

【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 2008-546754 (P2008-546754A)

【公表日】平成 20 年 12 月 25 日 (2008.12.25)

【年通号数】公開・登録公報 2008-051

【出願番号】特願 2008-517594 (P2008-517594)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/415 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/04 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/415

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/04

【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

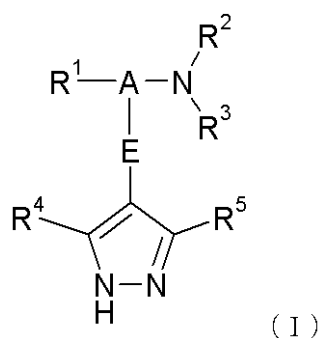
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

補助化合物および式 (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、 R^1 と $N R^2 R^3$ の間に伸張する最大 5 個の原子の鎖長を有し、また E と $N R^2 R^3$ の間に伸張する最大 4 個の原子の鎖長を有する；ただし、リンカー基の炭素原子の 1 個は所望によ

り酸素または窒素原子と置換わっていてもよい；また、リンカー基 A の炭素原子はオキシ、フッ素およびヒドロキシから選択される 1 個以上の置換基を所望により担持していてもよい；ただし、ヒドロキシ基は、それが存在する場合、 NR^2R^3 に関して 炭素原子に位置せず、またオキシ基は、それが存在する場合、 NR^2R^3 に関して 炭素原子に位置する；

E は単環状または二環状の炭素環状またはヘテロ環基である；

R^1 はアリールまたはヘテロアリール基である；

R^2 および R^3 は独立して、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る；ただし、該ヒドロカルビルおよびアシル部分は、フッ素、ヒドロキシ、アミノ、メチルアミノ、ジエチルアミノおよびメトキシから選択される 1 個以上の置換基で所望により置換されていてよい；

または R^2 および R^3 はそれらが結合す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、O および N から選択される第二のヘテロ原子環員を所望により含む飽和単環状ヘテロ環基から選択される環基を形成する；

または R^2 および R^3 の一方は、それらが結合する窒素原子およびリンカー基 A からの 1 個以上の原子と一緒にあって、4 ~ 7 環員を有し、O および N から選択される第二のヘテロ原子環員を所望により含む飽和単環状ヘテロ環基を形成する；

または NR^2R^3 およびそれが結合するリンカー基 A の炭素原子と一緒にあってシアノ基を形成する；

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 から選択される；また

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 NHCNHR^9 から選択される；

R^9 は基 R^{9a} または $(\text{CH}_2)\text{R}^{9a}$ である；ただし、 R^{9a} は炭素環状またはヘテロ環状であってもよい単環状または二環基である；

該炭素環状またはヘテロ環基 R^{9a} は、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 - もしくはジ - C_{1-4} ヒドロカルビルアミノ；基 $\text{R}^a - \text{R}^b$ (式中、 R^a は、結合、O、CO、 $\text{X}^1\text{C}(\text{X}^2)$ 、 $\text{C}(\text{X}^2)\text{X}^1$ 、 $\text{X}^1\text{C}(\text{X}^2)\text{X}^1$ 、S、SO、 SO_2 、 NR^c 、 SO_2NR^c または NR^cSO_2 である；また、 R^b は、水素、3 ~ 12 環員を有するヘテロ環基、およびヒドロキシ、オキシ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、カルボキシ、アミノ、モノ - 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およびヘテロ環基から選択される 1 個以上の置換基で所望により置換されていてよい C_{1-8} ヒドロカルビル基から選択される；ただし、 C_{1-8} ヒドロカルビル基の 1 個以上の炭素原子は O、S、SO、 SO_2 、 NR^c 、 $\text{X}^1\text{C}(\text{X}^2)$ 、 $\text{C}(\text{X}^2)\text{X}^1$ または $\text{X}^1\text{C}(\text{X}^2)\text{X}^1$ と所望により置き換わり得る) から選択される 1 個以上の置換基で所望により置換されていてよい；

R^c は水素および C_{1-4} ヒドロカルビルから選択される；また、

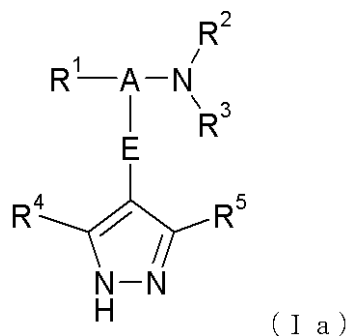
X^1 は O、S または NR^c であり、 X^2 は = O、= S または = NR^c である。]

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 - オキシドを含有してなる組み合わせ。

【請求項 2】

補助化合物および式 (I a)：

【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、 R^1 と NR^2R^3 の間に伸張する最大 5 個の原子の鎖長を有し、また E と NR^2R^3 の間に伸張する最大 4 個の原子の鎖長を有する；ただし、リンカー基の炭素原子の 1 個は所望により酸素または窒素原子と置換わっていてもよい；また、リンカー基 A の炭素原子はオキソ、フッ素およびヒドロキシから選択される 1 個以上の置換基を所望により担持していてもよい；ただし、ヒドロキシ基は、それが存在する場合、 NR^2R^3 に関して炭素原子に位置せず、またオキソ基は、それが存在する場合、 NR^2R^3 に関して炭素原子に位置する；

E は単環状または二環状の炭素環状またはヘテロ環基である；

R^1 はアリールまたはヘテロアリール基である；

R^2 および R^3 は独立して、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る；

または R^2 および R^3 はそれらが結合する窒素原子と一緒にあって、4 ～ 7 環員を有し、O および N から選択される第二のヘテロ原子環員を所望により含む飽和単環状ヘテロ環基を形成する；

または R^2 および R^3 の一方は、それらが結合する窒素原子およびリンカー基 A からの 1 個以上の原子と一緒にあって、4 ～ 7 環員を有し、O および N から選択される第二のヘテロ原子環員を所望により含む飽和単環状ヘテロ環基を形成する；

または NR^2R^3 およびそれが結合するリンカー基 A の炭素原子は一緒にあってシアノ基を形成する；

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

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

R^9 はフェニルまたはベンジルであり、それぞれには、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 - もしくはジ - C_{1-4} ヒドロカルビルアミノ；基 $R^a - R^b$ (式中、 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 である；また、 R^b は、水素、3 ～ 12 環員を有するヘテロ環基、およびヒドロキシ、オキソ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、カルボキシ、アミノ、モノ - 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およびヘテロ環基から選択される 1 個以上の置換基で所望により置換されていてよい C_{1-8} ヒドロカルビル基から選択される；ただし、 C_{1-8} ヒドロカルビル基の 1 個以上の炭素原子は O、S、SO、 SO_2 、 NR^c 、 $X^1C(X^2)$ 、 $C(X^2)X^1$ または $X^1C(X^2)X^1$ と所望により置き換わり得る)から選択される 1 個以上の置換基で所望により置換されていてよい；

R^c は水素および C_{1-4} ヒドロカルビルから選択される；また、

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。〕

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 - オキシドを含有して

なる請求項 1 記載の組み合わせ。

【請求項 3】

(a) $R^1 - A - NR^2R^3$ の部分が式 $R^1 - (G)_k - (CH_2)_m - W - O_b - (CH_2)_n - (CR^6R^7)_p - NR^2R^3$ (式中、G は NH、NMe または O である；W は基 E に結合し、 $(CH_2)_j - CR^{20}$ 、 $(CH_2)_j - N$ および $(NH)_j - CH$ から選択される；b は 0 または 1 であり、j は 0 または 1 であり、k は 0 または 1 であり、m は 0 または 1 であり、n は 0、1、2、または 3 であり、また p は 0 または 1 である；b および k の合計は 0 または 1 である；j、k、m、n および p の合計は 4 を超えない； R^6 および R^7 は同一または異なって、メチルおよびエチルから選択されるか、または CR^6R^7 がシクロプロピル基を形成する；また、 R^{20} は、水素、メチル、ヒドロキシおよびフッ素から選択される) で表される；および / または

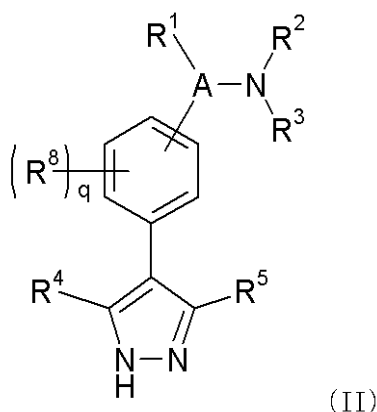
(b) E が 1,4-フェニレン、1,3-フェニレン、2,5-フェニレンおよび 2,4-ピリジレン、1,4-ピペラジニル、および 1,4-ピペラゾニルから選択される請求項 1 または 2 に記載の組み合わせ。

【請求項 4】

式 (I) の化合物が：

(a) 式 (II)：

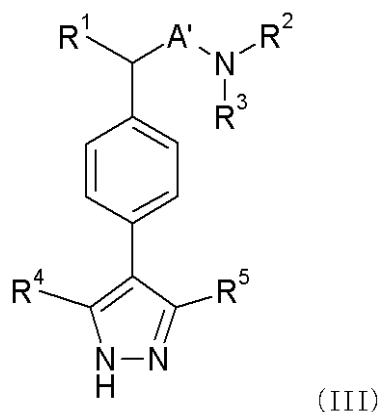
【化 3】



[式中、基 A はベンゼン環のメタまたはパラ位置に結合し、q は 0 ~ 4 である]
で示される化合物；または

(b) 式 (III)：

【化 4】

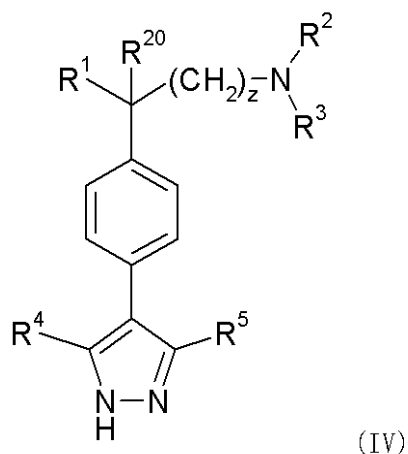


[式中、A' は基 A の残基であり、 R^1 ないし R^5 は請求項 1 ないし 3 のいずれか 1 項に記載のとおりである]

で示される化合物；または

(c) 式 (IV)：

【化 5】

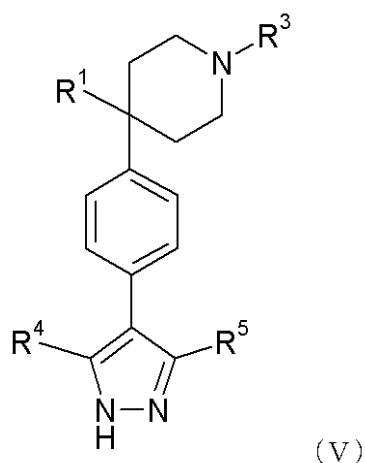


[式中、 z は 0、1 または 2 であり、 R^{20} は水素、メチル、ヒドロキシおよびフッ素から選択される；ただし、 z が 0 のとき、 R^{20} はヒドロキシ以外である]

で示される化合物；または

(d) 式 (V)：

【化 6】



で示される化合物である、請求項 1 ないし 3 のいずれか 1 項に記載の組み合わせ。

【請求項 5】

R^1 が未置換であるか、またはヒドロキシ； C_{1-4} アシルオキシ；フッ素；塩素；臭素；トリフルオロメチル；シアノ； $CONH_2$ ；ニトロ； C_{1-4} ヒドロカルビルオキシおよび C_{1-4} ヒドロカルビル(それぞれ C_{1-2} アルコキシ、カルボキシまたはヒドロキシで所望により置換されている)； C_{1-4} アシルアミノ；ベンゾイルアミノ；ピロリジノカルボニル；ピペリジノカルボニル；モルホリノカルボニル；ピペラジノカルボニル；N、O および S から選択される 1 個または 2 個のヘテロ原子を含む 5 員および 6 員のヘテロアリアルおよびヘテロアリアルオキシ基；フェニル；フェニル - C_{1-4} アルキル；フェニル - C_{1-4} アルコキシ；ヘテロアリアル - C_{1-4} アルキル；ヘテロアリアル - C_{1-4} アルコキシおよびフェノキシ(ただし、ヘテロアリアル、ヘテロアリアルオキシ、フェニル、フェニル - C_{1-4} アルキル、フェニル - C_{1-4} アルコキシ、ヘテロアリアル - C_{1-4} アルキル、ヘテロアリアル - C_{1-4} アルコキシおよびフェノキシ基には、それぞれに C_{1-2} アシルオキシ、フッ素、塩素、臭素、トリフルオロメチル、シアノ、 $CONH_2$ 、 C_{1-2} ヒドロカルビルオキシおよび C_{1-2} ヒドロカルビル(それぞれ C_{1-2} アルコキシまたはヒドロキシで所望により置換されている)から選択される 1、2 または 3 個の置換基で所望により置換されている)から選択される 1 個以上の置換基を担持するフェニル、ナフチル、チエニル、フラン、ピリミジンおよびピリジンから選択される、例え

ば R^1 がモノ - クロロフェニルまたはジクロロフェニル基である、請求項 1 ないし 4 のいずれか 1 項に記載の組み合わせ。

【請求項 6】

(a) R^2 および R^3 が独立して、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るか；または (b) R^2 および R^3 が独立して、水素およびメチルから選択されるか；または (c) R^2 および R^3 が共に水素である請求項 1 ないし 5 のいずれか 1 項に記載の組み合わせ。

【請求項 7】

式 (I) で示される化合物が次のものからなる群から選択される、請求項 1 に記載の組み合わせ；

2 - フェニル - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチルアミン；
 3 - フェニル - 2 - [3 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - プロピオニトリル；
 2 - [4 - (3, 5 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - 2 - フェニル - エチルアミン；
 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチルアミン；
 2 - [3 - (3, 5 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - 1 - フェニル - エチルアミン；
 3 - フェニル - 2 - [3 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - プロピルアミン；
 3 - フェニル - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - プロピルアミン；
 {3 - (4 - クロロ - フェニル) - 3 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - プロピル} - メチルアミン；
 {3 - (3, 4 - ジフルオロ - フェニル) - 3 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - プロピル} - メチルアミン；
 {3 - (3 - クロロ - フェニル) - 3 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - プロピル} - メチルアミン；
 3 - (4 - クロロ - フェニル) - 3 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - プロピオンアミド；
 3 - (4 - クロロ - フェニル) - 3 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - プロピルアミン；
 3 - (3, 4 - ジクロロ - フェニル) - 3 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - プロピルアミン；
 4 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - ピペリジン；
 4 - (4 - メトキシ - フェニル) - 4 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - ピペリジン；
 4 - (4 - クロロ - フェニル) - 1 - メチル - 4 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - ピペリジン；
 4 - フェニル - 4 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - ピペリジン；
 4 - [4 - (3, 5 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - 4 - フェニル - ピペリジン；
 ジメチル - {3 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - 3 - ピリジン - 2 - イル - プロピル} - アミン；
 {2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチル} - ジメチルアミン；
 {2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチル} - メチルアミン；
 {2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチル} - メチルアミン(R)；

{ 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチル } - メチルアミン (S) ;
 4 - { 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチル } - モルホリン ;
 4 - { 4 - [1 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - ピロリジン - 1 - イル - エチル] - フェニル } - 1 H - ピラゾール ;
 { 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチル } - イソプロピルアミン ;
 ジメチル - { 2 - フェニル - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチル } - アミン ;
 { 2, 2 - ビス - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチル } - ジメチルアミン ;
 { 2, 2 - ビス - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチル } - メチルアミン ;
 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチルアミン (R) ;
 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチルアミン (S) ;
 2 - (4 - クロロ - 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 ;
 1 - { 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチル } - ピペラジン ;
 1 - { 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチル } - ピペリジン ;
 4 - { 4 - [2 - アゼチジン - 1 - イル - 1 - (4 - クロロ - フェニル) - エチル] - フェニル } - 1 H - ピラゾール ;
 1 - フェニル - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチルアミン ;
 2 - (4 - クロロ - フェニル) - N - メチル - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - アセトアミド ;
 N - メチル - 2, 2 - ビス - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - アセトアミド ;
 { 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチル } - メチルアミン ;
 { 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチル } - エチルアミン ;
 4 - { 4 - [1 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - イミダゾール - 1 - イル - エチル] - フェニル } - 1 H - ピラゾール ;
 メチル - { 2 - (4 - フェノキシ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチル } - アミン ;
 { 2 - (4 - メトキシ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチル } - メチルアミン ;
 メチル - { 2 - [4 - (ピラジン - 2 - イルオキシ) - フェニル] - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチル } - アミン ;
 メチル - { 2 - フェノキシ - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチル } - アミン ;
 2 - { (4 - クロロ - フェニル) - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - メトキシ } - エチルアミン ;
 4 - { 4 - [1 - (4 - クロロ - フェニル) - 3 - ピロリジン - 1 - イル - プロピル] - フェニル } - 1 H - ピラゾール ;
 4 - { 4 - [3 - アゼチジン - 1 - イル - 1 - (4 - クロロ - フェニル) - プロピル] - フェ

ニル} - 1 H - ピラゾール ;
 メチル - { 3 - ナフタレン - 2 - イル - 3 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニ
 ル] - プロピル } - アミン ;
 ジメチル - (4 - { 3 - メチルアミノ - 1 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニ
 ル] - プロピル } - フェニル) - アミン ;
 { 3 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル]
 - プロピル } - メチルアミン ;
 4 - { 4 - [4 - (4 - クロロ - フェニル) - ピペリジン - 4 - イル] - フェニル } - 1 H - ピ
 ラゾール - 3 - カルボニトリル ;
 3 - (4 - フェノキシ - フェニル) - 3 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル]
 - プロピルアミン ;
 1 - { (4 - クロロ - フェニル) - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - メチ
 ル } - ピペラジン ;
 1 - メチル - 4 - { フェニル - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - メチル }
 - [1 , 4] ジアゼパン ;
 { 3 - (3 - クロロ - フェノキシ) - 3 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル]
 - プロピル } - メチルアミン ;
 メチル - { 2 - フェニル - 2 - [6 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - ピリジン - 3 - イル
] - エチル } - アミン ;
 4 - { 4 - [1 - (4 - クロロ - フェニル) - 3 - イミダゾール - 1 - イル - プロピル] - フ
 ェニル } - 1 H - ピラゾール ;
 4 - [4 - (3 - イミダゾール - 1 - イル - 1 - フェノキシ - プロピル) - フェニル] - 1 H
 - ピラゾール ;
 4 - { 4 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - ピペリジン - 4 - イル } - フ
 ェノール ;
 1 - { (4 - クロロ - フェニル) - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - メチ
 ル } - ピペラジン ;
 { 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル]
 - エチル } - メチルアミン ;
 { 2 - (3 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] -
 エチル } - メチルアミン ;
 4 - [4 - (2 - メトキシ - エトキシ) - フェニル] - 4 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イ
 ル) - フェニル] - ピペリジン ;
 4 - [4 - (3 - メトキシ - プロボキシ) - フェニル] - 4 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 -
 イル) - フェニル] - ピペリジン ;
 3 - (3 , 4 - ジクロロ - フェニル) - 3 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル
] - プロピオンアミド ;
 2 - (4 - { 2 - メチルアミノ - 1 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エ
 チル } - フェノキシ) - イソニコチンアミド ;
 { 2 - (3 - クロロ - フェノキシ) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル]
 - エチル } - メチルアミン ;
 3 - { 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル
] - エチルアミノ } - プロパン - 1 - オール ;
 2 - { 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル
] - エチルアミノ } - エタノール ;
 3 - { 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル
] - エチルアミノ } - プロパン - 1 - オール ;
 2 - { 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル
] - エチルアミノ } - エタノール ;
 { 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] -

エチル} - シクロプロピルメチルアミン ;
 メチル - [2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - 2 - (4 - ピリジン - 3 - イル - フェニル) - エチル] - アミン ;
 4 - { 3 - メチルアミノ - 1 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - プロピル } - フェノール ;
 3 - (4 - メトキシ - フェニル) - 3 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - プロピルアミン ;
 4 - (4 - クロロ - フェニル) - 4 - [4 - (3 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - ピペリジン ;
 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - モルホリン ;
 (4 - { 4 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - ピペリジン - 4 - イル } - フェノキシ) - 酢酸 ;
 (4 - { 4 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - ピペリジン - 4 - イル } - フェノキシ) - 酢酸メチルエステル ;
 4 - { 4 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - ピペリジン - 4 - イル } - ベンゾニトリル ;
 { 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - プロピル } - メチルアミン ;
 1 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - メチルアミノ - 1 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エタノール ;
 2 - アミノ - 1 - (4 - クロロ - フェニル) - 1 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エタノール ;
 4 - (3 , 4 - ジクロロ - フェニル) - 4 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - ピペリジン ;
 4 - (3 - クロロ - 4 - メトキシ - フェニル) - 4 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - ピペリジン ;
 4 - (4 - クロロ - 3 - フルオロ - フェニル) - 4 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - ピペリジン ;
 4 - { 4 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - ピペリジン - 4 - イル } - 安息香酸 ;
 4 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - 1 , 2 , 3 , 4 , 5 , 6 - ヘキサヒドロ - [4 , 4 '] ビピリジニル ;
 3 - (3 - クロロ - フェニル) - 3 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - プロピルアミン ;
 2 - メチルアミノ - 1 - (4 - ニトロ - フェニル) - 1 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エタノール ;
 2 - (3 - クロロ - 4 - メトキシ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチルアミン ;
 2 - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - フルオロ - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチルアミン ;
 3 - (3 , 4 - ジクロロ - フェニル) - 3 - [6 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - ピリジン - 3 - イル] - プロピルアミン ;
 2 - (4 - クロロ - 3 - フルオロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチルアミン ;
 4 - (2 - クロロ - 3 - フルオロ - フェニル) - 4 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - ピペリジン ;
 1 - { (3 , 4 - ジクロロ - フェニル) - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - メチル } - ピペラジン ;
 2 - (3 , 4 - ジクロロ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル

] - エチルアミン ;

{ 2 - (3 - クロロ - 4 - メトキシ - フェニル) - 2 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エチル } - メチルアミン ;

4 - { 4 - [2 - アゼチジン - 1 - イル - 1 - (4 - クロロ - フェノキシ) - エチル] - フェニル } - 1 H - ピラゾール ;

3 - (3 - クロロ - 4 - メトキシ - フェニル) - 3 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - プロピルアミン ;

{ 3 - (3 - クロロ - 4 - メトキシ - フェニル) - 3 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - プロピル } - メチルアミン ;

1 - { (3 , 4 - ジクロロ - フェニル) - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - メチル } - ピペラジン ; および

C - (4 - クロロ - フェニル) - C - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - メチルアミン ;

およびその塩、溶媒和物、互変異性体および N - オキシド。

【請求項 8】

式 (I) の化合物が 2 - アミノ - 1 - (4 - クロロ - フェニル) - 1 - [4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル] - エタノールまたはその塩、溶媒和物互変異性体または N - オキシドである、請求項 8 に記載の組み合わせ。

【請求項 9】

請求項 1 ないし 8 のいずれか 1 項に記載の組み合わせであって :

A . (I) 補助化合物が : (a) シグナル伝達阻害剤 ; (b) 補助 P B K 阻害剤 ; (c) C D K 阻害剤 ; (d) C O X - 2 阻害剤 ; (e) H D A C 阻害剤 ; (f) D N A メチラーゼ阻害剤 ; (g) プロテオソーム阻害剤 ; および (h) (a) ないし (g) の 2 種以上の組み合わせ ; から選択されるか ; または (II) 補助化合物が : (a) カンプトテシン化合物 ; (b) 代謝拮抗剤 ; (c) ビンカルカルロイド ; (d) タキサン類 ; (e) 白金化合物 ; (f) D N A 結合剤およびトポII阻害剤 ; (g) アルキル化剤 ; および (h) (a) ないし (g) の 2 種以上の組み合わせ ; から選択される細胞毒性化合物であるか ; または (III) 補助化合物が : (a) 完全なヒトの、またはキメラ (例えば、ヒト化) モノクローナル抗体 ; (b) 抗 C D 抗体 (例えば、抗 C D 2 0、C D 2 2、C D 3 3 または C D 5 2) ; (c) リツキシマブ (rituximab)、トシツモマブ (tositumomab) および ゲムツズマブ (gemtuzumab) ; (d) 本明細書に定義した 1 種以上のモノクローナル抗体 ; および (e) (b) ないし (d) から選択される 2 種以上のモノクローナル抗体の組み合わせ ; から選択されるモノクローナル抗体であるか ; または (IV) 補助化合物が : (a) ホルモン、ホルモンアゴニスト、ホルモンアンタゴニストおよびホルモン調節剤 ; (b) サイトカインおよびサイトカイン活性化剤 ; (c) レチノイド類 ; および (d) (a) ないし (c) の 2 種以上の組み合わせ ; から選択されるか ; または (V) 該組み合わせが : (a) ホルモン、ホルモンアゴニスト、ホルモンアンタゴニストおよびホルモン調節剤 ; (b) サイトカインおよびサイトカイン活性化剤 ; (c) レチノイド類 ; および (d) 前記分類の (a) ないし (c) の 2 種以上の組み合わせ ; (e) モノクローナル抗体 ; (f) カンプトテシン化合物 ; (g) 代謝拮抗剤 ; (h) ビンカルカルロイド ; (i) タキサン類 ; (j) 白金化合物 ; (k) D N A 結合剤およびトポII阻害剤 ; (l) アルキル化剤 ; (m) 前記分類 (f) ~ (l) の 2 種以上の組み合わせ ; (n) シグナル伝達阻害剤 ; (o) 補助 P K B 阻害剤 ; (p) C D K 阻害剤 ; (q) C O X - 2 阻害剤 ; (r) H D A C 阻害剤 ; (s) D N A メチラーゼ阻害剤 ; (t) プロテオソーム阻害剤 ; (u) 前記分類 (n) ~ (t) の 2 種以上の組み合わせ ; から選択される ; または B . 該補助化合物が (a) トラスツズマブ (trastuzumab)、セツキシマブ (cetuximab)、エルロチニブ (erlotinib)、ゲフィチニブ (gefitinib)、ビバシズマブ (bevacizumab)、イマチニブ (imatinib) および ソラフィニブ (sorafenib) から選択されるシグナル伝達阻害剤 ; または (b) アナストラゾール (anastrozole)、フルベストラント (fulvestrant)、レトロゾール (letrozole)、エクゼメスタン (exemestane)、ピカルタミド (bicalutamide) および ニルタミド (nilutamide) から選択されるホルモン ; または (c) インターロイキン - 2 および インターフェロン - アルファから選択されるサイトカイン ; または (d) ゴセレリン (goserel

in)およびロイボレリン(leuporelin)(ロイプロリド; leuprolide)から選択されるGNRA;または(e)レチノイド・トレチノイン;または(f)リツキシマブ(rituximab)およびアレムツズマブ(alemtuzumab)から選択されるモノクローナル抗体;または(g)パクリタキセル(paclitaxel)およびドセタキセル(docetaxel)から選択されるタキサン;または(h)ペメトレキシド(pemetrexed)、ゲムシタビン(gemcitabine)、カペシタビン(capecitabine)および5-FU±LVから選択される代謝拮抗剤;または(i)カルボプラチン(carboplatin)、シスプラチン(cisplatin)およびオキサリプラチン(oxaliplatin)から選択される白金化合物;または(j)カンプトテシン化合物、イリノテカン(irinotecan);または(k)アルキル化剤シクロホスファミド;または(l)パクリタキセル(paclitaxel)、ドセタキセル(docetaxel)、ペメトレキシド(pemetrexed)、ゲムシタビン(gemcitabine)、カペシタビン(capecitabine)、5-FU±LV、カルボプラチン、シスプラチン、オキサリプラチン、イリノテカンおよびシクロホスファミドから選択される細胞毒性化合物を含んでなる;または(m)該補助化合物がアナストラゾール(anastrozole)、フルベストラント(fulvestrant)、レトロゾール(letrozole)、エクゼメスタン(exemestane)、ピカルタミド(bicalutamide)、ニルタミド(nilutamide)、インターロイキン-2、インターフェロン-アルファ、ゴセレリン(goserelin)、ロイボレリン(leuporelin)(ロイプロリド; leuprolide)およびトレチノイン(tretinoin)から選択されるものである、組み合わせ。

【請求項10】

2種以上の補助化合物を含む、請求項1ないし9のいずれか1項に記載の組み合わせ。