

【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23年3月31日(2011.3.31)

【公表番号】特表2010-522181(P2010-522181A)

【公表日】平成22年7月1日(2010.7.1)

【年通号数】公開・登録公報2010-026

【出願番号】特願2009-554622(P2009-554622)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/416 (2006.01)

C 0 7 D 231/54 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/416

C 0 7 D 231/54

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成23年2月14日(2011.2.14)

【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

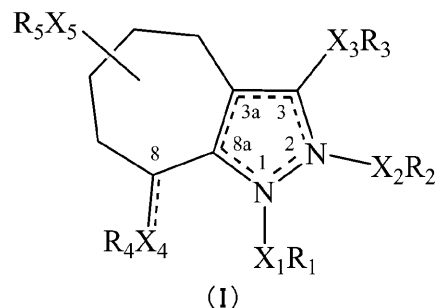
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

有効量の式(I)：

【化1】



[式中、

式(I)における位置2-3および位置3a-8aの間の点線は X_1R_1 が存在する時の存在する2つの二重結合の各々に関する位置を表し、

式(I)における位置3-3aおよび位置8a-1の間の点線は X_2R_2 が存在する時の存在する2つの二重結合の各々に関する位置を表し、

式(I)における位置8および X_4R_4 の間の点線は二重結合に関する位置を表し、

X_1 は不存在であるかまたは低級アルキレンであり、

X_2 は不存在であるかまたは低級アルキレンであり、

ここで $X_1 R_1$ および $X_2 R_2$ の 1 つだけが存在し、

X_3 は不存在であるか、低級アルキレン、低級アルキリデンまたは - NH - であり、位置 8 および $X_4 R_4$ の間の点線が存在しない時には、 X_4 は不存在であるか、または低級アルキレンであり、

位置 8 および $X_4 R_4$ の間の点線が存在する時には、 X_4 は不存在であり、

X_5 は不存在であるかまたは低級アルキレンであり、

R_1 は水素、アルキル（場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、ヒドロキシもしくは低級アルコキシにより置換されていてもよい）、低級アルキル - スルホニル、アリーール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルから選択され、ここでアリーール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルは各々場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、アミノスルホニル、低級アルキル - アミノスルホニル、アルキル（場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、ヒドロキシもしくは低級アルコキシにより置換されていてもよい）、ヒドロキシまたは低級アルコキシ（場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲンもしくはヒドロキシにより置換されていてもよい）により置換されていてもよく、

R_2 は水素、アルキル（場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、ヒドロキシもしくは低級アルコキシにより置換されていてもよい）、低級アルキル - スルホニル、アリーール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルから選択され、ここでアリーール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルは各々場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、アミノスルホニル、低級アルキル - アミノスルホニル、アルキル（場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、ヒドロキシもしくは低級アルコキシにより置換されていてもよい）、ヒドロキシまたは低級アルコキシ（場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲンもしくはヒドロキシにより置換されていてもよい）により置換されていてもよく、

R_3 は - C(O) - Z_1 (R_6)、- SO₂ - NR₇ - Z_2 (R_8) または - C(O) - NR₉ - Z_3 (R_{10}) であり、

位置 8 および $X_4 R_4$ の間の点線が存在しない時には、 X_4 は不存在であるかまたは低級アルキレンでありそして R_4 はヒドロキシ、低級アルコキシ、ハロゲン、アリーール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルであり、ここでアリーール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルは各々場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でヒドロキシ、オキソ、低級アルキル（場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、ヒドロキシもしくは低級アルコキシにより置換されていてもよい）、低級アルコキシ（場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲンもしくはヒドロキシにより置換されていてもよい）またはハロゲンにより置換されていてもよく、

位置 8 および $X_4 R_4$ の間の点線が存在する時には、 X_4 は不存在でありそして R_4 は CH - アリーールまたは CH - ヘテロシクリルであり、ここでアリーールまたはヘテロシクリルは各々場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でヒドロキシ、オキソ、低級アルキル（場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、ヒドロキシもしくは低級アルコキシにより置換されていてもよい）、低級アルコキシ（場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲンもしくはヒドロキシにより置換されていてもよい）またはハロゲンにより置換されていてもよく、

R_5 は水素、ヒドロキシ、オキソ、ハロゲン、アミノ、低級アルキル - アミノ、アルキル（場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、ヒドロキシもしくは低級アルコキシにより置換されていてもよい）、低級アルコキシ（場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲンもしくはヒドロキシにより置換されていてもよい）、カルボキシ、カルボニルアルコキシ、カルバモイル、カルバモイルアルキル、アリーール、アリーールオキシ、アリーールアルコキシまたはヘテロシクリルであり、

R_6 は各々場合により 1 個もしくはそれ以上のヒドロキシ、オキソ、ハロゲン、アミノ、低級アルキル - アミノ、アルキル（場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、ヒドロキシもしくは低級アルコキシにより置換されていてもよい）、低級アルコキシ（場

合により1つもしくはそれ以上の位置でハロゲンもしくはヒドロキシにより置換されていてもよい)、カルボキシ、カルボニルアルコキシ、カルバモイル、カルバモイルアルキル、アリール、アリーロキシ、アリールアルコキシまたはヘテロシクリルにより置換されていてもよいアリール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルであり、

R_7 は水素または低級アルキルであり、

R_8 は水素、アリール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルであり、ここでアリール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルは各々場合により1つもしくはそれ以上のヒドロキシ、オキソ、ハロゲン、アミノ、低級アルキル-アミノ、アルキル(場合により1つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、ヒドロキシもしくは低級アルコキシにより置換されていてもよい)、低級アルコキシ(場合により1つもしくはそれ以上の位置でハロゲンもしくはヒドロキシにより置換されていてもよい)、カルボキシ、カルボニルアルコキシ、カルバモイル、カルバモイルアルキル、アリール、アリーロキシ、アリールアルコキシまたはヘテロシクリルにより置換されていてもよく、

R_9 は水素または低級アルキルであり、

R_{10} は水素、アリール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルであり、ここでアリール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルは各々場合により1つもしくはそれ以上のヒドロキシ、オキソ、ハロゲン、アミノ、低級アルキル-アミノ、アルキル(場合により1つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、ヒドロキシもしくは低級アルコキシにより置換されていてもよい)、低級アルコキシ(場合により1つもしくはそれ以上の位置でハロゲンもしくはヒドロキシにより置換されていてもよい)、カルボキシ、カルボニルアルコキシ、カルバモイル、カルバモイルアルキル、アミノスルホニル、低級アルキル-アミノスルホニル、アリール、アリーロキシ、アリールアルコキシまたはヘテロシクリルにより置換されていてもよく、

Z_1 および Z_2 は各々不存在であるかまたはアルキルであり、そして

Z_3 は不存在であるか、 $-NH-$ 、 $-SO_2-$ またはアルキル(ここでアルキルは場合により1つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、ヒドロキシ、低級アルキル、低級アルコキシ、カルボキシもしくはカルボニルアルコキシにより置換されていてもよい)である]

の化合物またはその形態を含んでなる、被験体におけるCB2受容体介在疼痛を処置、緩和または予防するための医薬組成物。

【請求項2】

X_1 が不存在でありそして R_1 が水素、アルキル、低級アルキル-スルホニル、アリール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルから選択され、ここでアリールまたはヘテロシクリルが各々場合により1つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、アミノスルホニルまたはアルキル(場合により1つもしくはそれ以上の位置でハロゲンにより置換されていてもよい)により置換されていてもよい、請求項1の組成物。

【請求項3】

R_3 が $-SO_2-NR_7-Z_2(R_8)$ であり、 X_3 が不存在であるかまたは低級アルキリデンであり、 R_7 が水素または低級アルキルであり、 Z_2 が不存在であるかまたはアルキルであり、そして、 R_8 がアリール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルである、請求項1の組成物。

【請求項4】

R_3 が $-SO_2-NH-Z_2(R_8)$ であり、 X_3 が不存在であるかまたは低級アルキリデンであり、 Z_2 が不存在であるかまたはアルキルであり、そして、 R_8 がアリール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルである、請求項1の組成物。

【請求項5】

R_3 が $-C(O)-NR_9-Z_3(R_{10})$ であり、 X_3 が不存在であるかまたは低級アルキリデンであり、 R_9 が水素または低級アルキルであり、 Z_3 が不存在であるか、 $-SO_2-$ またはアルキル(ここでアルキルが場合により1つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、ヒドロキシもしくはカルボニルアルコキシにより置換されていてもよい)であり、そして、 R_{10} が水素、アリール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリル

であり、ここでアリール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルが各々場合により1個もしくはそれ以上のヒドロキシ、ハロゲン、アルキル(場合により1つもしくはそれ以上の位置でハロゲンにより置換されている)、アルコキシ、カルボキシ、カルボニルアルコキシ、カルバモイルアルキルまたはアミノスルホニルにより置換されている、請求項1の組成物。

【請求項6】

R_3 が $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$ であり、 X_3 が存在しないかまたは低級アルキリデンであり、 Z_3 が存在しないか、 $-SO_2$ -またはアルキル(ここでアルキルが場合により1つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、ヒドロキシもしくはカルボニルアルコキシにより置換されている)であり、そして、 R_{10} が水素、アリール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルであり、ここでアリール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルが各々場合により1個もしくはそれ以上のヒドロキシ、ハロゲン、アルキル(場合により1つもしくはそれ以上の位置でハロゲンにより置換されている)、アルコキシ、カルボキシ、カルボニルアルコキシ、カルバモイルアルキルまたはアミノスルホニルにより置換されている、請求項1の組成物。

【請求項7】

R_3 が $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$ であり、 X_3 が存在しないかまたは低級アルキリデンであり、 Z_3 が存在しないか、 $-SO_2$ -またはアルキル(ここでアルキルが場合により1つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、ヒドロキシもしくはカルボニルアルコキシにより置換されている)であり、そして R_{10} が場合により1個もしくはそれ以上のヒドロキシ、ハロゲン、アルキル(場合により1つもしくはそれ以上の位置でハロゲンにより置換されている)、アルコキシまたはアミノスルホニルにより置換されている、アリールである、請求項1の組成物。

【請求項8】

R_3 が $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$ であり、 X_3 が存在しないかまたは低級アルキリデンであり、 Z_3 が存在しないか、 $-SO_2$ -またはアルキル(ここでアルキルが場合により1つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、ヒドロキシもしくはカルボニルアルコキシにより置換されている)であり、そして、 R_{10} が水素または $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルであり、ここで $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルが場合により1個もしくはそれ以上のヒドロキシ、アルキル、アルコキシ、カルボキシ、カルボニルアルコキシまたはカルバモイルアルキルにより置換されている、請求項1の組成物。

【請求項9】

R_3 が $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$ であり、 X_3 が存在しないかまたは低級アルキリデンであり、 Z_3 が存在しないか、 $-SO_2$ -またはアルキル(ここでアルキルが場合により1つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、ヒドロキシもしくはカルボニルアルコキシにより置換されている)であり、そして、 R_{10} が水素またはヘテロシクリルであり、ここでヘテロシクリルが場合により1個もしくはそれ以上のカルボニルアルコキシにより置換されている、請求項1の組成物。

【請求項10】

位置8および $X_4 R_4$ の間の点線が存在しない、 X_4 が存在しないかまたは低級アルキレンでありそして R_4 が場合により1つもしくはそれ以上の位置で低級アルキルまたはハロゲンにより置換されている、アリールである、請求項1の組成物。

【請求項11】

位置8および $X_4 R_4$ の間の点線が存在し、 X_4 が存在しない、 R_4 が CH -アリールまたは CH -ヘテロシクリルであり、ここでアリールまたはヘテロシクリルが各々場合により1つもしくはそれ以上の位置で低級アルコキシまたはハロゲンにより置換されている、請求項1の組成物。

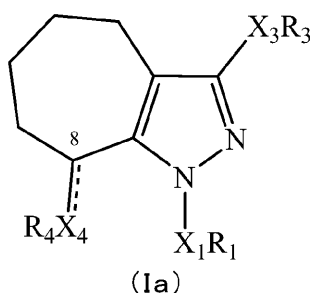
【請求項12】

X_5 が存在しない、 R_5 が水素である、請求項1の組成物。

【請求項13】

化合物が式 (I a)

【化 2】



[式中、 X_1 は不存在であるかまたは低級アルキレンであり、 X_3 は不存在であるかまたは低級アルキリデンであり、位置 8 および $X_4 R_4$ の間の点線が不存在である時には X_4 は不存在であるかまたは低級アルキレンであり、位置 8 および $X_4 R_4$ の間の点線が存在する時には X_4 は不存在であり、 R_1 は水素、アルキル、低級アルキル - スルホニル、アリール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルから選択され、ここでアリールまたはヘテロシクリルは各々場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、アミノスルホニルまたはアルキル (場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲンにより置換されていてもよい) により置換されていてもよく、 R_3 は $-C(O)-(R_6)$ 、 $-SO_2-NH-Z_2(R_8)$ または $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$ であり、位置 8 および $X_4 R_4$ の間の点線が不存在である時には、 R_4 はアリールであり、ここでアリールは場合により 1 つもしくはそれ以上の位置で低級アルキルまたはハロゲンにより置換されていてもよく、位置 8 および $X_4 R_4$ の間の点線が存在する時には、 R_4 は CH - アリールまたは CH - ヘテロシクリルであり、ここでアリールまたはヘテロシクリルは各々場合により 1 つもしくはそれ以上の位置で低級アルコキシまたはハロゲンにより置換されていてもよく、 R_6 は場合により 1 個もしくはそれ以上のアリールまたはヘテロシクリルにより置換されていてもよいヘテロシクリルであり、 Z_2 は不存在であるかまたはアルキルであり、 R_8 はアリール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルであり、 Z_3 は不存在であるか、 $-SO_2$ - またはアルキル (ここでアルキルは場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、ヒドロキシもしくはカルボニルアルコキシにより置換されていてもよい) であり、そして、 R_{10} は水素、アリール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルであり、ここでアリール、 $C_3 - C_{12}$ シクロアルキルまたはヘテロシクリルは各々場合により 1 個もしくはそれ以上のヒドロキシ、ハロゲン、アルキル (場合により 1 つもしくはそれ以上の位置でハロゲンにより置換されていてもよい)、アルコキシ、カルボキシ、カルボニルアルコキシ、カルバモイルアルキルまたはアミノスルホニルにより置換されていてもよい]

の化合物またはその塩、異性体、プロドラッグ、代謝産物もしくは多形相から選択される、請求項 1 の組成物。

【請求項 1 4】

X_1 が不存在であり、 X_3 が不存在であるかまたは低級アルキリデンであり、位置 8 および $X_4 R_4$ の間の点線が不存在である時には X_4 が低級アルキレンであり、位置 8 および $X_4 R_4$ の間の点線が存在する時には X_4 が不存在であり、 R_1 が水素またはアルキルから選択され、 R_3 が $-SO_2-NH-Z_2(R_8)$ または $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$ であり、位置 8 および $X_4 R_4$ の間の点線が不存在である時には、 R_4 がアリールであり、ここでアリールが場合により 1 つもしくはそれ以上の位置で低級アルキルまたはハロゲンにより置換されていてもよく、位置 8 および $X_4 R_4$ の間の点線が存在する時には、 R_4 が CH - アリールまたは CH - ヘテロシクリルであり、ここでアリールまたはヘテロシクリルが各々場合により 1 つもしくはそれ以上の位置で低級アルコキシまたはハロゲンにより置換されていてもよく、 Z_2 が不存在であるかまたはアルキルであり、 R_8 がアリールまたはヘテロシクリルであり、 Z_3 がアルキル (ここでアルキルが場合により 1

つもしくはそれ以上の位置でハロゲン、ヒドロキシもしくはカルボニルアルコキシにより置換されていてもよい)であり、そして、 R_{10} がアリールまたはヘテロシクリルであり、ここでアリールまたはヘテロシクリルが各々場合により1個もしくはそれ以上のヒドロキシ、ハロゲン、アルキル(場合により1つもしくはそれ以上の位置でハロゲンにより置換されていてもよい)、アルコキシ、カルボキシ、カルボニルアルコキシ、カルバモイルアルキルまたはアミノスルホニルにより置換されていてもよい、請求項1の組成物。

【請求項15】

化合物が

8 - (3 - クロロ - ベンジル) - 1, 4, 5, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボン酸 [(1S) - 2 - ヒドロキシ - 1 - フェニル - エチル] - アミド、

(8R*) - 8 - (3 - クロロ - ベンジル) - 1, 4, 5, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボン酸 [(1R) - 2 - ヒドロキシ - 1 - フェニル - エチル] - アミド、

(8R*) - 8 - (3 - クロロ - ベンジル) - 1, 4, 5, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボン酸 [(1S) - 2 - ヒドロキシ - 1 - フェニル - エチル] - アミド、

(8S*) - 8 - (3 - クロロ - ベンジル) - 1, 4, 5, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボン酸 [(1S) - 2 - ヒドロキシ - 1 - フェニル - エチル] - アミド、

(2E) - 2 - [(8R*) - 8 - (3 - フルオロ - ベンジル) - 1, 4, 5, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - イル] - エテンスルホン酸 [(1S) - 1 - フェニル - エチル] - アミド、

(8E) - 8 - (4 - クロロ - ベンジリデン) - 1, 4, 5, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボン酸 [(1R) - 2 - ヒドロキシ - 1 - フェニル - エチル] - アミド、

(2E, 8E) - 2 - [8 - (4 - クロロ - ベンジリデン) - 1, 4, 5, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - イル] - エテンスルホン酸 [(1S) - 1 - フェニル - エチル] - アミド、

(8E) - (2S) - 2 - { [8 - (4 - クロロ - ベンジリデン) - 1, 4, 5, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボニル] - アミノ } - 3 - (4 - フルオロ - フェニル) - プロピオン酸メチルエステル、

(8E) - 8 - (3 - クロロ - ベンジリデン) - 1, 4, 5, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボン酸 [(1R) - 2 - ヒドロキシ - 1 - フェニル - エチル] - アミド、

(8E) - (2S) - 2 - { [8 - (3 - クロロ - ベンジリデン) - 1, 4, 5, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボニル] - アミノ } - 3 - (4 - フルオロ - フェニル) - プロピオン酸メチルエステル、

(8E) - (2S) - 2 - { [8 - (3 - フルオロ - ベンジリデン) - 1 - メチル - 1, 4, 5, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボニル] - アミノ } - 3 - (4 - フルオロ - フェニル) - プロピオン酸メチルエステル、

(8E) - 8 - (3 - フルオロ - ベンジリデン) - 1 - メチル - 1, 4, 5, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボン酸 [(1R) - 2 - ヒドロキシ - 1 - フェニル - エチル] - アミド、

(8E) - (2S) - 8 - (3 - フルオロ - ベンジリデン) - 1 - メチル - 1, 4, 5, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボン酸 [1 - ヒドロキシメチル - 2 - (4 - ヒドロキシ - フェニル) - エチル] - アミド、

(8E) - (2R) - 2 - { [8 - (3 - クロロ - ベンジリデン) - 1, 4, 5, 6, 7, 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボニル] - アミノ } - 3 - (4 - フルオロ - フェニル) - プロピオン酸メチルエステル、

(8 E) - (2 R) - 2 - { [8 - (4 - クロロ - ベンジリデン) - 1 , 4 , 5 , 6 , 7 , 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボニル] - アミノ } - 3 - (4 - フルオロ - フェニル) - プロピオン酸メチルエステル、
 (8 E) - 8 - (3 - フルオロ - ベンジリデン) - 1 - メチル - 1 , 4 , 5 , 6 , 7 , 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボン酸 [(1 R) - 3 - ヒドロキシ - 1 - フェニル - プロピル] - アミド、
 (8 E) - 8 - (3 - クロロ - ベンジリデン) - 1 , 4 , 5 , 6 , 7 , 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボン酸 [(1 R) - 3 - ヒドロキシ - 1 - フェニル - プロピル] - アミド、
 (8 R *) - (3 - クロロ - ベンジル) - 1 , 4 , 5 , 6 , 7 , 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボン酸 [(1 S) - 2 - メトキシ - 1 - フェニル - エチル] - アミド、
 (8 S *) - (3 - クロロ - ベンジル) - 1 , 4 , 5 , 6 , 7 , 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボン酸 [(1 S) - 2 - メトキシ - 1 - フェニル - エチル] - アミド、
 (8 S *) - (3 - クロロ - ベンジル) - 1 , 4 , 5 , 6 , 7 , 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボン酸 [(1 R) - 2 - メトキシ - 1 - フェニル - エチル] - アミド、および
 (8 R *) - (3 - クロロ - ベンジル) - 1 , 4 , 5 , 6 , 7 , 8 - ヘキサヒドロ - シクロヘプタピラゾール - 3 - カルボン酸 [(1 R) - 2 - メトキシ - 1 - フェニル - エチル] - アミド

から選択される、請求項 1 の組成物。

【請求項 16】

C B 2 受容体介在疼痛が慢性または急性である、請求項 1 の組成物。

【請求項 17】

C B 2 受容体介在疼痛が手術後、炎症性もしくは神経障害性であるかまたは損傷もしくは年齢の結果である、請求項 16 の組成物。

【請求項 18】

C B 2 受容体介在疼痛が別のやり方で特性づけを不可能とし且つ C B 2 受容体アゴニストを用いる処置から利点を受けるであろう中枢または末梢経路介在疼痛症状である、請求項 16 の組成物。

【請求項 19】

C B 2 受容体介在疼痛が変形性関節症、慢性関節リウマチ、頭痛、片頭痛、歯痛、分娩、月経困難症、間質性膀胱炎、末梢神経炎、粘膜炎、外科疼痛、運動損傷疼痛、外傷、癌疼痛、線維筋痛、膵臓炎、腸炎、蜂巣炎、骨折、手術後腸仙痛、過敏性腸症候群、炎症性腸疾病に起因する疼痛、クローン病、潰瘍性大腸炎、胆嚢炎、火傷、日焼け、毒性の蛇噛み傷、蜘蛛噛み傷または昆虫刺し傷に起因する疼痛および非毒の蛇噛み傷、蜘蛛噛み傷または昆虫刺し傷に起因する疼痛よりなる群から選択される炎症性疼痛である、請求項 17 の組成物。

【請求項 20】

C B 2 受容体介在疼痛が化学療法性神経障害、エイズ - 関連神経障害、糖尿病性神経障害および肝炎後神経痛よりなる群から選択される神経障害疼痛である、請求項 17 の組成物。

【請求項 21】

請求項 1 の化合物の有効量が約 0 . 0 0 1 m g / k g / 日 ~ 約 3 0 0 m g / k g / 日である、請求項 1 の組成物。

【請求項 22】

請求項 13 の化合物の有効量が約 0 . 0 0 1 m g / k g / 日 ~ 約 3 0 0 m g / k g / 日である、請求項 1 の組成物。

【請求項 23】

請求項 1 4 の化合物の有効量が約 0 . 0 0 1 m g / k g / 日 ~ 約 3 0 0 m g / k g / 日である、請求項 1 の組成物。

【請求項 2 4】

被験体に有効量の請求項 1 の化合物および治療剤を含んでなる組み合わせ製品および/または療法を投与することをさらに含んでなる、請求項 1 の組成物。

【請求項 2 5】

C B 2 受容体介在疼痛の処置、緩和または予防を必要とする被験体において C B 2 受容体介在疼痛を処置、緩和または予防するための薬品の製造における請求項 1 の化合物の使用。

【請求項 2 6】

C B 2 受容体介在疼痛が慢性または急性である、請求項 2 5 の使用。

【請求項 2 7】

C B 2 受容体介在疼痛が手術後、炎症性もしくは神経障害性であるかまたは損傷もしくは年齢の結果である、請求項 2 5 の使用。

【請求項 2 8】

C B 2 受容体介在疼痛が別のやり方で特性づけを不可能とし且つ C B 2 受容体アゴニストを用いる処置から利点を受けるであろう中枢または末梢経路介在疼痛症状である、請求項 2 5 の使用。

【請求項 2 9】

C B 2 受容体介在疼痛が変形性関節症、慢性関節リウマチ、頭痛、片頭痛、歯痛、分娩、月経困難症、間質性膀胱炎、末梢神経炎、粘膜炎、外科疼痛、運動損傷疼痛、外傷、癌疼痛、線維筋痛、膵臓炎、腸炎、蜂巣炎、骨折、手術後腸仙痛、過敏性腸症候群、炎症性腸疾病に起因する疼痛、クローン病、潰瘍性大腸炎、胆嚢炎、火傷、日焼け、毒性の蛇噛み傷、蜘蛛噛み傷または昆虫刺し傷に起因する疼痛および非毒の蛇噛み傷、蜘蛛噛み傷または昆虫刺し傷に起因する疼痛よりなる群から選択される炎症性疼痛である、請求項 2 7 の使用。

【請求項 3 0】

C B 2 受容体介在疼痛が化学療法性神経障害、エイズ - 関連神経障害、糖尿病性神経障害および肝炎後神経痛よりなる群から選択される神経障害疼痛である、請求項 2 7 の使用。