

【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】令和3年2月4日(2021.2.4)

【公表番号】特表2020-502213(P2020-502213A)

【公表日】令和2年1月23日(2020.1.23)

【年通号数】公開・登録公報2020-003

【出願番号】特願2019-533489(P2019-533489)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/55	(2006.01)
C 0 7 D 333/60	(2006.01)
C 0 7 D 333/28	(2006.01)
C 0 7 D 333/24	(2006.01)
C 0 7 D 213/64	(2006.01)
C 0 7 D 231/12	(2006.01)
C 0 7 D 231/56	(2006.01)
C 0 7 D 401/12	(2006.01)
C 0 7 D 405/04	(2006.01)
C 0 7 D 495/04	(2006.01)
C 0 7 D 233/61	(2006.01)
C 0 7 D 233/64	(2006.01)
C 0 7 D 277/30	(2006.01)
C 0 7 D 241/12	(2006.01)
A 6 1 P 25/04	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 15/00	(2006.01)
A 6 1 P 13/00	(2006.01)
A 6 1 P 11/00	(2006.01)
A 6 1 P 11/06	(2006.01)
A 6 1 P 11/08	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)
A 6 1 P 11/02	(2006.01)
A 6 1 P 1/04	(2006.01)
A 6 1 P 1/18	(2006.01)
A 6 1 P 13/12	(2006.01)
A 6 1 P 13/10	(2006.01)
A 6 1 P 17/00	(2006.01)
A 6 1 P 17/04	(2006.01)
A 6 1 P 17/06	(2006.01)
A 6 1 P 19/08	(2006.01)
A 6 1 P 19/02	(2006.01)
A 6 1 P 19/10	(2006.01)
A 6 1 P 19/06	(2006.01)
A 6 1 P 25/16	(2006.01)
A 6 1 P 25/28	(2006.01)
A 6 1 P 21/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/02	(2006.01)
A 6 1 P 25/06	(2006.01)
A 6 1 P 31/18	(2006.01)

A 6 1 P 31/06 (2006.01)
 A 6 1 P 17/02 (2006.01)
 A 6 1 P 39/02 (2006.01)
 A 6 1 P 25/34 (2006.01)
 A 6 1 P 3/10 (2006.01)
 A 6 1 P 9/10 (2006.01)
 A 6 1 P 27/02 (2006.01)
 A 6 1 P 3/00 (2006.01)
 A 6 1 P 3/04 (2006.01)
 A 6 1 P 5/00 (2006.01)
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)
 A 6 1 P 9/04 (2006.01)
 A 6 1 P 31/04 (2006.01)
 A 6 1 P 1/16 (2006.01)
 A 6 1 P 13/08 (2006.01)
 A 6 1 K 31/381 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4418 (2006.01)
 A 6 1 K 31/415 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4365 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4164 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4155 (2006.01)
 A 6 1 K 31/426 (2006.01)
 A 6 1 K 31/416 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4965 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 213/55
 C 0 7 D 333/60 C S P
 C 0 7 D 333/28
 C 0 7 D 333/24
 C 0 7 D 213/64
 C 0 7 D 231/12 C
 C 0 7 D 231/12 E
 C 0 7 D 231/12 D
 C 0 7 D 231/56 Z
 C 0 7 D 401/12
 C 0 7 D 405/04
 C 0 7 D 495/04 1 0 5 A
 C 0 7 D 233/61 1 0 1
 C 0 7 D 233/64 1 0 1
 C 0 7 D 277/30
 C 0 7 D 241/12
 A 6 1 P 25/04
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 15/00
 A 6 1 P 13/00
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 11/08
 A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P	11/02	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	1/18	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	13/10	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	17/04	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	19/08	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	19/06	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/02	
A 6 1 P	25/06	
A 6 1 P	31/18	
A 6 1 P	31/06	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	39/02	
A 6 1 P	25/34	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	3/00	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	5/00	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	9/04	
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	13/08	
A 6 1 K	31/381	
A 6 1 K	31/4418	
A 6 1 K	31/415	
A 6 1 K	31/4439	
A 6 1 K	31/4365	
A 6 1 K	31/4164	
A 6 1 K	31/4155	
A 6 1 K	31/426	
A 6 1 K	31/416	
A 6 1 K	31/4965	

【手続補正書】

【提出日】令和2年12月15日(2020.12.15)

【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

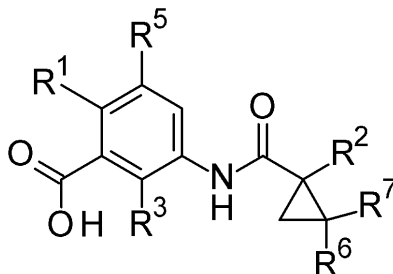
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記一般式（Ⅰ）の化合物又は該化合物の異性体、エナンチオマー、ジアステレオマー、ラセミ体、水和物、溶媒和物若しくは塩、特に該化合物の薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物。

【化 1】



[式中、

R¹ は、

・フェニル、

・5員若しくは6員ヘテロアリール〔前記5員ヘテロアリールは、独立にS、N、NH、及びOからなる群から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子含有基を含み、前記6員ヘテロアリールは1個若しくは2個の窒素原子を含む。〕、又は

・独立にNH、N、O、S、SO及びSO₂から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子含有基を含む二環式8～10員ヘテロアリールを表し、

前記R¹は、1以上の炭素原子で、1～3個の同一であるか異なっている置換基R^{1a}によって置換されていても良く、R^{1a}は、C₁-C₅-アルキル、C₃-C₇-シクロアルキル、-(C₁-C₃-アルキル)-(C₃-C₇-シクロアルキル)、-OC₁-C₅-アルキル、-OC₃-C₇-シクロアルキル、NHR⁴、N(R⁴)₂、NH(C₃-C₇-シクロアルキル)、ハロゲン、CN、NH₂SO₂R⁴、SO₂R⁴、5～7員ラクタム、又はNH、-NR⁴、N、O、S、SO及びSO₂から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子又はヘテロ原子含有基を含む4～7員複素環アルキルを表し、

独立に、R¹が5員ヘテロアリール又は二環式8～10員ヘテロアリールを表す場合、前記R¹の各環窒素原子（存在する場合）は置換基R^{1b}によって置換されていても良く、R^{1b}は、C₁-C₅-アルキル、-(C₁-C₃-アルキル)-(C₃-C₇-シクロアルキル)、C₃-C₇-シクロアルキル、SO₂R⁴、又はNH、-NR⁴、N、O、S、SO及びSO₂から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子又はヘテロ原子含有基を含む4～7員複素環アルキルを表し、

R^{1a}が、C₁-C₅-アルキル、C₃-C₇-シクロアルキル、-(C₁-C₃-アルキル)-(C₃-C₇-シクロアルキル)、-OC₁-C₅-アルキル又は-OC₃-C₇-シクロアルキルを表す場合、及び/又はR^{1b}が、C₁-C₅-アルキル、-(C₁-C₃-アルキル)-(C₃-C₇-シクロアルキル)又はC₃-C₇-シクロアルキルを表す場合、前記C₁-C₅-アルキル、C₃-C₇-シクロアルキル、-(C₁-C₃-アルキル)-(C₃-C₇-シクロアルキル)、-OC₁-C₅-アルキル及び-OC₃-C₇-シクロアルキルは独立に、独立にメチル、エチル、OH、OR⁴及びFからなる群から選択される1以上の置換基によって置換されていても良く、

R^{1a}及び/又はR^{1b}が4～7員複素環アルキルを表す場合、前記4～7員複素環

アルキルの各炭素原子は、独立にOH、OR⁴及びFからなる群から選択される1以上の置換基によって置換されていても良く；

R²は、

- ・ - (CH₂)_p - (C₅ - C₇ - シクロアルキル)、
- ・ - (CH₂)_p - フェニル

・ 5員若しくは6員ヘテロアリール [前記5員ヘテロアリールは、独立にS、N、NH及びOからなる群から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子含有基を含み、前記6員ヘテロアリールは1個若しくは2個の窒素原子を含む。]、又は

・ 独立にNH、N、O、S、SO及びSO₂から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子含有基を含む二環式8～10員ヘテロアリールを表し、

前記R²は、1以上の炭素原子で、1～3個の同一であるか異なっている置換基R^{2a}によって置換されていても良く、R^{2a}は、C₁ - C₅ - アルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキル、- (C₁ - C₃ - アルキル) - (C₃ - C₇ - シクロアルキル)、- OC₁ - C₅ - アルキル、- OC₃ - C₇ - シクロアルキル、ハロゲン、OH又はCNを表し、

独立に、R²が、5員ヘテロアリール又は二環式8～10員ヘテロアリールを表す場合、前記R²の各環窒素原子（存在する場合）は置換基R^{2b}によって置換されていても良く、R^{2b}は、C₁ - C₅ - アルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキル又は- (C₁ - C₃ - アルキル) - (C₃ - C₇ - シクロアルキル)を表し、

R^{2a}がC₁ - C₅ - アルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキル、- (C₁ - C₃ - アルキル) - (C₃ - C₇ - シクロアルキル)、- OC₁ - C₅ - アルキル又は- OC₃ - C₇ - シクロアルキルを表す場合、及び/又はR^{2b}がC₁ - C₅ - アルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキル又は- (C₁ - C₃ - アルキル) - (C₃ - C₇ - シクロアルキル)を表す場合、前記C₁ - C₅ - アルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキル、- (C₁ - C₃ - アルキル) - (C₃ - C₇ - シクロアルキル)、- OC₁ - C₅ - アルキル及び- OC₃ - C₇ - シクロアルキルは独立に、独立にOH、OR⁴、及びFからなる群から選択される1以上の置換基によって置換されていても良く；

pは0又は1を表し；

R³は、H又はFを表し；

R⁴は、1～5個のフッ素原子によって置換されていても良いC₁ - C₅ - アルキルを表し；

R⁵は、H、ハロゲン、CN、C₁ - C₅ - アルキル、又は- OC₁ - C₅ - アルキルを表し、前記C₁ - C₅ - アルキル及び- OC₁ - C₅ - アルキルは1～5個のフッ素原子によって置換されていても良く；

R⁶及びR⁷は独立に、H又はC₁ - C₃ - アルキルを表し、前記C₁ - C₃ - アルキルは、1～5個のフッ素原子によって置換されていても良い。]

【請求項2】

R¹が、独立にS、N、NH、及びOからなる群から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子含有基を含む5員ヘテロアリール、特にピラゾリル、チアゾリル、イミダゾリル又はチオフェニルを表し、

前記R¹が、1以上の炭素原子で、1個若しくは2個の同一であるか異なっている置換基R^{1a}によって置換されていても良く、R^{1a}が、C₁ - C₅ - アルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキル、- (C₁ - C₃ - アルキル) - (C₃ - C₇ - シクロアルキル)、- OC₁ - C₅ - アルキル、- OC₃ - C₇ - シクロアルキル、ハロゲン又はCNを表し、

独立に、前記R¹の各環窒素原子（存在する場合）が、置換基R^{1b}によって置換されていても良く、R^{1b}が、C₁ - C₅ - アルキル、- (C₁ - C₃ - アルキル) - (C₃ - C₇ - シクロアルキル)又はC₃ - C₇ - シクロアルキルを表し、

R^{1a}が、C₁ - C₅ - アルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキル、- (C₁ - C₃ - アルキル) - (C₃ - C₇ - シクロアルキル)、- OC₁ - C₅ - アルキル又は- OC₃ - C₇ - シクロアルキルを表す場合、及び/又はR^{1b}が、C₁ - C₅ - アルキル、- (

C₁ - C₃ - アルキル) - (C₃ - C₇ - シクロアルキル) 又は C₃ - C₇ - シクロアルキルを表す場合、前記 C₁ - C₅ - アルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキル、- (C₁ - C₃ - アルキル) - (C₃ - C₇ - シクロアルキル)、- OC₁ - C₅ - アルキル及び - OC₃ - C₇ - シクロアルキルが独立に、独立にメチル、エチル、OH、OR⁴ 及び F からなる群から選択される 1 以上の置換基によって置換されていても良い、請求項 1 に記載の化合物又は該化合物の異性体、エナンチオマー、ジアステレオマー、ラセミ体、水和物、溶媒和物若しくは塩、特に該化合物の薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物。

【請求項 3】

R¹ が、置換されていない又は 1 位の窒素原子で置換基 R^{1b} によって置換されているピラゾール - 4 - イルを表し、R^{1b} が C₁ - C₅ - アルキル、- (C₁ - C₃ - アルキル) - (C₃ - C₇ - シクロアルキル) 又は C₃ - C₇ - シクロアルキルを表し、前記 R^{1b} が、独立にメチル、エチル、OH、OR⁴ 及び F からなる群から選択される 1 以上の置換基によって置換されていても良い、請求項 1 又は 2 のいずれか 1 項に記載の化合物又は該化合物の異性体、エナンチオマー、ジアステレオマー、ラセミ体、水和物、溶媒和物若しくは塩、特に該化合物の薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物。

【請求項 4】

R² が、1 個若しくは 2 個の同一であるか異なっている置換基 R^{2a} によって置換されているフェニルを表し、R^{2a} が、C₁ - C₅ - アルキル、OC₁ - C₅ - アルキル、F 又は Cl を表し、

前記置換基又は前記置換基のうちの少なくとも一つが C₁ - C₅ - アルキル、- OC₁ - C₅ - アルキル又は Cl である場合、それが好ましくは、前記フェニルを分子の残りの部分に連結させる炭素原子に対してパラ位にあり、

前記 C₁ - C₅ - アルキル及び - OC₁ - C₅ - アルキルが独立に、1 ~ 5 個のフッ素原子によって置換されていても良い、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物又は該化合物の異性体、エナンチオマー、ジアステレオマー、ラセミ体、水和物、溶媒和物若しくは塩、特に該化合物の薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物。

【請求項 5】

R⁶ 及び R⁷ が H を表す、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物又は該化合物の異性体、エナンチオマー、ジアステレオマー、ラセミ体、水和物、溶媒和物若しくは塩、特に該化合物の薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物。

【請求項 6】

R¹ が、1 以上の炭素原子で、1 個若しくは 2 個の同一であるか異なっている置換基 R^{1a} によって置換されていても良いピラゾリル、特にピラゾール - 4 - イルを表し、R^{1a} が、C₁ - C₅ - アルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキル、- (C₁ - C₃ - アルキル) - (C₃ - C₇ - シクロアルキル)、- OC₁ - C₅ - アルキル、- OC₃ - C₇ - シクロアルキル、ハロゲン又は CN を表し、

独立に、前記 R¹ の各窒素原子が、置換基 R^{1b} によって置換されていても良く、R^{1b} が、C₁ - C₅ - アルキル、- (C₁ - C₃ - アルキル) - (C₃ - C₇ - シクロアルキル) 又は C₃ - C₇ - シクロアルキルを表し、

R^{1a} が、C₁ - C₅ - アルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキル、- (C₁ - C₃ - アルキル) - (C₃ - C₇ - シクロアルキル)、- OC₁ - C₅ - アルキル又は - OC₃ - C₇ - シクロアルキルを表す場合、及び / 又は R^{1b} が、C₁ - C₅ - アルキル、- (C₁ - C₃ - アルキル) - (C₃ - C₇ - シクロアルキル) 又は C₃ - C₇ - シクロアルキルを表す場合、前記 C₁ - C₅ - アルキル、C₃ - C₇ - シクロアルキル、- (C₁ - C₃ - アルキル) - (C₃ - C₇ - シクロアルキル)、- OC₁ - C₅ - アルキル及び - OC₃ - C₇ - シクロアルキルが独立に、独立にメチル、OH、OR⁴ 及び F からなる群から選択される 1 以上の置換基によって置換されていても良く；

R⁵ が、H、F、Cl 又はメチル、特に H 又は F を表し；

R⁶ 及び R⁷ が H を表す、請求項 1、2、4 及び 5 のいずれか 1 項に記載の化合物又は該化合物の異性体、エナンチオマー、ジアステレオマー、ラセミ体、水和物、溶媒和物若

しくは塩、特には該化合物の薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物。

【請求項 7】

R^2 が、1 個若しくは 2 個の同一であるか異なっている置換基 R^{2a} によって置換されているフェニルを表し、 R^{2a} が、 $C_1 - C_5$ - アルキル、 $-OC_1 - C_5$ - アルキル、F 又は Cl を表し、

前記置換基又は前記置換基のうちの少なくとも一つが $C_1 - C_5$ - アルキル、 $-OC_1 - C_5$ - アルキル又は Cl である場合、それが好ましくは、前記フェニルを分子の残りの部分に連結させる炭素原子に対してパラ位にあり、

前記 $C_1 - C_5$ - アルキル及び $-OC_1 - C_5$ - アルキルが独立に、1 ~ 5 個のフッ素原子によって置換されていても良く；

R^5 が、H、F、Cl 又はメチル、特には H 又は F を表し；

R^6 及び R^7 が H を表す、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物又は該化合物の異性体、エナンチオマー、ジアステレオマー、ラセミ体、水和物、溶媒和物若しくは塩、特には該化合物の薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物。

【請求項 8】

R^1 が、1 以上の炭素原子で、1 個若しくは 2 個の同一であるか異なっている置換基 R^{1a} によって置換されていても良いピラゾリル、特にはピラゾール - 4 - イルを表し、 R^{1a} が、 $C_1 - C_5$ - アルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル、 $-(C_1 - C_3 - \text{アルキル}) - (C_3 - C_7 - \text{シクロアルキル})$ 、 $-OC_1 - C_5$ - アルキル、 $-OC_3 - C_7$ - シクロアルキル、ハロゲン又は CN を表し、

独立に、前記 R^1 の各窒素原子が、置換基 R^{1b} によって置換されていても良く、 R^{1b} が、 $C_1 - C_5$ - アルキル、 $-(C_1 - C_3 - \text{アルキル}) - (C_3 - C_7 - \text{シクロアルキル})$ 又は $C_3 - C_7$ - シクロアルキルを表し、

R^{1a} が、 $C_1 - C_5$ - アルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル、 $-(C_1 - C_3 - \text{アルキル}) - (C_3 - C_7 - \text{シクロアルキル})$ 、 $-OC_1 - C_5$ - アルキル又は $-OC_3 - C_7$ - シクロアルキルを表す場合、及び / 又は R^{1b} が、 $C_1 - C_5$ - アルキル、 $-(C_1 - C_3 - \text{アルキル}) - (C_3 - C_7 - \text{シクロアルキル})$ 又は $C_3 - C_7$ - シクロアルキルを表す場合、前記 $C_1 - C_5$ - アルキル、 $C_3 - C_7$ - シクロアルキル、 $-(C_1 - C_3 - \text{アルキル}) - (C_3 - C_7 - \text{シクロアルキル})$ 、 $-OC_1 - C_5$ - アルキル及び $-OC_3 - C_7$ - シクロアルキルが独立に、独立にメチル、OH、 OR^4 及び F からなる群から選択される 1 以上の置換基によって置換されていても良く；

R^2 が、1 個若しくは 2 個の同一であるか異なっている置換基 R^{2a} によって置換されているフェニルを表し、 R^{2a} が、 $C_1 - C_5$ - アルキル、 $-OC_1 - C_5$ - アルキル、F 又は Cl を表し、

前記置換基又は前記置換基のうちの少なくとも一つが $C_1 - C_5$ - アルキル、 $-OC_1 - C_5$ - アルキル又は Cl である場合、それが好ましくは、前記フェニルを分子の残りの部分に連結させる炭素原子に対してパラ位にあり、

前記 $C_1 - C_5$ - アルキル及び $-OC_1 - C_5$ - アルキルが独立に、1 ~ 5 個のフッ素原子によって置換されていても良く；

R^5 が、H、F、Cl 又はメチル、特には H 又は F を表し；

R^6 及び R^7 が H を表す、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物又は該化合物の異性体、エナンチオマー、ジアステレオマー、ラセミ体、水和物、溶媒和物若しくは塩、特には該化合物の薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物。

【請求項 9】

R^1 が、1 位の窒素原子で、置換基 R^{1b} によって置換されているピラゾール - 4 - イルを表し、 R^{1b} が、 $C_1 - C_5$ - アルキル、 $-(C_1 - C_3 - \text{アルキル}) - (C_3 - C_7 - \text{シクロアルキル})$ 又は $C_3 - C_7$ - シクロアルキルを表し、

前記 R^{1b} が、独立にメチル、OH、 OR^4 及び F からなる群から選択される 1 以上の置換基によって置換されていても良く、

R^2 が、1 個若しくは 2 個の同一であるか異なっている置換基 R^{2a} によって置換され

ているフェニルを表し、 R^{2a} が、メチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、F又はClを表し、

前記置換基又は前記置換基のうちの少なくとも一つがFである場合、それが好ましくは、前記フェニルを分子の残りの部分に連結させる炭素原子に対してオルト位にあり、

前記置換基又は前記置換基のうちの少なくとも一つがメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ又はClである場合、それが好ましくは、前記フェニルを分子の残りの部分に連結させる炭素原子に対してパラ位にあり；

R^5 が、H、F、Cl又はメチル、特にH又はFを表し、

R^6 及び R^7 がHを表す、請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物又は該化合物の異性体、エナンチオマー、ジアステレオマー、ラセミ体、水和物、溶媒和物若しくは塩、特に該化合物の薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物。

【請求項10】

R^3 が、Hを表し；

R^5 がHを表す、請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物又は該化合物の異性体、エナンチオマー、ジアステレオマー、ラセミ体、水和物、溶媒和物若しくは塩、特に該化合物の薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物。

【請求項11】

R^3 が、Hを表し；

R^5 が、Fを表す、請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物又は該化合物の異性体、エナンチオマー、ジアステレオマー、ラセミ体、水和物、溶媒和物若しくは塩、特に該化合物の薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物。

【請求項12】

R^1 が、1位の窒素原子で、メチル、エチル、プロピル、プロパン-2-イル、2-メチルプロピル、tert-ブチル、ブタン-2-イル、シクロブチル、2,2-ジメチルプロピル、3-メチルブタン-2-イル、シクロペンチル、シクロヘキシル、1-シクロプロピルメチル、1-シクロプロピルエチル、1-シクロブチルメチル、1-(1-メチルシクロプロピル)メチル及び2,2,2-トリフルオロエチル、特にエチル、プロパン-2-イル、2-メチルプロピル、ブタン-2-イル、シクロブチル、2,2-ジメチルプロピル、1-シクロプロピルメチル、1-シクロプロピルエチル、1-(1-メチルシクロプロピル)メチル、及び1-シクロブチルメチルからなる群から選択される置換基によって置換されているピラゾール-4-イルを表し；

R^2 が、1個若しくは2個の同一であるか異なっている置換基 R^{2a} によって置換されているフェニルを表し、 R^{2a} が、メチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、F又はClを表し、

前記置換基又は前記置換基のうちの少なくとも一つがFである場合、それが好ましくは、前記フェニルを分子の残りの部分に連結させる炭素原子に対してオルト位にあり、

前記置換基又は前記置換基のうちの少なくとも一つがメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ又はClである場合、それが好ましくは、前記フェニルを分子の残りの部分に連結させる炭素原子に対してパラ位にあり、

R^3 が、Hを表し、

R^5 が、H又はF、好ましくはHを表し、

R^6 及び R^7 がHを表す、請求項1～10のいずれか1項に記載の化合物又は該化合物の異性体、エナンチオマー、ジアステレオマー、ラセミ体、水和物、溶媒和物若しくは塩、特に該化合物の薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物。

【請求項13】

R^1 が、2位の炭素原子で、メチル、エチル、プロピル、プロパン-2-イル、シクロプロピル、2-メチルプロピル、tert-ブチル、ブタン-2-イル、シクロブチル、2,2-ジメチルプロピル、3-メチルブタン-2-イル、シクロペンチル、シクロヘキシル、1-シクロプロピルメチル、1-シクロプロピルエチル、1-シクロブチルメチル、1-(1-メチルシクロプロピル)メチル及び2,2,2-トリフルオロエチル、特に

はエチル、プロパン - 2 - イル、2 - メチルプロピル、ブタン - 2 - イル、シクロブチル、2, 2 - ジメチルプロピル、シクロペンチル、1 - シクロプロピルメチル、1 - シクロプロピルエチル、1 - (1 - メチルシクロプロピル) メチル及び1 - シクロブチルメチルからなる群から選択される置換基 R^{1a} によって置換されていても良いチアゾール - 5 - イルを表し；

R^2 が、1個若しくは2個の同一であるか異なっている置換基 R^{2a} によって置換されているフェニルを表し、 R^{2a} が、メチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、F又はClを表し、

前記置換基又は前記置換基のうちの少なくとも一つがFである場合、それが好ましくは、前記フェニルを分子の残りの部分に連結させる炭素原子に対してオルト位にあり、

前記置換基又は前記置換基のうちの少なくとも一つがメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ又はClである場合、それが好ましくは、前記フェニルを分子の残りの部分に連結させる炭素原子に対してパラ位にあり、

R^5 が、H、F、Cl又はメチル、特にH又はFを表し、

R^6 及び R^7 がHを表す、請求項1又は2のいずれか1項に記載の化合物又は該化合物の異性体、エナンチオマー、ジアステレオマー、ラセミ体、水和物、溶媒和物若しくは塩、特に該化合物の薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物。

【請求項14】

2 - (1 - ベンゾチオフェン - 2 - イル) - 5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] 安息香酸；

2 - [6 - (1, 1 - ジフルオロプロピル) ピリジン - 3 - イル] - 5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] 安息香酸；

2 - (1 - シクロブチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] 安息香酸；

2 - (6 - エトキシピリジン - 3 - イル) - 5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] 安息香酸；

2 - (6 - エトキシピリジン - 3 - イル) - 5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] 安息香酸；

2 - (1 - シクロブチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 3 - フルオロ - 5 - ({ [1 - (2 - フルオロ - 4 - メチルフェニル) シクロプロピル] カルボニル } アミノ) 安息香酸；

2 - [6 - (1, 1 - ジフルオロプロピル) ピリジン - 3 - イル] - 5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] 安息香酸；

3 - フルオロ - 5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] - 2 - [6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - イル] 安息香酸；

5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] - 2 - [1 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] 安息香酸；

5 - ({ [1 - (4 - クロロフェニル) シクロプロピル] カルボニル } アミノ) - 2 - (1 - シクロブチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 3 - フルオロ 安息香酸；

2 - (1 - シクロブチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 3 - フルオロ - 5 - [({ 1 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] 安息香酸；

2 - (1 - シクロブチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 3 - フルオロ - 5 - [({ 1 - [4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] 安息香酸；

5 - 「 ({ 1 - 「 2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロプロピ

ル}カルボニル)アミノ]-2-[1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]安息香酸;

5-[({1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]シクロプロピル}カルボニル)アミノ]-2-[1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]安息香酸;

2-[1-(2,2-ジメチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-5-[({1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]シクロプロピル}カルボニル)アミノ]安息香酸;

2-[1-(2,2-ジメチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-5-[({1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]シクロプロピル}カルボニル)アミノ]安息香酸;

3-フルオロ-5-({[1-(2-フルオロ-4-メチルフェニル)シクロプロピル]カルボニル}アミノ)-2-[1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]安息香酸;

3-フルオロ-5-[({1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]シクロプロピル}カルボニル)アミノ]-2-[1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]安息香酸;

3-フルオロ-5-[({1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]シクロプロピル}カルボニル)アミノ]-2-[1-(プロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]安息香酸;

2-(4-tert-ブチル-1H-イミダゾール-1-イル)-3-フルオロ-5-[({1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]シクロプロピル}カルボニル)アミノ]安息香酸;

2-(4-tert-ブチル-1H-イミダゾール-1-イル)-3-フルオロ-5-[({1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]シクロプロピル}カルボニル)アミノ]安息香酸;

3-フルオロ-5-[({1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]シクロプロピル}カルボニル)アミノ]-2-[1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]安息香酸;

2-[6-(ジフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-3-フルオロ-5-[({1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]シクロプロピル}カルボニル)アミノ]安息香酸;

2-[6-(ジフルオロメチル)ピリジン-3-イル]-3-フルオロ-5-[({1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]シクロプロピル}カルボニル)アミノ]安息香酸;

2-[6-(1,1-ジフルオロプロピル)ピリジン-3-イル]-3-フルオロ-5-[({1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]シクロプロピル}カルボニル)アミノ]安息香酸;

2-[6-(1,1-ジフルオロプロピル)ピリジン-3-イル]-3-フルオロ-5-[({1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]シクロプロピル}カルボニル)アミノ]安息香酸;

3-クロロ-2-(1-シクロブチル-1H-ピラゾール-4-イル)-5-[({1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]シクロプロピル}カルボニル)アミノ]安息香酸;

3-クロロ-2-(1-シクロブチル-1H-ピラゾール-4-イル)-5-[({1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル]シクロプロピル}カルボニル)アミノ]安息香酸;

3-クロロ-2-[6-(1,1-ジフルオロプロピル)ピリジン-3-イル]-5-[({1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]シクロプロピル}カルボニル)アミノ]安息香酸;

2 - (1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 3 - フルオロ - 5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] シクロプロピル } カルボニル)

アミノ]安息香酸；

5 - ({ [1 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) シクロプロピル] カルボニル } アミノ) - 3 - フルオロ - 2 - [1 - (プロパン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] 安息香酸；

5 - ({ [1 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) シクロプロピル] カルボニル } アミノ) - 2 - (2 - シクロブチル - 1 , 3 - チアゾール - 5 - イル) 安息香酸；

2 - (2 - シクロブチル - 1 , 3 - チアゾール - 5 - イル) - 5 - ({ [1 - (2 - フルオロ - 4 - メチルフェニル) シクロプロピル] カルボニル } アミノ) 安息香酸；

2 - (2 - シクロブチル - 1 , 3 - チアゾール - 5 - イル) - 5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] 安息香酸；

2 - (2 - シクロブチル - 1 , 3 - チアゾール - 5 - イル) - 5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] 安息香酸；

5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] - 2 - { 1 - [(1 - メチルシクロプロピル) メチル] - 1 H - ピラゾール - 4 - イル } 安息香酸；

5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] - 2 - { 1 - [(1 - メチルシクロプロピル) メチル] - 1 H - ピラゾール - 4 - イル } 安息香酸；

2 - { 1 - [(1 S) - 1 - シクロプロピルエチル] - 1 H - ピラゾール - 4 - イル } - 5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] 安息香酸；

2 - (6 - エチルピリジン - 3 - イル) - 5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] 安息香酸；

2 - (6 - エチルピリジン - 3 - イル) - 5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] 安息香酸；

2 - (6 - エチルピリジン - 3 - イル) - 3 - フルオロ - 5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] 安息香酸；

3 - フルオロ - 5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] - 2 - (1 - メチル - 1 H - インダゾール - 6 - イル) 安息香酸；

2 - (2 - シクロペンチル - 1 , 3 - チアゾール - 5 - イル) - 5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] 安息香酸；

2 - (2 - シクロブチル - 1 , 3 - チアゾール - 5 - イル) - 3 - フルオロ - 5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] 安息香酸；及び

3 - フルオロ - 5 - [({ 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロプロピル } カルボニル) アミノ] - 2 - [1 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] 安息香酸

からなる群から選択される、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の化合物又は該化合物の薬学的に許容される塩。

【請求項 15】

請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の化合物、及び薬学的に許容される希釈剤又は担体を含む医薬組成物。

【請求項 16】

医薬製造のための、請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の化合物又は請求項 15 に記載の医薬組成物の使用。

【請求項 17】

疾患又は疾患症候群、状態若しくは症状の治療若しくは予防で使用される、請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の化合物又は請求項 15 に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

前記疾患又は疾患症候群、状態若しくは症状が疼痛及び / 又は炎症に関連するものである、請求項 17 に記載の使用のための化合物。

【請求項 19】

前記疾患又は疾患症候群、状態若しくは症状が、

- ・例えば膀胱炎、間質性膀胱炎、膀胱痛症候群、腎疝痛、又は前立腺炎、慢性骨盤痛、又は浸潤性子宮内膜症関連の疼痛に係る内臓痛；

- ・神経因性疼痛、例えばヘルペス後神経痛、急性带状疱疹痛、神経損傷関連の疼痛、ジニア (d y n i a)、例えば外陰部痛、幻肢痛、神経根ひきぬき損傷関連の疼痛、神経根障害関連の疼痛、有痛性外傷性単神経障害、有痛性エントラップメント神経障害、手根管症候群関連の疼痛、尺骨神経障害、足根管症候群関連の疼痛、有痛性糖尿病性神経障害、有痛性多発神経障害、三叉神経痛、又は家族性アミロイド・多発神経障害関連の疼痛；

- ・卒中、多発性硬化症及び脊髄損傷関連の疼痛など（これらに限定されるものではない）の、神経系のあらゆるレベルでの実質的にあらゆる病変によって生じる可能性がある中心性疼痛症候群；

- ・術後痛症候群（乳房切除後痛症候群、開胸術後痛症候群、断端痛など）、骨関節痛（骨関節炎）、脊椎痛（急性及び慢性腰痛、頸部痛、脊髄狭窄関連の疼痛など）、肩の痛み、反復運動痛、歯痛、咽喉炎関連の疼痛、がん疼痛、日焼け痛などの火傷痛、筋筋膜痛（筋肉損傷関連の疼痛、線維筋痛）、術後及び術中疼痛（一般外科、整形外科及び婦人科手術など（これらに限定されるものではない））；及び

- ・急性及び慢性疼痛、慢性骨盤痛、子宮内膜症関連疼痛、月経困難症関連疼痛（原発性及び続発性）、子宮筋腫関連の疼痛、外陰部痛関連疼痛、並びにアンギナ関連の疼痛、又は各種起源の炎症性疼痛（例えば、骨関節炎、関節リウマチ、リウマチ性疾患、腱鞘炎、痛風、強直性脊椎炎、及び滑液包炎関連の疼痛（これらに限定されるものではない））からなる群から選択される疼痛に関連する、請求項 17 又は 18 のいずれか 1 項に記載の使用のための化合物。

【請求項 20】

前記疾患又は疾患症候群、状態若しくは症状が、

- ・婦人科障害及び / 又は疾患、又は女性の健康に悪影響を与える効果及び / 又は症状、例えば、子宮内膜症、子宮筋腫、子宮前症、ホルモン欠乏、子宮の攣縮、又は重度月経出血；

- ・呼吸器系又は排泄系の疾患、例えば慢性閉塞性肺疾患のような気道疾患関連の炎症事象、アレルギー性喘息（アトピー性若しくは非アトピー性）などの喘息、並びに運動誘発性気管支収縮、職業性喘息、喘息のウィルス若しくは細菌増悪、他の非アレルギー性喘息及び喘鳴乳幼児症候群、慢性閉塞性肺疾患、例えば肺気腫、成人呼吸窮迫症候群、気管支炎、肺炎、咳、肺損傷、肺線維症、アレルギー性鼻炎（季節性及び通年性）、血管運動神経性鼻炎、血管性浮腫（例えば、遺伝性血管性浮腫及び薬剤誘発性血管性浮腫、例えばアンジオテンシン変換酵素 (A C E) 又は A C E / 中性エンドペプチダーゼ阻害剤、例えばオマパトリラート (o m e p a t r i l a t) によって引き起こされるもの）、塵肺症、例えばアルミニウム肺症、炭粉沈着症、石綿沈着症、珪肺症、睫毛脱落症、鉄沈着症、珪肺症、タバコ症及び綿肺症、腸疾患、例えばクローン病及び潰瘍性大腸炎、過敏性大腸症候群、膀胱炎、腎炎、膀胱炎（間質性膀胱炎）、膀胱痛症候群、腎臓線維症、腎不全、過活動膀胱 (h y p e r a c t i v e b l a d d e r)、及び過活動膀胱 (o v e r a c t i v e b l a d d e r) ；

- ・皮膚科疾患、例えば掻痒症、かゆみ、炎症性皮膚障害、例えば乾癬、湿疹、及びアトピー性皮膚炎；

- ・関節若しくは骨の疾患、例えば関節リウマチ、痛風、骨粗鬆症、骨関節炎、及び強

直性脊椎炎；

・中枢及び末梢神経系の疾患、例えば神経変性疾患、例えばパーキンソン病及びアルツハイマー病、筋萎縮性側索硬化症（ALS）、癲癇、認知症、頭痛、例えば群発頭痛、片頭痛、例えば予防及び急性使用、卒中、閉鎖性頭部外傷、及び多発性硬化症；

・感染、例えばHIV感染、及び結核；

・浮腫に関連する外傷、例えば脳浮腫、火傷、日焼け、及び捻挫又は骨折；

・中毒、例えばアルミニウム肺症、炭粉沈着症、石綿沈着症、珪肺症、睫毛脱落症、鉄沈着症、珪肺症、タバコ症及び綿肺症ブドウ膜炎；

・糖尿病クラスター又は代謝、例えばI型糖尿病、II型糖尿病、糖尿病性脈管障害、糖尿病性神経障害、糖尿病性網膜症、後毛細血管抵抗（post capillary resistance）又は膵島炎関連の糖尿病症状（例えば、高血糖、多尿、タンパク尿及び亜硝酸塩増加及びカリクレイン尿中排泄）、糖尿病性黄斑浮腫、メタボリック・シンドローム、インシュリン抵抗性、肥満、又は脂肪若しくは筋肉代謝；

・がん、AIDS、セリアック病、慢性閉塞性肺疾患、多発性硬化症、関節リウマチ、鬱血性心不全、結核、家族性アミロイド・多発神経障害、水銀中毒（肢端疼痛症）、及びホルモン欠乏のいずれかに関連するかそれによって誘発される悪液質；

・心血管系、例えば鬱血性心不全、アテローム性動脈硬化症、鬱血性心不全、心筋梗塞、及び心臓線維症；及び

・他の状態、例えば原発性腹膜炎、二次性腹膜炎、敗血性ショック、敗血症、筋萎縮、消化管の攣縮、良性前立腺過形成、及び乾燥疾患、例えば非アルコール性及びアルコール性脂肪肝疾患、非アルコール性及びアルコール性脂肪性肝炎、肝線維症、又は肝硬変からなる群のいずれか一つから選択されるか、それに関連するものである、請求項17～19のいずれか1項に記載の使用のための化合物。

【請求項21】

前記疾患又は疾患症候群、状態若しくは症状が、子宮内膜症又は子宮内膜症関連疼痛、特には月経困難症、性交疼痛、排尿障害又は排便障害に係るものである、請求項20に記載の使用のための化合物。

【請求項22】

前記疾患又は疾患症候群、状態若しくは症状が、関連症状を含む過活動膀胱、肺、腎臓、心臓及び/又は肝臓の線維症、I型及び/又はII型糖尿病、メタボリック・シンドローム、痛風、関節リウマチ、及び骨関節炎から選択されるか、それに係るものである、請求項20に記載の使用のための化合物。