

【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17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2004-534774(P2004-534774A)

【公表日】平成16年11月18日(2004.11.18)

【年通号数】公開・登録公報2004-045

【出願番号】特願2002-591503(P2002-591503)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 471/04

A 6 1 K 31/407

A 6 1 K 31/41

A 6 1 K 31/4155

A 6 1 K 31/437

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 27/16

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00

C 0 7 D 487/04

C 0 7 D 497/16

【F I】

C 0 7 D 471/04 1 0 4 A

A 6 1 K 31/407

A 6 1 K 31/41

A 6 1 K 31/4155

A 6 1 K 31/437

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 27/16

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 487/04 1 3 7

C 0 7 D 497/16

【手続補正書】

【提出日】平成17年3月31日(2005.3.31)

【手続補正1】

【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

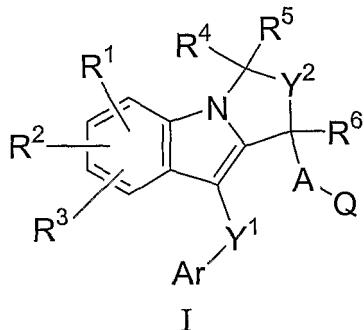
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式Iの化合物ならびに該化合物の製薬上許容される塩および水和物。

【化1】



[式中、

 R^1 、 R^2 および R^3 はそれぞれ独立に、水素および R^g から選択され； R^4 は、H、CN、1～6個のハロゲンで置換されていても良い C_{1-6} アルキル、O R^a および $S(O)_n C_{1-6}$ アルキルから選択され； R^5 は、H および 1～6 個のハロゲンで置換されていても良い C_{1-6} アルキルから選択され；あるいは R^4 および R^5 が一体となってオキソを表し；あるいは R^4 および R^5 が一体となって F、CF₃ および CH₃ から選択される 1 個もしくは 2 個の基で置換されていても良い NR^f、S および O から選択される 0 個または 1 個のヘテロ原子を有する 3 員もしくは 4 員環を形成してあり； R^6 は、H および独立に OR^a およびハロゲンから選択される 1～6 個の基で置換されていても良い C_{1-6} アルキルから選択され；Ar は、それぞれ独立に R^g から選択される 1～4 個の基で置換されていても良いアリールまたはヘテロアリールであり；A は、1～4 個のハロゲン原子、O(CH₂)₁₋₂、S(CH₂)₁₋₂ で置換されていても良い C_{1-3} アルキルであり；

Q は、

(1) COOH、

(2) CONR^a R^b、(3) C(O)NHSO₂ R^c、(4) SO₂NHR^a、(5) SO₃H、(6) PO₃H₂ および

(7) テトラゾリル

から選択され；

 Y^1 は、-(CR^d R^e)_a-X-(CR^d R^e)_b-、フェニレン、C₃₋₆ シクロアルキリデンまたはC₃₋₆ シクロアルキレンであり；a および b は0～1の整数であって、a および b の合計は0、1または2に等しく；X は、結合、O、S、NR^a、C(O)、OC(O)、C(O)O、C(O)NR^a、OC(O)NR^a、NR^aC(O)、CR^d=CR^e またはC-C であり； Y^2 は、CR^d R^e、CR^d R^e-CR^d R^e またはCR^d=CR^e であり； R^a および R^b は独立に、H、C₁₋₁₀ アルキル、C₂₋₁₀ アルケニル、C₂₋₁₀ アルキニル、Cy および Cy C₁₋₁₀ アルキルから選択され；前記のアルキル、アルケニル、アルキニルおよび Cy は、独立にハロゲン、アミノ、カルボキシ、C₁₋₄ アルキル、C₁₋₄ アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、アリール C₁₋₄ アルキル、ヒドロキシ、CF₃、OC(O)C₁₋₄ アルキル、OC(O)NRⁱ R^j およびアリールオキシから選択される 1～6 個の置換基で置換されていても良く；あるいは R^a および R^b がそれらが結合している原子と一体となって、独立に酸素、硫黄および N-R^f から選択される 0～2 個の別のヘテロ原子を有する 4～7 員のヘテロ環を形成し

ており；

R^c は、1～6個のハロゲンで置換されていても良い C_{1-6} アルキル、アリールおよびヘテロアリールから選択され；前記のアリールおよびヘテロアリールは、ハロゲン、 O C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルキルで置換されていても良く、前記アルキルは1～6個のハロゲンで置換されていても良く；

R^d および R^e は独立に、H、ハロゲン、アリール、ヘテロアリール、 C_{1-6} アルキルまたはハロ C_{1-6} アルキルであるか；あるいは

R^f は、H、 C_{1-6} アルキル、ハロ C_{1-6} アルキル、 Cy 、 $C(O)C_{1-6}$ アルキル、 $C(O)H$ C_{1-6} アルキルおよび $C(O)-Cy$ から選択され；

R^g は、

(1) ハロゲン、

(2) CN 、

(3) 独立にアリール、ヘテロアリール、ハロゲン、 NR^aR^b 、 $C(O)R^a$ 、 $C(OR^a)R^aR^b$ 、 SR^a および OR^a から選択される1～8個の基で置換されていても良い C_{1-6} アルキルであって、前記アリール、ヘテロアリールおよびアルキルがそれぞれ、独立にハロゲン、 CF_3 および $COOH$ から選択される1～6個の基で置換されていても良いもの、

(4) 独立にハロゲンおよび OR^a から選択される1～6個の基で置換されていても良い C_{2-6} アルケニル、

(5) Cy 、

(6) $C(O)R^a$ 、

(7) $C(O)OR^a$ 、

(8) $C(ONR^a)R^b$ 、

(9) $OCONR^aR^b$ 、

(10) OC_{1-6} アルキルであって、前記アルキルがハロゲン、アリール、ヘテロアリール、 OH および $OC(O)R^a$ から選択される1～6個の置換基で置換されていても良いもの、

(11) $O-$ アリール、

(12) $O-$ ヘテロアリール、

(13) $S(O)_nC_{1-6}$ アルキルであって、前記アルキルがハロゲン、アリール、ヘテロアリール、 OH および $OC(O)R^a$ から選択される1～6個の置換基で置換されていても良いもの、

(14) $S(O)_n$ アリール、

(15) $S(O)_n$ ヘテロアリール、

(16) $-NR^aS(O)_nR^b$ 、

(17) $-NR^aR^b$ 、

(18) $-NR^aC(O)R^b$ 、

(19) $-NR^aC(O)OR^b$ 、

(20) $-NR^aC(O)NR^aR^b$ 、

(21) $S(O)_nNR^aR^b$ 、

(22) NO_2 、

(23) C_{5-8} シクロアルケニル

から選択され； Cy は、ハロゲン、 $C(O)R^a$ 、 OR^a 、 C_{1-3} アルキル、アリール、ヘテロアリールおよび CF_3 から独立に選択される1～8個の基で置換されていても良く；

R^i および R^j は独立に、水素、 C_{1-10} アルキル、 Cy および CyC_{1-10} アルキルから選択され；あるいは

R^i および R^j はそれらが結合している炭素と一体となって、酸素、硫黄および窒素から独立に選択される0～2個のヘテロ原子を有する5～7員の環を形成しており；

Cy は、複素環、アリールおよびヘテロアリールから選択され；

n は 0、1 または 2 である。】

【請求項 2】

Y^1 が結合、O、S、NR^a、CHR^d、CHR^dCHR^d、C(O)、C(O)CH^d、フェニレンおよびC₃～₆シクロアルキリデンから選択される請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

Y^1 が S、CH₂ および C(O) から選択される請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

A が 1～4 個のハロゲン原子で置換されても良い C₁～₃ アルキルであり、Q が COOH である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

A - Q が CH₂COOH である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

Y^2 が CH₂ および CH₂CH₂ から選択される請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

Ar が、ハロゲン、アリール、1～6 個のハロゲンで置換されても良い S(O)_n、C₁～₆ アルキル、1～5 個のハロゲン原子で置換されても良い C₁～₆ アルキル、CN、CONR^aR^b および C(O)R^a から独立に選択される 1～3 個の基で置換されても良いフェニルまたはナフチルであり； R^a および R^b が請求項 1 で定義の通りである請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

Ar が、ハロゲン、アリール、1～6 個のハロゲンで置換されても良い S(O)_n、C₁～₆ アルキル、1～5 個のハロゲン原子で置換されても良い C₁～₆ アルキル、CN、CONR^aR^b および C(O)R^a から独立に選択される 1～3 個の基で置換されても良いフェニルであり； R^a および R^b が請求項 1 で定義の通りである請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

Ar が第 2 のハロゲン原子で置換されても良い 4-クロロフェニルである請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

R⁴ および R⁵ がそれぞれ水素である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

Y^1 が C(O)、S および CH₂ から選択され； Y^2 が CH₂ または CH₂CH₂ であり； R⁴ および R⁵ がそれぞれ水素であり； A - Q が CH₂COOH である請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 12】

Y^1 が C(O)、S および CH₂ から選択され； Y^2 が CH₂ または CH₂CH₂ であり； R⁴ および R⁵ がそれぞれ水素であり； A - Q が CH₂COOH である請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 13】

R¹、R² および R³ が独立に、水素、CN、ハロゲン、S(O)_nC₁～₃ アルキル、OC₁～₆ アルキル（ハロゲン、アリール、ヘテロアリール、OH および OC(O)R^a から選択される 1～6 個の置換基で置換されても良い）、C₁～₆ アルキル（アリール、ヘテロアリール、ハロゲン、NR^aR^b、C(O)R^a、C(OR^a)R^aR^b、SR^a および OR^a から選択される 1～8 個の基で置換されても良く、アリール、ヘテロアリールおよびアルキルはそれぞれ、ハロゲン、CF₃ および COOH から選択される 1～6 個の基で置換されても良い）、Cy、C₂～₆ アルケニル（ハロゲンおよび OR^a から独立に選択される 1～6 個の基で置換されても良い）、C(O)OC₁～₃ アルキル、S(O)_nNR^aR^b、C(O)R^a、C(OH)R^aR^b、C₅～₈ シクロアルケニルおよび C(OC₁～₃ アルキル)R^aR^b から選択され； Cy が、ハロゲン

、 $C(O)R^a$ 、 OR^a 、 C_{1-3} アルキル、アリール、ヘテロアリールおよび CF_3 から独立に選択される1~8個の基で置換されていても良く； $n=0$ 、1もしくは2であり； R^a および R^b が独立に、水素およびハロゲンで置換されていても良い C_{1-6} アルキルから選択される請求項1に記載の化合物。

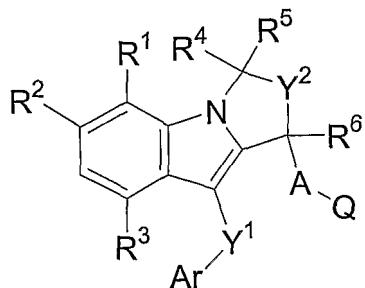
【請求項14】

R^1 、 R^2 および R^3 のうちのいずれかが水素である請求項13に記載の化合物。

【請求項15】

下記式Iaの構造を有する請求項1に記載の化合物。

【化2】



Ia

【請求項16】

R^1 、 R^2 および R^3 が独立に、水素、 CN 、ハロゲン、 $S(O)_nC_{1-3}$ アルキル、 OC_{1-6} アルキル（ハロゲン、アリール、ヘテロアリール、 OH および $OC(O)R^a$ から選択される1~6個の置換基で置換されていても良い）、 C_{1-6} アルキル（アリール、ヘテロアリール、ハロゲン、 NR^aR^b 、 $C(O)R^a$ 、 $C(OR^a)R^aR^b$ 、 SR^a および OR^a から選択される1~8個の基で置換されていても良く、アリール、ヘテロアリールおよびアルキルはそれぞれ、ハロゲン、 CF_3 および $COOH$ から選択される1~6個の基で置換されていても良い）、 Cy 、 C_{2-6} アルケニル（ハロゲンおよび OR^a から独立に選択される1~6個の基で置換されていても良い）、 $C(O)OC_{1-3}$ アルキル、 $S(O)_nNR^aR^b$ 、 $C(O)R^a$ 、 $C(OH)R^aR^b$ 、 C_{5-8} シクロアルケニルおよび $C(OC_{1-3})$ アルキル） R^aR^b から選択され； Cy が、ハロゲン、 $C(O)R^a$ 、 OR^a 、 C_{1-3} アルキル、アリール、ヘテロアリールおよび CF_3 から独立に選択される1~8個の基で置換されていても良く； $n=0$ 、1もしくは2であり； R^a および R^b が独立に、水素およびハロゲンで置換されていても良い C_{1-6} アルキルから選択される請求項15に記載の化合物。

【請求項17】

R^1 が水素であり； $A-Q$ が CH_2COOH である請求項16に記載の化合物。

【請求項18】

R^2 がハロゲン、 $S(O)_nC_{1-3}$ アルキル、 OC_{1-6} アルキル（アリールで置換されていても良い）、 CN 、 C_{2-6} アルケニル、1-および2-メチルテトラゾリル、1-メチルピロリルおよび C_{1-6} アルキルから選択される請求項17に記載の化合物。

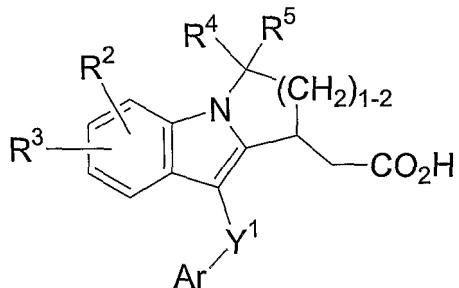
【請求項19】

R^3 が、ハロゲン、 $S(O)_nC_{1-3}$ アルキル、 OC_{1-6} アルキル、 $C(O)R^a$ 、 C_{1-6} アルキル（3~6個のハロゲン原子ならびに OR^a 、 SR^a から選択される0個もしくは1個の基で置換されていても良い）、 C_{2-6} アルケニル、 C_{5-8} シクロアルケニル、フェニル（ C_{1-3} アルキル、 OR^a およびピラゾリルから選択される基で置換されていても良い）、ナフチルおよびピロリル、チエニル、ピラゾリル、キノリニル、ベンゾチエニル、イソオキサリル、ピリジル（それぞれ、 C_{1-3} アルキルで置換されていても良い）から選択されるヘテロアリールから選択される請求項17に記載の化合物。

【請求項20】

下記式 I b の構造を有する請求項 1 に記載の化合物。

【化 3】



Ib

[式中、Y¹ は、O、S、C(O) または CH₂ であり；R⁴ および R⁵ はそれぞれ水素であるか、あるいは R⁴ と R⁵ が一体となってオキソを表し；R² および R³ は 1 個もしくは 2 個の非 H 置換基を表す。]

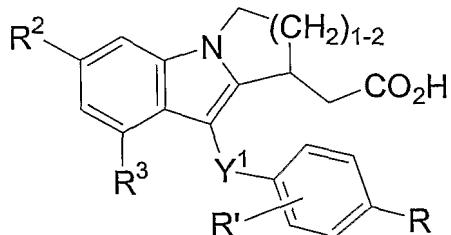
【請求項 2 1】

R⁴ および R⁵ がそれぞれ水素であり；R² が、ハロゲン、S(O)_nC₁~₃アルキル、OC₁~₆アルキル（アリールで置換されていても良い）、CN、C₂~₆アルケニル、1-および 2-メチルテトラゾリル、1-メチルピロリルおよび C₁~₆アルキルから選択され；R³ が、ハロゲン、S(O)_nC₁~₃アルキル、OC₁~₆アルキル、C(O)R^a、C₁~₆アルキル（3~6 個のハロゲン原子ならびに OR^a、SR^a から選択される 0 個もしくは 1 個の基で置換されていても良い）、C₂~₆アルケニル、C₅~₈シクロアルケニル、フェニル（C₁~₃アルキル、OR^a およびピラゾリルから選択される基で置換されていても良い）、ナフチルおよびピロリル、チエニル、ピラゾリル、キノリル、ベンゾチエニル、イソオキサリル、ピリジル（それぞれ、C₁~₃アルキルで置換されていても良い）から選択されるヘテロアリールから選択され；Ar が、1-および 2-ナフチル、フェニル（ハロゲン、アリール、1~6 個のハロゲンで置換されていても良い S(O)_nC₁~₆アルキル、1~5 個のハロゲン原子で置換されていても良い C₁~₆アルキル、CN、CONR^aR^b および C(O)R^a から独立に選択される 1~3 個の基で置換されていても良く；R^a および R^b が請求項 1 で定義の通りである）ならびにそれぞれ 1 個もしくは 2 個のハロゲン原子で置換されていても良いフリル、ピリジル、ベンゾチアゾリル、キノリニルおよびピリミジニルから選択されるヘテロアリールから選択される請求項 2 0 に記載の化合物。

【請求項 2 2】

下記式 I c の構造を有する請求項 1 に記載の化合物。

【化 4】



Ic

[式中、Y¹ は C(O)、CH₂ または S であり；R および R' は独立に、水素、ハロ

ゲン、シアノ、 $C_{1\sim 3}$ アルカノイルまたは $C F_3$ であり； R^2 は、ハロゲン、 $S(O)_n C_{1\sim 3}$ アルキル、 $O C_{1\sim 6}$ アルキル（アリールで置換されていても良い）、 CN 、 $C_{2\sim 6}$ アルケニル、1-もしくは2-メチルテトラゾリル、1-メチルピロリルおよび $C_{1\sim 6}$ アルキルから選択され； R^3 は、ハロゲン、 $S(O)_n C_{1\sim 3}$ アルキル、 $O C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C(O)R^a$ 、 $C_{1\sim 6}$ アルキル（3~6個のハロゲン原子ならびに OR^a 、 SR^a から選択される0個もしくは1個の基で置換されていても良い）、 $C_{2\sim 6}$ アルケニル、 $C_{5\sim 8}$ シクロアルケニル、フェニル（ $C_{1\sim 3}$ アルキル、 OR^a およびピラゾリルから選択される基で置換されていても良い）、ナフチルおよびピロリル、チエニル、ピラゾリル、キノリル、ベンゾチエニル、イソオキサリル、ピリジル（それぞれ、 $C_{1\sim 3}$ アルキルで置換されていても良い）から選択されるヘテロアリールから選択される。】

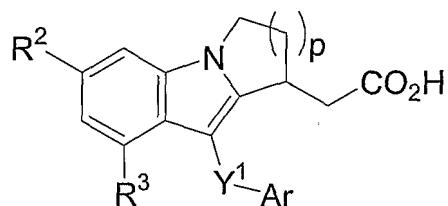
【請求項23】

R^2 がFであり； R がC1であり； R が水素であり； R^3 が、ハロゲン、 $S(O)_n C_{1\sim 3}$ アルキル、 $O C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C(O)R^a$ 、 $C_{1\sim 6}$ アルキル（3~6個のハロゲン原子ならびに OR^a 、 SR^a から選択される0個もしくは1個の基で置換されていても良い）、 $C_{2\sim 6}$ アルケニル、 $C_{5\sim 8}$ シクロアルケニル、フェニル（ $C_{1\sim 3}$ アルキル、 OR^a およびピラゾリルから選択される基で置換されていても良い）、ナフチルおよびピロリル、チエニル、ピラゾリル、キノリニル、ベンゾチエニル、イソオキサリル、ピリジル（それぞれ、 $C_{1\sim 3}$ アルキルで置換されていても良い）から選択されるヘテロアリールから選択される請求項22に記載の化合物。

【請求項24】

下記のものから選択される化合物。

【表1】



R ²	R ³	Y ¹	Ar	p
H	H	CH ₂	4-Cl-Ph	2
H	H	CH ₂	4-Cl-Ph	1
H	H	S	4-Cl-Ph	2
CH ₃ S(O) ₂	H	S	4-Cl-Ph	2
H	CH ₃ S(O)	-	4-Cl-Ph	2
H	CH ₃ S(O)	CH ₂	4-Cl-Ph	2
F	Br	S	4-Cl-Ph	1
F	Br	S	4-Cl-Ph	2
CH ₃ S(O) ₂	CH ₃ O	S	4-Cl-Ph	2
F	CH ₃ C(O)	S	4-Cl-Ph	1
F	CF ₃ C(O)	S	4-Cl-Ph	1
F	CF ₃ CH(OH)	S	4-Cl-Ph	1
F	(CH ₃) ₂ CHCH(OH)	S	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ CH(OH)	S	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ CH(OCH ₃)	S	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ C(O)	S	Ph	1
F	CH ₃ C(O)	S	3,4-ジCl-Ph	1
F	CF ₃ CH(OCH ₃)	S	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ CH ₂ CH(OH)	S	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ CH ₂ CH(OCH ₃)	S	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ CH(SCH ₃)	S	4-Cl-Ph	1
CH ₃ O	CH ₃ S(O) ₂	S	4-Cl-Ph	1
PhCH ₂ O	CH ₃ S(O) ₂	S	4-Cl-Ph	1
CH ₃ S	CH ₃ S(O) ₂	S	4-Cl-Ph	1
CH ₃ S(O) ₂	(CH ₃) ₂ CH	S	4-Cl-Ph	1
(CH ₃) ₂ CHO	CH ₃ S(O) ₂	S	4-Cl-Ph	1
PhCH ₂ O	(CH ₃) ₂ CH	S	4-Cl-Ph	1

R ²	R ³	Y ¹	Ar	p
CH ₃ O	(CH ₃) ₂ CH	S	4-Cl-Ph	1
4-Cl-Ph	CH ₃ S(O) ₂	S	4-Cl-Ph	1
I	Br	S	4-Cl-Ph	1
CN	Br	S	4-Cl-Ph	1
2-CH ₃ -5-Tz#	Br	S	4-Cl-Ph	1
1-CH ₃ -5-Tz	Br	S	4-Cl-Ph	1
1-CH ₃ -2-ヒドロリル	Br	S	4-Cl-Ph	1
CN	CH ₃ C(O)	S	4-Cl-Ph	1
2-CH ₃ -5-Tz	CH ₃ C(O)	S	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ S(O) ₂	S	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ CH ₂ S(O) ₂	S	4-Cl-Ph	1
F	1-CH ₃ -2-ヒドロリル	S	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ CH ₂ CH ₂	S	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ CH ₂	S	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ C(=CH ₂)	S	4-Cl-Ph	1
F	1-CH ₃ -5-ヒドロリル	S	4-Cl-Ph	1
F	(CH ₃) ₂ CH	S	4-Cl-Ph	1
F	1-シクロヘキソテニル	S	4-Cl-Ph	1
F	(CH ₃ CH=)(CH ₃ CH ₂)C	S	4-Cl-Ph	1
F	(CH ₃ CH ₂) ₂ CH	S	4-Cl-Ph	1
F	シクロヘキソチル	S	4-Cl-Ph	1
F	Ph	S	4-Cl-Ph	1
F	2-チエニル	S	4-Cl-Ph	1
F	3-CH ₃ -2-チエニル	S	4-Cl-Ph	1
F	CH ₂ =CH	S	4-Cl-Ph	1
CH ₂ =CH	Br	S	4-Cl-Ph	1
F	(CF ₃) ₂ C(OH)	S	4-Cl-Ph	1
F	3-チエニル	S	4-Cl-Ph	1
シクロヘキソチル	1-CH ₃ -2-ヒドロリル	S	4-Cl-Ph	1
2-CH ₃ -5-Tz	1-CH ₃ -2-ヒドロリル	S	4-Cl-Ph	1
2-CH ₃ -5-Tz	Ph	S	4-Cl-Ph	1

R ²	R ³	Y ¹	Ar	p
F	シクロ [¶] ヒ [¶] ル	S	4-Cl-Ph	1
F	Br	CH ₂	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ S(O)2	CO	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ S(O)2	CH ₂	4-Cl-Ph	1
F	(CF ₃) ₂ C(OCH ₃)	S	4-Cl-Ph	1
F	(CH ₃) ₂ CH	C(O)	4-Cl-Ph	1
F	1-CH ₃ -2-ヒ [¶] ル	C(O)	4-Cl-Ph	1
F	(CH ₃) ₂ CH	CH ₂	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ S(O)2	CH ₂	2,4-ジ [¶] Cl-Ph	1
F	CH ₃ S(O)2	CH ₂	2,6-ジ [¶] Cl-Ph	1
F	Br	C(O)	4-Cl-Ph	1
F	シクロ [¶] ヒ [¶] ル	C(O)	4-Cl-Ph	1
F	(CH ₃ O)(CH ₃ CH ₂)CH	C(O)	4-Cl-Ph	1
F	Ph	C(O)	4-Cl-Ph	1
F	2-チエニル	C(O)	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ S(O)2	CH ₂	2,4,6-トリCl-Ph	1
F	CH ₃ S(O)2	S	2,4,5-トリCl-Ph	1
F	CH ₃ S(O)2	C(O)	4-ヒ [¶] ニル	1
F	CH ₃ S(O)2	C(O)	2-ナフチル	1
F	Br	C(O)	2-ナフチル	1
*F	CH ₃ S(O)2	S	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ S(O)2	C(O)	2-ブリル	1
F	CH ₃ S(O)2	C(O)	2,4-ジ [¶] Cl-Ph	1
F	CH ₃ S(O)2	C(O)	4-Cl-2-CH ₃ S(O)2-Ph	1
F	Br	C(O)	4-Cl-2-I-Ph	1
F	Br	C(O)	4-Cl-2-CONH ₂ -Ph	1
F	CH ₃ S(O)2	C(O)	4-Cl-2-CN-Ph	1
F	(CH ₃) ₂ CH	C(O)	4-Cl-2-I-Ph	1
F	Br	C(O)	2-ヘンツ [¶] チアゾ [¶] リル	1

R ²	R ³	Y ¹	Ar	p
F	(CH ₃) ₂ CH	C(O)	4-Cl-2-CH ₃ S(O) ₂ -Ph	1
F	CH ₃ S(O) ₂	S	4-CF ₃ -Ph	1
F	CH ₃ S(O) ₂	S	4-CH ₃ S(O) ₂ -Ph	1
F	Br	C(O)	2-キノリニル	1
F	CH ₃ S(O) ₂	C(O)	2-キノリニル	1
F	Br	S	2-ヘンツ'チアゾ'リル	1
F	CH ₃ S(O) ₂	S	2-ヘンツ'チアゾ'リル	1
2-CH ₃ -5-Tz	CH ₃ S(O) ₂	S	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ S(O) ₂	CH(CH ₃)	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ S(O) ₂	C(O)CH ₂ **	4-Cl-Ph	1
F	(CH ₃) ₂ CH	S	1-ナフチル	1
F	(CH ₃) ₂ CH	S	2-ナフチル	1
F	Br	S	2-ヒ'リミジ'ニル	1
F	CH ₃ S(O) ₂	S	2-ヒ'リミジ'ニル	1
F	CH ₃ S(O) ₂	CH ₂ CH ₂	4-Cl-Ph	1
2-CH ₃ -5-Tz	(CH ₃ O)(CH ₃ CH ₂)CH	S	4-Cl-Ph	1
F	(CH ₃) ₂ CH	C(O)	2-ナフチル	1
F	CH ₃ S(O) ₂	S	2-ナフチル	1
F	(CH ₃) ₂ CH	S	4-Cl-2-F-Ph	1
F	CH ₃ S(O) ₂	S	4-Cl-2-F-Ph	1
F	2-CH ₃ -Ph	S	4-Cl-Ph	1
F	8-キノリニル	S	4-Cl-Ph	1
F	3-ヘンツ'チエニル	S	4-Cl-Ph	1
F	3,5-diCH ₃ -4-イツオキサリル	S	4-Cl-Ph	1
F	4-CH ₃ -3-チエニル	S	4-Cl-Ph	1
F	3-(1-ヒ'ラゾ'リル)-Ph	S	4-Cl-Ph	1
F	2-(HC(O))-3-チエニル	S	4-Cl-Ph	1
F	2-OCH ₃ -Ph	S	4-Cl-Ph	1
F	3,4-diCl-Ph	S	4-Cl-Ph	1

R ²	R ³	Y ¹	Ar	p
F	6-キノリニル	S	4-Cl-Ph	1
F	2-ナフチル	S	4-Cl-Ph	1
F	CN	S	4-Cl-Ph	1
F	(CH ₃) ₂ CH	C(O)	1-ナフチル	1
F	(CH ₃) ₂ CH	C(O)	3,4-ジ'Cl-Ph	1
F	(CH ₃) ₂ CH	S	4-Cl-Ph	2
F	(CH ₃) ₂ CH	C(O)	2-ナフチル	2
F	(CH ₃) ₂ CH	C(O)	4-Cl-Ph	2
F	CH ₃ S(O) ₂	S	4-Cl-Ph	2
F	CH ₃ S(O) ₂	1,4-フェニレン	Ph	1
F	CH ₃ S(O) ₂	-	2-ナフチル	1
F	CH ₃ S(O) ₂	1,3-フェニレン	Ph	1
CN	(CH ₃) ₂ CH	S	4-Cl-Ph	1
2-CH ₃ -5-Tz	(CH ₃) ₂ CH	S	4-Cl-Ph	1
1-CH ₃ -5-Tz	(CH ₃) ₂ CH	S	4-Cl-Ph	1
CH ₃ S(O) ₂	CH ₃ S(O) ₂	S	4-Cl-Ph	1
H	1-CH ₃ -2-ヒドリル	S	4-Cl-Ph	1
F	3-ヒドリジル	S	4-Cl-Ph	1
F	CH ₃ S(O) ₂	C(O)	4-Cl-Ph	2
F	CH ₃ S(O) ₂	C(O)	2-ナフチル	2
F	(CH ₃) ₂ CH	C(O)	3-Br-4-Cl-Ph	2
F	(CH ₃) ₂ CH	CH ₂	4-Cl-Ph	2
F	(CH ₃) ₂ CH	S	3-Br-4-Cl-Ph	2
F	(CH ₃)(CH ₂ =)C	C(O)	4-Cl-Ph	2
F	CH ₃ S(O) ₂	C(O)	6-Cl-Pyr##	2
F	CH ₃ S(O) ₂	C(O)	3,4-ジ'Cl-Ph	2
F	CH ₃ S(O) ₂	C(O)	4-nBu-Ph	2
F	CH ₃ S(O) ₂	C(O)	4-Ph-Ph	2
PhCH ₂ O	CH ₃ S(O) ₂	S	4-Cl-Ph	2
PhCH ₂ S	CH ₃ S(O) ₂	S	4-Cl-Ph	1

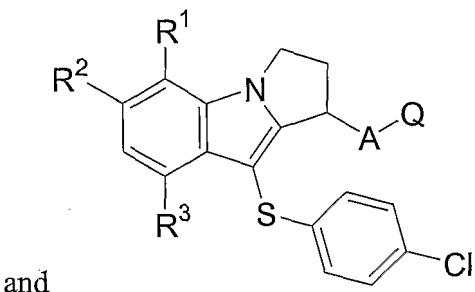
R ²	R ³	Y ¹	Ar	p
F	CH ₃ S(O)2	C(O)	4-Cl-Ph	2

T_zはテトラゾリルである。

P_yrはピリジルである。

* 実施例37の3-オキソ類縁体

** Y¹-Ar = -C(O)-CH₂-(4-Cl-Ph),



R ¹	R ²	R ³	A-Q
F	F	1-CH ₃ -2-ヒドロ	CH ₂ CO ₂ H
F	F	CH ₃ S(O)2	CH ₂ CO ₂ H
F	F	S-(4-Cl-Ph)	CH ₂ CO ₂ H
CH ₃ S(O)2	F	CH ₃ S(O)2	CH ₂ CO ₂ H
CH ₃ S(O)2	CH ₃ O	CH ₃ S(O)2	CH ₂ CO ₂ H
F	H	CH ₃ S(O)2	CH ₂ CO ₂ H
H	F	Br	CF ₂ CO ₂ H
*H	F	Br	CF ₂ CO ₂ H
H	F	CH ₃ S(O)2	CF ₂ CO ₂ H

*実施例141のスルホキシド

【請求項25】

請求項1ないし24のいずれかに記載の化合物、塩もしくは水和物および製薬上許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項26】

抗ヒスタミン剤、ロイコトリエン拮抗薬およびロイコトリエン生合成阻害薬から選択される第2の有効成分をさらに含む請求項25に記載の組成物。

【請求項27】

プロスタグランдинD2介在疾患治療用の医薬品製造における、請求項1ないし23のいずれかに記載の式Iの化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくは水和物の使用。

【請求項28】

鼻充血、アレルギー性喘息またはアレルギー性鼻炎治療用の医薬品製造における、請求項1ないし23のいずれかに記載の式Iの化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくは水和物の使用。