

【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22年10月28日(2010.10.28)

【公表番号】特表2010-503629(P2010-503629A)

【公表日】平成22年2月4日(2010.2.4)

【年通号数】公開・登録公報2010-005

【出願番号】特願2009-527741(P2009-527741)

【国際特許分類】

C 0 7 D 263/58 (2006.01)

A 6 1 K 31/423 (2006.01)

C 0 7 D 413/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 498/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

C 0 7 D 413/10 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 263/58 C S P

A 6 1 K 31/423

C 0 7 D 413/04

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/4725

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 498/04 1 0 5

A 6 1 K 31/437

A 6 1 K 31/541

C 0 7 D 413/12

A 6 1 K 31/496

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

C 0 7 D 413/10

A 6 1 P 7/00
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 25/00 1 0 1
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 3/10

【手続補正書】

【提出日】平成22年9月7日(2010.9.7)

【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

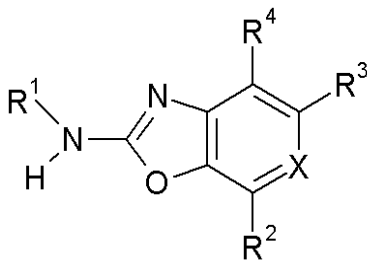
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



(I)

〔式中、

XはNまたはCR⁵であり、ここでR⁵はハロ、シアノ、ヒドロキシル、C₁-C₇-アルコキシ、C₁-C₇-アルキル、アミノ、N-モノ-もしくはN,N-ジ-C₁-C₇-アルキルまたは好ましくは水素であり；

R¹は置換もしくは非置換アリールであるか、または置換もしくは非置換ヘテロシクリルであり；そして

R²は置換もしくは非置換アリールであるか、または置換もしくは非置換ヘテロシクリルであり、これは環炭素原子を介して結合しており；

R³はシアノ、ヒドロキシル、C₁-C₇-アルキル、アミノ、N-モノ-もしくはN,N-ジ-C₁-C₇-アルキルまたは好ましくは水素であり；そして

R⁴はヒドロキシル、アミノまたは好ましくは水素である〕

の化合物、またはその塩。

【請求項2】

置換もしくは非置換アリールが、記載されていれば、6~14個の環炭素原子、より好ましくは6~10個の環炭素原子を有する芳香族性基、例えばフェニルまたはナフチルであり、これは非置換であるか、または1個以上、好ましくは3個まで、好ましくは2個までの下記群から独立して選択される置換基で置換されており：下記置換もしくは非置換ヘテロシクリル、とりわけピロリジニル、例えばピロリジノ、オキソピロリジニル、例えばオキソピロリジノ、C₁-C₇-アルキル-ピロリジニル、2,5-ジ-(C₁-C₇-アルキル)ピロリジニル、例えば2,5-ジ-(C₁-C₇-アルキル)-ピロリジノ、テトラヒドロフランニル、チオフェニル、C₁-C₇-アルキルピラゾリジニル、ピリジニル、C₁-C₇-アルキルピペリジニル、ピペリジノ、アミノまたはN-モノ-もしくはN,

N - ジ - [低級アルキル、フェニル、 $C_1 - C_7$ - アルカノイルおよび/またはフェニル - 低級アルキル) - アミノで置換されたピペリジノ、環炭素原子を介して結合した非置換もしくはN - 低級アルキル置換ピペリジニル、ピペラジノ、低級アルキルピペラジノ、モルホリノ、チオモルホリノ、S - オキソ - チオモルホリノもしくはS, S - ジオキソチオモルホリノ; $C_1 - C_7$ - アルキル、アミノ - $C_1 - C_7$ - アルキル、N - $C_1 - C_7$ - アルカノイルアミノ - $C_1 - C_7$ - アルキル、N - $C_1 - C_7$ - アルカンシルホニル - アミノ - $C_1 - C_7$ - アルキル、カルバモイル - $C_1 - C_7$ - アルキル、[N - モノ - もしくはN, N - ジ - ($C_1 - C_7$ - アルキル) - カルバモイル] - $C_1 - C_7$ - アルキル、 $C_1 - C_7$ - アルカンシルフィニル - $C_1 - C_7$ - アルキル、 $C_1 - C_7$ - アルカンシルホニル - $C_1 - C_7$ - アルキル、フェニル、ナフチル、モノ~トリ - [$C_1 - C_7$ - アルキル、ハロおよび/またはシアノ] - フェニルまたはモノ~トリ - [$C_1 - C_7$ - アルキル、ハロおよび/またはシアノ] - ナフチル; $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、モノ~トリ - [$C_1 - C_7$ - アルキルおよび/またはヒドロキシ] - $C_3 - C_8$ - シクロアルキル; ハロ、ヒドロキシ、低級アルコキシ、低級 - アルコキシ - 低級アルコキシ、(低級 - アルコキシ) - 低級アルコキシ - 低級アルコキシ、ハロ - $C_1 - C_7$ - アルコキシ、フェノキシ、ナフチルオキシ、フェニル - もしくはナフチル - 低級アルコキシ; アミノ - $C_1 - C_7$ - アルコキシ、低級 - アルカノイルオキシ、ベンゾイルオキシ、ナフトイルオキシ、ホルミル (CHO)、アミノ、N - モノ - もしくはN, N - ジ - ($C_1 - C_7$ - アルキル) - アミノ、 $C_1 - C_7$ - アルカノイルアミノ、 $C_1 - C_7$ - アルカンシルホニルアミノ、カルボキシ、低級アルコキシカルボニル、例えば; フェニル - もしくはナフチル - 低級アルコキシカルボニル、例えばベンジルオキシカルボニル; $C_1 - C_7$ - アルカノイル、例えばアセチル、ベンゾイル、ナフトイル、カルバモイル、N - モノ - もしくはN, N - ジ置換カルバモイル、例えばN - モノ - もしくはN, N - ジ - 置換カルバモイル(ここで、当該置換基は低級アルキル、(低級 - アルコキシ) - 低級アルキルおよびヒドロキシ - 低級アルキルから選択される); アミジノ、グアニジノ、ウレイド、メルカプト、低級アルキルチオ、フェニル - もしくはナフチルチオ、フェニル - もしくはナフチル - 低級アルキルチオ、低級アルキル - フェニルチオ、低級アルキル - ナフチルチオ、ハロゲン - 低級アルキルメルカプト、スルホ、低級アルカンシルホニル、フェニル - もしくはナフチル - スルホニル、フェニル - もしくはナフチル - 低級アルキルスルホニル、アルキルフェニルスルホニル、ハロゲン - 低級アルキルスルホニル、例えばトリフルオロメタンスルホニル; スルホンアミド、ベンゾスルホンアミド、アジド、アジド - $C_1 - C_7$ - アルキル、とりわけアジドメチル、 $C_1 - C_7$ - アルカンシルホニル、スルファモイル、N - モノ - もしくはN, N - ジ - ($C_1 - C_7$ - アルキル) - スルファモイル、モルホリノスルホニル、チオモルホリノスルホニル、シアノおよびニトロ; ここで、置換アルキル(または本明細書に記載の置換アリール、ヘテロシクリル等)の置換基または置換基の一部として上記の各フェニルまたはナフチルはそれ自体非置換であるか、またはハロ、とりわけフルオロ、クロロ、プロモまたはヨード、ハロ - 低級アルキル、例えばトリフルオロメチル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、アジド、アミノ、N - モノ - もしくはN, N - ジ - (低級アルキルおよび/または $C_1 - C_7$ - アルカノイル) - アミノ、ニトロ、カルボキシ、低級 - アルコキシカルボニル、カルバモイル、シアノおよび/またはスルファモイルから独立して選択される1個以上、例えば3個まで、好ましくは1もしくは2個の置換基で置換されており;

置換もしくは非置換ヘテロシクリルが、不飽和 (= 環内に可能な最高数の共役二重結合を担持する)、飽和または部分飽和であり、かつ好ましくは単環式、またはより広い本発明の局面において二環式もしくは三環式環であるヘテロ環式環であり; そして3 ~ 24、より好ましくは4 ~ 16、最も好ましくは4 ~ 10、最も好ましくは6個の環原子を有しており; ここで1個以上、好ましくは1 ~ 4、とりわけ1または2個の炭素環原子は窒素、酸素および硫黄から成る群から選択されるヘテロ原子で置換されており、結合環は好ましくは4 ~ 12、とりわけ5 ~ 7個の環原子を有しており; 該ヘテロ環式基(ヘテロシクリル)は非置換であるか、または置換アルキルについて上記定義の置換基から成る群から選

扱される 1 個以上、とりわけ 1 ~ 3 個の置換基で置換されており；そしてここでヘテロシクリルはとりわけ、下記群から選択されるヘテロシクリル基であり：オキシラニル、アジリニル、アジリジニル、1, 2 - オキサチオラニル、チエニル (= チオフェニル)、フラニル、テトラヒドロフリル、ピラニル、チオピラニル、チアントレニル、イソベンゾフラニル、ベンゾフラニル、クロメニル、2 H - ピロリル、ピロリル、ピロリニル、ピロリジニル、イミダゾリル、イミダゾリジニル、ベンゾイミダゾリル、ピラゾリル、ピラジニル、ピラゾリジニル、チアゾリル、イソチアゾリル、ジチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、ピリダジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、(S - オキソもしくは S, S - ジオキソ) - チオモルホリニル、インドリジニル、アゼパニル、ジアゼパニル、とりわけ 1, 4 - ジアゼパニル、イソインドリル、3 H - インドリル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、クマリル、インダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、プリニル、4 H - キノリジニル、イソキノリル、キノリル、テトラヒドロキノリル、テトラヒドロイソキノリル、デカヒドロキノリル、オクタヒドロイソキノリル、ベンゾフラニル、ジベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ジベンゾチオフェニル、フタラジニル、ナフチリジニル、キノキサリル、キナゾリニル、キナゾリニル、シノリニル、プテリジニル、カルバゾリル、ベータ - カルボリニル、フェナントリジニル、アクリジニル、ペリミジニル、フェナントロリニル、フラザニル、フェナジニル、フェノチアジニル、フェノキサジニル、クロメニル、イソクロマニル、クロマニル、ベンゾ [1, 3] ジオキソール - 5 - イルおよび 2, 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1, 4] ジオキシ - 6 - イル、ここでこれらの各基は非置換であるか、または置換アリアルについて上記のものから選択される 1 個以上、好ましくは 3 個までの置換基で置換されており、

そして X、R³ および R⁴ は請求項 1 に定義の通りである、

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物またはその (好ましくは薬学的に許容される) 塩。

【請求項 3】

置換もしくは非置換アリアルが、記載されていれば、非置換であるか、または下記群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたフェニル、ナフチルまたはインダニルであり：C₁ - C₇ - アルキル、ヒドロキシ - C₁ - C₇ - アルキル、C₁ - C₇ - アルコキシ - C₁ - C₇ - アルキル、アミノ - C₁ - C₇ - アルキル、ハロ - C₁ - C₇ - アルキル、N - C₁ - C₇ - アルカノイルアミノ - C₁ - C₇ - アルキル、N - C₁ - C₇ - アルカンスルホニル - アミノ - C₁ - C₇ - アルキル、ピロリジノ - C₁ - C₇ - アルキル、オキソ - ピロリジノ - C₁ - C₇ - アルキル、ピペリジノ - C₁ - C₇ - アルキル、ピペラジン - 1 - イル - C₁ - C₇ - アルキル、4 - (C₁ - C₇ - アルキル、C₁ - C₇ - アルコキシ - C₁ - C₇ - アルキル、ハロ - C₁ - C₇ - アルキルもしくは C₃ - C₁₀ - シクロアルキル) - ピペラジン - 1 - イル - C₁ - C₇ - アルキル、4 - (アミノ - C₁ - C₇ - アルキル) - ピペラジン - 1 - イル - C₁ - C₇ - アルキル、4 - [N - モノ - もしくは N, N - ジ - (C₁ - C₇ - アルキルアミノ) - C₁ - C₇ - アルキル] - ピペラジン - 1 - イル - C₁ - C₇ - アルキル、(C₁ - C₇ - アルコキシ - C₁ - C₇ - アルキル、C₁ - C₇ - アルカノイルもしくは C₃ - C₁₀ - シクロアルキル) - オキソ - ピペラジン - 1 - イル - C₁ - C₇ - アルキル、モルホリノ - C₁ - C₇ - アルキル、チオモルホリノ - C₁ - C₇ - アルキル、S - モノ - もしくは S, S - ジオキソ - チオモルホリノ - C₁ - C₇ - アルキル、4 - (C₁ - C₇ - アルカノイル) - ピペラジン - 1 - イル - C₁ - C₇ - アルキル、オキソ - ピペラジン - 1 - イル - C₁ - C₇ - アルキル、イミダゾール - 1 - イル - C₁ - C₇ - アルキル、ピロリジン - 1 - カルボニル - C₁ - C₇ - アルキル、ピペリジン - 1 - カルボニル - C₁ - C₇ - アルキル、ピペラジン - 1 - カルボニル - C₁ - C₇ - アルキル、4 - (C₁ - C₇ - アルキル) ピペラジン - 1 - カルボニル - C₁ - C₇ - アルキル、モルホリン - 1 - カルボニル - C₁ - C₇ - アルキル、チオモルホリン - 1 - カルボニル - C₁ - C₇ - アルキル、S - オキソ - もしくは S, S - ジオキソチオモルホリン - 1 - カルボニル - C₁ - C₇ - アルキル、カルバモイル - C₁ - C₇ - アルキル、[N - モノ - もしくは N, N - ジ - (C₁ - C₇

- アルキル) - カルバモイル] - $C_1 - C_7$ - アルキル、 $C_1 - C_7$ - アルカンスルフィニル - $C_1 - C_7$ - アルキル、 $C_1 - C_7$ - アルカンスルホニル - $C_1 - C_7$ - アルキル、ハロ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_7$ - アルコキシ、アミノ、N - モノ - もしくは N, N - ジ - ($C_1 - C_7$ - アルキル) - アミノ、 $C_1 - C_7$ - アルカノイルアミノ、ピロリジノ、オキソ - ピロリジノ、ペペリジノ、ペペラジン - 1 - イル、4 - ($C_1 - C_7$ - アルキル、 $C_1 - C_7$ - アルコキシ - $C_1 - C_7$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_7$ - アルキルもしくは $C_3 - C_{10}$ - シクロアルキル) - ペペラジン - 1 - イル、4 - (アミノ - $C_1 - C_7$ - アルキル) - ペペラジン - 1 - イル、4 - [N - モノ - もしくは N, N - ジ - ($C_1 - C_7$ - アルキルアミノ) - $C_1 - C_7$ - アルキル] - ペペラジン - 1 - イル、モルホリノ、チオモルホリノ、S - オキソ - もしくは S, S - ジオキソチオモルホリノ、 $C_1 - C_7$ - アルカンスルホニルアミノ、カルバモイル、N - モノ - もしくは N, N - ジ - ($C_1 - C_7$ - アルキル、 $C_1 - C_7$ - アルコキシ - $C_1 - C_7$ - アルキル、アミノ - $C_1 - C_7$ - アルキルおよび/または (N' - モノ - もしくは N', N' - ジ - ($C_1 - C_7$ - アルキル) - アミノ - $C_1 - C_7$ - アルキル) - カルバモイル、ピロリジン - 1 - カルボニル、ペペリジン - 1 - カルボニル、ペペラジン - 1 - カルボニル、4 - ($C_1 - C_7$ - アルキル) ペペラジン - 1 - カルボニル、モルホリン - 1 - カルボニル、チオモルホリン - 1 - カルボニル、S - オキソ - もしくは S, S - ジオキソチオモルホリン - 1 - カルボニル、スルホ、 $C_1 - C_7$ - アルカンスルホニル、 $C_1 - C_7$ - アルカンスルフィニル、スルファモイル、N - モノ - もしくは N, N - ジ - ($C_1 - C_7$ - アルキル) - スルファモイル、モルホリノスルホニル、チオモルホリノスルホニル、S - オキソ - チオモルホリノスルホニル、S, S - ジオキソチオモルホリノスルホニル、シアノおよびニトロ；
 そして置換もしくは非置換ヘテロシクリルが、好ましくはピロリル、オキソ - ピロリル、2, 3 - ジヒドロインドリル、2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロインドリルまたは 1H - ピリジノニルであり、これらは各々非置換であるか、または置換アリアルについて上記のものから独立して選択される 1 ~ 3 個の基で置換されている、
 請求項 1 に記載の式 (I) の化合物またはその塩。

【請求項 4】

X が CR^5 または N であり、ここで R^5 はハロ、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_7$ - アルコキシ、 $C_1 - C_7$ - アルキル、アミノ、N - モノ - もしくは N, N - ジ - $C_1 - C_7$ - アルキルまたは好ましくは水素であり；
 R^1 が置換もしくは非置換アリアルであるか、または置換もしくは非置換ヘテロシクリルであり、
 とりわけ R^1 がフェニル、ナフチル、インダニル、ピリジル、オキソ - 1H - ピリジル、インドリル、ジヒドロインドリルまたはオキソ - ジヒドロインドリルであり、これらは各々環炭素原子を介して結合しており、かつ非置換であるか、または下記群から独立して選択される 1 ~ 3 個の基で置換されており： $C_1 - C_7$ - アルキル、アミノ - $C_1 - C_7$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_7$ - アルキル、N - $C_1 - C_7$ - アルカノイルアミノ - $C_1 - C_7$ - アルキル、N - $C_1 - C_7$ - アルカンスルホニル - アミノ - $C_1 - C_7$ - アルキル、ピロリジノ - $C_1 - C_7$ - アルキル、オキソ - ピロリジノ - $C_1 - C_7$ - アルキル、ペペリジノ - $C_1 - C_7$ - アルキル、ペペラジン - 1 - イル - $C_1 - C_7$ - アルキル、4 - ($C_1 - C_7$ - アルキル、 $C_1 - C_7$ - アルコキシ - $C_1 - C_7$ - アルキル、ハロ - $C_1 - C_7$ - アルキルもしくは $C_3 - C_{10}$ - シクロアルキル) - ペペラジン - 1 - イル - $C_1 - C_7$ - アルキル、4 - (アミノ - $C_1 - C_7$ - アルキル) - ペペラジン - 1 - イル - $C_1 - C_7$ - アルキル、4 - [N - モノ - もしくは N, N - ジ - ($C_1 - C_7$ - アルキルアミノ) - $C_1 - C_7$ - アルキル] - ペペラジン - 1 - イル - $C_1 - C_7$ - アルキル、モルホリノ - $C_1 - C_7$ - アルキル、チオモルホリノ - $C_1 - C_7$ - アルキル、S - モノ - もしくは S, S - ジオキソ - チオモルホリノ - $C_1 - C_7$ - アルキル、カルバモイル - $C_1 - C_7$ - アルキル、[N - モノ - もしくは N, N - ジ - ($C_1 - C_7$ - アルキル) - カルバモイル] - $C_1 - C_7$ - アルキル、 $C_1 - C_7$ - アルカンスルフィニル - $C_1 - C_7$ - アルキル、 $C_1 - C_7$ - アルカンスルホニル - $C_1 - C_7$ - アルキル、ハロ、ヒドロキ

シル、 $C_1 - C_7$ -アルコキシ、アミノ、 N -モノ-もしくは N, N -ジ- ($C_1 - C_7$ -アルキル)-アミノ、 $C_1 - C_7$ -アルカノイルアミノ、ピロリジノ、オキソ-ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジン-1-イル、4- ($C_1 - C_7$ -アルキル、 $C_1 - C_7$ -アルコキシ- $C_1 - C_7$ -アルキル、ハロ- $C_1 - C_7$ -アルキルもしくは $C_3 - C_{10}$ -シクロアルキル)-ピペラジン-1-イル、4- (アミノ- $C_1 - C_7$ -アルキル)-ピペラジン-1-イル、4- [N -モノ-もしくは N, N -ジ- ($C_1 - C_7$ -アルキルアミノ)- $C_1 - C_7$ -アルキル]-ピペラジン-1-イル、モルホリノ、チオモルホリノ、 S -オキソ-もしくは S, S -ジオキソチオモルホリノ、 $C_1 - C_7$ -アルカンスルホニルアミノ、カルバモイル、 N -モノ-もしくは N, N -ジ- ($C_1 - C_7$ -アルキル、 $C_1 - C_7$ -アルコキシ- $C_1 - C_7$ -アルキル、アミノ- $C_1 - C_7$ -アルキルおよび/または(N' -モノ-もしくは N' , N' -ジ- ($C_1 - C_7$ -アルキル)-アミノ- $C_1 - C_7$ -アルキル)-カルバモイル、ピロリジン-1-カルボニル、ピペリジン-1-カルボニル、ピペラジン-1-カルボニル、4- ($C_1 - C_7$ -アルキル)ピペラジン-1-カルボニル、モルホリン-1-カルボニル、チオモルホリン-1-カルボニル、 S -オキソ-もしくは S, S -ジオキソチオモルホリン-1-カルボニル、スルホ、 $C_1 - C_7$ -アルカンスルホニル、 $C_1 - C_7$ -アルカンスルフィニル、スルファモイル、 N -モノ-もしくは N, N -ジ- ($C_1 - C_7$ -アルキル)-スルファモイル、モルホリノスルホニル、チオモルホリノスルホニル、シアノおよびニトロ、 R^2 がフェニル、ナフチル、インダニル、ピリジル、オキソ-1H-ピリジル、ピラゾリル、チオフェニル、インドリル、ジヒドロインドリル、オキソ-ジヒドロインドリル、キノリニル、イソキノリニルまたは1H-ベンゾイミダゾリルであり、これらは各々環炭素原子を介して結合しており、かつ非置換であるか、または好ましくはメタ位で、(より好ましくは1回)メタ位(好ましくは1回まで)およびパラ位で、またはパラ位で、下記群から独立して選択される1~3個の基で置換されており： $C_1 - C_7$ -アルキル、ヒドロキシル- $C_1 - C_7$ -アルキル、アミノ- $C_1 - C_7$ -アルキル、ハロ- $C_1 - C_7$ -アルキル、 $N - C_1 - C_7$ -アルカノイルアミノ- $C_1 - C_7$ -アルキル、 $N - C_1 - C_7$ -アルカンスルホニル-アミノ- $C_1 - C_7$ -アルキル、 $C_1 - C_7$ -アルカンスルホニル- $C_1 - C_7$ -アルキル、 $C_1 - C_7$ -アルカンスルフィニル- $C_1 - C_7$ -アルキル、ピロリジノ- $C_1 - C_7$ -アルキル、オキソ-ピロリジノ- $C_1 - C_7$ -アルキル、ピペリジノ- $C_1 - C_7$ -アルキル、ピペラジン-1-イル- $C_1 - C_7$ -アルキル、4- ($C_1 - C_7$ -アルキル、 $C_1 - C_7$ -アルコキシ- $C_1 - C_7$ -アルキル、ハロ- $C_1 - C_7$ -アルキルもしくは $C_3 - C_{10}$ -シクロアルキル)-ピペラジン-1-イル- $C_1 - C_7$ -アルキル、4- (アミノ- $C_1 - C_7$ -アルキル)-ピペラジン-1-イル- $C_1 - C_7$ -アルキル、4- [N -モノ-もしくは N, N -ジ- ($C_1 - C_7$ -アルキルアミノ)- $C_1 - C_7$ -アルキル]-ピペラジン-1-イル- $C_1 - C_7$ -アルキル、4- ($C_1 - C_7$ -アルカノイル)-ピペラジン-1-イル- $C_1 - C_7$ -アルキル、オキソ-ピペラジン-1-イル- $C_1 - C_7$ -アルキル、ピロリジン-1-カルボニル- $C_1 - C_7$ -アルキル、ピペリジン-1-カルボニル- $C_1 - C_7$ -アルキル、ピペラジン-1-カルボニル- $C_1 - C_7$ -アルキル、4- ($C_1 - C_7$ -アルキル)ピペラジン-1-カルボニル- $C_1 - C_7$ -アルキル、モルホリン-1-カルボニル- $C_1 - C_7$ -アルキル、チオモルホリン-1-カルボニル- $C_1 - C_7$ -アルキル、 S -オキソ-もしくは S, S -ジオキソチオモルホリン-1-カルボニル- $C_1 - C_7$ -アルキル、 $C_1 - C_7$ -アルコキシ- $C_1 - C_7$ -アルキル、ハロ- $C_1 - C_7$ -アルキル、 $C_1 - C_7$ -アルカノイルもしくは $C_3 - C_{10}$ -シクロアルキル)-オキソ-ピペラジン-1-イル- $C_1 - C_7$ -アルキル、モルホリノ- $C_1 - C_7$ -アルキル、チオモルホリノ- $C_1 - C_7$ -アルキル、 S -モノ-もしくは S, S -ジオキソ-チオモルホリノ- $C_1 - C_7$ -アルキル、イミダゾール-1-イル- $C_1 - C_7$ -アルキル、カルバモイル- $C_1 - C_7$ -アルキル、 [N -モノ-もしくは N, N -ジ- ($C_1 - C_7$ -アルキル)-カルバモイル]- $C_1 - C_7$ -アルキル、 $C_1 - C_7$ -アルカンスルフィニル- $C_1 - C_7$ -アルキル、 $C_1 - C_7$ -アルカンスルホニル- $C_1 - C_7$ -アルキル、ハロ、ヒドロキシル、 $C_1 -$

C₇ - アルコキシ、アミノ、N - モノ - もしくは N, N - ジ - (C₁ - C₇ - アルキル) - アミノ、C₁ - C₇ - アルカノイルアミノ、ピロリジノ、オキソ - ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジン - 1 - イル、4 - (C₁ - C₇ - アルキル、C₁ - C₇ - アルコキシ - C₁ - C₇ - アルキル、ハロ - C₁ - C₇ - アルキルもしくは C₃ - C₁₀ - シクロアルキル) - ピペラジン - 1 - イル、4 - (アミノ - C₁ - C₇ - アルキル) - ピペラジン - 1 - イル、4 - [N - モノ - もしくは N, N - ジ - (C₁ - C₇ - アルキルアミノ) - C₁ - C₇ - アルキル] - ピペラジン - 1 - イル、モルホリノ、チオモルホリノ、S - オキソ - もしくは S, S - ジオキソチオモルホリノ、C₁ - C₇ - アルカンシルホニルアミノ、カルバモイル、N - モノ - もしくは N, N - ジ - (C₁ - C₇ - アルキル、C₁ - C₇ - アルコキシ - C₁ - C₇ - アルキル、アミノ - C₁ - C₇ - アルキルおよび/または (N' - モノ - もしくは N', N' - ジ - (C₁ - C₇ - アルキル) - アミノ - C₁ - C₇ - アルキル) - カルバモイル、ピロリジン - 1 - カルボニル、ピペリジン - 1 - カルボニル、ピペラジン - 1 - カルボニル、4 - (C₁ - C₇ - アルキル) ピペラジン - 1 - カルボニル、モルホリン - 1 - カルボニル、チオモルホリン - 1 - カルボニル、S - オキソ - もしくは S, S - ジオキソチオモルホリン - 1 - カルボニル、スルホ、C₁ - C₇ - アルカンシルホニル、C₁ - C₇ - アルカンシルフィニル、スルファモイル、N - モノ - もしくは N, N - ジ - (C₁ - C₇ - アルキル) - スルファモイル、モルホリノスルホニル、チオモルホリノスルホニル、S - オキソ - チオモルホリノスルホニル、S, S - ジオキソチオモルホリノスルホニル、シアノおよびニトロ、

R³ はシアノ、ヒドロキシル、C₁ - C₇ - アルキル、アミノ、N - モノ - もしくは N, N - ジ - C₁ - C₇ - アルキルまたは好ましくは水素であり；そして

R⁴ はヒドロキシル、アミノまたは好ましくは水素である；

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 5】

X が CR⁵ または N であり、ここで R⁵ はハロ、シアノ、ヒドロキシル、C₁ - C₇ - アルコキシ、C₁ - C₇ - アルキル、アミノ、N - モノ - もしくは N, N - ジ - C₁ - C₇ - アルキルまたは好ましくは水素であり；

R¹ が置換もしくは非置換アリールであるか、または置換もしくは非置換ヘテロシクリルであり、

R² がフェニル、ナフチル、ピリジル、ピラゾリル、チオフェニル、キノリニル、イソキノリニルまたは 1H - ベンゾイミダゾリルであり、これらは各々環炭素原子を介して結合しており、かつ非置換であるか、または下記群から独立して選択される 1 ~ 3 個の基で置換されており：C₁ - C₇ - アルキル、アミノ - C₁ - C₇ - アルキル、N - C₁ - C₇ - アルカノイルアミノ - C₁ - C₇ - アルキル、N - C₁ - C₇ - アルカンシルホニル - アミノ - C₁ - C₇ - アルキル、カルバモイル - C₁ - C₇ - アルキル、[N - モノ - もしくは N, N - ジ - (C₁ - C₇ - アルキル) - カルバモイル] - C₁ - C₇ - アルキル、C₁ - C₇ - アルカンシルフィニル - C₁ - C₇ - アルキル、C₁ - C₇ - アルカンシルホニル - C₁ - C₇ - アルキル、ハロ、ヒドロキシル、C₁ - C₇ - アルコキシ、アミノ、N - モノ - もしくは N, N - ジ - (C₁ - C₇ - アルキル) - アミノ、C₁ - C₇ - アルカノイルアミノ、C₁ - C₇ - アルカンシルホニルアミノ、カルバモイル、N - モノ - もしくは N, N - ジ - (C₁ - C₇ - アルキル) - カルバモイル、スルホ、C₁ - C₇ - アルカンシルホニル、スルファモイル、N - モノ - もしくは N, N - ジ - (C₁ - C₇ - アルキル) - スルファモイル、モルホリノスルホニル、チオモルホリノスルホニル、シアノおよびニトロ、

R³ がシアノ、ヒドロキシル、C₁ - C₇ - アルキル、アミノ、N - モノ - もしくは N, N - ジ - C₁ - C₇ - アルキルまたは好ましくは水素であり；そして

R⁴ がヒドロキシル、アミノまたは好ましくは水素である；

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 6】

X が CR⁵ または N であり、ここで R⁵ はハロ、シアノ、ヒドロキシル、C₁ - C₇ -

アルコキシ、 $C_1 - C_7$ -アルキル、アミノ、 N -モノ-もしくは N, N -ジ- $C_1 - C_7$ -アルキルまたは好ましくは水素であり；

R^1 が置換もしくは非置換アリールであるか、または置換もしくは非置換ヘテロシクリルであり、

R^2 がフェニル、ナフチル、ピリジル、ピラゾリル、チオフェニル、キノリニル、イソキノリニルまたは1H-ベンゾイミダゾリルであり、これらは各々環炭素原子を介して結合しており、かつ非置換であるか、または好ましくはメタ位、メタ位およびパラ位、またはパラ位で、下記群から独立して選択される1~3個の基で置換されており： $C_1 - C_7$ -アルキル、アミノ- $C_1 - C_7$ -アルキル、 $N - C_1 - C_7$ -アルカノイルアミノ- $C_1 - C_7$ -アルキル、 $N - C_1 - C_7$ -アルカンシルホニル-アミノ- $C_1 - C_7$ -アルキル、カルバモイル- $C_1 - C_7$ -アルキル、[N -モノ-もしくは N, N -ジ-($C_1 - C_7$ -アルキル)-カルバモイル]- $C_1 - C_7$ -アルキル、 $C_1 - C_7$ -アルカンシルフィニル- $C_1 - C_7$ -アルキル、 $C_1 - C_7$ -アルカンシルホニル- $C_1 - C_7$ -アルキル、ハロ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_7$ -アルコキシ、アミノ、 N -モノ-もしくは N, N -ジ-($C_1 - C_7$ -アルキル)-アミノ、 $C_1 - C_7$ -アルカノイルアミノ、 $C_1 - C_7$ -アルカンシルホニルアミノ、カルバモイル、 N -モノ-もしくは N, N -ジ-($C_1 - C_7$ -アルキル)-カルバモイル、スルホ、 $C_1 - C_7$ -アルカンシルホニル、スルファモイル、 N -モノ-もしくは N, N -ジ-($C_1 - C_7$ -アルキル)-スルファモイル、モルホリノスルホニル、チオモルホリノスルホニル、シアノおよびニトロ；

R^3 がシアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_7$ -アルキル、アミノ、 N -モノ-もしくは N, N -ジ- $C_1 - C_7$ -アルキルまたは好ましくは水素であり；そして

R^4 がヒドロキシル、アミノまたは好ましくは水素である；

請求項1に記載の式(I)の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項7】

XがCHまたはNであり；

R^1 が(とりわけ3, 4, 5-)トリメトキシフェニルまたは4-モルホリノフェニル、(とりわけ3, 4-もしくは3, 5)-ジメトキシフェニル、(とりわけ4-)N-(2-メトキシエチル)-カルバモイルフェニル、または(とりわけ4-)N, N-(2-ジメチルアミノ-エチル)-カルバモイルフェニルであり；

R^2 がフェニル、4-メチルフェニル、3-メチルフェニル、2-メチルフェニル、4-アミノメチル-フェニル、3-アミノメチル-フェニル、4-アセチルアミノメチル-フェニル、4-メタンシルホニルアミノメチル-フェニル、3-アセチルアミノメチル-フェニル、3-メタンシルホニルアミノメチル-フェニル、4-メタンシルホニルアミノメチル-フェニル、4-(N-メチルカルバモイル)メチル-フェニル、4-メタンシルフィニルメチル-フェニル、4-メタンシルホニルメチル-フェニル、3-クロロフェニル、3-ヒドロキシフェニル、4-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、2-メトキシフェニル、4-アミノフェニル、3-アミノフェニル、2-アミノフェニル、3-N-メチルアミノ-フェニル、4-N, N-ジメチルアミノ-フェニル、4-アセチルアミノ-フェニル、3-アセチルアミノ-フェニル、4-メタンシルホニルアミノ-フェニル、4-メタンシルホニルアミノ-フェニル、3-メタンシルホニルアミノ-フェニル、4-カルバモイルフェニル、3-カルバモイルフェニル、4-(N-メチル-カルバモイル)-フェニル、4-(N, N-ジメチル-カルバモイル)-フェニル、4-メタンシルホニルフェニル、3-メタンシルホニルフェニル、4-スルファモイルフェニル*、4-(N-メチルスルファモイル)-フェニル、4-[N, N-(ジメチル)-スルファモイル]-フェニル、4-モルホリノスルホニルフェニル、4-シアノフェニル、3-シアノフェニル、3-ニトロフェニル、3-アミノ-4-メチル-フェニル、3-アミノ-4-メトキシフェニル、3-アミノ-4-クロロフェニル、4-メトキシ-3-ニトロフェニル、2H-ピラゾール-3-イル、5-N-メチルカルバモイル-チオフェニル、4-ピリジル、3-ピリジル、2-ピリジル、6-メトキシ-ピリジン-3-イル、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル、キノリン-6-イルまたはイソキノリン-4-イルであり、そし

て

R³ および R⁴ が各々水素である；

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 8】

X が C H または N であり；

R¹ がフェニル、(とりわけ 3, 4, 5 -)トリメトキシフェニル*、(とりわけ 3, 4 - もしくは 3, 5 -)ジメトキシフェニル*、(とりわけ 4 -)モルホリノフェニル、(とりわけ 4 -)N - (2 - メトキシエチル) - カルバモイルフェニル*、または(とりわけ 4 -)N, N - (2 - ジメチルアミノ - エチル) - カルバモイルフェニル*、(とりわけ 4 -)ジメチルアミノカルボニル - (とりわけ 3 -)メチル - フェニル*、(とりわけ 4 -) - (好ましくは 4 -) - (2 - メトキシ - エチル - ピペラジン - (とりわけ 1 -)イル - (とりわけ 3 -) - メチル - フェニル、(とりわけ 4 -)ピロリジン - 1 - カルボニル - (とりわけ 3 -)メチル - フェニル*、(とりわけ 3 -)メチル - (とりわけ 4 -) - 4 - メチルピペラジン - 1 - カルボニル - フェニル、(とりわけ 3 - もしくは 4 -)4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル - フェニル*、(とりわけ 4 -) - 4 - エチル - ピペラジン - 1 - イル - (とりわけ 3 -)メチル - フェニル*、(とりわけ 4 -) - 4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル - (とりわけ 3 -)シアノ - フェニル、(とりわけ 4 -) - ピペラジン - 1 - イル - フェニル、(とりわけ 4 -) - 4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル - フェニル、(とりわけ 4 -) - 4 - (2 - ジメチルアミノエチル) - ピペラジン - 1 - イル - (とりわけ 3 -)メチル - フェニル*、(とりわけ 4 -)4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - (とりわけ 3 -)メチル - フェニル*、(とりわけ 4 -)N, N - ジエチルアミノカルボニル - (とりわけ 3 -)メチル - フェニル*、(とりわけ 4 -)4 - エチルピペラジン - 1 - カルボニル - (とりわけ 3 -)メチル - フェニル、(とりわけ 4 -) - (4 - エチルピペラジン - 1 - イルメチル) - (とりわけ 3 -)メチル - フェニル、(とりわけ 4 -)N - メチルアミノカルボニル - (とりわけ 3 -)メチルフェニル、(とりわけ 4 -) - 4 - (3, 3, 3 - トリフルオロプロピル) - ピペラジン - 1 - イル - (とりわけ 3 -)メチル - フェニル、(とりわけ 4 -) - 4 - (2 - (N', N' - ジメチルアミノ)エチル - アミノカルボニル - (とりわけ 3 -)メチル - フェニル、(とりわけ 4 -) - メタンスルホニル - フェニル*、(とりわけ 4 -)[(とりわけ 2 -) - オキソ - ピロリジン - 1 - イル] - フェニル、(とりわけ 4 -)N, N - ジエチルアミノカルボニル - (とりわけ 3 -)メトキシフェニル、(とりわけ 3 -) - 4 - メチルピペラジン - 1 - イル - (とりわけ 4 -)メチル - フェニル、(とりわけ 3 -) - 4 - メチルピペラジン - 1 - イル - (とりわけ 4 -)メトキシ - フェニル*、(とりわけ 3 - もしくは 4 -) - モルホリノメチル - (とりわけ 4 - もしくは 3 -)メチル - フェニル、(とりわけ 2 -)アセチルアミノ - インダン - (とりわけ 5 -)イル、(とりわけ 2 -)オキソ - 2, 3 - ジヒドロインドール - (とりわけ 5 -)イル、(とりわけ 4 -)メチルスルフィニルフェニル、(とりわけ 4 -)メトキシフェニル、(とりわけ 4 -)メチル - (とりわけ 3 -)メトキシフェニル、(とりわけ 4 -) - N - (2 - メトキシエチル) - アミノカルボニル - フェニル、(とりわけ 4 -)N, N - ジメチルカルバモイル - フェニル、(とりわけ 3 -)メタンスルホニルアミノ - フェニル、(とりわけ 4 -)メトキシカルボニル - (とりわけ 3 -)メトキシ - フェニル、(とりわけ 4 -)N, N - ジメチルカルバモイル - (とりわけ 3 -)メトキシ - フェニル、(とりわけ 4 -) - (4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - (とりわけ 3 -)メチル - フェニル*、(とりわけ 4 -) - N - (2 - (N', N' - ジメチルアミノエチル) - N - メチル - カルバモイル - (とりわけ 3 -)メチル - フェニル*、1, 3 - ジメチル - オキソ - 1H - ピリジン - 5 - イル、(とりわけ 3 - もしくは 4 -)モルホリノ - (とりわけ 4 - もしくは 3 -)メチル - フェニル*、(とりわけ 4 -)モルホリノメチル - (とりわけ 3 -)メチル - フェニル、(とりわけ 4 -)モルホリン - 1 - カルボニル - (とりわけ 3 -)メチル - フェニル、(とりわけ 4 -) - N - 2 - (メトキシエチル)アミノカルボニル - (とりわけ 3 -)メチル - フェニル、(とりわけ 4 -) - N - (3 - N', N' - ジメチルアミノプロピル)

アミノ - カルボニル - (とりわけ 3 -)メチル - フェニル、(とりわけ 5 -) - メチル - (とりわけ 6 -)メトキシ - ピリジン - 3 - イル、(とりわけ 4 -)ジメチルカルバモイル - (とりわけ 3 , 5 -)ジメチル - フェニル、(とりわけ 4 -)ジメチルカルバモイル - (とりわけ 3 -)エチル - フェニル、(とりわけ 4 - (4 -)N , N - ジメチルカルバモイル - (とりわけ 3 -)メチル - フェニルまたは(とりわけ 4 -)モルホリノ - (とりわけ 3 -)シアノ - フェニルであり ;

R² がフェニル、(とりわけ 4 -)メチルフェニル、(とりわけ 3 -)メチルフェニル、(とりわけ 2 -)メチルフェニル、(とりわけ 4 -) - ヒドロキシメチル - フェニル、(とりわけ 4 -)アミノメチル - フェニル、(とりわけ 3 -)アミノメチル - フェニル、(とりわけ 4 -)アセチルアミノメチル - フェニル*、(とりわけ 4 -)メタンスルホニルアミノメチル - フェニル、(とりわけ 3 -)アセチルアミノメチル - フェニル、(とりわけ 3 -)メタンスルホニルアミノメチル - フェニル*、(とりわけ 4 -)メタンスルホニルアミノメチル - フェニル、(とりわけ 4 -) (N - メチルカルバモイル) - メチルフェニル*、(とりわけ 4 -)メタンスルフィニルメチルフェニル、(とりわけ 4 -)メタンスルホニルメチルフェニル、(とりわけ 3 -)クロロフェニル、(とりわけ 3 -)ヒドロキシフェニル、(とりわけ 4 -)メトキシフェニル、(とりわけ 3 -)メトキシフェニル*、(とりわけ 2 -)メトキシフェニル、(とりわけ 4 -)アミノフェニル、(とりわけ 3 -)アミノフェニル、(とりわけ 2 -)アミノフェニル、(とりわけ 3 -)N - メチルアミノ - フェニル、(とりわけ 4 -)N , N - ジメチルアミノ - フェニル*、(とりわけ 4 -)アセチルアミノ - フェニル、(とりわけ 3 -)アセチルアミノ - フェニル、(とりわけ 4 -)メタンスルホニルアミノ - フェニル*、(とりわけ 4 -)メタンスルホニルアミノ - フェニル、(とりわけ 3 -)メタンスルホニルアミノ - フェニル*、(とりわけ 4 -)カルバモイルフェニル、(とりわけ 3 -)カルバモイルフェニル、(とりわけ 4 -) (N - メチル - カルバモイル) - フェニル、(とりわけ 4 -) (N , N - ジメチル - カルバモイル) - フェニル、(とりわけ 4 -)メタンスルホニルフェニル*、(とりわけ 3 -)メタンスルホニルフェニル、(とりわけ 4 -)スルファモイルフェニル*、(とりわけ 4 -) (N - メチルスルファモイル) - フェニル*、(とりわけ 4 -) [N , N - (ジメチル) - スルファモイル] - フェニル、(とりわけ 4 -)モルホリノスルホニルフェニル、(とりわけ 4 -)シアノフェニル、(とりわけ 3 -)シアノフェニル、(とりわけ 3 -)ニトロフェニル、(とりわけ 3 -)アミノ - 4 - メチル - フェニル、(とりわけ 3 -)アミノ - 4 - メトキシフェニル、(とりわけ 3 -)アミノ - 4 - クロロフェニル、(とりわけ 4 -)メトキシ - 3 - ニトロフェニル、(とりわけ 4 -)モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル、(とりわけ 3 -)メチル - (とりわけ 4 -)モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル*、(とりわけ 3 -)フルオロ - (とりわけ 4 -)モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル*、(とりわけ 4 -)S , S - ジオキソ - チオモルホリン - 4 - イルメチルフェニル*、(とりわけ 3 , 5 -)ジフルオロ - (とりわけ 4 -)モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル、(とりわけ 3 -)フルオロ - (とりわけ 4 -)S , S - ジオキソチオモルホリン - 4 - イルメチル - フェニル*、(とりわけ 3 , 5 -)ジフルオロ - (とりわけ 4 -)S , S - ジオキソチオモルホリン - 4 - イルメチル - フェニル*、(とりわけ 3 -)トリフルオロメチル - (とりわけ 4 -)モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル、(とりわけ 3 , 5 -)ジフルオロ - (とりわけ 4 -) [(好ましくは 4 -)アセチル - ピペラジン - 1 - イル]メチル - フェニル、(とりわけ 3 , 5 -)ジフルオロ - (とりわけ 4 -) (好ましくは 4 -)ピペラジン - 1 - イル]メチル - フェニル、(とりわけ 4 -) [(好ましくは 4 -)メチル - ピペラジン - 1 - イル]メチル - フェニル、(とりわけ 3 , 5 -)ジフルオロ - (とりわけ 4 -) [(とりわけ 3 -)オキソ - ピペラジン - 1 - イル]メチル - フェニル (とりわけ 3 , 5 -)ジフルオロ - (とりわけ 4 -) [(好ましくは 4 -)メチル - (とりわけ 3 -)オキソ - ピペラジン - 1 - イル]メチル - フェニル、(とりわけ 4 -)イミダゾール - 1 - イルメチル - フェニル、(とりわけ 4 -) - 4 - メチルピペラジン - 1 - カルボニル - フェニル、(とりわけ 4 -)モルホリン - 4 - カルボニル - フェニル*、(とりわけ 2 - もしくは 3 -)フルオロ - (とりわけ 4 -)モルホリン

- 4 - カルボニル - フェニル *、(とりわけ 3 -)メチル - (とりわけ 4 -)モルホリン
 - 4 - カルボニル - フェニル *、(とりわけ 3, 5 -)ジフルオロ - (とりわけ 4 -)モ
 ルホリン - 4 - カルボニル - フェニル、(とりわけ 4 -)S, S - ジオキソチオモルホリ
 ン - 4 - カルボニル - フェニル、(とりわけ 3 -) - フルオロ - (とりわけ 4 -)S, S
 - ジオキソチオモルホリン - 4 - カルボニル - フェニル *、(とりわけ 4 -)モルホリン
 - 4 - カルボニルメチル - フェニル *、(とりわけ 3 -)フルオロ - (とりわけ 4 -)モ
 ルホリン - 4 - カルボニルメチル - フェニル *、[(とりわけ 4 -)モルホリン - 4 - カ
 ルボニル - (1, 1, ジメチル) - メチル] - フェニル、(とりわけ 4 -)S, S - ジオ
 キソチオモルホリン - 4 - カルボニルメチル - フェニル *、(とりわけ 3 -)フルオロ -
 (とりわけ 4 -)S, S - ジオキソチオモルホリン - 4 - カルボニルメチル - フェニル *
 、2H - ピラゾール - (とりわけ 3 -)イル、(とりわけ 5 -)N - メチルカルバモイル
 - チオフェニル、(とりわけ 4 -)ピリジル、(とりわけ 3 -)ピリジル、(とりわけ 2
 -)ピリジル、(とりわけ 6 -)メトキシ - ピリジン - (とりわけ 3 -)イル、1H - ベ
 ンゾイミダゾール - (とりわけ 5 -)イル、キノリン - (とりわけ 6 -)イルまたはイソ
 キノリン - (とりわけ 4 -)イルであり、

(ここで、アスタリスク(*)で印を付けた基が、その基が「とりわけ」の後の位置にあ
 るならば、とりわけ好ましい)そして

R³ および R⁴ が各々水素である;

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 9】

下記化合物名:

(7 - m - トリル - ベンゾオキサゾール - 2 - イル) - (3, 4, 5 - トリメトキシ - フェ
 ニル) - アミン;

(7 - フェニル - ベンゾオキサゾール - 2 - イル) - (3, 4, 5 - トリメトキシ - フェ
 ニル) - アミン;

(7 - ピリジン - 3 - イル - ベンゾオキサゾール - 2 - イル) - (3, 4, 5 - トリメト
 キシ - フェニル) - アミン;

[7 - (3 - メトキシ - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3, 4, 5 - ト
 リメトキシ - フェニル) - アミン;

[7 - (2 - メトキシ - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3, 4, 5 - ト
 リメトキシ - フェニル) - アミン;

[7 - (3 - ヒドロキシ - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3, 4, 5 - ト
 リメトキシ - フェニル) - アミン;

[7 - (4 - メトキシ - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3, 4, 5 - ト
 リメトキシ - フェニル) - アミン;

(7 - イソキノリン - 4 - イル - ベンゾオキサゾール - 2 - イル) - (3, 4, 5 - トリ
 メトキシ - フェニル) - アミン;

[7 - (3 - クロロ - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3, 4, 5 - ト
 リメトキシ - フェニル) - アミン;

[7 - (3 - アミノ - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3, 4, 5 - ト
 リメトキシ - フェニル) - アミン;

[7 - (4 - アミノ - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3, 4, 5 - ト
 リメトキシ - フェニル) - アミン;

[7 - (6 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3
 , 4, 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン;

[7 - (3 - アミノ - 4 - メチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3
 , 4, 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン;

[7 - (2 - アミノ - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3, 4, 5 - ト
 リメトキシ - フェニル) - アミン;

(7 - キノリン - 6 - イル - ベンゾオキサゾール - 2 - イル) - (3, 4, 5 - トリメト

キシ - フェニル) - アミン ;
 4 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 -
 イル] - ベンズアミド ;
 7 - (4 - メタンスルホニル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3 , 4
 , 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン ;
 4 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 -
 イル] - ベンゼンスルホンアミド ;
 4 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 -
 イル] - ベンゾニトリル ;
 [7 - (2 H - ピラゾール - 3 - イル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3 , 4 ,
 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン ;
 N - メチル - 4 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサ
 ザール - 7 - イル] - ベンゼンスルホンアミド ;
 N , N - ジメチル - 4 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾ
 オキサゾール - 7 - イル] - ベンゼンスルホンアミド ;
 { 7 - [4 - (モルホリン - 4 - スルホニル) - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 -
 イル } - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン ;
 N - メチル - 4 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサ
 ザール - 7 - イル] - ベンズアミド ;
 N , N - ジメチル - 4 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾ
 オキサゾール - 7 - イル] - ベンズアミド ;
 N - { 4 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール
 - 7 - イル] - フェニル } - メタンスルホンアミド ;
 N - { 4 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール
 - 7 - イル] - フェニル } - アセトアミド ;
 N - { 3 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール
 - 7 - イル] - フェニル } - アセトアミド ;
 [7 - (4 - アミノメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3 , 4 ,
 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン ;
 N - { 4 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール
 - 7 - イル] - ベンジル } - アセトアミド ;
 N - { 4 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール
 - 7 - イル] - ベンジル } - メタンスルホンアミド ;
 [7 - (3 - アミノメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3 , 4 ,
 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン ;
 N - { 3 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール
 - 7 - イル] - ベンジル } - アセトアミド ;
 2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 - イル]
 - チオフェン - 2 - カルボン酸メチルアミド ;
 [7 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 5 - イル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3 ,
 4 , 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン ;
 [4 - (4 - アミノ - フェニル) - オキサゾロ [5 , 4 - c] ピリジン - 2 - イル] - (3 ,
 4 , 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン ;
 [4 - (3 - アミノ - フェニル) - オキサゾロ [5 , 4 - c] ピリジン - 2 - イル] - (3 ,
 4 , 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン ;
 4 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - オキサゾロ [5 , 4 - c]
 ピリジン - 4 - イル] - ベンゼンスルホンアミド ;
 [7 - (3 - メトキシ - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (4 - モルホリン
 - 4 - イル - フェニル) - アミン ;
 [7 - (4 - アミノ - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (4 - モルホリン

- 4 - イル - フェニル) - アミン ;
 N - { 4 - [2 - (4 - モルホリン - 4 - イル - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール
 - 7 - イル] - フェニル } - メタン - スルホンアミド ;
 [7 - (3 - アミノ - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (6 - モルホリン
 - 4 - イル - ピリジン - 3 - イル) - アミン ;
 N - (2 - メトキシ - エチル) - 4 - [7 - (4 - スルファモイル - フェニル) - ベンゾ
 オキサゾール - 2 - イルアミノ] - ベンズアミド
 N - (2 - ジメチルアミノ - エチル) - 4 - [7 - (4 - スルファモイル - フェニル) -
 ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - ベンズアミド
 4 - [2 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 - イル]
 - ベンゼンスルホンアミド
 4 - [2 - (3 , 4 - ジメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 - イル]
 - N - メチル - ベンゼンスルホンアミド
 4 - [2 - (3 , 5 - ジメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 - イル]
 - ベンゼンスルホンアミド
 N - メチル - 2 - { 4 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾ
 オキサゾール - 7 - イル] - フェニル } - アセトアミド
 N - { 4 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール
 - 7 - イル] - ベンジル } - メタン - スルホンアミド ; および
 [7 - (4 - メタン - スルフィニル - メチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル]
 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン ;
 [4 - (4 - アミノ - フェニル) - オキサゾロ [5 , 4 - c] ピリジン - 2 - イル] - (3 ,
 4 , 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン ;
 (7 - o - トリル - ベンゾオキサゾール - 2 - イル) - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェ
 ニル) - アミン ;
 3 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 -
 イル] - ベンゾニトリル ;
 (7 - ピリジン - 2 - イル - ベンゾオキサゾール - 2 - イル) - (3 , 4 , 5 - トリメト
 キシ - フェニル) - アミン ;
 3 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 -
 イル] - ベンズアミド ;
 [7 - (3 - ニトロ - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3 , 4 , 5 - ト
 リメトキシ - フェニル) - アミン ;
 [7 - (3 - メタン - スルホニル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3 ,
 4 , 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン ;
 N - メチル - 3 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサ
 ザール - 7 - イル] - ベンゼンスルホンアミド ;
 [7 - (4 - メトキシ - 3 - ニトロ - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3 ,
 4 , 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン ;
 [7 - (3 - アミノ - 4 - クロロ - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3
 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン ;
 [7 - (3 - アミノ - 4 - メトキシ - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3
 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン ;
 [7 - (4 - ジメチルアミノ - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3 , 4
 , 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン ;
 N - { 3 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール
 - 7 - イル] - フェニル } - メタン - スルホンアミド ;
 の化合物群から選択される、請求項 1 ~ 8 のいずれかに記載の式 (I) の化合物またはそ
 の薬学的に許容される塩。

【請求項 10】

下記化合物名：

- [7 - (3 - アミノ - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (4 - モルホリン - 4 - イル - フェニル) - アミン；
- N - { 4 - [2 - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - オキサゾロ [5 , 4 - c] ピリジン - 4 - イル] - ベンジル } - メタンスルホンアミド；
- 4 - [7 - (3 - フルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - 2 , N , N - トリメチル - ベンズアミド；
- 4 - { 7 - [4 - (1 , 1 - ジオキソ - チオモルホリン - 4 - イルメチル) - 3 , 5 - ジフルオロ - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ } - 2 , N , N - トリメチル - ベンズアミド；
- [4 - (2 - { 4 - [4 - (2 - メトキシ - エチル) - ピペラジン - 1 - イル] - 3 - メチル - フェニルアミノ } - ベンゾオキサゾール - 7 - イル) - 2 - メチル - フェニル] - モルホリン - 4 - イル - メタノン；
- { 4 - [7 - (3 - フルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - 2 - メチル - フェニル } - ピロリジン - 1 - イル - メタノン；
- 4 - [7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - 2 , N , N - トリメチル - ベンズアミド；
- 2 , N , N - トリメチル - 4 - { 7 - [4 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ } - ベンズアミド；
- 2 , N , N - トリメチル - 4 - { 7 - [4 - (2 - モルホリン - 4 - イル - 2 - オキソ - エチル) - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ } - ベンズアミド；
- 4 - [7 - (4 - メタンスルホニルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - N , N - ジメチル - ベンズアミド；
- 2 - (4 - { 2 - [3 - メチル - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - カルボニル) - フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - フェニル) - 1 - モルホリン - 4 - イル - エタノン；
- 2 - (2 - フルオロ - 4 - { 2 - [3 - メチル - 4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - カルボニル) - フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - フェニル) - 1 - モルホリン - 4 - イル - エタノン；
- 2 - (4 - { 2 - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - フェニル) - 1 - モルホリン - 4 - イル - エタノン；
- (2 - フルオロ - 4 - { 2 - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - フェニル) - モルホリン - 4 - イル - メタノン；
- 4 - { 7 - [2 - フルオロ - 4 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ } - 2 , N , N - トリメチル - ベンズアミド；
- 4 - (7 - { 4 - [2 - (1 , 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イル) - 2 - オキソ - エチル] - フェニル } - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ) - 2 , N , N - トリメチル - ベンズアミド；
- 4 - { 7 - [3 - フルオロ - 4 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ } - 2 , N , N - トリメチル - ベンズアミド；
- 4 - { 7 - [4 - (1 , 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチル) - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ } - 2 , N , N - トリメチル - ベンズアミド；
- (1 , 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イル) - (2 - フルオロ - 4 - { 2 - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - フェニル) - メタノン；
- 4 - [7 - (4 - メタンスルフィニルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - 2 , N , N - トリメチル - ベンズアミド；

(2 - メチル - 4 - { 2 - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - フェニル) - モルホリン - 4 - イル - メタノン ;

4 - (7 - { 4 - [2 - (1 , 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イル) - 2 - オキソ - エチル] - 3 - フルオロ - フェニル } - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ) - 2 , N , N - トリメチル - ベンズアミド ;

4 - { 7 - [4 - (1 , 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチル) - 3 - フルオロ - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ } - 2 , N , N - トリメチル - ベンズアミド ;

2 , N , N - トリメチル - 4 - { 7 - [3 - メチル - 4 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ } - ベンズアミド ;

2 , N , N - トリメチル - 4 - [7 - (4 - モルホリン - 4 - イルメチル - 3 - トリフルオロメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - ベンズアミド ;

[4 - (4 - エチル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェニル] - [7 - (3 - フルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - アミン ;

{ 7 - [4 - (1 , 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチル) - 3 - フルオロ - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イル } - [4 - (4 - エチル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェニル] - アミン ;

{ 7 - [4 - (1 , 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチル) - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イル } - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - アミン ;

5 - { 7 - [3 - フルオロ - 4 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ } - 2 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - ベンゾニトリル ;

{ 2 - フルオロ - 4 - [2 - (4 - ピペラジン - 1 - イル - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 - イル] - フェニル } - モルホリン - 4 - イル - メタノン ;

[4 - (4 - エチル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェニル] - [7 - (4 - メタンスルホニル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - アミン ;

4 - { 2 - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - ベンゼンスルホンアミド ;

(4 - { 2 - [4 - (4 - エチル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - 2 - フルオロ - フェニル) - モルホリン - 4 - イル - メタノン ;

{ 7 - [4 - (1 , 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチル) - 3 , 5 - ジフルオロ - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イル } - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - アミン ;

(4 - { 7 - [4 - (1 , 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチル) - 3 , 5 - ジフルオロ - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ } - 2 - メチル - フェニル) - ピロリジン - 1 - イル - メタノン ;

(4 - { 2 - [4 - (4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - 2 - メチル - フェニル) - モルホリン - 4 - イル - メタノン ;

[7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - [4 - (4 - エチル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェニル] - アミン ;

{ 4 - [7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - 2 - メチル - フェニル } - ピロリジン - 1 - イル - メタノン ;

{ 4 - [4 - (2 - ジメチルアミノ - エチル) - ピペラジン - 1 - イル] - 3 - メチル -

フェニル} - [7 - (4 - メタンスルホニル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - アミン ;

{ 7 - [4 - (1 , 1 - ジオキソ - 1ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチル) - 3 , 5 - ジフルオロ - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イル } - [4 - (4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェニル] - アミン ;

[4 - (2 - { 4 - [4 - (2 - ジメチルアミノ - エチル) - ピペラジン - 1 - イル] - 3 - メチル - フェニルアミノ } - ベンゾオキサゾール - 7 - イル) - 2 - メチル - フェニル] - モルホリン - 4 - イル - メタノン ;

4 - [7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - N , N - ジエチル - 2 - メチル - ベンズアミド ;

{ 4 - [7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - 2 - メチル - フェニル } - (4 - エチル - ピペラジン - 1 - イル) - メタノン ;

[4 - (4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェニル] - [7 - (4 - メタンスルホニル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - アミン ;

(4 - { 2 - [4 - (4 - イソプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - 2 - メチル - フェニル) - モルホリン - 4 - イル - メタノン ;

{ 4 - [4 - (2 - ジメチルアミノ - エチル) - ピペラジン - 1 - イル] - 3 - メチル - フェニル } - { 7 - [4 - (1 , 1 - ジオキソ - 1ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチル) - 3 , 5 - ジフルオロ - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イル } - アミン ;

{ 7 - [4 - (1 , 1 - ジオキソ - 1ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチル) - 3 , 5 - ジフルオロ - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イル } - { 4 - [4 - (2 - メトキシ - エチル) - ピペラジン - 1 - イル] - 3 - メチル - フェニル } - アミン ;

(4 - { 2 - [4 - (4 - エチル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - 2 , 6 - ジフルオロ - フェニル) - モルホリン - 4 - イル - メタノン ;

{ 2 - メチル - 4 - [7 - (3 - メチル - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - フェニル } - ピロリジン - 1 - イル - メタノン ;

2 - (4 - { 2 - [4 - (4 - エチル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - フェニル) - 2 - メチル - 1 - モルホリン - 4 - イル - プロパン - 1 - オン ;

4 - { 2 - [4 - (4 - エチル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - ベンゼンスルホンアミド ;

[4 - (4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - [7 - (4 - メタンスルホニル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - アミン ;

[4 - (4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - { 7 - [4 - (1 , 1 - ジオキソ - 1ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチル) - 3 , 5 - ジフルオロ - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イル } - アミン ;

[7 - (4 - メタンスルホニル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - { 4 - [4 - (2 - メトキシ - エチル) - ピペラジン - 1 - イル] - 3 - メチル - フェニル } - アミン ;

(1 , 1 - ジオキソ - 1ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イル) - (4 - { 2 - [4 - (4 - エチル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - フェニル) - メタノン ;

4 - { 7 - [4 - (4 - アセチル - ピペラジン - 1 - イルメチル) - 3 , 5 - ジフルオロ - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ } - N , N - ジエチル - 2 - メチル - ベンズアミド ;

4 - [7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - ピペラジン - 1 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - N , N - ジエチル - 2 - メチル - ベンズアミド ;
 (4 - { 2 - [4 - (4 - エチル - ピペラジン - 1 - イルメチル) - 3 - メチル - フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - 2 - フルオロ - フェニル) - モルホリン - 4 - イル - メタノン ;

4 - [7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - 2 , N - ジメチル - ベンズアミド ;
 [7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - { 3 - メチル - 4 - [4 - (3 , 3 , 3 - トリフルオロ - プロピル) - ピペラジン - 1 - イル] - フェニル } - アミン ;

4 - [7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - N - (2 - ジメチルアミノ - エチル) - 2 - メチル - ベンズアミド ;

4 - (7 - { 4 - [2 - (1 , 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イル) - 2 - オキソ - エチル] - フェニル } - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ) - N , N - ジエチル - 2 - メトキシ - ベンズアミド ;

2 - { 4 - [2 - (4 - メタンスルホニル - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 - イル] - フェニル } - 1 - モルホリン - 4 - イル - エタノン ;

1 - (4 - { 7 - [4 - (1 , 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチル) - 3 , 5 - ジフルオロ - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ } - フェニル) - ピロリジン - 2 - オン ;

1 - { 4 - [7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - フェニル } - ピロリジン - 2 - オン ;

(4 - { 2 - [4 - メトキシ - 3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - 2 - メチル - フェニル) - モルホリン - 4 - イル - メタノン ;

{ 7 - [4 - (1 , 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチル) - 3 , 5 - ジフルオロ - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イル } - [3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - アミン ;

(2 - メチル - 4 - { 2 - [3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - フェニル) - モルホリン - 4 - イル - メタノン ;

{ 7 - [4 - (1 , 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチル) - 3 , 5 - ジフルオロ - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イル } - [4 - メトキシ - 3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - アミン ;

{ 2 - フルオロ - 4 - [2 - (3 - メチル - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 - イル] - フェニル } - モルホリン - 4 - イル - メタノン ;

N - { 5 - [7 - (3 - フルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - インダン - 2 - イル } - アセトアミド ;

N - (5 - { 7 - [4 - (1 , 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチル) - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ } - インダン - 2 - イル) - アセトアミド ;

5 - [7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - 1 , 3 - ジヒドロ - インドール - 2 - オン ;

2 - { 4 - [2 - (4 - メタンスルフィニル - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 - イル] - フェニル } - 1 - モルホリン - 4 - イル - エタノン ;

[7 - (4 - イミダゾール - 1 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (3 , 4 , 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン ;

{ 7 - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イルメチル) - フェニル] - ベンゾオキサ

ザール - 2 - イル} - (3, 4, 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン;
 [7 - (4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル]
] - (3, 4, 5 - トリメトキシ - フェニル) - アミン;
 4 - [2 - (4 - メトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 - イル] - N -
 メチル - ベンゼンスルホンアミド;
 1 - モルホリン - 4 - イル - 2 - {4 - [2 - (3, 4, 5 - トリメトキシ - フェニルア
 ミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 - イル] - フェニル} - エタノン;
 モルホリン - 4 - イル - {4 - [2 - (3, 4, 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) -
 ベンゾオキサゾール - 7 - イル] - フェニル} - メタノン;
 (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - {4 - [2 - (3, 4, 5 - トリメトキシ - フ
 ェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 - イル] - フェニル} - メタノン;
 {4 - [2 - (3, 4, 5 - トリメトキシ - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7
 - イル] - フェニル} - メタノール;
 4 - [2 - (3 - メトキシ - 4 - メチル - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 -
 イル] - N - メチル - ベンゼンスルホンアミド;
 N - (2 - メトキシ - エチル) - 4 - {7 - [4 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - フ
 ェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ} - ベンズアミド;
 N, N - ジメチル - 4 - [7 - (4 - スルファモイル - フェニル) - ベンゾオキサゾール
 - 2 - イルアミノ] - ベンズアミド;
 N - (2 - メトキシ - エチル) - 4 - {7 - [4 - (2 - モルホリン - 4 - イル - 2 - オ
 キソ - エチル) - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ} - ベンズアミド;
 N - (3 - {7 - [4 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - フェニル] - ベンゾオキサゾ
 ール - 2 - イルアミノ} - フェニル) - メタンズルホンアミド;
 2 - メトキシ - 4 - {7 - [4 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - フェニル] - ベンゾ
 オキサゾール - 2 - イルアミノ} - 安息香酸メチルエステル;
 2 - メトキシ - N, N - ジメチル - 4 - {7 - [4 - (モルホリン - 4 - カルボニル) -
 フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ} - ベンズアミド;
 2 - メチル - 2 - (4 - {2 - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル
 アミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル} - フェニル) - 1 - モルホリン - 4 - イル -
 プロパン - 1 - オン;
 [4 - (3, 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - オキサゾ
 ロ [5, 4 - c] ピリジン - 2 - イル] - [4 - (4 - エチル - ピペラジン - 1 - イル)
 - 3 - メチル - フェニル] - アミン;
 {4 - [4 - (1, 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチル)
 - 3, 5 - ジフルオロ - フェニル] - オキサゾロ [5, 4 - c] ピリジン - 2 - イル} -
 [4 - (4 - エチル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェニル] - アミン;
 [4 - (4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェニル] - {7
 - [4 - (1, 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチル) - 3
 , 5 - ジフルオロ - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イル} - アミン;
 (4 - {2 - [4 - (4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェ
 ニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル} - 2 - メチル - フェニル) - モルホリン
 - 4 - イル - メタノン;
 (4 - {2 - [4 - (4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェ
 ニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル} - 2 - フルオロ - フェニル) - モルホリ
 ン - 4 - イル - メタノン;
 2 - (4 - {2 - [4 - (4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル -
 フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル} - フェニル) - 2 - メチル - 1 - モ
 ルホリン - 4 - イル - プロパン - 1 - オン;
 4 - [7 - (3, 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベン
 ザオキサゾール - 2 - イルアミノ] - N - (2 - ジメチルアミノ - エチル) - 2, N - ジ

メチル - ベンズアミド ;

N - (2 - ジメチルアミノ - エチル) - 4 - { 7 - [4 - (1 , 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチル) - 3 , 5 - ジフルオロ - フェニル] - ベンゾ
オキサゾール - 2 - イルアミノ } - 2 , N - ジメチル - ベンズアミド ;

[4 - (4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェニル] - [7
- (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサ
ゾール - 2 - イル] - アミン ;

5 - [7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベン
ゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピリジン - 2 - オン ;

(4 - { 2 - [4 - (4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェ
ニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - 2 - メチル - フェニル) - (1 , 1 -
ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イル) - メタノン ;

[7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオ
キサゾール - 2 - イル] - (3 - メチル - 4 - モルホリン - 4 - イル - フェニル) - アミ
ン ;

{ 7 - [4 - (1 , 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチル)
- 3 , 5 - ジフルオロ - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イル } - (3 - メチル -
4 - モルホリン - 4 - イル - フェニル) - アミン ;

(1 , 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イル) - { 4 - [2 - (3
- メチル - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニルアミノ) - ベンゾオキサゾール -
7 - イル] - フェニル } - メタノン ;

{ 2 - メチル - 4 - [2 - (3 - メチル - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニルア
ミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 - イル] - フェニル } - モルホリン - 4 - イル - メタノ
ン ;

2 - メチル - 2 - { 4 - [2 - (3 - メチル - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニ
ルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 - イル] - フェニル } - 1 - モルホリン - 4 - イル
- プロパン - 1 - オン ;

4 - { 4 - [4 - (1 , 1 - ジオキソ - 1 ラムダ * 6 * - チオモルホリン - 4 - イルメチ
ル) - 3 , 5 - ジフルオロ - フェニル] - オキサゾール [5 , 4 - c] ピリジン - 2 - イル
アミノ } - 2 , N , N - トリメチル - ベンズアミド ;

4 - { 7 - [3 , 5 - ジフルオロ - 4 - (3 - オキソ - ピペラジン - 1 - イルメチル) -
フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ } - 2 , N , N - トリメチル - ベンズ
アミド ;

4 - { 2 , 6 - ジフルオロ - 4 - [2 - (3 - メチル - 4 - モルホリン - 4 - イル - フェ
ニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 - イル] - ベンジル } - ピペラジン - 2 - オン ;

4 - (4 - { 2 - [4 - (4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル -
フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - 2 , 6 - ジフルオロ - ベンジル)
- ピペラジン - 2 - オン ;

4 - { 7 - [3 , 5 - ジフルオロ - 4 - (4 - メチル - 3 - オキソ - ピペラジン - 1 - イ
ルメチル) - フェニル] - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ } - 2 , N , N - トリメ
チル - ベンズアミド ;

4 - { 2 , 6 - ジフルオロ - 4 - [2 - (3 - メチル - 4 - モルホリン - 4 - イル - フェ
ニルアミノ) - ベンゾオキサゾール - 7 - イル] - ベンジル } - 1 - メチル - ピペラジン
- 2 - オン ;

4 - (4 - { 2 - [4 - (4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル -
フェニルアミノ] - ベンゾオキサゾール - 7 - イル } - 2 , 6 - ジフルオロ - ベンジル)
- 1 - メチル - ピペラジン - 2 - オン ;

4 - [7 - (4 - メタンシルフィニルメチル - 3 - メチル - フェニル) - ベンゾオキサゾ
ール - 2 - イルアミノ] - 2 , N , N - トリメチル - ベンズアミド ;

[4 - (4 - シクロプロピル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - メチル - フェニル] - [7

- (4 - メタンスルホニルメチル - 3 - メチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - アミン ;

[7 - (4 - メタンスルフィニルメチル - 3 - メチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (4 - メチル - 3 - モルホリン - 4 - イル - フェニル) - アミン ;

{ 4 - [7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - 2 - メチル - フェニル } - モルホリン - 4 - イル - メタノン ;

4 - [7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - N - (2 - メトキシ - エチル) - 2 - メチル - ベンズアミド ;

4 - [7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - N - (3 - ジメチルアミノ - プロピル) - 2 - メチル - ベンズアミド ;

[7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イル] - (6 - メトキシ - 5 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - アミン ;

4 - [7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - 2 , 6 , N , N - テトラメチル - ベンズアミド ;

4 - [7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - 2 - エチル - N , N - ジメチル - ベンズアミド ;

4 - [7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - N - (2 - メトキシ - エチル) - 2 , N - ジメチル - ベンズアミド ;

4 - [7 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - モルホリン - 4 - イルメチル - フェニル) - ベンゾオキサゾール - 2 - イルアミノ] - 2 - モルホリン - 4 - イル - ベンゾニトリル ;

の化合物群から選択される、請求項 1 ~ 9 のいずれかに記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 1】

動物、とりわけヒトの体の処置に使用するための、請求項 1 ~ 1 0 のいずれかに記載の式 (I) の化合物。

【請求項 1 2】

使用が J A K 2 および / または J a k 3 キナーゼ介在性疾患の処置においてである、請求項 1 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 1 3】

請求項 1 ~ 1 0 のいずれかに記載の化合物と、薬学的に許容される担体物質を含む医薬組成物。

【請求項 1 4】

J A K 2 および / または J A K 3 キナーゼ介在性疾患の処置に使用するための、請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

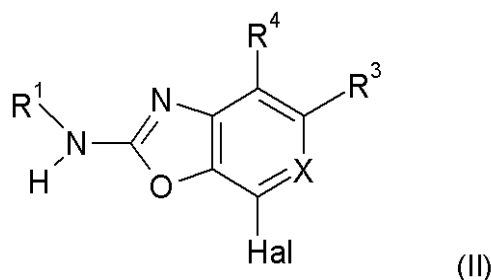
【請求項 1 5】

J A K 2 および / または J A K 3 キナーゼ介在性疾患の処置用医薬製剤の製造のための、請求項 1 ~ 1 0 のいずれかに記載の式 (I) の化合物の使用。

【請求項 1 6】

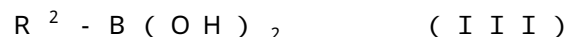
請求項 1 ~ 1 0 のいずれかに記載の式 (I) の化合物の製造方法であって、
a) 式 (I I)

【化2】



〔式中、X、R¹、R³およびR⁴は請求項1または請求項2～7のいずれか1つ以上において式(I)の化合物について定義のとおりであり、そしてHalはハロ、とりわけブromoである〕

の化合物を鈴木カップリング条件下で式(III)

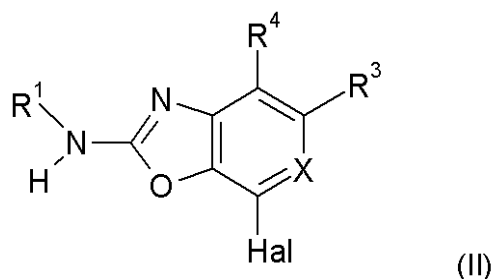


〔式中、R²は式(I)の化合物について定義のとおりである〕

のボロン酸またはその反応性誘導体と反応させること、または

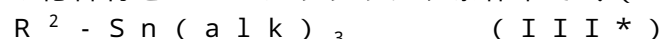
b)式(II)

【化3】



〔式中、X、R¹、R³およびR⁴は式(I)の化合物について定義のとおりであり、そしてHalはハロ、とりわけブromoである〕

の化合物をStilleカップリング条件下で式(III*)



〔式中、R²は式(I)の化合物について定義のとおりであり、alkはアルキル、好ましくはC₁-C₇-アルキルである〕

の有機スズ化合物と反応させること、

および所望により、得られた式(I)の化合物を異なる式(I)の化合物に変換すること、

得られた式(I)の化合物の塩を異なるその塩に変換すること、得られた遊離形の式(I)

の化合物をその塩に変換すること、および/または得られた式(I)の化合物の1個

の異性体を1個以上の異なる得られた式Iの異性体から分離すること；

を含む方法。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0023

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0023】

置換もしくは非置換ヘテロシクリルにおいて、ヘテロシクリルは好ましくはヘテロ環式基であり、これは不飽和(=環内に可能な最高数の共役二重結合を担持する)、飽和または部分飽和であり、かつ好ましくは単環式、またはより広い本発明の局面において二環式もしくは三環式環である；そして3～24、より好ましくは4～16、最も好ましくは4～10、最も好ましくは6個の環原子を有しており；ここで1個以上、好ましくは1～4、とりわけ1または2個の炭素環原子が窒素、酸素および硫黄から成る群から選択される

ヘテロ原子で置換されており、結合環は好ましくは4～12個、とりわけ5～7個の環原子を有し；当該ヘテロ環式基（ヘテロシクリル）は非置換であるか、または1個以上、とりわけ1～3個の置換アルキルについて上記定義の置換基から成る群から独立して選択される置換基で置換されており；そしてここで、ヘテロシクリルはとりわけオキシラニル、アジリニル、アジリジニル、1,2-オキサチオラニル、チエニル（=チオフェニル）、フラニル、テトラヒドロフリル、ピラニル、チオピラニル、チアントレニル、イソベンゾフラニル、ベンゾフラニル、クロメニル、2H-ピロリル、ピロリル、ピロリニル、ピロリジニル、イミダゾリル、イミダゾリジニル、ベンゾイミダゾリル、ピラゾリル、ピラジニル、ピラゾリジニル、チアゾリル、イソチアゾリル、ジチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、ピリダジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、（S-オキソまたはS, S-ジオキソ）-チオモルホリニル、インドリジニル、アゼパニル、ジアゼパニル、とりわけ1,4-ジアゼパニル、イソインドリル、3H-インドリル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、クマリル、インダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、プリニル、4H-キノリジニル、イソキノリル、キノリル、テトラヒドロキノリル、テトラヒドロイソキノリル、デカヒドロキノリル、オクタヒドロイソキノリル、ベンゾフラニル、ジベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、ジベンゾチオフェニル、フタラジニル、ナフチリジニル、キノキサリル、キナゾリニル、キナゾリニル、シノリニル、プテリジニル、カルバゾリル、ベータ-カルボリニル、フェナントリジニル、アクリジニル、ペリミジニル、フェナントロリニル、フラザニル、フェナジニル、フェノチアジニル、フェノキサジニル、クロメニル、イソクロマニル、クロマニル、ベンゾ[1,3]ジオキソール-5-イルおよび2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]ジオキシン-6-イルから成る群から選択されるヘテロシクリル基であり、これらの基は各々非置換であるか、または置換アリールについて上記のものおよび/またはオキソから選択される、1個以上、好ましくは3個までの置換基で置換されている。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0030

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0030】

プロテインチロシンキナーゼ（とりわけJAK2および/またはJAK3キナーゼ）介在性疾患は、プロテインチロシンキナーゼの阻害、とりわけJAK（好ましくはJAK2および/またはJAK3）キナーゼまたはTYK2の阻害、よりとりわけJAK2キナーゼの阻害（処置する疾患について、とりわけ増殖性疾患、例えば腫瘍疾患、白血病、真性赤血球増加症、本態性血小板血症および骨髄化生を伴う骨髄線維症が記載され得る）および/またはJAK3キナーゼ（好ましくは臓器移植拒絶、紅斑性狼瘡、多発性硬化症、リウマチ性関節炎、乾癬、皮膚炎、クローン病、1型糖尿病および1型糖尿病の合併症のような疾患の（例えば免疫抑制による）処置が好ましいとして記載される）の阻害に有利な方法で（例えば1個以上の症状の改善、疾患発症の遅延、一時的または完全な疾患の治療まで）応答するような障害である。

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0136

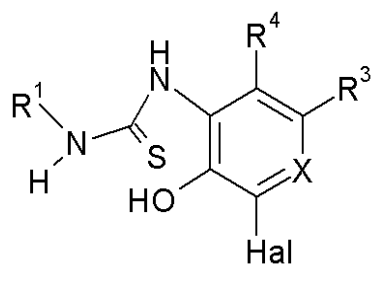
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0136】

式(II)の化合物は例えば、式(IV)

【化6】



のチオウレアを環化下、有機スルホニルクロライド、例えばトルエン - 4 - スルホニルクロライドの存在下、適切な溶媒、例えば環状エーテル、例えばテトラヒドロフラン中、水および塩基、例えば水酸化ナトリウムの存在下、 $-20 \sim 50$ 、例えばおよそ室温で、反応させて得ることができる。

【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0191

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0191】

c) 4 - プロモ - オキサゾロ [5 , 4 - c] ピリジン - 2 - チオール

4 - アミノ - 2 - プロモ - ピリジン - 3 - オール 1.34 g (7.09 mmol) を EtOH 13 ml に溶解させ、カリウムエチルキサントゲネート 1.86 g (11.3 mmol) を加える。この混合物を 18 時間、還流温度で撹拌する。室温に冷却後、反応混合物を真空下で濃縮し、水 5 ml を加える。酢酸を加えて、pH 5 に調節する。生成物が結晶化を開始し、これを濾取し、水で 2 回洗浄し、乾燥させて表題化合物を得る。