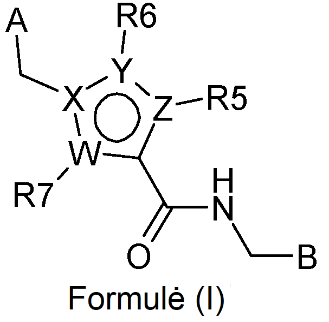
1. Farmacinė kompozicija, apimanti: (i) farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį, skiediklį arba pagalbinę medžiagą, ir (ii) junginį, kurio formulė (I), arba tautomerą, stereoizomerą (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir jų raceminius bei skaleminius mišinius) arba farmaciniu požiūriu priimtiną jo druską arba solvatą, kur junginys, kurio formulė (I), yra,



kur

B yra fenilas, pakeistas 1-4 pakaitais, pasirinktais iš alkilob, alkoksi, OH, halogeno, CN, heteroarilo, COOR8, NHCOR8, CONR8R9, OCF3 ir CF3;

arba B yra pasirinktas iš benzotiofenilo, benzofuranilo ir 5- arba 6-nario heterociklinio žiedo, kuriame yra vienas arba du heteroatomai, pasirinkti iš N, O ir S; kur minėtas 5- arba 6-naris heterociklinis žiedas gali būti aromatinis arba nearomatinis; ir kur minėtas benzotiofenilas, minėtas benzofuranilas arba minėtas 5- arba 6-naris heterociklinis žiedas yra pakeistas 1-3 pakaitais, pasirinktais iš alkilob, alkoksi, OH, okso, halogeno, CN, heteroarilo, COOR8, NHCOR8, CONR8R9, OCF3 ir CF3;

W yra C ir X, Y ir Z yra nepriklausomai pasirinkti iš C, N, O ir S taip, kad žiedas, kuriame yra W, X, Y ir Z, būtų penkių narių aromatinis heterociklas;

R5 ir R6 nepriklausomai nėra, arba jie yra nepriklausomai pasirinkti iš H, alkilo, cikloalkilo, -NR8R9, CN, -NR8COR9 ir CF3; kur mažiausiai vienas iš R5 ir R6 yra, ir jis nėra H;

R7 yra H;

A yra pasirinktas iš arilo ir heteroarilo; kur arilas yra pakeistas 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš alkilo, alkoksi, metilendioksi, etilendioksi, OH, halogeno, CN, heteroarilo, -(CH2)0-3-O-heteroarilo, arilob, -O-arilob, -(CH2)1-3-arilob, -(CH2)1-3-heteroarilo, -COOR10, -CONR10R11, -(CH2)0-3-NR10R11, OCF3 ir CF3; ir heteroarilas yra pakeistas 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš alkilo, alkoksi, OH, OCF3, halogeno, CN, arilo, -(CH2)1-3-arilo, -(CH2)0-3-NR10R11, heteroarilob, -COOR10, -CONR10R11 ir CF3;

R8 ir R9 yra nepriklausomai pasirinkti iš H ir alkilo;

alkilas yra linijinis sotusis angliavandenilis, turintis iki 10 anglies atomų (C1-C10) arba šakotasis sotusis angliavandenilis, turintis tarp 3 ir 10 anglies atomų (C3-C10); alkilas pasirinktinai gali būti pakeistas 1 arba 2 pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš (C1-C6)alkoksi, OH, CN, CF3, COOR10, CONR10R11, fluoro ir NR10R11;

alkilasb yra linijinis sotusis angliavandenilis, turintis iki 6 anglies atomų, arba šakotasis sotusis angliavandenilis, turintis tarp 3 ir 6 anglies atomų (C3-6); alkilb pasirinktinai gali būti pakeistas 1 arba 2 pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš (C1-C6)alkoksi, OH, CN, CF3, COOR10, CONR10R11 ir fluoro;

cikloalkilas yra monociklinis sotusis angliavandenilis, turintis tarp 3 ir 6 anglies atomų;

alkoksi yra linijinis per O prijungtas angliavandenilis, turintis tarp 1 ir 6 anglies atomų (C1-C6) arba šakotasis per O prijungtas angliavandenilis, turintis tarp 3 ir 6 anglies atomų (C3-C6); alkoksi pasirinktinai gali būti pakeistas 1 arba 2 pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš OH, CN, CF3, CONR10R11, fluoro ir NR10R11;

arilas yra fenilas, bifenilas arba naftilas; arilas gali būti pasirinktinai pakeistas 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš alkilo, alkoksi, metilendioksi, etilendioksi, OH, halogeno, CN, heteroarilo, -(CH2)0-3-O-heteroarilo, arilob, -O-arilob, -(CH2)1-3-arilob, -(CH2)1-3-heteroarilo, -COOR10, -CONR10R11, -(CH2)0-3-NR10R11, OCF3 ir CF3;

arilasb yra fenilas, bifenilas arba naftilas, kuris pasirinktinai gali būti pakeistas 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš alkilo, alkoksi, OH, halogeno, CN, -COOR10, -CONR10R11, CF3 ir NR10R11;

heteroarilas yra 5, 6, 9 arba 10 narių mono- arba biciklinis aromatinis žiedas, turintis, kur įmanoma, 1, 2, 3 arba 4 žiedo narius, nepriklausomai pasirinktus iš N, NR8, S ir O; heteroarilas gali būti pasirinktinai pakeistas 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš alkilo, alkoksi, OH, OCF3, halogeno, CN, arilo, -(CH2)1-3-arilo, -(CH2)0-3-NR10R11, heteroarilob, -COOR10, -CONR10R11 ir CF3;

heteroarilasb yra 5, 6, 9 arba 10 narių mono- arba biciklinis aromatinis žiedas, turintis, kur įmanoma, 1, 2 arba 3 žiedo narius, nepriklausomai pasirinktus iš N, NR8, S ir O; kur heteroarilasb gali būti pasirinktinai pakeistas 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš alkilo, alkoksi, OH, halogeno, CN, arilo, -(CH2)1-3-arilo, -COOR10, -CONR10R11, CF3 ir NR10R11;

R10 ir R11 yra nepriklausomai pasirinkti iš H, alkilo, arilob ir heteroarilob arba R10 ir R11 kartu su azoto atomu, prie kurio jie yra prijungti, suformuoja 4-, 5-, 6- arba 7-narį heterociklinį žiedą, kuriame yra anglis, pasirinktinai turintį papildomus heteroatomus, pasirinktus iš N, S ir O, kuris gali būti prisotintas arba neprisotintas su 1 arba 2 dvigubomis jungtimis, ir kuris pasirinktinai gali būti mono- arba dipakeistas pakaitais, pasirinktais iš okso, alkilo, alkoksi, OH, halogeno ir CF3.

2. Junginys, kurio formulė (I), arba tautomeras, stereoizomeras (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir raceminius bei skaleminius jų mišinius) arba farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba solvatas,

skirti naudoti medicinoje,

kur junginys, kurio formulė (I), yra kaip apibrėžta 1 punkte.

3. Junginys, kurio formulė (I), arba tautomeras, stereoizomeras (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir raceminius bei skaleminius jų mišinius),

skirtas panaudoti taikant ligos arba būklės, kuriai būdingas plazmos kalikreino aktyvumas, gydymo būdą, kur liga arba būklė, kuriai būdingas plazmos kalikreino aktyvumas, yra pasirinkta iš sutrikusio regėjimo aštrumo, diabetinės retinopatijos, diabetinės geltonosios dėmės edemos, paveldimos angioedemos, diabeto, pankreatito, kraujo išsiliejimo į smegenis, nefropatijos, kardiomiopatijos, neuropatijos, uždegiminės žarnyno ligos, artrito, uždegimo, septinio šoko, hipotenzijos, vėžio, suaugusiųjų kvėpavimo distreso sindromo, išplitusio intravaskulinio krešėjimo sindromo, šuntavimo operacijos, taikant dirbtinę kraujo apytaką, ir kraujavimo po operacijos,

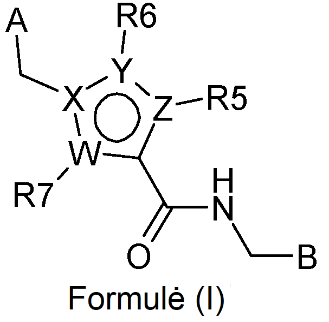
kur junginys, kurio formulė (I), yra kaip apibrėžta 1 punkte.

4. Junginys, kurio formulė (I), arba tautomeras, stereoizomeras (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir raceminius bei skaleminius jų mišinius),

skirtas panaudoti taikant ligos arba būklės, kuriai būdingas plazmos kalikreino aktyvumas, gydymo būdą, kur liga arba būklė, kuriai būdingas plazmos kalikreino aktyvumas, yra tinklainės kraujagyslių pralaidumas, susijęs su diabetine retinopatija ir diabetine geltonosios dėmės edema,

kur junginys, kurio formulė (I), yra kaip apibrėžta 1 punkte.

5. Junginys, kurio formulė (I),



kur

B yra fenilas, pakeistas 1-4 pakaitais, pasirinktais iš alkilob, alkoksi, OH, halogeno, CN, heteroarilo, COOR8, NHCOR8, CONR8R9, OCF3 ir CF3;

arba B yra pasirinktas iš benzotiofenilo, benzofuranilo ir 5- arba 6-nario heterociklinio žiedo, kuriame yra vienas arba du heteroatomai, pasirinkti iš N, O ir S; kur minėtas 5- arba 6-naris heterociklinis žiedas gali būti aromatinis arba nearomatinis; ir kur minėtas benzotiofenilas, minėtas benzofuranilas arba minėtas 5- arba 6-naris heterociklinis žiedas yra pakeistas 1-3 pakaitais, pasirinktais iš alkilob, alkoksi, OH, okso, halogeno, CN, heteroarilo, COOR8, NHCOR8, CONR8R9, OCF3 ir CF3;

W yra C ir X, Y ir Z yra nepriklausomai pasirinkti iš C, N, O ir S taip, kad žiedas, kuriame yra W, X, Y ir Z, būtų penkių narių aromatinis heterociklas;

R5 ir R6 nepriklausomai nėra, arba jie yra nepriklausomai pasirinkti iš H, alkilo, cikloalkilo, -NR8R9, CN, -NR8COR9 ir CF3; kur mažiausiai vienas iš R5 ir R6 yra, ir jis nėra H;

R7 yra H;

A yra pasirinktas iš arilo ir heteroarilo; kur arilas yra pakeistas 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš alkilo, alkoksi, metilendioksi, etilendioksi, OH, halogeno, CN, heteroarilo, -(CH2)0-3-O-heteroarilo, arilob, -O-arilob, -(CH2)1-3-arilob, -(CH2)1-3-heteroarilo, -COOR10, -CONR10R11, -(CH2)0-3-NR10R11, OCF3 ir CF3; ir heteroarilas yra pakeistas 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš alkilo, alkoksi, OH, OCF3, halogeno, CN, arilo, -(CH2)1-3-arilo, -(CH2)0-3-NR10R11, heteroarilob, -COOR10, -CONR10R11 ir CF3;

R8 ir R9 yra nepriklausomai pasirinkti iš H ir alkilo;

alkilas yra linijinis sotusis angliavandenilis, turintis iki 10 anglies atomų (C1-C10) arba šakotasis sotusis angliavandenilis, turintis tarp 3 ir 10 anglies atomų (C3-C10); alkilas pasirinktinai gali būti pakeistas 1 arba 2 pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš (C1-C6)alkoksi, OH, CN, CF3, COOR10, CONR10R11, fluoro ir NR10R11;

alkilasb yra linijinis sotusis angliavandenilis, turintis iki 6 anglies atomų, arba šakotasis sotusis angliavandenilis, turintis tarp 3 ir 6 anglies atomų (C3-6); alkilasb pasirinktinai gali būti pakeistas 1 arba 2 pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš (C1-C6)alkoksi, OH, CN, CF3, COOR10, CONR10R11 ir fluoro;

cikloalkilas yra monociklinis sotusis angliavandenilis, turintis tarp 3 ir 6 anglies atomų;

alkoksi yra linijinis per O prijungtas angliavandenilis, turintis tarp 1 ir 6 anglies atomų (C1-C6) arba šakotasis per O prijungtas angliavandenilis, turintis tarp 3 ir 6 anglies atomų (C3-C6); alkoksi pasirinktinai gali būti pakeistas 1 arba 2 pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš OH, CN, CF3, CONR10R11, fluoro ir NR10R11;

arilas yra fenilas, bifenilas arba naftilas; arilas gali būti pasirinktinai pakeistas 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš alkilo, alkoksi, metilendioksi, etilendioksi, OH, halogeno, CN, heteroarilo, -(CH2)0-3-O-heteroarilo, arilob, -O-arilob, -(CH2)1-3-arilob, -(CH2)1-3-heteroarilo, -COOR10, -CONR10R11, -(CH2)0-3-NR10R11, OCF3 ir CF3;

arilasb yra fenilas, bifenilas arba naftilas, kuris pasirinktinai gali būti pakeistas 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš alkilo, alkoksi, OH, halogeno, CN, -COOR10, -CONR10R11, CF3 ir NR10R11;

heteroarilas yra 5, 6, 9 arba 10 narių mono- arba biciklinis aromatinis žiedas, turintis, kur įmanoma, 1, 2, 3 arba 4 žiedo narius, nepriklausomai pasirinktus iš N, NR8, S ir O; heteroarilas gali būti pasirinktinai pakeistas 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš alkilo, alkoksi, OH, OCF3, halogeno, CN, arilo, -(CH2)1-3-arilo, -(CH2)0-3-NR10R11, heteroarilob, -COOR10, -CONR10R11 ir CF3;

heteroarilasb yra 5, 6, 9 arba 10 narių mono- arba biciklinis aromatinis žiedas, turintis, kur įmanoma, 1, 2 arba 3 žiedo narius, nepriklausomai pasirinktus iš N, NR8, S ir O; kur heteroarilasb gali būti pasirinktinai pakeistas 1, 2 arba 3 pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš alkilo, alkoksi, OH, halogeno, CN, arilo, -(CH2)1-3-arilo, -COOR10, -CONR10R11, CF3 ir NR10R11;

R10 ir R11 yra nepriklausomai pasirinkti iš H, alkilo, arilob ir heteroarilob arba R10 ir R11 kartu su azoto atomu, prie kurio jie yra prijungti, suformuoja 4-, 5-, 6- arba 7-narį heterociklinį žiedą, kuriame yra anglis, pasirinktinai turintį papildomus heteroatomus, pasirinktus iš N, S ir O, kuris gali būti prisotintas arba neprisotintas su 1 arba 2 dvigubomis jungtimis, ir kuris pasirinktinai gali būti mono- arba dipakeistas pakaitais, pasirinktais iš okso, alkilo, alkoksi, OH, halogeno ir CF3;

ir jo tautomerai, stereoizomerai (įskaitant enantiomerus, diastereoizomerus ir raceminius bei skaleminius jų mišinius), farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos arba solvatai

kur junginys nėra pasirinktas iš:

benzoinės rūgšties, 3-[[[[1-[(3-chlorfenil)metil]-3-metil-1H-pirazol-4-il]karbonil]amino]metil]-;

benzoinės rūgšties, 4-[[([1-[(3-chlorfenil)metil]-3-metil-1H-pirazol-4-il]karbonil]amino]metil]-;

2-furankarboksirūgšties, 5-[[[[1-[(3-chlorfenil)metil]-3-metil-1H-pirazol-4-il)karbonil]amino]metil]-;

benzoinės rūgšties, 5-[[[[1-[(3-chlorfenil)metil]-3-metil-1H-pirazol-4-il] karbonil]amino]metil]-2-metoksi-;

3-furankarboksirūgšties, 5-[[[[1-[(3-chlorfenil)metil]-3-metil-1H-pirazol-4-il]karbonil]amino]metil]-2-metil-; ir

benzoinės rūgšties, 4-[[[[1-[(3-chlorfenil)metil]-3-metil-1H-pirazol-4-il]karbonil]amino]metil]-2-metoksi-.

6. Farmacinė kompozicija pagal 1 punktą; junginys, skirtas panaudoti pagal bet kurį vieną iš 2-4 punktų; arba junginys pagal 5 punktą,

kur B yra pasirinktas iš fenilo, tiofenilo, benzotiofenilo ir piridilo, kiekvieno pakeisto 1-3 pakaitais, pasirinktais iš alkilob, alkoksi, halogeno, CN, COOR8, CONR8R9, OCF3 ir CF3; kur alkilasb, alkoksi, R8 ir R9 yra kaip apibrėžta 1 punkte,

arba jo tautomeras, stereoizomeras (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir raceminį bei skaleminį jų mišinį), farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba solvatas.

7. Farmacinė kompozicija pagal bet kurį vieną iš 1 arba 6 punkto; junginys, skirtas panaudoti pagal bet kurį vieną iš 2-4 arba 6 punktų; arba junginys pagal bet kurį vieną iš 5-6 punktų,

kur B yra pasirinktas iš fenilo ir piridilo, kiekvieno pakeisto 1-3 pakaitais, pasirinktais iš alkilob, alkoksi, CF3 ir halogeno; kur alkilasb ir alkoksi yra kaip apibrėžta 1 punkte,

arba jo tautomeras, stereoizomeras (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir raceminį bei skaleminį jų mišinį), farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba solvatas.

8. Farmacinė kompozicija pagal 6 punktą; junginys, skirtas panaudoti pagal 6 punktą; arba junginys pagal 6 punktą,

kur B yra piridilas, pakeistas 1-3 pakaitais, pasirinktais iš alkilob, alkoksi, CF3 ir halogeno; kur alkilasb ir alkoksi yra kaip apibrėžta 1 punkte,

arba jo tautomeras, stereoizomeras (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir raceminį bei skaleminį jų mišinį), farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba solvatas.

9. Farmacinė kompozicija pagal bet kurį vieną iš 1 arba 6-8 punktų; junginys, skirtas panaudoti pagal bet kurį vieną iš 2-4 arba 6-8 punktų; arba junginys pagal bet kurį vieną iš 5-8 punktų,

kur W yra C, ir X, Y ir Z yra nepriklausomai pasirinkti iš C ir N taip, kad žiedas, turintis W, X, Y ir Z, būtų penkių narių aromatinis heterociklas,

arba jo tautomeras, stereoizomeras (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir raceminį bei skaleminį jų mišinį), farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba solvatas.

10. Farmacinė kompozicija pagal bet kurį vieną iš 1 arba 6-9 punktų; junginys, skirtas panaudoti pagal bet kurį vieną iš 2-4 arba 6-9 punktų; arba junginys pagal bet kurį vieną iš 5-9 punktų,

kur W yra C, X yra N, ir Y ir Z yra pasirinkti iš C ir N,

arba jo tautomeras, stereoizomeras (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir raceminį bei skaleminį jų mišinį), farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba solvatas.

11. Farmacinė kompozicija pagal bet kurį vieną iš 1 arba 6-10 punktų; junginys, skirtas panaudoti pagal bet kurį vieną iš 2-4 arba 6-10 punktų; arba junginys pagal bet kurį vieną iš 5-10 punktų,

kur R5 ir R6 nepriklausomai nėra, arba jie yra nepriklausomai pasirinkti iš H, CH2OCH3, cikloalkilo, -NR8R9, -NR8COR9, CN ir CF3; kur cikloalkilas, R8 ir R9 yra kaip apibrėžta 1 punkte; ir kur mažiausiai vienas iš R5 ir R6 yra, ir jis nėra H,

arba jo tautomeras, stereoizomeras (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir raceminį bei skaleminį jų mišinį), farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba solvatas.

12. Farmacinė kompozicija pagal bet kurį vieną iš 1, 6, 7 arba 9-11 punktų; junginys, skirtas panaudoti pagal bet kurį vieną iš 2-4, 6, 7 arba 9-11 punktų; arba junginys pagal bet kurį vieną iš 5-7 arba 9-11 punktų,

kur R5 yra CH2OCH3,

arba jo tautomeras, stereoizomeras (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir raceminį bei skaleminį jų mišinį), farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba solvatas.

13. Farmacinė kompozicija pagal bet kurį vieną iš 1 arba 6-12 punktų; junginys, skirtas panaudoti pagal bet kurį vieną iš 2-4 arba 6-12 punktų; arba junginys pagal bet kurį vieną iš 5-12 punktų,

kur A yra fenilas, pakeistas -(CH2)1-3-heteroarilu arba -(CH2)1-3-NR10R11 ir, pasirinktinai, 1 arba 2 papildomais pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš alkilo, halogeno ir CF3; kur alkilas, heteroarilas, R10 ir R11 yra kaip apibrėžta 1 punkte,

arba jo tautomeras, stereoizomeras (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir raceminį bei skaleminį jų mišinį), farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba solvatas.

14. Farmacinė kompozicija pagal bet kurį vieną iš 1 arba 6-12 punktų; junginys, skirtas panaudoti pagal bet kurį vieną iš 2-4 arba 6-12 punktų; arba junginys pagal bet kurį vieną iš 5-12 punktų,

kur A yra piridilas, pakeistas heteroarilub arba -NR10R11, ir pasirinktinai 1 arba 2 papildomais pakaitais, nepriklausomai pasirinktais iš alkilo, halogeno ir CF3; kur alkilas, heteroarilasb, R10 ir R11 yra kaip apibrėžta 1 punkte,

arba jo tautomeras, stereoizomeras (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir raceminį bei skaleminį jų mišinį), farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba solvatas.

15. Farmacinė kompozicija pagal bet kurį vieną iš 13 arba 14 punktų; junginys, skirtas panaudoti pagal bet kurį vieną iš 13 arba 14 punktų; arba junginys pagal bet kurį vieną iš 13 arba 14 punktų,

kur R10 ir R11 kartu su azoto atomu, prie kurio jie yra prijungti, suformuoja 5- arba 6-narį anglies turintį heterociklinį žiedą, pasirinktinai turintį papildomą N atomą, kuris gali būti prisotintas arba neprisotintas 1 arba 2 dvigubomis jungtimis, ir pasirinktinai mono- arba dipakeistąjį pakaitais, pasirinktais iš okso, metilo, Cl ir F,

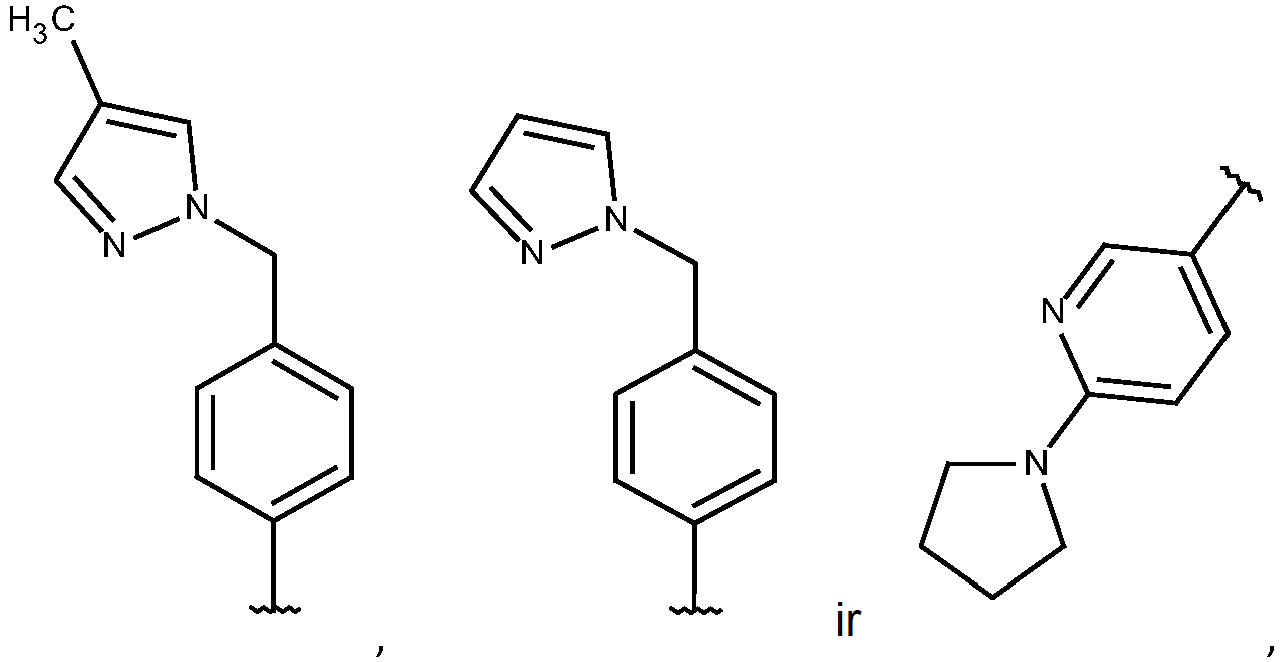
arba jo tautomeras, stereoizomeras (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir raceminį bei skaleminį jų mišinį), farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba solvatas.

16. Farmacinė kompozicija pagal bet kurį vieną iš 1 arba 6-12 punkto; junginys, skirtas panaudoti pagal bet kurį vieną iš 2-4 arba 6-12 punktų; arba junginys pagal bet kurį vieną iš 5-12 punktų,

kur A yra pasirinktas iš:







arba jo tautomeras, stereoizomeras (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir raceminį bei skaleminį jų mišinį), farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba solvatas.

17. Farmacinė kompozicija pagal 16 punktą; junginys, skirtas panaudoti pagal 16 punktą; arba junginys pagal 16 punktą,

kur A yra pasirinktas iš:



arba jo tautomeras, stereoizomeras (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir raceminį bei skaleminį jų mišinį), farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba solvatas.

18. Farmacinė kompozicija pagal bet kurį vieną iš 1, 6, 7 arba 9-11 punktų; junginys, skirtas panaudoti pagal bet kurį vieną iš 2-4, 6, 7 arba 9-11 punktų; arba junginys pagal bet kurį vieną iš 5-7 arba 9-11 punktų,

kur A yra pasirinktas iš:



arba jo tautomeras, stereoizomeras (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir raceminį bei skaleminį jų mišinį), farmaciniu požiūriu priimtina jo druska arba solvatas.

19. Farmacinė kompozicija pagal 1 punktą; junginys, skirtas panaudoti pagal bet kurį vieną iš 2-4 punktų; arba junginys pagal 5 punktą,

kur junginys yra pasirinktas iš:

3-amino-1-[4-(2-okso-2H-piridin-1-ilmetil)-benzil]-1H-pirazol-4-karboksirūgšties 2-fluor-3-metoksi-benzilamido;

N-[(2-fluor-3-metoksifenil)metil]-1-({4-[(4-metilpirazol-1-il)metil]fenil}metil)-3-(trifluormetil)pirazol-4-karboksamido;

N-[(2-fluor-5-metoksifenil)metil]-1-({4-[(4-metilpirazol-1-il)metil]fenil}metil)-3-(trifluormetil)pirazol-4-karboksamido;

N-{[2-fluor-6-(trifluormetil)fenil]metil}-1-({4-[(4-metilpirazol-1-il)metil]fenil}metil)-3-(trifluormetil)pirazol-4-karboksamido;

N-[(4-chlor-2,6-difluorofenil)metil]-1-({4-[(4-metilpirazol-1-il)metil]fenil}metil)-3-(trifluormetil)pirazol-4-karboksamido;

N-{[3-chlor-2-fluor-6-(trifluormetil)fenil]metil}-1-({4-[(4-metilpirazol-1-il)metil]fenil}metil)-3-(trifluormetil)pirazol-4-karboksamido;

N-[(2-fluor-4-metilfenil)metil]-1-({4-[(4-metilpirazol-1-il)metil]fenil}metil)-3-(trifluormetil)pirazol-4-karboksamido;

N-[(5-chlor-1-benzotiofen-3-il)metil]-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-{[2-fluor-6-(trifluormetil)fenil]metil}-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)-3-(trifluormetil)pirazol-4-karboksamido;

3-ciklopropil-N-[(2-fluor-3-metoksifenil)metil]-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-[(2-fluor-3-metoksifenil)metil]-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-[(2-fluor-3,6-dimetoksifenil)metil]-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

3-(dimetilamino)-N-[(2-fluor-3-metoksifenil)metil]-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-[(2-fluor-5-metoksifenil)metil]-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-[(2-fluor-4-metilfenil)metil]-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-{[2-(difluormetil)fenil]metil}-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-{[2-(difluormetil)-3-metoksifenil]metil}-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

3-amino-N-{[2-fluor-6-(trifluormetil)fenil]metil}-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

3-acetamido-N-[(2-fluor-3-metoksifenil)metil]-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-[(3-chlor-2,6-difluorofenil)metil]-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-[(5-chlor-2-cianofenil)metil]-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-[(6-ciano-2-fluor-3-metoksifenil)metil]-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-{[5-metoksi-2-(trifluormetil)fenil]metil}-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-{[2-(difluormetil)-6-fluorofenil]metil}-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-{[2-(difluormetil)-5-metoksifenil]metil}-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-{[2-(difluormetil)-6-fluor-3-metoksifenil]metil}-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-[(2-karbamoil-6-fluorofenil)metil]-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-[(2-karbamoil-5-metoksifenil)metil]-3-(metoksimetil)-1-(14-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-{[3-(difluormetoksi)-2-fluorofenil]metil}-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-{[2-(difluormetoksi)-6-fluorofenil]metil}-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-[(2,5-difluor-3-metoksifenil)metil]-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-[(2-fluor-6-metilfenil)metil]-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-[(6-chlor-2-fluor-3-metoksifenil)metil]-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

3-amino-N-[(2-fluor-3-hidroksifenil)metil]-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-[(3-etil-2-fluorofenil)metil]-3-(metoksimetil)-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

3-(metoksimetil)-N-[(3-metoksifenil)metil]-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

N-[(2,6-difluor-3-metoksifenil)metil]-1-({4-[(5-fluor-2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)-3-(metoksimetil)pirazol-4-karboksamido;

3-amino-N-[(7-chlor-4-metil-2,3-dihidro-1,4-benzoksazin-2-il)metil]-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-karboksamido;

3-amino-N-[(7-chlor-3,4-dihidro-2H-1,4-benzoksazin-2-il)metil]-1-({4-[(2-oksopiridin-1-il)metil]fenil}metil)pirazol-4-carboksamido

ir farmaciniu požiūriu priimtino jų s druskos ir solvatai.

20. Farmacinė kompozicija, apimanti (i) junginį arba tautomerą, stereoizomerą (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir raceminį bei skaleminį jų mišinį), farmaciniu požiūriu priimtiną jo druską arba solvatą, kaip nurodyta 5 punkte, ir (ii) farmaciniu požiūriu priimtiną nešiklį, skiediklį arba pagalbinę medžiagą.

21. Junginys, skirtas panaudoti pagal bet kurį vieną iš 3, 6-7, 9-11, 13-17 arba 19 punktų, arba tautomeras, stereoizomeras (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir jų raceminį bei skaleminį mišinį),

skirtas panaudoti taikant ligos arba būklės, kuri yra susijusi su plazmos kalikreino aktyvumu, gydymo būdą, kur liga arba būklė, kuri yra susijusi su plazmos kalikreino aktyvumu, yra paveldima angioedema.

22. Junginys pagal bet kurį vieną iš 3, 6-7, 9-11, 13-17 arba 19 punktų arba tautomeras, stereoizomeras (įskaitant enantiomerą, diastereoizomerą ir jų raceminį bei skaleminį mišinį),

skirtas panaudoti taikant ligos arba būklės, kuri yra susijusi su plazmos kalikreino aktyvumu, gydymo būdą, kur liga arba būklė, kuri yra susijusi su plazmos kalikreino aktyvumu, yra diabetinė geltonosios dėmės edema.