

【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20年11月6日(2008.11.6)

【公表番号】特表2008-513464(P2008-513464A)

【公表日】平成20年5月1日(2008.5.1)

【年通号数】公開・登録公報2008-017

【出願番号】特願2007-532443(P2007-532443)

【国際特許分類】

C 07 D 231/12	(2006.01)
C 07 D 403/04	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
A 61 K 31/4184	(2006.01)
A 61 K 31/415	(2006.01)
C 07 D 405/12	(2006.01)
C 07 D 405/04	(2006.01)
A 61 K 31/4155	(2006.01)
C 07 D 409/04	(2006.01)
C 07 D 401/04	(2006.01)
A 61 K 31/4439	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 19/02	(2006.01)
A 61 P 37/06	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 17/06	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 1/04	(2006.01)
A 61 P 27/02	(2006.01)
A 61 P 3/10	(2006.01)
G 01 N 33/50	(2006.01)
G 01 N 33/15	(2006.01)
C 12 N 9/99	(2006.01)

【F I】

C 07 D 231/12	C S P A
C 07 D 403/04	
A 61 K 31/496	
A 61 K 31/4184	
C 07 D 231/12	B
A 61 K 31/415	
C 07 D 405/12	
C 07 D 405/04	
A 61 K 31/4155	
C 07 D 409/04	
C 07 D 401/04	
A 61 K 31/4439	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 43/00	1 0 5
A 61 P 35/00	

A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	9/10	1 0 3
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	3/10	
G 0 1 N	33/50	Z
G 0 1 N	33/15	Z
C 1 2 N	9/99	

【手続補正書】

【提出日】平成20年9月12日(2008.9.12)

【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

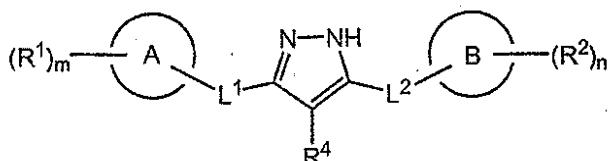
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

キナーゼ活性、特に、c - K i t および / または f l t - 3 を調節する式 I に従う化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、水和物またはプロドラッグ：

【化1】

**I**

ここで、

R¹ および R² の各々は、別個に、- H、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、- C N、- N O₂、- O R³、- N (R³) R³、- S (O)_{0 ~ 2} R³、- N (R³) C (= O) N (R³) R³、- SO₂ N (R³) R³、- CO₂ R³、- C (= O) N (R³) R³、- C (= N R⁵) N (R³) R³、- C (= N R⁵) R³、- N (R³) SO₂ R³、- N (R³) C (O) R³、- NCO₂ R³、- N (R³) C (O)₂ R³、- C (= O) R³、必要に応じて置換したアルコキシ、必要に応じて置換した低級アルキル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換した低級アリールアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したヘテロアリールアルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリル、および必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキルから選択される；

m および n の各々は、別個に、1 ~ 5 である；

A および B の各々は、別個に、5 員 ~ 10 員アリールまたはヘテロアリールから選択される；

R^3 は、 - H、 必要に応じて置換した低級アルキル、 必要に応じて置換したアリール、 必要に応じて置換した低級アリールアルキル、 必要に応じて置換したヘテロシクリル、 または必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキルから選択される；

R^3 の 2 個は、 それらが結合する窒素と一緒にになって、 組み合わされて、 必要に応じて置換したヘテロシクリルを形成でき、 該ヘテロシクリルは、 1 個と 3 個の間の追加ヘテロ原子を含有する；

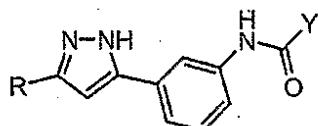
R^4 は、 - H および必要に応じて置換した低級アルキルから選択される；

各 R^5 は、 別個に、 - H、 - CN、 - NO₂、 - OR³、 - S(O)_{0~2}R³、 - CO₂R³、 必要に応じて置換した低級アルキル、 必要に応じて置換した低級アルケニル、 および必要に応じて置換したアルキニルから選択される； そして

L^1 および L^2 の各々は、 別個に、 存在しないおよび - C(R³) = C(R³) - から選択される；

但し、 該化合物は、 N' - [3 - [5 - (3 - クロロフェニル) - 1H - ピラゾール - 3 - イル] フェニル] - N, N - ジメチル - 尿素 (登録番号 143704 - 64 - 7) または N' - [3 - [5 - (2 - クロロフェニル) - 1H - ピラゾール - 3 - イル] フェニル] - N, N - ジメチル - 尿素 (登録番号 143704 - 63 - 6) のいずれかではなく、 また、 但し、 該化合物は、 式 i に従っておらず、

【化 2】



i

ここで、 R は、 低級アルキルまたは必要に応じて置換したフェニルである； そして Y は、 低級アルキル、 低級アルケニル、 低級アルコキシ、 低級アルケニルオキシ、 N, N - ジアルキルアミノ、 または N - 低級アルキル - N - 低級アルコキシアミノである。

化合物。

【請求項 2】

置換基アルコキシ、 アルキル、 アルケニル、 アルキニル、 アリール、 アリールアルキル、 シクロアルキル、 シクロアルキルアルキル、 ヘテロアリール、 ヘテロアリールアルキル、 ヘテロシクリルまたはヘテロシクリルアルキルが、 必要に応じて、 1 個またはそれ以上の置換基で置換されており、 該置換基が、 別個に、 アルキル、 アルコキシ、 ハロ、 ハロアルキル、 ハロアルコキシ、 - CN、 - NO₂、 - OR³、 - N(R³)R³、 - S(O)_{0~2}R³、 - N(R³)C(=O)N(R³)R³、 - N(R³)C(=O)C(=O)N(R³)R³、 - SO₂N(R³)R³、 - CO₂R³、 - C(=O)N(R³)R³、 - C(=NR⁵)N(R³)R³、 - C(=NR⁵)R³、 - N(R³)SO₂R³、 - N(R³)C(O)R³、 - NCO₂R³、 - N(R³)C(O)₂R³、 - C(=O)R³、 必要に応じて置換したアリール、 必要に応じて置換したアリールアルキル、 必要に応じて置換したシクロアルキル、 必要に応じて置換したシクロアルキルアルキル、 必要に応じて置換したヘテロシクリル、 必要に応じて置換したヘテロシクリルアルキル、 必要に応じて置換したヘテロアリール、 および必要に応じて置換したヘテロアリールアルキルからなる群から選択される、 請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^4 が、 - H である、 請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

L^1 および L^2 が、 両方共に、 - C(R³) = C(R³) - である、 請求項 3 に記載の化合物。

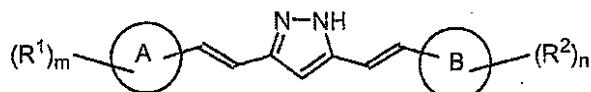
【請求項 5】

L^1 および L^2 が、 両方共に、 E - - C(R³) = C(R³) - である、 請求項 4 に記

載の化合物。

【請求項 6】

式 II である、請求項 5 に記載の化合物、
【化 3】



II

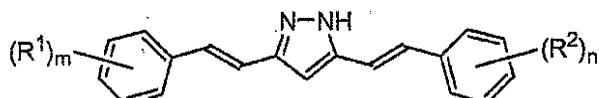
ここで、R¹ および R² の各々は、別個に、-H、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、-CN、-NO₂、-OR³、-N(R³)R³、-S(O)_{0~2}R³、-N(R³)C(=O)N(R³)R³、-N(R³)C(=O)C(=O)N(R³)R³、-SO₂N(R³)R³、-CO₂R³、-C(=O)N(R³)R³、-C(=N R⁵)N(R³)R³、-C(=N R⁵)R³、-N(R³)SO₂R³、-N(R³)C(O)R³、-NCO₂R³、-C(=O)R³、必要に応じて置換したアルコキシ、必要に応じて置換した低級アルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したヘテロシクリルおよび必要に応じて置換したアリールから選択される；

A および B の各々は、ラジカルであり、該ラジカルは、別個に、フェニル、ベンゾチオフェニル、ピリジル、ピラジニル、ベンゾフラニル、ベンゾピラゾリル、ベンゾキサゾリル、ナフチル、ベンゾイミダゾリル、インドリル、およびビフェニルからなる群から選択される。

化合物。

【請求項 7】

式 IIa である、請求項 6 に記載の化合物、
【化 4】



IIa

ここで、R¹ および R² の各々は、別個に、-H、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、-CN、-NO₂、-OR³、-N(R³)R³、-S(O)_{0~2}R³、-N(R³)C(=O)N(R³)R³、-SO₂N(R³)R³、-CO₂R³、-C(=O)N(R³)R³、-C(=N R⁵)N(R³)R³、-C(=N R⁵)R³、-N(R³)SO₂R³、-N(R³)C(O)R³、-NCO₂R³、-C(=O)R³、必要に応じて置換したアルコキシ、必要に応じて置換した低級アルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したシクロアルキルおよび必要に応じて置換したアリールから選択される。

化合物。

【請求項 8】

R¹ および R² の各々が、別個に、-H、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、-CN、-NO₂、-OR³、-N(R³)R³、-C(=O)R³、および必要に応じて置換した低級アルキルから選択される、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

以下からなる群から選択される、請求項 8 に記載の化合物：

4 - ((E) - 2 - { 5 - [(E) - 2 - フェニルエテニル] - 1 H - ピラゾール - 3 - イル } エテニル) フェノール；

2 - (メチルオキシ) - 4 - ((E) - 2 - {5 - [(E) - 2 - フェニルエテニル] - 1 H - ピラゾール - 3 - イル}エテニル)フェノール；
 4 - ((E) - 2 - {3 - [(E) - 2 - (4 - クロロフェニル)エテニル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル}エテニル) - 2 - (メチルオキシ)フェノール；
 4 - ((E) - 2 - {3 - [(E) - 2 - (2,4 -ジフルオロフェニル)エテニル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル}エテニル) - 2 - (メチルオキシ)フェノール；および
 4 - ((E) - 2 - {3 - [(E) - 2 - (4 - フルオロフェニル)エテニル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル}エテニル) - 2 - (メチルオキシ)フェノール。

【請求項 10】

R^1 が、 - H、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、 - CN、 - NO₂、および必要に応じて置換した低級アルキルから選択される；そして R^2 が、 - H、 - OR³、 - N(R³)R³、および必要に応じて置換した低級アルキルから選択される、請求項 8 に記載の化合物。

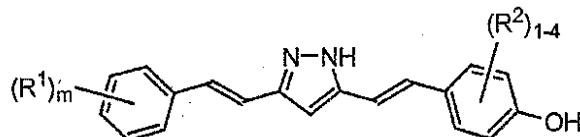
【請求項 11】

R^1 が、 - H、ハロゲン、ハロアルコキシおよびハロアルキルから選択される；そして R^2 が、 - H、 - OR³、 - N(R³)R³、および必要に応じて置換した低級アルキルから選択される、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 12】

式 I I I である、請求項 11 に記載の化合物、

【化 5】



III

ここで、 R^1 は、 - H、ハロゲン、ハロアルキルおよびハロアルコキシから選択される；そして R^2 は、 - H、 - OR³、 - N(R³)R³、および必要に応じて置換した低級アルキルから選択される、

化合物。

【請求項 13】

L^1 が、存在せず、そして L^2 が、 - C(R³) = C(R³) - である、請求項 3 に記載の化合物。

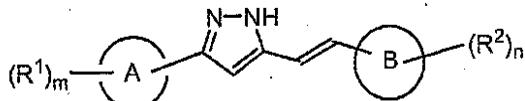
【請求項 14】

L^1 が、存在せず、そして L^2 が、 - C(H) = C(H) - である、請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 15】

式 I V である、請求項 13 に記載の化合物、

【化 6】



IV

ここで、 R^1 および R^2 の各々は、別個に、 - H、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、 - CN、 - NO₂、 - OR³、 - N(R³)R³、 - S(O)_{0~2}R³、 - N(R³)C(=O)N(R³)R³、 - N(R³)C(=O)C(=O)N(R³)R³、 - SO₂N(R³)R³、 - CO₂R³、 - C(=O)N(R³)R³、 - C(=N)R⁵

) N (R ³) R ³ 、 - C (= N R ⁵) R ³ 、 - N (R ³) S O ₂ R ³ 、 - N (R ³) C (O) R ³ 、 - N (R ³) C (O) ₂ R ³ 、 - N C O ₂ R ³ 、 - C (= O) R ³ 、 必要に応じて置換したアルコキシ、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したヘテロアリール、または必要に応じて置換した低級アルキルから選択される；そして各 A および B は、ラジカルであり、該ラジカルは、別個に、フェニル、ベンゾチオフェニル、ピリジル、ピラジニル、ベンゾフラニル、ベンゾピラゾリル、ベンゾキサゾリル、ナフチル、ベンゾイミダゾリル、インドリル、およびビフェニルからなる群から選択される。

化合物。

【請求項 16】

以下からなる群から選択される、請求項 15 に記載の化合物：

4 - { (E) - 2 - { 3 - [6 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } エテニル } フェノール；
 4 - { (E) - 2 - [3 - (1 - ベンゾフラン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] エテニル } フェノール；
 4 - { (E) - 2 - [3 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] エテニル } フェノール；
 4 - { (E) - 2 - [3 - (1 - ベンゾチエン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] エテニル } フェノール；
 4 - { (E) - 2 - { 3 - [3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) フェニル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } エテニル } フェノール；
 4 - { (E) - 2 - [3 - (4 - クロロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] エテニル } フェノール；
 4 - { (E) - 2 - [3 - (5 - クロロ - 1 - ベンゾフラン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] エテニル } フェノール；
 4 - [(E) - 2 - (3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) エテニル] フェノール；
 4 - { (E) - 2 - [3 - (3 - クロロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] エテニル } フェノール；
 4 - { (E) - 2 - [3 - (2 - クロロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] エテニル } フェノール；
 4 - [(E) - 2 - (3 - ピリジン - 3 - イル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) エテニル] フェノール；
 4 - { (E) - 2 - [3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] エテニル } フェノール；および
 2 - { 5 - [(E) - 2 - フェニルエテニル] - 1 H - ピラゾール - 3 - イル } - 1 - ベンゾフラン - 6 - オール。

【請求項 17】

L ² が、存在せず、そして L ¹ が、 - C (R ³) = C (R ³) - である、請求項 3 に記載の化合物。

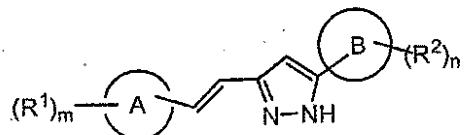
【請求項 18】

L ² が、存在せず、そして L ¹ が、 - C (H) = C (H) - である、請求項 17 に記載の化合物。

【請求項 19】

式 I V a である、請求項 18 に記載の化合物、

【化7】



IVa

ここで、 R^1 および R^2 の各々は、別個に、-H、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、-CN、-NO₂、-OR³、-N(R³)R³、-S(O)_{0~2}R³、-N(R³)C(=O)N(R³)R³、-SO₂N(R³)R³、-CO₂R³、-C(=O)N(R³)R³、-C(=N R⁵)N(R³)R³、-C(=N R⁵)R³、-N(R³)SO₂R³、-N(R³)C(O)R³、-NCO₂R³、-C(=O)R³、必要に応じて置換したアルコキシ、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したシクロアルキル、および必要に応じて置換した低級アルキルから選択される；そして各AおよびBは、ラジカルであり、該ラジカルは、別個に、フェニル、ベンゾチオフェニル、ピリジル、ピラジニル、ベンゾフラニル、ベンゾピラゾリル、ベンゾキサゾリル、ナフチル、ベンゾイミダゾリル、インドリル、およびビフェニルからなる群から選択される。

化合物。

【請求項20】

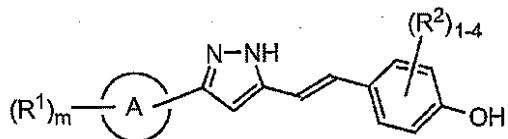
以下からなる群から選択される、請求項19に記載の化合物：

2 - (メチルオキシ) - 4 - [(E) - 2 - (5 - フェニル - 1H - ピラゾール - 3 - イル) エテニル] フエノール；
 4 - [(E) - 2 - (5 - ナフタレン - 2 - イル - 1H - ピラゾール - 3 - イル) エテニル] フエノール；
 4 - { (E) - 2 - [5 - (2 - フルオロフェニル) - 1H - ピラゾール - 3 - イル] エテニル } フエノール；
 4 - { (E) - 2 - [5 - (4 - フルオロフェニル) - 1H - ピラゾール - 3 - イル] エテニル } フエノール；
 4 - [(E) - 2 - (5 - ピリジン - 2 - イル - 1H - ピラゾール - 3 - イル) エテニル] フエノール；
 4 - ((E) - 2 - { 5 - [2 - (メチルオキシ) フエニル] - 1H - ピラゾール - 3 - イル } エテニル) フエノール；
 4 - ((E) - 2 - { 5 - [3 - (メチルオキシ) フエニル] - 1H - ピラゾール - 3 - イル } エテニル) フエノール；
 (4 - { 3 - [(E) - 2 - フエニルエテニル] - 1H - ピラゾール - 5 - イル } フエニル) カルバミン酸 1 , 1 - ジメチルエチル；
 4 - { (E) - 2 - [5 - (3 - フルオロフェニル) - 1H - ピラゾール - 3 - イル] エテニル } フエノール；
 4 - [(E) - 2 - (5 - ビフェニル - 3 - イル - 1H - ピラゾール - 3 - イル) エテニル] フエノール； および
 4 - ((E) - 2 - { 5 - [5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1H - ピラゾール - 3 - イル } エテニル) フエノール。

【請求項21】

式Vである、請求項14に記載の化合物、

【化 8】



ここで、 R^1 および R^2 の各々は、別個に、-H、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、-CN、-NO₂、-OR³、-N(R³)R³、-S(O)_{0~2}R³、-CO₂R³、-C(=O)N(R³)R³、-N(R³)SO₂R³、-N(R³)C(O)R³、-NCO₂R³、-C(=O)R³、必要に応じて置換したアルコキシ、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換した低級アルキルおよび必要に応じて置換したシクロアルキルから選択される；そしてAは、ラジカルであり、該ラジカルは、フェニル、ベンゾチオフェニル、ピリジル、ベンゾフラニル、ベンゾイミダゾリル、およびインドリルからなる群から選択される、

化合物。

【請求項 2 2】

Aが、フェニルまたは2-ベンゾイミダゾリルのいずれかである、請求項21に記載の化合物。

【請求項 2 3】

Aが、-N(R³)R³、必要に応じて置換したヘテロアリシクリル、または低級アルキルの少なくとも1個で置換されており、該低級アルキルが、-N(R³)R³の少なくとも1個で置換されている、請求項22に記載の化合物。

【請求項 2 4】

L¹ および L² が、両方共に、存在しない、請求項3に記載の化合物。

【請求項 2 5】

Aが、6員または9員アリールまたはヘテロアリールであり、そしてBが、6員アリールまたはヘテロアリールである、請求項24に記載の化合物。

【請求項 2 6】

以下からなる群から選択される、請求項25に記載の化合物：

N-[4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-N'-(4-{3-[5-(4-エチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル]-1H-ピラゾール-5-イル}フェニル)尿素；

N-(3-エチルフェニル)-N'-(4-{3-[5-(4-エチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル]-1H-ピラゾール-5-イル}フェニル)尿素；

N-(4-{3-[5-(4-エチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル]-1H-ピラゾール-5-イル}フェニル)-N'-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)尿素；

N-(3-アセチルフェニル)-N'-(4-{3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル]-1H-ピラゾール-5-イル}フェニル)尿素；

N-(3,4-ジクロロフェニル)-N'-(4-{3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル]-1H-ピラゾール-5-イル}フェニル)尿素；

N-(3-ブロモフェニル)-N'-(4-{3-[6-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル]-1H-ピラゾール-5-イル}フェニル)尿素；

N-[4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-N'-(4-{3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル]-1H-ピラゾール-5-イル}フェニル)尿素；

5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) 尿素 ;

N - (4 - { 3 - [5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) - N' - [4 - (フェニルオキシ) フェニル] 尿素；

N - (3 - クロロフェニル) - N' - (4 - { 3 - [5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) 尿素；

N - [3 , 5 - ビス (メチルオキシ) フェニル] - N ' - (4 - { 3 - [6 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) 尿素 ;

N - (4 - { 3 - [5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) - N' - { 4 - [(トリフルオロメチル) オキシ] フェニル } 尿素 ;

N - (4 - { 3 - [6 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) - N' - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素；

N - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - N ' - (4 - { 3 - [5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) 尿素；

N - (4 - { 3 - [5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) - N' - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素；

N - (4 - クロロフェニル) - N' - (4 - { 3 - [5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) 尿素；

N - (3 , 5 - ジフルオロフェニル) - N' - (4 - { 3 - [5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) 尿素 ;

N - [3 - (メチルオキシ) フェニル] - N' - (4 - { 3 - [5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) 尿素 ;

N - (3 - フルオロフェニル) - N' - (4 - { 3 - [5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) 尿素；

N - (4 - フルオロフェニル) - N' - (4 - { 3 - [5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) 尿素；

N - (3 - シアノフェニル) - N' - (4 - { 3 - [6 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) 尿素；

N - (3 , 4 - ジフルオロフェニル) - N' - (4 - { 3 - [5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) 尿素 ;

N - [3 , 4 - ビス (メチルオキシ) フェニル] - N ' - (4 - { 3 - [5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) 尿素 ;

N - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - N' - (4 - { 3 - [6 - (4 - エチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) 尿素 ;

N - { 4 - [3 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] フェニル } - N ' - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素 ;

N - { 4 - [3 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] フェニル } - N ' - [2 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素 ;

N - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - N ' - (4 - { 3 - [5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) 尿素 ;

N - { 4 - [3 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] フェニル } - N ' - フェニル尿素 ;

N - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] - N ' - (4 - { 3 - [5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) 尿素 ;

N - (2 - フルオロフェニル) - N ' - (4 - { 3 - [5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) 尿素 ;

N - (5 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) - N ' - (4 - { 3 - [6 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) 尿素 ;

N - (4 - { 3 - [5 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) - N ' - フェニル尿素 ;

{ 4 - [3 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] フェニル } カルバミン酸 1 , 1 - ジメチルエチル ;

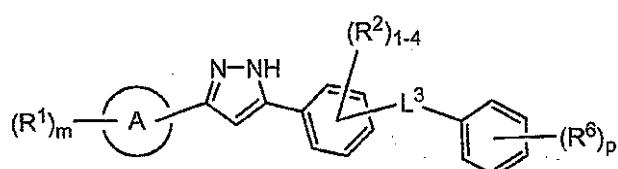
N - (1 , 1 - ジメチルエチル) - N ' - (4 - { 3 - [5 - (4 - エチルピペラジン - 1 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 5 - イル } フェニル) 尿素 ; および

4 - [3 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] アニリン。

【請求項 27】

式 V I である、請求項 25 に記載の化合物、

【化 9】



VI

ここで、R¹、R² および R⁶ の各々は、別個に、-H、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、-CN、-NO₂、-OR³、-N(R³)R³、-S(O)_{0~2}R³、-N(R³)C(=O)N(R³)R³、-N(R³)C(=O)C(=O)N(R³)R³、-SO₂N(R³)R³、-CO₂R³、-C(=O)N(R³)R³、-C(=NR⁵)N(R³)R³、-C(=NR⁵)R³、-N(R³)SO₂R³、-N(R³)C(O)R³、-N(R³)C(O)₂R³、-NCO₂R³、-C(=O)R³、必要に応じて置換したアルコキシ、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したアリール、必要に応じて置換したシクロアルキル、および必要に応じて置換した低級アルキルから選択される；p は、1~5 である；A は、ラジカルであり、該ラジカルは、フェニル、ベンゾチオフェニル、ピリジル、ピラジニル、ベンゾフラニル、ベンゾイミダゾリル、およびインドリルから選択される；そして、L³ は、存在しない、-(CH₂)_{0~1}N(R³)C(=O)N(R³) - 、-

$N(R^3)C(=S)N(R^3)R^3$ 、 $-N(R^3)C(=O)N(R^3)(CH_2)_0$
 $\sim_1 -$ 、 $- (CH_2)_0 \sim_1 N(R^3)C(=O) -$ 、 $-N(R^3)C(=O)(CH_2)_0$
 $)_0 \sim_1 -$ 、 $- (CH_2)_0 \sim_1 SO_2N(R^3) -$ 、 $-SO_2N(R^3)(CH_2)_0$
 $\sim_1 -$ 、 $- C(=NR^5)N(R^3) -$ 、 $- C(=NR^5) -$ 、 $- (CH_2)_0 \sim_1 N(R^3)CO_2 -$
 $R^3)CO_2 -$ 、 $-N(R^3)CO_2(CH_2)_0 \sim_1 -$ 、 $- C(=O) -$ 、 $- CO_2 -$
 $- (CH_2)_0 \sim_1 N(R^3)C(=NR^5)N(R^3) -$ および $- (CH_2)_0 \sim_1 N(R^3) -$ から選択される、

化合物。

【請求項 28】

以下からなる群から選択される、請求項 27 に記載の化合物：

$N - [4 - \text{クロロ} - 3 - (\text{トリフルオロメチル})\text{フェニル}] - N' - (4 - \{3 - [4 - (4 - \text{メチルピペラジン} - 1 - \text{イル})\text{フェニル}] - 1H - \text{ピラゾール} - 5 - \text{イル}\})\text{フェニル}$)尿素；

$N - (3, 4 - \text{ジメチルフェニル}) - N' - (4 - \{5 - [4 - (4 - \text{メチルピペラジン} - 1 - \text{イル})\text{フェニル}] - 1H - \text{ピラゾール} - 3 - \text{イル}\})\text{フェニル}$)尿素；

$N - [4 - \text{クロロ} - 3 - (\text{トリフルオロメチル})\text{フェニル}] - N' - (4 - \{3 - [4 - (4 - \text{エチルピペラジン} - 1 - \text{イル})\text{フェニル}] - 1H - \text{ピラゾール} - 5 - \text{イル}\})\text{フェニル}$)尿素；

$N - [5 - \text{クロロ} - 2 - (\text{メチルオキシ})\text{フェニル}] - N' - (4 - \{5 - [4 - (4 - \text{メチルピペラジン} - 1 - \text{イル})\text{フェニル}] - 1H - \text{ピラゾール} - 3 - \text{イル}\})\text{フェニル}$)尿素；

$N - (4 - \{5 - [4 - (4 - \text{メチルピペラジン} - 1 - \text{イル})\text{フェニル}] - 1H - \text{ピラゾール} - 3 - \text{イル}\})\text{フェニル} - N' - [4 - (\text{フェニルオキシ})\text{フェニル}]$)尿素；

$N - [4 - \text{クロロ} - 3 - (\text{トリフルオロメチル})\text{フェニル}] - N' - (4 - \{3 - [3 - (4 - \text{メチルピペラジン} - 1 - \text{イル})\text{フェニル}] - 1H - \text{ピラゾール} - 5 - \text{イル}\})\text{フェニル}$)尿素；

$N - (2, 4 - \text{ジフルオロフェニル}) - N' - (4 - \{3 - [4 - (4 - \text{メチルピペラジン} - 1 - \text{イル})\text{フェニル}] - 1H - \text{ピラゾール} - 5 - \text{イル}\})\text{フェニル}$)尿素；

$N - (2, 3 - \text{ジヒドロ} - 1, 4 - \text{ベンゾジオキシン} - 6 - \text{イル}) - N' - (4 - \{5 - [4 - (4 - \text{メチルピペラジン} - 1 - \text{イル})\text{フェニル}] - 1H - \text{ピラゾール} - 3 - \text{イル}\})\text{フェニル}$)尿素；

$N - [2, 4 - \text{ビス}(\text{メチルオキシ})\text{フェニル}] - N' - (4 - \{5 - [4 - (4 - \text{メチルピペラジン} - 1 - \text{イル})\text{フェニル}] - 1H - \text{ピラゾール} - 3 - \text{イル}\})\text{フェニル}$)尿素；

$N - (4 - \{3 - [4 - (4 - \text{メチルピペラジン} - 1 - \text{イル})\text{フェニル}] - 1H - \text{ピラゾール} - 5 - \text{イル}\})\text{フェニル} - N' - (2 - \text{フェニルエチル})\text{エタンジアミド}$ ；

$N - [4 - \text{クロロ} - 3 - (\text{トリフルオロメチル})\text{フェニル}] - N' - [4 - (3 - \text{フェニル} - 1H - \text{ピラゾール} - 5 - \text{イル})\text{フェニル}]$)尿素；

$4 - ((E) - 2 - \{3 - [4 - (4 - \text{メチルピペラジン} - 1 - \text{イル})\text{フェニル}] - 1H - \text{ピラゾール} - 5 - \text{イル}\})\text{エテニル}$)フェノール；

$N - (5 - \text{フルオロ} - 2 - \text{メチルフェニル}) - N' - (4 - \{5 - [4 - (4 - \text{メチルピペラジン} - 1 - \text{イル})\text{フェニル}] - 1H - \text{ピラゾール} - 3 - \text{イル}\})\text{フェニル}$)尿素；

$4 - \{(E) - 2 - [3 - (4 - \text{クロロフェニル}) - 1H - \text{ピラゾール} - 5 - \text{イル}] \text{エテニル}\}$)フェノール；

$4 - \{(E) - 2 - [3 - (5 - \text{クロロ} - 1 - \text{ベンゾフラン} - 2 - \text{イル}) - 1H - \text{ピラゾール} - 5 - \text{イル}] \text{エテニル}\}$)フェノール；

$4 - [(E) - 2 - (3 - \text{ピリジン} - 4 - \text{イル} - 1H - \text{ピラゾール} - 5 - \text{イル}) \text{エテニル}] \text{フェノール}$ ；

$4 - \{(E) - 2 - [3 - (3 - \text{クロロフェニル}) - 1H - \text{ピラゾール} - 5 - \text{イル}] \text{エテニル}\}$)フェノール；

2 - (5 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール；および

N - フェニル - N' - [4 - (3 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) フェニル] 尿素。

【請求項 29】

A がフェニルであるとき、L³ が、-N(R³)C(=O)N(R³) - である、請求項 27 に記載の化合物。

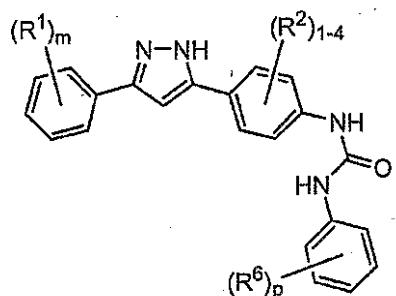
【請求項 30】

A が、フェニルまたはベンゾイミダゾリルのいずれかである、請求項 29 に記載の化合物。

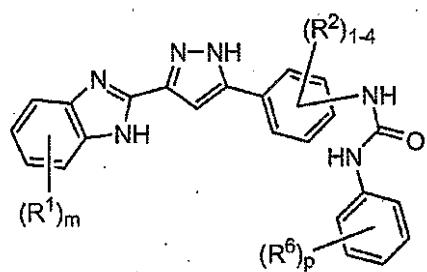
【請求項 31】

式 V I I a または式 V I I b のいずれかである、請求項 30 に記載の化合物：

【化 10】



VIIa



VIIb

ここで、R¹ は、-H、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、-CN、-NO₂、-OR³、-N(R³)R³、-S(O)_{0~2}R³、-CO₂R³、-C(=O)N(R³)R³、-N(R³)SO₂R³、-N(R³)C(O)R³、-N(R³)C(O)₂R³、-NCO₂R³、-C(=O)R³、必要に応じて置換したアルコキシ、必要に応じて置換したヘテロシクリル、必要に応じて置換したヘテロアリール、必要に応じて置換したシクロアルキル、必要に応じて置換したアリール、および必要に応じて置換した低級アルキルから選択される；m は、1 ~ 5 である；R² は、-H、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、-CN、-NO₂、-OR³、-N(R³)R³、および必要に応じて置換した低級アルキルから選択される；R⁶ は、-H、ハロゲン、ハロアルキル、-CN、-NO₂、-OR³、-N(R³)R³、-S(O)_{0~2}R³、-N(R³)C(=O)N(R³)R³、-N(R³)SO₂R³、-N(R³)C(O)R³、-NCO₂R³、-C(=O)R³、必要に応じて置換したアルコキシ、必要に応じて置換したヘテロシクリル、および必要に応じて置換した低級アルキルから選択される；p は、1 ~ 5 である、

化合物。

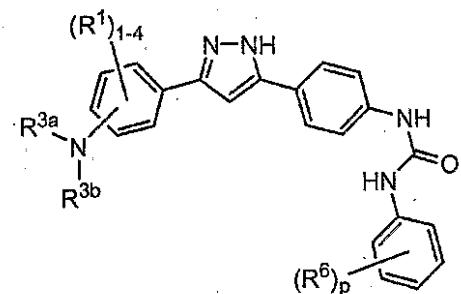
【請求項 32】

V I I b における前記フェニル尿素が、前記ピラゾール部分に対して、メタ位またはパラ位のいずれかにある、請求項 31 に記載の化合物。

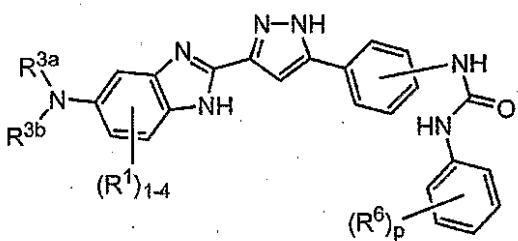
【請求項 33】

式 V I I c または式 V I I d のいずれかである、請求項 32 に記載の化合物、

【化11】



VIIc



VIId

ここで、 R^1 は、 - H、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、- CN、- NO₂、- OR³、- N(R³)R³、- S(O)_{0~2}R³、- CO₂R³、- C(=O)N(R³)R³、- N(R³)SO₂R³、- N(R³)C(O)R³、- N(R³)C(O)₂R³、- NCO₂R³、- C(=O)R³、必要に応じて置換したアルコキシ、必要に応じて置換したヘテロシクリル、および必要に応じて置換した低級アルキルから選択される； R^{3a} および R^{3b} は、それぞれ別個に、- H および必要に応じて置換した低級アルキルから選択される；または、 R^{3a} および R^{3b} は、それらが結合する窒素と一緒にになって、組み合わされ、必要に応じて置換したヘテロアリシクリルを形成でき、該ヘテロアリシクリルは、1個と2個の間の追加ヘテロ原子を含有する； R^6 は、- H、ハロゲン、ハロアルキル、- CN、- NO₂、- OR³、- N(R³)R³、- S(O)_{0~2}R³、- N(R³)C(=O)C(=O)N(R³)R³、- CO₂R³、- C(=O)N(R³)R³、- N(R³)SO₂R³、- N(R³)C(O)R³、- NCO₂R³、- C(=O)R³、必要に応じて置換したアルコキシ、必要に応じて置換したヘテロシクリル、および必要に応じて置換した低級アルキルから選択される；そして、 p は、1~5である； p は、1~5である、

化合物。

【請求項34】

VIIcについて、- N(R^{3a})R^{3b}が、前記ピラゾール部分に対して、メタ位またはパラ位のいずれかにある；そしてVIIdにおける前記フェニル尿素が、該ピラゾール部分に対して、メタ位またはパラ位のいずれかにある、請求項33に記載の化合物。

【請求項35】

表3：

【化12】

表3

エントリ	名称	構造
1	4-((E)-2-[3-[6-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]エテニル)フェノール	
2	N-[4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-N'-(4-[3-[5-(4-エチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
3	N-(3-エチルフェニル)-N'-(4-[3-[5-(4-エチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
4	N-(4-[3-[5-(4-エチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)-N'-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)尿素	
5	N-(3-アセチルフェニル)-N'-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
6	N-(3,4-ジクロロフェニル)-N'-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	

【化13】

表3

エントリ	名称	構造
7	N-(3-ブロモフェニル)-N'-(4-[3-[6-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
8	N-[4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-N'-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
9	N-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)-N'-[4-(フェニルオキシ)フェニル]尿素	
10	N-(3-クロロフェニル)-N'-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
11	N-[3,5-ビス(メチルオキシ)フェニル]-N'-(4-[3-[6-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
12	N-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)-N'-[4-(トリフルオロメチル)オキシ]フェニル)尿素	
13	N-(4-[3-[6-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)-N'-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]尿素	

【化14】

表3

エントリ	名称	構造
14	N-[4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-N'-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
15	N-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)-N'-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]尿素	
16	N-[4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-N'-(4-[3-[4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
17	N-(3,4-ジメチルフェニル)-N'-(4-[3-[4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]-1H-ピラゾル-3-イル]フェニル)尿素	
18	N-(4-クロロフェニル)-N'-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
19	N-(3,5-ジフルオロフェニル)-N'-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
20	N-[3-(メチルオキシ)フェニル]-N'-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	

【化15】

表3

エントリ	名称	構造
21	N-[4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-N'-(4-[3-[4-(4-エチルピペラジン-1-イル)フェニル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
22	N-(3-フルオロフェニル)-N'-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
23	N-(4-フルオロフェニル)-N'-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
24	N-(3-シアノフェニル)-N'-(4-[3-[6-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
25	N-(3,4-ジフルオロフェニル)-N'-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
26	N-[3,4-ビス(メチルオキシ)フェニル]-N'-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
27	N-[5-クロロ-2-(メチルオキシ)フェニル]-N'-(4-[5-[4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]-1H-ピラゾル-3-イル]フェニル)尿素	

【化16】

表3

エントリ	名称	構造
28	N-(4-[5-[4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]-1H-ピラゾル-3-イル]フェニル)-N'-[4-(フェニルオキシ)フェニル]尿素	
29	N-(2,4-ジフルオロフェニル)-N'-(4-[3-[6-(4-エチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
30	N-[4-[3-(1H-ベンズイミダゾル-2-イル)-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル]-N'-[4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]尿素	
31	N-[4-[3-(1H-ベンズイミダゾル-2-イル)-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル]-N'-[2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]尿素	
32	N-(2,4-ジフルオロフェニル)-N'-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
33	N-[4-[3-(1H-ベンズイミダゾル-2-イル)-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル]-N'-フェニル尿素	
34	N-[3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル]-N'-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	

【化17】

表3

エントリ	名称	構造
35	N-(2-フルオロフェニル)-N'-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
36	4-((E)-2-[5-[(E)-2-フェニルエテニル]-1H-ピラゾル-3-イル]エテニル)フェノール	
37	2-(メチルオキシ)-4-((E)-2-[5-[(E)-2-フェニルエテニル]-1H-ピラゾル-3-イル]エテニル)フェノール	
38	N-(5-フルオロ-2-メチルフェニル)-N'-(4-[3-[6-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	
39	N-(4-[3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)-N'-フェニル尿素	
40	N-[4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-N'-(4-[3-[4-メチルピペラジン-1-イル]フェニル]-1H-ピラゾル-5-イル)フェニル)尿素	
41	N-(2,4-ジフルオロフェニル)-N'-(4-[3-[4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	

【化18】

表3

エントリ	名称	構造
42	N-(2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル)-N'-(4-[5-[4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]-1H-ピラゾル-3-イル]フェニル)尿素	
43	N-[2,4-ビス(メチルオキシ)フェニル]-N'-(4-[5-[4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]-1H-ピラゾル-3-イル]フェニル)尿素	
44	4-((E)-2-[3-[(E)-2-(4-フルオロフェニル)エテニル]-1H-ピラゾル-5-イル]エテニル)-2-(メチルオキシ)フェノール	
45	4-[(E)-2-[3-(1-ベンゾフラン-2-イル)-1H-ピラゾル-5-イル]エテニル]フェノール	
46	N-(4-[3-[4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)-N'-(2-フェニルエチル)エタンジアミド	
47	4-[(E)-2-[3-(1H-ベンズイミダゾル-2-イル)-1H-ピラゾル-5-イル]エテニル]フェノール	
48	4-((E)-2-[3-[(E)-2-(4-クロロフェニル)エテニル]-1H-ピラゾル-5-イル]エテニル)-2-(メチルオキシ)フェノール	

【化19】

表3

エントリ	名称	構造
49	4-[(E)-2-[3-(1-ベンゾチエン-2-イル)-1H-ピラゾル-5-イル]エテニル]フェノール	
50	N-[4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-N'-[4-(3-フェニル-1H-ピラゾル-5-イル)フェニル]尿素	
51	4-((E)-2-[3-[4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]-1H-ピラゾル-5-イル]エテニル)フェノール	
52	1,1-ジメチルエチル[4-[3-(1H-ベンズイミダゾル-2-イル)-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル]カルバメート	
53	N-(5-フルオロ-2-メチルフェニル)-N'-(4-[5-[4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]-1H-ピラゾル-3-イル]フェニル)尿素	
54	4-[(E)-2-(3-フェニル-1H-ピラゾル-5-イル)エテニル]フェノール	
55	2-(メチルオキシ)-4-[(E)-2-(5-フェニル-1H-ピラゾル-3-イル)エテニル]フェノール	
56	4-[(E)-2-(5-ナフタレン-2-イル-1H-ピラゾル-3-イル)エテニル]フェノール	

【化 2 0】

表 3

エントリ	名称	構造
57	4-[(E)-2-[5-(2-フルオロフェニル)-1H-ピラゾル-3-イル]エテニル]フェノール	
58	4-((E)-2-[3-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル]-1H-ピラゾル-5-イル]エテニル)フェノール	
59	4-((E)-2-[3-[(E)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)エテニル]-1H-ピラゾル-5-イル]エテニル)-2-(メチルオキシ)フェノール	
60	4-[(E)-2-[5-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾル-3-イル]エテニル]フェノール	
61	4-[(E)-2-[3-(4-クロロフェニル)-1H-ピラゾル-5-イル]エテニル]フェノール	
62	4-[(E)-2-(5-ピリジン-2-イル-1H-ピラゾル-3-イル)エテニル]フェノール	
63	4-[(E)-2-[3-(5-クロロ-1-ベンゾフラン-2-イル)-1H-ピラゾル-5-イル]エテニル]フェノール	
64	N-(1,1-ジメチルエチル)-N'-(4-[3-[5-(4-エチルピペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-5-イル]フェニル)尿素	

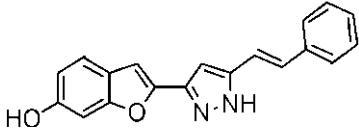
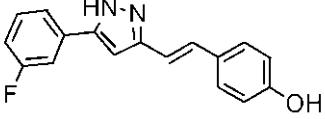
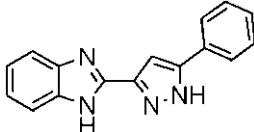
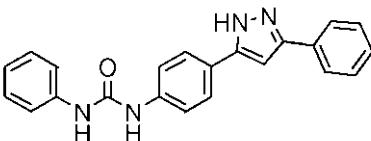
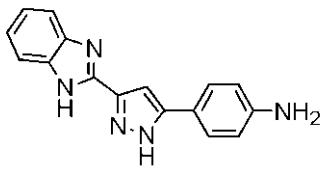
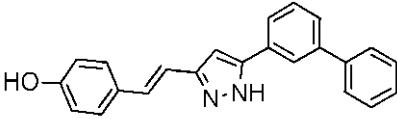
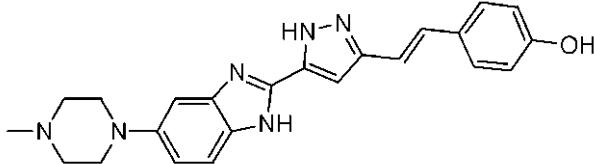
【化21】

表3

エントリ	名称	構造
65	4-[(E)-2-(3-ピリジン-4-イル-1H-ピラゾル-5-イル)エテニル]フェノール	
66	4-[(E)-2-[3-(3-クロロフェニル)-1H-ピラゾル-5-イル]エテニル]フェノール	
67	4-((E)-2-{5-[2-(メチルオキシ)フェニル]-1H-ピラゾル-3-イル}エテニル)フェノール	
68	4-[(E)-2-[3-(2-クロロフェニル)-1H-ピラゾル-5-イル]エテニル]フェノール	
69	4-[(E)-2-(3-ピリジン-3-イル-1H-ピラゾル-5-イル)エテニル]フェノール	
70	4-((E)-2-{5-[3-(メチルオキシ)フェニル]-1H-ピラゾル-3-イル}エテニル)フェノール	
71	1,1-ジメチルエチル(4-[(E)-2-フェニルエテニル]-1H-ピラゾル-5-イル)フェニルカルバメート	
72	4-[(E)-2-[3-(3,4-ジクロロフェニル)-1H-ピラゾル-5-イル]エテニル]フェノール	

【化22】

表3

エントリ	名称	構造
73	2-[5-[(E)-2-フェニルエテニル]-1H-ピラゾル-3-イル]-1-ベンズフラン-6-オール	
74	4-[(E)-2-[5-(3-フルオロフェニル)-1H-ピラゾル-3-イル]エテニル]フェノール	
75	2-(5-フェニル-1H-ピラゾル-3-イル)-1H-ベンズイミダゾール	
76	N-フェニル-N'-[4-(3-フェニル-1H-ピラゾル-5-イル)フェニル]尿素	
77	4-[3-(1H-ベンズイミダゾル-2-イル)-1H-ピラゾル-5-イル]アニリン	
78	4-[(E)-2-(5-ビフェニル-3-イル-1H-ピラゾル-3-イル)エテニル]フェノール	
79	4-((E)-2-[5-(4-メチルビペラジン-1-イル)-1H-ベンズイミダゾル-2-イル]-1H-ピラゾル-3-イル)エテニル)フェノール	

から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項36】

請求項1～35のいずれか1項に記載の化合物と、薬学的に受容可能なキャリアとを含有する、薬学的組成物。

【請求項37】

請求項1～35のいずれか1項に記載の化合物の代謝産物。

【請求項38】

キナーゼのインヒビ活性を調節するための組成物であって、請求項1～35のいずれかに記載の化合物の少なくとも1種の有効量および薬学的に受容可能なキャリアを含有する組成物。

【請求項39】

前記キナーゼが、c-Kintおよびf1t-3から選択される、請求項38に記載の組成物。

成物。

【請求項 4 0】

前記キナーゼのインビボ活性の調節が、該キナーゼの阻害を包含する、請求項 3 9 に記載の組成物。

【請求項 4 1】

制御できない異常および／または不要な細胞活性に関連した疾患または障害を処置するための組成物であって、請求項 1～35 のいずれかに記載の化合物の少なくとも 1 種の治療有効量および薬学的に受容可能なキャリアを含有する、組成物。

【請求項 4 2】

キナーゼのモジュレーターをスクリーニングする方法であって、請求項 1～35 のいずれかに記載の化合物の少なくとも 1 種と、少なくとも 1 種の候補試薬とを混ぜ合わせる工程、および該キナーゼの活性に対する候補試薬の効果を決定する工程を包含する、方法。

【請求項 4 3】

細胞または複数の細胞における増殖活性をインビトロで阻害する方法であって、該細胞または該複数の細胞に、請求項 1～35 のいずれかに記載の化合物の少なくとも 1 種の有効量を投与する工程を包含する、方法。