

【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4年1月11日(2022.1.11)

【公表番号】特表2021-505647(P2021-505647A)

【公表日】令和3年2月18日(2021.2.18)

【年通号数】公開・登録公報2021-008

【出願番号】特願2020-532696(P2020-532696)

【国際特許分類】

A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/282	(2006.01)
A 6 1 K	33/243	(2019.01)
A 6 1 K	31/427	(2006.01)
A 6 1 K	31/337	(2006.01)
A 6 1 K	31/475	(2006.01)
A 6 1 K	31/454	(2006.01)
A 6 1 K	38/08	(2019.01)
A 6 1 K	31/69	(2006.01)
A 6 1 K	31/357	(2006.01)
A 6 1 K	31/18	(2006.01)
A 6 1 K	31/255	(2006.01)
A 6 1 K	31/4406	(2006.01)
A 6 1 K	31/381	(2006.01)
A 6 1 K	31/341	(2006.01)
A 6 1 K	31/40	(2006.01)
A 6 1 K	31/165	(2006.01)
A 6 1 K	31/166	(2006.01)
A 6 1 K	31/426	(2006.01)
A 6 1 K	31/4453	(2006.01)
A 6 1 K	31/422	(2006.01)
A 6 1 K	31/433	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 P	25/04	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 K	31/282	
A 6 1 K	33/243	
A 6 1 K	31/427	
A 6 1 K	31/337	
A 6 1 K	31/475	
A 6 1 K	31/454	
A 6 1 K	38/08	
A 6 1 K	31/69	
A 6 1 K	31/357	
A 6 1 K	31/18	
A 6 1 K	31/255	
A 6 1 K	31/4406	

A 6 1 K 31/381
 A 6 1 K 31/341
 A 6 1 K 31/40
 A 6 1 K 31/165
 A 6 1 K 31/166
 A 6 1 K 31/426
 A 6 1 K 31/4453
 A 6 1 K 31/422
 A 6 1 K 31/433

【手続補正書】

【提出日】令和3年11月30日(2021.11.30)

【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】

C 5 a R 阻害薬を含む、化学療法誘発性医原性疼痛の予防及び／又は治療のための医薬組成物。

【請求項2】

化学療法誘発性医原性疼痛に関連する異痛の予防及び／又は治療のために用いられる、請求項1に記載の医薬組成物。

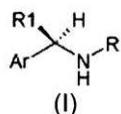
【請求項3】

C 5 a R 阻害薬が、(R) - アリールアルキルアミノ誘導体、(R) - 4 - (ヘテロアリール)フェニルエチル化合物及びそれらの薬学的に許容可能な塩から選ばれる、請求項1又は2に記載の医薬組成物。

【請求項4】

前記(R) - アリールアルキルアミノ誘導体が、式(I)：

【化1】



の化合物又は薬学的に許容可能な塩から選ばれ、

式中、

Rは、

- 2 - チアゾリル又は2 - オキサゾリル(非置換であるか又はメチル、tert - プチルもしくはトリフルオロメチル基から選ばれる基によって置換されている)；

- C(Ra) = N - W(ここで、Wは、直鎖又は分枝C₁ - C₄アルキルである)、

- CORa、SORa、SO₂Ra、PORa、PO₂Ra

から選ばれ、

ここで、

Raは、

- C₁ - C₅ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₂ - C₅ - アルケニル、非置換又は置換フェニル(ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、ハロ - C₁ - C₄ - アルコキシ、ヒドロキシ、C₁ - C₄ - アシルオキシ、フェノキシ、シアノ、ニトロ、アミノから選ばれる基で置換されている)；

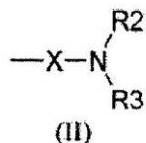
- ピリジン、ピリミジン、ピロール、チオフェン、フラン、インドール、チアゾール

、オキサゾールから選ばれるヘテロアリール基（該ヘテロアリールは、非置換であるか又はハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、ハロ - $C_1 - C_4$ - アルコキシ、ヒドロキシ、 $C_1 - C_4$ - アシルオキシ、フェノキシ、シアノ、ニトロ、アミノから選ばれる基で置換されている）；

- 直鎖又は分枝 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_1 - C_6$ - フェニルアルキルからなる 又は カルボキシアルキル残基(任意にさらにカルボキシ($COOH$)基で置換されていてもよい)；

- 式 || :

【化 2】



の - アミノアルキルアミノ基
から選ばれ；

上記式(11)中、

X は、

- 直鎖又は分枝 C₁ - C₆ アルキレン、C₄ - C₆ アルケニレン、C₄ - C₆ アルキニレン（任意に、CO₂ R₄ 基又はCONHR₅ 基によって置換されていてもよく、ここで、R₄ は、水素又は直鎖もしくは分枝 C₁ - C₆ アルキル基又は直鎖もしくは分枝 C₂ - C₆ アルケニル基を表し、R₅ は、水素、直鎖又は分枝 C₂ - C₆ アルキル又はOR₄ 基を表し、R₄ は上記定義の通りである）；

- $(CH_2)_m - B - (CH_2)_n$ 基 (任意に、上記定義の CO_2R 4 又は $CONH$ R 5 基によって置換されていてもよく、式中、B は、酸素、又は硫黄原子、又は窒素原子で、任意に $C_1 - C_4$ アルキル基で置換されていてもよく、m はゼロ又は 2 ~ 3 の整数であり、n は 2 ~ 3 の整数であるか、又は、B は、CO、SO 又は CONH 基であり、m は 1 ~ 3 の整数であり、n は 2 ~ 3 の整数である)

を表すか

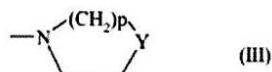
- 又は、Xは、それが結合している窒素原子及びR₂基と一緒にになって、窒素含有3~7員のヘテロ環式、单環式又は多環式環を形成し、R₃は、水素、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄アシル、非置換又は置換フェニル(ハロゲン、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、ヒドロキシ、C₁-C₄-アシルオキシ、フェノキシ、シアノ、ニトロ、アミノから選ばれる基で置換されている)を表し；

B 2 及び B 3 は、独立に

水素、直鎖又は分枝 $C_1 - C_6$ アルキル（任意に、酸素又は硫黄原子が介在していてよい）、 $C_3 - C_7$ シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ アルケニル、 $C_3 - C_6 -$ アルキニル、アリール- $C_1 - C_3 -$ アルキル、ヒドロキシ- $C_2 - C_3 -$ アルキル基であるか；

又は、R₂及びR₃は、それらが結合しているN原子と一緒にになって、式(111)：

【化 3】



の3~7員窒素へテロ環式環を形成し、

上記式(111)中、

Y は、

- 単結合、 CH_2 、O、S、又はN-R6基{ここで、R6は、水素、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 アシル、非置換又は置換フェニル(ハロゲン、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ、ヒドロキシ、 C_1 - C_4 -アシルオキシ、フェノキシ、シアノ、ニトロ、アミノから選ばれる基で置換されている)を表す}、

そして p は、0 ~ 3 の整数を表し；

- 式 SO_2R_7 の残基（ここで、R₇ は、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、アリール及びヘテロアリールである）を表し；

R₁ は、直鎖又は分枝 C₁ - C₅ アルキル、C₃ - C₅ シクロアルキルであり；A_r は、フェニル基（非置換であるか、又は、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、ヒドロキシ、C₁ - C₄ - アシリルオキシ、フェノキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、C₁ - C₄ - アシリルアミノ、ハロ - C₁ - C₃ - アルキル、ハロ - C₁ - C₃ - アルコキシ、ベンゾイル、ヘテロアリールカルボニル、ヘテロアリール、直鎖又は分枝 C₁ - C₈ - アルカンスルホネート、直鎖又は分枝 C₁ - C₈ - アルカンスルホニアミド、直鎖又は分枝 C₁ - C₈ アルキルスルホニルメチルから独立に選ばれる一つ又は複数の基によって置換されている）であるか；

又は、A_r は、ピリジン、ピロール、チオフェン、フラン、インドールから選ばれるヘテロアリール環である、請求項 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

R が、

- 2 - チアゾリル又は 2 - オキサゾリル（非置換であるか又はメチル、tert - ブチルもしくはトリフルオロメチル基から選ばれる基によって置換されている）；
- C (R_a) = N - W（ここで、W は、直鎖又は分枝 C₁ - C₄ アルキルである）、
- COR_a、SOR_a 又は SO₂R_a

から選ばれ、

ここで、R_a は上記定義の通りであり；

A_r が、

3' - ベンゾイルフェニル、3' - (4 - クロロ - ベンゾイル) - フェニル、3' - (4 - メチル - ベンゾイル) - フェニル、3' - アセチル - フェニル、3' - プロピオニル - フェニル、3' - イソブタノイル - フェニル、4' - イソブチル - フェニル、4' - トリフルオロメタンスルホニルオキシ - フェニル、4' - ベンゼンスルホニルオキシ - フェニル、4' - トリフルオロメタンスルホニルアミノ - フェニル、4' - ベンゼンスルホニルアミノ - フェニル、4' - ベンゼンスルホニルメチル - フェニル、4' - アセトキシフェニル、4' - プロピオニルオキシ - フェニル、4' - ベンゾイルオキシ - フェニル、4' - アセチルアミノ - フェニル、4' - プロピオニルアミノ - フェニル、4' - ベンゾイルアミノ - フェニル、3' - (フラン - 2 - カルボニル) - フェニル、3' - (ベンゾフラン - 2 - カルボニル) - フェニル、3' - (チオフェン - 2 - カルボニル) - フェニル、3' - (ピリジン - 2 - カルボニル) - フェニル、3' - (チアゾール - 2 - カルボニル) - フェニル、3' - (オキサゾール - 2 - カルボニル) - フェニル、3' - (2 - フリル) - フェニル、3' - (2 - オキサゾリル) - フェニル、3' - (3 - イソオキサゾリル) - フェニル、3' - (2 - ベンゾオキサゾリル) - フェニル、3' - (3 - ベンゾイソオキサゾリル) - フェニル、3' - (2 - チアゾリル) - フェニル、3' - (2 - ピリジル) - フェニル、3' - (2 - チオフェニル) - フェニルから選ばれるか；

又は、A_r が、ピリジン、ピロール、チオフェン、フラン又はインドールから選ばれるヘテロアリール環である、請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

R が、

- 2 - チアゾリル（非置換であるか又はメチルもしくはトリフルオロメチル基から選ばれる基によって置換されている）、
- COR_a、SO₂R_a、SOR_a

であり、

ここで、

R_a は、

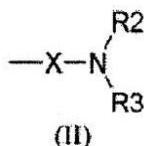
- C₁ - C₅ - アルキル、C₃ - C₅ - シクロアルキル；

- フェニル、2-ピリジル、2-チアゾリル、2-フリル、2-ピロリル、2-チオフェニル、2-インドリル基；

- 直鎖又は分枝C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - フェニルアルキル基からなるカルボキシアルキル基；

- 式II：

【化4】



の - アルキルアミノ基

から選ばれ；

上記式(II)中、

Xは、

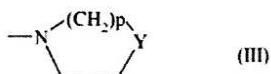
直鎖又は分枝C₁ - C₆ アルキレン、C₄ - C₆ アルケニレン、C₄ - C₆ アルキニレンを表すか；

又は、Xは、それが結合している窒素原子及びR2基と一緒にになって、窒素含有3~7員のヘテロ環式単環式環を形成し、R3は、水素又はC₁ - C₄ アルキルを表し；

R2及びR3は、独立に、水素、直鎖又は分枝C₁ - C₆ アルキル、C₃ - C₇ シクロアルキル、C₃ - C₆ アルケニル、C₃ - C₆ - アルキニルであるか；

又は、R2及びR3は、それらが結合しているN原子と一緒にになって、式(III)：

【化5】



の4~6員窒素含有ヘテロ環式環を形成し、

上記式(III)中、

Yは、CH₂、O、S、又はN - R6基(ここで、R6は、水素、C₁ - C₄ アルキル、C₁ - C₄ アシルを表す)を表し、そしてpは、0~2の整数を表し；

R1がメチルであり；

Arが、

3' - ベンゾイルフェニル、3' - (4-クロロ-ベンゾイル) - フェニル、3' - (4-メチル-ベンゾイル) - フェニル、3' - アセチル - フェニル、3' - プロピオニル - フェニル、3' - イソブタノイル - フェニル、4' - イソブチル - フェニル、4' - トリフルオロメタンスルホニルオキシ - フェニル、4' - ベンゼンスルホニルオキシ - フェニル、4' - トリフルオロメタンスルホニルアミノ - フェニル、4' - ベンゼンスルホニルアミノ - フェニル、4' - ベンゼンスルホニルメチル - フェニル、4' - アセトキシフェニル、4' - プロピオニルオキシ - フェニル、4' - ベンゾイルオキシ - フェニル、4' - アセチルアミノ - フェニル、4' - プロピオニルアミノ - フェニル、4' - ベンゾイルアミノ - フェニル；3' - (フラン - 2 - カルボニル) - フェニル；3' - (ベンゾフラン - 2 - カルボニル) - フェニル；3' - (チオフェン - 2 - カルボニル) - フェニル；3' - (ピリジン - 2 - カルボニル) - フェニル、3' - (チアゾール - 2 - カルボニル) - フェニル、3' - (オキサゾール - 2 - カルボニル) - フェニル；3' - (2 - フリル) - フェニル、3' - (2 - オキサゾリル) - フェニル、3' - (3 - イソオキサゾリル) - フェニル、3' - (2 - ベンゾオキサゾリル) - フェニル、3' - (3 - ベンゾイソオキサゾリル) - フェニル、3' - (2 - チアゾリル) - フェニル、3' - (2 - ピリジル) - フェニル、3' - (2 - チオフェニル) - フェニルから選ばれる、請求項4に記載の医薬組成物。

【請求項7】

R が、

- 2 - チアゾリル (非置換であるか又はメチルもしくはトリフルオロメチル基から選ばれる基によって置換されている) ;
 - COR_a 、 SO_2R_a

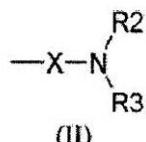
であり、

ここで、

- R a は、

 - $C_1 - C_5$ - アルキル、 $C_3 - C_5$ - シクロアルキル；
 - フェニル、2 - ピリジル、2 - フリル、2 - チオフェニル基；
 - 式 || :

【化 6】



の墓から選ばれ；

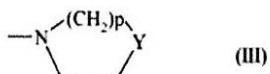
上記式(11)中、

X は、

直鎖又は分枝 $C_1 - C_6$ アルキレンを表す；

R₂ 及び R₃ は、それらが結合している N 原子と一緒にになって、式 (111) :

【化7】



の4~6員窒素含有ヘテロ環式環を形成し、

上記式(111)中、

Y は CH_2 を表し、そして p は 0 ~ 2 の整数を表す；

R 1 がメチルであり；

Arが、

3' - ベンゾイルフェニル、3' - (4' - クロロ - ベンゾイル) - フェニル、3' - (4' - メチル - ベンゾイル) - フェニル、4' - トリフルオロメタンスルホニルオキシ - フェニル、4' - ベンゼンスルホニルオキシ - フェニル、3' - (フラン - 2 - カルボニル) - フェニル

から選ばれる、請求項4に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

C 5 a R 阻害薬が、

4 - { (1 R) - 1 - [(フェニルスルホニル) アミノ] エチル } フェニルトリフルオロメタンスルホネート

N - [(1 R) - 1 - (3 - ベンゾイルフェニル) エチル] ベンゼンスルホンアミド

4 - { (1 R) - 1 - [(ピリジン - 3 - イルスルホニル) アミノ] エチル } フェニルトリフルオロメタンスルホネート

N - [(1 R) - 1 - (3 - ベンゾイルフェニル) エチル] メタンスルホンアミド

N - { (1 R) - 1 - [3 - (2 - フロイル) フェニル] エチル } チオフェン - 2 - スルホニアミド

N - { (1 R) - 1 - [3 - (2 - フロイル) フェニル] エチル } メタンスルホンアミド
 4 - { (1 R) - 1 - [(チエン - 2 - イルスルホニル) アミノ] エチル } フェニルトリ
 フロオロメタンスルホニ酸

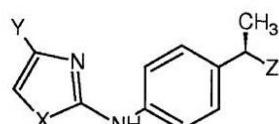
フルオロスタンスルホネート
N - [(1 R) - 1 - (3 - ベンゾイルフェニル) エチル] チオフェン - 2 - スルホニアニド

N - [(1 R) - 1 - (3 - ベンゾイルフェニル) エチル] - 3 - ピロリジン - 1 - イル
 プロパン - 1 - スルホンアミド
 メチル 5 - ({ [(1 R) - 1 - (3 - ベンゾイルフェニル) エチル] アミノ } スルホ
 ニル) - 2 - フロエート
 5 - ({ [(1 R) - 1 - (3 - ベンゾイルフェニル) エチル] アミノ } スルホニル) -
 2 - フロ酸
 4 - { (1 R) - 2 - メチル - 1 - [(メチルスルホニル) アミノ] プロピル } フェニル
 トリフルオロメタンスルホネート
 N - ((1 R) - 1 - { 4 - [1 - メチル - 1 - (フェニルスルホニル) エチル] フェニ
 ル } エチル) メタンスルホンアミド
 4 - [(1 R) - 1 - (イソブチリルアミノ) エチル] フェニルトリフルオロメタンスル
 ホネート
 4 - { [(1 R) - 1 - (ピリジン - 3 - イルカルボニル) アミノ] エチル] } フェニル
 トリフルオロメタンスルホネート
 N - [(1 R) - 1 - (3 - ベンゾイルフェニル) エチル] ベンズアミド
 N - [(1 R) - 1 - (3 - ベンゾイルフェニル) エチル] - 2 - フラミド
 N - [(1 R) - 1 - (3 - ベンゾイルフェニル) エチル] シクロブantanカルボキサミド
 N - [(1 R) - 1 - (4 - トリフルオロメタンスルホニルオキシ) フェニルエチル] -
 4 - ピペリジン - 1 - イルブタノアミド
 4 - { (1 R) - 1 - [(4 - ピロリジン - 1 - イルブタノイル) アミノ] エチル] } フ
 ェニルトリフルオロメタンスルホネート
 3 - { (1 R) - 1 - [4 - (4 - トリフルオロメチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル
) アミノ] エチル } フェニル) (フェニル) メタノン及びそれらの薬学的に許容可能な塩
 から選ばれ、好ましくは、N - [(1 R) - 1 - (4 - トリフルオロメタンスルホニルオ
 キシ) フェニルエチル] - 4 - ピペリジン - 1 - イルブタノアミド及びその塩化物塩から
 選ばれる、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記 (R) - 4 - (ヘテロアリール) フェニルエチル化合物が、式 (II) :

【化 8】



の化合物又はその薬学的に許容可能な塩から選ばれ、

式中、

X は、

- S、O 及び N

から選ばれるヘテロ原子であり；

Y は、H 又は

- ハロゲン、直鎖又は分枝 C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₁ - C₄ - アルコキシ、ヒドロキシ、- COOH、C₁ - C₄ - アシルオキシ、フェノキシ、シアノ、ニトロ、- NH₂、C₁ - C₄ - アシルアミノ、ハロ - C₁ - C₃ - アルキル、ベ
 ンゾイル、直鎖又は分枝 C₁ - C₈ - アルカンスルホネート、直鎖又は分枝 C₁ - C₈ - アルカンスルホンアミド、直鎖又は分枝 C₁ - C₈ - アルキルスルホニルメチルからなる
 群から選ばれる残基であり；

Z は、

非置換テトラゾール及び

1 個のヒドロキシ基によって置換されている及び任意にさらに、ハロゲン、直鎖又は分枝
 C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₁ - C₄ - アルキルアミノ、C₁ -
 C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、C₁ - C₄ - アシルオキシ、シアノ、ニ

トロ、N H₂、C₁ - C₄ - アシルアミノ、ハロ - C₁ - C₃ - アルキル、ハロ - C₁ - C₃ - アルコキシ、直鎖又は分枝C₁ - C₈ - アルカンスルホネート及び直鎖又は分枝C₁ - C₈ - アルカンスルホニアミドからなる群から選ばれる一つ又は複数の基によって置換されていてもよいトリアゾール、ピラゾール、オキサゾール、チアゾール、イソオキサゾール、イソチアゾール、チアジアゾール及びオキサジアゾール

からなる群から選ばれるヘテロアリール環である、請求項3に記載の医薬組成物。

【請求項10】

Xが、

- S及びO

から選ばれるヘテロ原子であり；

Yが、H又は

- ハロゲン、直鎖又は分枝C₁ - C₄ - アルキル及びハロ - C₁ - C₃ - アルキルからなる群から選ばれる；好ましくは、トリフルオロメチル、塩素、メチル及びtert-ブチルからなる群から選ばれる残基であり；

Zが、

非置換テトラゾール及び

1個のヒドロキシ基によって置換されている及び任意にさらに、ハロゲン、直鎖又は分枝C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルキルチオ及びハロ - C₁ - C₃ - アルキルからなる群から選ばれる；好ましくは、メチル、トリフルオロメチル及び塩素からなる群から選ばれる一つ又は複数の基によって置換されていてもよいトリアゾール、ピラゾール、イソオキサゾール、イソチアゾール、チアジアゾール及びオキサジアゾール

からなる群から選ばれるヘテロアリール環である、請求項9に記載の医薬組成物。

【請求項11】

C5aR阻害薬が、

N - {4 - [(1R) - 1 - (1H - テトラゾール - 5 - イル)エチル]フェニル} - 4 - (トリフルオロメチル) - 1, 3 - チアゾール - 2 - アミン；
 4 - メチル - N - {4 - [(1R) - 1 - (1H - テトラゾール - 5 - イル)エチル]フェニル} - 1, 3 - チアゾール - 2 - アミン；
 4 - tert - ブチル - N - {4 - [(1R) - 1 - (1H - テトラゾール - 5 - イル)エチル]フェニル} - 1, 3 - チアゾール - 2 - アミン；
 N - {4 - [(1R) - 1 - (1H - テトラゾール - 5 - イル)エチル]フェニル} - 1, 3 - チアゾール - 2 - アミン；
 N - {4 - [(1R) - 1 - (1H - テトラゾール - 5 - イル)エチル]フェニル} - 4 - (トリフルオロメチル) - 1, 3 - オキサゾール - 2 - アミン；
 4 - メチル - N - {4 - [(1R) - 1 - (1H - テトラゾール - 5 - イル)エチル]フェニル} - 1, 3 - オキサゾール - 2 - アミン；
 5 - [(1R) - 1 - (4 - {[4 - (トリフルオロメチル) - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル]アミノ}フェニル)エチル] - 1H - ピラゾール - 1 - オール；
 4 - メチル - 5 - [(1R) - 1 - (4 - {[4 - (トリフルオロメチル) - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル]アミノ}フェニル)エチル] - 1H - ピラゾール - 1 - オール；
 5 - [(1R) - 1 - (4 - {[4 - (トリフルオロメチル) - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル]アミノ}フェニル)エチル] - 1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - オール；
 5 - [(1R) - 1 - (4 - {[4 - (トリフルオロメチル) - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル]アミノ}フェニル)エチル]イソオキサゾール - 3 - オール；
 4 - メチル - 5 - [(1R) - 1 - (4 - {[4 - (トリフルオロメチル) - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル]アミノ}フェニル)エチル]イソオキサゾール - 3 - オール；
 5 - [(1R) - 1 - (4 - {[4 - (トリフルオロメチル) - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル]アミノ}フェニル)エチル]イソチアゾール - 3 - オール；
 4 - [(1R) - 1 - (4 - {[4 - (トリフルオロメチル) - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル]アミノ}フェニル)エチル] - 1, 2, 5 - オキサジアゾール - 3 - オール；

4 - [(1 R) - 1 - (4 - { [4 - (トリフルオロメチル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] アミノ } フェニル) エチル] - 1 , 2 , 5 - チアジアゾール - 3 - オール ;
5 - [(1 R) - 1 - (4 - { [4 - (トリフルオロメチル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] アミノ } フェニル) エチル] - 1 H 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - オール 及びそれらの薬学的に許容可能な塩から選ばれ、好ましくは、1 - N - [4 - [(1 R) - 1 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) エチル] フェニル] - 4 - (トリフルオロメチル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - アミン及びそのナトリウム塩から選ばれる、請求項 9 又は 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2】

前記化学療法誘発性医原性疼痛が、白金系薬物、タキサン系、エポチロン類、植物アルカリイド系、サリドマイド、レナリドミド及びポマリドミド、カルフィルゾミブ、ボルテゾミブ及びエリブリン、好ましくはタキサン系及び白金系薬物から選ばれる化学療法薬によって誘発される、請求項 1 ~ 1 1 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3】

前記化学療法薬が、シスプラチニン、カルボプラチニン、オキサリプラチニン、パクリタキセル、カバジタキセル、ドセタキセル、イクサベピロン、ビンプラスチニン、ビンクリスチニン、ビノレルビン、エトポシド、サリドマイド、レナリドミド、ポマリドミド、カルフィルゾミブ、ボルテゾミブ及びエリブリン、好ましくはパクリタキセルから選ばれる、請求項 1 2 に記載の医薬組成物。