

【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 17 年 12 月 22 日 (2005.12.22)

【公表番号】特表 2004-513171 (P2004-513171A)

【公表日】平成 16 年 4 月 30 日 (2004.4.30)

【年通号数】公開・登録公報 2004-017

【出願番号】特願 2002-541100 (P2002-541100)

【国際特許分類第 7 版】

C 0 7 D 487/04

A 6 1 K 31/53

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/22

【F I】

C 0 7 D 487/04 1 4 4

A 6 1 K 31/53

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/22

【手続補正書】

【提出日】平成 16 年 11 月 5 日 (2004.11.5)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

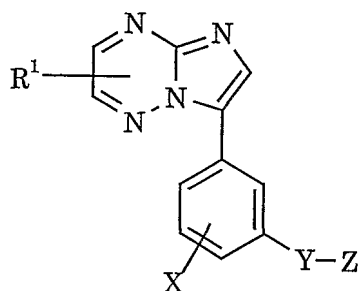
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 下記式 I の化合物または該化合物の塩もしくはプロドラッグ。

【化 1】



(I)

[ 式中、

X は水素またはハロゲンを表し、

Y は、化学結合、酸素原子または -NH- 連結を表し、

Z は、置換されていても良いアリール基またはヘテロアリール基を表し、

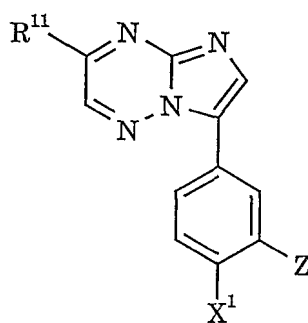
R<sup>1</sup> は、水素、炭化水素、複素環基、ハロゲン、シアノ、トリフルオロメチル、ニトロ、  
 -OR<sup>a</sup>、-SR<sup>a</sup>、-SOR<sup>a</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>a</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、  
 -NR<sup>a</sup>COR<sup>b</sup>、-NR<sup>a</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>b</sup>、-COR<sup>a</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>a</sup>、-CONR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>  
 または -CR<sup>a</sup>=NOR<sup>b</sup> を表し、

R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> は独立に、水素、炭化水素または複素環基を表す。]

【請求項 2】 下記式 I I A によって表される請求項 1 に記載の化合物ならびに該化

化合物の塩およびプロドラッグ。

【化 2】



(IIA)

[ 式中、

$X^1$  は水素またはフルオロを表し、

Z は請求項 1 で定義の通りであり、

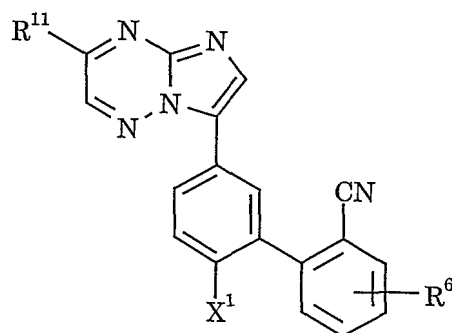
$R^{11}$  は、水素、 $C_{1-6}$  アルキル、ハロ ( $C_{1-6}$ ) アルキル、ジハロ ( $C_{1-6}$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_{1-6}$ ) アルキル、ヘテロアリール、ハロゲン、トリフルオロメチル、 $C_{1-6}$  アルコキシ、ホルミル、 $C_{2-6}$  アルキルカルボニル、 $C_{2-6}$  アルコキシカルボニルまたは  $-CR^4 = NOR^5$  を表し、

$R^4$  は、水素または  $C_{1-6}$  アルキルを表し、

$R^5$  は、水素、 $C_{1-6}$  アルキル、ヒドロキシ ( $C_{1-6}$ ) アルキルまたはジ ( $C_{1-6}$ ) アルキルアミノ ( $C_{1-6}$ ) アルキルを表す。]

【請求項 3】 下記式 I I B によって表される請求項 2 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

【化 3】



(IIB)

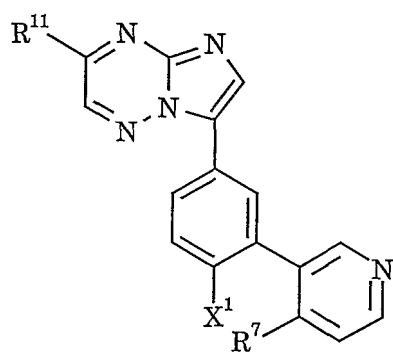
[ 式中、

$X^1$  および  $R^{11}$  は請求項 2 で定義の通りであり、

$R^6$  は水素を表す。]

【請求項 4】 下記式 I I C によって表される請求項 2 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

【化 4】



(IIC)

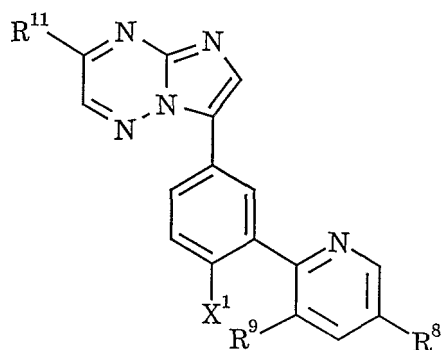
[ 式中、

$X^1$  および  $R^{11}$  は請求項 2 で定義の通りであり、

$R^7$  は水素、ハロゲンまたは  $C_{1-6}$  アルキルを表す。]

【請求項 5】 下記式 IID によって表される請求項 2 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩。

【化 5】



(IID)

[ 式中、

$X^1$  および  $R^{11}$  は請求項 2 で定義の通りであり、

$R^8$  は水素またはフッ素を表し、

$R^9$  は水素、フッ素またはシアノを表す。]

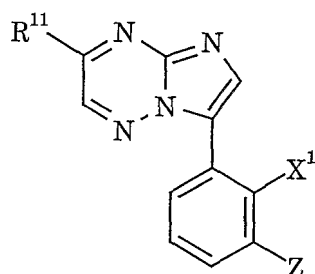
【請求項 6】  $R^8$  および  $R^9$  がいずれもフッ素を表す請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】  $X^1$  がフッ素を表す請求項 2 ないし 6 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 8】  $R^{11}$  が 2 - ヒドロキシプロピル - 2 - イルを表す請求項 2 ないし 7 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 9】 下記式 IIE によって表される請求項 1 に記載の化合物ならびに該化合物の塩およびプロドラッグ。

【化 6】



(IIE)

[ 式中、Zは請求項1で定義の通りであり、  
X<sup>1</sup> および R<sup>11</sup> は請求項2で定義の通りである。 ]

【請求項10】

3 - ( 2 - メチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル ) ビフェニル - 2 - カルボニトリル、

3 - ( 3 - メチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル ) ビフェニル - 2 - カルボニトリル、

2 - フルオロ - 5 - ( 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル ) ビフェニル - 2 - カルボニトリル、

から選択される化合物ならびに該化合物の塩およびプロドラッグ。

【請求項11】

3 - ( 1 - フルオロ - 1 - メチルエチル ) - 7 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( ピリジン - 3 - イル ) フェニル ] イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、

2 - フルオロ - 5 - ( イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル ) ビフェニル - 2 - カルボニトリル、

7 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( ピリジン - 2 - イル ) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、

2 - フルオロ - 3 - ( 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル ) ビフェニル - 2 - カルボニトリル、

2 - [ 2 - フルオロ - 5 - ( 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] トリアジン - 7 - イル ) フェニル ] - ニコチノニトリル、

3 - ( 1 , 1 - ジフルオロエチル ) - 7 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( ピリジン - 3 - イル ) フェニル ] イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、

3 - tert - ブチル - 7 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( ピリジン - 3 - イル ) フェニル ] イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、

3 - tert - ブチル - 7 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( ピリジン - 2 - イル ) フェニル ] イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、

2 - { 7 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( ピリジン - 3 - イル ) フェニル ] イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 - イル } プロパン - 2 - オール、

2 - { 7 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( ピリジン - 4 - イル ) フェニル ] イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 - イル } プロパン - 2 - オール、

2 - フルオロ - 5 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル ) イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル ] ビフェニル - 2 - カルボニトリル、

2 - { 7 - [ 2 - フルオロ - 3 - ( ピリジン - 4 - イル ) フェニル ] イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 - イル } プロパン - 2 - オール、

から選択される化合物ならびに該化合物の塩およびプロドラッグ。

【請求項12】

2 - { 2 - フルオロ - 5 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル ) イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル ] フェニル } ニコチノニトリル、

7 - [ 6 - フルオロ - 2 - (メタンスルホニル) ピフェニル - 3 - イル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 3 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル ) イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル ] ピフェニル - 2 - カルボニトリル、  
 2 - { 7 - [ 3 - ( 3 , 5 - ジフルオロピリジン - 2 - イル ) - 4 - フルオロフェニル ] イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 - イル } プロパン - 2 - オール、  
 4 - { 2 - フルオロ - 5 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル ) イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル ] フェニル } ニコチノニトリル、  
 6 , 2 - ジフルオロ - 5 - [ 3 - ( 1 - フルオロ - 1 - メチルエチル ) イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル ] ピフェニル - 2 - カルボニトリル、  
 7 - [ 3 - ( 3 , 5 - ジフルオロピリジン - 2 - イル ) - 4 - フルオロフェニル ] - 3 - ( 1 - フルオロ - 1 - メチルエチル ) - イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 4 , 6 , 2 - トリフルオロ - 5 - [ 3 - ( 1 - フルオロ - 1 - メチルエチル ) イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル ] ピフェニル - 2 - カルボニトリル、  
 2 - { 7 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( 3 - フルオロピリジン - 2 - イル ) フェニル ] イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 - イル } プロパン - 2 - オール、  
 2 - { 7 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( 5 - フルオロピリジン - 2 - イル ) フェニル ] イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 - イル } プロパン - 2 - オール、  
 2 - [ 7 - ( 4 - フルオロ - 3 - ( ピリジン - 2 - イル ) フェニル ) イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 - イル ] プロパン - 2 - オール、  
 2 - [ 7 - ( 4 - フルオロ - 3 - ( ピリダジン - 3 - イル ) フェニル ) イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 - イル ] プロパン - 2 - オール、  
 2 - [ 7 - ( 4 - フルオロ - 3 - ( ピリミジン - 4 - イル ) フェニル ) イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 - イル ] プロパン - 2 - オール、  
 2 - [ 7 - ( 4 - フルオロ - 3 - ( ピリダジン - 4 - イル ) フェニル ) イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 - イル ] プロパン - 2 - オール、  
 4 - { 2 - フルオロ - 5 - [ 3 - ( 1 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル ) イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル ] フェニル } ピリミジン - 5 - カルボニトリル、  
 2 - { 7 - [ 3 - ( 3 , 5 - ジフルオロピリジン - 2 - イル ) フェニル ] イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 - イル } プロパン - 2 - オール、  
 7 - [ 3 - ( 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 7 - [ 4 - クロロ - 3 - ( ピリジン - 3 - イル ) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 7 - [ 3 - ( ピリジン - 3 - イル ) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 7 - [ 3 - ( [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾール - 1 - イル ) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 7 - [ 3 - ( 2 - メチル - 2 H - [ 1 , 2 , 3 ] トリアゾール - 4 - イル ) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 7 - [ 3 - ( 1 - メチル - 1 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾール - 3 - イル ) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 7 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( イミダゾール - 1 - イル ) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 7 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( ピリジン - 3 - イル ) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、

[illegible]

7 - [ 3 - (チアゾール - 4 - イル) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 7 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( 1 - メチルピラゾール - 4 - イル) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 7 - [ 3 - (イミダゾール - 1 - イル) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 7 - [ 3 - ( 3 - メチル - [ 1 , 2 , 4 ] オキサジアゾール - 5 - イル) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 7 - [ 3 - ( 1 - エチルピラゾール - 3 - イル) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 7 - [ 3 - ( 5 - メチル - [ 1 , 2 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 7 - [ 3 - ( [ 1 , 2 , 3 ] チアジアゾール - 4 - イル) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 7 - [ 3 - ( 5 - メチル - [ 1 , 2 , 4 ] チアジアゾール - 2 - イル) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 7 - [ 2 - フルオロ - 3 - (ピリジン - 4 - イル) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 7 - ( 2 - メトキシビフェニル - 3 - イル) - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 1 - [ 3 - ( 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル) ビフェニル - 3 - イル ] エタノン、  
 3 - ( 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル) ビフェニル - 4 - カルボアルデヒド、  
 7 - ( 2 - フルオロ - 3 , 4 - ジメトキシビフェニル - 5 - イル) - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 1 - [ 2 - フルオロ - 5 - ( 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル) ビフェニル - 3 - イル ] エタノン、  
 3 - [ 2 - フルオロ - 5 - ( 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル) ビフェニル - 3 - イル ] アクリル酸、  
 2 - フルオロ - 5 - ( 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル) ビフェニル - 4 - カルボアルデヒド、  
 2 - フルオロ - 5 - ( 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル) ビフェニル - 3 - イルアミン、  
 N - [ 3 - ( 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル) ビフェニル - 3 - イル ] アセトアミド、  
 3 - ( 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル) ビフェニル - 2 - カルボアルデヒド、  
 [ 3 - ( 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル) ビフェニル - 4 - イル ] メタノール、  
 1 - [ 3 - ( 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル) ビフェニル - 4 - イル ] エタノン、  
 3 - [ 3 - ( 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル) フェニル ] チオフエン - 2 - カルボアルデヒド、  
 3 - ( 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル) ビフェニル - 4 - カルボニトリル、  
 7 - [ 3 - ( 3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) - 4 - フルオロフェニル ] - 3 - トリフルオロメチル - イミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、  
 7 - [ 3 - ( 3 - メトキシピリダジン - 5 - イル) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、

7 - ( 2 - フルオロ - 4 - メトキシビフェニル - 5 - イル ) - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、

7 - [ 4 - フルオロ - 3 - ( フル - 2 - イル ) フェニル ] - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、

7 - ( 2 - フルオロ - 4 - メチルチオビフェニル - 5 - イル ) - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、

7 - ( 2 - フルオロ - 2 - メトキシビフェニル - 5 - イル ) - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、

1 - { 5 - [ 2 - フルオロ - 5 - ( 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル ) フェニル ] チエン - 2 - イル } エタノン、

7 - ( 2 , 4 - ジフルオロビフェニル - 5 - イル ) - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、

2 - フルオロ - 5 - ( 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 7 - イル ) ビフェニル - 4 - オール、

7 - ( 3 - ニトロビフェニル - 3 - イル ) - 3 - トリフルオロメチルイミダゾ [ 1 , 2 - b ] [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン、

から選択される化合物ならびに該化合物の塩およびプロドラッグ。

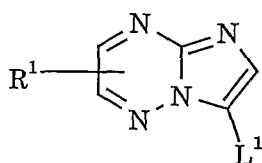
【請求項 13】 製薬上許容される担体とともに、請求項 1 に記載の式 I の化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくは該化合物のプロドラッグを含む医薬組成物。

【請求項 14】 有害神経状態の治療および/または予防用の医薬の製造における、請求項 1 に記載の式 I の化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくは該化合物のプロドラッグの使用。

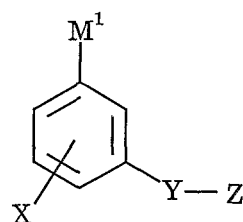
【請求項 15】

( A ) 遷移金属触媒存在下に、下記式 I I I の化合物と下記式 I V の化合物：

【化 7】



(III)



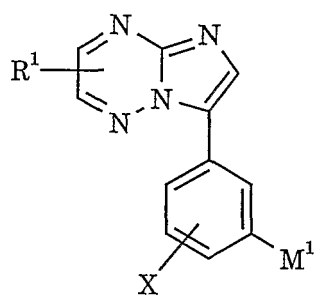
(IV)

[ 式中、X、Y、Z および R<sup>1</sup> は請求項 1 で定義の通りであり、L<sup>1</sup> は好適な脱離基を表し、M<sup>1</sup> は、ボロン酸部分 - B ( OH )<sub>2</sub> または有機ジオールと形成されるその環状エステルを表すか、あるいは M<sup>1</sup> は - S n ( Al k )<sub>3</sub> を表し、Al k は C<sub>1</sub> - 6 アルキル基を表す ] とを反応させる段階、あるいは

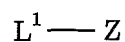
( B ) 遷移金属触媒存在下に下記式 V の化合物と下記式 V I の化合物：

【化 8】





(V)

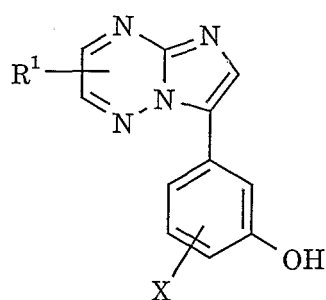


(VI)

[ 式中、X、Zおよび $R^1$ は請求項1で定義の通りであり、 $L^1$ および $M^1$ は上記で定義の通りである。 ] とを反応させる段階、あるいは

(C) 上記で定義の式V Iの化合物と下記式V I Iの化合物：

【化9】

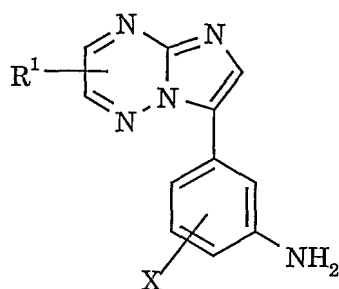


(VII)

[ 式中、Xおよび $R^1$ は請求項1で定義の通りである。 ] とを反応させる段階、あるいは

(D) 上記で定義の式V Iの化合物と下記式V I I Iの化合物：

【化10】

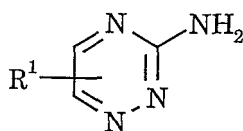


(VIII)

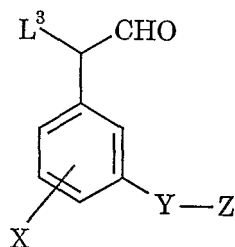
[ 式中、Xおよび $R^1$ は請求項1で定義の通りである。 ] とを反応させる段階、あるいは

(E) 下記式X I Iの化合物と下記式X I I Iの化合物：

【化11】



(XII)

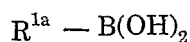


(XIII)

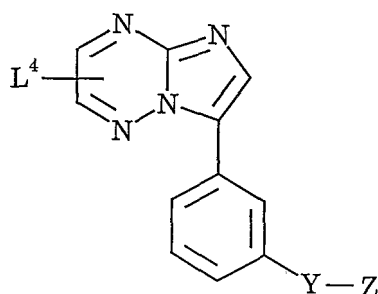
[ 式中、X、Y、Zおよび $R^1$ は請求項1で定義の通りであり、 $L^3$ は好適な脱離基を表す。 ] とを反応させる段階、あるいは

( F ) 遷移金属触媒の存在下、下記式XIVの化合物と下記式XVの化合物：

【化12】



(XIV)

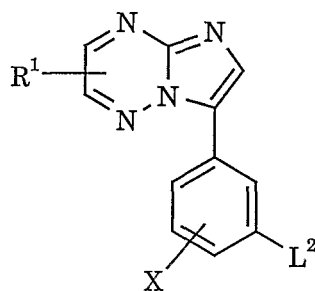


(XV)

[ 式中、YおよびZは請求項1で定義の通りであり、 $R^{1a}$ はアリールまたはヘテロアリール部分を表し、 $L^4$ は好適な脱離基を表す。 ] とを反応させる段階、あるいは

( G ) 遷移金属触媒存在下に、式M<sup>1</sup>-Zの化合物と下記式VAの化合物：

【化13】



(VA)

[ 式中、X、Zおよび $R^1$ は請求項1で定義の通りであり、 $M^1$ は上記で定義の通りであり、 $L^2$ は好適な脱離基を表す。 ] とを反応させる段階、あるいは

( H ) 上記で定義の式VIIの化合物と2,5-ジメトキシテトラヒドロフランとを反応させる段階、ならびに

( J ) 適宜に、最初に得られた式Iの化合物を、標準的な方法によって別の式Iの化合物に変換する段階

を有する請求項1に記載の化合物の製造方法。