

【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 18 年 10 月 19 日 (2006.10.19)

【公表番号】 特表 2006-503033 (P2006-503033A)

【公表日】 平成 18 年 1 月 26 日 (2006.1.26)

【年通号数】 公開・登録公報 2006-004

【出願番号】 特願 2004-536098 (P2004-536098)

【国際特許分類】

C 0 7 D 235/26 (2006.01)

A 6 1 K 31/4184 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 7/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 39/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

C 0 7 D 405/06 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 235/26 C S P C

A 6 1 K 31/4184

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/496

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 7/08

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 9/08

A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	9/10	1 0 3
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	19/08	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/00	1 0 1
A 6 1 P	25/04	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	39/02	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
C 0 7 D	401/06	
C 0 7 D	405/06	

【手続補正書】

【提出日】平成18年9月4日(2006.9.4)

【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

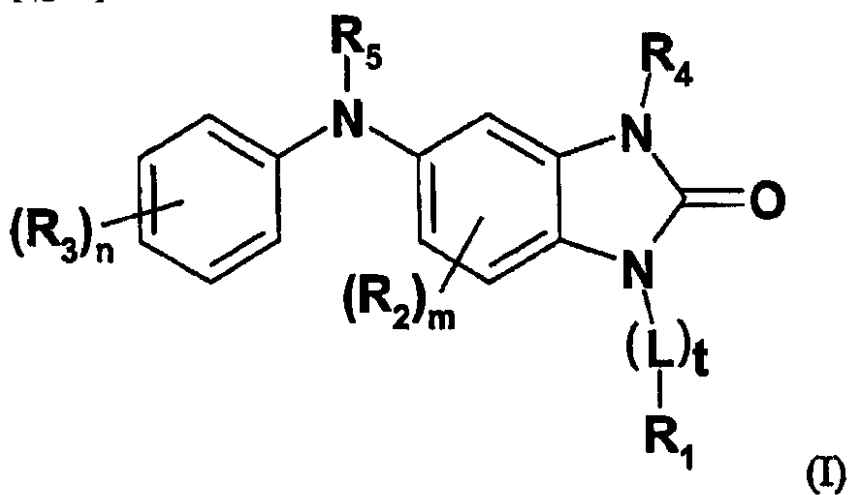
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の式(I)の化合物、それらの医薬的に許容可能な酸、塩又は異性体：

【化1】



(式中、m及びnが、独立して、0、1又は2であり；

tが、0～10であり；

Lが、場合により、アルキル又はアルコキシにより置換されていてもよい $-CH_2-$ であり；

R_1 が、アミノ、アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール及びヘテロ環より選ばれ、各々が、場合により、1～4つの R_a により置換されていてもよく；

R_2 が、モノー又はジールキルアミノ、アルキルチオ、アルコキシ、 C_{3-7} シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール及びヘテロ環より選ばれ、各々が、場合により、1～4つの R_b により置換されていてもよく；

R_a 及び R_b の各々が、独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アリールアルキル、アリールオキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アシル、アルコキシカルボニル、アシルオキシ、アシルアミノ、スルホニルアミノ、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、カルボキシ、カルボキサミド、ヒドロキシ、オキソ、ハロゲン、トリフルオロメチル、ニトロ、ニトリル及びアミノ又はグアニジノより選ばれ、各々が、場合により、アルキル、アシル又はアルコキシカルボニルによりモノー又はジー置換されていてもよく、上記 R_a 及び R_b のいずれかが、場合により、可能であればハロゲン化されていてもよく；

各 R_3 が、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、アルールアルキル、アリールオキシ、アルコキシ、アルキルチオ、アシル、アルコキシカルボニル、アシルオキシ、アシルアミノ、スルホニルアミノ、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、カルボキシ、カルボキサミド、ヒドロキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、ニトロ、ニトリル及び場合により、アルキル、アシル又はアルコキシカルボニルによりモノー又はジー置換されていてもよいアミノより選ばれ、上記 R_3 のいずれかが、場合により、可能であればハロゲン化されていてもよく；及び

R_4 及び R_5 が、独立して、水素及び C_{1-3} アルキルより選ばれる）。

【請求項2】

tが、0～5であり；

Lが、場合により、メチル、エチル又はプロピルにより置換されていてもよい $-CH_2-$ であり；

R_1 が、アミノ、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル、インダニル、インデニル、フェニルナフチル、チエニル、フラニル、イソキサゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピラゾリル、ピロリル、イミダゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピラニル、キノキサリニル、インドリル、ベンズイミダゾリル、ベンズオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾチエニル、キノリニル、キナゾリニル及びインダゾリルより選ばれるヘテロアリール、及びアジリジニル、ピロリジニル、ピロリニル、モルホリニル、チオモルホリニル、テトラヒドロフラニル、ジオキサラニル、ピラニル、ペペリジニル及びピペラジニルより選ばれるヘテロ環より選ばれ、各々が、場合により、1～3つの R_a により置換されていてもよく；

R_2 が、モノー又はジールキルアミノ、 C_{1-5} アルキルチオ、 C_{1-5} アルコキシ、 C_{3-7} シクロアルキル、アリール、チエニル、フラニル、イソキサゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピラゾリル、ピロリル、イミダゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピラニル、キノキサリニル、インドリル、ベンズイミダゾリル、ベンズオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾチエニル、キノリニル、キナゾリニル及びインダゾリルより選ばれるヘテロアリール、及びアジリジニル、ピロリジニル、ピロリニル、モルホリニル、チオモルホリニル、テトラヒドロフラニル、ジオキサラニル、ピラニル、ペペリジニル及びピペラジニルより選ばれるヘテロ環より選ばれ、各々が、場合により、1～3つの R_b により置換されていてもよく；

R_a 及び R_b の各々が、独立して、 C_{1-5} アルキル、 C_{2-5} アルケニル、 C_{2-5} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、アリールオキシ、 C_{1-5} アルコキシ、 C_{1-5} アルキルチオ、 C_{1-5} アシル、 C_{2-7} アルコキシカルボニル、 C_{1-5} アシルオキシ、 C_{1-5} アシルアミノ、スルホニルアミノ、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、カルボキシ、カルボキサミド、ヒドロキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、ニトロ、ニト

リル及び場合により、 C_{1-5} アルキル、 C_{1-5} アシル又は C_{2-7} アルコキシカルボニルによりモノー又はジー置換されていてもよいアミノより選ばれ、上記 R_a 及び R_b のいずれかが、場合により、可能であればハロゲン化されていてもよく；

各 R_3 が、水素、 C_{1-5} アルキル、 C_{2-5} アルケニル、 C_{2-5} アルキニル、 C_{1-5} アルコキシ、 C_{1-5} アルキルチオ、 C_{1-5} アシル、 C_{2-7} アルコキシカルボニル、 C_{1-5} アシルオキシ、 C_{1-5} アシルアミノ、スルホニルアミノ、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、カルボキシ、カルボキサミド、ヒドロキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、ニトロ、ニトリル及び場合により、 C_{1-5} アルキル、 C_{1-5} アシル又は C_{2-7} アルコキシカルボニルによりモノー又はジー置換されていてもよいアミノより選ばれ、上記 R_3 のいずれかが、場合により、可能であればハロゲン化されていてもよく；及び

R_4 及び R_5 が、独立して、水素及びメチルより選ばれる、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

m が、0又は1であり；

n が、0、1又は2であり；

t が、0～3であり；

L が、場合により、メチルにより置換されていてもよい $-CH_2-$ であり；

R_1 が、 C_{3-6} アルキル、アミノ、 C_{3-7} シクロアルキル、インダニル、インデニル、フェニル、ナフチル、イソキサゾリル、オキサゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピラゾリル、ピロリル、イミダゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、キノキサリニル、インドリル、ベンズイミダゾリル、ベンズオキサゾリル、ベンズチアジアゾリル、キノリニル、キナゾリニル及びインダゾリルより選ばれるヘテロアリール、及びピロリジニル、ピロリニル、モルホリニル、チオモルホリニル、テトラヒドロフラニル、ジオキサラニル、テトラヒドロピラニル、ピペリジニル及びピペラジニルより選ばれるヘテロ環より選ばれ、各々が、場合により、1～2つの R_a により置換されていてもよく；

R_2 が、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル及びピリダジニルより選ばれるヘテロアリール、及びモルホリニル、チオモルホリニル、ピラニル、ピペリジニル及びピペラジニルより選ばれるヘテロ環より選ばれ、各々が、場合により、1～2つの R_b により置換されていてもよく；

R_a 及び R_b の各々が、独立して、 C_{1-5} アルキル、アリールオキシ、 C_{1-5} アルコキシ、 C_{1-5} アルキルチオ、 C_{1-5} アシル、 C_{2-7} アルコキシカルボニル、 C_{1-5} アシルオキシ、 C_{1-5} アシルアミノ、スルホニルアミノ、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、カルボキシ、カルボキサミド、ヒドロキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、ニトロ、ニトリル及び場合により、 C_{1-5} アルキル、 C_{1-5} アシル又は C_{2-7} アルコキシカルボニルによりモノー又はジー置換されていてもよいアミノより選ばれ、上記 R_a 及び R_b のいずれかが、場合により、可能であればハロゲン化されていてもよく；

各 R_3 が、 C_{1-5} アルキル、 C_{1-5} アルコキシ、 C_{1-5} アルキルチオ、 C_{1-5} アシル、 C_{1-5} アシルアミノ、スルホニルアミノ、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、カルボキシ、カルボキサミド、ヒドロキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、ニトロ、ニトリル及び場合により、 C_{1-3} アルキルによりモノー又はジー置換されていてもよいアミノより選ばれ、上記 R_3 のいずれかが、場合により、可能であればハロゲン化されていてもよく；

R_4 が、水素であり；及び

R_5 が、水素又はメチルである、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

t が、0～2であり；

R_1 が、 C_{4-6} アルキル、アミノ、 C_{5-7} シクロアルキル、インダニル、インデニル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピロリジニル、ピロリニル、テトラヒドロフラニル、ピペリジニル及びジオ

キサランルより選ばれ、各々は、場合により、1～2つの R_a により置換されていてもよく；

R_2 が、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル及びピリダジニルより選ばれるヘテロアリール、及びモルホリニル、チオモルホリニル、ピラニル、ピペリジニル及びピペラジニルより選ばれるヘテロ環より選ばれ、各々が、場合により、 R_b により置換されていてもよく；

R_a 及び R_b の各々が、独立して、 C_{1-5} アルキル、アリールオキシ、 C_{1-5} アルコキシ、 C_{1-5} アルキルチオ、 C_{1-5} アシル、 C_{2-7} アルコキシカルボニル、 C_{1-5} アシルオキシ、 C_{1-5} アシルアミノ、スルホニルアミノ、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、カルボキシ、カルボキサミド、ヒドロキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、ニトロ、ニトリル及び場合により、 C_{1-5} アルキル、 C_{1-5} アシル又は C_{2-7} アルコキシカルボニルによりモノー又はジー置換されていてもよいアミノより選ばれ、上記 R_a 及び R_b のいずれかが、場合により、可能であればハロゲン化されていてもよく；

各 R_3 が、 C_{1-5} アルキル、 C_{1-5} アルコキシ、 C_{1-5} アルキルチオ、 C_{1-5} アシル、 C_{1-5} アシルアミノ、スルホニルアミノ、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、カルボキシ、カルボキサミド、ヒドロキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、ニトロ、ニトリル及び場合により、 C_{1-3} アルキルによりモノー又はジー置換されていてもよいアミノより選ばれ、上記 R_3 のいずれかが、場合により、可能であればハロゲン化されていてもよい、請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

t が、0又は1であり；

R_1 が、 C_4 アルキル、アミノ、 C_{5-6} シクロアルキル、インダニル、インデニル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ピリジニル、テトラヒドロフラニル及びピペリジニルより選ばれ、各々は、場合により、1～2つの R_a により置換されていてもよく；

R_2 が、モルホリニル、チオモルホリニル、ピラニル、ピペリジニル及びピペラジニルより選ばれ、各々が、場合により、 R_b により置換されていてもよく；

R_a 及び R_b の各々が、独立して、 C_{1-5} アルキル、 C_{1-5} アルコキシ、 C_{4-6} アルコキシカルボニル、ヒドロキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、ニトロ、ニトリル及びアミノより選ばれ、上記 R_a 及び R_b のいずれかが、場合により、可能であればハロゲン化されていてもよく；

各 R_3 が、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコキシ、ヒドロキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、ニトロ、ニトリル及びアミノより選ばれ、上記 R_3 のいずれかが、場合により、可能であればハロゲン化されていてもよい、請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

n が、1又は2であり；

m が、0であり；

R_1 が、アミノ、シクロヘキシル、インダニル、インデニル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ピリジニル、テトラヒドロフラニル及びピペリジニルより選ばれ、各々は、場合により、1～2つの R_a により置換されていてもよい、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

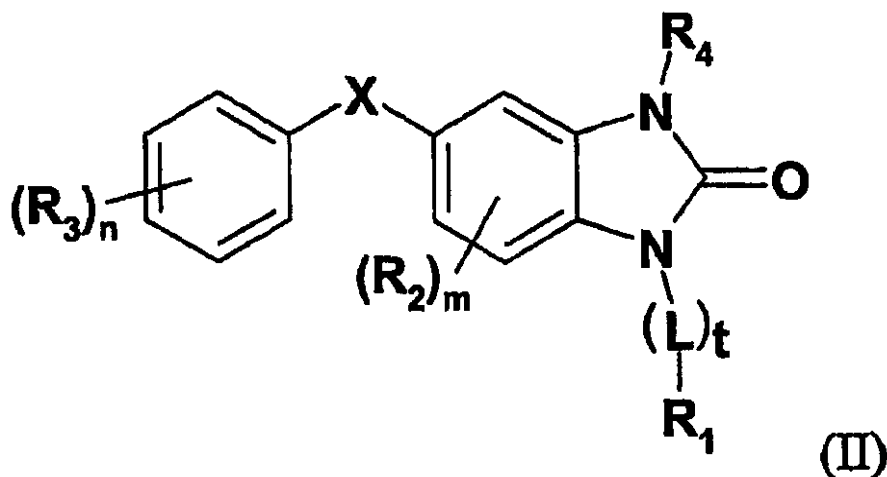
R_a 及び R_b の各々が、独立して、メチル、メトキシ、*tert*-ブトキシカルボニル、フッ素、トリフルオロメチル及びアミノより選ばれ；及び

各 R_3 が、メチル、メトキシ、フッ素、トリフルオロメチル及びアミノより選ばれる、請求項6に記載の化合物。

【請求項8】

以下の式 (I I) の化合物、それらの医薬的に許容可能な酸、塩又は異性体：

【化 2】



(式中、Xが、Oであり；

m及びnが、独立して0、1又は2であり；

tが、0又は1であり；

Lが、場合によりメチルにより置換されていてもよい-CH₂-であり；

R₁が、*tert*-ブチル、アミノ、シクロヘキシル及びフェニルより選ばれ、フェニルが、場合により、1～2つのR_aにより置換されていてもよい、

R₂が、モノー又はジ- C₁₋₅アルキルアミノ、C₁₋₅アルキルチオ、C₁₋₅アルコキシ、C₃₋₇シクロアルキル、アリール、チエニル、フラニル、イソキサゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピラゾリル、ピロリル、イミダゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピラニル、キノキサリニル、インドリル、ベンズイミダゾリル、ベンズオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾチエニル、キノリニル、キナゾリニル及びインダゾリルより選ばれるヘテロアリール、及びアジリジニル、ピロリジニル、ピロリニル、モルホリニル、チオモルホリニル、テトラヒドロフラニル、ジオキサラニル、ピラニル、ピペリジニル及びピペラジニルより選ばれるヘテロ環より選ばれ、各々が、場合により、1～3つのR_bにより置換されていてもよく；

各R_aが、C₁₋₅アルキル、メトキシ、*tert*-ブトキシカルボニル、フッ素、トリフルオロメチル及びアミノより選ばれ；

R_bの各々が、独立して、C₁₋₅アルキル、アリールオキシ、C₁₋₅アルコキシ、C₁₋₅アルキルチオ、C₁₋₅アシル、C₂₋₇アルコキシカルボニル、C₁₋₅アシルオキシ、C₁₋₅アシルアミノ、スルホニルアミノ、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、カルボキシ、カルボキサミド、ヒドロキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、ニトロ、ニトリル及び場合により、C₁₋₅アルキル、C₁₋₅アシル又はC₂₋₇アルコキシカルボニルによりモノー又はジ-置換されていてもよいアミノより選ばれ；

各R₃が、メチル、メトキシ、フッ素、トリフルオロメチル及びアミノより選ばれ；

R₄及びR₅が、水素である)。

【請求項 9】

Xが、Oであり；

各R_aが、メチル、メトキシ、*tert*-ブトキシカルボニル、フッ素、トリフルオロメチル及びアミノより選ばれ；及び

各R₃が、メチル及びフッ素より選ばれる、
請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

R₁が、シクロヘキシルである請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

R₂が、モノー又はジ- C₁₋₅アルキルアミノにより置換されているモノー又はジ- C₁₋₅アルキルアミノである請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

R_2 が、 C_{1-3} アルキルチオ又は C_{1-3} アルコキシより選ばれ、各々が、更に、モノー又はジ- C_{1-5} アルキルアミノにより置換されている請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】

1-シクロヘキシルメチル-5-フェニルアミノ-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

1-シクロヘキシルメチル-5-(3,5-ジクロロフェニルアミノ)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

5-(3-アミノ-4-メチルフェニルアミノ)-1-シクロヘキシルメチル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

1-シクロヘキシルメチル-5-(2-フルオロフェニルアミノ)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

1-シクロヘキシルメチル-5-(2-メトキシフェニルアミノ)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

1-シクロヘキシルメチル-5-(3-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

1-シクロヘキシルメチル-5-(4-フルオロフェニルアミノ)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

1-シクロヘキシルメチル-5-オトリルアミノ-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

1-シクロヘキシルメチル-5-(2,4-ジフルオロフェニルアミノ)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

1-シクロヘキシルメチル-5-(3-フルオロフェニルアミノ)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

1-シクロヘキシルメチル-5-(3,4-ジフルオロフェニルアミノ)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

1-フェニル-5-フェニルアミノ-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

1-シクロヘキシルメチル-6-(4-メチルピペラジン-1-イル)-5-フェニルアミノ-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

1-シクロヘキシルメチル-5-フェニルアミノ-6-ピペラジン-1-イル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

1-シクロペンチル-5-(2-フルオロフェニルアミノ)-6-(4-メチルピペラジン-1-イル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

1-シクロヘキシルメチル-5-(2-フルオロフェニルアミノ)-6-ピペラジン-1-イル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

1-シクロヘキシルメチル-6-(4-メチルピペラジン-1-イル)-5-オトリルアミノ-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

1-シクロヘキシルメチル-6-[(2-ジメチルアミノエチル)-メチルアミノ]-5-オトリルアミノ-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

1-シクロヘキシルメチル-6-[(3-ジメチルアミノプロピル)-メチルアミノ]-5-オトリルアミノ-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-ベンジル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(1-フェニルエチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(ピリジン-3-イルメチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(4-クロロベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(2,6-ジフルオロベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(2,4-ジクロロベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(2,3-ジクロロベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(3-メトキシベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(2,6-ジメトキシベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(3,5-ジメトキシベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(2,4-ジメトキシベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(2,3-ジメトキシベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(2,5-ジメトキシベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(2-メチルベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(3,5-ジメチルベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(3,4-ジメチルベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(2,3-ジメチルベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-[2-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-[3-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(2-フェニルエチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(2-ピリジン-2-イルエチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(2-ピリジン-3-イルエチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(2-ピリジン-4-イルエチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(2-チエン-2-イルエチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-[3-(1H-イミダゾール-1-イル)プロピル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-[3-(2-オキソピロリジン-1-イル)プロピル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(2-メトキシエチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

エチル3-(5-アニリノ-2-オキソ-2-,3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)ブタノエート;

5-アニリノ-1-tert-ブチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(1-2-ジメチルプロピル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-ブチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-ペンチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-ヘキシル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(シクロプロピルメチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(1-シクロヘキシルエチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-シクロペンチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(4-メチルシクロヘキシル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-[2-(ジメチルアミノ)エチル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(2-モルホリン-4-イルエチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(2-ピロリジン-1-イルエチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(2-ピペリジン-1-イルエチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

tert-ブチル2-(5-アニリノ-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)エチルカルバメート;

5-アニリノ-1-(3-メトキシプロピル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-[3-(ジメチルアミノ)プロピル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-[3-(4-メチルピペラジン-1-イル)プロピル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(3-モルホリン-4-イルプロピル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-[(1-エチルピロリジン-2-イル)メチル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-[2-(1-メチルピロリジン-2-イル)エチル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

及び

エチル4-(5-アニリノ-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)ピペリジン-1-カルボキシレート

からなる群から選ばれる化合物、それらの医薬的に許容可能な酸、塩又は異性体。

【請求項14】

1-シクロヘキシルメチル-5-p-トリルアミノ-1,3-ジヒドロ-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(1-メチル-1-フェニルエチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(1-ナフチルメチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(ピリジン-2-イルメチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(ピリジン-4-イルメチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(2-プロモベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(3-クロロベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(3,5-ジクロロベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(3,4-ジクロロベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(2,5-ジクロロベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(2-メトキシベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(4-メトキシベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(3,4-ジメトキシベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(3-メチルベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(4-メチルベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(2,4-ジメチルベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(2,5-ジメチルベンジル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(チエン-2-イルメチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(2-フリルメチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-[4-(メチルスルホニル)ベンジル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

4-[(5-アニリノ-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)メチル]ベンゼンスルホンアミド;

5-アニリノ-1-[4-(ジメチルアミノ)ベンジル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(1,1'-ビフェニル-3-イルメチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

メチル4-[(5-アニリノ-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)メチル]ベンゾエート;

5-アニリノ-1-(1H-イミダゾール-4-イルメチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-テトラヒドロフラン-3-イル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(2-オキソテトラヒドロフラン-3-イル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
メチル2-(5-アニリノ-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)プロパノエート;
5-アニリノ-1-イソブチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(3-メチルブチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
メチル(5-アニリノ-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)アセテート;
2-(5-アニリノ-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)アセトアミド;
5-アニリノ-1-(2-オキソアゼパン-3-イル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
(5-アニリノ-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)アセトニトリル;
3-(5-アニリノ-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール-1-イル)プロパンニトリル;
5-アニリノ-1-(2-オキソ-2-フェニルエチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-[2-(1H-イミダゾール-4-イル)エチル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-[3-(1H-イミダゾール-4-イル)プロピル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
1-シクロヘキシルメチル-6-[4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンズイミダゾール-1-イル)-ピペリジン-1-イル]-5-フェニルアミノ-1,3-ジヒドロ-ベンズイミダゾール-2-オン;
8-[6-アニリノ-3-(シクロヘキシルメチル)-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール-5-イル]-1-フェニル-1,3,8-トリアザスピロ[4.5]デカン-4-オン;
3-[[6-アニリノ-3-(シクロヘキシルメチル)-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール-5-イル](メチル)アミノ]プロパンニトリル;
5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-[4-(ピペリジン-1-イルメチル)ピペリジン-1-イル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-[シクロヘキシル(メチル)アミノ]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-(4-シクロヘキシルピペラジン-1-イル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-(1,3-チアゾリジン-3-イル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
2-{4-[6-アニリノ-3-(シクロヘキシルメチル)-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール-5-イル]ピペラジン-1-イル}-N-イソプロピルアセトアミド;
5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-ピロリジン-1-イル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-(4-フェニルピペラジン-1-イル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-[4-(2-メトキシフェニル)ピ

ペラジン-1-イル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
 5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-(1,4-ジオキサ-8-アザスピ
 ロ[4.5]デカ-8-イル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
 エチル4-[6-アニリノ-3-(シクロヘキシルメチル)-2-オキソ-2,3-ジヒ
 ドロ-1H-ベンズイミダゾール-5-イル]ピペラジン-1-カルボキシレート;
 5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-(4-メチルピペラジン-1-イル
)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
 5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-(4-ピリジン-4-イルピペラジ
 ン-1-イル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
 5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-チオモルホリン-4-イル-1,3-
 ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
 5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-{4-[2-(ジメチルアミノ)エチ
 ル]ピペラジン-1-イル}-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
 5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-ピペリジン-1-イル-1,3-ジ
 ヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
 5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-{4-[3-(ジメチルアミノ)プロ
 ピル]ピペラジン-1-イル}-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン
 ;
 6-{4-[2-(アミノオキシ)エチル]ピペラジン-1-イル}-5-アニリノ-1-(
 シクロヘキシルメチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
 5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-(2,6-ジメチルピペリジン-1-
 イル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
 1-[6-アニリノ-3-(シクロヘキシルメチル)-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1
 H-ベンズイミダゾール-5-イル]-N,N-ジエチルピペリジン-3-カルボキサミド
 ;
 エチル1-[6-アニリノ-3-(シクロヘキシルメチル)-2-オキソ-2,3-ジヒド
 ロ-1H-ベンズイミダゾール-5-イル]ピペリジン-3-カルボキシレート;
 1-[6-アニリノ-3-(シクロヘキシルメチル)-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1
 H-ベンズイミダゾール-5-イル]ピペリジン-3-カルボキサミド;
 5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-(3-メチルピペリジン-1-イル
)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
 エチル1-[6-アニリノ-3-(シクロヘキシルメチル)-2-オキソ-2,3-ジヒド
 ロ-1H-ベンズイミダゾール-5-イル]ピペリジン-4-カルボキシレート;
 5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-(4-メチルピペリジン-1-イル
)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
 5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-(4-ピリジン-2-イルピペラジ
 ン-1-イル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
 5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-[メチル(2-ピリジン-2-ルエ
 チル)アミノ]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
 5-アニリノ-6-(1,4'-ビペリジン-1'-イル)-1-(シクロヘキシルメ
 チル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
 5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-[メチル(1-メチルピペリジン-
 4-イル)アミノ]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
 5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-(ジメチルアミノ)-1,3-ジヒ
 ドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
 6-[アリル(メチル)アミノ]-5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-1,3-
 ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
 5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-(2,2-ジメチル-1,3-チアゾ
 リジン-3-イル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;
 5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-[[2-(ジメチルアミノ)エチル]

(メチル) アミノ] - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンズイミダゾール - 2 - オン ;
5 - アニリノ - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 6 - [メチル (2 - ピリジン - 4 - イル
エチル) アミノ] - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンズイミダゾール - 2 - オン ;
6 - (4 - アセチルピペラジン - 1 - イル) - 5 - アニリノ - 1 - (シクロヘキシルメチル)
- 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンズイミダゾール - 2 - オン ;
N - {1 - [6 - アニリノ - 3 - (シクロヘキシルメチル) - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒド
ロ - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル]ピロリジン - 3 - イル} - N - メチルアセトア
ミド ;
5 - アニリノ - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 6 - [メチル (1 - メチルピロリジン -
3 - イル) アミノ] - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンズイミダゾール - 2 - オン ;
5 - アニリノ - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 6 - (4 - メチル - 1, 4 - ジアゼパン
- 1 - イル) - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンズイミダゾール - 2 - オン ;
5 - アニリノ - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 6 - (4 - エチルピペラジン - 1 - イル
) - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンズイミダゾール - 2 - オン ;
5 - アニリノ - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 6 - [(2 R) - 2 - (メトキシメチル
) ピロリジン - 1 - イル] - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンズイミダゾール - 2 - オン ;
t e r t - ブチル 4 - [6 - アニリノ - 3 - (シクロヘキシルメチル) - 2 - オキソ - 2,
3 - ジヒドロ - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル]ピペラジン - 1 - カルボキシレー
ト ;
6 - [アリル (シクロペンチル) アミノ] - 5 - アニリノ - 1 - (シクロヘキシルメチル)
- 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンズイミダゾール - 2 - オン ;
メチル 1 - [6 - アニリノ - 3 - (シクロヘキシルメチル) - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒド
ロ - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル]ピペリジン - 4 - カルボキシレート ;
5 - アニリノ - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 6 - [(3 R) - 3 - (ジメチルアミノ
) ピロリジン - 1 - イル] - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンズイミダゾール - 2 - オン ;
5 - アニリノ - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 6 - [(3 S) - 3 - (ジメチルアミノ
) ピロリジン - 1 - イル] - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンズイミダゾール - 2 - オン ;
1 - [6 - アニリノ - 3 - (シクロヘキシルメチル) - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1
H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - D - プロリンアミド ;
5 - アニリノ - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 6 - [4 - (3, 5 - ジクロロピリジン -
4 - イル) ピペラジン - 1 - イル] - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンズイミダゾール - 2 -
オン ;
1 - [6 - アニリノ - 3 - (シクロヘキシルメチル) - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1
H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 1 H - ピロール - 2 - カルボニトリル ;
6 - (4 - アセチル - 1, 4 - ジアゼパン - 1 - イル) - 5 - アニリノ - 1 - (シクロヘ
キシルメチル) - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンズイミダゾール - 2 - オン ;
3 - {4 - [6 - アニリノ - 3 - (シクロヘキシルメチル) - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒド
ロ - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル]ピペラジン - 1 - イル}ピラジン - 2 - カルボ
ニトリル ;
5 - アニリノ - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 6 - (ジエチルアミノ) - 1, 3 - ジヒ
ドロ - 2 H - ベンズイミダゾール - 2 - オン ;
5 - アニリノ - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 6 - [4 - (3 - メトキシフェニル) ピ
ペラジン - 1 - イル] - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンズイミダゾール - 2 - オン ;
5 - アニリノ - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 6 - [4 - (4 - メトキシフェニル) ピ
ペラジン - 1 - イル] - 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンズイミダゾール - 2 - オン ;
エチル {4 - [6 - アニリノ - 3 - (シクロヘキシルメチル) - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒ
ドロ - 1 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル]ピペラジン - 1 - イル}アセテート ;
5 - アニリノ - 6 - (4 - ベンジルピペラジン - 1 - イル) - 1 - (シクロヘキシルメチル)
- 1, 3 - ジヒドロ - 2 H - ベンズイミダゾール - 2 - オン ;
5 - アニリノ - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 6 - (2 - メチルピペリジン - 1 - イル

)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-(2-{[(2S)-1-メチルピロリジン-2-イル]メチル}ピペリジン-1-イル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-モルホリン-4-イル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-[4-(テトラヒドロフラン-2-イルカルボニル)ピペラジン-1-イル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-(4-ヒドロキシ-4-フェニルピペリジン-1-イル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-[(シクロプロピルメチル)(プロピル)アミノ]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-[(2-ヒドロキシエチル)(ペンチル)アミノ]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-6-[ブチル(プロピル)アミノ]-1-(シクロヘキシルメチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-6-[ビス(2-メトキシエチル)アミノ]-1-(シクロヘキシルメチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-(4-ピリミジン-2-イルピペラジン-1-イル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

tert-ブチル-1-[6-アニリノ-3-(シクロヘキシルメチル)-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール-5-イル]ピロリジン-3-イルカルバメート;

5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-(3,5-ジメチルピペリジン-1-イル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

エチルN-[6-アニリノ-3-(シクロヘキシルメチル)-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール-5-イル]-N-(2-フリルメチル)-ベータアラニネート;

tert-ブチル-4-[6-アニリノ-3-(シクロヘキシルメチル)-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール-5-イル]-1,4-ジアゼパン-1-カルボキシレート;

5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-[メチル(2-フェニルエチル)アミノ]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-[(2-メトキシエチル)(プロピル)アミノ]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-[4-(4-ニトロフェニル)ピペラジン-1-イル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-6-(4-ベンジル-1,4-ジアゼパン-1-イル)-1-(シクロヘキシルメチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-[4-(4-ヒドロキシフェニル)ピペラジン-1-イル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-[4-(2-ヒドロキシフェニル)ピペラジン-1-イル]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

6-[アリル(シクロヘキシル)アミノ]-5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

3-[[6-アニリノ-3-(シクロヘキシルメチル)-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンズイミダゾール-5-イル](ブチル)アミノ]プロパンニトリル;

5-アニリノ-1-(シクロヘキシルメチル)-6-[[2-(ジメチルアミノ)エチル](エチル)アミノ]-1,3-ジヒドロ-2H-ベンズイミダゾール-2-オン;

1-シクロヘキシルメチル-6-(R)-2-メトキシメチル-ピロリジン-1-イル
)-5-フェニルアミノ-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン;
tert-ブチル1-[6-アニリノ-3-(シクロヘキシルメチル)-2-オキソ-2,
3-ジヒドロ-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル]ピロリジン-3-イル(メチル)
カルバメート;
6-[4-(4-アセチルフェニル)ピペラジン-1-イル]-5-アニリノ-1-(シク
ロヘキシルメチル)-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-オン;
6-(4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)-1-シクロヘキシルメチル-5-フェニ
ルアミノ-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン;
エチル1-[6-アニリノ-3-(シクロヘキシルメチル)-2-オキソ-2,3-ジヒド
ロ-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル]ピペリジン-3-カルボキシレート;
1-[4-(2-ジメチルアミノ-エトキシ)-ベンジル]-5-フェニルアミノ-1,3-
-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン;
5-(2,4-ジフルオロ-フェニルアミノ)-1-[4-(2-ジメチルアミノ-エトキ
シ)-ベンジル]-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン;
1-(2,6-ジフルオロ-フェニル)-5-フェニルアミノ-1,3-ジヒドロ-ベンゾ
イミダゾール-2-オン;
1-フェニル-5-フェニルアミノ-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン
;
5-(2,4-ジフルオロ-フェニルアミノ)-1-フェニル-1,3-ジヒドロ-ベンゾ
イミダゾール-2-オン;
1-(2,6-ジクロロ-フェニル)-5-フェニルアミノ-1,3-ジヒドロ-ベンゾイ
ミダゾール-2-オン;
1-シクロヘキシルメチル-6-(2-ジメチルアミノ-エチルスルファニル)-5-フ
ェニルアミノ-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン;
1-シクロヘキシルメチル-5-(2,4-ジフルオロ-フェニルアミノ)-6-(2-
ジメチルアミノ-エチルスルファニル)-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-
オン;
1-シクロヘキシルメチル-6-(2-ジメチルアミノ-エトキシ)-5-フェニルアミ
ノ-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン;
1-シクロヘキシルメチル-5-(2,4-ジフルオロ-フェニルアミノ)-6-(2-
ジメチルアミノ-エトキシ)-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン;
1-シクロヘキシルメチル-6-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-5-フェニル
アミノ-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン

及び

1-シクロヘキシルメチル-5-(2,4-ジフルオロ-フェニルアミノ)-6-(2-
ジメチルアミノ-エチルアミノ)-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン
 からなる群から選ばれる化合物、それらの医薬的に許容可能な酸、塩又は異性体。

【請求項15】

1-ベンジル-5-フェノキシ-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン;
1-シクロヘキシルメチル-5-フェノキシ-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-
2-オン;
1-ベンジル-5-オトリルオキシ-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オ
ン;
1-tert-ブチル-5-フェノキシ-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-
オン;
1-シクロペンチル-5-フェノキシ-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オ
ン;
5-フェノキシ-1-ピペリジン-4-イル-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-
2-オン;

5-フェノキシ-1-ピペリジン-4-イルメチル-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン;

1-(2-アミノ-エチル)-5-フェノキシ-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン;

1-(2-アミノ-1,1-ジメチル-エチル)-5-フェノキシ-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン;

1-(2-アミノ-2-メチル-プロピル)-5-フェノキシ-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン;

1-シクロヘキシルメチル-5-フェニルスルファニル-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン;

1-tert-ブチル-5-フェニルスルファニル-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン;

1-シクロペンチル-5-フェニルスルファニル-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン;

5-フェニルスルファニル-1-ピペリジン-4-イル-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン;

5-フェニルスルファニル-1-ピペリジン-4-イルメチル-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン;

1-(2-アミノ-エチル)-5-フェニルスルファニル-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン;

1-(2-アミノ-1,1-ジメチル-エチル)-5-フェニルスルファニル-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン

及び

1-(2-アミノ-2-メチル-プロピル)-5-フェニルスルファニル-1,3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン

からなる群から選ばれる化合物、それらの医薬的に許容可能な酸、塩又は異性体。

【請求項16】

医薬的に有効用の請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物及び1種又は2種以上の医薬的に許容可能なキャリア及び／又はアジュバントを含む医薬組成物。

【請求項17】

請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物を含有することを特徴とする、以下のものより選ばれる疾患又は状態の治療用医薬組成物：

変形性関節症、アテローム性動脈硬化症、接触性皮膚炎、骨吸収疾患、再灌流傷害、喘息、多発性硬化症、ギラン・バレー症候群、クローン病、潰瘍性大腸炎、乾癬、対宿主性移植片疾患、全身性エリテマトーデス及びインシュリン依存性糖尿病、関節リウマチ、アルツハイマー病、毒素性ショック症候群、糖尿病、炎症性大腸炎、急性及び慢性の痛み、ストローク、心筋梗塞単独又は血栓溶解療法後のもの、熱傷、成人呼吸窮迫症候群（ARDS）、外傷の次に生じる多臓器創傷、急性糸球体腎炎、急性炎症成分での皮膚病、急性化膿性髄膜炎又は他の中枢神経系疾患、血液透析に関連する症候群、ロイコフェリシス、顆粒球輸血に関連する症候群、壊死性全腸炎、経皮経管冠動脈形成後の再狭窄を含む合併症、外傷性関節炎、敗血症、慢性閉塞性肺疾患及びうつ血性心不全。

【請求項18】

以下のものより選ばれる疾患又は状態の治療用医薬組成物を製造するための、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物1種又は2種以上の使用：

変形性関節症、アテローム性動脈硬化症、接触性皮膚炎、骨吸収疾患、再灌流傷害、喘息、多発性硬化症、ギラン・バレー症候群、クローン病、潰瘍性大腸炎、乾癬、対宿主性移植片疾患、全身性エリテマトーデス及びインシュリン依存性糖尿病、関節リウマチ、アルツハイマー病、毒素性ショック症候群、糖尿病、炎症性大腸炎、急性及び慢性の痛み、ストローク、心筋梗塞単独又は血栓溶解療法後のもの、熱傷、成人呼吸窮迫症候群（ARDS）、外傷の次に生じる多臓器創傷、急性糸球体腎炎、急性炎症成分での皮膚病、急性

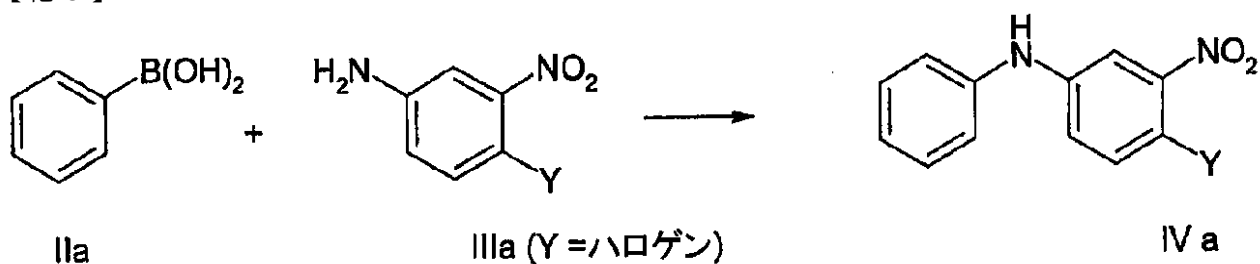
化膿性髄膜炎又は他の中枢神経系疾患、血液透析に関連する症候群、ロイコフェリシス、顆粒球輸血に関連する症候群、壊死性全腸炎、経皮経管冠動脈形成後の再狭窄を含む合併症、外傷性関節炎、敗血症、慢性閉塞性肺疾患及びうつ血性心不全。

【請求項 19】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物を製造する方法であって、

適切な条件下でのアリールボロン酸 (IIa) と 4-ハロ-3-ニトロアニリン (IIIa) との結合を、銅塩及び適切な塩基の存在下で、溶剤中において、場合により該反応において形成される水を除去するための試薬を添加して行って、中間体 (IVa) を形成すること；

【化 3】



(V) とアミン (Va) との反応を、塩基の存在下において、適切な溶剤中において行って、(V Ia) を形成すること；

適切な条件下で、(V Ia) のニトロ基を、適切な溶剤中において、水素雰囲気下で、触媒の存在下で還元して、(V II) を形成すること；及び

(V II) とカルボニル源試薬との反応を、適切な溶剤中において行って、式 (I) を提供すること、を含む方法。

【化 4】

