

【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2月26日(2009.2.26)

【公表番号】特表2008-530011(P2008-530011A)

【公表日】平成20年8月7日(2008.8.7)

【年通号数】公開・登録公報2008-031

【出願番号】特願2007-554205(P2007-554205)

【国際特許分類】

C 07 D 401/04	(2006.01)
A 61 K 31/4439	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
A 61 K 31/4545	(2006.01)
C 07 D 487/04	(2006.01)
A 61 K 31/519	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 37/00	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 1/16	(2006.01)
A 61 P 31/12	(2006.01)
A 61 P 7/00	(2006.01)
A 61 P 3/10	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 17/06	(2006.01)
A 61 P 37/08	(2006.01)
A 61 P 5/00	(2006.01)
A 61 P 37/04	(2006.01)
A 61 P 19/08	(2006.01)
A 61 P 31/00	(2006.01)
A 61 P 7/02	(2006.01)
A 61 P 35/04	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 17/02	(2006.01)
A 61 P 25/16	(2006.01)
A 61 P 25/14	(2006.01)
A 61 P 17/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 401/04	C S P
A 61 K 31/4439	
C 07 D 401/14	
A 61 K 31/4545	
C 07 D 487/04	1 4 2
A 61 K 31/519	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 29/00	
A 61 P 35/00	
A 61 P 37/00	

A 6 1 P	9/00
A 6 1 P	1/16
A 6 1 P	31/12
A 6 1 P	7/00
A 6 1 P	3/10
A 6 1 P	25/28
A 6 1 P	9/10
A 6 1 P	1 0 1
A 6 1 P	9/10
A 6 1 P	17/06
A 6 1 P	37/08
A 6 1 P	5/00
A 6 1 P	37/04
A 6 1 P	19/08
A 6 1 P	31/00
A 6 1 P	7/02
A 6 1 P	35/04
A 6 1 P	25/00
A 6 1 P	17/02
A 6 1 P	25/16
A 6 1 P	25/14
A 6 1 P	29/00
A 6 1 P	1 0 1
A 6 1 P	17/00

## 【手続補正書】

【提出日】平成21年1月7日(2009.1.7)

## 【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

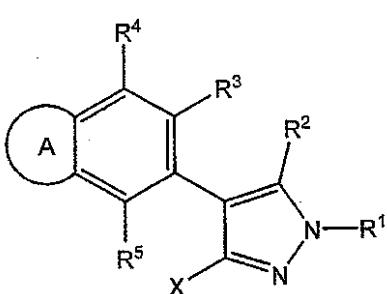
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

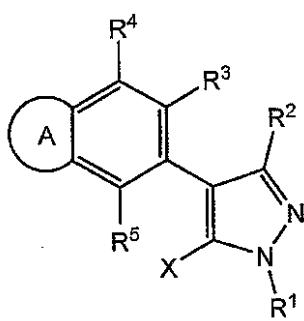
## 【請求項1】

式IaおよびIb:

## 【化1】



Ia



Ib

から選択される化合物、ならびにその立体異性体、互変異性体、溶媒和物、および薬学的に許容可能な塩であって、

式中、

環Aは、(i)O、N、およびSから独立して選択される1つまたは2つのヘテロ原子を有する5または6員複素環、(ii)任意選択的に5または6員複素環と縮合した5または6員炭素環、または(iii)フェニル環であり、ここで、前記複素環、炭素環、お

およびフェニル環は、F、C1、Br、I、-C(=Y)R<sup>2 0</sup>、-C(=Y)OR<sup>2 0</sup>、-C(=Y)NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、-NR<sup>2 0</sup>C(=Y)R<sup>2 1</sup>、-NR<sup>2 0</sup>C(=Y)OR<sup>2 1</sup>、-NR<sup>2 3</sup>C(=Y)NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、=NOR<sup>2 0</sup>、=NR<sup>2 0</sup>、=N+(O)OR<sup>2 0</sup>、=NNR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、=O、-OR<sup>2 0</sup>、-OC(=Y)R<sup>2 0</sup>、-OC(=Y)OR<sup>2 0</sup>、-OC(=Y)NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sup>2 0</sup>)、-OP(=Y)(OR<sup>2 0</sup>)(OR<sup>2 1</sup>)、-OP(OR<sup>2 0</sup>)(OR<sup>2 1</sup>)、-P(=Y)(OR<sup>2 0</sup>)(OR<sup>2 1</sup>)、-P(=Y)(OR)(NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>)、=S、-SR<sup>2 0</sup>、-S(O)R<sup>2 0</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>2 0</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、-S(O)(OR<sup>2 0</sup>)、-S(O)<sub>2</sub>(OR<sup>2 0</sup>)、-SC(=Y)R<sup>2 0</sup>、-SC(=Y)OR<sup>2 0</sup>、-SC(=Y)NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニル、C<sub>6</sub>~C<sub>20</sub>アリール、C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>カルボシクリル、C<sub>2</sub>~C<sub>20</sub>ヘテロシクリル、および保護基から独立して選択される1つまたは複数の基と任意選択的に置換され、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、F、C1、Br、I、-C(=Y)R<sup>2 0</sup>、-C(=Y)OR<sup>2 0</sup>、-C(=Y)NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、-NR<sup>2 0</sup>C(=Y)R<sup>2 1</sup>、-NR<sup>2 3</sup>C(=Y)NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、-OR<sup>2 0</sup>、-OC(=Y)R<sup>2 0</sup>、-OC(=Y)OR<sup>2 0</sup>、-OC(=Y)NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sup>2 0</sup>)、-OP(=Y)(OR<sup>2 0</sup>)(OR<sup>2 1</sup>)、-OP(OR<sup>2 0</sup>)(OR<sup>2 1</sup>)、-P(=Y)(OR<sup>2 0</sup>)(OR<sup>2 1</sup>)、-P(=Y)(OR)(NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>)、-SR<sup>2 0</sup>、-S(O)R<sup>2 0</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>2 0</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、-S(O)(OR<sup>2 0</sup>)、-S(O)<sub>2</sub>(OR<sup>2 0</sup>)、-SC(=Y)R<sup>2 0</sup>、-SC(=Y)OR<sup>2 0</sup>、-SC(=Y)NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニル、C<sub>6</sub>~C<sub>20</sub>アリール、C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>カルボシクリル、C<sub>2</sub>~C<sub>20</sub>ヘテロシクリルから独立して選択される1つまたは複数の基と任意選択的および独立して置換され、

Xは、C<sub>2</sub>~C<sub>20</sub>ヘテロシクリル、C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>カルボシクリル、およびC<sub>6</sub>~C<sub>20</sub>アリールから選択され、ここで、前記複素環、カルボシクリル、およびアリールは、F、C1、Br、I、-C(=Y)R<sup>2 0</sup>、-C(=Y)OR<sup>2 0</sup>、-C(=Y)NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、-NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、-NR<sup>2 0</sup>C(=Y)R<sup>2 1</sup>、-NR<sup>2 3</sup>C(=Y)NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、-OR<sup>2 0</sup>、-OC(=Y)R<sup>2 0</sup>、-OC(=Y)NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sup>2 0</sup>)、-OP(=Y)(OR<sup>2 0</sup>)(OR<sup>2 1</sup>)、-OP(OR<sup>2 0</sup>)(OR<sup>2 1</sup>)、-P(=Y)(OR<sup>2 0</sup>)(OR<sup>2 1</sup>)、-P(=Y)(OR)(NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>)、-SR<sup>2 0</sup>、-S(O)R<sup>2 0</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>2 0</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、-S(O)(OR<sup>2 0</sup>)、-S(O)<sub>2</sub>(OR<sup>2 0</sup>)、-SC(=Y)R<sup>2 0</sup>、-SC(=Y)OR<sup>2 0</sup>、-SC(=Y)NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、5~7員環ラクタム、5~7員環ラクトン、5~7員環スルタム、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>カルボシクリル、C<sub>6</sub>~C<sub>20</sub>アリール、およびC<sub>2</sub>~C<sub>20</sub>ヘテロシクリルから独立して選択される1つまたは複数の基と任意選択的に置換され、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、カルボシクリル、アリール、およびヘテロシクリルは、F、C1、Br、I、OR<sup>2 0</sup>、NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、-SR<sup>2 0</sup>、-S(O)R<sup>2 0</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>2 0</sup>、アルキル、アルケニル、アルキニル、カルボシクリル、アリール、およびヘテロシクリルから独立して選択される1つまたは複数の基と任意選択的に置換され、

R<sup>1</sup>は、H、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニル、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル)NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、C<sub>2</sub>~C<sub>20</sub>ヘテロシクリル、C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>カルボシクリル、およびC<sub>6</sub>~C<sub>20</sub>アリールから選択され、ここで、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、複素環、カルボシクリル、およびアリールは、F、C1、Br、I、-C(=Y)R<sup>2 0</sup>、-C(=Y)OR<sup>2 0</sup>、-C(=Y)NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、-NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、OR<sup>2 0</sup>、CN、C(=O)NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、C(=O)OR<sup>2 0</sup>、アルキル、(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル)NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>、およびヘテロシクリルから独立して選択される

1つまたは複数の基と任意選択的に置換され、

$R^2$  は、H、F、C<sub>1</sub>、Br、I、-C(=Y)R<sup>2</sup>0、-C(=Y)OR<sup>2</sup>0、-C(=Y)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-OR<sup>2</sup>0、-OC(=Y)R<sup>2</sup>0、-OC(=Y)OR<sup>2</sup>0、-OC(=Y)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sup>2</sup>0)、-OP(=Y)(OR<sup>2</sup>0)(OR<sup>2</sup>0) (OR<sup>2</sup>1)、-OP(OR<sup>2</sup>0)OR<sup>2</sup>1)、-P(=Y)(OR<sup>2</sup>0)(OR<sup>2</sup>1)、-P(=Y)(OR)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-SR<sup>2</sup>0、-S(O)R<sup>2</sup>0、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>2</sup>0、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-S(O)(OR<sup>2</sup>0)、-S(O)<sub>2</sub>(OR<sup>2</sup>0)、-SC(=Y)R<sup>2</sup>0、-SC(=Y)OR<sup>2</sup>0、-SC(=Y)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、5~7員環ラクタム、5~7員環ラクトン、5~7員環スルタム、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>カルボシクリル、C<sub>6</sub>~C<sub>20</sub>アリール、およびC<sub>2</sub>~C<sub>20</sub>ヘテロシクリルから選択され、ここで、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、カルボシクリル、アリール、およびヘテロシクリルはF、C<sub>1</sub>、Br、I、OR<sup>2</sup>0、NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1-SR<sup>2</sup>0、-S(O)R<sup>2</sup>0、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>2</sup>0、アルキル、アルケニル、アルキニル、カルボシクリル、アリール、およびヘテロシクリルから独立して選択される1つまたは複数の基と任意選択的に置換されるか、

式IaのR<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は、結合する原子と共に、O、N、およびSから独立して選択される少なくとも2つのヘテロ原子を有する飽和、部分不飽和、または芳香族の5または6員縮合複素環を任意選択的に形成し、ここで、前記複素環は、F、C<sub>1</sub>、Br、I、-C(=Y)R<sup>2</sup>0、-C(=Y)OR<sup>2</sup>0、-C(=Y)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-NR<sup>2</sup>0C(=Y)R<sup>2</sup>1、-NR<sup>2</sup>0C(=Y)OR<sup>2</sup>1、-NR<sup>2</sup>3C(=Y)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-OR<sup>2</sup>0、-OC(=Y)R<sup>2</sup>0、-OC(=Y)OR<sup>2</sup>0、-OC(=Y)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-OC(=Y)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sup>2</sup>0)、-OP(=Y)(OR<sup>2</sup>0)(OR<sup>2</sup>1)、-OP(OR<sup>2</sup>0)(OR<sup>2</sup>1)、-P(=Y)(OR<sup>2</sup>0)(OR<sup>2</sup>1)、-P(=Y)(OR<sup>2</sup>3)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-SR<sup>2</sup>0、-S(O)R<sup>2</sup>0、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>2</sup>0、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-S(O)(OR<sup>2</sup>0)、-S(O)<sub>2</sub>(OR<sup>2</sup>0)、-SC(=Y)R<sup>2</sup>0、-SC(=Y)OR<sup>2</sup>0、-SC(=Y)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、5~7員環ラクタム、5~7員環ラクトン、5~7員環スルタム、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>カルボシクリル、C<sub>6</sub>~C<sub>20</sub>アリール、およびC<sub>2</sub>~C<sub>20</sub>ヘテロシクリルから独立して選択される1つまたは複数の基と任意選択的に置換され、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、カルボシクリル、アリール、およびヘテロシクリルは、F、C<sub>1</sub>、Br、I、OR<sup>2</sup>0、NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1-SR<sup>2</sup>0、-S(O)R<sup>2</sup>0、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>2</sup>0、アルキル、アルケニル、アルキニル、カルボシクリル、アリール、およびヘテロシクリルから独立して選択される1つまたは複数の基と任意選択的に置換され、

$R^3$ 、 $R^4$ 、および $R^5$ は、H、F、C<sub>1</sub>、Br、I、-C(=Y)R<sup>2</sup>0、-C(=Y)OR<sup>2</sup>0、-C(=Y)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-NR<sup>2</sup>0C(=Y)R<sup>2</sup>1、-NR<sup>2</sup>0C(=Y)OR<sup>2</sup>1、-NR<sup>2</sup>3C(=Y)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-OR<sup>2</sup>0、-OC(=Y)R<sup>2</sup>0、-OC(=Y)OR<sup>2</sup>0、-OC(=Y)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sup>2</sup>0)、-OP(=Y)(OR<sup>2</sup>0)(OR<sup>2</sup>1)、-OP(OR<sup>2</sup>0)(OR<sup>2</sup>1)、-P(=Y)(OR<sup>2</sup>0)(OR<sup>2</sup>1)、-P(=Y)(OR<sup>2</sup>3)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-SR<sup>2</sup>0、-S(O)R<sup>2</sup>0、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>2</sup>0、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-S(O)(OR<sup>2</sup>0)、-S(O)<sub>2</sub>(OR<sup>2</sup>0)、-SC(=Y)R<sup>2</sup>0、-SC(=Y)OR<sup>2</sup>0、-SC(=Y)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、5~7員環ラクタム、5~7員環ラクトン、5~7員環スルタム、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>カルボシクリル、C<sub>6</sub>~C<sub>20</sub>アリール、およびC<sub>2</sub>~C<sub>20</sub>ヘテロシクリルから独立して選択され、ここで、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、カルボシクリル、アリール、およびヘテロシクリルは、F、C<sub>1</sub>、Br、I、OR<sup>2</sup>0、NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1-SR<sup>2</sup>0、-S(O)R<sup>2</sup>0、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>2</sup>0、アルキル、アルケニル、アルキニル、カルボシクリル、アリール、およびヘテロシクリルから独立して選択され、

ルから独立して選択される1つまたは複数の基と任意選択的に置換され、

$R^{2\ 0}$  および  $R^{2\ 1}$  は、H、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニル、 $C_2 \sim C_8$  アルキニル、 $C_6 \sim C_{20}$  アリール、 $C_2 \sim C_{20}$  ヘテロシクリル、および保護基から独立して選択され、ここで、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、およびヘテロシクリルは、F、C1、Br、I、-C(=Y)R<sup>a</sup>、-C(=Y)OR<sup>a</sup>、-C(=Y)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-OR<sup>a</sup>、-OC(=Y)R<sup>a</sup>、-OC(=Y)OR<sup>a</sup>、-OC(=Y)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sup>a</sup>)、-OP(=Y)(OR<sup>a</sup>)(OR<sup>b</sup>)、-OP(OR<sup>a</sup>)(OR<sup>b</sup>)、-P(=Y)(OR<sup>a</sup>)(OR<sup>b</sup>)、-P(=Y)(OR)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-SR<sup>a</sup>、-S(O)R<sup>a</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>a</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-S(O)(OR<sup>a</sup>)、-S(O)<sub>2</sub>(OR<sup>a</sup>)、-SC(=Y)R<sup>a</sup>、-SC(=Y)OR<sup>a</sup>、および-SC(=Y)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup> から独立して選択される1つまたは複数の基と任意選択的および独立して置換されるか、

$R^{2\ 0}$  および  $R^{2\ 1}$  は、結合する原子と共に、複素環を形成し、ここで、前記複素環は、F、C1、Br、I、アルキル、アルケニル、およびアルキニルから独立して選択される1つまたは複数の基と任意選択的に置換され、

$R^{2\ 3}$  は、H、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニル、 $C_2 \sim C_8$  アルキニル、 $C_6 \sim C_{20}$  アリール、 $C_2 \sim C_{20}$  ヘテロシクリル、または保護基であり、

$R^a$  および  $R^b$  は、独立して、H、 $C_1 \sim C_8$  アルキル、 $C_2 \sim C_8$  アルケニル、 $C_2 \sim C_8$  アルキニル、 $C_6 \sim C_{20}$  アリール、または  $C_2 \sim C_{20}$  ヘテロシクリルであり、  
Yは、独立して、O、S、NR<sup>2 0</sup>、<sup>+</sup>N(O)R<sup>2 0</sup>、N(OR<sup>2 0</sup>)、<sup>+</sup>N(O)(OR<sup>2 0</sup>)、またはN-NR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup> であり、

保護基は、トリアルキルシリル、ジアルキルフェニルシリル、ベンゾエート、ベンジル、ベンジルオキシメチル、メチル、メトキシメチル、トリアリールメチル、フタルイミド、t-ブトキシカルボニル(BOC)、ベンジルオキシカルボニル(CBz)、9-フルロレニルメチレンオキシカルボニル(Fmoc)、およびテトラヒドロピラニルから選択される)から選択される、化合物。

#### 【請求項2】

$R^1$  がHである、請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項3】

$R^1$  が任意選択的に置換された $C_1 \sim C_8$  アルキルである、請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項4】

$R^1$  がメチルである、請求項3に記載の化合物。

#### 【請求項5】

$R^1$  がアルキルNR<sup>2 0</sup>R<sup>2 1</sup>と置換されたアルキルである、請求項3に記載の化合物。

#### 【請求項6】

$R^1$  が、 $CH_2CH_2NH_2$ 、 $CH_2CH_2CH_2NH_2$ 、または $CH_2CH_2CH_2NH_2$ である、請求項5に記載の化合物。

#### 【請求項7】

$R^1$  が $CH_2CH_2CH_2NHCH_2C(=O)OCH_3$ である、請求項5に記載の化合物。

#### 【請求項8】

$R^1$  が $CH_2CH_2NHCH_2CH_2OH$ である、請求項5に記載の化合物。

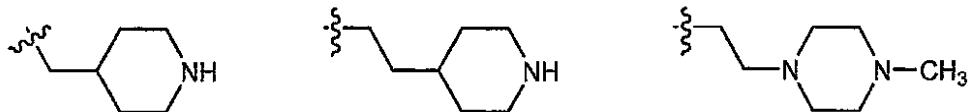
#### 【請求項9】

$R^1$  がヘテロシクリルと置換されたアルキルである、請求項3に記載の化合物。

#### 【請求項10】

$R^1$  が、構造：

## 【化2】



から選択される、請求項9に記載の化合物。

## 【請求項11】

$R^1$  が  $OR^{20}$  と置換されたアルキルである、請求項3に記載の化合物。

## 【請求項12】

$R^1$  が  $CH_2CH_2OH$  または  $CH_2CH(OH)CH_2OH$  である、請求項11に記載の化合物。

## 【請求項13】

$R^1$  が  $C(=O)OR^{20}$  と置換されたアルキルである、請求項3に記載の化合物。

## 【請求項14】

$R^1$  が  $CH_2C(=O)OH$  である、請求項13に記載の化合物。

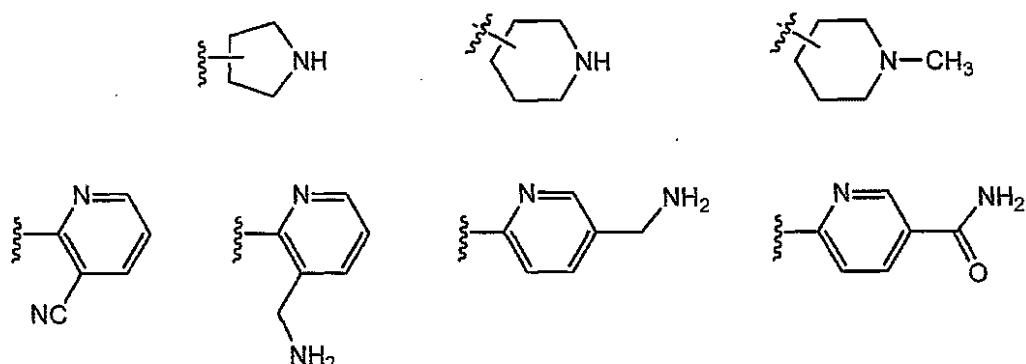
## 【請求項15】

$R^1$  が任意選択的に置換されたヘテロシクリルである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項16】

$R^1$  が、構造：

## 【化3】



から選択される、請求項15に記載の化合物。

## 【請求項17】

$R^1$  が、構造：

## 【化4】



から選択される、請求項15に記載の化合物。

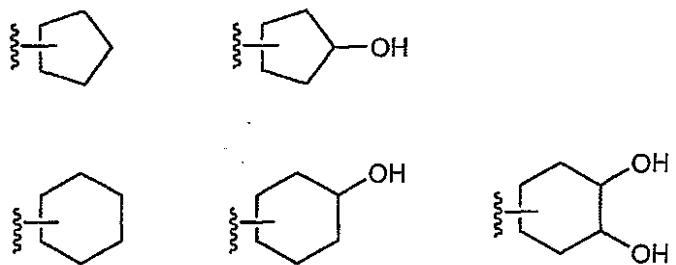
## 【請求項18】

$R^1$  が任意選択的に置換されたカルボシクリルである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項19】

$R^1$  が、構造：

## 【化5】



から選択される、請求項1～8に記載の化合物。

## 【請求項20】

Xが任意選択的に置換されたアリールである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項21】

Xが任意選択的に置換されたフェニル、ナフチル、アントラシル、ビフェニル、インダニル、またはテトラヒドロナフチルである、請求項20に記載の化合物。

## 【請求項22】

Xが任意選択的に置換されたヘテロシクリルである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項23】

Xが、任意選択的に置換された2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、2-イミダゾリル、4-イミダゾリル、3-ピラゾリル、4-ピラゾリル、2-チアゾリル、4-チアゾリル、5-チアゾリル、3-ピリダジニル、4-ピリダジニル、5-ピリダジニル、2-ピリミジニル、5-ピリミジニル、6-ピリミジニル、2-ピラジニル、2-オキサゾリル、4-オキサゾリル、または5-オキサゾリルである、請求項22に記載の化合物。

## 【請求項24】

Xが任意選択的に置換された4-ピリジルである、請求項23に記載の化合物。

## 【請求項25】

環Aが、フェニル、シクロペンチル、シクロペンテニル、シクロヘキシル、シクロヘキセニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロピリジル、ピペラジニル、ピロリジニル、ピリジル、ピリミジニル、ジヒドロチオフェニル、チオフェニル、イミダゾリル、チアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、およびピラゾリルから選択される任意選択的に置換された環である、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項26】

式IaのR<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>が、結合する原子と共に、O、N、およびSから選択される少なくとも2つのヘテロ原子を有する5または6員縮合複素環を形成する、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項27】

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>が、結合する原子と共に、縮合ピリミジン環を形成する、請求項26に記載の化合物。

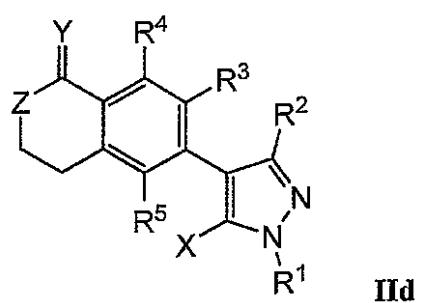
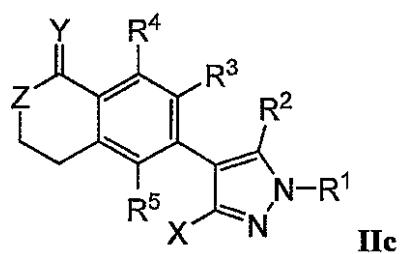
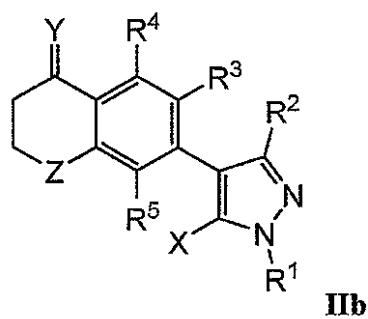
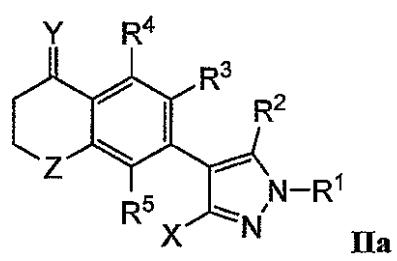
## 【請求項28】

環Aが、フェニル、シクロペンチル、シクロペンテニル、シクロヘキシル、シクロヘキセニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロピリジル、ピペラジニル、ピロリジニル、ピリジル、ピリミジニル、ジヒドロチオフェニル、チオフェニル、イミダゾリル、チアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、およびピラゾリルから選択される任意選択的に置換された環である、請求項26に記載の化合物。

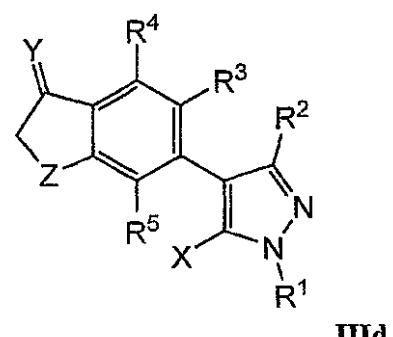
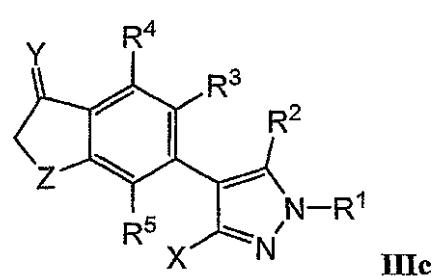
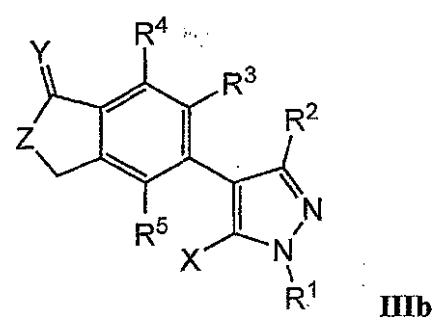
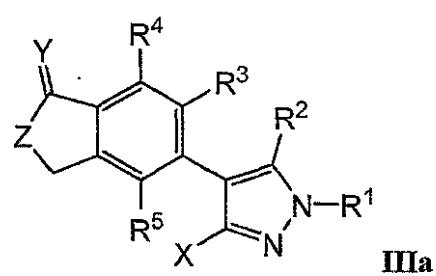
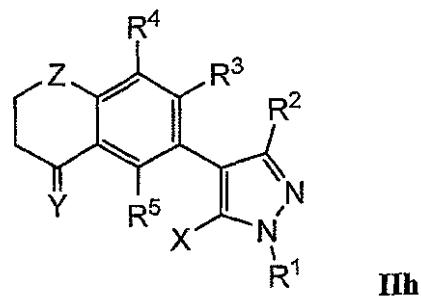
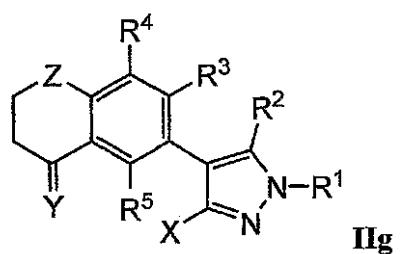
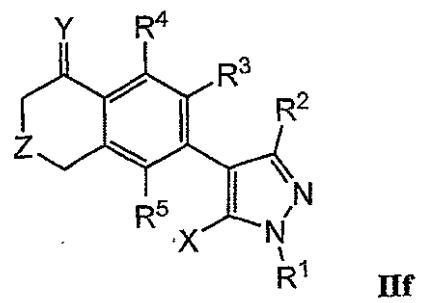
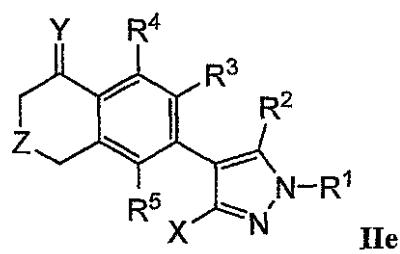
## 【請求項29】

式IIa～hおよびIIIa～f：

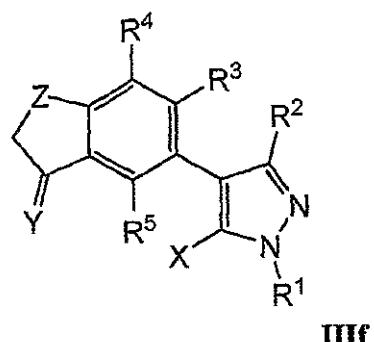
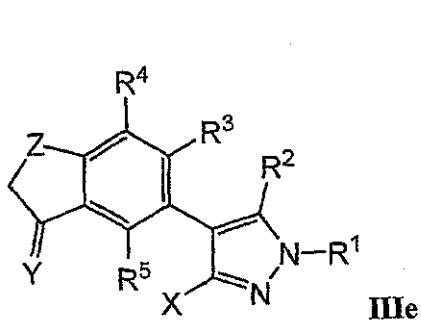
【化 6】



【化 7】



## 【化 8】



から選択され、

式中、Zは、 $\text{CR}^{2-0}\text{R}^{2-1}$ 、C(=Y)、 $\text{NR}^{2-0}$ 、O、およびSから選択される、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項30】

Zが $\text{CH}_2$ である、請求項29に記載の化合物。

## 【請求項31】

ZがOである、請求項29に記載の化合物。

## 【請求項32】

YがOである、請求項29に記載の化合物。

## 【請求項33】

Yが $\text{N-OR}^{2-0}$ である、請求項29に記載の化合物。

## 【請求項34】

Yが $\text{N-OH}$ である、請求項33に記載の化合物。

## 【請求項35】

ZがOであり、Yが $\text{N-OR}^{2-0}$ である、請求項29に記載の化合物。

## 【請求項36】

Zが $\text{CH}_2$ であり、Yが $\text{N-OR}^{2-0}$ である、請求項29に記載の化合物。

## 【請求項37】

$\text{R}^1$ および $\text{R}^2$ が、結合する原子と共に、O、N、およびSから選択される少なくとも2つのヘテロ原子を有する5または6員縮合複素環を形成する、式IIIA、IIIC、IIIE、IIIG、IIIA、IIIC、およびIIIEから選択される、請求項29に記載の化合物。

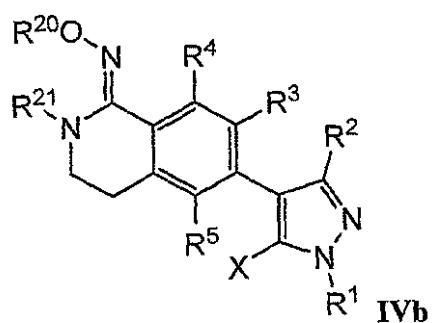
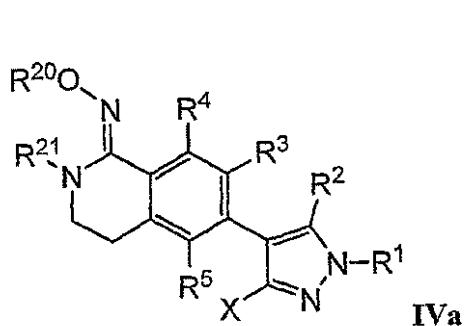
## 【請求項38】

$\text{R}^1$ および $\text{R}^2$ が、結合する原子と共に、縮合ピリミジン環を形成する、請求項37に記載の化合物。

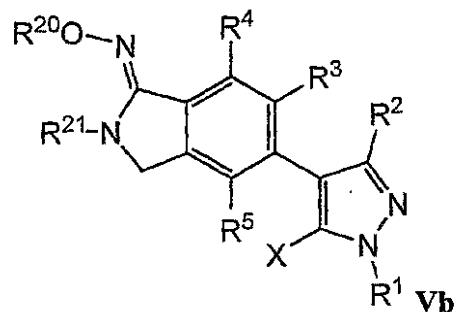
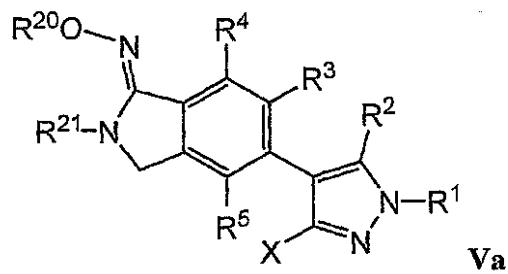
## 【請求項39】

式IVa、IVb、Va、およびVb：

## 【化9】



## 【化10】



から選択される、請求項29に記載の化合物。

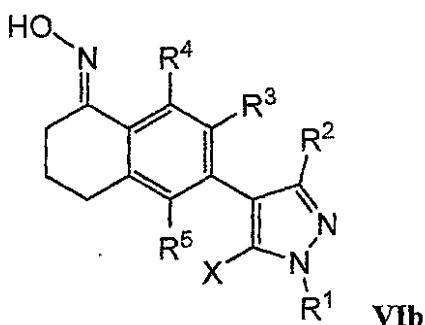
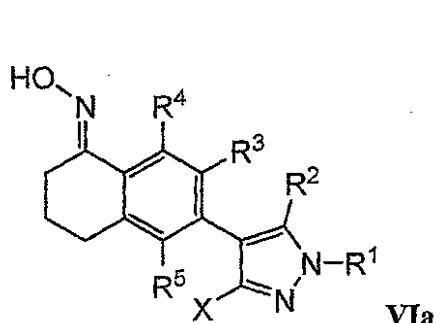
## 【請求項40】

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>が、結合する原子と共に、O、N、およびSから選択される少なくとも2つのヘテロ原子を有する5または6員縮合複素環を形成する、式I V aおよびV aから選択される、請求項39に記載の化合物。

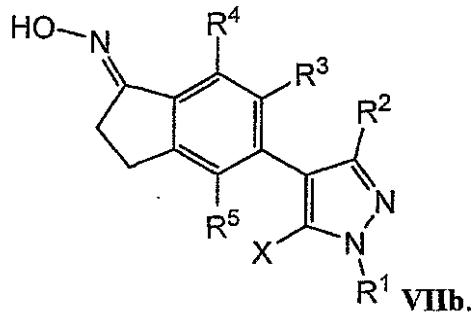
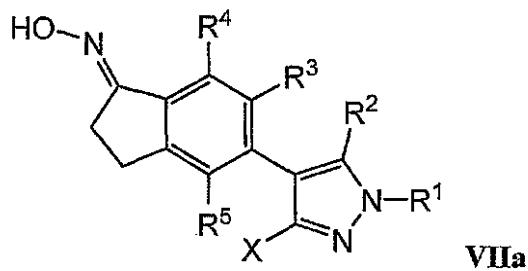
## 【請求項41】

式V I a、V I b、V I I a、およびV I I b：

## 【化11】



【化 1 2】



から選択される、請求項 29 に記載の化合物。

## 【請求項 4 2】

式ⅤⅠaおよびⅤⅡaのR<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>が、結合する原子と共に、O、N、およびSから選択される少なくとも2つのヘテロ原子を有する5または6員縮合複素環を形成する、請求項4.1に記載の化合物。

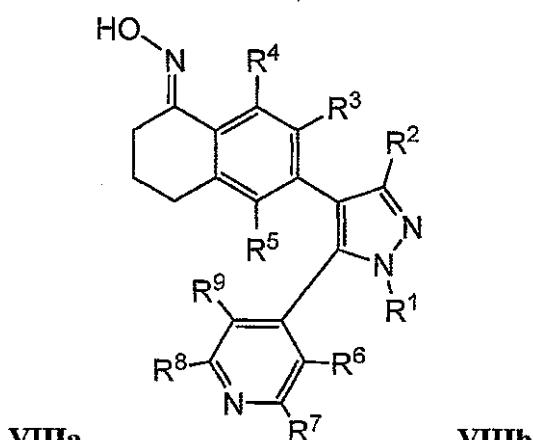
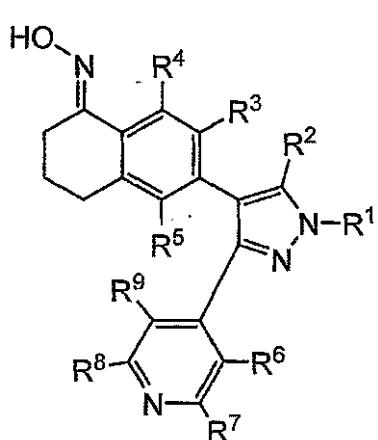
### 【請求項 4 3】

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> が、結合する原子と共に、縮合ピリミジン環を形成する、請求項 4 2 に記載の化合物。

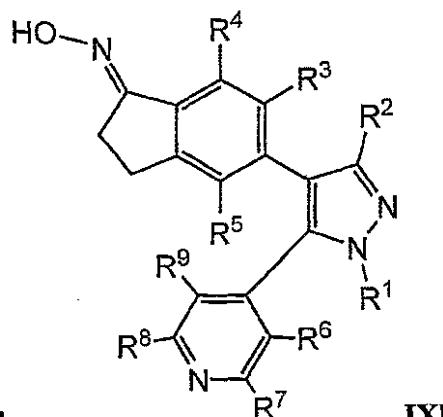
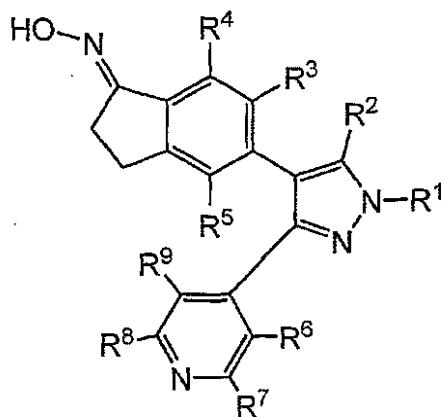
#### 【請求項 4 4】

式  $VTTTa$ ,  $VTTTh$ ,  $TXa$ , および  $TXh$  。

【化 1 3 】



### 【化 1 4】



から選択され、

式中、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、およびR<sup>9</sup>は、H、F、C<sub>1</sub>、Br、I、-C(=Y)R<sup>2</sup>0  
 、-C(=Y)OR<sup>2</sup>0、-C(=Y)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-NR<sup>2</sup>0  
 C(=Y)R<sup>2</sup>1、-NR<sup>2</sup>0C(=Y)OR<sup>2</sup>1、-NR<sup>2</sup>3C(=Y)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>  
 1、-OR<sup>2</sup>0、-OC(=Y)R<sup>2</sup>0、-OC(=Y)OR<sup>2</sup>0、-OC(=Y)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>  
 2<sup>0</sup>R<sup>2</sup>1、-OS(O)<sub>2</sub>(OR<sup>2</sup>0)、-OP(=Y)(OR<sup>2</sup>0)(OR<sup>2</sup>1)、  
 -OP(OR<sup>2</sup>0)(OR<sup>2</sup>1)、-P(=Y)(OR<sup>2</sup>0)(OR<sup>2</sup>1)、-P(=Y)  
 (OR<sup>2</sup>3)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-SR<sup>2</sup>0、-S(O)R<sup>2</sup>0、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>2</sup>0、  
 -S(O)<sub>2</sub>NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、-S(O)(OR<sup>2</sup>0)、-S(O)<sub>2</sub>(OR<sup>2</sup>0)、-  
 SC(=Y)R<sup>2</sup>0、-SC(=Y)OR<sup>2</sup>0、-SC(=Y)NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1、5~7  
 員環ラクタム、5~7員環ラクトン、5~7員環スルタム、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~  
 C<sub>8</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>カルボシクリル、C<sub>6</sub>~C<sub>20</sub>ア  
 リール、およびC<sub>2</sub>~C<sub>20</sub>ヘテロシクリルから独立して選択され、前記アルキル、アル  
 ケニル、アルキニル、カルボシクリル、アリール、およびヘテロシクリルは、F、C<sub>1</sub>、  
 Br、I、OR<sup>2</sup>0、NR<sup>2</sup>0R<sup>2</sup>1-SR<sup>2</sup>0、-S(O)R<sup>2</sup>0、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>2</sup>  
 0、アルキル、アルケニル、アルキニル、カルボシクリル、アリール、およびヘテロシクリ  
 ルから独立して選択される1つまたは複数の基と任意選択的に置換される、請求項41  
 に記載の化合物。

### 【請求項 4 5】

$R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、および $R^5$ がHである、請求項4.4に記載の化合物。

### 【請求項 4 6】

$R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、および $R^9$ がHである、請求項44に記載の化合物。

### 【請求項 4 7】

R<sup>1</sup> が、H または任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキルである、請求項 4 4 に記載の化合物。

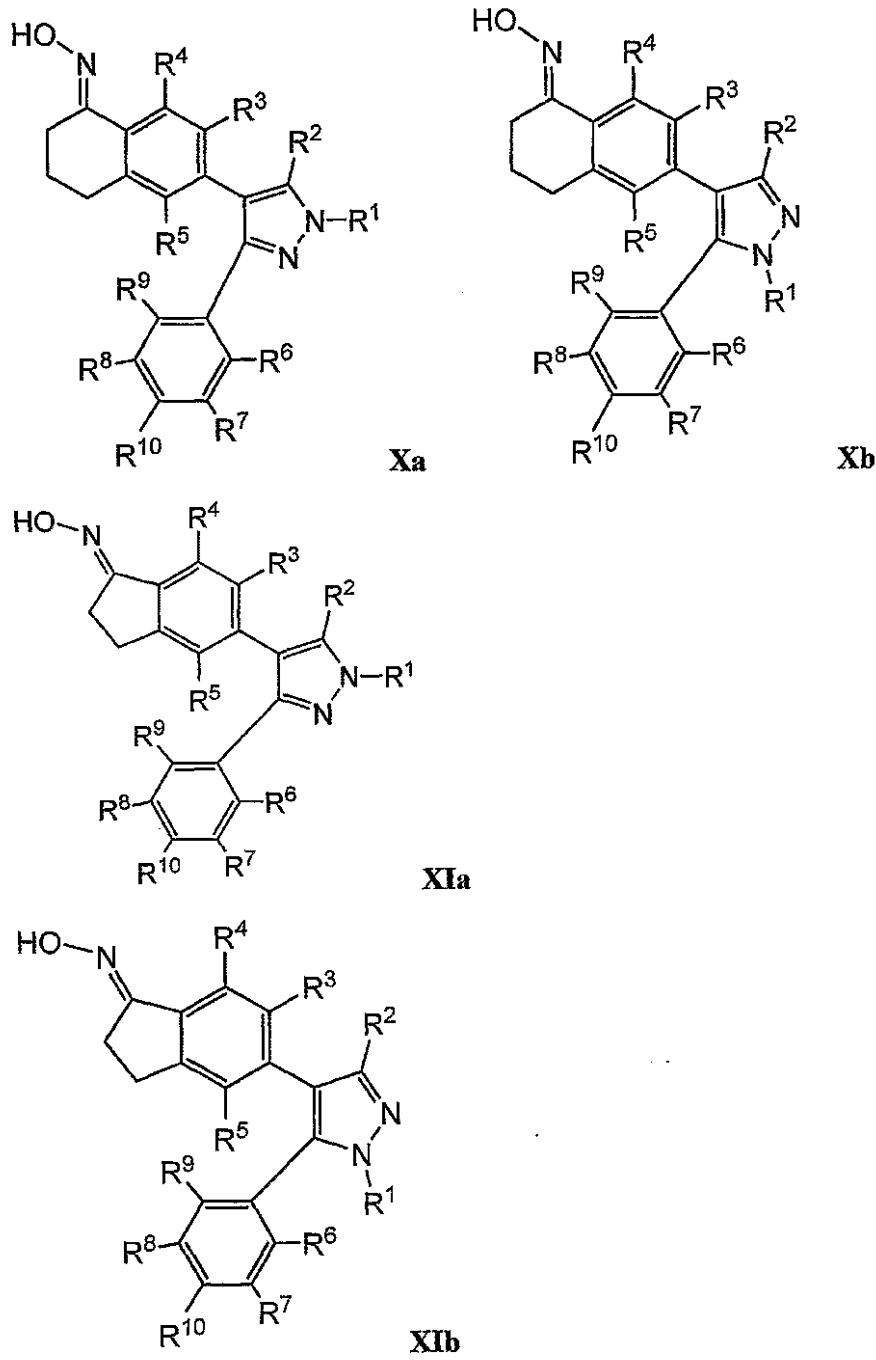
### 【請求項 4 8】

式  $V\text{I}\text{I}\text{I}\text{I}\text{a}$  および  $\text{IX}\text{a}$  の  $\text{R}^1$  および  $\text{R}^2$  が、結合する原子と共に、 $\text{O}$ 、 $\text{N}$ 、および  $\text{S}$  から選択される少なくとも 2 つのヘテロ原子を有する 5 または 6 員縮合複素環を形成する。請求項 4.4 に記載の化合物

### 三、請求項

式 X a X b X T a または X T b :

【化 1 5 】



から選択され、

式中、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ は、 $H$ 、 $F$ 、 $C_1$ 、 $B_r$ 、 $I$ 、 $-OR^2$ 、 $-C(=Y)R^{20}$ 、 $-C(=Y)OR^{20}$ 、 $-C(=Y)NR^{20}R^{21}$ 、 $-NR^{20}R^{21}$ 、 $-NR^{20}C(=Y)R^{21}$ 、 $-NR^{20}C(=Y)OR^{21}$ 、 $-NR^{20}C(=Y)NR^{20}R^{21}$ 、 $-OC(=Y)R^{20}$ 、 $-OC(=Y)OR^{20}$ 、 $-OC(=Y)NR^{20}R^{21}$ 、 $-OS(O)_2(OR^{20})$ 、 $-OP(=Y)(OR^{20})(OR^{21})$ 、 $-OP(=Y)(OR^{20})(OR^{21})$ 、 $-P(=Y)(OR^{20})(OR^{21})$ 、 $-P(=Y)(OR^{23})NR^{20}R^{21}$ 、 $-SR^{20}$ 、 $-S(O)R^{20}$ 、 $-S(O)R^{20}$ 、 $-S(O)_2NR^{20}R^{21}$ 、 $-S(O)(OR^{20})$ 、 $-S(O)_2(OR^{20})$ 、 $-SC(=Y)R^{20}$ 、 $-SC(=Y)OR^{20}$ 、 $-SC(=Y)NR^{20}R^{21}$ 、5~7員環ラクタム、5~7員環ラクトン、5~7員環スルタム、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$ カルボシクリル、 $C_6 \sim C_{20}$ アリール、および $C_2 \sim C_{20}$ 複素環から独立して選択され、前記アルキル、アル

ケニル、アルキニル、カルボシクリル、アリール、および複素環は、F、Cl、Br、I、OR<sup>2</sup>、NR<sup>2</sup>、R<sup>2</sup>、-SR<sup>2</sup>、-S(O)R<sup>2</sup>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>2</sup>、アルキル、アルケニル、アルキニル、カルボシクリル、アリール、および複素環から独立して選択される1つまたは複数の基と任意選択的に置換される、請求項29に記載の化合物。

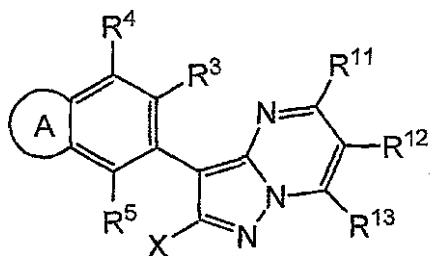
【請求項50】

式XaおよびXIaのR<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>が、結合する原子と共に、O、N、およびSから選択される少なくとも2つのヘテロ原子を有する5または6員縮合複素環を形成する、請求項49に記載の化合物。

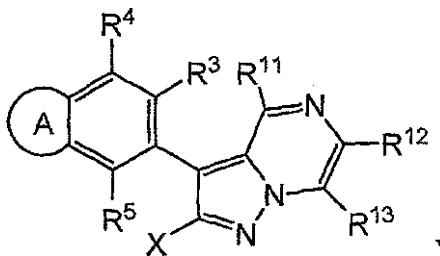
【請求項51】

式XIIda～dおよびXIIda～j：

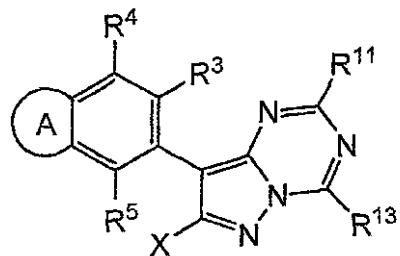
【化16】



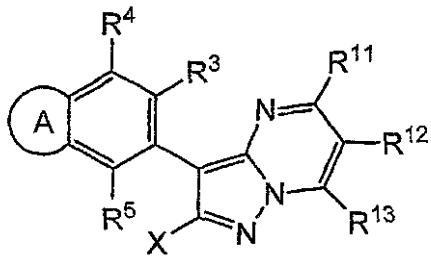
XIIa



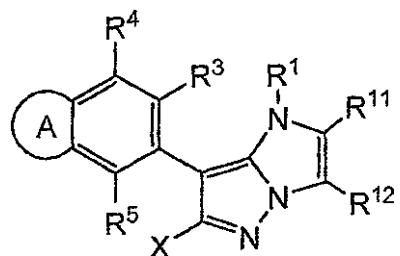
XIIb



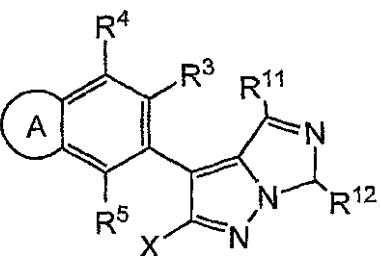
XIIc



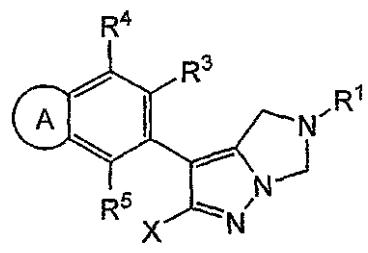
XIIId



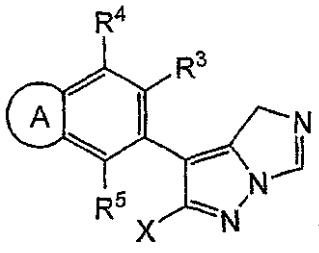
XIIIa



XIIIb

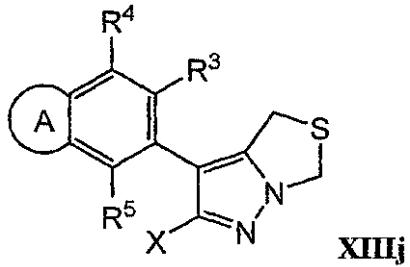
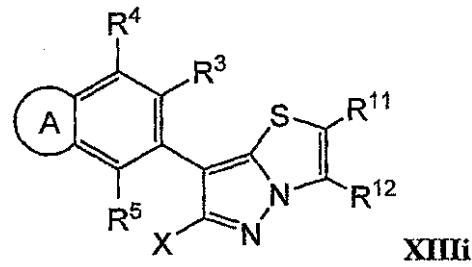
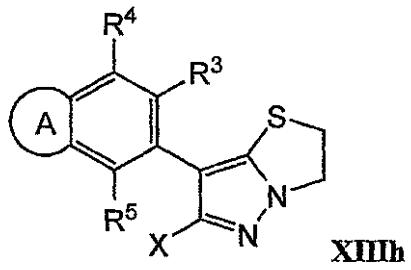
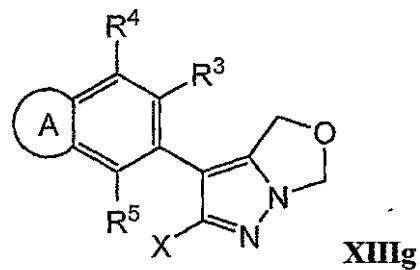
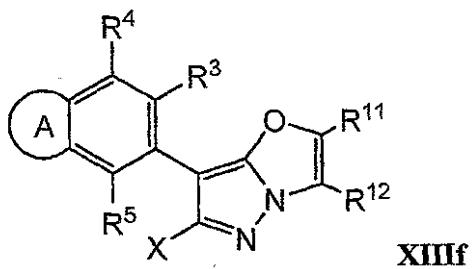
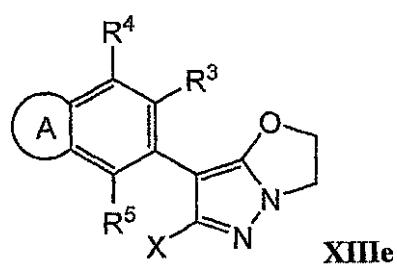


XIIIc



XIIIId

## 【化17】



から選択され、

式中、R<sup>1-1</sup>、R<sup>1-2</sup>、およびR<sup>1-3</sup>は、H、F、Cl、Br、I、-OR<sup>2-0</sup>、-C(=Y)R<sup>2-0</sup>、-C(=Y)OR<sup>2-0</sup>、-C(=Y)NR<sup>2-0</sup>R<sup>2-1</sup>、-NR<sup>2-0</sup>R<sup>2-1</sup>、-NR<sup>2-0</sup>C(=Y)R<sup>2-1</sup>、-NR<sup>2-0</sup>C(=Y)OR<sup>2-1</sup>、-NR<sup>2-3</sup>C(=Y)NR<sup>2-0</sup>R<sup>2-1</sup>、-OC(=Y)R<sup>2-0</sup>、-OC(=Y)OR<sup>2-0</sup>、-OC(=Y)NR<sup>2-0</sup>R<sup>2-1</sup>、-OS(=O)<sub>2</sub>(OR<sup>2-0</sup>)、-OP(=Y)(OR<sup>2-0</sup>)(OR<sup>2-1</sup>)、-OP(=Y)(OR<sup>2-1</sup>)(OR<sup>2-0</sup>)、-P(=Y)(OR<sup>2-0</sup>)(OR<sup>2-1</sup>)、-P(=Y)(OR<sup>2-3</sup>)(NR<sup>2-0</sup>R<sup>2-1</sup>)、-SR<sup>2-0</sup>、-S(=O)R<sup>2-0</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>R<sup>2-0</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>2-0</sup>R<sup>2-1</sup>、-S(=O)(OR<sup>2-0</sup>)、-S(=O)<sub>2</sub>(OR<sup>2-0</sup>)、-SC(=Y)R<sup>2-0</sup>、-SC(=Y)OR<sup>2-0</sup>、-SC(=Y)NR<sup>2-0</sup>R<sup>2-1</sup>、5~7員環ラクタム、5~7員環ラクトン、5~7員環スルタム、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>カルボシクリル、C<sub>6</sub>~C<sub>20</sub>アリール、およびC<sub>2</sub>~C<sub>20</sub>複素環から独立して選択され、ここで、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、カルボシクリル、アリール、および複素環は、F、Cl、Br、I、OR<sup>2-0</sup>、NR<sup>2-0</sup>R<sup>2-1</sup>、-SR<sup>2-0</sup>、-S(=O)R<sup>2-0</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>R<sup>2-0</sup>、アルキル、アルケニル、アルキニル、カルボシクリル、アリール、および複素環から独立して選択される1つまたは複数の基と任意選択的に置換される、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項52】

Xが、フェニル、ナフチル、およびビフェニル、ならびにその置換形態から選択される、請求項51に記載の化合物。

## 【請求項53】

Xが、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、2-イミダゾリル、4-イミダゾリル、3-ピラゾリル、4-ピラゾリル、2-チアゾリル、4-チアゾリル、および5-チアゾリル、ならびにその置換形態から選択される、請求項51に記載の化合物。

## 【請求項54】

Xが任意選択的に置換された4-ピリジルである、請求項51に記載の化合物。

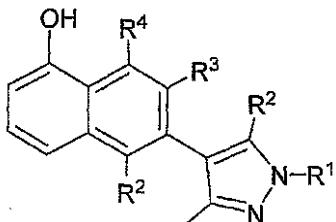
## 【請求項 5 5】

環 A が、シクロペンチル、シクロペンテニル、シクロヘキシル、シクロヘキセニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロピリジル、ピペラジニル、ピロリジニル、ピリジル、ピリミジニル、チオフェニル、およびフェニルから選択される任意選択的に置換された環である、請求項 5 1 に記載の化合物。

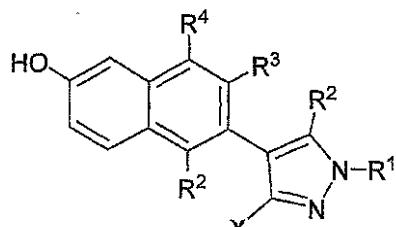
## 【請求項 5 6】

式 X I V a ~ d :

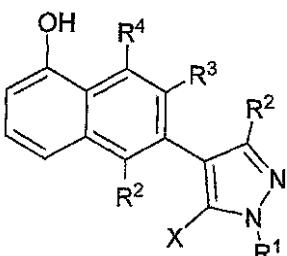
## 【化 1 8】



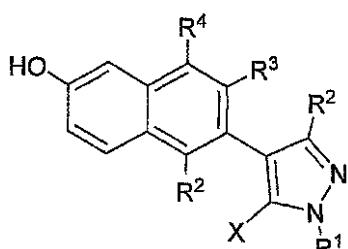
XIVa



XIVb



XIVc



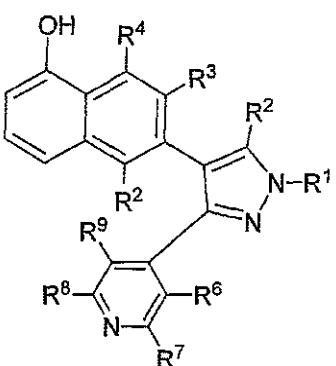
XIVd

から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

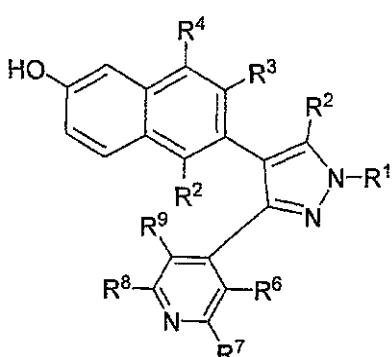
## 【請求項 5 7】

式 X V a ~ d :

## 【化 1 9】

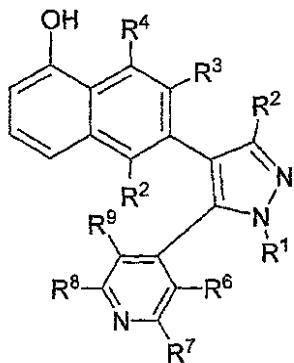


XVa

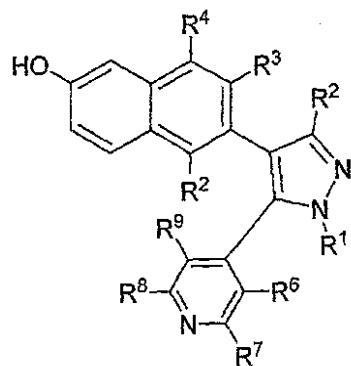


XVb

## 【化 2 0】



XVc



XVd

から選択される、請求項 5 6 に記載の化合物。

## 【請求項 5 8】

5 - ( 1 - ( 2 - アミノエチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - ( 3 - アミノプロピル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - ( 4 - アミノブチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - ( ピロリジン - 3 - イル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - ( ピペリジン - 4 - イル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - ( 4 - メチルピペリジニル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - ( 3 R - テトラヒドロフラニル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - ( 3 S - テトラヒドロフラニル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - ( 4 - テトラヒドロピラニル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - ( 3 S - ( 1 R - ヒドロキシ ) シクロヘキシル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - ( 2 , 3 ジヒドロキシプロピル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - メチル - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - ( 3 - シアノ - ピリジン - 2 - イル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - ( 3 S - ( 1 S - ヒドロキシ ) シクロヘキシル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - ( 3 - アミノメチル - ピリジン - 2 - イル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - ( 5 - ( アミノメチル ) ピリジン - 2 - イル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - ( 3 S - ( 1 S , 2 R - ジヒドロキシ ) シクロヘキシル ) - 3 - ピリジン -

4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;

5 - ( 1 - ( 3 - メトキシアセトアミドプロピル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;

5 - ( 1 - ( 4 - アミノメチルフェニル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;

5 - ( 1 - ( 5 - ( アセトアミド ) ピリジン - 2 - イル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;

5 - ( 1 - メチル - 5 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;

5 - ( 1 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - 5 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;

5 - ( 2 - ( ピリジン - 4 - イル ) ピラゾロ [ 1 . 5 - a ] ピリミジン - 3 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;

5 - ( 1 - ( 2 S - ( 1 S - ヒドロキシ ) シクロペンチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;

5 - ( 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;

5 - ( 1 - シクロペンチル - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;

5 - ( 1 - ( 2 - ( 4 - メチルピペラジニル ) エチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;

5 - ( 1 - メチル - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - ベンゾフラン - 3 ( 2 H ) - オンオキシム ;

5 - ( 1 - メチル - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロクロメン - 4 - オンオキシム ;

5 - ( 1 - メチル - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オン ;

5 - ( 1 - ( 2 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) アミノエチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;

5 - ( 1 - ( 2 - ( 4 - メチルピペラジニル ) エチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - アミン ;

5 - ( 2 - ヒドロキシエチル - 5 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - アミン ;

5 - ( 1 - ( 2 S - ( 1 S - ヒドロキシ ) シクロペンチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - アミン ;

5 - ( 1 - ( 2 - ( N - ピペリジル ) エチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;

5 - ( 1 - メチル - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 ( 2 H ) - オンオキシム ;

5 - ( 1 - ( 4 - ピペリジル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロシクロペンタ [ c ] フェニルピラゾール ;

5 - ( 1 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オン ;

5 - ( 1 - ( 4 - ( N - メチルピペリジル ) ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;

5 - ( 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オン ;

5 - ( 1 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - インドリン - 2 - オン ;

5 - ( 1 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - イソキノリン - 1 - オール ;  
 5 - ( 1 - メチル - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - インドリン - 2 - オン ;  
 5 - ( 1 - 酢酸 - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロインデン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロフタラジン - 1 , 4 - ジオン ;  
 5 - ( 1 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 6 - 1 H - インドール ;  
 5 - ( 1 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 - ( 2 - メトキシエチル ) イソインドリン - 1 , 3 - ジオン ;  
 5 - ( 1 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - ベンゾ [ d ] [ 1 , 3 ] ジオキソール ;  
 5 - ( 1 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - キナゾリン - 4 ( 3 H ) - オン ;  
 5 - ( 1 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - アミン ;  
 5 - ( 1 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - N - t e r t - ブチルオキシカルボニル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - アミン ;  
 5 - ( 1 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 5 - 1 H - インドール ;  
 5 - ( 1 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) - 3 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) - 5 - イソインドリン - 1 , 3 - ジオン ;  
 ( Z ) - 5 - ( 1 - メチル - 3 - ( ピリジン - 4 - イル ) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) イソインドリン - 1 - オンオキシム ;  
 ( Z ) - 5 - ( 1 - ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル ) - 3 - ( ピリジン - 4 - イル ) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) イソインドリン - 1 - オンオキシム ;  
 5 - ( 1 - ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル ) - 3 - ( ピリジン - 4 - イル ) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) イソインドリン - 1 - イミン ;  
 6 - ( 1 - メチル - 3 - ( ピリジン - 4 - イル ) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) ナフタレン - 1 - オール ;  
 6 - ( 1 - ( ( 1 S , 2 S ) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル ) - 3 - ( ピリジン - 4 - イル ) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) ナフタレン - 1 - オール ; および  
 6 - ( 1 - メチル - 3 - ( ピリジン - 4 - イル ) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ) ナフタレン - 2 - オール

から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

#### 【請求項 5 9】

請求項 1 に記載の化合物および薬学的に許容可能なキャリアから構成される薬学的組成物。

#### 【請求項 6 0】

抗増殖薬、抗炎症薬、免疫調節薬、神経栄養因子、心血管疾患の治療薬、肝疾患の治療薬、抗ウイルス薬、血液疾患の治療薬、糖尿病の治療薬、または免疫不全障害の治療薬から選択されるさらなる治療薬をさらに含む、請求項 5 9 に記載の組成物。

#### 【請求項 6 1】

R a f キナーゼ活性を検出可能に阻害する量の請求項 1 に記載の化合物および薬学的に許容可能なキャリア、アジュバント、またはビヒクルを含む組成物。

#### 【請求項 6 2】

患者における癌、脳卒中、糖尿病、肝肥大、心血管疾患、アルツハイマー病、囊胞性線

維症、ウイルス性疾患、自己免疫疾患、アテローム性動脈硬化症、再狭窄、乾癬、アレルギー性障害、炎症、神経障害、ホルモン関連疾患、臓器移植に関連する容態、免疫不全障害、破壊性骨障害、増殖性障害、感染症、細胞死に関連する容態、トロンビン誘導血小板凝集、慢性骨髄性白血病（CML）、肝疾患、T細胞活性化に関与する病的免疫容態、およびCNS障害からなる群から選択される疾患または容態を治療あるいはこれらの疾患または容態の重症度を軽減するための組成物であって、治療に有効な請求項1に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項63】

治療を必要とする哺乳動物の癌を治療するための組成物であって、治療有効量の請求項1に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項64】

癌が、乳房癌、卵巣癌、子宮頸癌、前立腺癌、精巣癌、尿生殖路癌、食道癌、喉頭癌、神経膠芽腫、神経芽細胞腫、胃癌、皮膚癌、角化棘細胞腫、肺癌、類表皮癌、大細胞癌、非小細胞肺癌（NSCLC）、小細胞癌、肺腺癌、骨癌、結腸癌、腺腫、脾臓癌、腺癌、甲状腺癌、濾胞状癌、未分化癌、乳頭状癌、精上皮腫、黒色腫、肉腫、膀胱癌、肝癌、胆汁道癌、腎癌、骨髄障害、リンパ様障害、有毛細胞癌、頬側口腔および咽頭（経口）の癌、唇、舌、口腔、咽頭、小腸、結腸-直腸、大腸、直腸、脳、および中枢神経系の癌、ホジキン病、および白血病から選択される、請求項63に記載の組成物。

【請求項65】

治療を必要とする哺乳動物の再狭窄、心拡大、アテローム性動脈硬化症、心筋梗塞、またはうっ血性心不全から選択される心血管疾患を治療するための組成物であって、治療有効量の請求項1に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項66】

治療を必要とする哺乳動物の外傷、グルタミン酸神経毒性症状、または低酸素に起因するアルツハイマー病、パーキンソン病、筋萎縮性側索硬化症、ハンチントン病、脳虚血、または神経変性疾患から選択される神経変性疾患を治療するための組成物であって、治療有効量の請求項1に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項67】

治療を必要とする哺乳動物の関節リウマチ、乾癬、接触皮膚炎、および遅延型過敏症反応から選択される炎症性疾患を治療するための組成物であって、治療有効量の請求項1に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項68】

癌の予防薬または治療薬の製造における、請求項1に記載の化合物の使用。

【請求項69】

心血管疾患の予防薬または治療薬の製造における、請求項1に記載の化合物の使用。

【請求項70】

神経変性疾患の予防薬または治療薬の製造における、請求項1に記載の化合物の使用。

【請求項71】

炎症性疾患の予防薬または治療薬の製造における、請求項1に記載の化合物の使用。

【請求項72】

過剰増殖障害の治療のためのキットであって、

- a) 請求項1に記載の化合物を含む第1薬学的組成物、および
- b) 使用説明書

を含む、キット。

【請求項73】

(c) 第2薬学的組成物をさらに含み、第2薬学的組成物が、抗高増殖活性を有する第2化合物を含む、請求項72に記載のキット。

【請求項74】

前記第1および第2薬学的組成物を必要とする患者に同時、連続、または個別に投与するための説明書をさらに含む、請求項73に記載のキット。

## 【請求項 7 5】

前記第1および第2薬学的組成物が個別の容器に含まれる、請求項73に記載のキット。

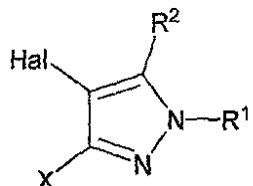
## 【請求項 7 6】

前記第1および第2薬学的組成物が同一の容器に含まれる、請求項73に記載のキット。

## 【請求項 7 7】

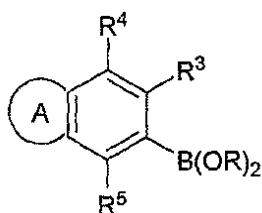
ハロ-ピラゾール化合物：

## 【化21】



を、縮合環Aボロン酸化合物：

## 【化22】



と反応させる工程であって、

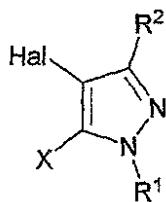
該ハロ-ピラゾール化合物の式中、Halは、I、Br、またはClであり、

該縮合環Aボロン酸化合物の式中、Rは、HまたはC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、工程を含む、請求項1に記載の式Iaの化合物を作製する方法。

## 【請求項 7 8】

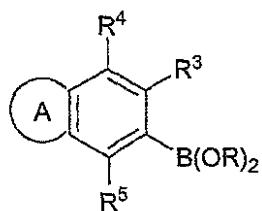
ハロ-ピラゾール化合物：

## 【化23】



を、縮合環Aボロン酸化合物：

## 【化24】



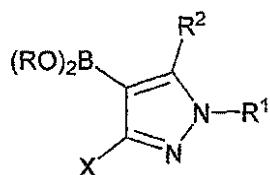
と反応させる工程であって、

該ハロ-ピラゾール化合物の式中、Halは、I、Br、またはClであり、

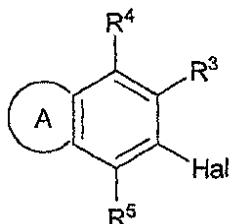
該縮合環Aボロン酸化合物の式中、Rは、HまたはC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、工程を含む、請求項1に記載の式Ibの化合物を作製する方法。

## 【請求項 7 9】

ピラゾールボロン酸化合物：  
【化25】



を、ハロ置換縮合環A化合物：  
【化26】



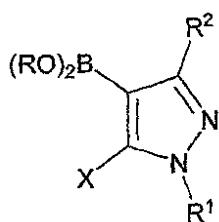
と反応させる工程であって、

該ピラゾールボロン酸化合物の式中、Rは、HまたはC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルであり、  
該ハロ置換縮合環A化合物の式中、Halは、I、Br、またはClである、工程を含む  
、請求項1に記載の式Iaの化合物を作製する方法。

【請求項80】

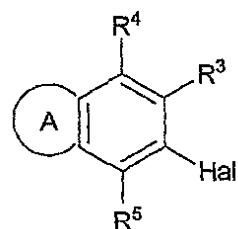
ハロ-ピラゾール化合物：

【化27】



を、縮合環Aボロン酸化合物：

【化28】



と反応させる工程であって、

該ハロ-ピラゾール化合物の式中、Halは、I、Br、またはClであり、  
該縮合環Aボロン酸化合物の式中、Rは、HまたはC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキルである、工程を含む  
、請求項1に記載の式Ibの化合物を作製する方法。