

【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24年12月13日(2012.12.13)

【公表番号】特表2011-502994(P2011-502994A)

【公表日】平成23年1月27日(2011.1.27)

【年通号数】公開・登録公報2011-004

【出願番号】特願2010-532265(P2010-532265)

【国際特許分類】

C 07 D	471/04	(2006.01)
A 61 K	31/437	(2006.01)
A 61 K	31/4545	(2006.01)
A 61 K	31/444	(2006.01)
A 61 K	31/496	(2006.01)
A 61 K	31/5377	(2006.01)
A 61 P	3/10	(2006.01)
A 61 P	11/06	(2006.01)
A 61 P	17/06	(2006.01)
A 61 P	19/02	(2006.01)
A 61 P	25/00	(2006.01)
A 61 P	29/00	(2006.01)
A 61 P	35/02	(2006.01)
A 61 P	37/02	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
C 07 B	61/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D	471/04	1 0 6 C
C 07 D	471/04	C S P
A 61 K	31/437	
A 61 K	31/4545	
A 61 K	31/444	
A 61 K	31/496	
A 61 K	31/5377	
A 61 P	3/10	
A 61 P	11/06	
A 61 P	17/06	
A 61 P	19/02	
A 61 P	25/00	
A 61 P	29/00	1 0 1
A 61 P	35/02	
A 61 P	37/02	
A 61 P	43/00	1 1 1
C 07 B	61/00	3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成23年10月28日(2011.10.28)

【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

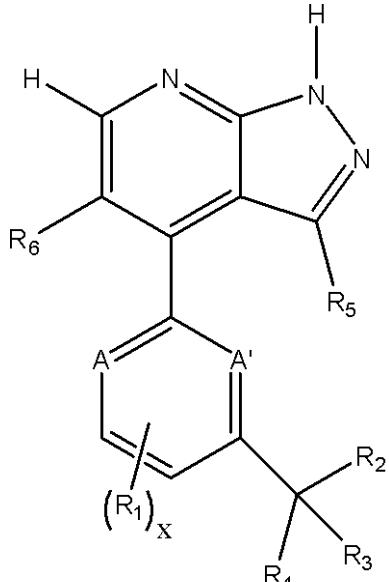
## 【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

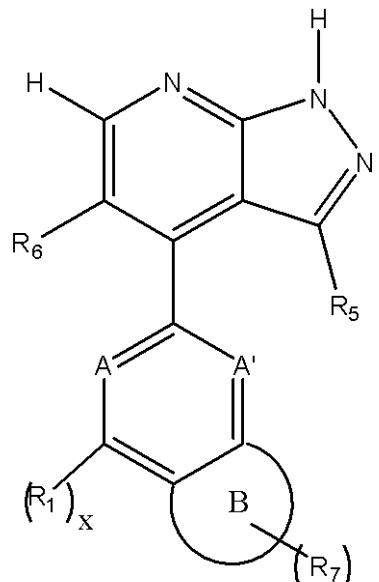
## 【請求項1】

構造式 I または IA により表わされる化合物：

## 【化140】



I



または

IA

; またはその薬剤として許容可能な塩。(式中、  
A および A' は独立して、 - N - または - C ( R<sup>+</sup> ) - であり、  
環 B は、 5 員または 6 員の飽和炭素環式環または複素環式環であり、  
R<sub>1</sub> は、ハロゲン、 - CN、 - NO<sub>2</sub>、または - T<sub>1</sub> - Q<sub>1</sub> であり、  
T<sub>1</sub> は、不在または C<sub>1</sub> - 10 脂肪族であり、式中、 T<sub>1</sub> の 1 個以上のメチレン単位は  
、任意にかつ独立して、 G に置き換えられ、式中、 G は、 - O - 、 - S ( O )<sub>p</sub> - 、 - N  
( R' ) - 、または - C ( O ) - であり、 T<sub>1</sub> は、任意にかつ独立して、 1 つ以上の J<sub>T<sub>1</sub></sub>  
で置換され、  
Q<sub>1</sub> は、不在、または O、 N、および S からなる群から独立して選択される 0 ~ 3 個の  
ヘテロ原子を有する 3 ~ 8 員の飽和、部分的に飽和、もしくは完全に不飽和な单環式環、  
または O、 N、および S からなる群から独立して選択される 0 ~ 5 個のヘテロ原子を有する  
8 ~ 12 員の飽和、部分的に飽和、もしくは完全に不飽和な二環式環であり、式中、 Q<sub>1</sub> は、  
任意にかつ独立して、 1 つ以上の J<sub>Q<sub>1</sub></sub> で置換され、式中、 R<sub>1</sub> が T<sub>1</sub> - Q<sub>1</sub> である  
場合、 T<sub>1</sub> および Q<sub>1</sub> は共に不在であることはなく、

R<sub>2</sub> は、 - H、 - ( CR<sup>++</sup><sub>2</sub> )<sub>n</sub> CN、 - ( CR<sup>++</sup><sub>2</sub> )<sub>n</sub> N ( R )<sub>2</sub>、 - ( CR<sup>++</sup><sub>2</sub> )<sub>n</sub> OR、 - ( CR<sup>++</sup><sub>2</sub> )<sub>n</sub> C ( O ) N ( R )<sub>2</sub>、または 1 個以上のハロゲン、フ  
エニル、 OR<sup>\*</sup>、もしくは N ( R<sup>\*</sup> )<sub>2</sub> で任意に置換される C<sub>1</sub> - 10 脂肪族であり、

各 R<sub>3</sub> および R<sub>4</sub> は独立して、 - H、ハロゲン、 C<sub>1</sub> - 10 脂肪族、ヘテロシクリル、  
ヘテロシクリルアルキル、アリール、またはアラルキルであり、式中、 R<sub>3</sub> および R<sub>4</sub> は  
、任意にかつ独立して、 C<sub>1</sub> - 10 アルキル、ハロゲン、 - CN、 - NO<sub>2</sub>、 - N ( R<sup>\*</sup> )<sub>2</sub>、  
- S ( O )<sub>p</sub> R<sup>\*</sup>、 - S ( O )<sub>p</sub> NR<sup>\*</sup>、 - C ( O ) N ( R<sup>\*</sup> )<sub>2</sub>、 - NR<sup>\*</sup> C ( O )、  
- OC ( O ) N ( R<sup>\*</sup> )<sub>2</sub>、 - N ( R<sup>\*</sup> ) C ( O ) OR<sup>\*</sup>、 - N ( R<sup>\*</sup> ) C ( O )  
N ( R<sup>\*</sup> )<sub>2</sub>、および - OR<sup>\*</sup> からなる群から選択される 1 個以上で置換され、

R<sub>3</sub> および R<sub>4</sub> は、それらが結合する炭素と共に、 C = O、または O、 N、および S から  
なる群から独立して選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 8 員の飽和、部分的に  
飽和、もしくは完全に不飽和な单環式環を形成し、式中、前記環は、任意にかつ独立して、 = O、 = S、 = N - R<sup>\*</sup>、 C<sub>1</sub> - 10 脂肪族、 C<sub>1</sub> - 10 ハロ脂肪族、ハロゲン、 -

C N、-N O<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sup>\*</sup>、-S(O)<sub>p</sub>N R<sup>\*</sup>、-C(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-N R<sup>\*</sup>C(O)、-O C(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)C(O)O R<sup>\*</sup>、-N(R<sup>\*</sup>)C(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換され、

各R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は独立して、-H、ハロゲン、C<sub>1-10</sub>ハロ脂肪族、またはC<sub>1-10</sub>脂肪族であり、

各R<sub>7</sub>は独立して、C<sub>1-10</sub>ハロ脂肪族、C<sub>1-10</sub>脂肪族、ハロゲン、-N O<sub>2</sub>、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>C N、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>N(R<sup>\*\*</sup>)<sub>2</sub>、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>OR<sup>\*\*</sup>、または-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>C(O)N(R<sup>\*\*</sup>)<sub>2</sub>であるか、または2つのR<sub>7</sub>基は、それらが結合する炭素と共に、C=Oを形成し、

各J<sub>T1</sub>は独立して、ハロゲン、-OR<sup>^</sup>、-N(R<sup>^</sup>)<sub>2</sub>、または-CNであり、

各J<sub>Q1</sub>は独立して、ハロゲン、C<sub>1-10</sub>アルキル、C<sub>1-10</sub>ハロアルキル、-OR'、-N(R')<sub>2</sub>、-CN、-NO<sub>2</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R'、-S(O)<sub>p</sub>NR'、アシル、カルバルコキシアルキル、またはアセトキシアルキルであり、

各R<sup>+</sup>は独立して、-H、ハロゲン、または5個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換されるC<sub>1-10</sub>アルキルであり、

各R<sup>++</sup>は独立して、-Hまたはハロゲンであり、

各R'は独立して、-H、または5個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換されるC<sub>1-10</sub>アルキルであり、

各R<sup>^</sup>は独立して、-H、C<sub>1-10</sub>アルキル、またはアラルキルであり、式中、各R<sup>^</sup>は、5個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換され、

各R''は独立して、-H、または5個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換されるC<sub>1-10</sub>アルキルであり、

各Rは独立して、-H、または5個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換されるC<sub>1-10</sub>アルキルであり、

各R\*は独立して、-H、または5個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換されるC<sub>1-10</sub>アルキルであり、

各R\*\*は独立して、-H、または5個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換されるC<sub>1-10</sub>アルキルであり、

xは、0または1であり、

yは、0、1、または2であり、

各nは独立して、0、1、2、または3であり、

各pは、独立して、0、1、または2である。)

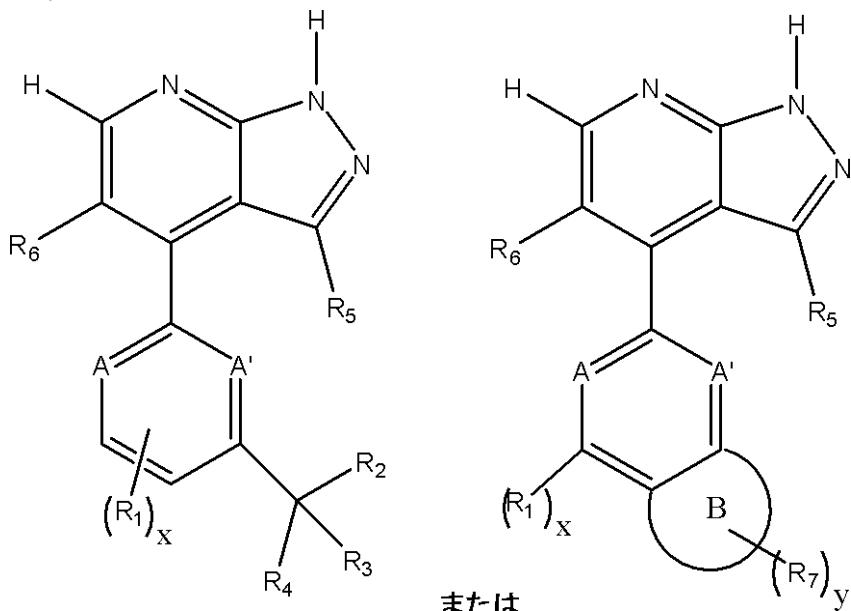
### 【請求項2】

R<sub>2</sub>は、-H、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>C N、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>N(R)<sub>2</sub>、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>OR、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>C(O)N(R)<sub>2</sub>、または1個以上のハロゲン、OR<sup>\*</sup>、もしくはN(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>で任意に置換されるC<sub>1-10</sub>脂肪族である、請求項1に記載の化合物。

### 【請求項3】

構造式IまたはIA:

【化141】

I  
により表わされる、請求項2に記載の化合物、

またはその薬剤として許容可能な塩。(式中、

AおよびA'は独立して、-N-または-C(R<sup>+</sup>)-であり、

環Bは、5員または6員の飽和炭素環式環または複素環式環であり、

R<sub>1</sub>は、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、または-T1-Q1であり、T1は、不在またはC1-10脂肪族であり、式中、T1の3個までのメチレン単位は、任意にかつ独立して、Gに置き換えられ、式中、Gは、-O-、-S(O)<sub>p</sub>-、-N(R')-、または-C(O)-であり、T1は、任意にかつ独立して、1つ以上のJ<sub>T1</sub>で置換され、Q1は、不在、またはO、N、およびSからなる群から独立して選択される0~3個のヘテロ原子を有する3~8員の飽和、部分的に飽和、もしくは完全に不飽和な单環式環、またはO、N、およびSからなる群から独立して選択される0~5個のヘテロ原子を有する8~12員の飽和、部分的に飽和、もしくは完全に不飽和な二環式環であり、式中、Q1は、任意にかつ独立して、1つ以上のJ<sub>Q1</sub>で置換され、式中、R<sub>1</sub>がT1-Q1である場合、T1およびQ1は共に不在であることはなく、R<sub>2</sub>は、-H、C1-10脂肪族、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>CN、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>N(R)<sub>2</sub>、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>OR、または-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>C(O)N(R)<sub>2</sub>であり、各R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は独立して、-H、ハロゲン、C1-10脂肪族、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、またはアラルキルであり、式中、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、任意にかつ独立して、C1-10アルキル、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sup>\*</sup>、-S(O)<sub>p</sub>NR<sup>\*</sup>、-C(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>\*</sup>C(O)、-OC(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)C(O)OR<sup>\*</sup>、-N(R<sup>\*</sup>)C(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換され、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、それらが結合する炭素と共に、C=O、またはO、N、およびSからなる群から独立して選択される0~3個のヘテロ原子を有する3~8員の飽和、部分的に飽和、もしくは完全に不飽和な单環式環を形成し、式中、前記環は、任意にかつ独立して、C1-10脂肪族、C1-10ハロ脂肪族、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sup>\*</sup>、-S(O)<sub>p</sub>NR<sup>\*</sup>、-C(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>\*</sup>C(O)、-OC(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)C(O)OR<sup>\*</sup>、-N(R<sup>\*</sup>)C(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換され、各R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は独立して、-H、ハロゲン、C1-10ハロ脂肪族、またはC1-

10 脂肪族であり、

各 R<sub>7</sub> は独立して、 C<sub>1</sub> - 10 ハロ脂肪族、 C<sub>1</sub> - 10 脂肪族、 ハロゲン、 - NO<sub>2</sub>、 - (CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>CN、 - (CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>N(R<sup>\*\*</sup>)<sub>2</sub>、 - (CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>OR<sup>\*\*</sup>、 または - (CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>C(O)N(R<sup>\*\*</sup>)<sub>2</sub> であるか、 または 2 つの R<sub>7</sub> 基は、 それらが結合する炭素と共に、 C = O を形成し、

各 J<sub>T1</sub> は独立して、 ハロゲン、 - OR<sup>^</sup>、 - N(R<sup>^</sup>)<sub>2</sub>、 または - CN であり、

各 J<sub>Q1</sub> は独立して、 ハロゲン、 C<sub>1</sub> - 10 アルキル、 C<sub>1</sub> - 10 ハロアルキル、 - OR'、 - N(R')<sub>2</sub>、 - CN、 - NO<sub>2</sub>、 - S(O)<sub>p</sub>R'、 - S(O)<sub>p</sub>NR'、 アシル、 カルバルコキシアルキル、 または アセトキシアルキルであり、

各 R<sup>+</sup> は独立して、 - H、 ハロゲン、 または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1</sub> - 10 アルキルであり、

各 R<sup>++</sup> は独立して、 - H または ハロゲンであり、

各 R' は独立して、 - H、 または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1</sub> - 10 アルキルであり、

各 R<sup>^</sup> は独立して、 - H、 または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1</sub> - 10 アルキルであり、

各 R<sup>''</sup> は独立して、 - H、 または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1</sub> - 10 アルキルであり、

各 R は独立して、 - H、 または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1</sub> - 10 アルキルであり、

各 R<sup>\*</sup> は独立して、 - H、 または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1</sub> - 10 アルキルであり、

各 R<sup>\*\*</sup> は独立して、 - H、 または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1</sub> - 10 アルキルであり、

x は、 0 または 1 であり、

y は、 0、 1、 または 2 であり、

各 n は独立して、 0、 1、 2、 または 3 であり、

各 p は、 独立して、 0、 1、 または 2 である。 )

#### 【請求項 4】

前記構造式が、 式 I により表わされる、 請求項 3 に記載の化合物。

#### 【請求項 5】

A は、 - N - または - C(R<sup>+</sup>) - であり、 A' は、 - C(R<sup>+</sup>) - である、 請求項 1、 2、 3、 または 4 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物。

#### 【請求項 6】

R<sup>+</sup> は、 - H である、 請求項 1 ~ 5 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物。

#### 【請求項 7】

R<sub>1</sub> は、 ハロゲン、 または - T<sub>1</sub> - Q<sub>1</sub> である、 請求項 1 ~ 6 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物。

#### 【請求項 8】

T<sub>1</sub> は、 不在または C<sub>1</sub> - 10 脂肪族であり、 式中、 T<sub>1</sub> の 3 個までのメチレン単位は、 任意にかつ独立して、 G に置き換えられ、 式中、 G は、 - O - 、 - N(R') - 、 または - C(O) - であり、 T<sub>1</sub> は、 任意にかつ独立して、 1 つ以上の J<sub>T1</sub> で置換される、 請求項 1 ~ 7 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物。

#### 【請求項 9】

Q<sub>1</sub> は、 不在、 または O、 N、 および S からなる群から独立して選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 8 員の飽和、 部分的に飽和、 もしくは完全に不飽和な单環式環であり、 式中、 Q<sub>1</sub> は、 任意にかつ独立して、 1 個以上の J<sub>Q1</sub> で置換される、 請求項 1 ~ 8 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物。

#### 【請求項 10】

各 J<sub>T1</sub> は、 独立して、 - OR<sup>^</sup>、 - N(R<sup>^</sup>)<sub>2</sub>、 または - CN である、 請求項 1 ~ 9

のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項11】**

各 $J_{Q_1}$ は独立して、C1-10脂肪族、-OR'、-N(R')<sub>2</sub>、またはアシルである、請求項1~10のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項12】**

$R_2$ は、C1-10脂肪族、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>CN、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>N(R)<sub>2</sub>、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>OR、または-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>C(O)N(R)<sub>2</sub>である、請求項1~11のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項13】**

各 $R_3$ および $R_4$ は独立して、-H、C1-10脂肪族、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、またはアラルキルであり、式中、 $R_3$ および $R_4$ は、任意にかつ独立して、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換されるか、または

$R_3$ および $R_4$ は、それらが結合する炭素と共に、C=O、またはO、N、およびSからなる群から独立して選択される0~3個のヘテロ原子を有する3~8員の飽和、部分的に飽和、もしくは完全に不飽和な单環式環を形成し、式中、前記環は、任意にかつ独立して、=O、=S、C1-10脂肪族、C1-10ハロ脂肪族、ハロゲン、-CN、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換される、請求項1~12のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項14】**

各 $R_3$ および $R_4$ は独立して、-H、C1-10脂肪族、シクロアルキルアルキルであり、式中、 $R_3$ および $R_4$ は、任意にかつ独立して、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換されるか、または

$R_3$ および $R_4$ は、それらが結合する炭素と共に、C=O、またはO、N、およびSからなる群から独立して選択される0~3個のヘテロ原子を有する3~8員の飽和、部分的に飽和、もしくは完全に不飽和な单環式環を形成し、式中、前記環は、任意にかつ独立して、C1-10脂肪族、C1-10ハロ脂肪族、ハロゲン、-CN、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換される、請求項1~12のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項15】**

Aは、-C(R<sup>+</sup>)-である、請求項1~14のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項16】**

$J_{T_1}$ は、-OR<sup>^</sup>である、請求項1~15のうちのいずれか1項に記載の化合物。

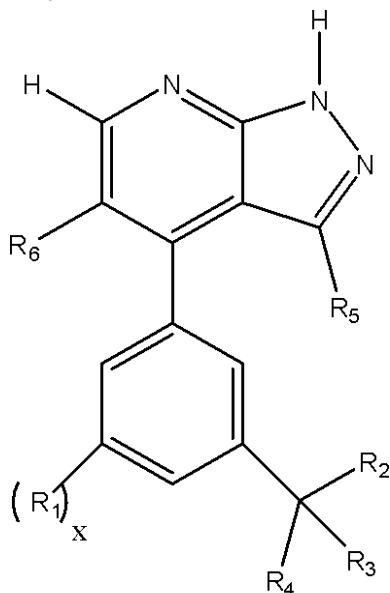
**【請求項17】**

$R_2$ は、-H、C1-10脂肪族、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>CN、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>N(R)<sub>2</sub>、または-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>ORである、請求項1~10、または12~16のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項18】**

前記化合物は、構造式IB:

## 【化142】



IIB  
により表わされる、請求項1～4、7～14、または16～17のうちのいずれか1項に記載の化合物、

またはその薬剤として許容可能な塩。

## 【請求項19】

$\text{R}_3$ および $\text{R}_4$ は、それらが結合する炭素と共に、O、N、およびSからなる群から独立して選択される0～3個のヘテロ原子を有する3～8員の飽和、もしくは部分的に飽和の単環式環を形成し、式中、前記環は、任意にかつ独立して、=O、=S、C1-10脂肪族、C1-10八口脂肪族、ハロゲン、-CN、-N( $\text{R}^*$ )<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換される、請求項1～13、または15～18のうちのいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項20】

$\text{R}_3$ および $\text{R}_4$ は、それらが結合する炭素と共に、シクロプロピル、シクロブチル、シクロヘキシリル、シクロペンチル、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、アゼパニル、ジアゼパニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、オキセタニル、イミダゾリニル、チアゾリジニル、またはオキサゾリジニルからなる群から選択される単環式環を形成し、式中、前記環は、任意にかつ独立して、=O、=S、C1-10脂肪族、C1-10八口脂肪族、ハロゲン、-CN、-N( $\text{R}^*$ )<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換される、請求項1～13、または15～18のうちのいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項21】

$\text{R}_2$ は、-H、またはC1-10脂肪族であり、

$\text{R}_3$ および $\text{R}_4$ は、それらが結合する炭素と共に、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、アゼパニル、ジアゼパニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、オキセタニル、イミダゾリニル、チアゾリジニル、またはオキサゾリジニルからなる群から選択される単環式環を形成し、式中、前記環は、任意にかつ独立して、=O、=S、C1-10脂肪族、C1-10八口脂肪族、ハロゲン、-CN、-N( $\text{R}^*$ )<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換される、請求項1～10、12～13、または15～20のうちのいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項22】

$\text{R}_2$ は、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>CN、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>N( $\text{R}$ )<sub>2</sub>、または-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>ORであり、

$\text{R}_3$ および $\text{R}_4$ は、それらが結合する炭素と共に、シクロプロピル、シクロブチル、シ

クロヘキシル、またはシクロペンチルからなる群から選択される单環式環を形成し、式中、前記環は、任意にかつ独立して、=O、=S、C1-10脂肪族、C1-10ハロ脂肪族、ハロゲン、-CN、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換される、請求項1～13、または15～20のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項23】**

R<sub>2</sub>は、-H、C1-10脂肪族、-(CR<sup>+</sup>)<sub>n</sub>CN、-(CR<sup>+</sup>)<sub>n</sub>N(R)<sub>2</sub>、-(CR<sup>+</sup>)<sub>n</sub>OR、または-(CR<sup>+</sup>)<sub>n</sub>C(O)N(R)<sub>2</sub>であり、各R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は独立して、-H、C1-10脂肪族、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、またはアラルキルであり、式中、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、任意にかつ独立して、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換される、請求項1～10、12～13、または15～19のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項24】**

R<sub>5</sub>は、-H、C1、C1-4ハロアルキル、またはC1-4アルキルであり、R<sub>6</sub>は、-HまたはC1-4アルキルである、請求項1～23のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項25】**

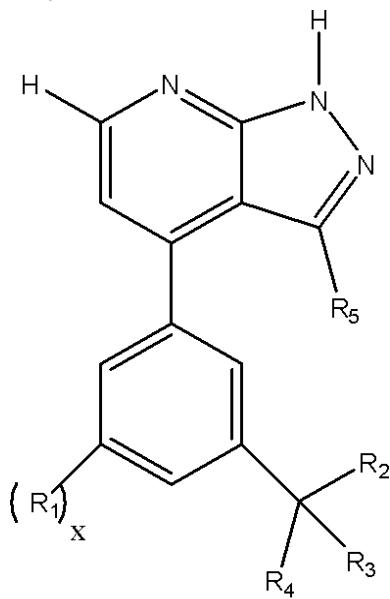
R<sub>5</sub>は、-H、C1、トリフルオロメチル、メチル、エチル、またはシクロプロピルであり、

R<sub>6</sub>は、-Hである、請求項1～24のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項26】**

前記化合物は、構造式IC：

**【化143】**



により表わされる、請求項1～4、7～14、または16～25のうちのいずれか1項に記載の化合物、

またはその薬剤として許容可能な塩。

**【請求項27】**

前記構造式は、式IAにより表わされる、請求項1、2、または3のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項28】**

Aは、-N-または-C(R<sup>+</sup>)-であり、A'は、-C(R<sup>+</sup>)-である、請求項1、または27のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項 2 9】**

R<sup>+</sup>は、-Hである、請求項1～3、または27～28のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項 3 0】**

R<sub>1</sub>は、ハロゲン、または-T<sub>1</sub>-Q<sub>1</sub>である、請求項1～3、または27～29のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項 3 1】**

T<sub>1</sub>は、不在またはC<sub>1</sub>-10脂肪族であり、式中、T<sub>1</sub>の3個までのメチレン単位は、任意にかつ独立して、Gに置き換えられ、式中、Gは、-O-、-N(R')-、または-C(O)-であり、T<sub>1</sub>は、任意にかつ独立して、1つ以上のJ<sub>T<sub>1</sub></sub>で置換される、請求項1～3、または27～30のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項 3 2】**

Q<sub>1</sub>は、不在、またはO、N、およびSからなる群から独立して選択される0～3個のヘテロ原子を有する3～8員の飽和、部分的に飽和、もしくは完全に不飽和な単環式環であり、式中、Q<sub>1</sub>は、任意にかつ独立して、1個以上のJ<sub>Q<sub>1</sub></sub>で置換される、請求項1～3、または27～31のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項 3 3】**

各J<sub>T<sub>1</sub></sub>は独立して、-OR<sup>^</sup>、-N(R<sup>^</sup>)<sub>2</sub>、または-CNである、請求項1～3、または27～32のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項 3 4】**

各J<sub>Q<sub>1</sub></sub>は独立して、C<sub>1</sub>-10アルキル、-OR<sup>''</sup>、-N(R<sup>''</sup>)<sub>2</sub>、またはアシルである、請求項1～3、または27～33のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項 3 5】**

環Bは、5員または6員の飽和炭素環式環である、請求項1～3、または27～34のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項 3 6】**

各R<sub>7</sub>は独立して、C<sub>1</sub>-10脂肪族、C<sub>1</sub>-10ハロ脂肪族、ハロゲン、-CN、-N(R<sup>\*\*</sup>)<sub>2</sub>、または-OR<sup>\*\*</sup>であるか、または2つのR<sub>7</sub>基は、それらが結合する炭素と共に、C=Oを形成する、請求項1～3、または27～35のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項 3 7】**

Aは、-C(R<sup>+</sup>)-である、請求項1～3、または27～36のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項 3 8】**

J<sub>T<sub>1</sub></sub>は、-OR<sup>^</sup>である、請求項1～3、または27～37のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項 3 9】**

各J<sub>Q<sub>1</sub></sub>は独立して、C<sub>1</sub>-10アルキル、-OR<sup>''</sup>、-N(R<sup>''</sup>)<sub>2</sub>、またはアシルである、請求項1～3、または27～38のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項 4 0】**

環Bは、5員の飽和炭素環式環である、請求項1～3、または27～39のうちのいずれか1項に記載の化合物。

**【請求項 4 1】**

表1から選択される構造式により表わされる化合物、またはその薬剤として許容可能な塩。

**【請求項 4 2】**

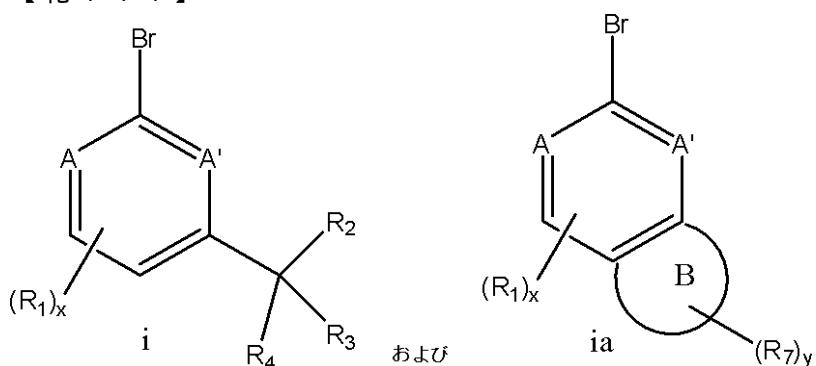
請求項1～41のうちのいずれか1項に記載の化合物またはその薬剤として許容可能な塩、および薬剤として許容可能な担体、アジュバント、またはビヒクルを含む組成物。

**【請求項 4 3】**

請求項1～41のうちのいずれか1項に記載の化合物を調製するためのプロセスであって

a) 以下からなる群から選択される構造式：

【化144】

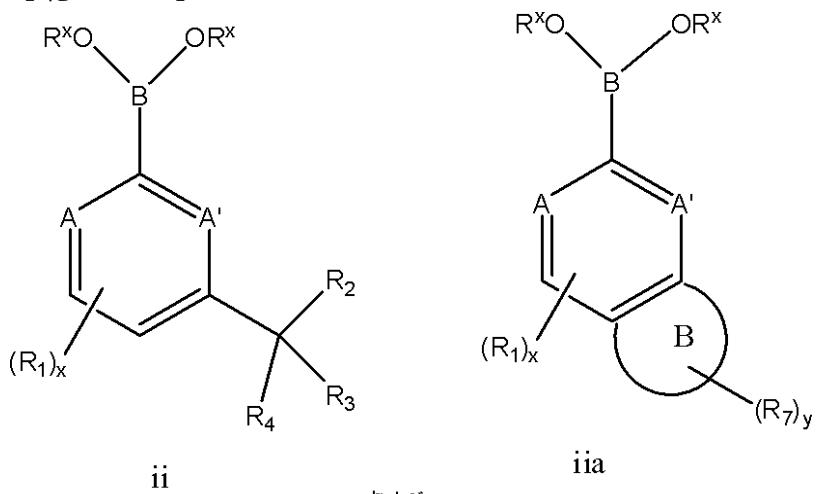


により表わされる化合物を、

ホウ酸化剤および溶媒の存在下でホウ酸化して、以下からなる群から選択される構造式

：

【化145】

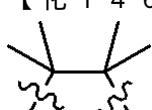


により表わされる化合物を得るステップであって、

式中、

各 R<sup>x</sup> は、 -H であるか、または 2 つの R<sup>x</sup> が共に、

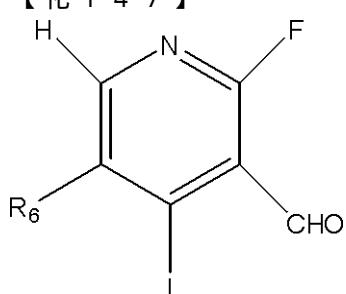
【化146】



を形成する、ステップと、

b) 以下の構造式：

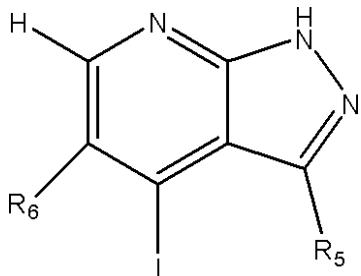
【化147】



により表わされる化合物を、

ヒドラジンおよび溶媒の存在下で環化して、以下の構造式：

【化148】



iv

により表わされる化合物を得るステップと、

c) 溶媒、触媒錯体、または塩基の存在下で、式 iv により表わされる化合物との式 i または ii a により表わされる前記化合物のSuzukiカップリングを行って、請求項1～41のうちのいずれか1項に記載の化合物を得るステップと、を含む、プロセス。

【請求項44】

ステップa)における前記ホウ酸化剤は、ビス(ピナコラト)ジボロン、ピナコール、または2-メトキシ-4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロランである、請求項43に記載のプロセス。

【請求項45】

ステップa)において使用される前記溶媒は、テトラヒドロフラン、ジメチルエーテル、ジオキサン、ジメチルスルホキシド、およびこれらの組み合わせからなる群から選択される、請求項43に記載のプロセス。

【請求項46】

ステップa)において触媒錯体の使用をさらに含む、請求項45に記載のプロセス。

【請求項47】

前記触媒錯体は、少なくとも1個の金属および1個以上のリガンドを含む、請求項46に記載のプロセス。

【請求項48】

前記触媒錯体は、Pd(dppf)Cl<sub>2</sub>.DCM、Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>、または塩化イソプロピルマグネシウム塩化リチウム錯体である、請求項47に記載のプロセス。

【請求項49】

ステップb)における前記溶媒は、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジクロロメタン、トルエン、エタノール、メタノール、エチレングリコール、ブタノール、およびこれらの組み合わせからなる群から選択される、請求項43に記載のプロセス。

【請求項50】

ステップc)における前記溶媒は、ジオキサン、ジメチルエーテル、トルエン、エタノール、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、ベンゼン、水、およびこれらの組み合わせからなる群から選択される、請求項43に記載のプロセス。

【請求項51】

ステップc)において使用される前記触媒錯体は、少なくとも1個の金属および1個以上のリガンドを含む、請求項43に記載のプロセス。

【請求項52】

前記金属は、Pdである、請求項51に記載のプロセス。

【請求項53】

各リガンドは独立して、P(tBu)<sub>3</sub>、P(CyC)<sub>3</sub>、PPh<sub>3</sub>、PPh<sub>2</sub>tBu、BINAP、dppf、dba、およびこれらの組み合わせからなる群から選択される、請求項52に記載のプロセス。

【請求項54】

前記触媒錯体は、Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>、PdCl<sub>2</sub>(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、Pd(dppf)<sub>2</sub>

C<sub>1</sub><sub>2</sub>、Pd<sub>2</sub>(d<sub>b</sub>a)<sub>3</sub>、およびPd(P<sup>t</sup>Bu<sub>3</sub>)<sub>2</sub>からなる群から選択される、請求項53に記載のプロセス。

【請求項55】

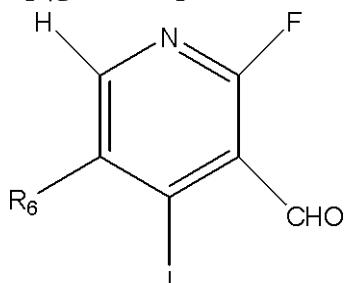
ステップc)における前記塩基は、Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>、NaHCO<sub>3</sub>、Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>、CsF、KF、K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>、KOAc、K<sub>3</sub>PO<sub>4</sub>、NaOEt、KOH、およびCsOHからなる群から選択される、請求項43に記載のプロセス。

【請求項56】

請求項1～41のうちのいずれか1項に記載の化合物を調製するためのプロセスであって、

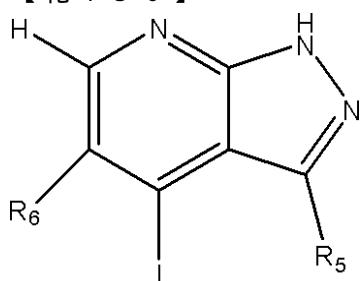
a) 以下の構造式：

【化149】



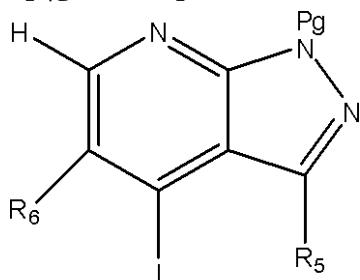
により表わされる化合物を、  
ヒドラジンおよび溶媒の存在下で環化して、以下の構造式：

【化150】



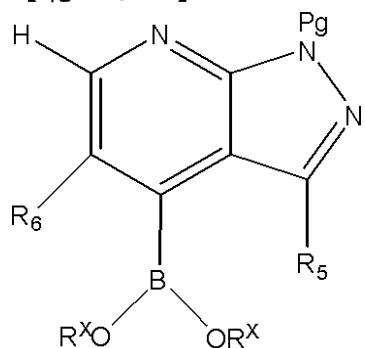
により表わされる化合物を得るステップと、  
b) ivにより表わされる化合物を保護して、以下の構造式：

【化151】



により表わされる化合物を得るステップと、  
c) vにより表わされる化合物を、ホウ酸化剤および溶媒の存在下でホウ酸化して、以下の構造式：

## 【化152】



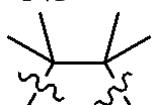
vi

により表わされる化合物を得るステップであって、

式中、

各  $R^X$  は、 - H であるか、または 2 つの  $R^X$  が共に、

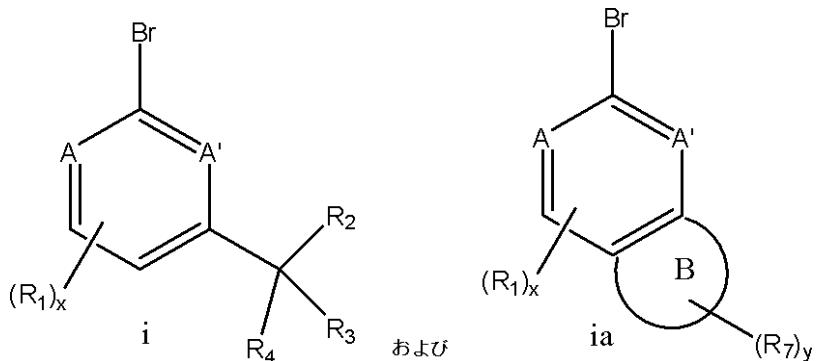
## 【化153】



を形成する、ステップと、

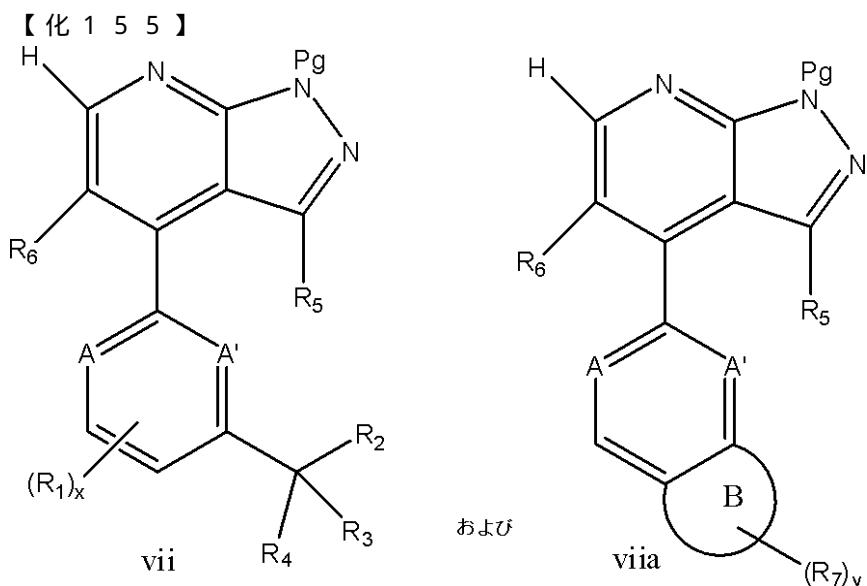
d ) 溶媒、触媒錯体、または塩基の存在下で、以下からなる群から選択される構造式：

## 【化154】



に表わされる化合物との式 v i により表わされる前記化合物のSuzukiカップリングを行つて、

以下からなる群から選択される構造式：



により表わされる化合物を得るステップと、

e) ヒドラジンの存在下で、*vivi* または *vicia* により表わされる化合物を脱保護し、請求項 1 ~ 41 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物を得るステップと、を含む、プロセス。

## 【請求項 5 7】

ステップa)における前記溶媒は、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジクロロメタン、トルエン、エタノール、メタノール、エチレングリコール、ブタノール、およびこれらの組み合わせからなる群から選択される、請求項5-6に記載のプロセス。

### 【請求項 5 8】

ステップc)における前記ホウ酸化剤は、ビス(ピナコラト)ジボロン、ピナコール、または2-メトキシ-4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロランである、請求項56に記載のプロセス。

## 【請求項 5 9】

ステップc)において使用される前記溶媒は、テトラヒドロフラン、ジメチルエーテル、ジオキサン、ジメチルスルホキシド、およびこれらの組み合わせからなる群から選択される、請求項5-6に記載のプロセス。

## 【請求項 60】

ステップa)において触媒錯体の使用をさらに含む、請求項5-6に記載のプロセス。

## 【請求項 61】

前記触媒錯体は、少なくとも1個の金属および1個以上のリガンドを含む、請求項60に記載のプロセス。

## 【請求項 6 2】

前記触媒錯体は、 $Pd(dppf)Cl_2 \cdot DCM$ 、 $Pd(PPh_3)_4$ 、または塩化イソプロピルマグネシウム塩化リチウム錯体である。請求項6.1に記載のプロセス。

【請求項 6 3】

【前記 d )】における前記溶媒は、ジオキサン、ジメチルエーテル、トルエン、エタノール、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、ベンゼン、水、およびこれらの組み合わせからなる群から選択される。請求項 5, 6 に記載のプロセス。

【請求項 6 4】

【前記 d )】において使用される前記触媒錯体は、少なくとも 1 個の金属および 1 個以上のリガンドを含む。請求項 5, 6 に記載のプロセス

【請求項 65】

前記金属は Pd である。請求項 6, 4 に記載のプロセス

### 【請求項 66】

各リガンドは独立して、 $P(tBu)_3$ 、 $P(Cyc)_3$ 、 $PPh_3$ 、 $PPh_2^tBu$ 、 $BINAP$ 、 $dppf$ 、 $dba$ 、およびこれらの組み合わせからなる群から選択される、請求項64に記載のプロセス。

【請求項67】

前記触媒錯体は、 $Pd(PPh_3)_4$ 、 $PdCl_2(PPh_3)_2$ 、 $Pd(dppf)_2Cl_2$ 、 $Pd_2(dbu)_3$ 、および $Pd(P^tBu_3)_2$ からなる群から選択される、請求項64に記載のプロセス。

【請求項68】

ステップd)における前記塩基は、 $Na_2CO_3$ 、 $NaHCO_3$ 、 $Cs_2CO_3$ 、 $CsF$ 、 $KF$ 、 $K_2CO_3$ 、 $KOAc$ 、 $K_3PO_4$ 、 $NaOEt$ 、 $KOH$ 、および $CsOH$ からなる群から選択される、請求項56に記載のプロセス。

【請求項69】

タンパク質キナーゼ媒介性状態の治療または予防を必要とする対象において、タンパク質キナーゼ媒介性状態を治療する、または予防するための組成物であって、有効量の請求項1~41のうちのいずれか1項に記載の化合物、もしくはその薬剤として許容可能な塩、または請求項42に記載の組成物を含む、組成物。

【請求項70】

前記タンパク質キナーゼ媒介性状態は、PKC媒介性状態である、請求項69に記載の組成物。

【請求項71】

前記PKC媒介性状態は、PKC-媒介性状態である、請求項70に記載の組成物。

【請求項72】

前記PKC-媒介性状態は、自己免疫疾患、炎症性疾患、または増殖性もしくは過剰増殖性疾患である、請求項71に記載の組成物。

【請求項73】

前記PKC-媒介性状態は、喘息、乾癐、関節炎、関節リウマチ、関節の炎症、多発性硬化症、糖尿病、炎症性腸疾患、移植拒絶、T細胞白血病、リンパ腫、および狼瘍からなる群から選択される、請求項72に記載の組成物。

【請求項74】

前記PKC-媒介性状態は、自己免疫疾患である、請求項71に記載の組成物。

【請求項75】

前記自己免疫疾患は、多発性硬化症、関節リウマチ、および過敏性腸疾患からなる群から選択される、請求項74に記載の組成物。

【請求項76】

前記自己免疫疾患は、多発性硬化症である、請求項75に記載の組成物。

【請求項77】

前記自己免疫疾患は、関節リウマチである、請求項75に記載の組成物。

【請求項78】

前記自己免疫疾患は、過敏性腸疾患である、請求項75に記載の組成物。

【請求項79】

前記PKC-媒介性状態は、T細胞白血病およびリンパ腫からなる群から選択される、請求項72に記載の組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0044

【補正方法】変更

【補正の内容】

## 【0044】

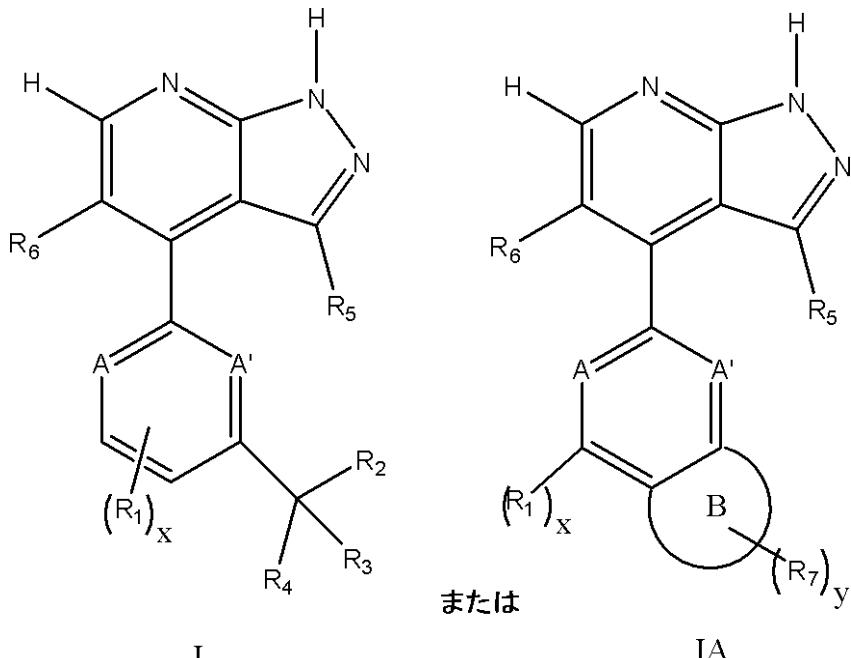
別の実施形態において、本発明の化合物および組成物はまた、生物学的および病理学的現象におけるキナーゼの研究、このようなキナーゼにより媒介される細胞内シグナル変換経路の研究、ならびに新規キナーゼ阻害剤の比較評価にも有用である。

例えば、本発明は以下を提供する：

## (項目1)

構造式IまたはIAにより表わされる化合物：

## 【化140】



またはその薬剤として許容可能な塩。(式中、

AおよびA'は独立して、-N-または-C(R<sup>+</sup>)-であり、

環Bは、5員または6員の飽和炭素環式環または複素環式環であり、

R<sub>1</sub>は、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、または-T1-Q1であり、

T1は、不在またはC1-10脂肪族であり、式中、T1の1個以上のメチレン単位は、任意にかつ独立して、Gに置き換えられ、式中、Gは、-O-、-S(O)<sub>p</sub>-、-N(R')-、または-C(O)-であり、T1は、任意にかつ独立して、1つ以上のJ<sub>T1</sub>で置換され、

Q1は、不在、またはO、N、およびSからなる群から独立して選択される0~3個のヘテロ原子を有する3~8員の飽和、部分的に飽和、もしくは完全に不飽和な单環式環、またはO、N、およびSからなる群から独立して選択される0~5個のヘテロ原子を有する8~12員の飽和、部分的に飽和、もしくは完全に不飽和な二環式環であり、式中、Q1は、任意にかつ独立して、1つ以上のJ<sub>Q1</sub>で置換され、式中、R<sub>1</sub>がT1-Q1である場合、T1およびQ1は共に不在であることはなく、

R<sub>2</sub>は、-H、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>CN、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>N(R)<sub>2</sub>、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>OR、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>C(O)N(R)<sub>2</sub>、または1個以上のハロゲン、フェニル、OR<sup>\*</sup>、もしくはN(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>で任意に置換されるC1-10脂肪族であり、

各R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は独立して、-H、ハロゲン、C1-10脂肪族、ヘテロシクリル、ヘテロシクリアルキル、アリール、またはアラルキルであり、式中、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、任意にかつ独立して、C1-10アルキル、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sup>\*</sup>、-S(O)<sub>p</sub>NR<sup>\*</sup>、-C(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>\*</sup>C(O)、-OC(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)C(O)OR<sup>\*</sup>、-N(R<sup>\*</sup>)C(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換され、

R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、それらが結合する炭素と共に、C=O、またはO、N、およびSか

らなる群から独立して選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 8 員の飽和、部分的に飽和、もしくは完全に不飽和な単環式環を形成し、式中、前記環は、任意にかつ独立して、=O、=S、=N-R<sup>\*</sup>、C<sub>1-10</sub>脂肪族、C<sub>1-10</sub>ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sup>\*</sup>、-S(O)<sub>p</sub>NR<sup>\*</sup>、-C(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>\*</sup>C(O)、-OC(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)C(O)OR<sup>\*</sup>、-N(R<sup>\*</sup>)C(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される 1 個以上で置換され、

各 R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> は独立して、-H、ハロゲン、C<sub>1-10</sub>ハロゲン族、または C<sub>1-10</sub>脂肪族であり、

各 R<sub>7</sub> は独立して、C<sub>1-10</sub>ハロゲン族、C<sub>1-10</sub>脂肪族、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>CN、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>N(R<sup>\*\*</sup>)<sub>2</sub>、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>OR<sup>\*\*</sup>、または-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>C(O)N(R<sup>\*\*</sup>)<sub>2</sub> であるか、または 2 つの R<sub>7</sub> 基は、それらが結合する炭素と共に、C=O を形成し、

各 J<sub>T1</sub> は独立して、ハロゲン、-OR<sup>^</sup>、-N(R<sup>^</sup>)<sub>2</sub>、または-CN であり、

各 J<sub>Q1</sub> は独立して、ハロゲン、C<sub>1-10</sub>アルキル、C<sub>1-10</sub>ハロアルキル、-OR'、-N(R')<sub>2</sub>、-CN、-NO<sub>2</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R'、-S(O)<sub>p</sub>NR'、アシル、カルバルコキシアルキル、またはアセトキシアルキルであり、

各 R<sup>+</sup> は独立して、-H、ハロゲン、または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1-10</sub>アルキルであり、

各 R<sup>++</sup> は独立して、-H またはハロゲンであり、

各 R<sup>^</sup> は独立して、-H、または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1-10</sub>アルキルであり、

各 R<sup>^</sup> は独立して、-H、C<sub>1-10</sub>アルキル、またはアラルキルであり、式中、各 R<sup>^</sup> は、5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換され、

各 R<sup>'</sup> は独立して、-H、または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1-10</sub>アルキルであり、

各 R は独立して、-H、または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1-10</sub>アルキルであり、

各 R<sup>\*</sup> は独立して、-H、または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1-10</sub>アルキルであり、

各 R<sup>\*\*</sup> は独立して、-H、または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1-10</sub>アルキルであり、

x は、0 または 1 であり、

y は、0、1、または 2 であり、

各 n は独立して、0、1、2、または 3 であり、

各 p は、独立して、0、1、または 2 である。)

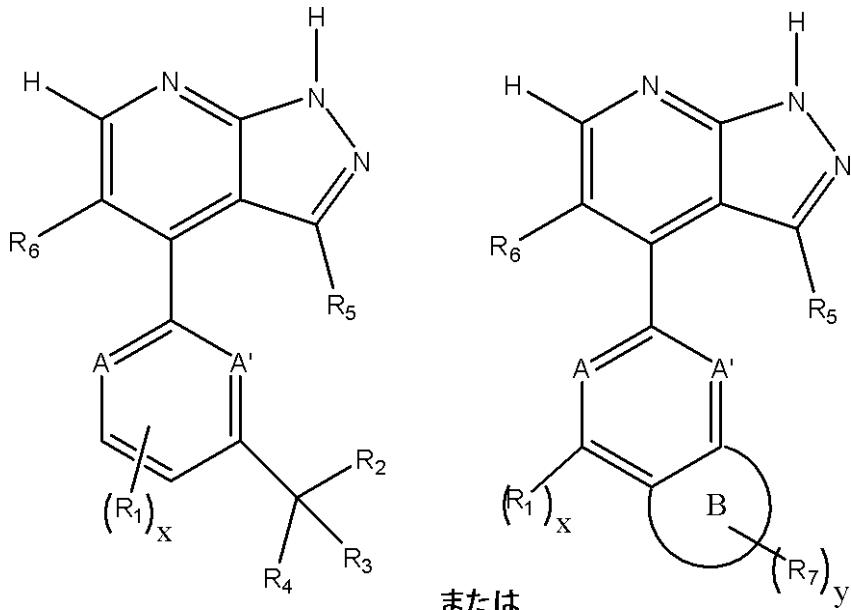
(項目 2)

R<sub>2</sub> は、-H、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>CN、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>N(R)<sub>2</sub>、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>OR、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>C(O)N(R)<sub>2</sub>、または 1 個以上のハロゲン、OR<sup>\*</sup>、もしくは N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub> で任意に置換される C<sub>1-10</sub>脂肪族である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 3)

構造式 I または IA :

【化141】

Iにより表わされる、項目2に記載の化合物、またはその薬剤として許容可能な塩。(式中、AおよびA'は独立して、-N-または-C(R<sup>+</sup>)-であり、環Bは、5員または6員の飽和炭素環式環または複素環式環であり、R<sub>1</sub>は、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、または-T1-Q1であり、T1は、不在またはC1-10脂肪族であり、式中、T1の3個までのメチレン単位は、任意にかつ独立して、Gに置き換えられ、式中、Gは、-O-、-S(O)<sub>p</sub>-、-N(R')-、または-C(O)-であり、T1は、任意にかつ独立して、1つ以上のJ<sub>T1</sub>で置換され、Q1は、不在、またはO、N、およびSからなる群から独立して選択される0~3個のヘテロ原子を有する3~8員の飽和、部分的に飽和、もしくは完全に不飽和な单環式環、またはO、N、およびSからなる群から独立して選択される0~5個のヘテロ原子を有する8~12員の飽和、部分的に飽和、もしくは完全に不飽和な二環式環であり、式中、Q1は、任意にかつ独立して、1つ以上のJ<sub>Q1</sub>で置換され、式中、R<sub>1</sub>がT1-Q1である場合、T1およびQ1は共に不在であることはなく、R<sub>2</sub>は、-H、C1-10脂肪族、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>CN、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>N(R)<sub>2</sub>、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>OR、または-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>C(O)N(R)<sub>2</sub>であり、各R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は独立して、-H、ハロゲン、C1-10脂肪族、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、またはアラルキルであり、式中、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、任意にかつ独立して、C1-10アルキル、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sup>\*</sup>、-S(O)<sub>p</sub>NR<sup>\*</sup>、-C(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>\*</sup>C(O)、-OC(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)C(O)OR<sup>\*</sup>、-N(R<sup>\*</sup>)C(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換され、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、それらが結合する炭素と共に、C=O、またはO、N、およびSからなる群から独立して選択される0~3個のヘテロ原子を有する3~8員の飽和、部分的に飽和、もしくは完全に不飽和な单環式環を形成し、式中、前記環は、任意にかつ独立して、C1-10脂肪族、C1-10ハロ脂肪族、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R<sup>\*</sup>、-S(O)<sub>p</sub>NR<sup>\*</sup>、-C(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-NR<sup>\*</sup>C(O)、-OC(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)C(O)OR<sup>\*</sup>、-N(R<sup>\*</sup>)C(O)N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換され、各R<sub>5</sub>およびR<sub>6</sub>は独立して、-H、ハロゲン、C1-10ハロ脂肪族、またはC1-

10 脂肪族であり、

各 R<sub>7</sub> は独立して、C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> ハロゲン族、C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> 脂肪族、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>CN、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>N(R<sup>\*\*</sup>)<sub>2</sub>、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>OR<sup>\*\*</sup>、または-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>C(O)N(R<sup>\*\*</sup>)<sub>2</sub> であるか、または 2 つの R<sub>7</sub> 基は、それらが結合する炭素と共に、C=O を形成し、

各 J<sub>T1</sub> は独立して、ハロゲン、-OR<sup>^</sup>、-N(R<sup>^</sup>)<sub>2</sub>、または-CN であり、

各 J<sub>Q1</sub> は独立して、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> ハロアルキル、-OR'、-N(R')<sub>2</sub>、-CN、-NO<sub>2</sub>、-S(O)<sub>p</sub>R'、-S(O)<sub>p</sub>NR'、アシル、カルバルコキシアルキル、またはアセトキシアルキルであり、

各 R<sup>+</sup> は独立して、-H、ハロゲン、または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> アルキルであり、

各 R<sup>++</sup> は独立して、-H またはハロゲンであり、

各 R<sup>\*</sup> は独立して、-H、または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> アルキルであり、

各 R<sup>^</sup> は独立して、-H、または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> アルキルであり、

各 R<sup>''</sup> は独立して、-H、または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> アルキルであり、

各 R<sup>'''</sup> は独立して、-H、または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> アルキルであり、

各 R<sup>\*</sup> は独立して、-H、または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> アルキルであり、

各 R<sup>\*\*</sup> は独立して、-H、または 5 個までのハロゲン基で任意にかつ独立して置換される C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> アルキルであり、

x は、0 または 1 であり、

y は、0、1、または 2 であり、

各 n は独立して、0、1、2、または 3 であり、

各 p は、独立して、0、1、または 2 である。)

(項目 4)

前記構造式が、式 I により表わされる、項目 3 に記載の化合物。

(項目 5)

A は、-N- または -C(R<sup>+</sup>)- であり、A' は、-C(R<sup>+</sup>)- である、項目 1、2、3、または 4 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 6)

R<sup>+</sup> は、-H である、項目 1 ~ 5 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 7)

R<sub>1</sub> は、ハロゲン、または-T<sub>1</sub>-Q<sub>1</sub> である、項目 1 ~ 6 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 8)

T<sub>1</sub> は、不在または C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> 脂肪族であり、式中、T<sub>1</sub> の 3 個までのメチレン単位は、任意にかつ独立して、G に置き換えられ、式中、G は、-O-、-N(R')-、または-C(O)- であり、T<sub>1</sub> は、任意にかつ独立して、1 つ以上の J<sub>T1</sub> で置換される、項目 1 ~ 7 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 9)

Q<sub>1</sub> は、不在、または O、N、および S からなる群から独立して選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 8 員の飽和、部分的に飽和、もしくは完全に不飽和な单環式環であり、式中、Q<sub>1</sub> は、任意にかつ独立して、1 個以上の J<sub>Q1</sub> で置換される、項目 1 ~ 8 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 10)

各 J<sub>T1</sub> は、独立して、-OR<sup>^</sup>、-N(R<sup>^</sup>)<sub>2</sub>、または-CN である、項目 1 ~ 9 の

うちのいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 1 )

各  $J_{Q_1}$  は独立して、C 1 - 1 0 脂肪族、-OR'、-N(R')<sub>2</sub>、またはアシルである、項目 1 ~ 1 0 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 2 )

$R_2$  は、C 1 - 1 0 脂肪族、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>CN、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>N(R)<sub>2</sub>、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>OR、または-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>C(O)N(R)<sub>2</sub> である、項目 1 ~ 1 1 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 3 )

各  $R_3$  および  $R_4$  は独立して、-H、C 1 - 1 0 脂肪族、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、またはアラルキルであり、式中、 $R_3$  および  $R_4$  は、任意にかつ独立して、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup> からなる群から選択される 1 個以上で置換されるか、または

$R_3$  および  $R_4$  は、それらが結合する炭素と共に、C = O、またはO、N、およびS からなる群から独立して選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 8 員の飽和、部分的に飽和、もしくは完全に不飽和な单環式環を形成し、式中、前記環は、任意にかつ独立して、=O、=S、C 1 - 1 0 脂肪族、C 1 - 1 0 ハロ脂肪族、ハロゲン、-CN、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup> からなる群から選択される 1 個以上で置換される、項目 1 ~ 1 2 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 4 )

各  $R_3$  および  $R_4$  は独立して、-H、C 1 - 1 0 脂肪族、シクロアルキルアルキルであり、式中、 $R_3$  および  $R_4$  は、任意にかつ独立して、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup> からなる群から選択される 1 個以上で置換されるか、または

$R_3$  および  $R_4$  は、それらが結合する炭素と共に、C = O、またはO、N、およびS からなる群から独立して選択される 0 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 3 ~ 8 員の飽和、部分的に飽和、もしくは完全に不飽和な单環式環を形成し、式中、前記環は、任意にかつ独立して、C 1 - 1 0 脂肪族、C 1 - 1 0 ハロ脂肪族、ハロゲン、-CN、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup> からなる群から選択される 1 個以上で置換される、項目 1 ~ 1 2 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 5 )

A は、-C(R<sup>+</sup>)<sub>2</sub> である、項目 1 ~ 1 4 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 6 )

$J_{T_1}$  は、-OR<sup>^</sup> である、項目 1 ~ 1 5 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物。

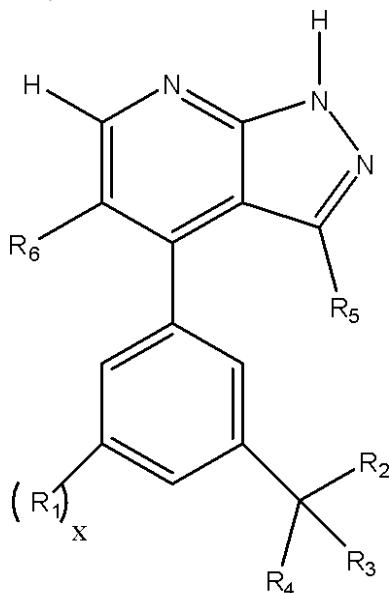
(項目 1 7 )

$R_2$  は、-H、C 1 - 1 0 脂肪族、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>CN、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>N(R)<sub>2</sub>、または-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>OR である、項目 1 ~ 1 0 、または 1 2 ~ 1 6 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 1 8 )

前記化合物は、構造式 I B :

## 【化142】



II B  
により表わされる、項目1～4、7～14、または16～17のうちのいずれか1項に記載の化合物、

またはその薬剤として許容可能な塩。

(項目19)

R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、それらが結合する炭素と共に、O、N、およびSからなる群から独立して選択される0～3個のヘテロ原子を有する3～8員の飽和、もしくは部分的に飽和の単環式環を形成し、式中、前記環は、任意にかつ独立して、=O、=S、C1-10脂肪族、C1-10ハロ脂肪族、ハロゲン、-CN、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換される、項目1～13、または15～18のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目20)

R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、それらが結合する炭素と共に、シクロプロピル、シクロブチル、シクロヘキシリル、シクロペンチル、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、アゼパニル、ジアゼパニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、オキセタニル、イミダゾリニル、チアゾリジニル、またはオキサゾリジニルからなる群から選択される単環式環を形成し、式中、前記環は、任意にかつ独立して、=O、=S、C1-10脂肪族、C1-10ハロ脂肪族、ハロゲン、-CN、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換される、項目1～13、または15～18のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目21)

R<sub>2</sub>は、-H、またはC1-10脂肪族であり、

R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、それらが結合する炭素と共に、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、アゼパニル、ジアゼパニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、オキセタニル、イミダゾリニル、チアゾリジニル、またはオキサゾリジニルからなる群から選択される単環式環を形成し、式中、前記環は、任意にかつ独立して、=O、=S、C1-10脂肪族、C1-10ハロ脂肪族、ハロゲン、-CN、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換される、項目1～10、12～13、または15～20のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目22)

R<sub>2</sub>は、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>CN、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>N(R)<sub>2</sub>、または-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>ORであり、

R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、それらが結合する炭素と共に、シクロプロピル、シクロブチル、シ

クロヘキシル、またはシクロペンチルからなる群から選択される单環式環を形成し、式中、前記環は、任意にかつ独立して、=O、=S、C1-10脂肪族、C1-10ハロ脂肪族、ハロゲン、-CN、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換される、項目1~13、または15~20のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目23)

R<sub>2</sub>は、-H、C1-10脂肪族、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>CN、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>N(R)<sub>2</sub>、-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>OR、または-(CR<sup>++</sup>)<sub>n</sub>C(O)N(R)<sub>2</sub>であり、各R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は独立して、-H、C1-10脂肪族、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、またはアラルキルであり、式中、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、任意にかつ独立して、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>\*</sup>)<sub>2</sub>、および-OR<sup>\*</sup>からなる群から選択される1個以上で置換される、項目1~10、12~13、または15~19のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目24)

R<sub>5</sub>は、-H、C1、C1-4ハロアルキル、またはC1-4アルキルであり、R<sub>6</sub>は、-HまたはC1-4アルキルである、項目1~23のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目25)

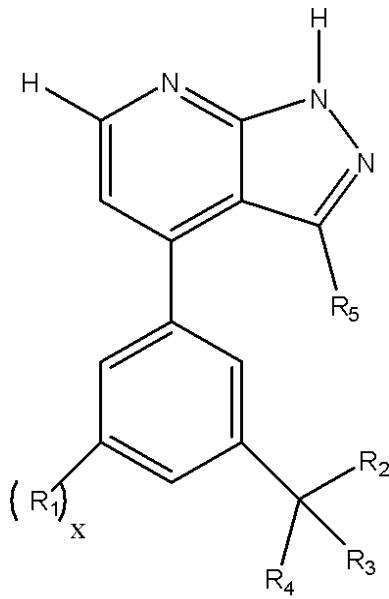
R<sub>5</sub>は、-H、C1、トリフルオロメチル、メチル、エチル、またはシクロプロピルであり、

R<sub>6</sub>は、-Hである、項目1~24のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目26)

前記化合物は、構造式IC:

【化143】



ICにより表わされる、項目1~4、7~14、または16~25のうちのいずれか1項に記載の化合物、

またはその薬剤として許容可能な塩。

(項目27)

前記構造式は、式IAにより表わされる、項目1、2、または3のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目28)

Aは、-N-または-C(R<sup>+</sup>)<sub>2</sub>-であり、A'は、-C(R<sup>+</sup>)<sub>2</sub>-である、項目1、または27のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目29)

R<sup>+</sup>は、-Hである、項目1～3、または27～28のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目30)

R<sub>1</sub>は、ハロゲン、または-T1-Q1である、項目1～3、または27～29のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目31)

T1は、不在またはC1-10脂肪族であり、式中、T1の3個までのメチレン単位は、任意にかつ独立して、Gに置き換えられ、式中、Gは、-O-、-N(R')-、または-C(O)-であり、T1は、任意にかつ独立して、1つ以上のJ<sub>T1</sub>で置換される、項目1～3、または27～30のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目32)

Q1は、不在、またはO、N、およびSからなる群から独立して選択される0～3個のヘテロ原子を有する3～8員の飽和、部分的に飽和、もしくは完全に不飽和な单環式環であり、式中、Q1は、任意にかつ独立して、1個以上のJ<sub>Q1</sub>で置換される、項目1～3、または27～31のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目33)

各J<sub>T1</sub>は独立して、-OR<sup>^</sup>、-N(R<sup>^</sup>)<sub>2</sub>、または-CNである、項目1～3、または27～32のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目34)

各J<sub>Q1</sub>は独立して、C1-10アルキル、-OR<sup>''</sup>、-N(R<sup>''</sup>)<sub>2</sub>、またはアシルである、項目1～3、または27～33のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目35)

環Bは、5員または6員の飽和炭素環式環である、項目1～3、または27～34のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目36)

各R<sub>7</sub>は独立して、C1-10脂肪族、C1-10ハロゲン脂肪族、ハロゲン、-CN、-N(R<sup>\*\*</sup>)<sub>2</sub>、または-OR<sup>\*\*</sup>であるか、または2つのR<sub>7</sub>基は、それらが結合する炭素と共に、C=Oを形成する、項目1～3、または27～35のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目37)

Aは、-C(R<sup>+</sup>)-である、項目1～3、または27～36のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目38)

J<sub>T1</sub>は、-OR<sup>^</sup>である、項目1～3、または27～37のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目39)

各J<sub>Q1</sub>は独立して、C1-10アルキル、-OR<sup>''</sup>、-N(R<sup>''</sup>)<sub>2</sub>、またはアシルである、項目1～3、または27～38のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目40)

環Bは、5員の飽和炭素環式環である、項目1～3、または27～39のうちのいずれか1項に記載の化合物。

(項目41)

表1から選択される構造式により表わされる化合物、またはその薬剤として許容可能な塩。

(項目42)

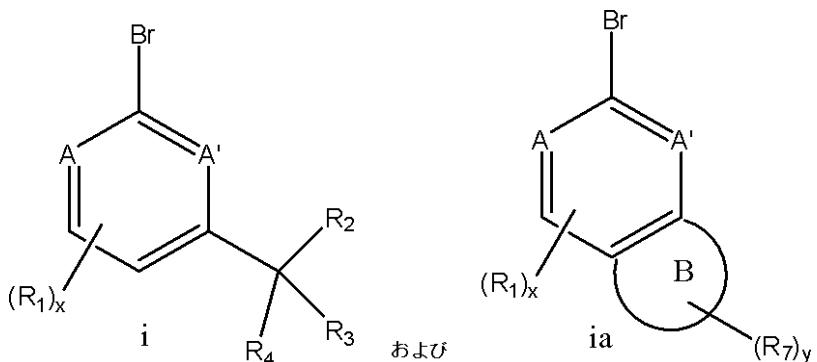
項目1～41のうちのいずれか1項に記載の化合物またはその薬剤として許容可能な塩、および薬剤として許容可能な担体、アジュバント、またはビヒクルを含む組成物。

(項目43)

項目1～41のうちのいずれか1項に記載の化合物を調製するためのプロセスであって、

a) 以下からなる群から選択される構造式 :

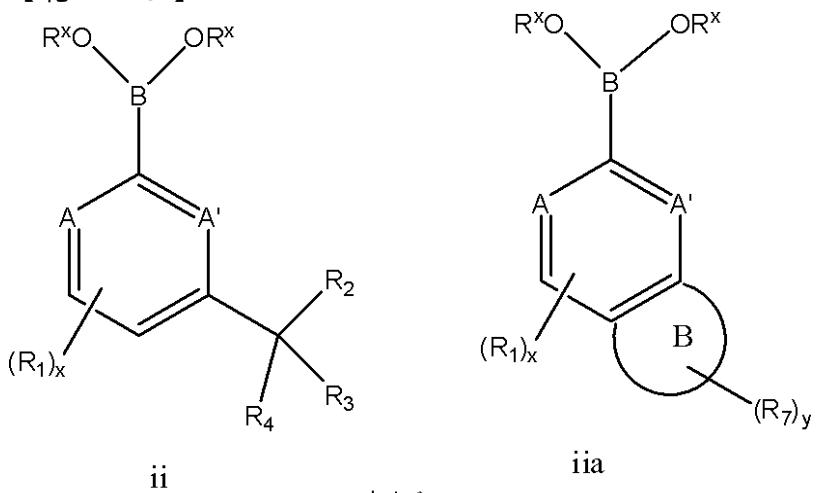
【化144】



により表わされる化合物を、

ホウ酸化剤および溶媒の存在下でホウ酸化して、以下からなる群から選択される構造式

【化145】

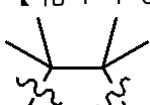


により表わされる化合物を得るステップであって、

式中、

各  $R^x$  は、 - H であるか、または 2 つの  $R^x$  が共に、

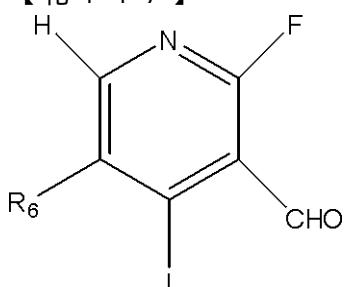
【化146】



を形成する、ステップと、

b) 以下の構造式 :

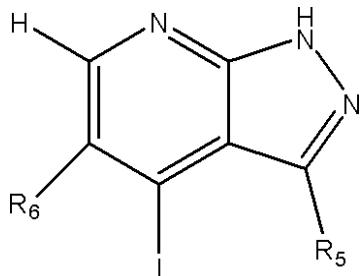
【化147】



により表わされる化合物を、

ヒドラジンおよび溶媒の存在下で環化して、以下の構造式 :

## 【化148】



iv

により表わされる化合物を得るステップと、

c) 溶媒、触媒錯体、または塩基の存在下で、式 i v により表わされる化合物との式 i i または i i a により表わされる前記化合物のSuzukiカップリングを行って、項目1～4 1のうちのいずれか1項に記載の化合物を得るステップと、を含む、プロセス。

(項目44)

ステップa)における前記ホウ酸化剤は、ビス(ピナコラト)ジボロン、ピナコール、または2-メトキシ-4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロランである、項目43に記載のプロセス。

(項目45)

ステップa)において使用される前記溶媒は、テトラヒドロフラン、ジメチルエーテル、ジオキサン、ジメチルスルホキシド、およびこれらの組み合わせからなる群から選択される、項目43に記載のプロセス。

(項目46)

ステップa)において触媒錯体の使用をさらに含む、項目45に記載のプロセス。

(項目47)

前記触媒錯体は、少なくとも1個の金属および1個以上のリガンドを含む、項目46に記載のプロセス。

(項目48)

前記触媒錯体は、Pd(dppf)Cl<sub>2</sub>.DCM、Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>、または塩化イソプロピルマグネシウム塩化リチウム錯体である、項目47に記載のプロセス。

(項目49)

ステップb)における前記溶媒は、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジクロロメタン、トルエン、エタノール、メタノール、エチレングリコール、ブタノール、およびこれらの組み合わせからなる群から選択される、項目43に記載のプロセス。

(項目50)

ステップc)における前記溶媒は、ジオキサン、ジメチルエーテル、トルエン、エタノール、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、ベンゼン、水、およびこれらの組み合わせからなる群から選択される、項目43に記載のプロセス。

(項目51)

ステップc)において使用される前記触媒錯体は、少なくとも1個の金属および1個以上のリガンドを含む、項目43に記載のプロセス。

(項目52)

前記金属は、Pdである、項目51に記載のプロセス。

(項目53)

各リガンドは独立して、P(tBu)<sub>3</sub>、P(CyC)<sub>3</sub>、PPh<sub>3</sub>、PPh<sub>2</sub>tBu、BINAP、dppf、dba、およびこれらの組み合わせからなる群から選択される、項目52に記載のプロセス。

(項目54)

前記触媒錯体は、Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>、PdCl<sub>2</sub>(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、Pd(dppf)<sub>2</sub>C<sub>12</sub>、Pd<sub>2</sub>(dba)<sub>3</sub>、およびPd(PtBu<sub>3</sub>)<sub>2</sub>からなる群から選択される、

項目 5 3 に記載のプロセス。

(項目 5 5 )

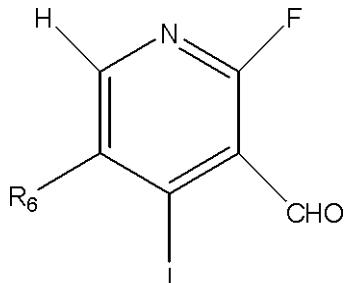
ステップ c ) における前記塩基は、  $\text{Na}_2\text{CO}_3$ 、  $\text{NaHCO}_3$ 、  $\text{Cs}_2\text{CO}_3$ 、  $\text{CsF}$ 、  $\text{KF}$ 、  $\text{K}_2\text{CO}_3$ 、  $\text{KOAc}$ 、  $\text{K}_3\text{PO}_4$ 、  $\text{NaOEt}$ 、  $\text{KOH}$ 、 および  $\text{CsOH}$  からなる群から選択される、項目 4 3 に記載のプロセス。

(項目 5 6 )

項目 1 ~ 4 1 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物を調製するためのプロセスであって、

a ) 以下の構造式 :

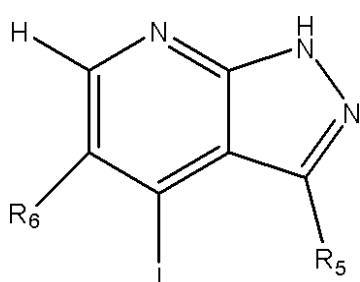
【化 1 4 9】



iii  
により表わされる化合物を、

ヒドラジンおよび溶媒の存在下で環化して、以下の構造式 :

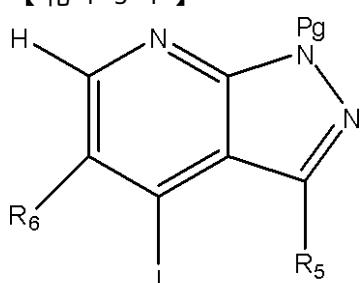
【化 1 5 0】



iv  
により表わされる化合物を得るステップと、

b ) i v により表わされる化合物を保護して、以下の構造式 :

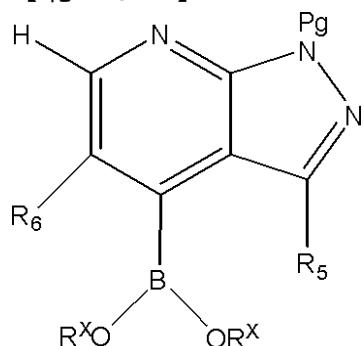
【化 1 5 1】



v  
により表わされる化合物を得るステップと、

c ) v により表わされる化合物を、ホウ酸化剤および溶媒の存在下でホウ酸化して、以下の構造式 :

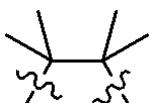
## 【化152】



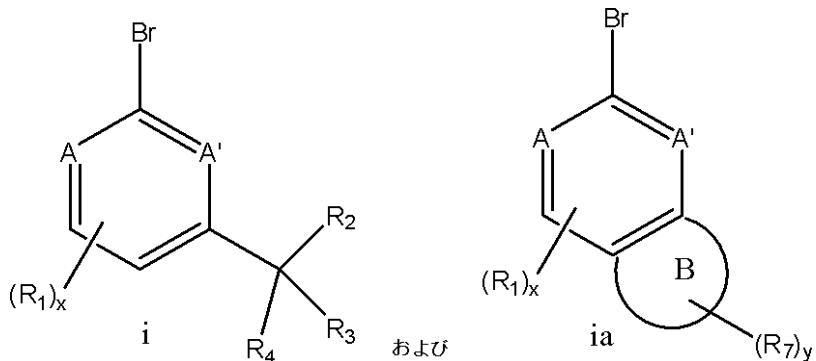
vi

により表わされる化合物を得るステップであって、式中、各R<sup>X</sup>は、-Hであるか、または2つのR<sup>X</sup>が共に、

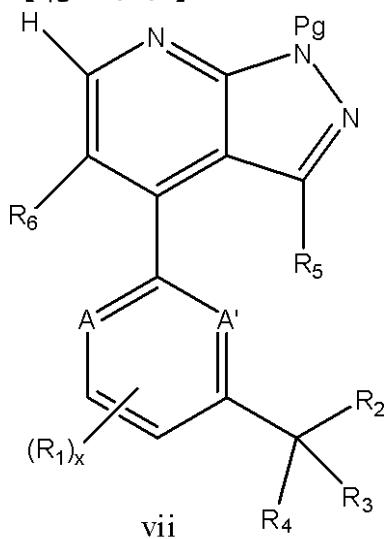
## 【化153】

を形成する、ステップと、d) 溶媒、触媒錯体、または塩基の存在下で、以下からなる群から選択される構造式：

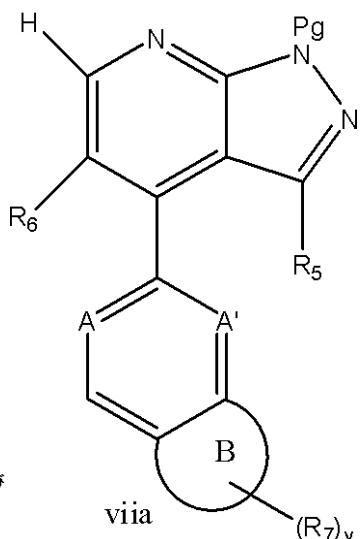
## 【化154】

に表わされる化合物との式v iにより表わされる前記化合物のSuzukiカップリングを行つて、以下からなる群から選択される構造式：

【化 1 5 5】



および



により表わされる化合物を得るステップと、

e) ヒドラジンの存在下で、*vici* または *vicia* により表わされる化合物を脱保護し、項目 1 ~ 41 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物を得るステップと、を含む、プロセス。

( 項目 5 7 )

ステップa)における前記溶媒は、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジクロロメタン、トルエン、エタノール、メタノール、エチレングリコール、ブタノール、およびこれらの組み合わせからなる群から選択される、項目56に記載のプロセス。

( 項目 5 8 )

ステップc)における前記ホウ酸化剤は、ビス(ピナコラト)ジボロン、ピナコール、または2-メトキシ-4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロランである。項目56に記載のプロセス。

(項目59)

ステップc)において使用される前記溶媒は、テトラヒドロフラン、ジメチルエーテル、ジオキサン、ジメチルスルホキシド、およびこれらの組み合わせからなる群から選択される、項目56に記載のプロセス。

( 項目 60 )

ステップa)において触媒錯体の使用をさらに含む、項目5.6に記載のプロセス。

( 項目 6 1 )

前記触媒錯体は、少なくとも1個の金属および1個以上のリガンドを含む、項目60に記載のプロセス。

( 項目 6 2 )

前記触媒錯体は、 $Pd(dppf)Cl_2 \cdot DCM$ 、 $Pd(PPh_3)_4$ 、または塩化イソプロピルマグネシウム塩化リチウム錯体である、項目 6.1 に記載のプロセス。

( 項目 6 3 )

ステップd)における前記溶媒は、ジオキサン、ジメチルエーテル、トルエン、エタノール、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、ベンゼン、水、およびこれらの組み合せからなる群から選択される、項目5.6に記載のプロセス。

( 項目 6 4 )

ステップd)において使用される前記触媒錯体は、少なくとも1個の金属および1個以上のリガンドを含む、項目5.6に記載のプロセス。

( 項目 65 )

前記金属は、Pdである、項目6.4に記載のプロセス。

( 項目 6 6 )

各リガンドは独立して、 $P(tBu)_3$ 、 $P(CyC)_3$ 、 $PPh_3$ 、 $PPh_2^tBu$ 、  
 $BINAP$ 、 $dppf$ 、 $dba$ 、およびこれらの組み合わせからなる群から選択される、  
項目 6 4 に記載のプロセス。

(項目 6 7)

前記触媒錯体は、 $Pd(PPh_3)_4$ 、 $PdCl_2(PPh_3)_2$ 、 $Pd(dppf)_2$ 、  
 $Cl_2$ 、 $Pd(dba)_3$ 、および $Pd(P^tBu_3)_2$ からなる群から選択される、  
項目 6 4 に記載のプロセス。

(項目 6 8)

ステップ d ) における前記塩基は、 $Na_2CO_3$ 、 $NaHCO_3$ 、 $Cs_2CO_3$ 、 $CsF$ 、  
 $KF$ 、 $K_2CO_3$ 、 $KOAc$ 、 $K_3PO_4$ 、 $NaOEt$ 、 $KOH$ 、および $CsOH$ から  
なる群から選択される、項目 5 6 に記載のプロセス。

(項目 6 9)

それらを必要とする対象において、タンパク質キナーゼ媒介性状態を治療する、または予防する方法であって、有効量の項目 1 ~ 4 2 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物、もしくはその薬剤として許容可能な塩、または組成物を、前記対象に投与するステップを含む、方法。

(項目 7 0)

前記タンパク質キナーゼ媒介性状態は、PKC 媒介性状態である、項目 6 9 に記載の方法。  
。

(項目 7 1)

前記 PKC 媒介性状態は、PKC - 媒介性状態である、項目 7 0 に記載の方法。

(項目 7 2)

前記 PKC - 媒介性状態は、自己免疫疾患、炎症性疾患、または増殖性もしくは過剰増殖性疾患である、項目 7 1 に記載の方法。

(項目 7 3)

前記 PKC - 媒介性状態は、喘息、乾癐、関節炎、関節リウマチ、関節の炎症、多発性硬化症、糖尿病、炎症性腸疾患、移植拒絶、T 細胞白血病、リンパ腫、および狼瘍からなる群から選択される、項目 7 2 に記載の方法。

(項目 7 4)

前記 PKC - 媒介性状態は、自己免疫疾患である、項目 7 1 に記載の方法。

(項目 7 5)

前記自己免疫疾患は、多発性硬化症、関節リウマチ、および過敏性腸疾患からなる群から選択される、項目 7 4 に記載の方法。

(項目 7 6)

前記自己免疫疾患は、多発性硬化症である、項目 7 5 に記載の方法。

(項目 7 7)

前記自己免疫疾患は、関節リウマチである、項目 7 5 に記載の方法。

(項目 7 8)

前記自己免疫疾患は、過敏性腸疾患である、項目 7 5 に記載の方法。

(項目 7 9)

前記 PKC - 媒介性状態は、T 細胞白血病およびリンパ腫からなる群から選択される、  
項目 7 2 に記載の方法。