

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成 18 年 1 月 12 日 (2006.1.12)

【公表番号】特表 2005-504736 (P2005-504736A)

【公表日】平成 17 年 2 月 17 日 (2005.2.17)

【年通号数】公開・登録公報 2005-007

【出願番号】特願 2003-511769 (P2003-511769)

【国際特許分類】

C 0 7 C	49/747	(2006.01)
A 6 1 K	31/122	(2006.01)
A 6 1 K	31/352	(2006.01)
A 6 1 K	31/385	(2006.01)
A 6 1 P	1/08	(2006.01)
A 6 1 P	9/02	(2006.01)
A 6 1 P	15/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/18	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	27/06	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/18	(2006.01)
A 6 1 P	37/02	(2006.01)
A 6 1 P	39/02	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
C 0 7 D	311/80	(2006.01)
C 0 7 D	339/06	(2006.01)
C 0 7 D	409/04	(2006.01)

【F I】

C 0 7 C	49/747	C
A 6 1 K	31/122	
A 6 1 K	31/352	
A 6 1 K	31/385	
A 6 1 P	1/08	
A 6 1 P	9/02	
A 6 1 P	15/00	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	25/02	
A 6 1 P	25/02	1 0 3
A 6 1 P	25/04	
A 6 1 P	25/08	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/18	

A 6 1 P 25/24
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 27/06
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 39/02
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 C 0 7 D 311/80
 C 0 7 D 339/06
 C 0 7 D 409/04

【手続補正書】

【提出日】平成17年9月27日(2005.9.27)

【手続補正1】

【補正対象書類名】誤訳訂正書

【補正対象項目名】誤訳訂正3

【補正方法】変更

【補正の内容】

【手続補正3】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

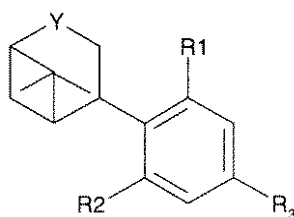
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)で表される化合物又はその生理学的に許容される塩。

【化1】



{ 式中、

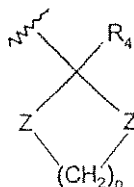
Y は、 $=C=O$ 、 $=CH-(CH_2)_f-Y_1-(CH_2)_g-Y_2$ 、 $=C=N-Y_3$ 、 $=CH-NY_4$
 Y_5 、 $=CH-(CH_2)_h-Y_6$ 、 $-C(O)N(Y_7)-$ 、 $-N(Y_7)C(O)-$ 、 $=NY_{11}$ 、 $=N-$
 $(CH_2)_f-Y_1-(CH_2)_g-Y_2$ 、スピロ環又は CY_9Y_{10} であり(すべての異性体
 を含む)[ここで、 Y_1 は、独立して、O、CO、C(O)O、OCO又は CH_2 であり；
 Y_2 は、独立して、H、ハロゲン、CN、 CF_3 、 N_3 、OH、COOH、アルコキシ、
 アシロキシ、NCS、NCO又は NY_7Y_8 であり； Y_3 は、独立して、-OH、-NH₂
 、アルコキシ、アルキル、 $-(CH_2)_n-NR_{10}R_{11}$ 、 $-(CH_2)_n-CO_2R$ (ここで
 R はH又はアルキルである)、 $-O-(CH_2)_n-NR_{10}R_{11}$ 、 $-O-(CH_2)_n-CO$
 $_2R$ 又は $-O-(CH_2)_n-CONR_{10}R_{11}$ であり； Y_4 は、独立して、H、OH、ア
 ルコキシ又はアルキルであり； Y_5 は、独立して、H、OH、アルコキシ又はアルキルで
 あり、ここで、 Y_4 及び Y_5 は、共にOHであることはなく、及び共にアルコキシである
 こともなく； Y_6 は、独立して、H、ハロゲン、CN、COOH、COアルキル、 CF_3
 、 SO_2 アルキル、COフルオロアルキル、 N_3 、OH、アルコキシ、アシロキシ、NC

S、NCO又はNY₇Y₈であり；Y₇は、独立して、H：アルキル：ヒドロキシアルキル：芳香環：アルキル、アルコキシ、ハロゲン及びCF₃から選ばれる少なくとも1の置換基で置換された芳香環：複素環：又は複素芳香環であり；Y₈は、独立して、H：アルキル：ヒドロキシアルキル：芳香環：アルキル、アルコキシ、ハロゲン及びCF₃から選ばれる少なくとも1の置換基で置換された芳香環：複素環：又は複素芳香環であり、あるいは、Y₇及びY₈は、一緒になって、N、O及びSから選ばれるさらに1以下のヘテロ原子を含有する3 - 7員飽和複素環の一部を形成し；Y₉は、独立して、H、アルキル又はアルコキシカルボニルメチルであり；Y₁₀は、独立して、H、アルキル又はアルコキシカルボニルメチルであり；Y₁₁は、H、アルキル、CO、CN、CO-アルキル、SO₂-アルキル又はCF₃であり；fは0 - 約5の整数であり；gは0 - 約5の整数であり；hは0 - 約5の整数であり；nは0 - 約4の整数である]；

R₁及びR₂は、互いに独立して、H、OH、ハロゲン、アルキル、-O-アルキル、NH₂、NO₂、CN、アシル、アロイル、ベンゾイル、置換ベンゾイル、アリールアルキル、置換アリールアルキル、フェナシル、置換フェナシル、-O-アルキル-NR₁₀R₁₁、-O-アルキル-COOR（ここで、RはH又はアルキルである）、-O-アルキル-CO-NR₁₀R₁₁、OCOCH₃、-N(アルキル)₂、-CO(アルキル)X又は-OCO(アルキル)X（ここで、Xは、H、ジアルキルアミノ、シクロアミン、炭素環、複素環、芳香環又は複素芳香環であり；R₁₀及びR₁₁は、独立して、H、アルキル、ヒドロキシアルキルであるか、又はR₁₀及びR₁₁は、一緒になって、N、O及びSから選ばれるさらに1以下のヘテロ原子を含有する3 - 7員飽和複素環の一部を形成する）であり；

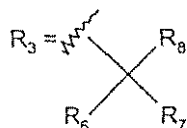
R₃は、

【化2】



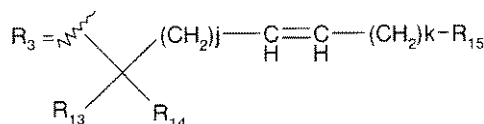
{ここで、Zは、CR₁₂R₁₃（ここで、R₁₂及びR₁₃は、互いに独立して、H又はアルキルである）、S、O、NH、N(CH₃)、SO又はSO₂であり；R₄は、-(CH₂)_j-R₅、-(CH₂)_j-A-(CH₂)_k-R₅又は-(CH₂)_j-A-(CH₂)_k-B-R₅ [ここで、A及びBは、互いに独立して、-CH₂-CH₂-、-CH=CH-、-C≡C-、O、S、SO、SO₂又はNHであり；R₅は、H、ハロゲン、CN、CF₃、N₃、COOH、NH₂、N(CH₃)₂、+N(CH₃)₃、Sn(アルキル)₃、フェニル、COOR（ここで、RはH又はアルキルである）、炭素環、複素環、芳香環、複素芳香環、2 - 約5個の環を有する多炭素環構造、2 - 5個の環を有する多複素環構造又はCONR₁₀R₁₁（ここで、R₁₀及びR₁₁は、互いに独立して、H、アルキル、ヒドロキシアルキルであるか、又はR₁₀及びR₁₁は、一緒になって、N、O及びSから選ばれるさらに1以下のヘテロ原子を含有する5又は6員飽和複素環の一部を形成する）であり；jは0 - 約7の整数であり；kは0 - 約7の整数である]であり；nは1 - 約4の整数である}、

【化 3】



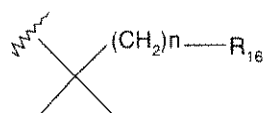
{ ここで、 R_6 及び R_7 は、独立して、H 又はアルキルであり； R_8 は、 $-(CH_2)_j-C-C-(CH_2)_k-R_9$ [ここで、 R_9 は、H、ハロゲン、CN、 CF_3 、 N_3 、 $COOH$ 、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $+N(CH_3)_3$ 、 Sn (アルキル) $_3$ 、フェニル、 $COOR$ (ここで、 R は H 又はアルキルである)、炭素環、複素環、芳香環、複素芳香環、2 - 5 個の環を有する多炭素環構造、2 - 約 5 個の環を有する多複素環構造又は $CONR_{10}R_{11}$ (ここで、 R_{10} 及び R_{11} は、互いに独立して、H、アルキル、ヒドロキシアルキルであるか、又は R_{10} 及び R_{11} は、一緒になって、N、O 及び S から選ばれる少なくとも 1 以下のヘテロ原子を含有する 5 又は 6 員飽和複素環の一部を形成する) であり； j は 0 - 約 7 の整数であり； k は 0 - 約 7 の整数である] である }、

【化 4】



[ここで、 R_{13} 及び R_{14} は、互いに独立して、H 又はアルキルであり； R_{15} は、H、ハロゲン、CN、 CF_3 、 N_3 、 $COOH$ 、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $+N(CH_3)_3$ 、 Sn (アルキル) $_3$ 、フェニル、 $COOR$ (ここで、 R は H 又はアルキルである)、炭素環、複素環、芳香環、複素芳香環、2 - 約 5 個の環を有する多炭素環構造、2 - 約 5 個の環を有する多複素環構造又は $CONR_{10}R_{11}$ (ここで、 R_{10} 及び R_{11} は、互いに独立して、H、アルキル、ヒドロキシアルキルであるか、又は R_{10} 及び R_{11} は、一緒になって、N、O 及び S から選ばれるさらに少なくとも 1 以下のヘテロ原子を含有する 5 又は 6 員飽和複素環の一部を形成する) であり； j は 0 - 約 7 の整数であり； k は 0 - 約 7 の整数である] 及び

【化 5】



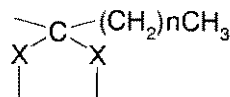
[ここで、 R_{16} は、H、ハロゲン、CN、 CF_3 、 N_3 、 $COOH$ 、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $+N(CH_3)_3$ 、 Sn (アルキル) $_3$ 、フェニル、 $COOR$ (ここで、 R は H 又はアルキルである)、炭素環、複素環、芳香環、複素芳香環、2 - 約 5 個の環を有する多炭素環構造、2 - 約 5 個の環を有する多複素環構造又は $CONR_{10}R_{11}$ (ここで、 R_{10}

R_0 及び R_{11} は、互いに独立して、H、アルキル、ヒドロキシアルキルであるか、又は R_{10} 及び R_{11} は、一緒になって、N、O 及び S から選ばれるさらに少なくとも 1 以下のヘテロ原子を含有する 5 又は 6 員飽和複素環の一部を形成する) であり; n は 0 - 約 7 の整数である] である群から選ばれるものであり;

ただし、

Y が C=O であり、 R_1 が、H、OH、OCH₃、NH₂ 又は O(CH₂)_nN(CH₃)₂ (ここで、 n は 1 - 3 の整数である) であり、 R_2 が、H、OH 又は OCH₃ である場合、 R_3 は、(CH₂)_nCH(CH₃) (ここで、 n は 3 - 5 の整数である) 又は

【化 16】



(ここで、X は、互いに独立して、CH₂、O、S 又は NH であり、 n は 3 - 5 の整数である) ではなく;

Y が C=O であり、 R_1 及び R_2 が共に OH である場合、 R_3 は C(CH₃)₂(CH₂)_nCH₃ (ここで、 n は 3 - 5 の整数である) ではなく;

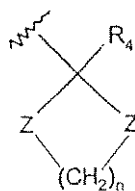
Y が C=O であり、 R_1 及び R_2 の一方が H であり、 R_1 及び R_2 の他方が OCH₃ である場合、 R_3 は (CH₂)_nCH₃ (ここで、 n は 4 - 6 の整数である) ではなく; 及び

Y が C=O であり、 R_1 及び R_2 が共に OH である場合、 R_3 は (CH₂)_nCH₃ (ここで、 n は 4 - 6 の整数である) ではない。}

【請求項 2】

R_3 が、

【化 2】



{ここで、Z は、CR₁₂R₁₃ (ここで、 R_{12} 及び R_{13} は、互いに独立して、H 又はアルキルである)、S、O、NH、N(CH₃)、SO 又は SO₂ であり; R_4 は、-(CH₂)_j-R₅、-(CH₂)_j-A-(CH₂)_k-R₅ 又は -(CH₂)_j-A-(CH₂)_k-B-R₅ [ここで、A 及び B は、互いに独立して、-CH₂-CH₂-, -CH=CH-, -C(C)-、O、S、SO、SO₂ 又は NH であり; R_5 は、H、ハロゲン、CN、CF₃、N₃、COOH、NH₂、N(CH₃)₂、+N(CH₃)₃、Sn(アルキル)₃、フェニル、COOR (ここで、R は H 又はアルキルである)、炭素環、複素環、芳香環、複素芳香環、2 - 約 5 個の環を有する多炭素環構造、2 - 5 個の環を有する多複素環構造又は CONR₁₀R₁₁ (ここで、 R_{10} 及び R_{11} は、互いに独立して、H、アルキル、ヒドロキシアルキルであるか、又は R_{10} 及び R_{11} は、一緒になって、N、O 及び S から選ばれるさらに 1 以下のヘテロ原子を含有する 5 又は 6 員飽和複素環の一部を形成する) であり; j は 0 - 約 7 の整数であり; k は 0 - 約 7 の整数である] であり; n は 1 - 約 4 の整数である

} である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

R_3 が、

【化 3】

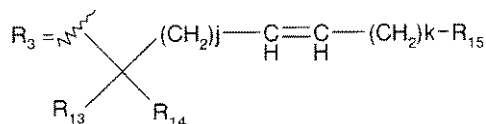


{ ここで、 R_6 及び R_7 は、独立して、H 又はアルキルであり； R_8 は、 $-(CH_2)_j-C$
 $C-(CH_2)_k-R_9$ [ここで、 R_9 は、H、ハロゲン、CN、 CF_3 、 N_3 、 $COOH$ 、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $+N(CH_3)_3$ 、 Sn (アルキル) $_3$ 、フェニル、 $COOR$ (こ
 こで、 R は H 又はアルキルである)、炭素環、複素環、芳香環、複素芳香環、2 - 5 個の
 環を有する多炭素環構造、2 - 約 5 個の環を有する多複素環構造又は $CONR_{10}R_{11}$
 (ここで、 R_{10} 及び R_{11} は、互いに独立して、H、アルキル、ヒドロキシアルキルで
 あるか、又は R_{10} 及び R_{11} は、一緒になって、N、O 及び S から選ばれる少なくとも
 1 以下のヘテロ原子を含有する 5 又は 6 員飽和複素環の一部を形成する) であり； j は 0
 - 約 7 の整数であり； k は 0 - 約 7 の整数である] である } である、請求項 1 記載の化
 合物。

【請求項 4】

R_1 及び R_2 が、互いに独立して、H、OH、アルキル又はアルコキシであり； R_3 が

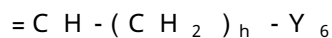
【化 4】



[ここで、 R_{13} 及び R_{14} は、互いに独立して、H 又はアルキルであり； R_{15} は、H
 、ハロゲン、CN、 CF_3 、 N_3 、 $COOH$ 、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $+N(CH_3)_3$ 、 Sn (アルキル) $_3$ 、フェニル、 $COOR$ (こ
 こで、 R は H 又はアルキルである)、炭素環、複素環、芳香環、複素芳香環、2 - 約 5 個の環
 を有する多炭素環構造、2 - 約 5 個の環を有する多複素環構造又は $CONR_{10}R_{11}$ (こ
 こで、 R_{10} 及び R_{11} は、互いに独立して、H、アルキル、ヒドロキシアルキルであるか、
 又は R_{10} 及び R_{11} は、一緒になって、N、O 及び S から選ばれるさらに少なくとも 1 以下
 のヘテロ原子を含有する 5 又は 6 員飽和複素環の一部を形成する) であり； j は 0 - 約 7
 の整数であり； k は 0 - 約 7 の整数である] である、請求項 1 記載の化合物。

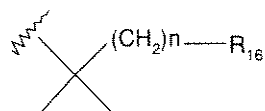
【請求項 5】

Y が、



(ここで、 Y_6 は、I、CN 又は N_3 であり、 h は約 1 - 約 3 の整数であるか、又は Y_6
 は、I 又は N_3 であり； h は 0 - 約 3 の整数である) であり； R_1 及び R_2 が、独立して
 、H、OH、アルキル又はアルコキシであり； R_3 が、

【化 5】

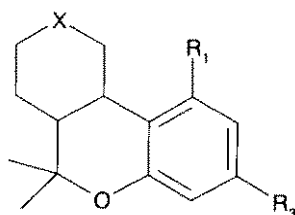


[ここで、 R_{16} は、H、ハロゲン、CN、 CF_3 、 N_3 、 $COOH$ 、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $+N(CH_3)_3$ 、 $Sn(\text{アルキル})_3$ 、フェニル、 $COOR$ (ここで、 R はH又はアルキルである)、炭素環、複素環、芳香環、複素芳香環、2 - 約5個の環を有する多炭素環構造、2 - 約5個の環を有する多複素環構造又は $CONR_{10}R_{11}$ (ここで、 R_{10} 及び R_{11} は、互いに独立して、H、アルキル、ヒドロキシアルキルであるか、又は R_{10} 及び R_{11} は、一緒になって、N、O及びSから選ばれるさらに少なくとも1以下のヘテロ原子を含有する5又は6員飽和複素環の一部を形成する)であり； n は0 - 約7の整数である]である、請求項1記載の化合物。

【請求項6】

式(IV')で表される化合物又はその生理学的に許容される塩。

【化17】



{ 式中、

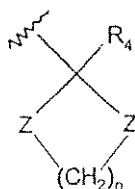
X は、 $=C=O$ 、 $=CH-(CH_2)_f-X_1-(CH_2)_g-X_2$ 、 $=C=N-X_3$ 、 $=CH-NX_4$ 、 X_5 、 $=CH-(CH_2)_h-X_6$ 、 $-C(O)N(X_7)-$ 、 $-N(X_7)C(O)-$ 、 $=NX_{11}$ 、 $=N-(CH_2)_f-X_1-(CH_2)_g-X_2$ 、スピロ環又は CX_9X_{10} であり (すべての異性体を含む) [ここで、 X_1 は、独立して、O、CO、 $C(O)O$ 、OCO又は CH_2 であり； X_2 は、独立して、H、ハロゲン、CN、 CF_3 、 N_3 、OH、 $COOH$ 、アルコキシ、アシロキシ、NCS、NCO又は NX_7X_8 であり； X_3 は、独立して、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、アルコキシ、アルキル、 $-(CH_2)_n-NR_{10}R_{11}$ 、 $-(CH_2)_n-CO_2R$ (ここで、 R はH又はアルキルである)、 $-O-(CH_2)_n-NR_{10}R_{11}$ 、 $-O-(CH_2)_n-CO_2R$ 又は $-O-(CH_2)_n-CONR_{10}R_{11}$ であり； X_4 は、独立して、H、OH、アルコキシ又はアルキルであり； X_5 は、独立して、H、OH、アルコキシ又はアルキルであり、ここで、 X_4 及び X_5 は、共にOHであることはなく、及び共にアルコキシであることもなく； X_6 は、独立して、H、ハロゲン、CN、 $COOH$ 、COアルキル、 CF_3 、 SO_2 アルキル、COフルオロアルキル、 N_3 、OH、アルコキシ、アシロキシ、NCS、NCO又は NX_7X_8 であり； X_7 は、独立して、H：アルキル：ヒドロキシアルキル：芳香環：アルキル、アルコキシ、ハロゲン及び CF_3 から選ばれる少なくとも1の置換基で置換された芳香環：複素環：又は複素芳香環であり； X_8 は、独立して、H：アルキル：ヒドロキシアルキル：芳香環：アルキル、アルコキシ、ハロゲン及び CF_3 から選ばれる少なくとも1の置換基で置換された芳香環：複素環：又は複素芳香環であり、あるいは、 X_7 及び X_8 は、一緒になって、N、O及びSから選ばれるさらに1以下のヘテロ原子を含有する3 - 7員飽和複素環の一部を形成し； X_9 は、独立して、H、アルキル又はアルコシカルボニルメチルであり； X_{10} は、独立して、H、アルキル又はアルコシカルボニルメチルであり； X_{11} は、H、アルキル、CO、CN、COアルキル、SO

$_2$ アルキル又は CF_3 であり； f は 0 - 約 3 の整数であり； g は 0 - 約 3 の整数であり；
 h は 0 - 約 3 の整数であり； n は 0 - 約 4 の整数である]；

R_1 は、H、OH、ハロゲン、アルキル、-O-アルキル、 NH_2 、 NO_2 、CN、アシル、アロイル、ベンゾイル、置換ベンゾイル、アリールアルキル、置換アリールアルキル、フェナシル、置換フェナシル、-O-アルキル- $\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、-O-アルキル- COOR （ここで、 R は H 又は アルキル である）、-O-アルキル- $\text{CONR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 OCOC H_3 、-N(アルキル) $_2$ 、-CO(アルキル) X 又は -OCO(アルキル) X （ここで、 X は、H、ジアルキルアミノ、シクロアミン、炭素環、複素環、芳香環又は複素芳香環であり； R_{10} 及び R_{11} は、互いに独立して、H、アルキル、ヒドロキシアルキルであるか、又は R_{10} 及び R_{11} は、一緒になって、N、O 及び S から選ばれるさらに 1 以下のヘテロ原子を含有する 3 - 7 員飽和複素環の一部を形成する）であり；及び

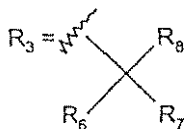
R_3 は、

【化 2】



[ここで、 Z は、 $\text{CR}_{12}\text{R}_{13}$ （ここで、 R_{12} 及び R_{13} は、互いに独立して、H 又は アルキルである）、S、O、NH、 $\text{N}(\text{CH}_3)$ 、SO 又は SO_2 であり； R_4 は、 $-(\text{CH}_2)_j-\text{R}_5$ 、 $-(\text{CH}_2)_j-\text{A}-(\text{CH}_2)_k-\text{R}_5$ 又は $-(\text{CH}_2)_j-\text{A}-(\text{CH}_2)_k-\text{B}-\text{R}_5$ （ここで、 A 及び B は、互いに独立して、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{C}-\text{C}-$ 、O、S、SO、 SO_2 又は NH であり； R_5 は、H、ハロゲン、CN、 CF_3 、 N_3 、 COOH 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $+\text{N}(\text{CH}_3)_3$ 、 $\text{Sn}(\text{アルキル})_3$ 、フェニル、 COOR （ここで、 R は H 又は アルキル である）、炭素環、複素環、芳香環、複素芳香環、2 - 約 5 個の環を有する多炭素環構造、2 - 5 個の環を有する多複素環構造又は $\text{CONR}_{10}\text{R}_{11}$ （ここで、 R_{10} 及び R_{11} は、互いに独立して、H、アルキル、ヒドロキシアルキルであるか、又は R_{10} 及び R_{11} は、一緒になって、N、O 及び S から選ばれるさらに 1 以下のヘテロ原子を含有する 5 又は 6 員飽和複素環の一部を形成する）であり； j は 0 - 約 7 の整数であり； k は 0 - 約 7 の整数である）であり； n は 1 - 約 4 の整数である]、

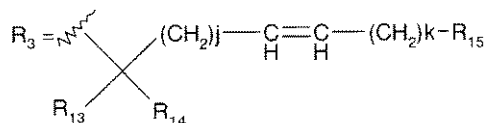
【化 3】



{ ここで、 R_6 及び R_7 は、互いに独立して、H 又は アルキル であり； R_8 は、 $-(\text{CH}_2)_j-\text{C}-\text{C}-(\text{CH}_2)_k-\text{R}_9$ [ここで、 R_9 は、H、ハロゲン、CN、 CF_3 、 N_3 、 COOH 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $+\text{N}(\text{CH}_3)_3$ 、 $\text{Sn}(\text{アルキル})_3$ 、フェニル、 COOR （ここで、 R は H 又は アルキル である）、炭素環、複素環、芳香環、複素芳香環、2 -

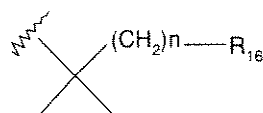
5 個の環を有する多炭素環構造、2 - 約 5 個の環を有する多複素環構造又は $\text{CONR}_{10}\text{R}_{11}$ (ここで、 R_{10} 及び R_{11} は、互いに独立して、H、アルキル、ヒドロキシアルキルであるか、又は R_{10} 及び R_{11} は、一緒になって、N、O 及び S から選ばれる少なくとも 1 以下のヘテロ原子を含有する 5 又は 6 員飽和複素環の一部を形成する) であり；
 j は 0 - 約 7 の整数であり； k は 0 - 約 7 の整数である] である }、

【化 4】



[ここで、 R_{13} 及び R_{14} は、互いに独立して、H 又はアルキルであり； R_{15} は、H、ハロゲン、CN、 CF_3 、 N_3 、 COOH 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $+\text{N}(\text{CH}_3)_3$ 、 $\text{Sn}(\text{アルキル})_3$ 、フェニル、 COOR (ここで、R は H 又はアルキルである)、炭素環、複素環、芳香環、複素芳香環、2 - 約 5 個の環を有する多炭素環構造、2 - 約 5 個の環を有する多複素環構造又は $\text{CONR}_{10}\text{R}_{11}$ (ここで、 R_{10} 及び R_{11} は、互いに独立して、H、アルキル、ヒドロキシアルキルであるか、又は R_{10} 及び R_{11} は、一緒になって、N、O 及び S から選ばれるさらに少なくとも 1 以下のヘテロ原子を含有する 5 又は 6 員飽和複素環の一部を形成する) であり； j は 0 - 約 7 の整数であり； k は 0 - 約 7 の整数である] 及び

【化 5】

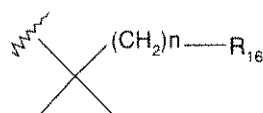


[ここで、 R_{16} は、H、ハロゲン、CN、 CF_3 、 N_3 、 COOH 、 NH_2 、 $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $+\text{N}(\text{CH}_3)_3$ 、 $\text{Sn}(\text{アルキル})_3$ 、フェニル、 COOR (ここで、R は H 又はアルキルである)、炭素環、複素環、芳香環、複素芳香環、2 - 約 5 個の環を有する多炭素環構造、2 - 約 5 個の環を有する多複素環構造又は $\text{CONR}_{10}\text{R}_{11}$ (ここで、 R_{10} 及び R_{11} は、互いに独立して、H、アルキル、ヒドロキシアルキルであるか、又は R_{10} 及び R_{11} は、一緒になって、N、O 及び S から選ばれるさらに少なくとも 1 以下のヘテロ原子を含有する 5 又は 6 員飽和複素環の一部を形成する) であり； n は 0 - 約 7 の整数である] でなる群から選ばれるものであり；

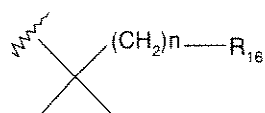
ただし、

R_1 が OH であり、 R_3 が

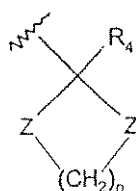
【化 5】



(ここで、 R_{1-6} が I であり、 n が 6 である) である場合、 X は $=CH-N_3$ ではなく;
 X が、 $=CH-(CH_2)-H$ であり、 R_3 が
 【化 5】



(ここで、 R_{1-6} が H である) である場合、 X_6 は、I 又は $COOH$ ではない。}
 【請求項 7】
 R_3 が、
 【化 2】

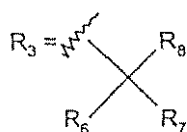


[ここで、 Z は、 $CR_{1-2}R_{1-3}$ (ここで、 R_{1-2} 及び R_{1-3} は、互いに独立して、 H 又はアルキルである)、 S 、 O 、 NH 、 $N(CH_3)$ 、 SO 又は SO_2 であり; R_4 は、 $-(CH_2)_j-R_5$ 、 $-(CH_2)_j-A-(CH_2)_k-R_5$ 又は $-(CH_2)_j-A-(CH_2)_k-B-R_5$ (ここで、 A 及び B は、互いに独立して、 $-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-C-C-$ 、 O 、 S 、 SO 、 SO_2 又は NH であり; R_5 は、 H 、ハロゲン、 CN 、 CF_3 、 N_3 、 $COOH$ 、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $+N(CH_3)_3$ 、 Sn (アルキル) $_3$ 、フェニル、 $COOR$ (ここで、 R は H 又はアルキルである)、炭素環、複素環、芳香環、複素芳香環、2 - 約 5 個の環を有する多炭素環構造、2 - 5 個の環を有する多複素環構造又は $CONR_{1-0}R_{1-1}$ (ここで、 R_{1-0} 及び R_{1-1} は、互いに独立して、 H 、アルキル、ヒドロキシアルキルであるか、又は R_{1-0} 及び R_{1-1} は、一緒になって、 N 、 O 及び S から選ばれるさらに 1 以下のヘテロ原子を含有する 5 又は 6 員飽和複素環の一部を形成する) であり; j は 0 - 約 7 の整数であり; k は 0 - 約 7 の整数である) であり; n は 1 - 約 4 の整数である] である、請求項 6 記載の化合物。

【請求項 8】

R_3 が、

【化 3】



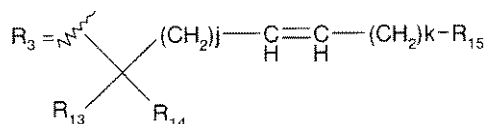
[ここで、 R_6 及び R_7 は、互いに独立して、 H 又はアルキルであり; R_8 は、 $-(CH_2)_j-C-C-(CH_2)_k-R_9$ (ここで、 R_9 は、 H 、ハロゲン、 CN 、 CF_3 、 N_3 、 $COOH$ 、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $+N(CH_3)_3$ 、 Sn (アルキル) $_3$ 、フェニル、 COO

R (ここで、RはH又はアルキルである)、炭素環、複素環、芳香環、複素芳香環、2 - 約5個の環を有する多炭素環構造、2 - 約5個の環を有する多複素環構造又はCONR₁₀R₁₁ (ここで、R₁₀及びR₁₁は、互いに独立して、H、アルキル、ヒドロキシアルキルであるか、又はR₁₀及びR₁₁は、一緒になって、N、O及びSから選ばれる少なくとも1以下のヘテロ原子を含有する5又は6員飽和複素環の一部を形成する)であり; jは0 - 約7の整数であり; kは0 - 約7の整数である)である]である、請求項6記載の化合物。

【請求項9】

R₁が、H、OH、アルキル又はアルコキシであり; R₃が、

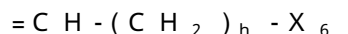
【化4】



[ここで、R₁₃及びR₁₄は、互いに独立して、H又はアルキルであり; R₁₅は、ハロゲン、CN、CF₃、N₃、COOH、NH₂、N(CH₃)₂、+N(CH₃)₃、Sn(アルキル)₃、フェニル、COOR (ここで、RはH又はアルキルである)、炭素環、複素環、芳香環、複素芳香環、2 - 約5個の環を有する多炭素環構造、2 - 約5個の環を有する多複素環構造又はCONR₁₀R₁₁ (ここで、R₁₀及びR₁₁は、互いに独立して、H、アルキル、ヒドロキシアルキルであるか、又はR₁₀及びR₁₁は、一緒になって、N、O及びSから選ばれるさらに少なくとも1以下のヘテロ原子を含有する5又は6員飽和複素環の一部を形成する)であり; jは0 - 約7の整数であり; kは0 - 約7の整数である]である、請求項6記載の化合物。

【請求項10】

Xが、

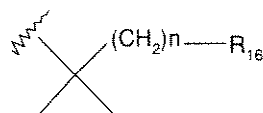


(ここで、X₆は、I、CN、N₃又はCOOHであり、hは約1 - 約3の整数であるか; 又はX₆は、I、N₃又はCOOHであり、hは0 - 約3の整数である)(すべての異性体を含む)であり;

R₁が、H、OH、アルキル又はアルコキシであり;

R₃が、

【化5】



[ここで、R₁₆は、H、ハロゲン、CN、CF₃、N₃、COOH、NH₂、N(CH₃)₂、+N(CH₃)₃、Sn(アルキル)₃、フェニル、COOR (ここで、RはH又はアルキルである)、炭素環、複素環、芳香環、複素芳香環、2 - 約5個の環を有する多炭素環構造、2 - 約5個の環を有する多複素環構造又はCONR₁₀R₁₁ (ここで、R₁₀及びR₁₁は、互いに独立して、H、アルキル、ヒドロキシアルキルであるか、又はR₁₀及びR₁₁は、一緒になって、N、O及びSから選ばれるさらに少なくとも1以下のヘテロ原子を含有する5又は6員飽和複素環の一部を形成する)であり; nは0 - 約7の整数である]である、請求項6記載の化合物。

【請求項11】

請求項1 - 10のいずれか1項記載の化合物又はその生理学的に許容される塩の少なく

とも 1 を、治療上有効な量で含有することを特徴とする、医薬組成物。

【請求項 1 2】

ヒト又は動物においてカンナビノイド受容体を刺激するための薬剤の製造における、請求項 1 - 1 0 のいずれか 1 項記載の化合物又はその生理学的に許容される塩の使用。

【請求項 1 3】

ヒト又は動物においてカンナビノイド受容体 C B 2 を選択的に刺激するための薬剤の製造における、請求項 1 - 1 0 のいずれか 1 項記載の化合物又はその生理学的に許容される塩の使用。

【請求項 1 4】

ヒト又は動物を治療するための薬剤の製造における、請求項 1 - 1 0 のいずれか 1 項記載の化合物又はその生理学的に許容される塩の使用。

【請求項 1 5】

治療が、中心性又は末梢性の痛み；神経障害；多発性硬化症、パーキンソン病、ハンチントン舞蹈病、アルツハイマー病を含む神経変性疾患；精神分裂症及び鬱病の如き精神障害；内毒素性ショック及び低血圧性ショック；食欲の調節；免疫系の調節；受胎性の低減；トゥレット症候群の如き運動機能に伴う疾患；炎症；神経保護の提供；記憶の抑制；末梢血管の拡張；癲癇；緑内障；ガンの化学療法に伴う悪心；及び AIDS 消耗症候群から選ばれる状態に関するものである、請求項 1 4 記載の使用。

【請求項 1 6】

治療が、中心性又は末梢性の痛み及び神経障害から選ばれる状態に関するものである、請求項 1 4 記載の使用。