

【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21年8月6日(2009.8.6)

【公表番号】特表2008-543919(P2008-543919A)

【公表日】平成20年12月4日(2008.12.4)

【年通号数】公開・登録公報2008-048

【出願番号】特願2008-517590(P2008-517590)

【国際特許分類】

C 0 7 D	231/12	(2006.01)
C 0 7 K	5/06	(2006.01)
C 0 7 D	401/10	(2006.01)
C 0 7 D	401/14	(2006.01)
C 0 7 D	413/14	(2006.01)
C 0 7 D	413/12	(2006.01)
C 0 7 D	417/14	(2006.01)
C 0 7 D	417/12	(2006.01)
C 0 7 D	403/10	(2006.01)
C 0 7 D	409/14	(2006.01)
A 6 1 K	31/415	(2006.01)
A 6 1 K	31/454	(2006.01)
A 6 1 K	31/4545	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
A 6 1 K	31/506	(2006.01)
A 6 1 K	31/422	(2006.01)
A 6 1 K	31/501	(2006.01)
A 6 1 K	31/427	(2006.01)
A 6 1 K	31/4184	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/02	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	3/08	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	27/16	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/22	(2006.01)
A 6 1 P	31/18	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)
A 6 1 P 21/04 (2006.01)
A 6 1 P 27/02 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 19/10 (2006.01)
A 6 1 P 19/08 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D	231/12	C S P A
C 0 7 K	5/06	
C 0 7 D	401/10	
C 0 7 D	401/14	
C 0 7 D	231/12	B
C 0 7 D	413/14	
C 0 7 D	413/12	
C 0 7 D	417/14	
C 0 7 D	417/12	
C 0 7 D	403/10	
C 0 7 D	409/14	
A 6 1 K	31/415	
A 6 1 K	31/454	
A 6 1 K	31/4545	
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	31/496	
A 6 1 K	31/506	
A 6 1 K	31/422	
A 6 1 K	31/501	
A 6 1 K	31/427	
A 6 1 K	31/4184	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	43/00	1 0 5
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	31/12	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	3/08	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	27/16	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	31/22	
A 6 1 P	31/18	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	9/10	1 0 1

A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 21/04
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 19/10
 A 6 1 P 19/08

【手続補正書】

【提出日】平成21年6月19日(2009.6.19)

【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

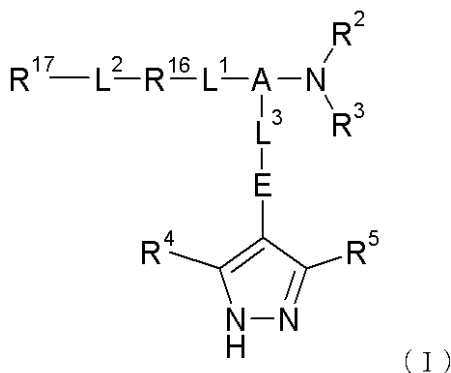
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(I)：

【化 1】



[式中、Aは、1～7個の炭素原子を含む飽和炭化水素リンカー基であり、該リンカー基は、 L^1 と NR^2R^3 の間に伸びる最大鎖長5原子と L^3 と NR^2R^3 の間に伸びる最大鎖長4原子とを有し、該リンカー基の炭素原子の1つは所望により酸素原子または窒素原子で置換されていてもよく、該リンカー基Aの炭素原子は所望により、オキソ、 C_{1-4} アルキル、フッ素およびヒドロキシから選択される1以上の置換基を有していてもよく(ただし、該ヒドロキシ基は存在する場合、 NR^2R^3 基に対して炭素原子 α の位置にはなく)；

Eは、単環式もしくは二環式炭素環式基または複素環式基であり；

R^2 および R^3 は独立に、水素、 C_{1-4} ヒドロカルビル、 C_{1-4} アシルおよび C_{1-4} ヒドロカルビルオキシカルボニルから選択され、該ヒドロカルビル、アシルおよびヒドロカルビルオキシカルボニル部分は所望により、フッ素、ヒドロキシ、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノおよびメトキシから選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

あるいは R^2 および R^3 は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、イミダゾール基、および4～7環員を有し、かつ、所望により、OおよびNから選択される第二のヘテロ原子環員を含む飽和単環式複素環式基から選択される環式基を形成するか；

あるいは R^2 および R^3 の一方は、それらが結合している窒素原子およびリンカー基A由来の1以上の原子と一緒にあって、4～7環員を有し、かつ、所望により、OおよびNから選択される第二のヘテロ原子環員を含む飽和単環式複素環式基を形成するか；

あるいは NR^2R^3 およびそれが結合しているリンカー基の炭素原子は一緒にあってシ

アノ基を形成し；

R^4 は、水素、ハロゲン、 C_{1-5} 飽和ヒドロカルビル、 C_{1-5} 飽和ヒドロカルビルオキシ、シアノおよび CF_3 から選択され；

R^5 は、水素、ハロゲン、 C_{1-5} 飽和ヒドロカルビル、 C_{1-5} 飽和ヒドロカルビルオキシ、シアノ、 $CONH_2$ 、 $CONHR^9$ 、 CF_3 、 NH_2 、 $NHCOR^9$ または $NHCONHR^9$ から選択され；

R^9 は、基 R^{9a} または $(CH_2)R^{9a}$ であり、ここで、 R^{9a} は、炭素環式または複素環式であり得る単環式基または二環式基であり；

該炭素環式基または複素環式基 R^{9a} は、所望により、ハロゲン、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、カルボキシ、アミノ、モノーもしくはジ- C_{1-4} ヒドロカルビルアミノ、基 R^a-R^b {ここで、 R^a は、結合、O、CO、 $X^1C(X^2)$ 、 $C(X^2)X^1$ 、 $X^1C(X^2)X^1$ 、S、SO、 SO_2 、 NR^c 、 SO_2NR^c または NR^cSO_2 であり、 R^b は、水素、3～12 環員を有する複素環式基、ならびに所望により、ヒドロキシ、オキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、カルボキシ、アミノ、モノーもしくはジ- C_{1-4} ヒドロカルビルアミノ、3～12 環員を有する炭素環式基および複素環式基から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい C_{1-8} ヒドロカルビル基から選択され、該 C_{1-8} ヒドロカルビル基の 1 以上の炭素原子は所望により、O、S、SO、 SO_2 、 NR^c 、 $X^1C(X^2)$ 、 $C(X^2)X^1$ または $X^1C(X^2)X^1$ で置換されていてもよく；

R^c は水素および C_{1-4} ヒドロカルビルから選択され；そして

X^1 は O、S または NR^c であり、 X^2 は =O、=S または = NR^c である} から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよく；

L^1 は結合、または C_1-C_4 アルケニレン、 C_1-C_4 アルキニレン、 $-CONR'^1-$ 、 $-NR'^1CO-$ 、 $-S-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(=NR^{11})-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-NR^{11}-$ 、 $C(=CHR^{11})$ 、 $-SO-$ および $-SO_2-$ から選択されるリンカーであり； R' は水素またはメチルであり；各 R^{11} は独立に水素または C_1-C_6 アルキルであり；

あるいは L^1 は基 R^{16} と一緒になって単環式または二環式 5～12 員のヘテロアリアル環構造を形成し；

L^3 は結合、または $CONH$ および $HNCO$ から選択されるリンカーであり；ただし、 L^1 と L^3 は双方とも同時にリンカーとなることはできず、かつ、 L^1 と L^3 は双方とも同時に結合となることもできない；

R^{16} は、所望により C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルケニル、 C_1-C_6 アルキニル、 $-O(C_1-C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-OH$ 、 $-CONHR^{11}$ 、 $-NHCOR^{11}$ 、 $-C(O)OR^{11}$ 、 COR^{11} 、ハロゲン、 NO_2 または CN から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい、5～12 員の飽和、不飽和または部分飽和型の単環式もしくは二環式炭素環式環または複素環式環であり；

ここで、該 R^{16} のアルキル、アルケニル、アルキニルおよびアルコキシ置換基はそれら自体さらに、 OH 、 $-O(C_1-C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-CONHR^{11}$ 、 $-NHCOR^{11}$ 、 $-C(O)OR^{11}$ 、 COR^{11} 、ハロゲン、 NO_2 または CN から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよく； R^{11} は上記で定義される通りであり；

L^2 は存在しないか、または結合、もしくは C_1-C_4 アルケニレン、 C_1-C_4 アルケニレン、 C_1-C_4 アルキニレン、 $-CONR'^1-$ 、 $-NR'^1CO-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-C(O)-$ 、 $C(=CHR^{11})$ 、 $C(S)-$ 、 $-NR^{11}-$ 、 C_3-C_4 シクロアルカンジイル、 $-SO-$ および $-SO_2-$ から選択されるリンカーであり；

R^{17} は存在しないか、あるいは C_1-C_6 アルキル、または 5～12 員の飽和、不飽和もしくは部分飽和型の炭素環式環もしくは複素環式環 {所望により C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルケニル、 C_1-C_6 アルキニル、 $-O(C_1-C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-OH$ 、 $-N(R^{11})_2$ 、 $-CONHR^{11}$ 、 $-NHCOR^{11}$ 、 $-C(O)OR^{11}$ 、 COR^{11} 、ハロゲン、 NO_2 、 CN 、 R^q 、 OR^q および $-Alk-R^q$ から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよく、ここで、 Alk は 1～4 炭素原子の直鎖または分枝アルキ

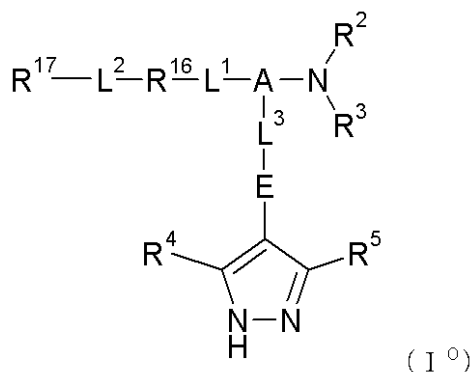
レン基であり、 R^9 は5～7員の飽和または不飽和炭素環式環または複素環式環である}であり；ただし、 R^{1-7} が存在しない場合には、 L^2 も存在せず；

該 R^{1-7} のアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリルおよびアルコキシ置換基はそれら自体、 C_1-C_6 アルキル、OH、 $-N(R^{1-1})_2$ 、 $-O(C_1-C_6$ アルキル)、 $-CONHR^{1-1}$ 、 $-NHCOR^{1-1}$ 、 $-C(O)OR^{1-1}$ 、 $CO R^{1-1}$ 、ハロゲン、 NO_2 、CNまたは炭素環式環もしくは複素環式環から選択される1以上の置換基でさらに置換されていてもよく、 R^{1-1} は上記で定義される通りである]で示される化合物、またはその塩、溶媒和物、互変異性体もしくはN-オキシド。

【請求項2】

式(I⁰):

【化2】



[式中、Aは、1～7個の炭素原子を含む飽和炭化水素リンカー基であり、該リンカー基は、 L^1 と NR^2R^3 の間に伸びる最大鎖長5原子と L^3 と NR^2R^3 の間に伸びる最大鎖長4原子とを有し、該リンカー基の炭素原子の1つは所望により酸素原子または窒素原子で置換されていてもよく、該リンカー基Aの炭素原子は所望により、オキシ、 C_1-4 アルキル、フッ素およびヒドロキシから選択される1以上の置換基を有していてもよく(ただし、該ヒドロキシ基は存在する場合、 NR^2R^3 基に対して炭素原子 α の位置にはなく)；

Eは、単環式もしくは二環式炭素環式基または複素環式基であり；

R^2 および R^3 は独立に、水素、 C_1-4 ヒドロカルビルおよび C_1-4 アシルから選択され、該ヒドロカルビルおよびアシル部分は所望により、フッ素、ヒドロキシ、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノおよびメトキシから選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

あるいは R^2 および R^3 は、それらが結合している窒素原子と一緒に、イミダゾール基、および4～7環員を有し、かつ、所望により、OおよびNから選択される第二のヘテロ原子環員を含む飽和単環式複素環式基から選択される環式基を形成するか；

あるいは R^2 および R^3 の一方は、それらが結合している窒素原子およびリンカー基A由来の1以上の原子と一緒に、4～7環員を有し、かつ、所望により、OおよびNから選択される第二のヘテロ原子環員を含む飽和単環式複素環式基を形成するか；

あるいは NR^2R^3 およびそれが結合しているリンカー基の炭素原子は一緒にシアン基を形成し；

R^4 は、水素、ハロゲン、 C_1-5 飽和ヒドロカルビル、 C_1-5 飽和ヒドロカルビルオキシ、シアノおよび CF_3 から選択され；

R^5 は、水素、ハロゲン、 C_1-5 飽和ヒドロカルビル、 C_1-5 飽和ヒドロカルビルオキシ、シアノ、 $CONH_2$ 、 $CONHR^9$ 、 CF_3 、 NH_2 、 $NHCOR^9$ または $NHCONHR^9$ から選択され；

R^9 は、基 R^{9a} または $(CH_2)R^{9a}$ であり、ここで、 R^{9a} は、炭素環式または複素環式であり得る単環式基または二環式基であり；

該炭素環式基または複素環式基 R^{9a} は、所望により、ハロゲン、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、カルボキシ、アミノ、モノーもしくはジ- C_1-4 ヒド

ロカルビルアミノ、基 $R^a - R^b$ {ここで、 R^a は、結合、O、CO、 $X^1 C(X^2)$ 、 $C(X^2)X^1$ 、 $X^1 C(X^2)X^1$ 、S、SO、 SO_2 、 NR^c 、 $SO_2 NR^c$ または $NR^c SO_2$ であり、 R^b は、水素、3～12 環員を有する複素環式基、ならびに所望により、ヒドロキシ、オキソ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、カルボキシ、アミノ、モノーもしくはジ- C_{1-4} ヒドロカルビルアミノ、3～12 環員を有する炭素環式基および複素環式基から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい C_{1-8} ヒドロカルビル基から選択され、該 C_{1-8} ヒドロカルビル基の 1 以上の炭素原子は所望により、O、S、SO、 SO_2 、 NR^c 、 $X^1 C(X^2)$ 、 $C(X^2)X^1$ または $X^1 C(X^2)X^1$ で置換されていてもよく；

R^c は水素および C_{1-4} ヒドロカルビルから選択され；そして

X^1 は O、S または NR^c であり、 X^2 は =O、=S または = NR^c である} から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよく；

L^1 は結合、または $C_1 - C_4$ アルケニレン、 $C_1 - C_4$ アルキニレン、 $-CONR'$ 、 $-NR'CO-$ 、 $-S-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(=NR^{11})-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-NR^{11}$ 、 $C(=CHR^{11})$ 、 $-SO-$ および $-SO_2-$ から選択されるリンカーであり； R' は水素またはメチルであり；各 R^{11} は独立に水素または $C_1 - C_6$ アルキルであり；

あるいは L^1 は基 R^{16} と一緒になって 8～12 員の縮合二環式ヘテロアリアル環構造を形成し；

L^3 は結合、または CONH および HNC O から選択されるリンカーであり；ただし、 L^1 と L^3 は双方とも同時にリンカーとなることはできず、かつ、 L^1 と L^3 は双方とも同時に結合となることもできない；

R^{16} は、所望により $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルケニル、 $C_1 - C_6$ アルキニル、 $-O(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-OH$ 、 $-CONHR^{11}$ 、 $-NHCOR^{11}$ 、 $-C(O)OR^{11}$ 、 COR^{11} 、ハロゲン、 NO_2 または CN から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい、5～12 員の飽和、不飽和または部分飽和型の単環式もしくは二環式炭素環式環または複素環式環であり；

ここで、該 R^{16} のアルキル、アルケニル、アルキニルおよびアルコキシ置換基はそれら自体さらに、 OH 、 $-O(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-CONHR^{11}$ 、 $-NHCOR^{11}$ 、 $-C(O)OR^{11}$ 、 COR^{11} 、ハロゲン、 NO_2 または CN から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよく； R^{11} は上記で定義される通りであり；

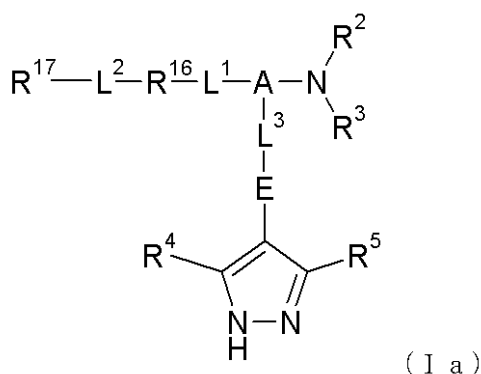
L^2 は存在しないか、または結合、もしくは $C_1 - C_4$ アルキレン、 $C_1 - C_4$ アルケニレン、 $C_1 - C_4$ アルキニレン、 $-CONR'$ 、 $-NR'CO-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-C(O)-$ 、 $C(=CHR^{11})$ 、 $C(S)-$ 、 $-NR^{11}$ 、 $C_3 - C_4$ シクロアルカンジイル、 $-SO-$ および $-SO_2-$ から選択されるリンカーであり；

R^{17} は存在しないか、あるいは $C_1 - C_6$ アルキル、または 5～12 員の飽和、不飽和もしくは部分飽和型の炭素環式環もしくは複素環式環 {所望により $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルケニル、 $C_1 - C_6$ アルキニル、 $-O(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-OH$ 、 $-N(R^{11})_2$ 、 $-CONHR^{11}$ 、 $-NHCOR^{11}$ 、 $-C(O)OR^{11}$ 、 COR^{11} 、ハロゲン、 NO_2 、CN、 R^q 、 OR^q および $-Alk-R^q$ から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよく、ここで、 Alk は 1～4 炭素原子の直鎖または分枝アルキレン基であり、 R^q は 5～7 員の飽和または不飽和炭素環式環または複素環式環である} であり；ただし、 R^{17} が存在しない場合には、 L^2 も存在せず；

該 R^{17} のアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリルおよびアルコキシ置換基はそれら自体、 $C_1 - C_6$ アルキル、 OH 、 $-N(R^{11})_2$ 、 $-O(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-CONHR^{11}$ 、 $-NHCOR^{11}$ 、 $-C(O)OR^{11}$ 、 COR^{11} 、ハロゲン、 NO_2 、CN または炭素環式環もしくは複素環式環から選択される 1 以上の置換基でさらに置換されていてもよく、 R^{11} は上記で定義される通りである] で示される、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物、互変異性体もしくは N-オキシド。

【請求項 3】

式(I a) :
【化 3】



[式中、Aは、1～7個の炭素原子を含む飽和炭化水素リンカー基であり、該リンカー基は、 L^1 と NR^2R^3 の間に伸びる最大鎖長5原子と L^3 と NR^2R^3 の間に伸びる最大鎖長4原子とを有し、該リンカー基の炭素原子の1つは所望により酸素原子または窒素原子で置換されていてもよく、該リンカー基Aの炭素原子は所望により、オキシ、 C_{1-4} アルキル、フッ素およびヒドロキシから選択される1以上の置換基を有していてもよく(ただし、該ヒドロキシ基は存在する場合、 NR^2R^3 基に対して炭素原子 α の位置にはなく)；

Eは、単環式もしくは二環式炭素環式基または複素環式基であり；

R^2 および R^3 は独立に、水素、 C_{1-4} ヒドロカルビルおよび C_{1-4} アシルから選択され、該ヒドロカルビルおよびアシル部分は所望により、フッ素、ヒドロキシ、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノおよびメトキシから選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

あるいは R^2 および R^3 は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、イミダゾール基、および4～7環員を有し、かつ、所望により、OおよびNから選択される第二のヘテロ原子環員を含む飽和単環式複素環式基から選択される環式基を形成するか；

あるいは R^2 および R^3 の一方は、それらが結合している窒素原子およびリンカー基A由来の1以上の原子と一緒にあって、4～7環員を有し、かつ、所望により、OおよびNから選択される第二のヘテロ原子環員を含む飽和単環式複素環式基を形成するか；

あるいは NR^2R^3 およびそれが結合しているリンカー基の炭素原子は一緒にあってシアノ基を形成し；

R^4 は、水素、ハロゲン、 C_{1-5} 飽和ヒドロカルビル、 C_{1-5} 飽和ヒドロカルビルオキシ、シアノおよび CF_3 から選択され；

R^5 は、水素、ハロゲン、 C_{1-5} 飽和ヒドロカルビル、 C_{1-5} 飽和ヒドロカルビルオキシ、シアノ、 $CONH_2$ 、 $CONHR^9$ 、 CF_3 、 NH_2 、 $NHCOR^9$ または $NHCONHR^9$ から選択され；

R^9 は、基 R^{9a} または $(CH_2)R^{9a}$ であり、ここで、 R^{9a} は、炭素環式または複素環式であり得る単環式基または二環式基であり；

該炭素環式基または複素環式基 R^{9a} は、所望により、ハロゲン、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、カルボキシ、アミノ、モノーもしくはジ- C_{1-4} ヒドロカルビルアミノ、基 R^a-R^b {ここで、 R^a は、結合、O、CO、 $X^1C(X^2)$ 、 $C(X^2)X^1$ 、 $X^1C(X^2)X^1$ 、S、SO、 SO_2 、 NR^c 、 SO_2NR^c または NR^cSO_2 であり、 R^b は、水素、3～12環員を有する複素環式基、ならびに所望により、ヒドロキシ、オキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、カルボキシ、アミノ、モノーもしくはジ- C_{1-4} ヒドロカルビルアミノ、3～12環員を有する炭素環式基および複素環式基から選択される1以上の置換基で置換されていてもよい C_{1-8} ヒドロカルビル基から選択され、該 C_{1-8} ヒドロカルビル基の1以上の炭素原子は所望により、O、S、SO、 SO_2 、 NR^c 、 $X^1C(X^2)$ 、 $C(X^2)X^1$ または $X^1C(X^2)X^1$ で置換されていてもよく；

R^c は水素および $C_1 - 4$ ヒドロカルビルから選択され；そして

X^1 は O、S または NR^c であり、 X^2 は $=O$ 、 $=S$ または $=NR^c$ である}から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよく；

L^1 は結合、または $-CONH-$ 、 $-NHCO-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-NR^{11}-$ 、 $-SO-$ および $-SO_2-$ から選択されるリンカーであり；各 R^{11} は独立に水素または $C_1 - C_6$ アルキルであり；

あるいは L^1 は基 R^{16} と一緒になって 8 ～ 12 員の縮合二環式ヘテロアリアル環構造を形成し；

L^3 は結合、または $CONH$ および $HNCO$ から選択されるリンカーであり；ただし、 L^1 と L^3 は双方とも同時にリンカーとなることはできず、かつ、 L^1 と L^3 は双方とも同時に結合となることもできない；

R^{16} は、所望により $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルケニル、 $C_1 - C_6$ アルキニル、 $-O(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-OH$ 、 $-CONHR^{11}$ 、 $-NHCOR^{11}$ 、 $-C(O)OR^{11}$ 、 COR^{11} 、ハロゲン、 NO_2 または CN から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい、5 ～ 12 員の飽和、不飽和または部分飽和型の単環式もしくは二環式炭素環式環または複素環式環であり；

ここで、該 R^{16} のアルキル、アルケニル、アルキニルおよびアルコキシ置換基はそれら自体さらに、 OH 、 $-O(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-CONHR^{11}$ 、 $-NHCOR^{11}$ 、 $-C(O)OR^{11}$ 、 COR^{11} 、ハロゲン、 NO_2 または CN から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよく； R^{11} は上記で定義される通りであり；

L^2 は存在しないか、または結合、もしくは $C_1 - C_4$ アルキレン、 $C_1 - C_4$ アルケニレン、 $C_1 - C_4$ アルキニレン、 $-CONH-$ 、 $-NHCO-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-NR^{11}-$ 、 $-SO-$ および $-SO_2-$ から選択されるリンカーであり；

R^{17} は存在しないか、あるいは $C_1 - 6$ アルキル、または 5 もしくは 6 員の飽和、不飽和もしくは部分飽和型の炭素環式環もしくは複素環式環{所望により $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルケニル、 $C_1 - C_6$ アルキニル、 $-O(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-OH$ 、 $-N(R^{11})_2$ 、 $-CONHR^{11}$ 、 $-NHCOR^{11}$ 、 $-C(O)OR^{11}$ 、 COR^{11} 、ハロゲン、 NO_2 、 CN 、 R^q 、および $-Alk-R^q$ から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよく、ここで、 Alk は 1 ～ 4 炭素原子の直鎖または分枝アルキレン基であり、 R^q は 5 ～ 7 員の飽和または不飽和炭素環式環または複素環式環である}であり；ただし、 R^{17} が存在しない場合には、 L^2 も存在せず；

該 R^{17} のアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、炭素環式ヘテロシクリルおよびアルコキシ置換基はそれら自体、 $C_1 - C_6$ アルキル、 OH 、 $-N(R^{11})_2$ 、 $-O(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-CONHR^{11}$ 、 $-NHCOR^{11}$ 、 $-C(O)OR^{11}$ 、 COR^{11} 、ハロゲン、 NO_2 、 CN または炭素環式環もしくは複素環式環から選択される 1 以上の置換基でさらに置換されていてもよく、 R^{11} は上記で定義される通りである]

を有する、請求項 2 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物、互変異性体もしくは N-オキシド。

【請求項 4】

(a) L^1 が $-CONH-$ 、 $-NHCO-$ または $-C(O)-$ であるか；または

(b) L^1 は基 R^{16} と一緒になって、(i) インドール、アザインドール、プリンまたはベンズイミダゾール環構造か；あるいは(ii) インドール、アザインドール、プリン、ベンズオキサゾール、ベンゾチアゾールまたはベンズイミダゾール環構造を形成するか；または

(c) R^{16} が単環式芳香基である、

請求項 1 ～ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

(a) L^2 が存在しないか、あるいは結合、または $C_1 - C_4$ アルキレン、 $C_1 - C_4$ アルケニレン、 $C_1 - C_4$ アルキニレン、 $-CONH-$ 、 $-NHCO-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-$

$C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-NR^{11}-$ 、 $-SO-$ および $-SO_2-$ から選択されるリンカーであるか；または

(b) L^2 が $-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO-$ または $-SO_2-$ であるか；または

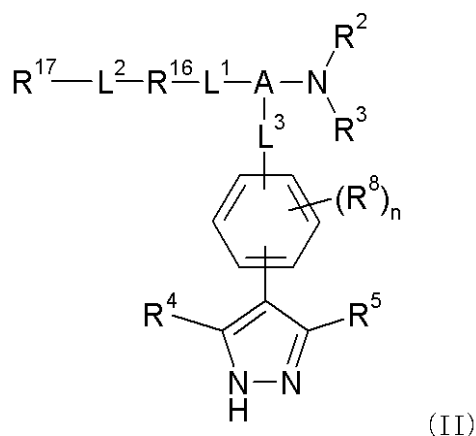
(c) L^2 が結合であり、そして、 R^{17} が R^{16} と直接結合している、

請求項 1～4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

(a) 式 (II)：

【化 4】

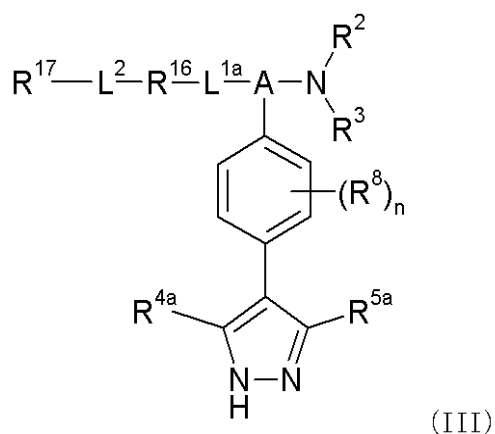


(式中、 n は 0、1、2 または 3 であり、そして、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^8 、 R^{16} 、 R^{17} 、 L^1 、 L^2 、 L^3 および A は請求項 1～5 のいずれか一項で定義される通りである)

を有する；または

(b) 式 (III)：

【化 5】

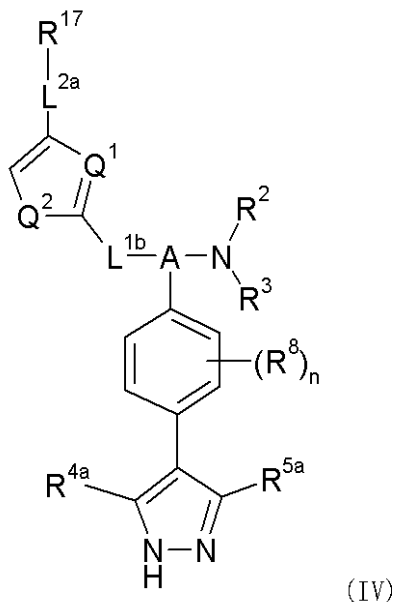


[式中、 R^{4a} は水素、ハロゲン、メチル、メトキシ、シアノおよび CF_3 から選択され； R^{5a} は水素、ハロゲン、メチル、メトキシ、シアノ、 CF_3 および $CONH_2$ から選択され； L^{1a} は $C(O)NH$ および $NHC(O)$ から選択されるか、あるいは基 R^{16} と一緒になって、ベンゾイミダゾールとベンズオキサゾールから選択される 8～12 員の縮合二環式ヘテロアリール環構造を形成し； n は 0、1 または 2 であり、そして、 A 、 R^2 、 R^3 、 R^8 および R^{17} は請求項 1～5 のいずれか一項で定義される通りである]

を有するか；または

(c) 式 (IV)：

【化 6】

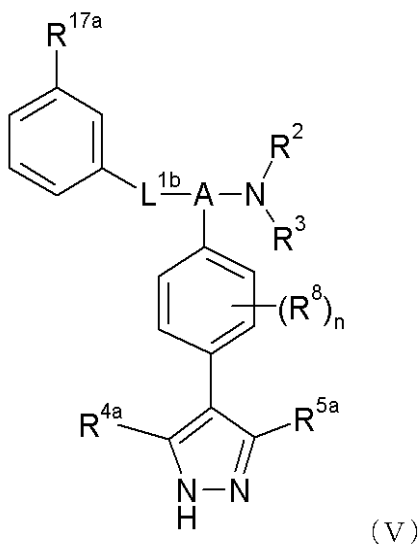


[式中、 L^{1b} は $NHC(O)$ または $C(O)NH$ であり； L^{2a} は結合またはエチニレン基であり； Q^1 は CH または N であり； Q^2 は $CH=CH$ または S であり；そして、 n 、 A 、 R^2 、 R^3 、 R^{4a} 、 R^{5a} 、 R^8 および R^{17} は請求項 1～5 のいずれか一項で定義される通りである]

を有するか；または

(d) 式 (V)：

【化 7】



[式中、 R^{17a} はフェニル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、ピラゾリル、オキサゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、チアゾリル、オキソ-オキサゾリジニルおよびベンゾキサゾリル{各々、所望により、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルケニル、 C_1-C_6 アルキニル、 $-O(C_1-C_6$ アルキル)、 $-OH$ 、 $-N(R^{11})_2$ 、 $-CONHR^{11}$ 、 $-NHCOR^{11}$ 、 $-C(O)OR^{11}$ 、 COR^{11} 、ハロゲン、 NO_2 、 CN 、 R^q 、 OR^q および $-Alk-R^q$ (ここで、 Alk は 1～4 個の炭素原子の直鎖または分枝アルキレン基であり、 R^q は 5～7 員の飽和または不飽和炭素環式基または複素環式環である) から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい} から選択され；

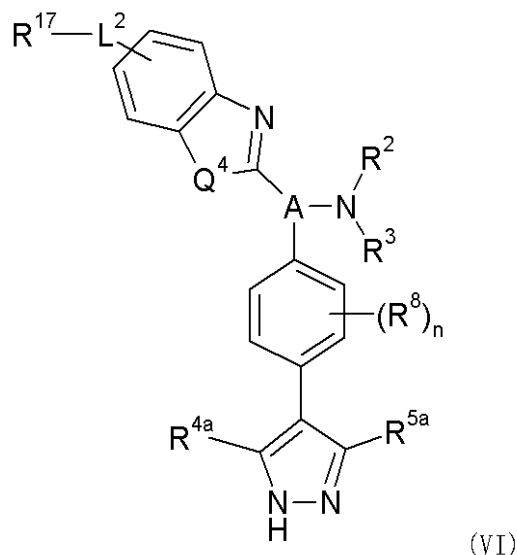
該 R^{17a} のアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリルお

よびアルコキシ置換基はそれら自体、 $C_1 - C_6$ アルキル、OH、 $-N(R^{11})_2$ 、 $-O(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-CONHR^{11}$ 、 $-NHCO R^{11}$ 、 $-C(O)OR^{11}$ 、 $CO R^{11}$ 、ハロゲン、 NO_2 、CNまたは炭素環式環もしくは複素環式環から選択される1以上の置換基でさらに置換されていてもよく；ここで、 R^{11} は上記で定義される通りであり、そして、 n 、 A 、 R^2 、 R^3 、 R^{4a} 、 R^{5a} および R^8 は請求項1～5のいずれか一項で定義される通りである]

を有するか；または

(e)式(VI)：

【化8】



(式中、 Q^4 はNH、SまたはOであり、そして、 n 、 L^2 、 R^2 、 R^3 、 R^{4a} 、 R^{5a} 、 R^8 および R^{17} は請求項1～5のいずれか一項で定義される通りである)

で示される、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項7】

N-{3-アミノ-1-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-プロピル}-3-メトキシ-ベンズアミドホルメート；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸(3-メトキシ-フェニル)-アミドアセテート；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸(3-クロロ-フェニル)-アミド；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸(3,4-ジクロロ-フェニル)-アミドホルメート；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[4-(3-ピペリジン-1-イル-フェノキシ)-フェニル]-アミドジアセテート；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[4-(3-メトキシ-フェノキシ)-フェニル]-アミドアセテート；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[4-(2-ヒドロキシ-フェノキシ)-フェニル]-アミドホルメート；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[4-(ピペリジン-4-イルオキシ)-フェニル]-アミドトリフルオロアセテート；

2-{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-1H-ベンゾイミダゾールジアセテート；

6-(3-メトキシ-フェノキシ)-2-{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-1H-ベンゾイミダゾールジホルメート；

ジメチル-[3-(2-{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-3H-ベンゾイミダゾール-5-イルオキシ)-フェニル]-アミンジ

ホルメート；

6-(2-メトキシ-フェノキシ)-2-{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-1H-ベンゾイミダゾールアセテート；

6-(4-メトキシ-フェノキシ)-2-{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-1H-ベンゾイミダゾールジアセテート；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[4-(2-ヒドロキシ-5-ピペリジン-1-イル-フェノキシ)-フェニル]-アミドアセテート；

4-(3-ピペリジン-1-イル-フェノキシ)-N-{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-ベンズアミドアセテート；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸(3-モルホリン-4-イル-フェニル)-アミドジホルメート；

N-{2-メチルアミノ-1-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-エチル}-ベンズアミド；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸(4-フェノキシ-フェニル)-アミドアセテート；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[4-(3-ジメチルアミノ-フェノキシ)-フェニル]-アミドアセテート；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[4-(3-トリフルオロメトキシ-フェノキシ)-フェニル]-アミドアセテート；

6-フェノキシ-2-{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-1H-ベンゾイミダゾール；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸{4-[3-(3,3-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-フェノキシ]-フェニル}-アミド；

6-(3-ピペリジン-1-イル-フェノキシ)-2-{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-1H-ベンゾイミダゾールトリアセテート；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[4-(3-イソプロポキシ-フェノキシ)-フェニル]-アミドアセテート；

4-(4-モルホリン-4-イルメチル-ベンゾイル)-N-{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-ベンズアミド；

4-{4-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンゾイル]-ベンゾイルアミノ}-4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル；

4-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンゾイル]-N-{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-ベンズアミド；

4-(3-メトキシ-フェノキシ)-N-{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-ベンズアミド；

4-(2-メトキシ-フェノキシ)-N-{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-ベンズアミド；

4-(2-ヒドロキシ-フェノキシ)-N-{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-ベンズアミド；

N-{3-アミノ-1-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-プロピル}-4-(2-フルオロ-6-ヒドロキシ-3-メトキシ-ベンゾイル)-ベンズアミド；

4-(3-モルホリン-4-イルメチル-ベンゾイル)-N-{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-ベンズアミド；

4-[3-(4-メチル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンゾイル]-N-{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-ベンズアミド；

4-(2-フルオロ-6-ヒドロキシ-3-メトキシ-ベンゾイル)-N-{4-[4-(

1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-ベンズアミド;
 N-{3-アミノ-1-[4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-プロピル}-
 4-クロロ-ベンズアミド;
 N-{3-アミノ-1-[4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-プロピル}-
 3-クロロ-ベンズアミド;
 N-{3-アミノ-1-(4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル)-プロピ(prop
 y)}-4-フェノキシ-ベンズアミド;
 N-{3-アミノ-1-(4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル)-プロピ(prop
 y)}-4-ベンゼンスルホニル-ベンズアミド;
 N-[3-アミノ-1-(4-クロロ-フェニル)-プロピル]-3-(1 H-ピラゾール
 -4-イル)-ベンズアミド;
 4-[4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[
 4-(3-シクロペンチルオキシ-フェノキシ)-フェニル]-アミドホルメート;
 N-[-アミノ-1-(4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル)-プロピ(propy
)}-ベンゾイル-ベンズアミド;
 4-[4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[
 3-(3,3-ジメチル-ブト-1-イニル)-フェニル]-アミド;
 4-[4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[
 3-(3-メチル-3 H-イミダゾール-4-イルエチニル)-フェニル]-アミド;
 4-[4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸(
 3-チオフエン-3-イルエチニル-フェニル)-アミド;
 4-[4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[
 3-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-フェニル]-アミド;
 4-[4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[
 3-(4,4-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-アミド;
 4-[4-(1 H-ピラゾール(pPyrazol)-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カ
 ルボン酸(4'-メチル-ビフェニル-3-イル)-アミド;
 4-[4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸(
 4'-メトキシ-ビフェニル-3-イル)-アミド;
 4-[4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸(
 4'-シアノ-ビフェニル-3-イル)-アミド;
 4-[4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸{
 4-[5-(3,3-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-2-ヒドロキシ-フェノキシ]-
 フェニル}-アミド;
 4-[4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸{
 4-[5-(4,4-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-2-ヒドロキシ-フェノキシ]-
 フェニル}-アミド;
 4-[4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸(
 4'-メトキシ-ビフェニル-3-イル)-アミドアセテート;
 4-[4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸(
 3'-メチル-ビフェニル-4-イル)-アミド;
 シクロヘキサカルボン酸{4-[4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピ
 ペリジン-4-イル}-アミドアセテート;
 4'-トリフルオロメチル-ビフェニル-3-カルボン酸{4-[4-(1 H-ピラゾール
 -4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-アミドアセテート;
 4-[4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[
 3-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-アミド;
 2-アミノ-N-フェニル-2-[4-(1 H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ア
 セトアミドアセテート;
 2-アミノ-N-(4'-メトキシ-ビフェニル-3-イル)-2-[4-(1 H-ピラゾ

ール-4-イル)-フェニル]-アセトアミドアセテート；

1-ベンゾイル-ピペリジン-4-カルボン酸{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-アミドアセテート；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸(3-ピリミジン-2-イル-フェニル)-アミドジアセテート；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[3-(4-メチル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イル)-フェニル]-アミドジアセテート；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸(3-ピリジン-3-イル-フェニル)-アミドジアセテート；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸(3-tert-ブチル-フェニル)-アミドアセテート；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸(3-ベンゾオキサゾール-2-イル-フェニル)-アミドジアセテート；

2-アミノ-N-(3-tert-ブチル-フェニル)-2-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-アセトアミドヒドロクロリド；

2-アミノ-N-(3-イソプロポキシ-フェニル)-2-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-アセトアミドヒドロクロリド；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[3-(5-フルオロ-ピリミジン-2-イル)-フェニル]-アミドジアセテート；

2-アミノ-N-(3-ベンゾオキサゾール-2-イル-フェニル)-2-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-アセトアミドヒドロクロリド；

2-アミノ-N-[3-(3,3-ジメチル-ブト-1-イニル)-フェニル]-2-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-アセトアミド；

2-アミノ-N-[3-(3,3-ジメチル-ブト-1-イニル)-フェニル]-2-[4-(5-エチル-1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-アセトアミド；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸(3-オキサゾール-5-イル-フェニル)-アミドジアセテート；

4-(5-フェニル-1H-イミダゾール-2-イル)-4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[4-(3-シクロペンチルオキシ-フェノキシ)-フェニル]-アミドホルメート；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[3-(2-メチル-ピリミジン-4-イル)-フェニル]-アミドトリヒドロクロリド；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[4-(4-クロロ-フェニル)-チアゾール-2-イル]-アミド；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[3-(6-メチル-ピリダジン-3-イル)-フェニル]-アミドアセテート；

4-[4-(3-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[3-(3,3-ジメチル-ブト-1-イニル)-フェニル]-アミドアセテート；

4-[4-(3-エチル-1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[3-(3,3-ジメチル-ブト-1-イニル)-フェニル]-アミドアセテート；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸(3-ピペリジン-1-イル-フェニル)-アミドヒドロクロリド；

4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸メチル-(3-ピペリジン-1-イル-フェニル)-アミドヒドロクロリド；

2-{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-ベンゾオキサゾールヒドロクロリド；

4'-メトキシ-ビフェニル-3-カルボン酸{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-アミド、塩酸塩；

6-(4-メトキシ-フェニル)-ピリジン-2-カルボン酸{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-アミド、塩酸塩；

3-(5-メチル-テトラゾール-1-イル)-N-{4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-イル}-ベンズアミド；

N-(3-ベンゾオキサゾール-2-イル-フェニル)-2-ピペラジン-1-イル-2-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-アセトアミドジアセテート；

2-アミノ-N-[3-(5-メチル-チアゾール-2-イル)-フェニル]-2-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-アセトアミドジアセテート；

2-アミノ-N-[3-(4-メチル-ピリジン-2-イル)-フェニル]-2-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-アセトアミドジアセテート；

1-メチル-4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジン-4-カルボン酸[3-(5-フルオロ-ピリミジン-2-イル)-フェニル]-アミド；

4-[3-(5-フルオロ-ピリミジン-2-イル)-フェニルカルバモイル]-1,1-ジメチル-4-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-ピペリジニウム；

2-アミノ-N-[3-((R)-4-イソプロピル-2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル]-2-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-アセトアミド；
および

C-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-C-[4-(1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル]-メチルアミン

から選択される、請求項1に記載の式(I)の化合物、またはその塩、溶媒和物、互変異性体もしくはN-オキシド。

【請求項8】

哺乳類において異常な細胞増殖を含む、または異常な細胞増殖から起こる疾病または状態の処置に使用するための、請求項1～7のいずれか一項に記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項9】

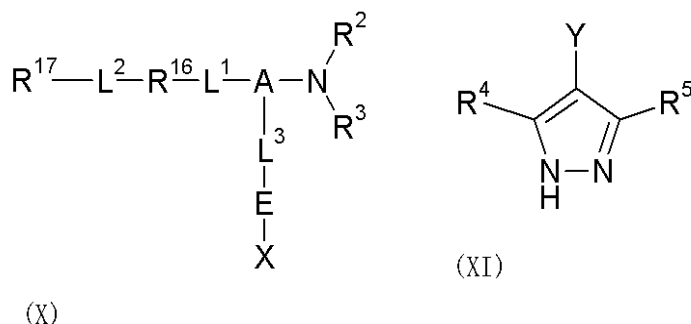
請求項1～7のいずれか一項に記載の化合物と医薬上許容される担体とを含む、医薬組成物。

【請求項10】

請求項1～7のいずれか一項に記載の式(I)の化合物の製造方法であって、

式(X)の化合物と式(XI)の化合物またはそのN保護誘導体を、パラジウム触媒と塩基の存在下で反応させることを含む、方法；

【化9】



(式中、A、E、L¹、L²、L³、R²～R⁵、R¹⁶およびR¹⁷は請求項1で定義される通りであり、基XおよびYの一方は塩素、臭素、ヨウ素およびトリフルオロメタンスルホネートから選択され、基XおよびYの他方はボロネート残基、例えば、ボロン酸エステルまたはボロン酸残基である)。