

【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5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-508972(P2005-508972A)

【公表日】平成17年4月7日(2005.4.7)

【年通号数】公開・登録公報2005-014

【出願番号】特願2003-538142(P2003-538142)

【国際特許分類】

C 07 D 233/60 (2006.01)  
A 61 K 31/4164 (2006.01)  
A 61 K 31/417 (2006.01)  
A 61 K 31/4178 (2006.01)  
A 61 K 31/4196 (2006.01)  
A 61 K 31/4439 (2006.01)  
A 61 P 1/04 (2006.01)  
A 61 P 1/14 (2006.01)  
A 61 P 1/18 (2006.01)  
A 61 P 3/10 (2006.01)  
A 61 P 5/14 (2006.01)  
A 61 P 7/00 (2006.01)  
A 61 P 7/02 (2006.01)  
A 61 P 7/06 (2006.01)  
A 61 P 7/10 (2006.01)  
A 61 P 9/00 (2006.01)  
A 61 P 9/14 (2006.01)  
A 61 P 11/00 (2006.01)  
A 61 P 11/06 (2006.01)  
A 61 P 13/12 (2006.01)  
A 61 P 15/06 (2006.01)  
A 61 P 15/08 (2006.01)  
A 61 P 15/10 (2006.01)  
A 61 P 17/00 (2006.01)  
A 61 P 17/02 (2006.01)  
A 61 P 19/00 (2006.01)  
A 61 P 19/02 (2006.01)  
A 61 P 19/10 (2006.01)  
A 61 P 25/04 (2006.01)  
A 61 P 25/28 (2006.01)  
A 61 P 27/02 (2006.01)  
A 61 P 29/00 (2006.01)  
A 61 P 31/04 (2006.01)  
A 61 P 31/18 (2006.01)  
A 61 P 35/00 (2006.01)  
A 61 P 35/02 (2006.01)  
A 61 P 35/04 (2006.01)  
A 61 P 37/00 (2006.01)  
A 61 P 37/02 (2006.01)  
A 61 P 37/08 (2006.01)  
A 61 P 43/00 (2006.01)

**C 0 7 D 233/61 (2006.01)**  
**C 0 7 D 249/08 (2006.01)**  
**C 0 7 D 401/12 (2006.01)**  
**C 0 7 D 405/12 (2006.01)**

## 【 F I 】

C 0 7 D 233/60 1 0 3

A 6 1 K 31/4164

A 6 1 K 31/417

A 6 1 K 31/4178

A 6 1 K 31/4196

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/14

A 6 1 P 1/18

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 5/14

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 7/06

A 6 1 P 7/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/14

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 15/06

A 6 1 P 15/08

A 6 1 P 15/10

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 19/00

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 35/04

A 6 1 P 37/00

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 233/61 1 0 2

C 0 7 D 249/08

C 0 7 D 401/12 C S P

C 0 7 D 405/12

## 【手続補正書】

【提出日】平成17年10月24日(2005.10.24)

## 【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

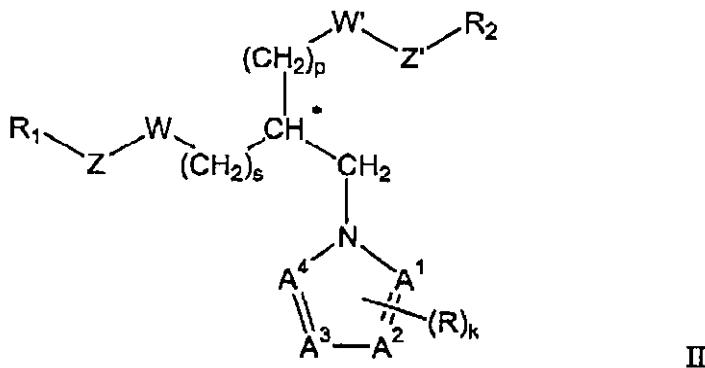
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

癌、炎症、敗血症性ショック、不妊症、早産、痛みまたは虚血に関連する状態の治療のための医薬組成物の製造のための下記式II:

## 【化1】



[式中、A<sup>1</sup> , A<sup>2</sup> , A<sup>3</sup> および A<sup>4</sup> は各々独立して炭素または窒素であり、 A<sup>1</sup> , A<sup>2</sup> , A<sup>3</sup> および A<sup>4</sup> の少なくとも1つが炭素であり；

各Rは独立して、ハロ、ニトロ、任意に置換されてよいアルキル、任意に置換されてよいアルケニル、任意に置換されてよいアルキニル、任意に置換されてよいヘテロアルキル、任意に置換されてよいヘテロアルケニル、任意に置換されてよいヘテロアルキニル、任意に置換されてよいアルカノール、任意に置換されてよい炭素環アリール、任意に置換されてよいヘテロ脂環族、任意に置換されてよいヘテロ芳香族、任意に置換されてよいアラルキル、任意に置換されてよいヘテロアリールアルキル、または任意に置換されてよいヘテロ脂環族アルキルであり；

あるいは隣接する環原子上の2つのR基がその環と一緒にになって4～約8環員をもった縮合した脂環族、ヘテロ脂環族、炭素環アリールまたはヘテロ芳香族基を形成し；

kは整数であり；

sおよびpは、同じか又は異なり、ゼロまたは正の整数であり；

WおよびW'は各々ヘテロ原子であり；

ZおよびZ'は各々独立して、化学結合またはアルカノイルであり；

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は各々独立して、任意に置換されてよい炭素環アリールまたは任意に置換されてよいヘテロ芳香族である]

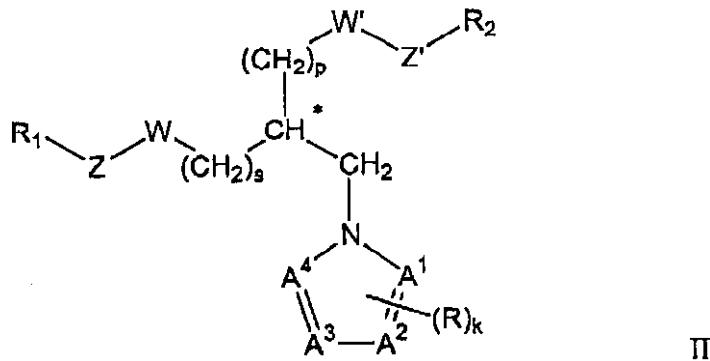
により表される化合物ならびにそれらの医薬として許容される塩の使用。

## 【請求項2】

自己免疫疾患もしくは障害、細菌感染、アレルギー、血管形成障害、臓器低酸素血症、血管過形成、心臓肥大、トロンビンにより誘発される血小板凝集、プロスタグランジンシンターゼ-2に関連する状態、肺炎、喘息、ARDS、糸球体腎炎、リューマチ関節炎、

SLE、強皮症、甲状腺炎、グレーブス病、胃炎、糖尿病、溶血性貧血、炎症性腸疾患、潰瘍性大腸炎、クローン病、乾癬、移植片対宿主病、骨関節症、細菌性赤痢、浮腫、発熱、眼性新生血管および/または小児性血管腫の治療のための医薬組成物の製造のための下記式 I I :

【化2】



[式中、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup> および A<sup>4</sup> は各々独立して炭素または窒素であり、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup> および A<sup>4</sup> の少なくとも 1 つが炭素であり；

各 R は独立して、ハロ、ニトロ、任意に置換されてよいアルキル、任意に置換されてよいアルケニル、任意に置換されてよいアルキニル、任意に置換されてよいヘテロアルキル、任意に置換されてよいヘテロアルケニル、任意に置換されてよいヘテロアルキニル、任意に置換されてよいアルカノール、任意に置換されてよい炭素環アリール、任意に置換されてよいヘテロ脂環族、任意に置換されてよいヘテロ芳香族、任意に置換されてよいアラルキル、任意に置換されてよいヘテロアリールアルキル、または任意に置換されてよいヘテロ脂環族アルキルであり；

あるいは隣接する環原子上の 2 つの R 基がその環と一緒にになって 4 ~ 約 8 環員をもった縮合した脂環族、ヘテロ脂環族、炭素環アリールまたはヘテロ芳香族基を形成し；

k は整数であり；

s および p は、同じか又は異なり、ゼロまたは正の整数であり；

W および W' は各々ヘテロ原子であり；

Z および Z' は各々独立して、化学結合またはアルカノイルであり；

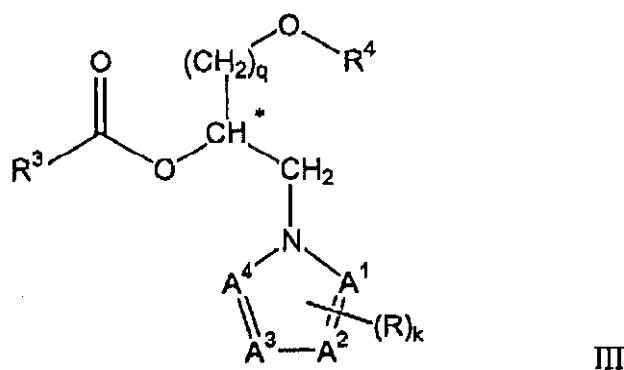
R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は各々独立して、任意に置換されてよい炭素環アリールまたは任意に置換されてよいヘテロ芳香族である]

により表される化合物ならびにそれらの医薬として許容される塩の使用。

【請求項 3】

該化合物が下記式 I I I :

## 【化3】



[式中、A<sup>1</sup>，A<sup>2</sup>，A<sup>3</sup> および A<sup>4</sup> は各々独立して炭素または窒素であり、A<sup>1</sup>，A<sup>2</sup>，A<sup>3</sup> および A<sup>4</sup> の少なくとも 1 つが炭素であり；

各 R は独立して、ハロ、ニトロ、任意に置換されてよいアルキル、任意に置換されてよいアルケニル、任意に置換されてよいアルキニル、任意に置換されてよいヘテロアルキル、任意に置換されてよいヘテロアルケニル、任意に置換されてよいヘテロアルキニル、任意に置換されてよいアルカノール、任意に置換されてよい炭素環アリール、任意に置換されてよいヘテロ脂環族、任意に置換されてよいヘテロ芳香族、任意に置換されてよいアラルキル、任意に置換されてよいヘテロアリールアルキル、または任意に置換されてよいヘテロ脂環族アルキルであり；

あるいは隣接する環原子上の 2 つの R 基がその環と一緒にになって 4 ~ 約 8 環員をもった縮合した脂環族、ヘテロ脂環族、炭素環アリールまたはヘテロ芳香族基を形成し；

k は整数であり；

q は正の整数であり；

R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> は各々、任意に置換されてよい炭素環アリールまたは任意に置換されてよいヘテロ芳香族であり；

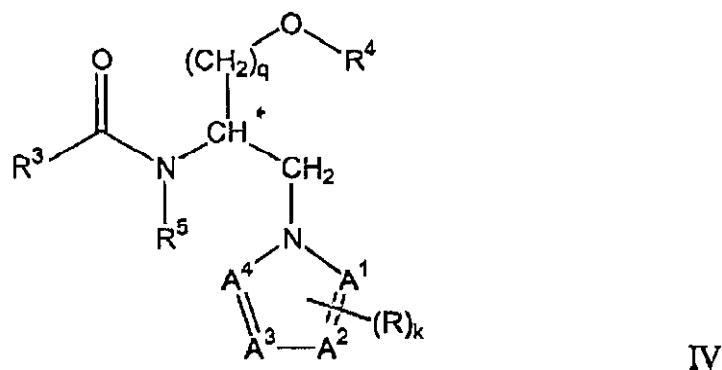
R<sup>5</sup> は、水素、任意に置換されてよいアルキル、任意に置換されてよいアルケニル、任意に置換されてよいアルキニル、任意に置換されてよいヘテロアルキル、任意に置換されてよいヘテロアルケニル、または任意に置換されてよいヘテロアルキニル、任意に置換されてよい炭素環アリール、または任意に置換されてよいヘテロ芳香族である】

により表わされる化合物ならびにそれらの医薬として許容される塩である、請求項 1 又は 2 に記載の使用。

## 【請求項 4】

該化合物が下記式 I V :

## 【化4】



[式中、A<sup>1</sup>，A<sup>2</sup>，A<sup>3</sup> および A<sup>4</sup> は各々独立して炭素または窒素であり、A<sup>1</sup>，A<sup>2</sup>，A<sup>3</sup> および A<sup>4</sup> の少なくとも 1 つが炭素であり；

各 R は独立して、ハロ、ニトロ、任意に置換されてよいアルキル、任意に置換されてよいアルケニル、任意に置換されてよいアルキニル、任意に置換されてよいヘテロアルキル、任意に置換されてよいヘテロアルケニル、任意に置換されてよいヘテロアルキニル、任意に置換されてよいアルカノール、任意に置換されてよい炭素環アリール、任意に置換されてよいヘテロ脂環族、任意に置換されてよいヘテロ芳香族、任意に置換されてよいアラルキル、任意に置換されてよいヘテロアリールアルキル、または任意に置換されてよいヘテロ脂環族アルキルであり；

あるいは隣接する環原子上の 2 つの R 基がその環と一緒にになって 4 ~ 約 8 環員をもった縮合した脂環族、ヘテロ脂環族、炭素環アリールまたはヘテロ芳香族基を形成し；

k は整数であり；

q は正の整数であり；

R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> は各々、任意に置換されてよい炭素環アリールまたは任意に置換されてよいヘテロ芳香族であり；

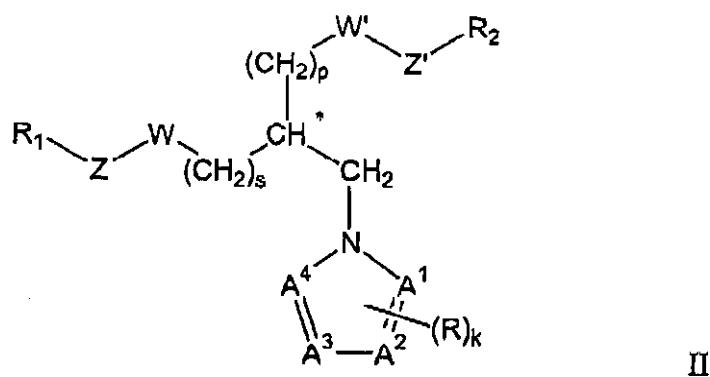
R<sup>5</sup> は、水素、任意に置換されてよいアルキル、任意に置換されてよいアルケニル、任意に置換されてよいアルキニル、任意に置換されてよいヘテロアルキル、任意に置換されてよいヘテロアルケニル、または任意に置換されてよいヘテロアルキニル、任意に置換されてよい炭素環アリール、または任意に置換されてよいヘテロ芳香族である】

により表わされる化合物ならびにそれらの医薬として許容される塩である、請求項 1 又は 2 に記載の使用。

## 【請求項 5】

下記式 II :

【化 5】



[式中、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$  および  $A^4$  は各々独立して炭素または窒素であり、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$  および  $A^4$  の少なくとも 1 つが炭素であり；

各 R は独立して、ハロ、ニトロ、任意に置換されてよいアルキル、任意に置換されてよいアルケニル、任意に置換されてよいアルキニル、任意に置換されてよいヘテロアルキル、任意に置換されてよいヘテロアルケニル、任意に置換されてよいヘテロアルキニル、任意に置換されてよいアルカノール、任意に置換されてよい炭素環アリール、任意に置換されてよいヘテロ脂環族、任意に置換されてよいヘテロ芳香族、任意に置換されてよいアルキル、任意に置換されてよいヘテロアリールアルキル、または任意に置換されてよいヘテロ脂環族アルキルであり；

あるいは隣接する環原子上の2つのR基がその環と一緒にになって4～約8環員をもった縮合した脂環族、ヘテロ脂環族、炭素環アリールまたはヘテロ芳香族基を形成し；

$k$  は整数であり；

$s$  および  $p$  は、同じか又は異なり、ゼロまたは正の整数であり；

W および W' は各々ヘテロ原子であり；

乙および乙'は各々独立して、化学結合またはアルカノイルであり；

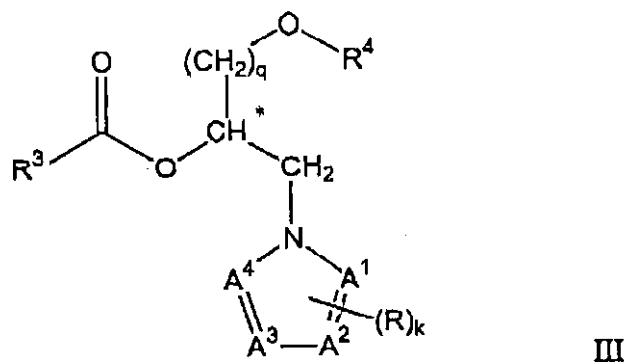
R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は各々独立して、任意に置換されてよい炭素環アリールまたは任意に置換されてよいヘテロ芳香族である。]

により表わされる化合物ならびにそれらの医薬として許容される塩(但し、4-メトキシ-安息香酸1-イミダゾール-1-イルメチル-2-フェノキシ-エチルエステル、4-クロロ-安息香酸1-イミダゾール-1-イルメチル-2-フェノキシ-エチルエステルおよび安息香酸1-イミダゾール-1-イルメチル-2-フェノキシ-エチルエステルのラセミ体を除く)。

### 【請求項 6】

該化合物が下記式 I I I :

## 【化6】



[式中、A<sup>1</sup>，A<sup>2</sup>，A<sup>3</sup> および A<sup>4</sup> は各々独立して炭素または窒素であり、A<sup>1</sup>，A<sup>2</sup>，A<sup>3</sup> および A<sup>4</sup> の少なくとも 1 つが炭素であり；

各 R は独立して、ハロ、ニトロ、任意に置換されてよいアルキル、任意に置換されてよいアルケニル、任意に置換されてよいアルキニル、任意に置換されてよいヘテロアルキル、任意に置換されてよいヘテロアルケニル、任意に置換されてよいヘテロアルキニル、任意に置換されてよいアルカノール、任意に置換されてよい炭素環アリール、任意に置換されてよいヘテロ脂環族、任意に置換されてよいヘテロ芳香族、任意に置換されてよいアラルキル、任意に置換されてよいヘテロアリールアルキル、または任意に置換されてよいヘテロ脂環族アルキルであり；

あるいは隣接する環原子上の 2 つの R 基がその環と一緒にになって 4 ~ 約 8 環員をもった縮合した脂環族、ヘテロ脂環族、炭素環アリールまたはヘテロ芳香族基を形成し；

k は整数であり；

q は正の整数であり；

R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> は各々、任意に置換されてよい炭素環アリールまたは任意に置換されてよいヘテロ芳香族であり；

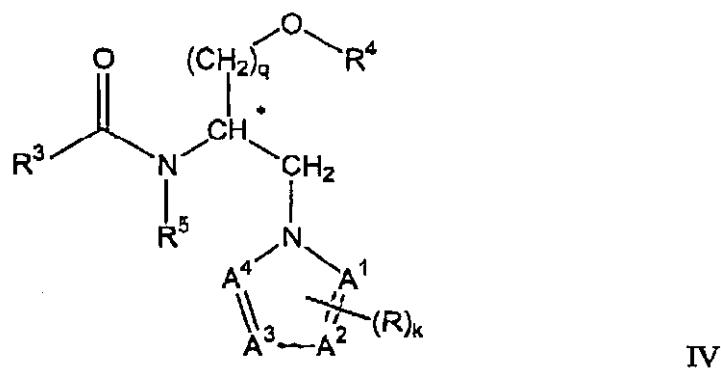
R<sup>5</sup> は、水素、任意に置換されてよいアルキル、任意に置換されてよいアルケニル、任意に置換されてよいアルキニル、任意に置換されてよいヘテロアルキル、任意に置換されてよいヘテロアルケニル、または任意に置換されてよいヘテロアルキニル、任意に置換されてよい炭素環アリール、または任意に置換されてよいヘテロ芳香族である】

の化合物ならびにそれらの医薬として許容される塩。

## 【請求項 7】

該化合物が下記式 I V :

## 【化7】



[式中、A<sup>1</sup>，A<sup>2</sup>，A<sup>3</sup> および A<sup>4</sup> は各々独立して炭素または窒素であり、A<sup>1</sup>，A<sup>2</sup>，A<sup>3</sup> および A<sup>4</sup> の少なくとも 1 つが炭素であり；

各 R は独立して、ハロ、ニトロ、任意に置換されてよいアルキル、任意に置換されてよいアルケニル、任意に置換されてよいアルキニル、任意に置換されてよいヘテロアルキル、任意に置換されてよいヘテロアルケニル、任意に置換されてよいヘテロアルキニル、任意に置換されてよいアルカノール、任意に置換されてよい炭素環アリール、任意に置換されてよいヘテロ脂環族、任意に置換されてよいヘテロ芳香族、任意に置換されてよいアラルキル、任意に置換されてよいヘテロアリールアルキル、または任意に置換されてよいヘテロ脂環族アルキルであり；

あるいは隣接する環原子上の 2 つの R 基がその環と一緒にになって 4 ~ 約 8 環員をもった縮合した脂環族、ヘテロ脂環族、炭素環アリールまたはヘテロ芳香族基を形成し；

k は整数であり；

q は正の整数であり；

R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> は各々、任意に置換されてよい炭素環アリールまたは任意に置換されてよいヘテロ芳香族であり；

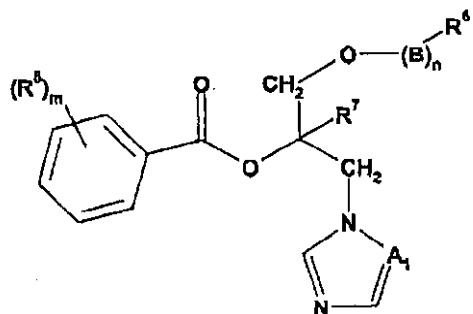
R<sup>5</sup> は、水素、任意に置換されてよいアルキル、任意に置換されてよいアルケニル、任意に置換されてよいアルキニル、任意に置換されてよいヘテロアルキル、任意に置換されてよいヘテロアルケニル、または任意に置換されてよいヘテロアルキニル、任意に置換されてよい炭素環アリール、または任意に置換されてよいヘテロ芳香族である]

により表わされる化合物ならびにそれらの医薬として許容される塩である、請求項 5 に記載の化合物。

## 【請求項 8】

該化合物が下記式 V :

## 【化8】



V

[式中、A<sup>1</sup>はNまたはC R<sup>9</sup>であり、そしてR<sup>9</sup>はH、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、アリール、またはハロゲンであり；

Bは-C(O)-であり；

R<sup>6</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>ヘテロシクロアルキル、アリール、またはヘテロアリールであり；

R<sup>7</sup>はHまたはC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキルであり；

R<sup>8</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルコキシ、またはハロゲンであり；

nは0または1であり；

mは1または2である]

により表される化合物である、請求項5に記載の化合物。

## 【請求項9】

A<sup>1</sup>はNであり；R<sup>6</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>ヘテロシクロアルキル、アリール、またはヘテロアリールであり；R<sup>7</sup>はHまたはC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキルであり；R<sup>8</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルコキシ、またはハロゲンであり；nは0または1であり；mは1または2である、請求項8に記載の化合物。

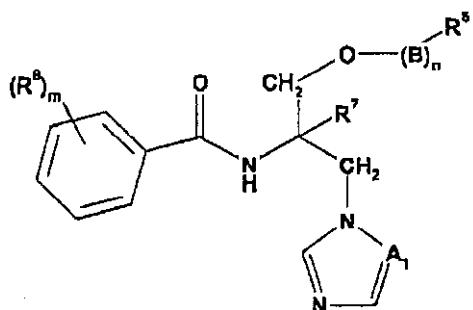
## 【請求項10】

A<sup>1</sup>はC R<sup>9</sup>であり、そしてR<sup>9</sup>はH、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、アリール、またはハロゲンであり；R<sup>6</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>ヘテロシクロアルキル、アリール、またはヘテロアリールであり；R<sup>7</sup>はHまたはC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキルであり；R<sup>8</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルコキシ、またはハロゲンであり；nは0または1であり；mは1または2である、請求項8に記載の化合物。

## 【請求項11】

該化合物が下記式V I :

## 【化9】



VI

[式中、A<sup>1</sup>はNまたはC R<sup>9</sup>であり、そしてR<sup>9</sup>はH、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、アリール、またはハロゲンであり；

Bは-C(=O)-であり；

R<sup>6</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>ヘテロシクロアルキル、アリール、またはヘテロアリールであり；

R<sup>7</sup>はHまたはC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキルであり；

R<sup>8</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルコキシ、またはハロゲンであり；

nは0または1であり；

mは1または2である]

により表わされる化合物である、請求項5に記載の化合物。

## 【請求項12】

A<sup>1</sup>はNであり；R<sup>6</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>ヘテロシクロアルキル、アリール、またはヘテロアリールであり；R<sup>7</sup>はHまたはC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキルであり；R<sup>8</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルコキシ、またはハロゲンであり；nは0または1であり；mは1または2である、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項13】

A<sup>1</sup>はC R<sup>9</sup>であり、そしてR<sup>9</sup>はH、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、アリール、またはハロゲンであり；R<sup>6</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>ヘテロシクロアルキル、アリール、またはヘテロアリールであり；R<sup>7</sup>はHまたはC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキルであり；R<sup>8</sup>はC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルコキシ、またはハロゲンであり；nは0または1であり；mは1または2である、請求項11に記載の化合物。

## 【請求項14】

該化合物が以下：

4-メトキシ-安息香酸1-イミダゾール-1-イルメチル-2-(4-フルオロフェノキシ)-エチルエステル；

3-メトキシ-安息香酸1-イミダゾール-1-イルメチル-2-フェノキシ-エチルエステル；

4-メトキシ-安息香酸1-イミダゾール-1-イルメチル-2-(4-メトキシフェノキシ)-エチルエステル；

4-メトキシ-安息香酸1-イミダゾール-1-イルメチル-2-(4-ヨードフェノキシ)-エチルエステル；

4-ヨード-安息香酸1-イミダゾール-1-イルメチル-2-(4-ヨードフェノキシ)-エチルエステル；

4 - ブロモ - 2 - クロロ - 安息香酸 1 - イミダゾール - 1 - イルメチル - 2 - フェノキシ - エチルエステル；  
4 - ブロモ - 2 - クロロ - 安息香酸 1 - イミダゾール - 1 - イルメチル - 2 - ( 4 - ヨードフェノキシ ) - エチルエステル；  
4 - ブロモ - 安息香酸 1 - イミダゾール - 1 - イルメチル - 2 - フェノキシ - エチルエステル；  
4 - トリフルオロメチル - 安息香酸 1 - イミダゾール - 1 - イルメチル - 2 - フェノキシ - エチルエステル；  
N - ( 1 - イミダゾール - 1 - イルメチル - 2 - フェノキシ - エチル ) - 4 - メトキシ - ベンズアミド；  
4 - ヨード - 安息香酸 1 - イミダゾール - 1 - イルメチル - 2 - ( 4 - フルオロフェノキシ ) - エチルエステル；  
4 - フルオロ - 安息香酸 1 - イミダゾール - 1 - イルメチル - 2 - フェノキシ - エチルエステル；  
N - [ ( 1 - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 2 - フェノキシ - エチル ] - N - メチル - 4 - ヨード - ベンズアミド；  
N - [ ( 1 - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 2 - ( 4 - フルオロフェノキシ - エチル ) ] - N - メチル - 4 - ヨード - ベンズアミド；  
4 - ヨード - 安息香酸 2 - ( 4 - フルオロ - フェノキシ ) - 1 - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾール - 1 - イルメチル - エチルエステル ( R - 異性体 )；  
4 - ヨード - 安息香酸 2 - ( 4 - アセチルアミノ - フェノキシ ) - 1 - イミダゾール - 1 - イルメチル - エチルエステル ( R - 異性体 )；  
N - [ 2 - ( 4 - フルオロ - フェノキシ ) - 1 - イミダゾール - 1 - イルメチル - エチル ] - 4 - ヨード - ベンズアミド ( R - 異性体 )；  
N - [ 2 - ( 4 - tert - ブチル - フェノキシ ) - 1 - イミダゾール - 1 - イルメチル - エチル ] - 4 - ヨード - ベンズアミド；  
4 - ヨード - 安息香酸 2 - イミダゾール - 1 - イル - 1 - ( 3 - ニトロ - フェノキシメチル ) - エチルエステル ( R - 異性体 )；  
4 - ヨード - 安息香酸 2 - イミダゾール - 1 - イル - 1 - ( 2 - ニトロ - フェノキシメチル ) - エチルエステル ( R - 異性体 )；  
4 - ヨード - 安息香酸 1 - ( 4 - ニトロベンゾイルオキシメチル ) - 2 - イミダゾール - 1 - イル - 1 - メチル - エチルエステル ( R - 異性体 )；  
4 - ヨード - 安息香酸 2 - イミダゾール - 1 - イル - 1 - ( 4 - ニトロ - フェノキシメチル ) - エチルエステル ( R - 異性体 )；  
4 - ヨード - 安息香酸 1 - イミダゾール - 1 - イルメチル - 2 - メトキシ - エチルエステル ( R - 異性体 )；  
4 - ヨード - 安息香酸 1 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 2 - ( テトラヒドロ - ピラン - 2 - イルオキシ ) - エチルエステル；  
N - [ 2 - ( 4 - フルオロ - フェノキシ ) - 1 - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾール - 1 - イルメチル - エチル ] - 4 - ヨード - ベンズアミド；  
4 - ヨード - 安息香酸 1 - イミダゾール - 1 - イルメチル - 2 - ( ピリジン - 3 - イルオキシ ) - エチルエステル ( R - 異性体 )；  
2 , 4 - ジクロロ - 安息香酸 2 - ( 4 - フルオロ - フェノキシ ) - 1 - イミダゾール - 1 - イルメチル - エチルエステル ( R - 異性体 )；  
4 - ヨード - 安息香酸 1 - ( 4 - シアノ - フェノキシメチル ) - 2 - イミダゾール - 1 - イル - エチルエステル；  
4 - ヨード - 安息香酸 1 - ( 4 - シアノ - フェノキシメチル ) - 2 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イル ) - エチルエステル ( R - 異性体 )；  
2 - クロロ - N - [ 2 - ( 4 - フルオロ - フェノキシ ) - 1 - イミダゾール - 1 - イルメチル - エチル ] - 4 - ヨード - ベンズアミド ( R - 異性体 )；

N - [ 2 - ( 4 - フルオロ - フエノキシ ) - 1 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - エチル ] - 4 - ヨード - ベンズアミド ( R - 異性体 ) ;

2 - クロロ - 4 - ヨード - 安息香酸 1 - シクロプロピルメトキシメチル - 2 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イル ) - エチルエステル ( R - 異性体 ) ;

N - [ 1 - ( 2 - クロロ - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 2 - ( 4 - フルオロ - フエノキシ ) - エチル ] - 4 - ヨード - ベンズアミド ( R - 異性体 ) ;

N - [ 2 - ( 4 - フルオロ - フエノキシ ) - 1 - イミダゾール - 1 - イルメチル - エチル ] - 3 - ヨード - ベンズアミド ;

N - [ 2 - ( 4 - フルオロ - フエノキシ ) - 1 - テトラゾール - 1 - イルメチル - エチル ] - 4 - ヨード - ベンズアミド ;

2 - クロロ - N - [ 2 - イミダゾール - 1 - イル - 1 - ( ピリジン - 3 - イルオキシメチル ) - エチル ] - 4 - ヨード - ベンズアミド ;

N - [ 2 - イミダゾール - 1 - イル - 1 - ( ピリジン - 3 - イルオキシメチル ) - エチル ] - 4 - ヨード - ベンズアミド ;

N - [ 2 - ( 4 - フルオロ - フエノキシ ) - 1 - ( 2 - フェニル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - エチル ] - 4 - ヨード - ベンズアミド ;

N - [ 1 - ( 2 - クロロ - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 2 - ( 4 - シアノ - フエノキシ ) - エチル ] - 4 - ヨード - ベンズアミド ;

N - [ 2 - イミダゾール - 1 - イル - 1 - ( 3 - ニトロ - ピリジン - 2 - イルオキシメチル ) - エチル ] - 4 - ヨード - ベンズアミド ;

N - [ 2 - イミダゾール - 1 - イル - 1 - ( 4 - ニトロ - フエノキシメチル ) - エチル ] - 4 - ヨード - ベンズアミド ;

N - [ 1 - ( 3 - シアノ - ピリジン - 2 - イルオキシメチル ) - 2 - イミダゾール - 1 - イル - エチル ] - 4 - ヨード - ベンズアミド ;

N - [ 1 - ( 5 - シアノ - ピリジン - 2 - イルオキシメチル ) - 2 - イミダゾール - 1 - イル - エチル ] - 4 - ヨード - ベンズアミド ;

N - [ 1 - ( 4 - シアノ - フエノキシメチル ) - 2 - イミダゾール - 1 - イル - エチル ] - 4 - ヨード - ベンズアミド ;

N - [ 1 - ( 4 - シアノ - フエノキシメチル ) - 2 - ( 2 - メチル - イミダゾール - 1 - イル ) - エチル ] - 4 - ヨード - ベンズアミド ; および

N - [ 1 - ( 2 - ジフルオロメチル - イミダゾール - 1 - イルメチル ) - 2 - ( 4 - フルオロ - フエノキシ ) - エチル ] - 4 - ヨード - ベンズアミド、ならびに

それらの医薬として許容される塩からなる群より選択される、請求項 5 に記載の化合物。

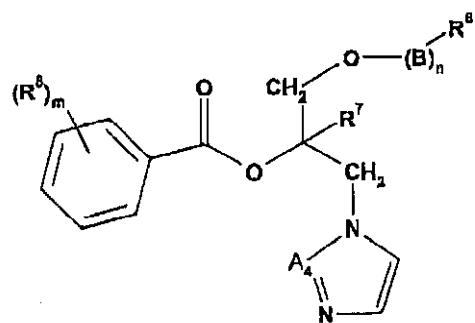
**【請求項 15】**

医薬として許容される担体と、1種以上の請求項 5 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物を含んでなる医薬組成物。

**【請求項 16】**

該化合物が下記式 V I I :

【化10】



VII

[式中、A<sup>4</sup> は C R<sup>9</sup> であり、そして R<sup>9</sup> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、アリール、またはハロゲンであり；

B は - C (O) - であり；

R<sup>6</sup> は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ヘテロシクロアルキル、アリール、またはヘテロアリールであり；

R<sup>7</sup> は H または C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルであり；

R<sup>8</sup> は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ、またはハロゲンであり；

n は 0 または 1 であり；

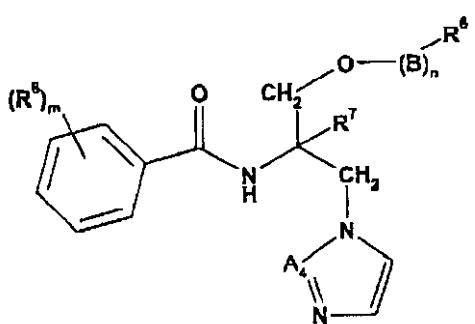
m は 1 または 2 である]

により表わされる化合物である、請求項 1 又は 2 に記載の使用。

【請求項 17】

該化合物が下記式 VIII :

【化11】



VIII

[式中、A<sup>4</sup> は C R<sup>9</sup> であり、そして R<sup>9</sup> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、アリール、またはハロゲンであり；

B は - C (O) - であり；

R<sup>6</sup> は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ヘテロシクロアルキル、アリール、またはヘテロアリールであり；

R<sup>7</sup> は H または C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルであり；

R<sup>8</sup> は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ、またはハロゲンであり；

n は 0 または 1 であり；

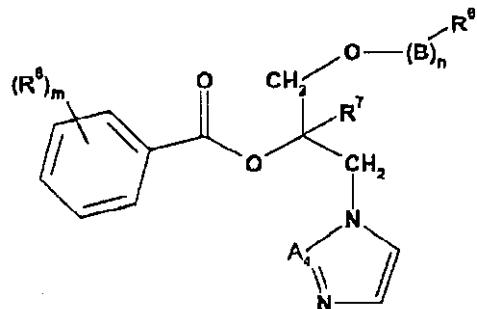
m は 1 または 2 である】

により表わされる化合物である、請求項 1 又は 2 に記載の使用。

【請求項 18】

該化合物が下記式 V I I :

【化 12】



VII

〔式中、A<sup>4</sup> は C R<sup>9</sup> であり、そして R<sup>9</sup> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、アリール、またはハロゲンであり；

B は - C (O) - であり；

R<sup>6</sup> は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ヘテロシクロアルキル、アリール、またはヘテロアリールであり；

R<sup>7</sup> は H または C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルであり；

R<sup>8</sup> は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ、またはハロゲンであり；

n は 0 または 1 であり；

m は 1 または 2 である】

により表わされる化合物である、請求項 5 に記載の化合物。

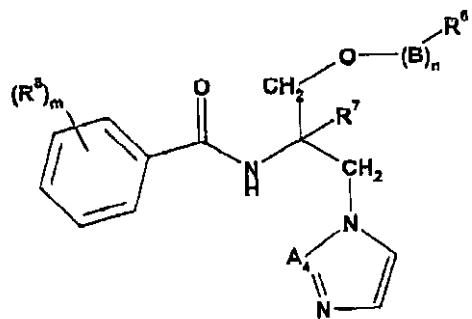
【請求項 19】

A<sup>4</sup> は C R<sup>9</sup> であり、そして R<sup>9</sup> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、アリール、またはハロゲンであり；R<sup>6</sup> は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ヘテロシクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；R<sup>7</sup> は H または C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルであり；R<sup>8</sup> は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ、またはハロゲンであり；n は 0 または 1 であり；m は 1 または 2 である、請求項 18 に記載の化合物。

【請求項 20】

該化合物が下記式 V I I I :

## 【化13】



VIII

〔式中、A<sup>4</sup> は C R<sup>9</sup> であり、そして R<sup>9</sup> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、アリール、またはハロゲンであり；

B は - C (O) - であり；

R<sup>6</sup> は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ヘテロシクロアルキル、アリール、またはヘテロアリールであり；

R<sup>7</sup> は H または C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルであり；

R<sup>8</sup> は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ、またはハロゲンであり；

n は 0 または 1 であり；

m は 1 または 2 である〕

により表わされる化合物である、請求項 5 に記載の化合物。

## 【請求項 21】

A<sup>4</sup> は C R<sup>9</sup> であり、そして R<sup>9</sup> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、アリール、またはハロゲンであり；R<sup>6</sup> は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ヘテロシクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；R<sup>7</sup> は H または C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルであり；R<sup>8</sup> は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ、またはハロゲンであり；n は 0 または 1 であり；m は 1 または 2 である、請求項 20 に記載の化合物。

## 【請求項 22】

A<sup>4</sup> は C R<sup>9</sup> であり、そして R<sup>9</sup> は H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、またはハロゲンであり；R<sup>6</sup> は アリールまたはヘテロアリールであり；n は 0 である、請求項 21 に記載の化合物。

## 【請求項 23】

癌、炎症、敗血症性ショック、早産、不妊症、痛みまたは虚血に関連する状態の治療のための請求項 5 ~ 14 および 18 ~ 22 のいずれか 1 項に記載の化合物を含んで成る医薬組成物。

## 【請求項 24】

自己免疫疾患もしくは障害、細菌感染、アレルギー、血管形成障害、臓器低酸素血症、血管過形成、心臓肥大、トロンビンにより誘発される血小板凝集、プロスタグランジンシンターゼ - 2 に関連する状態、膵炎、喘息、ARDS、糸球体腎炎、リューマチ関節炎、SLE、強皮症、甲状腺炎、グレーブス病、胃炎、糖尿病、溶血性貧血、炎症性腸疾患、潰瘍性大腸炎、クローン病、乾癬、移植片対宿主病、骨関節症、細菌性赤痢、浮腫、発熱、眼性新生血管および / または小児性血管腫の治療のための請求項 5 ~ 14 および 18 ~ 22 のいずれか 1 項に記載の化合物を含んで成る医薬組成物。