

【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22年4月15日 (2010.4.15)

【公表番号】特表2009-528317(P2009-528317A)

【公表日】平成21年8月6日 (2009.8.6)

【年通号数】公開・登録公報2009-031

【出願番号】特願2008-556725(P2008-556725)

【国際特許分類】

C 0 7 D 231/20 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/415 (2006.01)

A 6 1 K 31/4155 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/12 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/30 (2006.01)

A 6 1 P 25/36 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/14 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 231/20 C S P Z

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/415

A 6 1 K 31/4155

C 0 7 D 413/12

A 6 1 K 31/496

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 3/06  
 A 6 1 P 1/12  
 A 6 1 P 3/00  
 A 6 1 P 25/06  
 A 6 1 P 3/04  
 A 6 1 P 19/02  
 A 6 1 P 9/12  
 A 6 1 P 9/06  
 A 6 1 P 1/04  
 A 6 1 P 25/28  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 25/30  
 A 6 1 P 25/36  
 A 6 1 P 9/10  
 A 6 1 P 25/24  
 A 6 1 P 25/18  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 37/00  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 1/14  
 A 6 1 P 3/10  
 A 6 1 P 25/04  
 A 6 1 P 25/22  
 A 6 1 P 37/06

【手続補正書】

【提出日】平成22年3月1日(2010.3.1)

【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

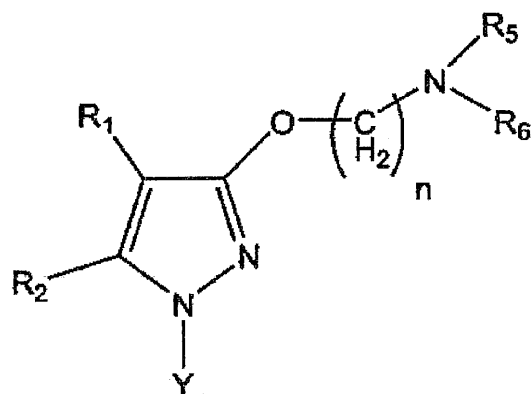
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】



(I)

(ここで、

$R_1$  が、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアリールアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換非置換のヘテロシクリルアルキル、 $-COR_8$ 、 $-C(O)OR_8$ 、 $-C(O)NR_8R_9$ 、 $-C=NR_8$ 、 $-CN$ 、 $-OR_8$ 、 $-OC(O)R_8$ 、 $-S(O)_t-R_8$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-NR_8C(O)R_9$ 、 $-NO_2$ 、 $-N=CR_8R_9$ 、またはハロゲンによって形成される群から選択され；

$R_2$  が、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のアリールアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換非置換のヘテロシクリルアルキル、 $-COR_8$ 、 $-C(O)OR_8$ 、 $-C(O)NR_8R_9$ 、 $-C=NR_8$ 、 $-CN$ 、 $-OR_8$ 、 $-OC(O)R_8$ 、 $-S(O)_t-R_8$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-NR_8C(O)R_9$ 、 $-NO_2$ 、 $-N=CR_8R_9$ 、またはハロゲンによって形成される群から選択され； $Y$  が、置換もしくは非置換の、分枝状もしくは直鎖状の  $C_{1-6}$ -アルキル；置換もしくは非置換の  $C_{3-8}$ -シクロアルキルから選択され；

$R_5$  および  $R_6$  が独立して、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のアリールアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換非置換のヘテロシクリルアルキル、 $-COR_8$ 、 $-C(O)OR_8$ 、 $-C(O)NR_8R_9$ 、 $-C=NR_8$ 、 $-CN$ 、 $-OR_8$ 、 $-OC(O)R_8$ 、 $-S(O)_t-R_8$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-NR_8C(O)R_9$ 、 $-NO_2$ 、 $-N=CR_8R_9$ 、またはハロゲンによって形成される群から選択され；

$R_5$  および  $R_6$  がともに、それらが結合される窒素原子と一体になって、置換もしくは非置換のヘテロシクリル基を形成し；

$n$  が、1、2、3、4、5、6、7または8から選択され；

$t$  が、1、2または3であり；

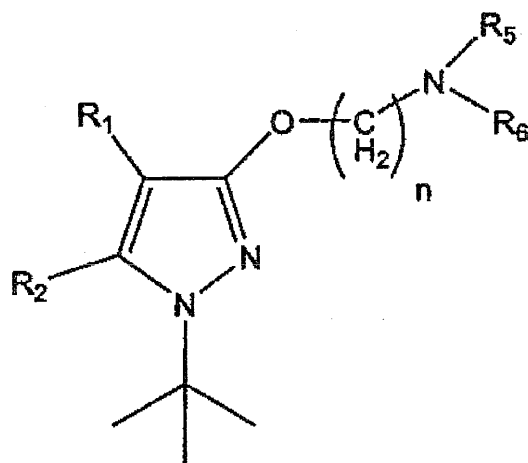
$R_8$  および  $R_9$  が互いに独立して、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、またはハロゲンから選択される）

の化合物（任意に立体異性体（好ましくは鏡像異性体またはジアステレオ異性体）の1つの形態、ラセミ化合物、もしくは少なくとも2つの立体異性体（好ましくは鏡像異性体および/またはジアステレオ異性体）のあらゆる混合比における混合物の形態、またはそれらの対応する塩、またはそれらの対応する溶媒和物）。

【請求項2】

式 IB：

## 【化 2】



(IB)

(ここで、

$R_1$  が、水素；置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のアリールアルキル、置換もしくは非置換の芳香族ヘテロシクリル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換非置換のヘテロシクリルアルキル、 $-COR_8$ 、 $-C(O)OR_8$ 、 $-C(O)NR_8R_9$ 、 $-C=NR_8$ 、 $-CN$ 、 $-OR_8$ 、 $-OC(O)R_8$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-NR_8C(O)R_9$ 、 $-NO_2$ 、 $-N=CR_8R_9$  またはハロゲンによって形成される群から選択され；

$R_2$  が、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のアリールアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のヘテロシクリルアルキル、 $-COR_8$ 、 $-C(O)OR_8$ 、 $-C(O)NR_8R_9$ 、 $-C=NR_8$ 、 $-CN$ 、 $-OR_8$ 、 $-OC(O)R_8$ 、 $-S(O)_t-R_8$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-NR_8C(O)R_9$ 、 $-NO_2$ 、 $-N=CR_8R_9$ 、またはハロゲンによって形成される群から選択され；

$R_5$  および  $R_6$  が独立して、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のアリールアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のヘテロシクリルアルキル、 $-COR_8$ 、 $-C(O)OR_8$ 、 $-C(O)NR_8R_9$ 、 $-C=NR_8$ 、 $-CN$ 、 $-OR_8$ 、 $-OC(O)R_8$ 、 $-S(O)_t-R_8$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-NR_8C(O)R_9$ 、 $-NO_2$ 、 $-N=CR_8R_9$ 、またはハロゲンによって形成される群から選択され；

$R_5$  および  $R_6$  がともに、それらが結合される窒素原子と一体になって、置換もしくは非置換のヘテロシクリル基を形成し；

$n$  が、1、2、3、4、5、6、7 または 8 から選択され；

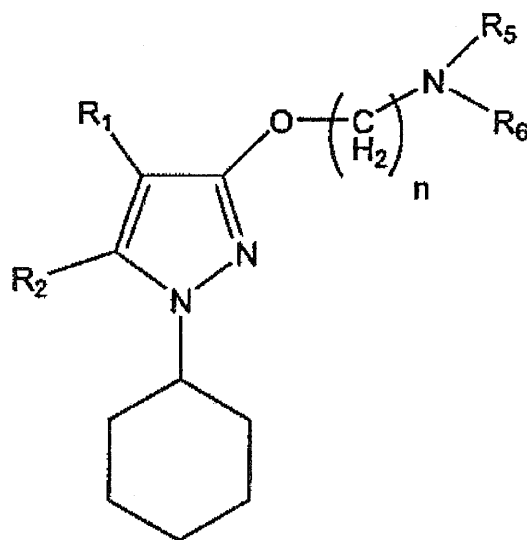
$t$  が、1、2 または 3 であり；

$R_8$  および  $R_9$  が互いに独立して、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、またはハロゲンから選択される)

の請求項 1 に記載の化合物 (任意に立体異性体 (好ましくは鏡像異性体またはジアステレオ異性体) の 1 つの形態、ラセミ化合物、もしくは少なくとも 2 つの立体異性体 (好ましくは鏡像異性体および / またはジアステレオ異性体) のあらゆる混合比における混合物の形態、またはそれらの対応する塩、またはそれらの対応する溶媒和物)。

【請求項 3】

式 IC :  
【化 3】



(IC)

(ここで、

$R_1$  が、水素；置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のアリールアルキル、置換もしくは非置換の芳香族ヘテロシクリル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のヘテロシクリルアルキル、 $-COR_8$ 、 $-C(O)OR_8$ 、 $-C(O)NR_8R_9$ 、 $-C=NR_8$ 、 $-CN$ 、 $-OR_8$ 、 $-OC(O)R_8$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-NR_8C(O)R_9$ 、 $-NO_2$ 、 $-N=CR_8R_9$  またはハロゲンによって形成される群から選択され；

$R_2$  が、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のアリールアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のヘテロシクリルアルキル、 $-COR_8$ 、 $-C(O)OR_8$ 、 $-C(O)NR_8R_9$ 、 $-C=NR_8$ 、 $-CN$ 、 $-OR_8$ 、 $-OC(O)R_8$ 、 $-S(O)_t-R_8$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-NR_8C(O)R_9$ 、 $-NO_2$ 、 $-N=CR_8R_9$ 、またはハロゲンによって形成される群から選択され；

$R_5$  および  $R_6$  が独立して、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のアリールアルキル、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、置換もしくは非置換のヘテロシクリルアルキル、 $-COR_8$ 、 $-C(O)OR_8$ 、 $-C(O)NR_8R_9$ 、 $-C=NR_8$ 、 $-CN$ 、 $-OR_8$ 、 $-OC(O)R_8$ 、 $-S(O)_t-R_8$ 、 $-NR_8R_9$ 、 $-NR_8C(O)R_9$ 、 $-NO_2$ 、 $-N=CR_8R_9$ 、またはハロゲンによって形成される群から選択され；

$R_5$  および  $R_6$  がともに、それらが結合される窒素原子と一体になって、置換もしくは非置換のヘテロシクリル基を形成し；

$n$  が、1、2、3、4、5、6、7 または 8 から選択され；

$t$  が、1、2 または 3 であり；

$R_8$  および  $R_9$  が互いに独立して、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のシクロアルキル、置換もしくは非置換のアルケニル、置換もしくは非置換のアリール、置換もしくは非置換のヘテロシクリル、またはハロゲンから選択される)

の請求項 1 に記載の化合物 (任意に立体異性体 (好ましくは鏡像異性体またはジアステレオ異性体) の 1 つの形態、ラセミ化合物、もしくは少なくとも 2 つの立体異性体 (好まし

くは鏡像異性体および/またはジアステレオ異性体)のあらゆる混合比における混合物の形態、またはそれらの対応する塩、またはそれらの対応する溶媒和物)。

【請求項4】

R<sub>1</sub>が、H、ハロゲン、-COR<sub>8</sub>、または置換もしくは非置換のアルキルから選択され、好ましくは当該R<sub>1</sub>が、H、Cl、メチルまたはアセチルから選択されることを特徴とする請求項1、2または3に記載の化合物。

【請求項5】

R<sub>1</sub>が、水素であることを特徴とする請求項1、2または3に記載の化合物。

【請求項6】

R<sub>2</sub>が、H、アリール、C(O)OR<sub>8</sub>またはアルキル、好ましくはメチル、イソプロピル、フェニル、C(O)O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>またはHであることを特徴とする請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項7】

nが、2、3、または4、好ましくは2から選択されることを特徴とする請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項8】

R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>が、水素または置換もしくは非置換のアルキル、好ましくは水素、メチル、エチル、プロピルまたはブチルから選択されることを特徴とする請求項1～7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項9】

R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>がともに、それらが結合される窒素原子と一体になって、置換もしくは非置換のヘテロシクリル基を形成し、

好ましくは、環における任意に1つのC原子がN、SもしくはOから選択される異種原子によって置換される状態において、環において5もしくは6つの炭素原子を有する置換もしくは非置換のヘテロシクリルを形成し、

より好ましくは、置換もしくは非置換のピペリジン、ピロリジン、ピペラジンまたはモルホリン、特に非置換のピペリジン、ピロリジン、またはモルホリンを形成することを特徴とする請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項10】

- - 1 - [ 2 - ( 1 - tert - ブチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ] ピペリジン

- - 4 - [ 2 - ( 1 - tert - ブチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ] モルホリン

- - 2 - ( 1 - tert - ブチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) - N , N - ジエチルエタンアミン

- - 1 - tert - ブチル - 3 - [ 2 - ( ピロリジン - 1 - イル ) エトキシ ] - 1 H - ピラゾール

- - 4 - ( 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ) モルホリン

- - 1 - ( 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ) ピペリジン

- - 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) - N , N - ジエチルエタンアミン

1 - シクロヘキシル - 3 - ( 2 - ( ピロリジン - 1 - イル ) エトキシ ) - 1 H - ピラゾール ;

4 - ( 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ) - 2 , 6 - ジメチルモルホリン ;

1 - ( 4 - ( 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ) ピペラジン - 1 - イル ) エタンオン ;

1 - ( 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ) - 4

- フェニルピペリジン；
- 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) - N , N - ジエチルエタンアミン；
- 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 3 - ( 2 - ( ピロリジン - 1 - イル ) エトキシ ) - 1 H - ピラゾール；
- 1 - ( 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ) ピペリジン；
- 4 - ( 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ) モルホリン；
- 4 - ( 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ) - 2 , 6 - ジメチルモルホリン；
- 1 - ( 4 - ( 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ) ピペラジン - 1 - イル ) エタンオン；
- 4 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) - N , N - ジエチルブタン - 1 - アミン；
- 4 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) - N , N - ジエチルブタン - 1 - アミン；
- 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 3 - ( 4 - ( ピロリジン - 1 - イル ) ブトキシ ) - 1 H - ピラゾール；
- 1 - シクロヘキシル - 3 - ( 4 - ( ピロリジン - 1 - イル ) ブトキシ ) - 1 H - ピラゾール；
- 1 - ( 4 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) ブチル ) ピペリジン；
- 1 - ( 4 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) ブチル ) ピペリジン；
- 4 - ( 4 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) ブチル ) モルホリン；
- 4 - ( 4 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) ブチル ) - 2 , 6 - ジメチルモルホリン；
- 4 - ( 4 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) ブチル ) モルホリン；
- 4 - ( 4 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) ブチル ) - 2 , 6 - ジメチルモルホリン；
- 1 - ( 4 - ( 4 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) ブチル ) ピペラジン - 1 - イル ) エタンオン；
- 1 - ( 4 - ( 4 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) ブチル ) ピペラジン - 1 - イル ) エタンオン；
- - 1 - [ 2 - ( 1 - t e r t - ブチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ] ピペリジン シュウ酸塩；
- - 4 - [ 2 - ( 1 - t e r t - ブチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ] モルホリン シュウ酸塩；
- - 2 - ( 1 - t e r t - ブチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) - N , N - ジエチルエタンアミン シュウ酸塩；
- - 1 - t e r t - ブチル - 3 - [ 2 - ( ピロリジン - 1 - イル ) エトキシ ] - 1 H - ピラゾール シュウ酸塩；
- - 4 - ( 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ) モルホリン シュウ酸塩；
- - 1 - ( 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ) ピペリジン シュウ酸塩；
- - 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) - N , N - ジエ

チルエタンアミン シュウ酸塩；

1 - シクロヘキシル - 3 - ( 2 - ( ピロリジン - 1 - イル ) エトキシ ) - 1 H - ピラゾール シュウ酸塩；

4 - ( 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ) - 2 , 6 - ジメチルモルホリン シュウ酸塩；

1 - ( 4 - ( 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ) ピペラジン - 1 - イル ) エタンオン シュウ酸塩；

1 - ( 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ) - 4 - フェニルピペリジン シュウ酸塩；

2 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) - N , N - ジエチルエタンアミン シュウ酸塩；

1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 3 - ( 2 - ピロリジン - 1 - イル ) エトキシ ) - 1 H - ピラゾール シュウ酸塩；

1 - ( 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ) ピペリジン シュウ酸塩；

4 - ( 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ) モルホリン シュウ酸塩；

4 - ( 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ) - 2 , 6 - ジメチルモルホリン シュウ酸塩；

1 - ( 4 - ( 2 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) エチル ) ピペラジン - 1 - イル ) エタンオン シュウ酸塩；

4 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) - N , N - ジエチルブタン - 1 - アミン シュウ酸塩；

4 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) - N , N - ジエチルブタン - 1 - アミン シュウ酸塩；

1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 3 - ( 4 - ( ピロリジン - 1 - イル ) ブトキシ ) - 1 H - ピラゾール シュウ酸塩；

1 - シクロヘキシル - 3 - ( 4 - ( ピロリジン - 1 - イル ) ブトキシ ) - 1 H - ピラゾール シュウ酸塩；

1 - ( 4 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) ブチル ) ピペリジン シュウ酸塩；

1 - ( 4 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) ブチル ) ピペリジン シュウ酸塩；

4 - ( 4 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) ブチル ) モルホリン シュウ酸塩；

4 - ( 4 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) ブチル ) - 2 , 6 - ジメチルモルホリン シュウ酸塩；

4 - ( 4 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) ブチル ) モルホリン シュウ酸塩；

4 - ( 4 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) ブチル ) - 2 , 6 - ジメチルモルホリン シュウ酸塩；

1 - ( 4 - ( 4 - ( 1 - シクロヘキシル - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) ブチル ) ピペラジン - 1 - イル ) エタンオン シュウ酸塩；または

1 - ( 4 - ( 4 - ( 1 - シクロヘキシル - 1 H - ピラゾール - 3 - イルオキシ ) ブチル ) ピペラジン - 1 - イル ) エタンオン シュウ酸塩

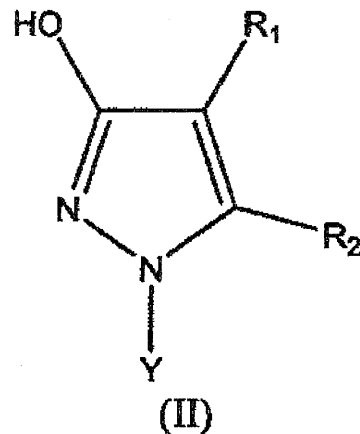
から選択される化合物（任意に立体異性体（好ましくは鏡像異性体またはジアステレオ異性体）の1つの形態、ラセミ化合物、もしくは少なくとも2つの立体異性体（好ましくは鏡像異性体および/またはジアステレオ異性体）のあらゆる混合比における混合物の形態、またはそれらの対応する塩、またはそれらの対応する溶媒和物）であって、請求項1に記載の化合物。



## 【請求項 11】

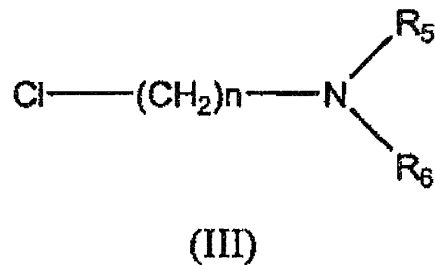
式 (II) :

## 【化 4】



(ここで、 $R_1$ 、 $R_2$  および  $Y$  が、請求項 1 における上述の定義の通りである) の化合物の、式 (III) :

## 【化 5】



(ここで、 $R_5$ 、 $R_6$  および  $n$  が、請求項 1 または 2 に定義される通りである) の化合物との縮合を包含する請求項 1 に記載の式 (I) の化合物、またはそれらの塩、異性体もしくは溶媒和物の調製方法。

## 【請求項 12】

請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物またはそれらの薬学的に受容可能な塩、プロドラッグ、異性体もしくは溶媒和物、ならびに薬学的に受容可能な担体、補助剤または溶媒を包含する薬学的組成物。

## 【請求項 13】

薬剤の製造における、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物の利用。

## 【請求項 14】

シグマ受容体に関連する疾患または好ましくない健康状態を処置または予防する薬剤の製造における、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物の利用。

## 【請求項 15】

上記疾患が、下痢、リポタンパク障害、代謝症候群、高いトリグリセリド濃度の処置、キロミクロン血症、高リポタンパク血症；高脂血症、特に混合型高脂血症；高コレステロール血症、異常ベータリポタンパク血症、高トリグリセリド血症（散発性障害および家族性障害（遺伝性の高トリグリセリド血症）の両方を含む）、偏頭痛、肥満、関節炎、高血圧、不整脈、潰瘍、学習障害、記憶障害および注意障害、認識障害、神経変性疾患、脱髄疾患、薬物および化学物質（コカイン、アンフェタミン、エタノールおよびニコチンを含む）に対する中毒；遅発性ジスキネジア、虚血性脳卒中、癲癇、脳卒中、うつ病、ストレス、精神異常、精神分裂病；炎症、自己免疫疾患またはがん；食物摂取の障害、肥満、過食症、拒食症、悪液質または 2 型の糖尿病、好ましくは肥満によって引き起こされる 2 型の糖尿病の処置および / または予防を目的とした、体重の増加、減少または維持を目的とした、食欲の調整である請求項 13 に記載の利用。

**【請求項 16】**

上記疾患が、痛み、特に神経障害性の痛みか、炎症性の痛みか、または他の痛みの状態、異痛症および／または痛覚過敏症、特に器械的な異痛症である請求項 13 に記載の利用。