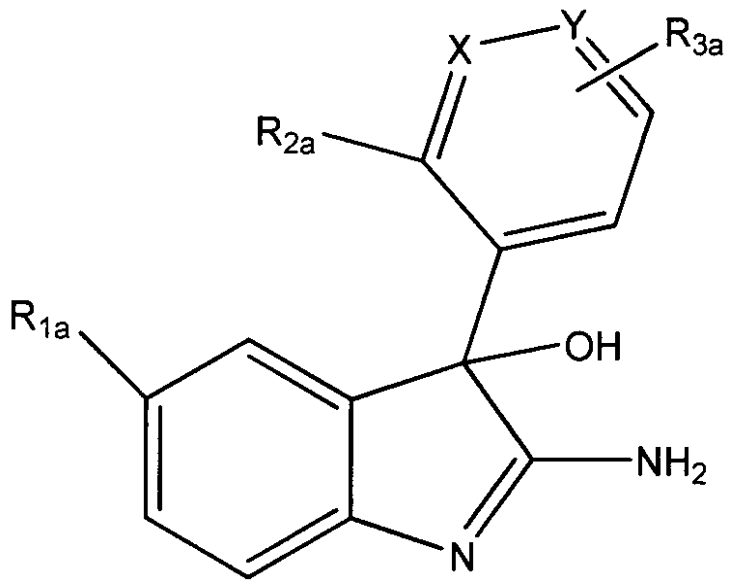
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成25年12月12日(2013.12.12)

【公表番号】特表2013-509425(P2013-509425A)
【公表日】平成25年3月14日(2013.3.14)
【年通号数】公開・登録公報2013-013
【出願番号】特願2012-537060(P2012-537060)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 209/40　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 33/06　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/404　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 401/04　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4439　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 405/04　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/5377　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 491/056　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 417/04　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/407　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/454　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 401/10　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/55　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 403/10　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 405/06　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 409/06　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 405/12　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/541　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4184　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4709　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4725　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 409/04　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/433　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/427　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 405/10　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 403/04　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/416　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/428　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/496　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 209/40　ＣＳＰ
Ａ６１Ｐ 33/06
Ａ６１Ｋ 31/404
Ｃ０７Ｄ 401/04
Ａ６１Ｋ 31/4439
Ｃ０７Ｄ 405/04
Ａ６１Ｋ 31/5377
Ｃ０７Ｄ 491/056
Ｃ０７Ｄ 417/04
Ａ６１Ｋ 31/407
Ａ６１Ｋ 31/454

Ｃ０７Ｄ 401/10
Ａ６１Ｋ 31/55
Ｃ０７Ｄ 403/10
Ｃ０７Ｄ 405/06
Ｃ０７Ｄ 409/06
Ｃ０７Ｄ 405/12
Ａ６１Ｋ 31/541
Ａ６１Ｋ 31/4184
Ａ６１Ｋ 31/4709
Ａ６１Ｋ 31/4725
Ｃ０７Ｄ 409/04
Ａ６１Ｋ 31/433
Ａ６１Ｋ 31/427
Ｃ０７Ｄ 405/10
Ｃ０７Ｄ 403/04
Ａ６１Ｋ 31/416
Ａ６１Ｋ 31/428
Ａ６１Ｋ 31/496

【手続補正書】
【提出日】平成25年10月24日(2013.10.24)
【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IIa：
【化１】



(IIa)

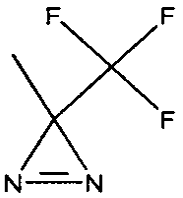
（式中、
Xは、炭素または窒素であり、
Yは、炭素または窒素であり、
R_{1a}は、ハロゲン、(C_1-C_4)アルキル、または(C_1-C_4)アルコキシであり、

R_{2a}は、$(C_1\text{-}C_6)$アルキル、$(C_1\text{-}C_6)$アルコキシ、$S(C_1\text{-}C_6)$アルキル、$SO(C_1\text{-}C_6)$アルキルまたは$SO_2(C_1\text{-}C_6)$アルキルであり、R_{4a}によって表される1以上の基で任意に置換され、

R_{3a}は、ハロゲン、$(C_1\text{-}C_6)$アルキル、または$(C_1\text{-}C_6)$アルコキシであり、各々、R_{4a}によって表される1以上の基で任意に置換され、

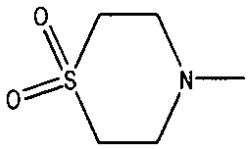
各R_{4a}は独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、$(C_1\text{-}C_4)$アルキル、ハロ$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ヒドロキシ$(C_1\text{-}C_4)$アルキル、$(C_1\text{-}C_4)$アルコキシ、ハロ$(C_1\text{-}C_4)$アルコキシ、アリール、ハロアリール、シクロアルキル、アリール$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、アリール$(C_1\text{-}C_4)$アルコキシ、ヘテロシクリル、$N(R_{5a})_2$、$C(=NOH)NH_2$、$NR_{5a}CON(R_{5a})_2$、$CON(R_{5a})_2$、CO_2R_{5a}、COR_{6a}、$OC(O)R_{5a}$、$SO_2N(R_{5a})_2$、SO_2R_{6a}、SR_{6a}、$S(C_1\text{-}C_3)$アルキルシクロアルキル、$NR_{5a}COR_{6a}$、$NR_5CO_2R_{6a}$、$NR_{5a}SO_2R_{6a}$、$S(=O)R_{6a}$、-O-シクロアルキル、-O-ヘテロシクリル、アダマンチル、$OC(=O)N(R_{5a})_2$、

【化２】



、または

【化３】



であり、

各R_{5a}は独立して、水素であるか、または$(C_1\text{-}C_{10})$アルキル、アリール、もしくはアリール$(C_1\text{-}C_6)$アルキルであり、各々、ハロゲン、$(C_1\text{-}C_3)$アルコキシ、$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ハロ$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ハロ$(C_1\text{-}C_3)$アルコキシ、シアノ、もしくはニトロで任意に置換される、かつ

各R_{6a}は独立して、水素もしくはハロゲンであるか、または$(C_1\text{-}C_{10})$アルキル、$(C_1\text{-}C_{10})$アルコキシ、アリール$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、シクロアルキル、もしくはアリール$(C_1\text{-}C_3)$アルコキシであり、各々、ハロゲン、$(C_1\text{-}C_3)$アルコキシ、$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ハロ$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ハロ$(C_1\text{-}C_3)$アルコキシ、シアノ、もしくはニトロで任意に置換される）の該化合物またはその医薬として許容し得る塩。

【請求項２】

R_{2a}は、$(C_1\text{-}C_6)$アルコキシである、請求項１に記載の化合物。

【請求項３】

R_{3a}はハロゲンである、請求項１または２に記載の化合物。

【請求項４】

R_{1a}は塩素であり、R_{2a}はエトキシであり、R_{3a}はフッ素であり、かつXは炭素である、請求項１～３のいずれか一項に記載の化合物。

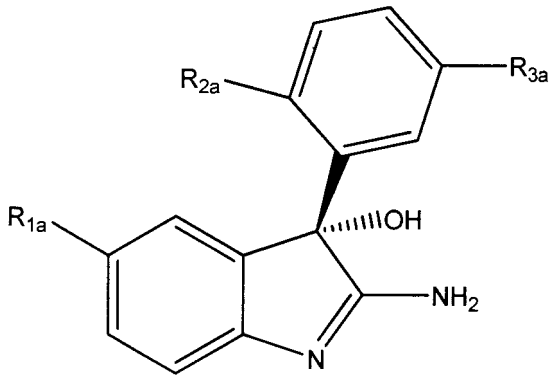
【請求項５】

R_{1a}は塩素であり、R_{2a}およびR_{3a}はメトキシであり、かつXは窒素である、請求項１～３のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項６】

式IIIa：

【化４】



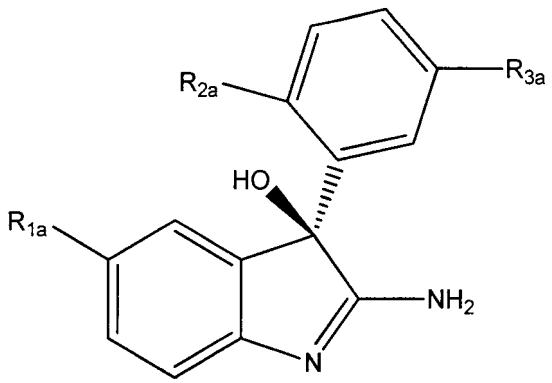
(IIIa)

の構造を有する、請求項１～４のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬として許容し得る塩。

【請求項７】

式XXIIIa：

【化５】



(XXIIIa)

の構造を有する、請求項１～４のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬として許容し得る塩。

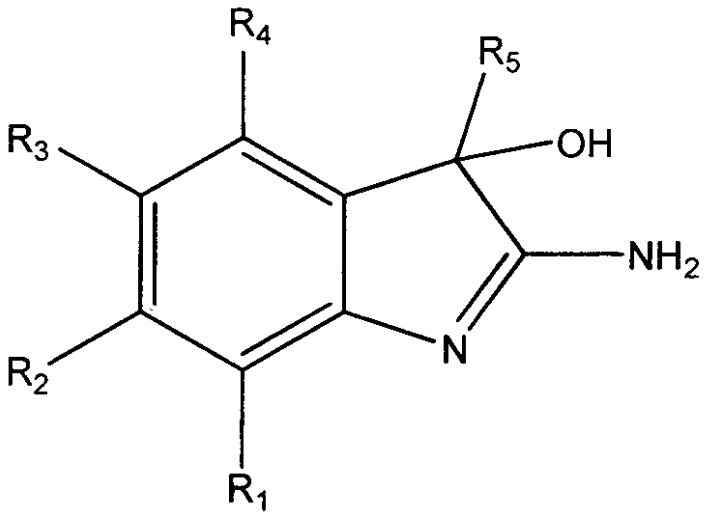
【請求項８】

請求項１～７のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬として許容し得る塩と、医薬として許容し得る担体とを含む、医薬組成物。

【請求項９】

式I：

【化６】



(I)

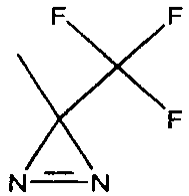
の化合物またはその医薬として許容し得る塩を含む、マラリアを有する対象を治療するための医薬組成物であって、式中、

R_1、R_2、R_3、およびR_4は独立して、水素、ハロゲン、$(C_1\text{-}C_4)$アルキル、または$(C_1\text{-}C_4)$アルコキシであり、

R_5は、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、アリール$(C_3\text{-}C_{10})$ヘテロシクリル、アリール$(C_1\text{-}C_3)$アルコキシ、ヘテロアリール$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、シクロアルキル$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ヘテロシクリル$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、アルキルヘテロアリール、$(C_1\text{-}C_6)$アルキル、または$(C_1\text{-}C_4)$アルコキシであり、各々、R_6によって表される1～3個の基で任意に置換され、

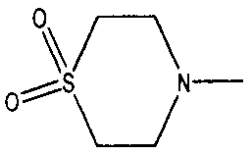
各R_6は独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、$(C_1\text{-}C_4)$アルキル、ハロ$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ヒドロキシ$(C_1\text{-}C_4)$アルキル、$(C_1\text{-}C_4)$アルコキシ、ハロ$(C_1\text{-}C_4)$アルコキシ、アリール、ハロアリール、シクロアルキル、アリール$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、アリール$(C_1\text{-}C_4)$アルコキシ、ヘテロシクリル、$N(R_7)_2$、$C(=NOH)NH_2$、$NR_7CON(R_7)_2$、$CON(R_7)_2$、CO_2R_7、COR_8、$OC(O)R_8$、S、$SO_2N(R_8)_2$、SO_2R_8、SR_8、$S(C_1\text{-}C_3)$アルキルシクロアルキル、NR_7COR_8、$NR_7CO_2R_8$、$NR_8SO_2R_8$、$S(=O)R_8$、-O-シクロアルキル、-O-ヘテロシクリル、アダマンチル、$OC(=O)N(R_7)_2$、

【化７】



、または

【化８】



であり、

各R_7は独立して、水素であるか、または$(C_1\text{-}C_{10})$アルキル、アリール、もしくはアリール$(C_1\text{-}C_3)$アルキルであり、各々は、ハロゲン、$(C_1\text{-}C_3)$アルコキシ、$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ハロ$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ハロ$(C_1\text{-}C_3)$アルコキシ、シアノ、もしくはニトロで任意に置換され、かつ

各R_8は独立して、水素もしくはハロゲンであるか、または(C_1-C_{10})アルキル、(C_1-C_{10})アルコキシ、アリール、アリール(C_1-C_3)アルキル、シクロアルキル、もしくはアリール(C_1-C_3)アルコキシであり、各々、ハロゲン、(C_1-C_3)アルコキシ、(C_1-C_3)アルキル、ハロ(C_1-C_3)アルキル、ハロ(C_1-C_3)アルコキシ、シアノ、もしくはニトロで任意に置換される、医薬組成物。

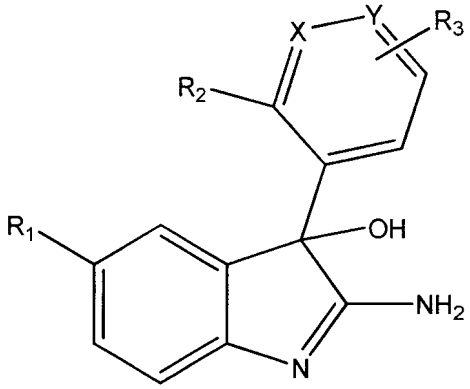
【請求項１０】

R_3は塩素である、請求項９に記載の医薬組成物。

【請求項１１】

式II：

【化９】



(II)

の化合物またはその医薬として許容し得る塩を含む、マラリアを有する対象を治療するための医薬組成物であって、式中、

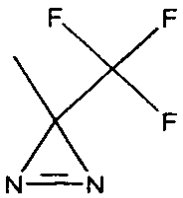
Xは、炭素または窒素であり、

Yは、炭素または窒素であり、

R_1、R_2およびR_3は独立して、水素もしくはハロゲンであるか、またはニトロ、シアノ、ヒドロキシ、(C_1-C_6)アルキル、(C_2-C_6)アルケニル、(C_2-C_6)アルキニル、(C_1-C_6)アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール(C_1-C_3)アルキル、ヘテロアリール(C_1-C_3)アルキル、シクロアルキル(C_1-C_3)アルキル、ヘテロシクリル(C_1-C_3)アルキル、ヒドロキシ(C_1-C_3)アルキル、$N(R_7)_2$、$-C(=NOH)NH_2$、$-NR_7CON(R_7)_2$、$-CON(R_7)_2$、$-CO_2R_7$、$-COR_8$、$-OC(O)R_7$、$-SO_2N(R_7)_2$、$-SO_2R_8$、$-NR_7COR_8$、$-NR_7CO_2R_8$、$-NR_7SO_2R_8$、もしくは$-OC(=O)N(R_7)_2$であり、各々、R_6によって表される1以上の基で任意に置換され、

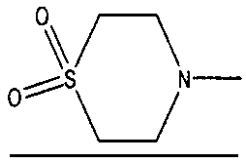
各R_6は独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、(C_1-C_4)アルキル、ハロ(C_1-C_3)アルキル、ヒドロキシ(C_1-C_4)アルキル、(C_1-C_4)アルコキシ、ハロ(C_1-C_4)アルコキシ、アリール、ハロアリール、シクロアルキル、アリール(C_1-C_3)アルキル、アリール(C_1-C_4)アルコキシ、ヘテロシクリル、$-N(R_7)_2$、$-C(=NOH)NH_2$、$-NR_7CON(R_7)_2$、$-CON(R_7)_2$、$-CO_2R_7$、$-COR_8$、$-OC(O)R_8$、$-SO_2N(R_8)_2$、$-SO_2R_8$、$-SR_8$、$-S(C_1-C_3)$アルキルシクロアルキル、$-NR_7COR_8$、$-NR_7CO_2R_8$、$-NR_8SO_2R_8$、$-S(=O)R_8$、-O-シクロアルキル、-O-ヘテロシクリル、アダマンチル、$-OC(=O)N(R_7)_2$、

【化１０】



、または

【化１１】



であり、

各R_7は独立して、水素であるか、または$(C_1\text{-}C_{10})$アルキル、アリール、もしくはアリール$(C_1\text{-}C_3)$アルキルであり、各々、ハロゲン、$(C_1\text{-}C_3)$アルコキシ、$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ハロ$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ハロ$(C_1\text{-}C_3)$アルコキシ、シアノ、もしくはニトロで任意に置換され、かつ

各R_8は独立して、水素もしくはハロゲンであるか、または$(C_1\text{-}C_{10})$アルキル、$(C_1\text{-}C_{10})$アルコキシ、アリール、アリール$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、シクロアルキル、もしくはアリール$(C_1\text{-}C_3)$アルコキシであり、各々、ハロゲン、$(C_1\text{-}C_3)$アルコキシ、$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ハロ$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ハロ$(C_1\text{-}C_3)$アルコキシ、シアノ、もしくはニトロで任意に置換される、医薬組成物。

【請求項１２】

R_1は塩素であり、R_2はエトキシであり、R_3はフッ素であり、Xは炭素であり、かつYは炭素である、請求項１１に記載の医薬組成物。

【請求項１３】

R_1は塩素であり、R_2およびR_3はメトキシであり、Xは窒素であり、かつYは炭素である、請求項１１に記載の医薬組成物。

【請求項１４】

R_1は塩素であり、R_2はヒドロキシであり、かつR_3はフッ素である、請求項１１に記載の医薬組成物。

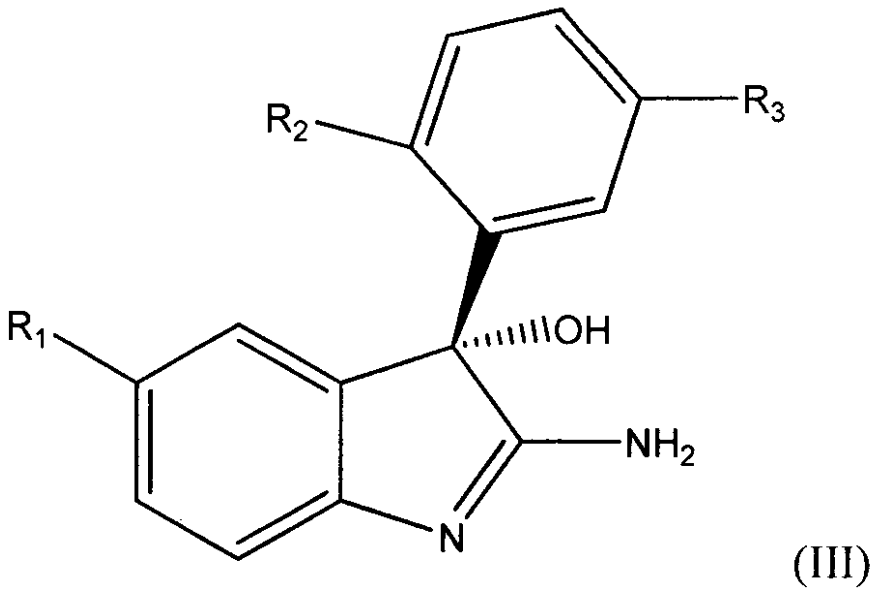
【請求項１５】

Xは炭素であり、かつYは炭素である、請求項１４に記載の医薬組成物。

【請求項１６】

式III：

【化１２】



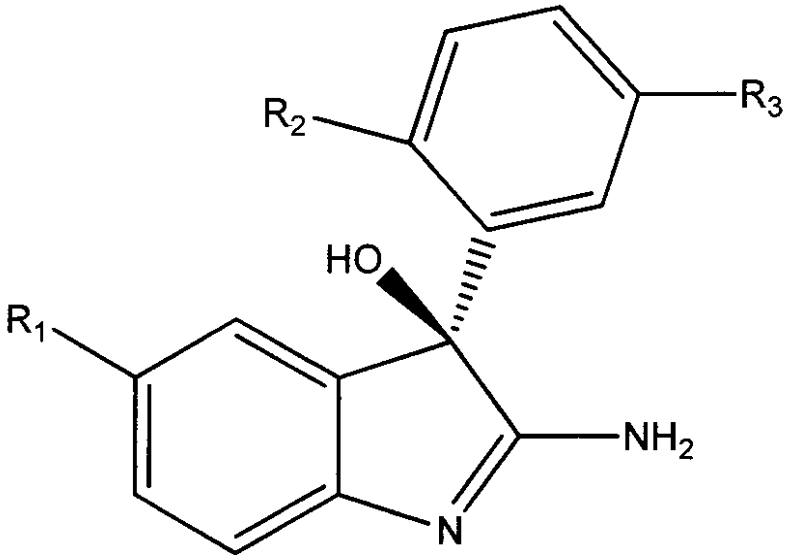
(III)

の化合物またはその医薬として許容し得る塩を含む、請求項１１に記載の医薬組成物。

【請求項１７】

式XXIII：

【化１３】



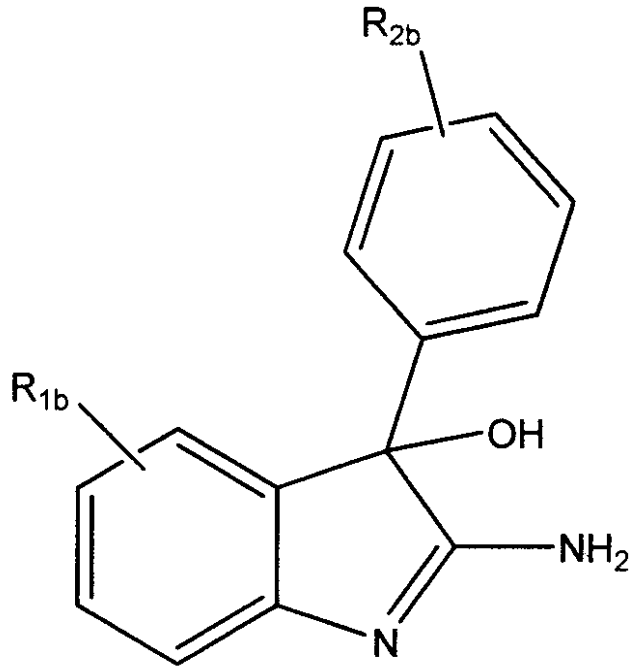
(XXIII)

の化合物またはその医薬として許容し得る塩を含む、請求項１１に記載の医薬組成物。

【請求項１８】

式VII：

【化１４】



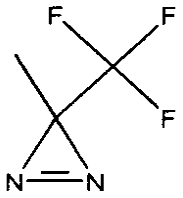
(VII)

によって表される化合物またはその医薬として許容し得る塩を調製する方法であって、式中、

各R_{1b}は独立して、水素もしくはハロゲンであるか、またはニトロ、シアノ、ヒドロキシ、$(C_1\text{-}C_6)$アルキル、$(C_2\text{-}C_6)$アルケニル、$(C_2\text{-}C_6)$アルキニル、$(C_1\text{-}C_6)$アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ヘテロアリール$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、シクロアルキル$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ヘテロシクリル$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ヒドロキシ$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、$N(R_{3b})_2$、$C(=NOH)NH_2$、$NR_{3b}CON(R_{3b})_2$、$CON(R_{3b})_2$、CO_2R_{3b}、COR_{4b}、$OC(O)R_{3b}$、$SO_2N(R_{3b})_2$、SO_2R_{4b}、$NR_{3b}COR_{4b}$、$NR_{3b}CO_2R_{4b}$、$NR_{3b}SO_2R_{4b}$、もしくは$OC(=O)N(R_{3b})_2$であり、各々、R_{2b}によって表される1以上の基で任意に置換され、

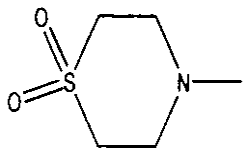
各R_{2b}は独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、(C_1-C_4)アルキル、ハロ(C_1-C_3)アルキル、ヒドロキシ(C_1-C_4)アルキル、(C_1-C_4)アルコキシ、ハロ(C_1-C_4)アルコキシ、アリール、ハロアリール、シクロアルキル、アリール(C_1-C_3)アルキル、アリール(C_1-C_4)アルコキシ、ヘテロシクリル、$N(R_{3b})_2$、$C(=NOH)NH_2$、$NR_{3b}CON(R_{3b})_2$、$CON(R_{3b})_2$、CO_2R_{3b}、COR_{4b}、$OC(O)R_{3b}$、$SO_2N(R_{3b})_2$、SO_2R_{4b}、SR_{4b}、$S(C_1-C_3)$アルキルシクロアルキル、$NR_{3b}COR_{4b}$、$NR_{3b}CO_2R_{4b}$、$NR_{3b}SO_2R_{4b}$、$S(=O)R_{3b}$、-O-シクロアルキル、-O-ヘテロシクリル、アダマンチル、$OC(=O)N(R_{3b})_2$、

【化１５】



、または

【化１６】



であり、

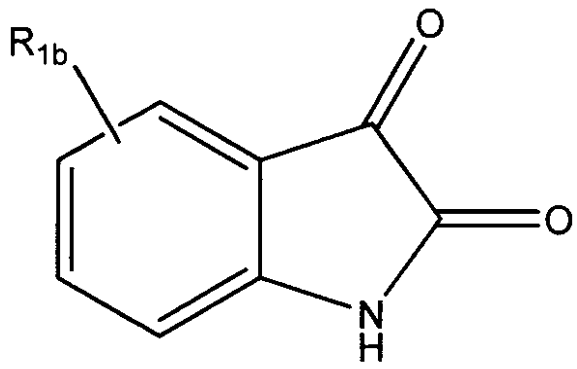
各R_{3b}は独立して、水素であるか、または(C_1-C_{10})アルキル、アリール、もしくはアリール(C_1-C_3)アルキルであり、各々、ハロゲン、(C_1-C_3)アルコキシ、(C_1-C_3)アルキル、ハロ(C_1-C_3)アルキル、ハロ(C_1-C_3)アルコキシ、シアノ、もしくはニトロで任意に置換される、かつ

各R_{4b}は独立して、水素もしくはハロゲンであるか、または(C_1-C_{10})アルキル、(C_1-C_{10})アルコキシ、アリール、アリール(C_1-C_3)アルキル、シクロアルキル、もしくはアリール(C_1-C_3)アルコキシであり、各々、ハロゲン、(C_1-C_3)アルコキシ、(C_1-C_3)アルキル、ハロ(C_1-C_3)アルキル、ハロ(C_1-C_3)アルコキシ、シアノ、もしくはニトロで任意に置換される、

該方法は、

a）式VIII：

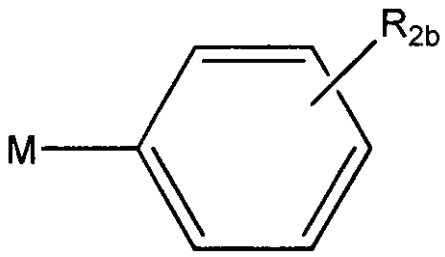
【化１７】



(VIII)

(式中、R_{1b}は上述で規定されるとおりである)によって表される化合物を、式IX：

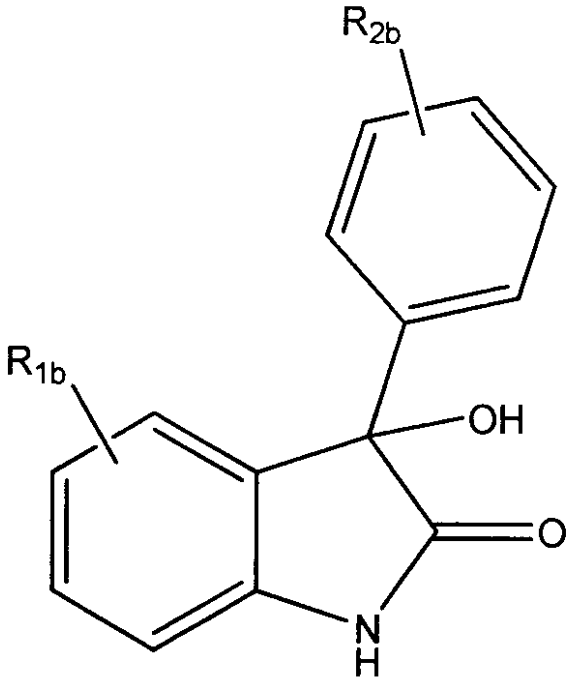
【化１８】



(IX)

（式中、R_{2b}は上述で規定されるとおりであり、Mは、-MgBr、-Li、または$-B(OH)_2$である）によって表される薬剤と反応させ、それにより式X：

【化１９】



(X)

(式中、R_{1b}およびR_{2b}は上述で規定されるとおりである)によって表される化合物を形成すること、および

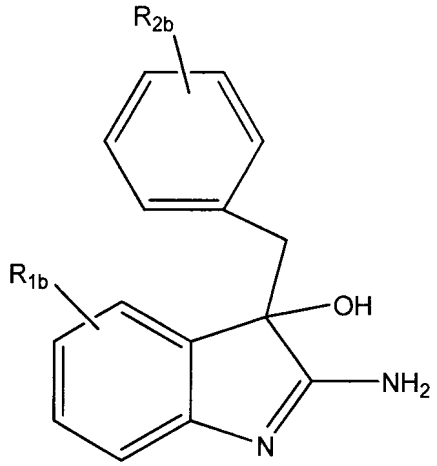
b）$SnCl_4$と、トリエチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン、およびN-メチルモルフォリンからなる群より選択される薬剤との存在下で、式Xの化合物をtert-ブチルジメチルシリルアミンでアミノ化し、それにより式VIIによって表される化合物またはその医薬として許容し得る塩を形成すること

を含む、方法。

【請求項１９】

式XI：

【化２０】



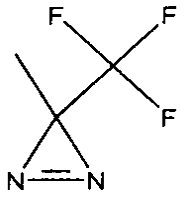
(XI)

によって表される化合物またはその医薬として許容し得る塩を調製する方法であって、式中、

各R_{1b}は独立して、水素もしくはハロゲンであるか、またはニトロ、シアノ、ヒドロキシ、$(C_1\text{-}C_6)$アルキル、$(C_2\text{-}C_6)$アルケニル、$(C_2\text{-}C_6)$アルキニル、$(C_1\text{-}C_6)$アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ヘテロアリール$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、シクロアルキル$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ヘテロシクリル$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ヒドロキシ$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、$N(R_{3b})_2$、$C(=NOH)NH_2$、$NR_{3b}CON(R_{3b})_2$、$CON(R_{3b})_2$、CO_2R_{3b}、COR_{4b}、$OC(O)R_{3b}$、$SO_2N(R_{3b})_2$、SO_2R_{4b}、$NR_{3b}COR_{4b}$、$NR_{3b}CO_2R_{4b}$、$NR_{3b}SO_2R_{4b}$、または$OC(=O)N(R_{3b})_2$であり、各々、R_{2b}によって表される1以上の基で任意に置換され、

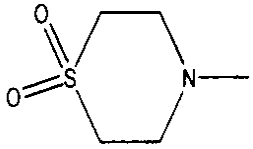
各R_{2b}は独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、$(C_1\text{-}C_4)$アルキル、ハロ$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ヒドロキシ$(C_1\text{-}C_4)$アルキル、$(C_1\text{-}C_4)$アルコキシ、ハロ$(C_1\text{-}C_4)$アルコキシ、アリール、ハロアリール、シクロアルキル、アリール$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、アリール$(C_1\text{-}C_4)$アルコキシ、ヘテロシクリル、$N(R_{3b})_2$、$C(=NOH)NH_2$、$NR_{3b}CON(R_{3b})_2$、$CON(R_{3b})_2$、CO_2R_{3b}、COR_{4b}、$OC(O)R_{3b}$、$SO_2N(R_{3b})_2$、SO_2R_{4b}、SR_{4b}、$S(C_1\text{-}C_3)$アルキルシクロアルキル、$NR_{3b}COR_{4b}$、$NR_{3b}CO_2R_{4b}$、$NR_{3b}SO_2R_{4b}$、$S(=O)R_{3b}$、-O-シクロアルキル、-O-ヘテロシクリル、アダマンチル、$OC(=O)N(R_{3b})_2$、

【化２１】



または

【化２２】



であり、

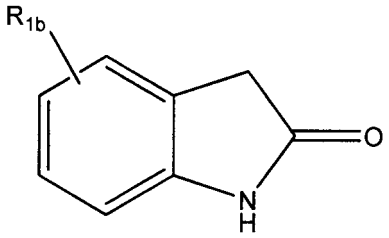
各R_{3b}は独立して、水素であるか、または$(C_1\text{-}C_{10})$アルキル、アリール、もしくはアリール$(C_1\text{-}C_3)$アルキルであり、各々、ハロゲン、$(C_1\text{-}C_3)$アルコキシ、$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ハロ$(C_1\text{-}C_3)$アルキル、ハロ$(C_1\text{-}C_3)$アルコキシ、シアノ、もしくはニトロで任意に置換さ

れ、かつ

各R_{4b}は独立して、水素もしくはハロゲンであるか、または(C_1-C_{10})アルキル、(C_1-C_{10})アルコキシ、アリール、アリール(C_1-C_3)アルキル、シクロアルキル、またはアリール(C_1-C_3)アルコキシであり、各々、ハロゲン、(C_1-C_3)アルコキシ、(C_1-C_3)アルキル、ハロ(C_1-C_3)アルキル、ハロ(C_1-C_3)アルコキシ、シアノ、もしくはニトロで任意に置換され、該方法は、

a）式XII：

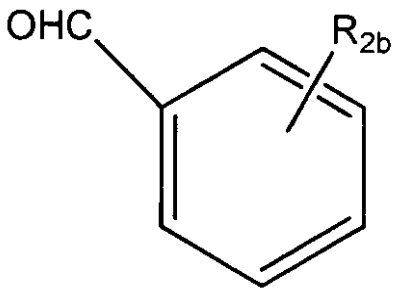
【化２３】



(XII)

(式中、R_{1b}は上述で規定されるとおりである)によって表される化合物を式XIII：

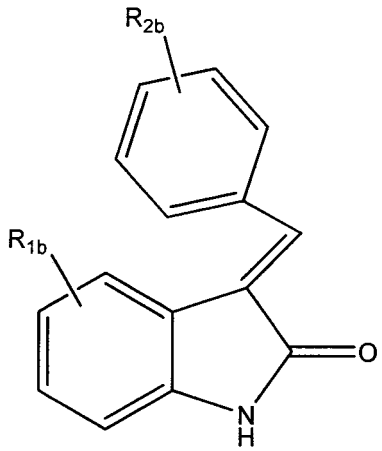
【化２４】



(XIII)

(式中、R_{2b}は上述で規定されるとおりである)によって表される薬剤と反応させ、それにより式XIV：

【化２５】

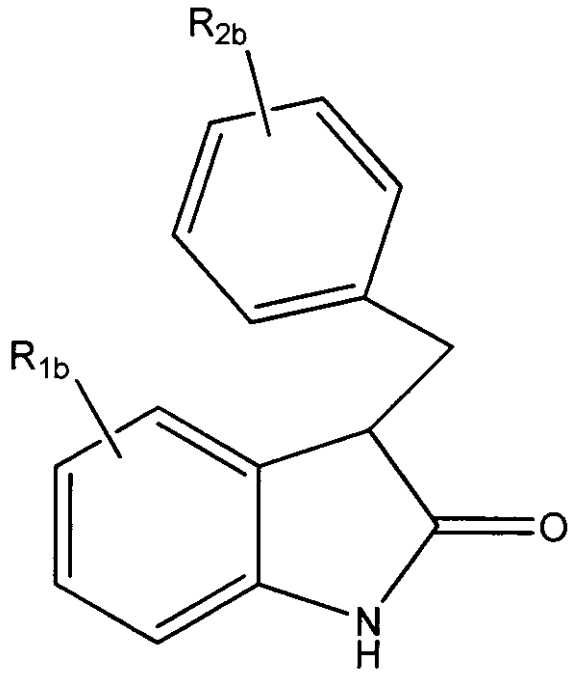


(XIV)

(式中、R_{1b}およびR_{2b}は上述で規定されるとおりである)によって表される化合物を形成すること、および

b）Pd／Cおよび任意にジフェニルスルフィドの存在下で、式XIVの化合物をH_2と反応させ、それにより式XV：

【化２６】

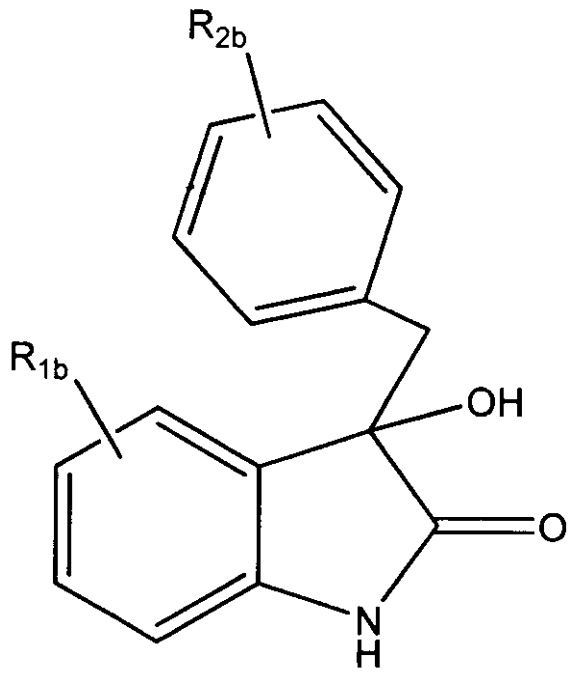


(XV)

(式中、R_{1b}およびR_{2b}は上述で規定されるとおりである)によって表される化合物を形成すること、および

c）式XVの化合物をペルオキシ一硫酸カリウムで酸化し、それにより式XVI：

【化２７】



(XVI)

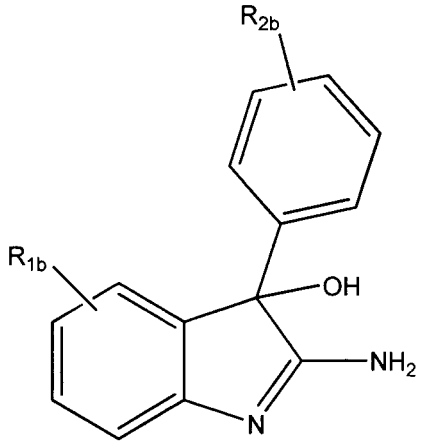
(式中、R_{1b}およびR_{2b}は上述で規定されるとおりである)によって表される化合物を形成すること、および

d）$SnCl_4$と、トリエチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン、およびN-メチルモルフォリンからなる群より選択される薬剤との存在下で、式XVIの化合物をtert-ブチルジメチルシリルアミンでアミノ化し、それにより式XIによって表される化合物またはその医薬として許容し得る塩を形成すること

を含む、方法。

【請求項２０】

式VII：
【化２８】



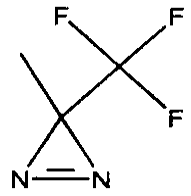
(VII)

によって表される化合物またはその医薬として許容し得る塩を調製する方法であって、式中、

各R_{1b}は独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノであるか、またはヒドロキシ、(C_1-C_6)アルキル、(C_2-C_6)アルケニル、(C_2-C_6)アルキニル、(C_1-C_6)アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール(C_1-C_3)アルキル、ヘテロアリール(C_1-C_3)アルキル、シクロアルキル(C_1-C_3)アルキル、ヘテロシクリル(C_1-C_3)アルキル、ヒドロキシ(C_1-C_3)アルキル、$N(R_{3b})_2$、$C(=NOH)NH_2$、$NR_{3b}CON(R_{3b})_2$、$CON(R_{3b})_2$、CO_2R_{3b}、COR_{4b}、$OC(O)R_{3b}$、$SO_2N(R_{3b})_2$、SO_2R_{4b}、$NR_{3b}COR_{4b}$、$NR_{3b}CO_2R_{4b}$、$NR_{3b}SO_2R_{4b}$、もしくは$OC(=O)N(R_{3b})_2$であり、各々、R_{2b}によって表される1以上の基で任意に置換され、

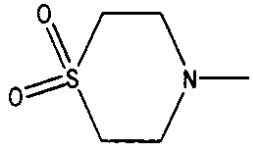
各R_{2b}は独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、(C_1-C_4)アルキル、ハロ(C_1-C_3)アルキル、ヒドロキシ(C_1-C_4)アルキル、(C_1-C_4)アルコキシ、ハロ(C_1-C_4)アルコキシ、アリール、ハロアリール、シクロアルキル、アリール(C_1-C_3)アルキル、アリール(C_1-C_4)アルコキシ、ヘテロシクリル、$N(R_{3b})_2$、$C(=NOH)NH_2$、$NR_{3b}CON(R_{3b})_2$、$CON(R_{3b})_2$、CO_2R_{3b}、COR_{4b}、$OC(O)R_{3b}$、S、$SO_2N(R_{3b})_2$、SO_2R_{4b}、SR_{4b}、$S(C_1-C_3)$アルキルシクロアルキル、$NR_{3b}COR_{4b}$、$NR_{3b}CO_2R_{4b}$、$NR_{3b}SO_2R_{4b}$、$S(=O)R_{3b}$、-O-シクロアルキル、-O-ヘテロシクリル、アダマンチル、$OC(=O)N(R_{3b})_2$、

【化２９】



、または

【化３０】



であり、

各R_{3b}は独立して、水素であるか、または(C_1-C_{10})アルキル、アリール、もしくはアリール(C_1-C_3)アルキルであり、各々、ハロゲン、(C_1-C_3)アルコキシ、(C_1-C_3)アルキル、ハロ(C_1-C_3)アルキル、ハロ(C_1-C_3)アルコキシ、シアノ、もしくはニトロで任意に置換され、かつ

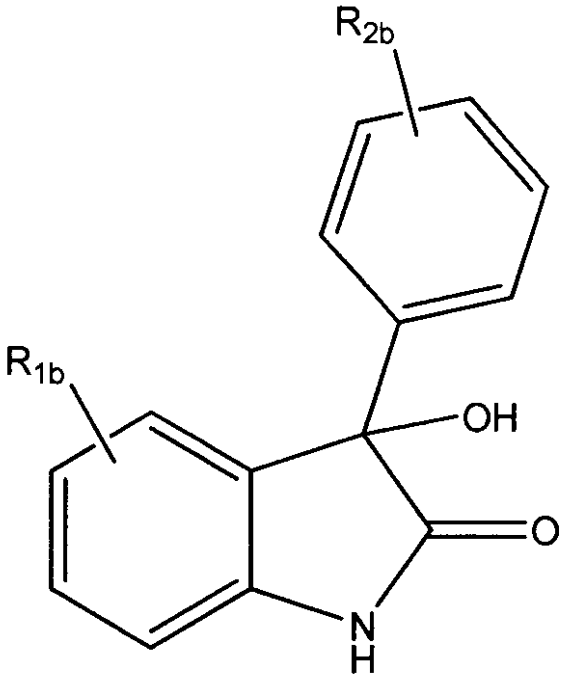
各R_{4b}は独立して、水素もしくはハロゲンであるか、または(C_1-C_{10})アルキル、(C_1-C_{10})アルコキシ、アリール、アリール(C_1-C_3)アルキル、シクロアルキル、もしくはアリール(C_1-C_3)アルコキシであり、各々、ハロゲン、(C_1-C_3)アルコキシ、(C_1-C_3)アルキル、ハロ(C_1-C_3)アルキル、ハロ(C_1-C_3)アルコキシ、シアノ、もしくはニトロで任意に置換され、かつ

R_{5b}は、水素または$C(=O)O(C_1-C_3)$アルキルであり、

該方法は、

$SnCl_4$と、トリエチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミンおよびN-メチルモルフォリンからなる群から選択される薬剤との存在下で、式X：

【化３１】



(X)

(式中、R_{1b}およびR_{2b}は上述で規定されるとおりである)によって表される化合物を、tert-ブチルジメチルシリルアミンでアミノ化し、それにより式VIIによって表される化合物またはその医薬として許容し得る塩を形成すること

を含む、方法。

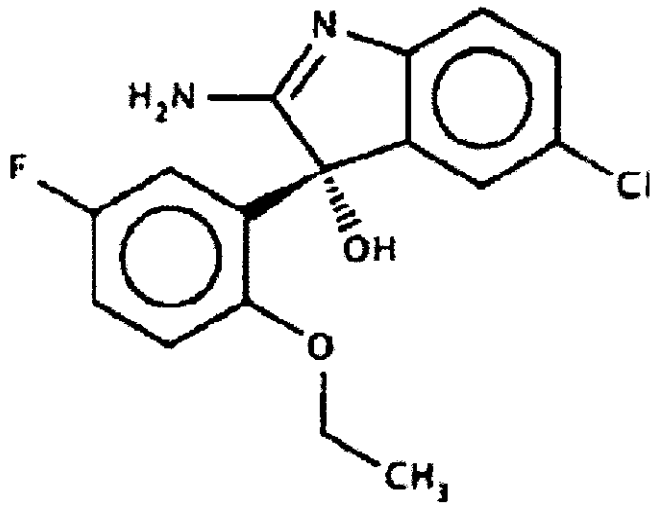
【請求項２１】

前記アミノ化は、テトラヒドロフラン（THF）の存在下で、約120℃の温度で約40～約60分間実施される、請求項２０に記載の方法。

【請求項２２】

以下の構造式：

【化３２】



によって表される化合物またはその医薬として許容し得る塩を含む、マラリアを有する対象を治療するための医薬組成物。