

【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25年3月7日 (2013.3.7)

【公表番号】特表2008-528519(P2008-528519A)

【公表日】平成20年7月31日 (2008.7.31)

【年通号数】公開・登録公報2008-030

【出願番号】特願2007-552413(P2007-552413)

【国際特許分類】

C 07 D 333/36 (2006.01)

C 07 D 333/38 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 21/04 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 1/16 (2006.01)

A 61 P 15/08 (2006.01)

A 61 P 37/06 (2006.01)

A 61 P 5/38 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 21/00 (2006.01)

A 61 P 11/06 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 P 1/02 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

A 61 P 17/06 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 25/14 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 9/04 (2006.01)

A 61 P 3/06 (2006.01)

A 61 P 11/02 (2006.01)

A 61 P 27/16 (2006.01)

A 61 K 31/381 (2006.01)

C 07 D 409/12 (2006.01)

C 07 D 409/14 (2006.01)

C 07 D 413/14 (2006.01)

C 07 D 417/14 (2006.01)

A 61 K 31/4436 (2006.01)

A 61 K 31/4439 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 333/36 C S P

C 07 D 333/38

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 43/00 1 0 5

A 61 P 25/00

A 6 1 P 21/04  
A 6 1 P 27/02  
A 6 1 P 9/00  
A 6 1 P 1/04  
A 6 1 P 1/16  
A 6 1 P 15/08  
A 6 1 P 37/06  
A 6 1 P 5/38  
A 6 1 P 29/00 1 0 1  
A 6 1 P 19/02  
A 6 1 P 21/00  
A 6 1 P 11/06  
A 6 1 P 11/00  
A 6 1 P 1/02  
A 6 1 P 13/12  
A 6 1 P 17/06  
A 6 1 P 25/28  
A 6 1 P 25/16  
A 6 1 P 25/14  
A 6 1 P 9/10  
A 6 1 P 9/04  
A 6 1 P 3/06  
A 6 1 P 11/02  
A 6 1 P 27/16  
A 6 1 K 31/381  
C 0 7 D 409/12  
C 0 7 D 409/14  
C 0 7 D 413/14  
C 0 7 D 417/14  
A 6 1 K 31/4436  
A 6 1 K 31/4439

## 【誤訳訂正書】

【提出日】平成25年1月11日(2013.1.11)

## 【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

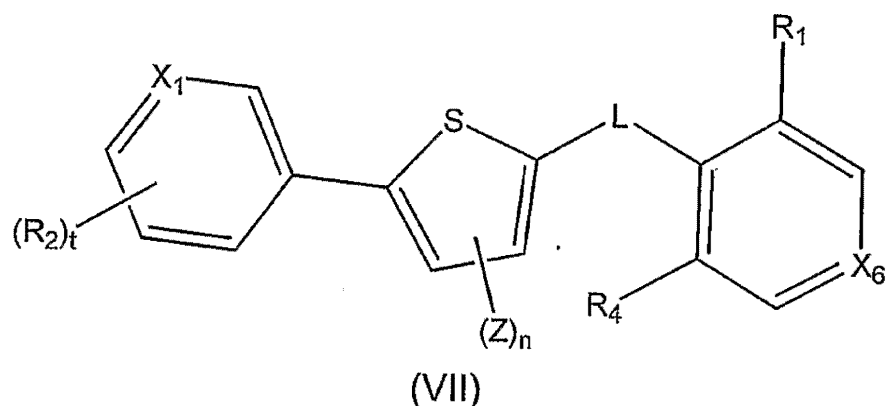
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(V I I)で表される化合物

## 【化 1】



又はその薬理的に許容できる塩、溶媒和化合物、若しくは包接化合物。

(式中、Lは -NRC(O)- 又は -C(O)-NR- であり、

X<sub>1</sub> はCH、CR<sub>2</sub> 又はNであり、

X<sub>6</sub> はCH又はNであり、

各Zは低級アルキル、低級ハロアルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級アルキルスルファニル、シアノ、ニトロ又は低級ハロアルコキシ基からなる群から独立に選択され、

Rは各々独立に水素原子、アルキル、-C(O)R<sub>5</sub> 又は -C(O)OR<sub>5</sub> から選択され、

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub> 及びR<sub>4</sub> は各々独立に、任意に置換されてもよいアルキル、任意に置換されてもよいアルケニル、任意に置換されてもよいアルキニル、任意に置換されてもよいシクロアルキル、任意に置換されてもよいシクロアルケニル、任意に置換されてもよいヘテロシクリル、任意に置換されてもよいアリール、任意に置換されてもよいヘテロアリール、任意に置換されてもよいアラルキル又は任意に置換されてもよいヘテロアラルキル、ニトロ、シアノ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、-OR<sub>5</sub>、-SR<sub>5</sub>、-NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-C(X<sub>3</sub>)R<sub>5</sub>、-C(X<sub>3</sub>)OR<sub>5</sub>、-OC(X<sub>3</sub>)R<sub>5</sub>、-NR<sub>5</sub>C(X<sub>3</sub>)OR<sub>5</sub>、-C(X<sub>3</sub>)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-NR<sub>5</sub>C(X<sub>3</sub>)R<sub>5</sub>、-NR<sub>5</sub>C(X<sub>3</sub>)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-OC(X<sub>3</sub>)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-C(X<sub>3</sub>)SR<sub>5</sub>、-SC(X<sub>3</sub>)R<sub>5</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>5</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>5</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>5</sub>、-NR<sub>5</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>5</sub>、-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-P(X<sub>4</sub>)(R<sub>5</sub>)<sub>2</sub>、-P(X<sub>4</sub>)(X<sub>5</sub>R<sub>5</sub>)(R<sub>5</sub>)、-P(X<sub>4</sub>)(X<sub>5</sub>R<sub>5</sub>)<sub>2</sub>、-X<sub>5</sub>P(X<sub>4</sub>)(X<sub>5</sub>R<sub>5</sub>)<sub>2</sub>、-X<sub>5</sub>P(X<sub>4</sub>)(R<sub>5</sub>)(X<sub>5</sub>R<sub>5</sub>) 又は -X<sub>5</sub>P(X<sub>4</sub>)(R<sub>5</sub>)<sub>2</sub>、であり、

X<sub>3</sub> は=O、=S 又は=NR<sub>8</sub> であり、

X<sub>4</sub> は=O 又は=S であり、

X<sub>5</sub> は-O- 又は-S- であり、

R<sub>5</sub> は各々独立に水素原子、任意に置換されてもよいアルキル、任意に置換されてもよいアルケニル、任意に置換されてもよいアルキニル、任意に置換されてもよいシクロアルキル、任意に置換されてもよいシクロアルケニル、任意に置換されてもよいヘテロシクリル、任意に置換されてもよいアリール、任意に置換されてもよいヘテロアリール、任意に置換されてもよいアラルキル又は任意に置換されてもよいヘテロアラルキル基であり、R<sub>6</sub> 及びR<sub>7</sub> は各々独立に水素原子、任意に置換されてもよいアルキル、任意に置換されてもよいアルケニル、任意に置換されてもよいアルキニル、任意に置換されてもよいシクロアルキル、任意に置換されてもよいシクロアルケニル、任意に置換されてもよいヘテロシクリル、任意に置換されてもよいアリール、任意に置換されてもよいヘテロアリール、任意に置換されてもよいアラルキル若しくは任意に置換されてもよいヘテロアラルキル基であるか、又はR<sub>6</sub> 及びR<sub>7</sub> はそれらが結合する窒素と共に結合した、任意に置換されてもよいヘテロシクリル若しくは任意に置換されてもよいヘテロアリール基であり、

R<sub>8</sub> は各々独立に水素原子、ハロ、アルキル、-OR<sub>5</sub>、-NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-C(O)R<sub>5</sub>

、 $-C(O)OR_5$  又は  $C(O)NR_6R_7$  であり、  
 $n$  は 0 又は 1 から 2 までの整数であり、  
 $p$  は各々独立に 1 又は 2 であり、  
 $t$  は 0 又は 1 から 4 までの整数である。)

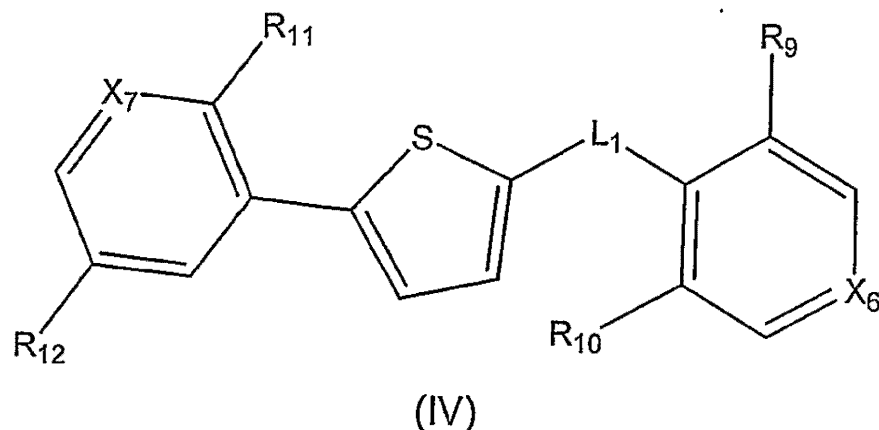
【請求項 2】

$R_1$  及び  $R_4$  が各々独立にハロ、低級アルキル、低級ハロアルキル、低級アルコキシ又は低級ハロアルコキシ基であり、 $n$  が 0 である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

前記化合物が式 (IV) で表される化合物

【化 2】



又はその薬理学的に許容できる塩、溶媒和化合物、若しくは包接化合物である、請求項 1 記載の化合物。

(式中、 $L_1$  は  $-NHC(O)-$  又は  $-C(O)-NH-$  であり、

$X_6$  は CH 又は N であり、

$X_7$  は CH 又は N であり、

$R_9$  及び  $R_{10}$  は各々独立にハロ、低級アルキル、低級ハロアルキル、低級アルコキシ又は低級ハロアルコキシ基であり、

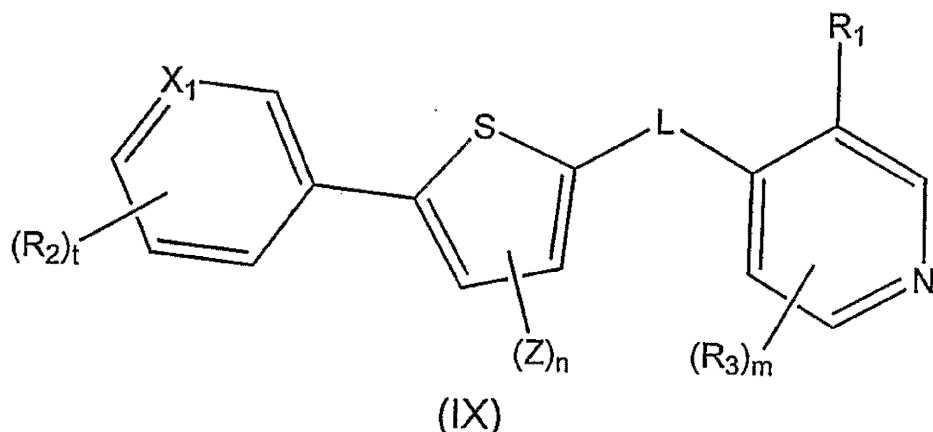
$R_{11}$  及び  $R_{12}$  は各々独立にハロ、低級アルキル、低級ハロアルキル、低級アルコキシ、低級ハロアルコキシ、1 から 3 個の低級アルキル基で任意に置換されてもよい 5 員環を有するヘテロアリール、 $-C(O)OR_{13}$ 、 $-C(O)NR_{14}R_{15}$  又はシアノ基であり、

$R_{13}$ 、 $R_{14}$  及び  $R_{15}$  は各々独立に水素原子、低級アルキル、又はアルコキシ基で置換された低級アルキル基である。)

【請求項 4】

式 (IX) で表される化合物

## 【化 3】



又はその薬理的に許容できる塩、溶媒和化合物、若しくは包接化合物。

(式中、Lは - NRC(O) - 又は - C(O) - NR - であり、

X<sub>1</sub>はCH、CR<sub>2</sub>又はNであり、

各Zは低級アルキル、低級ハロアルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級アルキルスルファニル、シアノ、ニトロ又は低級ハロアルコキシ基からなる群から独立に選択され、

Rは各々独立に水素原子、アルキル、-C(O)R<sub>5</sub>又は-C(O)OR<sub>5</sub>から選択され、

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>及びR<sub>3</sub>は各々独立に任意に置換されてもよいアルキル、任意に置換されてもよいアルケニル、任意に置換されてもよいアルキニル、任意に置換されてもよいシクロアルキル、任意に置換されてもよいシクロアルケニル、任意に置換されてもよいヘテロシクリル、任意に置換されてもよいアリール、任意に置換されてもよいヘテロアリール、任意に置換されてもよいアラルキル又は任意に置換されてもよいヘテロアラルキル、ニトロ、シアノ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、-OR<sub>5</sub>、-SR<sub>5</sub>、-NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-C(X<sub>3</sub>)R<sub>5</sub>、-C(X<sub>3</sub>)OR<sub>5</sub>、-OC(X<sub>3</sub>)R<sub>5</sub>、-NR<sub>5</sub>C(X<sub>3</sub>)OR<sub>5</sub>、-C(X<sub>3</sub>)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-NR<sub>5</sub>C(X<sub>3</sub>)R<sub>5</sub>、-NR<sub>5</sub>C(X<sub>3</sub>)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-OC(X<sub>3</sub>)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-C(X<sub>3</sub>)SR<sub>5</sub>、-SC(X<sub>3</sub>)R<sub>5</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sub>5</sub>、-OS(O)<sub>p</sub>R<sub>5</sub>、-S(O)<sub>p</sub>OR<sub>5</sub>、-NR<sub>5</sub>S(O)<sub>p</sub>R<sub>5</sub>、-S(O)<sub>p</sub>NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-P(X<sub>4</sub>)(R<sub>5</sub>)<sub>2</sub>、-P(X<sub>4</sub>)(X<sub>5</sub>R<sub>5</sub>)(R<sub>5</sub>)、-P(X<sub>4</sub>)(X<sub>5</sub>R<sub>5</sub>)<sub>2</sub>、-X<sub>5</sub>P(X<sub>4</sub>)(X<sub>5</sub>R<sub>5</sub>)<sub>2</sub>、-X<sub>5</sub>P(X<sub>4</sub>)(R<sub>5</sub>)(X<sub>5</sub>R<sub>5</sub>)又は-X<sub>5</sub>P(X<sub>4</sub>)(R<sub>5</sub>)<sub>2</sub>であり、

X<sub>3</sub>は=O、=S又は=NR<sub>8</sub>であり、

X<sub>4</sub>は=O又は=Sであり、

X<sub>5</sub>は-O-又は-S-であり、

R<sub>5</sub>は各々独立に水素原子、任意に置換されてもよいアルキル、任意に置換されてもよいアルケニル、任意に置換されてもよいアルキニル、任意に置換されてもよいシクロアルキル、任意に置換されてもよいシクロアルケニル、任意に置換されてもよいヘテロシクリル、任意に置換されてもよいアリール、任意に置換されてもよいヘテロアリール、任意に置換されてもよいアラルキル又は任意に置換されてもよいヘテロアラルキル基であり、

R<sub>6</sub>及びR<sub>7</sub>は各々独立に水素原子、任意に置換されてもよいアルキル、任意に置換されてもよいアルケニル、任意に置換されてもよいアルキニル、任意に置換されてもよいシクロアルキル、任意に置換されてもよいシクロアルケニル、任意に置換されてもよいヘテロシクリル、任意に置換されてもよいアリール、任意に置換されてもよいヘテロアリール、任意に置換されてもよいアラルキル若しくは任意に置換されてもよいヘテロアラルキル基であるか、又はR<sub>6</sub>及びR<sub>7</sub>はそれらが結合する窒素と共に結合した、任意に置換されてもよいヘテロシクリル若しくは任意に置換されてもよいヘテロアリール基であり、

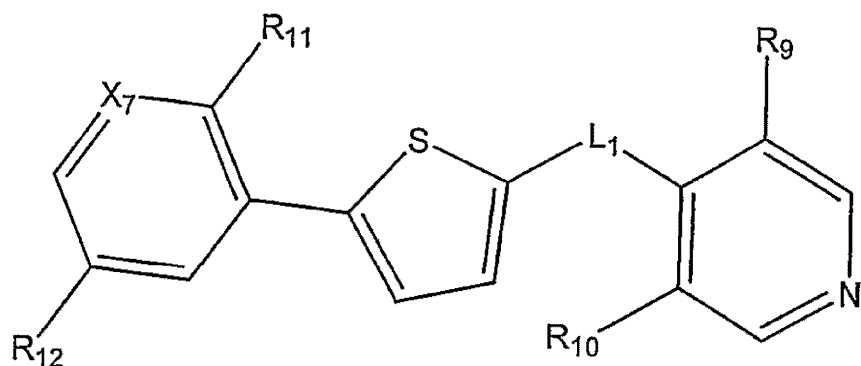
R<sub>8</sub>は各々独立に水素原子、ハロ、アルキル、-OR<sub>5</sub>、-NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-C(O)R<sub>5</sub>

、 $-C(O)OR_5$  又は  $C(O)NR_6R_7$  であり、  
 $n$  は 0 又は 1 から 4 までの整数であり、  
 $p$  は各々独立に 1 又は 2 であり、  
 $m$  は 0 又は 1 から 3 まで整数であり、  
 $t$  は 0 又は 1 から 4 までの整数である。)

【請求項 5】

前記化合物が式 (XII) で表される化合物

【化 4】



(XII)

又はその薬理的に許容できる塩、溶媒和化合物、若しくは包接化合物である、請求項 4 記載の化合物。

(式中、 $L_1$  は  $-NHC(O)-$  又は  $-C(O)-NH-$  であり、

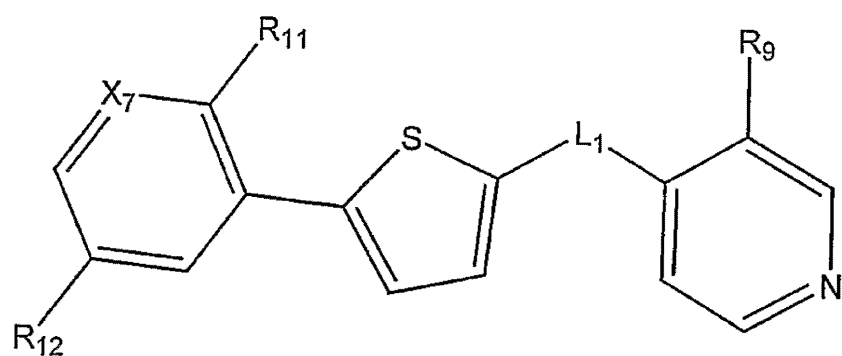
$X_7$  は  $CH$  又は  $N$  であり、

$R_9$  及び  $R_{10}$  は各々独立にハロ、低級アルキル、低級ハロアルキル、低級アルコキシ又は低級ハロアルコキシ基である。)

【請求項 6】

前記化合物が式 (VI) で表される化合物

【化 5】



(VI)

又はその薬理的に許容できる塩、溶媒和化合物、若しくは包接化合物である、請求項 4 記載の化合物。

(式中、 $L_1$  は  $-NHC(O)-$  又は  $-C(O)-NH-$  であり、

$X_7$  は  $CH$  又は  $N$  であり、

$R_{11}$  及び  $R_{12}$  は各々独立にハロ、低級アルキル、低級ハロアルキル、低級アルコキシ、低級ハロアルコキシ、1 から 3 個の低級アルキル基で任意に置換されてもよい 5 員環を有するヘテロアリアル、 $-C(O)OR_{13}$ 、 $-C(O)NR_{14}R_{15}$ 、又はシアノ基であり、

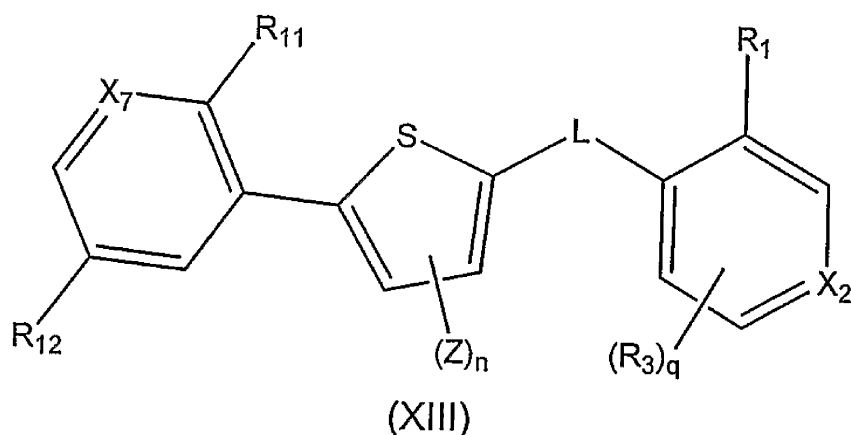
$R_{13}$ 、 $R_{14}$  及び  $R_{15}$  は各々独立に水素原子、低級アルキル、又はアルコキシ基によって置換された低級アルキルであり、

$R_9$  はハロ、低級アルキル、低級ハロアルキル、低級アルコキシ又は低級ハロアルコキシ基である。）

【請求項 7】

式 (XIII) で表される化合物

【化 6】



又はその薬理学的に許容できる塩、溶媒和化合物、若しくは包接化合物。

(式中、 $L$  は  $-NRC(O)-$  又は  $-C(O)-NR-$  であり、

$X_2$  は  $CH$ 、 $CR_3$  又は  $N$  であり、

$X_7$  は  $CH$  又は  $N$  であり、

各  $Z$  は低級アルキル、低級ハロアルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級アルキルスルファニル、シアノ、ニトロ又は低級ハロアルコキシ基からなる群から独立に選択され、

$R$  は各々独立に水素原子、アルキル、 $-C(O)R_5$  又は  $-C(O)OR_5$  から選択され、

$R_1$  及び  $R_3$  は各々独立に任意に置換されてもよいアルキル、任意に置換されてもよいアルケニル、任意に置換されてもよいアルキニル、任意に置換されてもよいシクロアルキル、任意に置換されてもよいシクロアルケニル、任意に置換されてもよいヘテロシクリル、任意に置換されてもよいアリール、任意に置換されてもよいヘテロアリール、任意に置換されてもよいアラルキル、任意に置換されてもよいヘテロアラルキル、ニトロ、シアノ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、 $-OR_5$ 、 $-SR_5$ 、 $-NR_6R_7$ 、 $-C(X_3)R_5$ 、 $-C(X_3)OR_5$ 、 $-OC(X_3)R_5$ 、 $-NR_5C(X_3)OR_5$ 、 $-C(X_3)NR_6R_7$ 、 $-NR_5C(X_3)R_5$ 、 $-NR_5C(X_3)NR_6R_7$ 、 $-OC(X_3)NR_6R_7$ 、 $-C(X_3)SR_5$ 、 $-SC(X_3)R_5$ 、 $-S(O)_pR_5$ 、 $-OS(O)_pR_5$ 、 $-S(O)_pOR_5$ 、 $-NR_5S(O)_pR_5$ 、 $-S(O)_pNR_6R_7$ 、 $-P(X_4)(R_5)_2$ 、 $-P(X_4)(X_5R_5)(R_5)$ 、 $-P(X_4)(X_5R_5)_2$ 、 $-X_5P(X_4)(X_5R_5)_2$ 、 $-X_5P(X_4)(R_5)(X_5R_5)$  又は  $-X_5P(X_4)(R_5)_2$  であり、

$X_3$  は  $=O$ 、 $=S$  又は  $=NR_8$  であり、

$X_4$  は  $=O$  又は  $=S$  であり、

$X_5$  は  $-O-$  又は  $-S-$  であり、

$R_5$  は各々独立に水素原子、任意に置換されてもよいアルキル、任意に置換されてもよいアルケニル、任意に置換されてもよいアルキニル、任意に置換されてもよいシクロアルキル、任意に置換されてもよいシクロアルケニル、任意に置換されてもよいヘテロシクリル、任意に置換されてもよいアリール、任意に置換されてもよいヘテロアリール、任意に置換されてもよいアラルキル又は任意に置換されてもよいヘテロアラルキル基であり、

$R_6$  及び  $R_7$  は各々独立に水素原子、任意に置換されてもよいアルキル、任意に置換され

てもよいアルケニル、任意に置換されてもよいアルキニル、任意に置換されてもよいシクロアルキル、任意に置換されてもよいシクロアルケニル、任意に置換されてもよいヘテロシクリル、任意に置換されてもよいアリール、任意に置換されてもよいヘテロアリール、任意に置換されてもよいアラルキル若しくは任意に置換されてもよいヘテロアラルキル基であるか、又は  $R_6$  及び  $R_7$  はそれらが結合する窒素と共に結合した、任意に置換されてもよいヘテロシクリル若しくは任意に置換されてもよいヘテロアリール基であり、

$R_8$  は各々独立に水素原子、ハロ、アルキル、 $-OR_5$ 、 $-NR_6R_7$ 、 $-C(O)R_5$ 、 $-C(O)OR_5$  又は  $C(O)NR_6R_7$  であり、

$R_{11}$  及び  $R_{12}$  は各々独立にハロ、低級アルキル、低級ハロアルキル、低級アルコキシ、低級ハロアルコキシ、1 から 3 個の低級アルキル基で任意に置換されてもよい 5 員環を有するヘテロアリール、 $-C(O)OR_{13}$ 、 $-C(O)NR_{14}R_{15}$ 、又はシアノ基であり、

$R_{13}$ 、 $R_{14}$  及び  $R_{15}$  は各々独立に水素原子、低級アルキル又は低級アルキルがアルコキシ基によって置換され、

$n$  は 0 又は 1 から 2 までの整数であり、

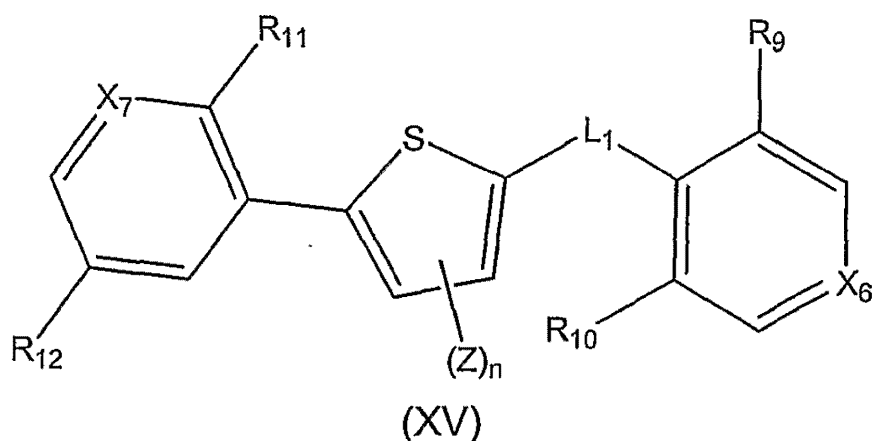
$p$  は各々独立に 1 又は 2 であり、

$q$  は 0 又は 1 から 3 までの整数である。) )

【請求項 8】

前記化合物が式 (XV) で表される化合物

【化 7】



又はその薬理学的に許容できる塩、溶媒和化合物、若しくは包接化合物である、請求項 7 記載の化合物。

(式中、 $X_6$  は CH 又は N であり、

$L_1$  は  $-NHC(O)-$  又は  $-C(O)-NH-$  であり、

$X_7$  は CH 又は N であり、

$R_{11}$  及び  $R_{12}$  は各々独立にハロ、低級アルキル、低級ハロアルキル、低級アルコキシ、低級ハロアルコキシ、1 から 3 個の低級アルキル基で任意に置換されてもよい 5 員環を有するヘテロアリール、 $-C(O)OR_{13}$ 、 $-C(O)NR_{14}R_{15}$ 、又はシアノ基であり、

$R_{13}$ 、 $R_{14}$  及び  $R_{15}$  は各々独立に水素原子、低級アルキル、又はアルコキシ基によって置換された低級アルキルであり、

$R_9$  及び  $R_{10}$  は各々独立にハロ、低級アルキル、低級ハロアルキル、低級アルコキシ又は低級ハロアルコキシ基である。) )

【請求項 9】

$X_6$  が CH である、請求項 1、3 又は 8 記載の化合物。

【請求項 10】

$X_7$  が N である、請求項 5 又は 9 記載の化合物。



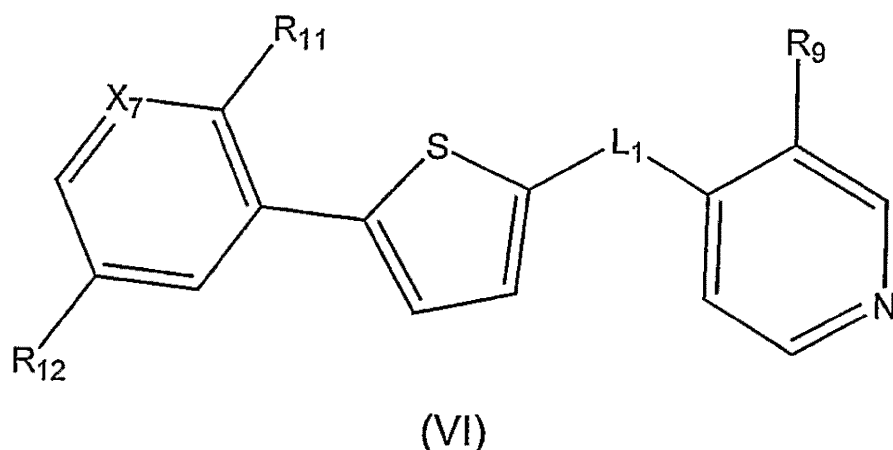
## 【請求項 1 1】

R<sub>9</sub> 及び R<sub>10</sub> が各々独立にハロ基である、請求項 3、5 又は 9 記載の化合物。

## 【請求項 1 2】

前記化合物が式 (VI) で表される化合物

## 【化 8】



又はその薬理学的に許容できる塩、溶媒和化合物、若しくは包接化合物である、請求項 7 記載の化合物。

(式中、R<sub>9</sub> はハロ、低級アルキル、低級ハロアルキル、低級アルコキシ又は低級ハロアルコキシ基である。)

## 【請求項 1 3】

X<sub>7</sub> が CH である、請求項 3、5、9 又は 12 記載の化合物。

## 【請求項 1 4】

R<sub>9</sub> が低級アルキル又はハロ基である、請求項 6 又は 12 記載の化合物。

## 【請求項 1 5】

以下からなる群から選択される化合物：

- 5 - (2 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - フェニル) - チオフェン - 2 - カルボン酸
- (2, 6 - ジフルオロ - フェニル) - アミド、
- 5 - (2 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - フェニル) - チオフェン - 2 - カルボン酸
- (3 - メチル - ピリジン - 4 - イル) - アミド、
- 3 - [5 - (2, 6 - ジフルオロ - フェニルカルバモイル) - チオフェン - 2 - イル] -
- 4 - メチル安息香酸メチルエステル、
- 4 - メチル - 3 - [5 - (3 - メチル - ピリジン - 4 - イルカルバモイル) - チオフェン -
- 2 - イル] - 安息香酸メチルエステル、
- 3 - [5 - (2, 6 - ジフルオロ - フェニルカルバモイル) - チオフェン - 2 - イル] -
- 4 - メチル安息香酸プロピルエステル、
- 3 - [5 - (2, 6 - ジフルオロ - フェニルカルバモイル) - チオフェン - 2 - イル] -
- 4 - メチル安息香酸 2 - メトキシ - エチルエステル、
- 4 - クロロ - 3 - [5 - (2, 6 - ジフルオロ - フェニルカルバモイル) - チオフェン -
- 2 - イル] - 安息香酸メチルエステル、
- 4 - クロロ - 3 - [5 - (2, 6 - ジフルオロ - フェニルカルバモイル) - チオフェン -
- 2 - イル] - 安息香酸エチルエステル、
- 4 - クロロ - 3 - [5 - (2, 6 - ジフルオロ - フェニルカルバモイル) - チオフェン -
- 2 - イル] - 安息香酸プロピルエステル、
- 4 - クロロ - 3 - [5 - (2, 6 - ジフルオロ - フェニルカルバモイル) - チオフェン -
- 2 - イル] - 安息香酸 2 - メトキシ - エチルエステル、
- 5 - (5 - フラン - 2 - イル - 2 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル) - チオフェン - 2 -
- カルボン酸 (2, 6 - ジフルオロ - フェニル) - アミド、

[illegible]

[illegible]

5 - ( 5 - ブロモ - 2 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル ) - チオフェン - 2 - カルボン酸  
( 3 - メチル - ピリジン - 4 - イル ) - アミド、  
5 - ( 2 - エチル - 5 - トリフルオロメチル - フェニル ) - チオフェン - 2 - カルボン酸  
( 3 - メチル - ピリジン - 4 - イル ) - アミド、  
5 - ( 2 - メチル - 5 - トリフルオロメチル - フェニル ) - チオフェン - 2 - カルボン酸  
( 3 - メチル - ピリジン - 4 - イル ) - アミド、  
5 - ( 5 - カルバモイル - 2 - メチル - フェニル ) - チオフェン - 2 - カルボン酸 ( 3 -  
メチル - ピリジン - 4 - イル ) - アミド、  
5 - ( 5 - シアノ - 2 - メチル - フェニル ) - チオフェン - 2 - カルボン酸 ( 3 - メチル  
- ピリジン - 4 - イル ) - アミド、  
3 - [ 5 - ( 2 , 6 - ジフルオロ - フェニルカルバモイル ) - チオフェン - 2 - イル ] -  
4 - メチル安息香酸エチルエステル、  
[ 5 - ( 2 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - フェニル ) - チオフェン - 2 - イルメチ  
ル ] - ( 2 , 6 - ジフルオロ - フェニル ) - アミン、  
3 - フルオロ - N - [ 5 - ( 5 - イソオキサゾ - ル - 5 - イル - 2 - メチル - フェニル )  
- チオフェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
N - [ 5 - ( 5 - イソオキサゾ - ル - 5 - イル - 2 - メチル - フェニル ) - チオフェン -  
イル ] - 3 - メチル - イソニコチンアミド、  
3 , 5 - ジフルオロ - N - [ 5 - ( 5 - イソオキサゾ - ル - 5 - イル - 2 - メチル - フェ  
ニル ) - チオフェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
3 - フロロ - N - [ 5 - ( 5 - イソチアゾ - ル - 5 - イル - 2 - メチル - フェニル ) - チ  
オフェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
N - [ 5 - ( 5 - イソチアゾ - ル - 5 - イル - 2 - メチル - フェニル ) - チオフェン - 2  
- イル ] - 3 - メチル - イソニコチンアミド、  
3 , 5 - ジフルオロ - N - [ 5 - ( 5 - イソチアゾ - ル - 5 - イル - 2 - メチル - フェニ  
ル ) - チオフェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
N - [ 5 - ( 2 - クロロ - 5 - イソオキサゾ - ル - 5 - イル - フェニル ) - チオフェン -  
2 - イル ] - 3 - フルオロイソニコチンアミド、  
N - [ 5 - ( 2 - クロロ - 5 - イソオキサゾ - ル - 5 - イル - フェニル ) - チオフェン -  
2 - イル ] - 3 - メチル - イソニコチンアミド、  
N - [ 5 - ( 2 - クロロ - 5 - イソオキサゾ - ル - 5 - イル - フェニル ) - チオフェン -  
2 - イル ] - 3 , 5 - ジフルオロ - イソニコチンアミド、  
3 - フロロ - N - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - オキサゾ - ル - 5 - イル - フェニル ) - チオ  
フェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
3 - メチル - N - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - オキサゾ - ル - 5 - イル - フェニル ) - チオ  
フェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
3 , 5 - ジフルオロ - N - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - オキサゾ - ル - 5 - イル - フェニル )  
- チオフェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
3 - フルオロ - N - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - チアゾ - ル - 5 - イル - フェニル ) - チオ  
フェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
3 - メチル - N - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - チアゾ - ル - 5 - イル - フェニル ) - チオフ  
ェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
3 , 5 - ジフルオロ - N - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - チアゾ - ル - 5 - イル - フェニル )  
- チオフェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
N - [ 5 - ( 2 - クロロ - 5 - オキサゾ - ル - 5 - イル - フェニル ) - チオフェン - 2 -  
イル ] - 3 - フルオロ - イソニコチンアミド、  
N - [ 5 - ( 2 - クロロ - 5 - オキサゾ - ル - 5 - イル - フェニル ) - チオフェン - 2 -  
イル ] - 3 - メチル - イソニコチンアミド、  
N - [ 5 - ( 2 - クロロ - 5 - オキサゾ - ル - 5 - イル - フェニル ) - チオフェン - 2 -  
イル ] - 3 , 5 - ジフルオロ - イソニコチンアミド、

3 - フルオロ - N - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - オキサゾ - ル - 2 - イル - フェニル ) - チ  
 オフェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
 3 - メチル - N - [ 5 - ( 2 - メチル ) - 5 - オキサゾ - ル - 2 - イル - フェニル ) - チ  
 オフェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
 3 , 5 - ジフルオロ - N - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - オキサゾ - ル - 2 - イル - フェニル  
 ) - チオフェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
 3 - フルオロ - N - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - チアゾ - ル - 2 - イル - フェニル ) - チオ  
 フェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
 3 - メチル - N - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - チアゾ - ル - 2 - イル - フェニル ) - チオフ  
 ェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
 3 , 5 - ジフルオロ - N - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - チアゾ - ル - 2 - イル - フェニル )  
 - チオフェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
 N - [ 5 - ( 2 - クロロ - 5 - オキサゾ - ル - 2 - イル - フェニル ) - チオフェン - 2 -  
 イル ] - 3 - フルオロイソニコチンアミド、  
 N - [ 5 - ( 2 - クロロ - 5 - オキサゾ - ル - 2 - イル - フェニル ) - チオフェン - 2 -  
 イル ] - 3 - メチル - イソニコチンアミド、  
 N - [ 5 - ( 2 - クロロ - 5 - オキサゾ - ル - 2 - イル - フェニル ) - チオフェン - 2 -  
 イル ] - 3 , 5 - ジフルオロ - イソニコチンアミド、  
 3 - フルオロ - N - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール 2 - イル  
 - フェニル ) - チオフェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
 3 - メチル - N - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール 2 - イル -  
 フェニル ) - チオフェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
 3 , 5 - ジフルオロ - N - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール 2  
 - イル - フェニル ) - チオフェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
 3 - フルオロ - N - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - [ 1 , 3 , 4 ] チアジアゾール 2 - イル -  
 フェニル ) - チオフェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
 3 - メチル - N - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール 2 - イル -  
 フェニル ) - チオフェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
 3 , 5 - ジフルオロ - N - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - [ 1 , 3 , 4 ] チアジアゾール 2 -  
 イル - フェニル ) - チオフェン - 2 - イル ] - イソニコチンアミド、  
 N - [ 5 - ( 2 - クロロ - 5 - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール 2 - イル - フェニル ) -  
 チオフェン - 2 - イル ] - 3 - フルオロイソニコチンアミド、  
 N - [ 5 - ( 2 - クロロ - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール 2 - イル - フェニル ) - チオ  
 フェン - 2 - イル ] - 3 - メチル - イソニコチンアミド、  
 N - [ 5 - ( 2 - クロロ - 5 - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール 2 - イル - フェニル ) -  
 チオフェン - 2 - イル ] - 3 , 5 - ジフルオロ - イソニコチンアミド、  
 2 , 6 - ジフルオロ - N - [ 5 - ( 3 - トリフルオロメチル - フェニル ) - チオフェン -  
 2 - イル ] - ベンズアミド、  
 3 - [ 5 - ( 2 , 6 - ジフルオロ - ベンゾイルアミノ ) - チオフェン - 2 - イル ] - 4 -  
 メチル安息香酸メチルエステル、  
 2 , 6 - ジフルオロ - N - [ 5 - ( 2 - メチル - 5 - オキサゾ - ル - 2 - イル - フェニル  
 ) - チオフェン - 2 - イル ] - ベンズアミド、  
 又はその薬理学的に許容できる塩、溶媒和化合物、若しくは包接化合物。

【請求項 16】

細胞に請求項 1 から 15 のいずれか 1 項記載の化合物を投与することを含んでなる、i n v i t r o における免疫細胞活性化の阻害方法。

【請求項 17】

患者体内の免疫細胞活性化を阻害する薬品を生産するための医薬を製造するための、請求項 1 から 15 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。

【請求項 18】

細胞に請求項 1 から 1 5 のいずれか 1 項記載の化合物を投与することを含んでなる、i n v i t r oにおける細胞内でのサイトカイン産生の阻害方法。

【請求項 1 9】

患者体内のサイトカインの産生を阻害する医薬を製造するための、請求項 1 から 1 5 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。

【請求項 2 0】

前記サイトカインが I L - 2、I L - 4、I L - 5、I L - 1 3、G M - C S F、I F N - 、T N F - 及びそれらの組み合わせからなる群から選択される、請求項 1 9 記載の使用。

【請求項 2 1】

イオンチャネルが免疫細胞活性化に関与する場合における、i n v i t r oにおける細胞内の前記イオンチャネルの調節方法であって、請求項 1 から 1 5 のいずれか 1 項記載の化合物を投与することを含んでなる方法。

【請求項 2 2】

患者体内のイオンチャネルを調節する医薬を製造するための、請求項 1 から 1 5 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。

【請求項 2 3】

前記イオンチャネルが  $C a^{2+}$  放出活性化型  $C a^{2+}$  チャネル ( C R A C ) である、請求項 2 2 記載の使用。

【請求項 2 4】

i n v i t r oにおける抗原に反応した T 細胞及び / 又は B 細胞の増殖の阻害方法であって、細胞に請求項 1 から 1 5 のいずれか 1 項記載の化合物を投与することを含んでなる方法。

【請求項 2 5】

患者体内で T 細胞及び / 又は B 細胞の増殖を阻害する医薬を製造するための、請求項 1 から 1 5 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。

【請求項 2 6】

免疫不全の治療又は予防を必要とする患者における、免疫疾患の治療又は予防の医薬を製造するための、請求項 1 から 1 5 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。

【請求項 2 7】

患者の炎症性疾患を治療又は予防する医薬を製造するための、請求項 1 から 1 5 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。

【請求項 2 8】

患者の免疫系を抑制する医薬を製造するための、請求項 1 から 1 5 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。

【請求項 2 9】

細胞に請求項 1 から 1 5 のいずれか 1 項記載の化合物を投与することを含んでなる、i n v i t r oでのマスト細胞の脱顆粒の阻害方法。

【請求項 3 0】

患者におけるマスト細胞の脱顆粒を阻害する医薬を製造するための、請求項 1 から 1 5 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。

【請求項 3 1】

患者のアレルギー性疾患の治療又は予防する医薬を製造するための、請求項 1 から 1 5 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。

【請求項 3 2】

薬理学的に許容できる担体、及び請求項 1 から 1 5 のいずれか 1 項記載の化合物を含んでなる医薬組成物。