

【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25年1月10日(2013.1.10)

【公表番号】特表2011-509296(P2011-509296A)

【公表日】平成23年3月24日(2011.3.24)

【年通号数】公開・登録公報2011-012

【出願番号】特願2010-542280(P2010-542280)

【国際特許分類】

C 0 7 D 215/48 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 513/04 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 491/052 (2006.01)

C 0 7 D 498/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 K 31/416 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 31/538 (2006.01)

A 6 1 K 31/436 (2006.01)

A 6 1 K 31/5365 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 13/00 (2006.01)
A 6 1 P 17/02 (2006.01)
A 6 1 P 11/08 (2006.01)
A 6 1 P 3/12 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 215/48	C S P
C 0 7 D 405/12	
C 0 7 D 513/04	3 4 3
C 0 7 D 413/12	
C 0 7 D 401/12	
C 0 7 D 491/052	
C 0 7 D 498/04	1 1 2 Q
A 6 1 K 31/4709	
A 6 1 K 31/416	
A 6 1 K 31/437	
A 6 1 K 31/538	
A 6 1 K 31/436	
A 6 1 K 31/5365	
A 6 1 P 25/04	
A 6 1 P 37/06	
A 6 1 P 29/00	
A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 25/06	
A 6 1 P 25/16	
A 6 1 P 25/00	
A 6 1 P 25/24	
A 6 1 P 25/18	
A 6 1 P 25/22	
A 6 1 P 9/10	
A 6 1 P 25/08	
A 6 1 P 13/08	
A 6 1 P 13/12	
A 6 1 P 1/00	
A 6 1 P 1/04	
A 6 1 P 11/02	
A 6 1 P 11/06	
A 6 1 P 11/00	
A 6 1 P 37/08	
A 6 1 P 19/02	
A 6 1 P 29/00	1 0 1
A 6 1 P 9/10	1 0 1
A 6 1 P 17/04	
A 6 1 P 17/06	
A 6 1 P 17/14	
A 6 1 P 3/04	
A 6 1 P 3/06	
A 6 1 P 35/00	
A 6 1 P 9/12	
A 6 1 P 13/00	

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 11/08

A 6 1 P 3/12

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成23年11月24日(2011.11.24)

【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

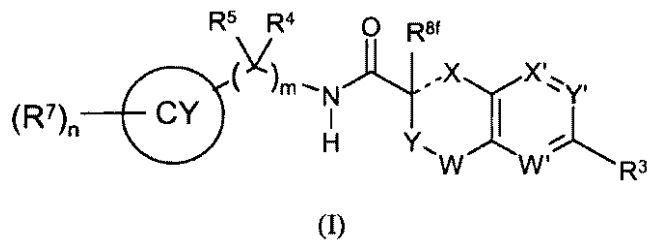
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式：

【化63】



の化合物、その薬学的に許容される塩、該化合物もしくは該塩の同位体改変体、該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の立体異性体、または該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の互変異性体であって、ここで：

CYはビシクロヘテロアリアルであり；

WはO、CR^{8a}R^{8b}、またはNR^{8c}を表し；

XはN、O、CR^{8a}、CR^{8a}R^{8b}、またはNR^{8c}を表し；

YはCR^{8d}R^{8e}を表し；

W'、X'、およびY'の3つすべてが同時にNになることはあり得ないという条件で、W'、X'、およびY'は、各々独立して、CR⁸またはNを表し；

R³は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、置換もしくは非置換(C₁-C₆)アルキル、置換もしくは非置換(C₁-C₆)アルコキシ、または置換もしくは非置換3～8員シクロアルキルを表し；

R⁴およびR⁵は、各々独立して、水素または置換もしくは非置換(C₁-C₆)アルキルを表し；mは0または1であり；

各R⁷は、H、ハロゲン、ヒドロキシ、(C₁-C₆)アシル、シアノ、置換もしくは非置換(C₁-C₆)アルキル、または置換もしくは非置換(C₁-C₆)アルコキシであり；またはR⁷は、(C₁-C₆)アルキル、ハロ(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルコキシ、ヒドロキシ(C₁-C₆)アルコキシ、ハロ(C₁-C₆)アルコキシであり；nは1、2、3、4または5であり；

各R⁸は、独立して、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、置換もしくは非置換(C₁-C₆)アルキル、置換もしくは非置換(C₁-C₆)アルコキシ、または置換もしくは非置換3～8員シクロアルキルを表し；

R^{8a}、R^{8b}、R^{8d}、R^{8e}およびR^{8f}の各々は、独立して、水素、ハロ、ヒドロキシ、置換もしくは非置換(C₁-C₆)アルキル、または置換もしくは非置換3～8員シクロアルキルを表し；

R^{8c}は、水素、または置換もしくは非置換(C₁-C₆)アルキルを表し；ならびに点線の結合は単結合または二重結合を表し；

ただし：

i) 点線の結合が二重結合である場合、 R^{8f} は存在せず；

ii) XがNまたはOである場合； R^{8f} は水素、または置換もしくは非置換アルキルであり；

iii) XがOである場合；WはOまたは NR^{8c} であり；ならびに

iv) WがOであり；かつ点線の結合が単結合である場合；XはOまたは NR^{8c} である、

化合物、その薬学的に許容される塩、該化合物もしくは該塩の同位体改変体、該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の立体異性体、または該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の互変異性体。

【請求項2】

R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^7 、 R^8 、 R^{8a} 、 R^{8b} 、 R^{8c} 、 R^{8d} 、 R^{8e} または R^{8f} が、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1 - C_6)$ アルキル、または $(C_1 - C_6)$ アルコキシ $(C_1 - C_6)$ アルキルである、請求項1に記載の化合物、その薬学的に許容される塩、該化合物もしくは該塩の同位体改変体、該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の立体異性体、または該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の互変異性体。

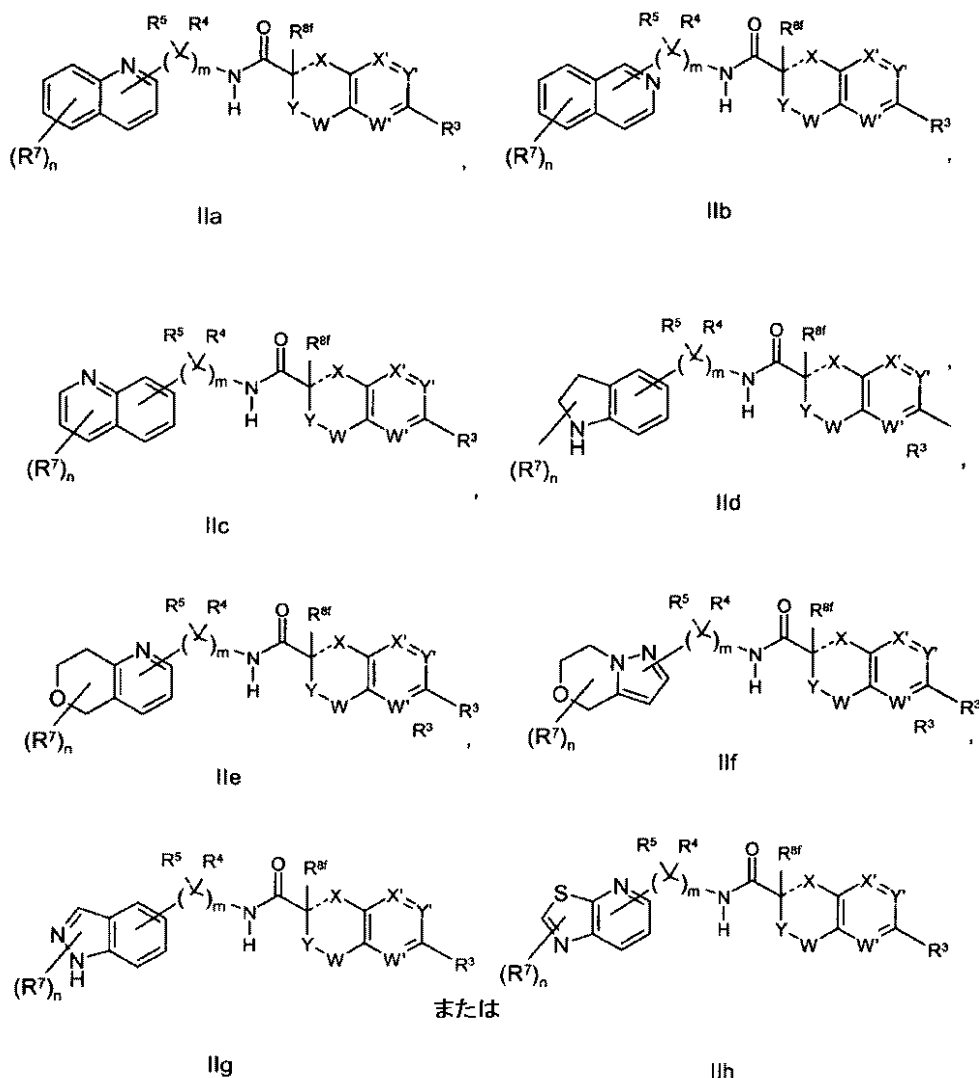
【請求項3】

CYが、キノリニル、イソキノリニル、インドリル、ジヒドロインドリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ベンゾピラニル、ピラノピリジル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、ベンズチアゾリル、ベンズオキサゾリル、ピラゾロピリジン、ピラゾロオキサジニル、またはチアゾロピリジンである、請求項1～2のいずれか1項に記載の化合物、その薬学的に許容される塩、該化合物もしくは該塩の同位体改変体、該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の立体異性体、または該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の互変異性体。

【請求項4】

式IIa、IIb、IIc、IId、IIe、IIf、IIg、またはIIh：

【化 6 4】



に従う、請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、その薬学的に許容される塩、該化合物もしくは該塩の同位体改変体、該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の立体異性体、または該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の互変異性体であって、

ここで、W、X、Y、W'、X'、Y'、R³、R⁴、R⁵、および R^{8f} は請求項 1 と同様であり、； R⁷ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆) アシル、非置換であるかもしくはハロ、ヒドロキシ、および (C₁ - C₆) アルコキシから選択される 1 つ以上の基で置換された (C₁ - C₆) アルキル、または非置換であるかもしくはハロ、ヒドロキシおよび (C₁ - C₆) アルコキシから選択される 1 つ以上の基で置換された (C₁ - C₆) アルコキシであり； m は 0 または 1 であり； n は 1、2、3、または 4 であり；ならびに点線の結合は単結合または二重結合を表す、

化合物、その薬学的に許容される塩、該化合物もしくは該塩の同位体改変体、該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の立体異性体、または該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の互変異性体。

【請求項 5】

W および X が、各々独立して、C R^{8a} R^{8b} を表し；ならびに点線の結合が単結合である、請求項 1 ～ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、その薬学的に許容される塩、該化合物もしくは該塩の同位体改変体、該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の立体異性体、または該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の互変異性体。

【請求項 6】

W が C R^{8a} R^{8b} を表す、請求項 1 ～ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、その薬学的

に許容される塩、該化合物もしくは該塩の同位体改変体、該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の立体異性体、または該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の互変異性体。

【請求項 7】

X' および Y' が各々独立して C R⁸ を表す、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物、その薬学的に許容される塩、該化合物もしくは該塩の同位体改変体、該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の立体異性体、または該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の互変異性体。

【請求項 8】

R³ が 1 - メチル - 1 - ヒドロキシエチルであり、かつ R⁸ が H であるか、または、R³ が 1 - メチル - 1 - トリフルオロメチルエチルであり、かつ R⁸ が H である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物、その薬学的に許容される塩、該化合物もしくは該塩の同位体改変体、該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の立体異性体、または該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の互変異性体。

【請求項 9】

R^{8a} が水素、または Me である、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、その薬学的に許容される塩、該化合物もしくは該塩の同位体改変体、該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の立体異性体、または該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の互変異性体。

【請求項 10】

R^{8c} が Me である、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、その薬学的に許容される塩、該化合物もしくは該塩の同位体改変体、該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の立体異性体、または該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の互変異性体。

【請求項 11】

m が 1 であり；かつ R⁴ が水素または Me である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、その薬学的に許容される塩、該化合物もしくは該塩の同位体改変体、該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の立体異性体、または該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の互変異性体。

【請求項 12】

以下：

6 - tert - ブチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシン - 2 - カルボン酸 (キノリン - 4 - イルメチル) - アミド；

6 - クロロ - 2 H - クロメン - 3 - カルボン酸 (キノリン - 4 - イルメチル) - アミド；

6 - ブロモ - 2 H - クロメン - 3 - カルボン酸 (キノリン - 4 - イルメチル) - アミド；

6 - トリフルオロメトキシ - 2 H - クロメン - 3 - カルボン酸 (キノリン - 4 - イルメチル) - アミド；

6 - クロロ - 2 H - クロメン - 3 - カルボン酸 [1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド；

(S) - 6 - tert - ブチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシン - 2 - カルボン酸 [1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド；

(R) - 6 - tert - ブチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシン - 2 - カルボン酸 [1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド；

7 - tert - ブチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシン - 2 - カルボン酸 (2 - ヒドロキシメチル - チアゾロ [5 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) - アミド；

4 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [1 , 4] オキサジン - 2 - カルボン酸 [1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド；

2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 [1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド；

ル] - アミド ;

(R) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 [(R) - 1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド ;

(S) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 [(R) - 1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド ;

(R) - 6 - トリフルオロメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシン - 2 - カルボン酸 [1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド ;

(S) - 6 - トリフルオロメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシン - 2 - カルボン酸 [1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド ;

(R) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 (2 - ヒドロキシメチル - チアゾロ [5 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) - アミド ;

(R) - 6 - トリフルオロメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシン - 2 - カルボン酸 (2 - ヒドロキシメチル - チアゾロ [5 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) - アミド ;

(R) - 6 - トリフルオロメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシン - 2 - カルボン酸 (7 , 8 - ジヒドロ - 5 H - ピラノ [4 , 3 - b] ピリジン - 3 - イル) - アミド ;

(R) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 (7 , 8 - ジヒドロ - 5 H - ピラノ [4 , 3 - b] ピリジン - 3 - イル) - アミド ;

(S) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 (7 , 8 - ジヒドロ - 5 H - ピラノ [4 , 3 - b] ピリジン - 3 - イル) - アミド ;

(R) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 [(R) - 1 - (6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピラゾロ [5 , 1 - b] [1 , 3] オキサジン - 3 - イル) - エチル] - アミド ;

(R) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 キノリン - 3 - イルアミド ;

(S) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 [(R) - 1 - (6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - ピラゾロ [5 , 1 - b] [1 , 3] オキサジン - 3 - イル) - エチル] - アミド ;

(R) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 (1 - アセチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 6 - イル) - アミド ;

6 - メチル - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 (2 - ヒドロキシメチル - チアゾロ [5 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) - アミド ;

(S) - 6 - トリフルオロメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシン - 2 - カルボン酸 [(R) - 1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド ;

および

(R) - 6 - トリフルオロメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシン - 2 - カルボン酸 [(R) - 1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド

の化合物、その薬学的に許容される塩、該化合物もしくは該塩の同位体改変体、該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の立体異性体、または該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の互変異性体から選択される、請求項 1 に記載の化合物、その薬学的に許容される塩、該化合物もしくは該塩の同位体改変体、該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の立体異性体、または該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の互変異性体。

【請求項 1 3】

薬学的に許容されるキャリアおよび薬学的有効量の請求項 1 ~ 1 2 のいずれかに記載の化合物、その薬学的に許容される塩、該化合物もしくは該塩の同位体改変体、該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の立体異性体、または該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の互変異性体を含む薬学的組成物。

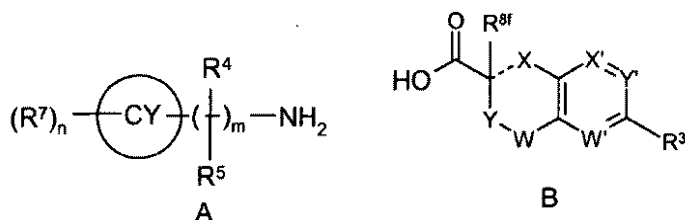
【請求項 1 4】

疾患または状態を治療するための請求項 1 3 に記載の薬学的組成物であって、該疾患または状態が：急性、炎症性、および神経障害性の疼痛を含む疼痛；慢性の疼痛；歯痛；片頭痛、群発性頭痛、および緊張性頭痛を含む頭痛；パーキンソン病；アルツハイマー病；多発性硬化症；神経炎症によって媒介されるかまたは神経炎症を生じる疾患および障害、外傷性脳傷害、脳卒中、または脳炎；うつ病、躁病、双極性疾患、不安、統合失調症、摂食障害、睡眠障害、および認知障害を含む、中枢媒介性 - 神経精神性の疾患および障害；てんかんおよびてんかん発作障害；前立腺、膀胱、および腸の機能不全、尿失禁、排尿困難、直腸の過敏症、大便失禁、良性前立腺肥大症、および炎症性腸疾患；アレルギー性鼻炎、喘息、および反応性気道疾患ならびに慢性閉塞性肺疾患を含む、呼吸器および気道の疾患および障害；関節炎、関節リウマチ、および変形性関節症を含む、炎症によって媒介されるかまたは炎症を生じる疾患および障害；心筋梗塞；自己免疫疾患および自己免疫障害；ブドウ膜炎およびアテローム性硬化症；かゆみ／そう痒症、乾癬；脱毛症（毛髪の喪失）；肥満；脂質障害；癌；高血圧；脊髄損傷；過敏性腸症候群；過活動膀胱；または腎障害からなる群より選択される、薬学的組成物。

【請求項 1 5】

請求項 1 ~ 1 2 のいずれかに記載の化合物、その薬学的に許容される塩、該化合物もしくは該塩の同位体改変体、該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の立体異性体、または該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の互変異性体を形成するために十分な条件下で、式 A のアミンおよび式 B の酸：

【化 7 0】



を接触させる工程を包含し；ここで、CY、W、X、Y、W'、X'、Y'、m、n、R³、R⁴、R⁵、R⁷、およびR^{8f}は請求項 1 と同様である、請求項 1 ~ 1 2 のいずれかに記載の化合物、その薬学的に許容される塩、該化合物もしくは該塩の同位体改変体、該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の立体異性体、または該化合物、該塩もしくは該同位体改変体の互変異性体を調製するための方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 3 5

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 3 5】

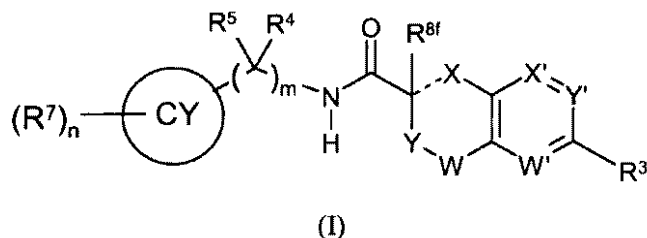
他の目的および利点は、詳細な説明の保証を考慮することから、当業者には明らかになる。

例えば、本発明は以下を提供する：

(項目 1)

式：

【化 6 3】



の化合物またはその薬学的に許容される塩、ならびにその同位体改変体、その立体異性体および互変異性体であって、ここで：

CYはビシクロヘテロアリールであり；

WはO、 $CR^{8a}R^{8b}$ 、または NR^{8c} を表し；

XはN、O、 CR^{8a} 、 $CR^{8a}R^{8b}$ 、または NR^{8c} を表し；

Yは $CR^{8d}R^{8e}$ を表し；

W'、X'、およびY'の3つすべてが同時にNになることはあり得ないという条件で、W'、X'、およびY'は、各々独立して、 CR^8 またはNを表し；

R^3 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、置換もしくは非置換($C_1 - C_6$)アルキル、置換もしくは非置換($C_1 - C_6$)アルコキシ、または置換もしくは非置換3～8員シクロアルキルを表し；

R^4 および R^5 は、各々独立して、水素または置換もしくは非置換($C_1 - C_6$)アルキルを表し；mは0または1であり；

各 R^7 は、H、ハロゲン、ヒドロキシ、($C_1 - C_6$)アシル、シアノ、置換もしくは非置換($C_1 - C_6$)アルキル、または置換もしくは非置換($C_1 - C_6$)アルコキシであり；または R^7 は、($C_1 - C_6$)アルキル、ハロ($C_1 - C_6$)アルキル、ヒドロキシ($C_1 - C_6$)アルキル、($C_1 - C_6$)アルコキシ、ヒドロキシ($C_1 - C_6$)アルコキシ、ハロ($C_1 - C_6$)アルコキシであり；nは1、2、3、4または5であり；

各 R^8 は、独立して、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、置換もしくは非置換($C_1 - C_6$)アルキル、置換もしくは非置換($C_1 - C_6$)アルコキシ、または置換もしくは非置換3～8員シクロアルキルを表し；

R^{8a} 、 R^{8b} 、 R^{8d} 、 R^{8e} および R^{8f} の各々は、独立して、水素、ハロ、ヒドロキシ、置換もしくは非置換($C_1 - C_6$)アルキル、または置換もしくは非置換3～8員シクロアルキルを表し；

R^{8c} は、水素、または置換もしくは非置換($C_1 - C_6$)アルキルを表し；ならびに点線の結合は単結合または二重結合を表し；

ただし：

i) 点線の結合が二重結合である場合、 R^{8f} は存在せず；

ii) XがNまたはOである場合； R^{8f} は水素、または置換もしくは非置換アルキルであり；

iii) XがOである場合；WはOまたは NR^{8c} であり；ならびに

iv) WがOであり；かつ点線の結合が単結合である場合；XはOまたは NR^{8c} である、

化合物またはその薬学的に許容される塩、ならびにその同位体改変体、その立体異性体および互変異性体。

(項目2)

R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^7 、 R^8 、 R^{8a} 、 R^{8b} 、 R^{8c} 、 R^{8d} 、 R^{8e} または R^{8f} が、($C_1 - C_6$)アルキル、ハロ($C_1 - C_6$)アルキル、ヒドロキシ($C_1 - C_6$)アルキル、または($C_1 - C_6$)アルコキシ($C_1 - C_6$)アルキルである、項目1に記載の化合物。

(項目3)

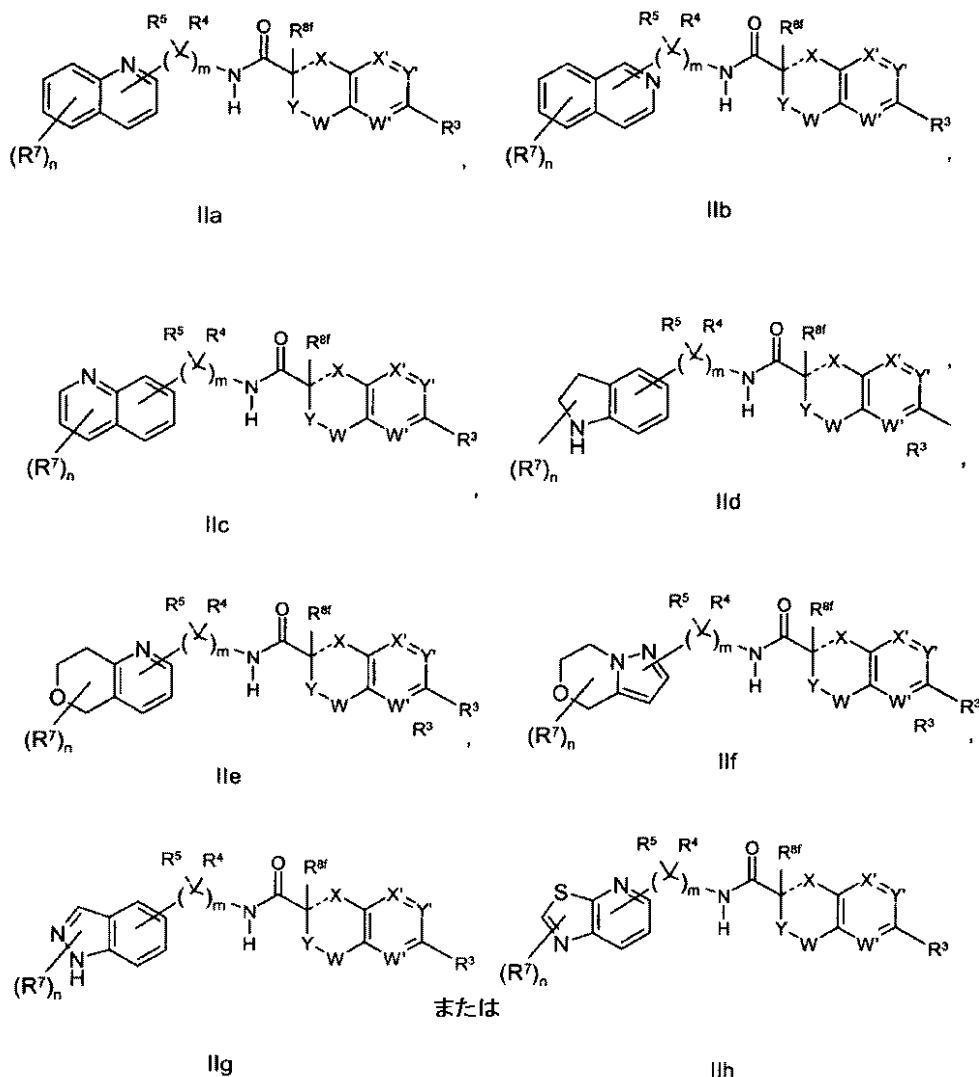
CYが、キノリニル、イソキノリニル、インドリル、ジヒドロインドリル、ベンゾフラ

ニル、ベンゾチオフエニル、ベンゾピラニル、ピラノピリジル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、ベンズチアゾリル、ベンズオキサゾリル、ピラゾロピリジン、ピラゾロオキサジニル、またはチアゾロピリジンである、項目 1 ~ 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 4)

式 I I a、I I b、I I c、I I d、I I e、I I f、I I g、または I I h：

【化 6 4】



に従う、項目 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物であって、

ここで、W、X、Y、W'、X'、Y'、 R^3 、 R^4 、 R^5 、および R^{8f} は項目 1 と同様であり、 R^7 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、 $(C_1 - C_6)$ アシル、非置換であるかもしくはハロ、ヒドロキシ、および $(C_1 - C_6)$ アルコキシから選択される 1 つ以上の基で置換された $(C_1 - C_6)$ アルキル、または非置換であるかもしくはハロ、ヒドロキシおよび $(C_1 - C_6)$ アルコキシから選択される 1 つ以上の基で置換された $(C_1 - C_6)$ アルコキシであり、m は 0 または 1 であり、n は 1、2、3、または 4 であり、ならびに点線の結合は単結合または二重結合を表す、化合物。

(項目 5)

W および X が、各々独立して、 $CR^{8a}R^{8b}$ を表し、ならびに点線の結合が単結合である、項目 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 6)

W が $CR^{8a}R^{8b}$ を表し、X が CR^{8a} を表し、および点線の結合が二重結合である、項目 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

WがOを表し；点線の結合が二重結合であり；およびXがC R^{8 a}である、項目1～4のいずれか1項に記載の化合物。

X が 0 を表し；および点線の結合が単結合である、項目 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

WがC R^{8 a} R^{8 b}を表す、項目1～4のいずれか1項に記載の化合物。

WがN R^{8c}を表す、項目1～4のいずれか1項に記載の化合物。

Wが〇を表す、項目1～4のいずれか1項に記載の化合物。

R⁵ が水素である、項目 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

R^{8f} が水素、または Me である、項目 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

式 III a、III b、III c、III d、または III e：

IIIa



IIIe

ここで、C^Y、W[']、X[']、Y[']、m、n、R³、R⁴、R^{8 a}、およびR^{8 c}は項目1と同様であり；およびR⁷は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、(C₁ - C₆)アシル、非置換であるかもしくはハロ、ヒドロキシ、および(C₁ - C₆)アルコキシから選択される1つ以上の基で置換された(C₁ - C₆)アルキル、または非置換であるかもしくはハロ、ヒドロキシおよび(C₁ - C₆)アルコキシから選択される1つ以上の基で置換された(C₁ - C₆)アルコキシである、化合物。

(項目 1 5)

(項目 1 6)

(項目 1 7)

(項目 1 8)

(項目 1 9)

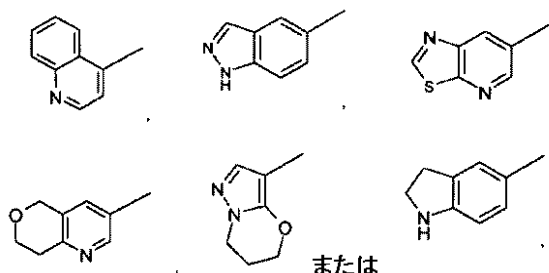
(項目 2 0)

【化 6 6】



ここで、 m 、 n 、 R^3 、 R^8 、 R^{8a} 、および R^{8c} は項目1と同様であり； R^7 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、 $(C_1 - C_6)$ アシル、非置換であるかもしくはハロ、ヒドロキシ、および $(C_1 - C_6)$ アルコキシから選択される1つ以上の基で置換された $(C_1 - C_6)$ アルキル、または非置換であるかもしくはハロ、ヒドロキシおよび $(C_1 - C_6)$ アルコキシから選択される1つ以上の基で置換された $(C_1 - C_6)$ アルコキシであり、 W' はCHまたはNであり；ならびにCYは

【化 6 7】



である、化合物。

(項目 2 1)

R^7 が水素である、項目 1 ~ 2 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 2)

R^7 が Me、 CH_2OH 、または $CH(OH)CH_2OH$ であり；かつ n が 1 である、項目 1 ~ 2 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 3)

W' が N である、項目 2 0 ~ 2 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 4)

W' が CH である、項目 2 0 ~ 2 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 5)

R^3 が、水素、ハロ、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、またはハロ $(C_1 - C_6)$ アルキルである、項目 1 ~ 2 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 6)

R^3 が、水素、F、Br、Cl、 OCF_3 、または CF_3 である、項目 1 ~ 2 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 7)

R^3 が、Me、Et、i-Pr、t-Bu、1-メチル-1-トリフルオロメチルエチル、または 1-メチル-1-ヒドロキシエチルである、項目 1 ~ 2 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 8)

R^8 が、水素、F、Br、Cl、 OCF_3 、または CF_3 である、項目 1 ~ 2 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 2 9)

R^8 が、Me、Et、i-Pr、t-Bu、1-メチル-1-トリフルオロメチルエチル、または 1-メチル-1-ヒドロキシエチルである、項目 1 ~ 2 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 3 0)

R^3 および R^8 の一方が、Cl、F、 CF_3 、 OCF_3 、1-メチル-1-ヒドロキシエチル、1-メチル-1-トリフルオロメチルエチルであり、かつ他方が水素である、項目 1 ~ 2 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 3 1)

R^3 および R^8 の一方が CF_3 であり；かつ他方が H である、項目 1 ~ 2 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 3 2)

R^3 が 1-メチル-1-ヒドロキシエチルであり、かつ R^8 が H である、項目 1 ~ 2 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 3 3)

R^3 が 1-メチル-1-トリフルオロメチルエチルであり、かつ R^8 が H である、項目 1 ~ 2 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 3 4)

R^{8a} が水素である、項目 1 ~ 3 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 3 5)

R^{8a} が Me である、項目 1 ~ 3 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 3 6)

R^{8c} が Me である、項目 1 ~ 3 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 3 7)

m が 0 である、項目 1 ~ 3 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 3 8)

m が 1 である、項目 1 ~ 3 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

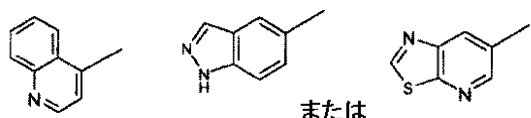
(項目 3 9)

m が 1 であり；かつ R^4 が水素または Me である、項目 1 ~ 3 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 4 0)

C Y が

【化 6 8】

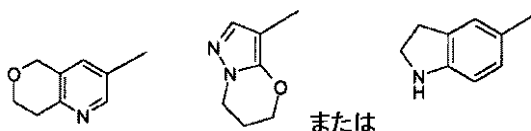


である、項目 2 0 ~ 3 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 4 1)

C Y が

【化 6 9】



である、項目 2 0 ~ 3 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 4 2)

点線の結合が単結合である、項目 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 4 3)

点線の結合が二重結合である、項目 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 4 4)

以下：

6 - tert - ブチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシン - 2 - カルボン酸 (キノリン - 4 - イルメチル) - アミド；

6 - クロロ - 2 H - クロメン - 3 - カルボン酸 (キノリン - 4 - イルメチル) - アミド；

6 - ブロモ - 2 H - クロメン - 3 - カルボン酸 (キノリン - 4 - イルメチル) - アミド；

6 - トリフルオロメトキシ - 2 H - クロメン - 3 - カルボン酸 (キノリン - 4 - イルメチル) - アミド；

6 - クロロ - 2 H - クロメン - 3 - カルボン酸 [1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド；

(S) - 6 - tert - ブチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシン - 2 - カルボン酸 [1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド；

(R) - 6 - tert - ブチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシン - 2 - カルボン酸 [1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド；

7 - tert - ブチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシン - 2 - カルボ

ン酸 (2 - ヒドロキシメチル - チアゾロ [5 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) - アミド ;
 4 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ベンゾ [1 , 4] オ
 キサジン - 2 - カルボン酸 [1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド
 ;

2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テ
 トラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 [1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチ
 ル] - アミド ;

(R) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7
 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 [(R) - 1 - (1 H - インダゾール -
 5 - イル) - エチル] - アミド ;

(S) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7
 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 [(R) - 1 - (1 H - インダゾール -
 5 - イル) - エチル] - アミド ;

(R) - 6 - トリフルオロメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシシ -
 2 - カルボン酸 [1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド ;

(S) - 6 - トリフルオロメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシシ -
 2 - カルボン酸 [1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド ;

(R) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7
 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 (2 - ヒドロキシメチル - チアゾロ [5
 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) - アミド ;

(R) - 6 - トリフルオロメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシシ -
 2 - カルボン酸 (2 - ヒドロキシメチル - チアゾロ [5 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル)
 - アミド ;

(R) - 6 - トリフルオロメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシシ -
 2 - カルボン酸 (7 , 8 - ジヒドロ - 5 H - ピラノ [4 , 3 - b] ピリジン - 3 - イル)
 - アミド ;

(R) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7
 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 (7 , 8 - ジヒドロ - 5 H - ピラノ [4
 , 3 - b] ピリジン - 3 - イル) - アミド ;

(S) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7
 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 (7 , 8 - ジヒドロ - 5 H - ピラノ [4
 , 3 - b] ピリジン - 3 - イル) - アミド ;

(R) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7
 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 [(R) - 1 - (6 , 7 - ジヒドロ - 5
 H - ピラゾロ [5 , 1 - b] [1 , 3] オキサジン - 3 - イル) - エチル] - アミド ;

(R) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7
 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 キノリン - 3 - イルアミド ;

(S) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7
 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 [(R) - 1 - (6 , 7 - ジヒドロ - 5
 H - ピラゾロ [5 , 1 - b] [1 , 3] オキサジン - 3 - イル) - エチル] - アミド ;

(R) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6 , 7
 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 (1 - アセチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1
 H - インドール - 6 - イル) - アミド ;

6 - メチル - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - 5 , 6
 , 7 , 8 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - カルボン酸 (2 - ヒドロキシメチル - チアゾロ
 [5 , 4 - b] ピリジン - 6 - イル) - アミド ;

(S) - 6 - トリフルオロメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシシ -
 2 - カルボン酸 [(R) - 1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド ;

および

(R) - 6 - トリフルオロメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシシ -

2 - カルボン酸 [(R) - 1 - (1 H - インダゾール - 5 - イル) - エチル] - アミド
またはその薬学的に許容される塩、ならびにその同位体改変体、その立体異性体および互
変異性体から選択される、項目 1 に記載の化合物。

(項目 4 5)

薬学的に許容されるキャリアおよび薬学的有効量の項目 1 ~ 4 4 のいずれかに記載の化
合物を含む薬学的組成物。

(項目 4 6)

前記キャリアが非経口キャリア、経口キャリア、または局所的キャリアである、項目 4
5 に記載の薬学的組成物。

(項目 4 7)

治療有効量の項目 1 ~ 4 4 のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される
塩、または項目 4 5 もしくは 4 6 のいずれかに記載の薬学的組成物を、その必要がある患
者に投与する工程を包含する、疾患または状態を治療するための方法。

(項目 4 8)

前記疾患または状態が疼痛の状態である、項目 4 7 に記載の方法。

(項目 4 9)

前記疾患または状態が自己免疫疾患である、項目 4 7 に記載の方法。

(項目 5 0)

前記疾患または状態が炎症性の疾患または状態である、項目 4 7 に記載の方法。

(項目 5 1)

前記疾患または状態が神経学的または神経変性の疾患または状態である、項目 4 7 に記
載の方法。

(項目 5 2)

治療的に許容される量の項目 1 ~ 4 4 のいずれかに記載の化合物、または項目 4 5 もし
くは 4 6 のいずれかに記載の薬学的組成物を、その必要がある患者に投与する工程を包含
する、疾患または状態を治療するための方法であって、該疾患が：急性、炎症性、および
神経障害性の疼痛を含む疼痛；慢性の疼痛；歯痛；片頭痛、群発性頭痛、および緊張性頭
痛を含む頭痛；パーキンソン病；アルツハイマー病；多発性硬化症；神経炎症によって媒
介されるかまたは神経炎症を生じる疾患および障害、外傷性脳傷害、脳卒中、または脳炎
；うつ病、躁病、双極性疾患、不安、統合失調症、摂食障害、睡眠障害、および認知障害
を含む、中枢媒介性 - 神経精神性の疾患および障害；てんかんおよびてんかん発作障害；
前立腺、膀胱、および腸の機能不全、尿失禁、排尿困難、直腸の過敏症、大便失禁、良性
前立腺肥大症、および炎症性腸疾患；アレルギー性鼻炎、喘息、および反応性気道疾患な
らびに慢性閉塞性肺疾患を含む、呼吸器および気道の疾患および障害；関節炎、関節リウ
マチ、および変形性関節症を含む、炎症によって媒介されるかまたは炎症を生じる疾患お
よび障害；心筋梗塞；自己免疫疾患および自己免疫障害；ブドウ膜炎およびアテローム性
硬化症；かゆみ／そう痒症、乾癬；脱毛症（毛髪の喪失）；肥満；脂質障害；癌；高血圧
；脊髄損傷；過敏性腸症候群；過活動膀胱；または腎障害、である、方法。

(項目 5 3)

前記疾患または状態が尿失禁である、項目 5 2 に記載の方法。

(項目 5 4)

前記疾患または状態が慢性閉塞性肺疾患である、項目 5 2 に記載の方法。

(項目 5 5)

前記疾患または状態が過敏性腸症候群である、項目 5 2 に記載の方法。

(項目 5 6)

前記疾患または状態が過活動膀胱である、項目 5 2 に記載の方法。

(項目 5 7)

前記疾患または状態が疼痛である、項目 5 2 に記載の方法。

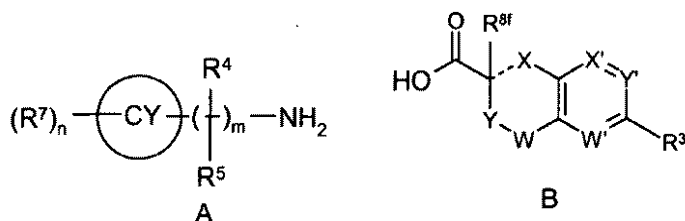
(項目 5 8)

前記疾患または状態が神経障害性の疼痛である、項目 5 2 に記載の方法。

(項目59)

項目1～44のいずれかに記載の化合物を形成するために十分な条件下で、式Aのアミンおよび式Bの酸：

【化70】



を接触させる工程を包含し；ここで、CY、W、X、Y、W'、X'、Y'、m、n、R³、R⁴、R⁵、R⁷、およびR^{8f}は項目1と同様である、項目1～44のいずれかに記載の化合物を調製するための方法。

(項目60)

カプサイシンへの曝露の症状、熱への曝露に起因する火傷または刺激の症状、光への曝露に起因する火傷または刺激の症状、催涙ガスへの曝露に起因する火傷、気管支収縮または刺激の症状、および酸への曝露に起因する火傷または曝露刺激の症状、からなる群より選択される少なくとも1つの症状に罹患している哺乳動物を治療する方法であって、有効な疾患治療量または状態治療量の、項目1～44のいずれかに記載の化合物または項目45もしくは46のいずれかの薬学的組成物を該哺乳動物に投与する工程を包含する、方法。

(項目61)

前記疼痛が、乳房切除後疼痛症候群、断端痛、幻肢痛、口腔神経障害性疼痛、シャルコー疼痛、歯痛、毒ヘビの咬傷、クモの咬傷、昆虫の刺傷、ヘルペス後神経痛、糖尿病性神経障害、反射性交感神経性ジストロフィ、三叉神経痛、変形性関節症、関節リウマチ、線維筋痛、ギラン・バレー症候群、知覚異常性大腿神経痛、口内焼灼感症候群、両側性末梢神経障害、カウザルギー、坐骨神経炎、末梢神経炎、多発性神経炎、分節性神経炎、ゴンボー神経炎、ニューロン炎、頸肩腕神経痛、頭部神経痛(cranial neuralgia)、膝神経痛(egniculate neuralgia)、舌咽神経痛、片頭痛性神経痛(migranous neuralgia)、特発性神経痛、肋間神経痛、乳房神経痛、顎関節神経痛、モートン神経痛、鼻毛様体神経痛、後頭神経痛、紅神経痛(red neuralgia)、スルダール神経痛、蝶口蓋神経痛(splenopalatine neuralgia)、眼窩上神経痛、ビディアン神経痛(vidian neuralgia)、副鼻腔炎頭痛(sinus headache)、緊張性頭痛、陣痛(labor)、分娩、腸内ガス、月経、癌、および外傷からなる群より選択される状態と関連する、項目57に記載の方法。

(項目62)

薬剤としての使用のための項目1～44のいずれかに記載される化合物。

(項目63)

項目47～58および60～61のいずれかに示される疾患または状態の治療における使用のための項目1～44のいずれかに記載される化合物。

(項目64)

項目47～58および60～61のいずれかに示される疾患または状態の治療のための医薬の調製のための項目1～44のいずれかに記載される化合物の使用。

(項目65)

項目47～58および60～61のいずれかに示される疾患または状態の治療のための、項目1～44のいずれかに記載される化合物または項目45～46のいずれかに記載される薬学的組成物の使用。

(項目66)

前記疾患が、急性、炎症性、および神経障害性の疼痛を含む疼痛；慢性の疼痛；歯痛；片頭痛、群発性頭痛、および緊張性頭痛を含む頭痛；パーキンソン病；アルツハイマー病；多発性硬化症；神経炎症によって媒介されるかまたは神経炎症を生じる疾患および障害、外傷性脳傷害、脳卒中、または脳炎；うつ病、躁病、双極性疾患、不安、統合失調症、摂食障害、睡眠障害、および認知障害を含む、中枢媒介性 - 神経精神性の疾患および障害；てんかんおよびてんかん発作障害；前立腺、膀胱、および腸の機能不全、尿失禁、排尿困難、直腸の過敏症、大便失禁、良性前立腺肥大症、および炎症性腸疾患；アレルギー性鼻炎、喘息、および反応性気道疾患ならびに慢性閉塞性肺疾患を含む、呼吸器および気道の疾患および障害；関節炎、関節リウマチ、および変形性関節症を含む、炎症によって媒介されるかまたは炎症を生じる疾患および障害；心筋梗塞；自己免疫疾患および自己免疫障害；ブドウ膜炎およびアテローム性硬化症；かゆみ／そう痒症、乾癬；脱毛症（毛髪の喪失）；肥満；脂質障害；癌；高血圧；脊髄損傷；過敏性腸症候群；過活動膀胱；または腎障害である、項目 6 2 もしくは 6 3 のいずれかに記載される化合物、または項目 6 4 もしくは 6 5 のいずれかに記載される使用。

(項目 6 7)

前記状態が：カプサイシンへの曝露の症状、熱への曝露に起因する火傷または刺激の症状、光への曝露に起因する火傷または刺激の症状、催涙ガスへの曝露に起因する火傷、気管支収縮または刺激の症状、および酸への曝露に起因する火傷または曝露刺激の症状からなる群より選択される症状である、項目 6 2 もしくは 6 3 のいずれかに記載される化合物、または項目 6 4 もしくは 6 5 のいずれかに記載される使用。

(項目 6 8)

前記疼痛が：乳房切除後疼痛症候群、断端痛、幻肢痛、口腔神経障害性疼痛、シャルコー疼痛、歯痛、毒ヘビの咬傷、クモの咬傷、昆虫の刺傷、ヘルペス後神経痛、糖尿病性神経障害、反射性交感神経性ジストロフィ、三叉神経痛、変形性関節症、関節リウマチ、線維筋痛、ギラン - バレー症候群、知覚異常性大腿神経痛、口内焼灼感症候群、両側性末梢神経障害、カウザルギー、坐骨神経炎、末梢神経炎、多発性神経炎、分節性神経炎、ゴンボー神経炎、ニューロン炎、頸肩腕神経痛、頭部神経痛、膝神経痛、舌咽神経痛、片頭痛性神経痛、特発性神経痛、肋間神経痛、乳房神経痛、顎関節神経痛、モートン神経痛、鼻毛様体神経痛、後頭神経痛、紅神経痛、スルダール神経痛、蝶口蓋神経痛、眼窩上神経痛、ビディアン神経痛、副鼻腔炎頭痛、緊張性頭痛、分娩、出産、腸内ガス、月経、癌、および外傷、からなる群より選択される状態に関連する、項目 6 6 において記載される化合物および／または使用。