

【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】令和 5 年 12 月 7 日(2023.12.7)

【国際公開番号】WO2021/116005

【公表番号】特表 2023-505684(P2023-505684A)

【公表日】令和 5 年 2 月 10 日(2023.2.10)

【年通号数】公開公報(特許)2023-027

【出願番号】特願 2022-534848(P2022-534848)

【国際特許分類】

10

C 0 7 D 231/40(2006.01)

A 6 1 P 43/00(2006.01)

A 6 1 P 19/02(2006.01)

A 6 1 P 27/02(2006.01)

A 6 1 P 9/10(2006.01)

A 6 1 P 37/06(2006.01)

A 6 1 P 17/00(2006.01)

A 6 1 P 17/06(2006.01)

A 6 1 P 25/04(2006.01)

A 6 1 P 29/02(2006.01)

20

A 6 1 P 11/00(2006.01)

A 6 1 P 35/04(2006.01)

A 6 1 P 35/00(2006.01)

C 0 7 D 403/12(2006.01)

C 0 7 D 401/14(2006.01)

C 0 7 D 413/14(2006.01)

C 0 7 D 471/04(2006.01)

C 0 7 D 403/14(2006.01)

C 0 7 D 401/12(2006.01)

C 0 7 D 417/12(2006.01)

30

A 6 1 K 31/497(2006.01)

A 6 1 K 31/506(2006.01)

A 6 1 K 31/437(2006.01)

A 6 1 K 31/4439(2006.01)

A 6 1 K 31/415(2006.01)

A 6 1 K 31/4155(2006.01)

A 6 1 K 31/496(2006.01)

A 6 1 K 31/454(2006.01)

A 6 1 K 31/5377(2006.01)

A 6 1 K 31/444(2006.01)

40

【F I】

C 0 7 D 231/40

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 25/04

50

A 6 1 P 29/02  
 A 6 1 P 43/00 1 0 5  
 A 6 1 P 11/00  
 A 6 1 P 35/04  
 A 6 1 P 35/00  
 C 0 7 D 403/12 C S P  
 C 0 7 D 401/14  
 C 0 7 D 413/14  
 C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z  
 C 0 7 D 403/14  
 C 0 7 D 401/12  
 C 0 7 D 417/12  
 A 6 1 K 31/497  
 A 6 1 K 31/506  
 A 6 1 K 31/437  
 A 6 1 K 31/4439  
 A 6 1 K 31/415  
 A 6 1 K 31/4155  
 A 6 1 K 31/496  
 A 6 1 K 31/454  
 A 6 1 K 31/5377  
 A 6 1 K 31/444

10

20

## 【手続補正書】

【提出日】令和5年11月29日(2023.11.29)

## 【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】

30

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)のN-フェニルカルバモイル化合物

【化1】



又はその塩

40

式中、Aは、

【化2】



であり、

Xは、

5員もしくは6員のヘテロアリアル環、2,3-ジヒドロ-1H-ピロロ[3,4-c

50

] ピリジニル、( 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール ) CO - 、( フェニル ) CO - 及び 5 員もしくは 6 員の飽和複素環

からなる群から選択される、任意に置換されていてよい基であり、

Y は、任意に置換されていてよい 5 員又は 6 員のヘテロアリール環であり、

B は、

フェニル、5 員もしくは 6 員のヘテロアリール環、5 員もしくは 6 員の飽和複素環、アザスピロ ( C<sub>7</sub> ~ C<sub>10</sub> ) アルキル及び飽和 ( C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> ) シクロアルキル - NH - からなる群から選択される、に置換されていてよい基であり、

R<sub>1</sub> 及び R<sub>2</sub> は、任意に存在し、同時に存在してよく、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> ) アルキル及びハロゲンから独立して選択される。

10

#### 【請求項 2】

X が、

5 員もしくは 6 員のヘテロアリール環、2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [ 3, 4 - c ] ピリジニル、( 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール ) CO - 、( フェニル ) CO - 及び 5 員もしくは 6 員の飽和複素環

からなる群から選択される任意に置換されていてよい基である、

請求項 1 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。

#### 【請求項 3】

5 員又は 6 員のヘテロアリール環が、ピラジン、ピリジン又はピリミジンである、請求項 2 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。

20

#### 【請求項 4】

5 員又は 6 員のヘテロアリール環が、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> ) アルキル、( モルホリノ ) メチル、( ジメチルモルホリノ ) メチル、ピロリジン - 1 - イル - メチル、4 - エチルピペラジン - 1 - イル、4 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) ピペラジン - 1 - イル、3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - イル、3 - ( ジメチルアミノ ) ピロリジン - 1 - イル、( 2 - ヒドロキシエチル ) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル、モルホリン - 1 - イル及びシアノからなる群から選択される 1 つ又は 2 つ以上の置換基で置換されている、請求項 3 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。

#### 【請求項 5】

X が、

( C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> ) アルキル、ヒドロキシ ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> ) アルキル、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> ) アルキル ) CO - からなる群、好ましくはエチル、アセチル及び 2 - ヒドロキシエチルから選択される 1 つ又は 2 つ以上の置換基で置換された 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [ 3, 4 - c ] ピリジニルである、請求項 2 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。

30

#### 【請求項 6】

X が、任意に置換されている、( 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール ) CO - 、すなわち ( ピリジン ) CO - 又は ( ピリミジン ) CO - 、である、請求項 2 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。

#### 【請求項 7】

X が、任意に置換されている ( フェニル ) CO - であり、好ましくは、ハロゲン、( 1 - イソプロピルアゼチジン - 3 - イル ) オキシ、4 - メチルピペラジン - 1 - イル及び 1 - メチルピペリジン - 4 - イルからなる群から選択される 1 つ又は 2 つ以上の置換基で置換されている、請求項 2 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。

40

#### 【請求項 8】

Y が、任意に置換されている、5 員又は 6 員のヘテロアリール環、すなわち非置換ピラジン、である、請求項 1 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。

#### 【請求項 9】

R<sub>1</sub> が、水素、メチル、フルオロ又はクロロであり、R<sub>2</sub> が、R<sub>1</sub> とは独立して、水素又はフルオロである、請求項 1 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。

#### 【請求項 10】

50

B が、任意に置換されているフェニルであり、

好ましくは、 $(C_1 \sim C_3)$  アルキル、 $R' SO_2 -$ 、 $R' R'' N (C_3)$  アルキル、 $R' NH (C_1 \sim C_3)$  アルキル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ハロゲン、 $R' R'' N S O$ 、 $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル -  $NH -$ 、 $NR' (C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル - からなる群から選択される 1 つ又は 2 つ以上の置換基で置換されており、

$R'$  及び  $R''$  は、互いに独立して、 $(C_3)$  アルキルである、請求項 2 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。

【請求項 11】

フェニルが、 $CH_3 SO_2 -$ 、 $-CH_2 N (CH_3)_2$ 、 $CH_3$ 、 $CF_3$ 、 $CHF_2$ 、フルオロ、 $-SO_2 N (CH_3)_2$ 、 $(N - エチル)$  アミノシクロプロピルからなる群から選択される 1 つ又は 2 つ以上の置換基で置換されている、請求項 10 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。 10

【請求項 12】

B が、ピリジン及びオキサゾールから選択される 5 員又は 6 員のヘテロアリール環であり、任意に置換されている、請求項 2 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。

【請求項 13】

B が、1 つ又は 2 つ以上のヒドロキシ  $(C_1 \sim C_3)$  アルキル、 $CF_3$ 、 $(C_1 \sim C_4)$  アルキル、シアノ  $(C_1 \sim C_3)$  アルキル及び  $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル -  $SO_2 -$  で置換されている 5 員又は 6 員のヘテロアリール環である、請求項 2 又は 12 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。 20

【請求項 14】

B が、2 - シアノプロピル - 2 - イル、2 - ヒドロキシプロピル - 2 - イル、 $CH_3$ 、 $CF_3$ 、フルオロ、イソブチル又はシクロプロピルスルホニルからなる群から選択される 1 つ又は 2 つ以上の置換基で置換されたピリジン又はオキサゾールである、請求項 12 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。

【請求項 15】

B が、アザスピロ [3, 4] オクタン及びアザスピロ [4, 5] デカンから選択されるアザスピロ  $(C_7 \sim C_{10})$  アルキルである、請求項 2 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。 30

【請求項 16】

B が、任意に置換されている、5 員又は 6 員の飽和複素環、すなわちピロリジンであり、好ましくは、1 つ又は 2 つ以上の  $(C_1 \sim C_3)$  アルキルで置換されていて、より好ましくはエチルで置換されている、請求項 2 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。

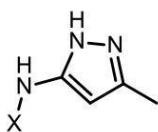
【請求項 17】

B が、任意に置換されている、飽和  $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル -  $NH -$  であり、飽和  $(C_3 \sim C_6)$  シクロアルキル -  $NH -$  は、好ましくは 4, 4 - (ジメチルシクロヘキシル) -  $NH -$ 、シクロペンチル -  $NH -$  である、請求項に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。

【請求項 18】

A が、

【化 3】



である、請求項 1 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。

【請求項 19】

X が、任意に置換されている 5 員又は 6 員のヘテロアリール環であり、好ましくは任意 50

に置換されているピラジンである、請求項 18 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。

【請求項 20】

B が、好ましくは任意に置換されているフェニルであり、好ましくは C F<sub>3</sub> で置換されている、請求項 18 又は 19 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。

【請求項 21】

以下からなる群から選択される、請求項 1 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物：

1) N - (4 - メチル - 3 - (2 - (5 - (ピラジン - 2 - イルアミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル) - 3 - (メチルスルホニル)ベンズアミド、

2) 2 - (2 - シアノプロパン - 2 - イル) - N - (4 - メチル - 3 - (2 - (5 - (ピラジン - 2 - イルアミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル)イソニコチンアミド、

3) N - (4 - メチル - 3 - (2 - (5 - (ピラジン - 2 - イルアミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル) - 3 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド、

4) 4 - (1 - (エチルアミノ)シクロプロピル) - N - (4 - メチル - 3 - (2 - (5 - (ピラジン - 2 - イルアミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル)ベンズアミド、

5) 2 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - N - (4 - メチル - 3 - (2 - (5 - (ピラジン - 2 - イルアミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル)イソニコチンアミド、

6) 2 - メチル - N - (4 - メチル - 3 - (2 - (5 - (ピラジン - 2 - イルアミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル) - 5 - (トリフルオロメチル)オキサゾール - 4 - カルボキサミド、

7) 2 - フルオロ - N - (4 - メチル - 3 - (2 - (5 - (ピラジン - 2 - イルアミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル) - 5 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド、

8) 4 - (シクロプロピルスルホニル) - N - (4 - メチル - 3 - (2 - (5 - (ピラジン - 2 - イルアミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル)ピコリンアミド、

9) N - (3 - (2 - フルオロ - 5 - (6 - イソブチルニコチンアミド)フェネチル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル)ピリミジン - 2 - カルボキサミド

10) N - (4 - フルオロ - 3 - (2 - (5 - ((2 - (2 - ヒドロキシエチル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ[3, 4 - c]ピリジン - 6 - イル)アミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル) - 3 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド

11) 2 - (2 - シアノプロパン - 2 - イル) - N - (4 - フルオロ - 3 - (2 - (5 - (ピラジン - 2 - イルアミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル)イソニコチンアミド、

12) N - (4 - フルオロ - 3 - (2 - (5 - (ピラジン - 2 - イルアミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル) - 3 - (メチルスルホニル)ベンズアミド、

13) N - (4 - フルオロ - 3 - (2 - (5 - (ピラジン - 2 - イルアミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル) - 3 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド、

14) N - (3 - (2 - (5 - ((3, 5 - ジメチルピラジン - 2 - イル)アミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル) - 4 - フルオロフェニル) - 3 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド、

15) N - (4 - フルオロ - 3 - (2 - (5 - ((3 - メチルピラジン - 2 - イル)アミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル) - 3 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド、

16) N - (4 - クロロ - 3 - (2 - (5 - (ピラジン - 2 - イルアミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル) - 3 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド、

10

20

30

40

50

17) N - ( 3 - ( 2 - ( 5 - ( ( 2 - エチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [ 3 , 4 - c ] ピリジン - 6 - イル ) アミノ ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) エチル ) - 4 - メチルフェニル ) - 3 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド、

18) N - ( 5 - ( 2 - メチル - 5 - ( 3 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド ) フェネチル ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) ピコリンアミド、

19) N - ( 3 - ( 2 - ( 3 - ( 4 - フルオロベンズアミド ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル ) エチル ) - 4 - メチルフェニル ) - 3 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド、

20) N - ( 4 - メチル - 3 - ( 2 - ( 5 - ( ( 3 - メチルピラジン - 2 - イル ) アミノ ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) エチル ) フェニル ) - 6 - アザスピロ [ 3 . 4 ] オクタン - 6 - カルボキサミド、

21) 3 , 3 - ジエチル - N - ( 4 - メチル - 3 - ( 2 - ( 5 - ( ( 3 - メチルピラジン - 2 - イル ) アミノ ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) エチル ) フェニル ) ピロリジン - 1 - カルボキサミド

22) 3 , 3 - ジエチル - N - ( 4 - メチル - 3 - ( 2 - ( 5 - ( ピラジン - 2 - イル アミノ ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) エチル ) フェニル ) ピロリジン - 1 - カルボキサミド

23) N - ( 3 - ( 5 - ( 3 - ( 4 , 4 - ジメチルシクロヘキシル ) ウレイド ) - 2 - メチルフェネチル ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル ) - 4 - ( ( 1 - イソプロピルアゼチジン - 3 - イル ) オキシ ) ベンズアミド、

24) N - ( 3 - ( 5 - ( 3 - シクロペンチルウレイド ) - 2 - メチルフェネチル ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル ) - 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) ベンズアミド、

25) N - ( 3 - ( 5 - ( 3 - ( 4 , 4 - ジメチルシクロヘキシル ) ウレイド ) - 2 - メチルフェネチル ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル ) - 4 - ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル ) ベンズアミド、

26) N - ( 4 - フルオロ - 3 - ( 2 - ( 3 - ( ( 2 - メチル - 6 - ( モルホリノメチル ) ピリミジン - 4 - イル ) アミノ ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル ) エチル ) フェニル ) - 3 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド、

27) N - ( 3 - ( 2 - ( 3 - ( ( 6 - ( ( 2 S , 6 R ) - 2 , 6 - ジメチルモルホリノ ) メチル ) - 2 - メチルピリミジン - 4 - イル ) アミノ ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル ) エチル ) - 4 - フルオロフェニル ) - 3 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド、

28) N - ( 4 - フルオロ - 3 - ( 2 - ( 3 - ( ( 2 - メチル - 6 - ( ピロリジン - 1 - イルメチル ) ピリミジン - 4 - イル ) アミノ ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル ) エチル ) フェニル ) - 3 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド、

29) N - ( 3 - ( 2 - ( 3 - ( ( 6 - ( 4 - エチルピペラジン - 1 - イル ) - 2 - メチルピリミジン - 4 - イル ) アミノ ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル ) エチル ) - 4 - フルオロフェニル ) - 3 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド、

30) N - ( 4 - フルオロ - 3 - ( 2 - ( 3 - ( ( 6 - ( 4 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) ピペラジン - 1 - イル ) - 2 - メチルピリミジン - 4 - イル ) アミノ ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル ) エチル ) フェニル ) - 3 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド、

31) N - ( 4 - フルオロ - 3 - ( 2 - ( 3 - ( ( 6 - ( 3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - イル ) - 2 - メチルピリミジン - 4 - イル ) アミノ ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル ) エチル ) フェニル ) - 3 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド、

32) ( S ) - N - ( 3 - ( 2 - ( 3 - ( ( 6 - ( 3 - ( ジメチルアミノ ) ピロリジン - 1 - イル ) - 2 - メチルピリミジン - 4 - イル ) アミノ ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル ) エチル ) - 4 - フルオロフェニル ) - 3 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド、

33) 3 - ( ジフルオロメチル ) - N - ( 4 - メチル - 3 - ( 2 - ( 5 - ( ピラジン - 2 - イルアミノ ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) エチル ) フェニル ) ベンズアミド、

34) N - ( 3 - ( 2 - ( 5 - ( ( 2 - アセチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [ 3 , 4 - c ] ピリジン - 6 - イル ) アミノ ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) エチル ) -

10

20

30

40

50

- 4 - メチルフェニル) - 3 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド、  
 35) 3 - (イソプロピルスルホニル) - N - (4 - メチル - 3 - (2 - (5 - ((3 - メチルピリジン - 2 - イル)アミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル)ベンズアミド、  
 36) 2 - (2 - シアノプロパン - 2 - イル) - N - (4 - メチル - 3 - (2 - (5 - ((3 - メチルピリジン - 2 - イル)アミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル)イソニコチンアミド、  
 37) N - (3 - (2 - (5 - ((6 - シアノ - 2 - メチルピリミジン - 4 - イル)アミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル) - 4 - メチルフェニル) - 3 - (N, N - ジメチルスルファモイル)ベンズアミド、  
 38) N - (3 - (2 - (5 - ((6 - シアノ - 2 - メチルピリミジン - 4 - イル)アミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル) - 4 - メチルフェニル) - 8 - アザスピロ[4.5]デカン - 8 - カルボキサミド、  
 39) N - (3 - (2 - (5 - ((6 - シアノ - 2 - メチルピリミジン - 4 - イル)アミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル) - 4 - フルオロフェニル) - 4 - ((ジメチルアミノ)メチル) - 3 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド、  
 40) N - (4 - フルオロ - 3 - (2 - (5 - ((2 - メチルピリミジン - 5 - イル)アミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル) - 3 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド、  
 41) 4 - (2 - シアノプロパン - 2 - イル) - N - (4 - メチル - 3 - (2 - (5 - (ピラジン - 2 - イルアミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル)ピコリンアミド、  
 42) N - (4 - フルオロ - 3 - (2 - (3 - ((6 - (1 - (2 - ヒドロキシエチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 2 - メチルピリミジン - 4 - イル)アミノ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル)エチル)フェニル) - 3 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド、  
 43) N - (2 - フルオロ - 5 - (2 - (5 - ((2 - メチル - 6 - モルホリノピリミジン - 4 - イル)アミノ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル) - 3 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド、  
 44) N - (2 - フルオロ - 5 - (2 - (3 - ((6 - (4 - (2 - ヒドロキシエチル)ピペラジン - 1 - イル) - 2 - メチルピリミジン - 4 - イル)アミノ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル)エチル)フェニル) - 3 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド、  
 45) N - (5 - (2 - (3 - ((6 - (4 - エチルピペラジン - 1 - イル) - 2 - メチルピリミジン - 4 - イル)アミノ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル)エチル) - 2 - フルオロフェニル) - 3 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド、  
 46) N - (2 - フルオロ - 5 - (2 - (3 - ((6 - (3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - イル) - 2 - メチルピリミジン - 4 - イル)アミノ) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル)エチル)フェニル) - 3 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド、  
 47) 4 - ((ジメチルアミノ)メチル) - N - (3 - (2 - (5 - (4 - モルホリノベンズアミド) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル)エチル)フェニル)ベンズアミド、  
 48) N - (4 - メチル - 3 - (2 - (2 - (ピラジン - 2 - イルアミノ)チアゾール - 5 - イル)エチル)フェニル) - 3 - (メチルスルホニル)ベンズアミド、  
 49) N - (4 - メチル - 3 - (2 - (2 - (ピラジン - 2 - イルアミノ)チアゾール - 5 - イル)エチル)フェニル) - 3 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド、及び  
 50) 2 - (2 - シアノプロパン - 2 - イル) - N - (4 - メチル - 3 - (2 - (2 - (ピラジン - 2 - イルアミノ)チアゾール - 5 - イル)エチル)フェニル)イソニコチンアミド。

【請求項 22】

以下からなる群から選択される、請求項 21 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物：

10

20

30

40

50

3) N - ( 4 - メチル - 3 - ( 2 - ( 5 - ( ピラジン - 2 - イルアミノ ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) エチル ) フェニル ) - 3 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド、

6) 2 - メチル - N - ( 4 - メチル - 3 - ( 2 - ( 5 - ( ピラジン - 2 - イルアミノ ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) エチル ) フェニル ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) オキサゾール - 4 - カルボキサミド、

8) 4 - ( シクロプロピルスルホニル ) - N - ( 4 - メチル - 3 - ( 2 - ( 5 - ( ピラジン - 2 - イルアミノ ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) エチル ) フェニル ) ピコリンアミド、

13) N - ( 4 - フルオロ - 3 - ( 2 - ( 5 - ( ピラジン - 2 - イルアミノ ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) エチル ) フェニル ) - 3 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド、

15) N - ( 4 - フルオロ - 3 - ( 2 - ( 5 - ( ( 3 - メチルピラジン - 2 - イル ) アミノ ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) エチル ) フェニル ) - 3 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド、

34) N - ( 3 - ( 2 - ( 5 - ( ( 2 - アセチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [ 3 , 4 - c ] ピリジン - 6 - イル ) アミノ ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) エチル ) - 4 - メチルフェニル ) - 3 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド、及び

49) N - ( 4 - メチル - 3 - ( 2 - ( 2 - ( ピラジン - 2 - イルアミノ ) チアゾール - 5 - イル ) エチル ) フェニル ) - 3 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド。

#### 【請求項 23】

化合物 3) N - ( 4 - メチル - 3 - ( 2 - ( 5 - ( ピラジン - 2 - イルアミノ ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) エチル ) フェニル ) - 3 - ( トリフルオロメチル ) ベンズアミドである、請求項 22 に記載の N - フェニルカルバモイル化合物。

#### 【請求項 24】

請求項 1 ~ 23 のいずれかに記載の N - フェニルカルバモイル化合物 ( I ) 又はその薬学的に許容される塩及び医薬的に受容可能な賦形剤を含む医薬組成物。

#### 【請求項 25】

F y n 及び V E G F R 2 から選択される少なくとも 1 つのチロシンキナーゼに關与する疾患及び障害の治療における、一方又は両方のキナーゼの阻害のための、請求項 1 ~ 23 のいずれかに記載の式 ( I ) の N - フェニルカルバモイル化合物又はその薬学的に許容される塩。

#### 【請求項 26】

F y n 及び V E G F R 2 の両キナーゼの阻害が、両キナーゼが關与する疾患 / 障害 / 病態の治療において生じる、請求項 25 に記載の式 ( I ) の N - フェニルカルバモイル化合物又はその薬学的に許容される塩。

#### 【請求項 27】

障害 / 疾患 / 病態が、変形性関節症、眼疾患、例えば、眼内血管新生障害、例えば、加齢性黄斑変性、糖尿病性黄斑浮腫及び他の虚血関連網膜症、又は免疫媒介性角膜移植片拒絶；乾癬又は酒さなどの皮膚障害；急性又は慢性の疼痛、好ましくは神経障害性疼痛、炎症性疼痛、変形性関節症性疼痛、眼病変性疼痛から選択される疼痛；急性呼吸窮迫症候群 ( A R D S )、特発性肺線維症 ( I P F )、過敏性肺炎 ( H P ) 及び全身性硬化症 ( S S c ) などの肺疾患；転移性結腸直腸がん、非扁平上皮非小細胞肺癌、転移性腎細胞がん、再発性多形神経膠芽腫、婦人科の悪性腫瘍、転移性乳がんなどのがんからなる群から選択される、請求項 26 に記載の式 ( I ) の N - フェニルカルバモイル化合物又はその薬学的に許容される塩。

10

20

30

40