

【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】令和7年6月12日(2025.6.12)

【国際公開番号】WO2022/253341

【公表番号】特表2024-521929(P2024-521929A)

【公表日】令和6年6月4日(2024.6.4)

【年通号数】公開公報(特許)2024-102

【出願番号】特願2023-574635(P2023-574635)

【国際特許分類】

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 1 9 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 3 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 1 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 4 3 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

10

【 F I 】

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 3 1 1

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 C S P

A 6 1 K 3 1 / 5 1 9

A 6 1 K 3 1 / 4 3 8

A 6 1 P 1 1 / 0 0

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 0 5

20

【手続補正書】

【提出日】令和7年6月4日(2025.6.4)

【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

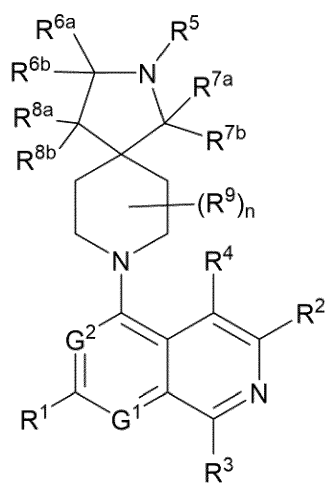
【補正の内容】

30

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物：



40

又はそのN-オキド又はその薬学的に許容される塩であって、

R<sup>1</sup>は、R<sup>10</sup>から独立して選択される1、2、3、4又は5個の置換基で置換されて

50

いてもよい5～14員ヘテロアリーールであり、

$R^2$ は、水素、ハロゲン、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $-O(C_1\sim 6$ アルキル)、 $-NH(C_1\sim 6$ アルキル)又は $-N(C_1\sim 6$ アルキル) $_2$ であり、ここで、各 $C_1\sim 6$ アルキルは、 $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3、4又は5個の置換基で置換されていてもよく、

$R^3$ は、水素、 $C_1\sim 6$ アルキル、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、 $-O(C_1\sim 6$ アルキル)、 $C_2\sim 6$ アルケニル又は $C_2\sim 6$ アルキニルであり、ここで、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_2\sim 6$ アルケニル及び $C_2\sim 6$ アルキニルはそれぞれ、 $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3、4又は5個の置換基で置換されていてもよく、

$R^4$ は、水素、ハロゲン、シアノ、 $-NR^{43a}R^{43b}$ 、 $-OR^{44}$ 、 $C_1\sim 6$ アルキル又は $C_3\sim 6$ シクロアルキルであり、ここで、 $C_1\sim 6$ アルキル及び $C_3\sim 6$ シクロアルキルはそれぞれ、 $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3、4又は5個の置換基で置換されていてもよく、

10

$G^1$ はN又は $CR^{41}$ であり、 $G^2$ はN又は $CR^{42}$ であり、ただし、 $G^1$ 及び $G^2$ の一方又は両方がNであることを条件とし、

$R^{41}$ 及び $R^{42}$ は独立して、水素、ハロゲン、シアノ、 $-NR^{43a}R^{43b}$ 、 $-OR^{44}$ 、 $C_1\sim 6$ アルキル又は $C_3\sim 6$ シクロアルキルであり、ここで、 $C_1\sim 6$ アルキル及び $C_3\sim 6$ シクロアルキルはそれぞれ、 $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3、4又は5個の置換基で置換されていてもよく、

各 $R^{43a}$ 及び $R^{43b}$ は、独立して、水素又は $C_1\sim 6$ アルキルであり、

20

$R^{44}$ は、水素、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 8$ シクロアルキル、3～14員ヘテロシクリルであり、ここで、 $R^{44}$ の $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 8$ シクロアルキル及び3～14員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

$R^5$ は、水素、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 8$ シクロアルキル、 $C_6\sim 14$ アリーール、5～14員ヘテロアリーール、3～14員ヘテロシクリル、 $-C(O)R^{14}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 又は $-C(O)NR^{16a}R^{16b}$ であり、ここで、 $R^5$ の $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_2\sim 6$ アルケニル、 $C_2\sim 6$ アルキニル、 $C_3\sim 8$ シクロアルキル、 $C_6\sim 14$ アリーール、5～14員ヘテロアリーール及び3～14員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3、4若しくは5個の置換基で置換されていてもよく、又は $R^{6a}$ 若しくは $R^{6b}$ 及びそれらが結合している原子と一緒にあって、 $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3、4若しくは5個の置換基で置換されていてもよい3～14員ヘテロシクリルを形成し、

30

各 $R^{6a}$ 及び $R^{6b}$ は、独立して、水素、 $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_3\sim 8$ シクロアルキル、 $C_6\sim 10$ アリーール、5～14員ヘテロアリーール、3～12員ヘテロシクリル、 $-C(O)R^{14}$ 、 $-C(O)OR^{15}$ 又は $-C(O)NR^{16a}R^{16b}$ であり、ここで、 $R^{6a}$ 及び $R^{6b}$ の $C_1\sim 6$ アルキル、 $C_3\sim 8$ シクロアルキル、 $C_6\sim 10$ アリーール、5～14員ヘテロアリーール及び3～12員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3、4又は5個の置換基で置換されていてもよく、又は $R^5$ 及びそれらが結合している原子と一緒にあって、 $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3、4若しくは5個の置換基で置換されていてもよい3～14員ヘテロシクリルを形成し、或いは、 $R^{6a}$ 及び $R^{6b}$ は、それらが結合している炭素と一緒にあってカルボニルを形成し、

40

各 $R^{7a}$ 及び $R^{7b}$ は、独立して、水素、又は $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3、4若しくは5個の置換基で置換されていてもよい $C_1\sim 6$ アルキルであり、或いは、 $R^{7a}$ 及び $R^{7b}$ は、それらが結合している炭素と一緒にあってカルボニルを形成し、

各 $R^{8a}$ 及び $R^{8b}$ は、独立して、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $-O(C_1\sim 6$ アルキル)又は $C_1\sim 6$ アルキルであり、ここで、各 $C_1\sim 6$ アルキルは、 $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3、4又は5個の置換基で置換されていてもよく、

nは0～8であり、

50

各  $R^9$  は独立して  $C_1 \sim 6$  アルキルであり、又は、存在する場合、2つのジェミナル  $R^9$  基は、それらが結合している炭素と一緒にあってカルボニルを形成し、

各  $R^{14}$  は独立して、水素又は  $C_1 \sim 6$  アルキルであり、

各  $R^{15}$  は独立して  $C_1 \sim 6$  アルキルであり、

各  $R^{16a}$  及び  $R^{16b}$  は、独立して、水素又は  $C_1 \sim 6$  アルキルであり、或いは、 $R^{16a}$  及び  $R^{16b}$  は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、 $R^{10}$  から独立して選択される1、2、3、4又は5個の置換基で置換されていてもよい4～12員ヘテロシクリルを形成し、

各  $R^{10}$  は独立して、オキソ、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_2 \sim 6$  アルケニル、 $C_2 \sim 6$  アルキニル、 $C_3 \sim 8$  シクロアルキル、 $C_6 \sim 14$  アリール、5～14員ヘテロアリール、3～14員ヘテロシクリル、ハロゲン、シアノ、 $-C(O)R^a$ 、 $-C(O)OR^b$ 、 $-C(O)NR^cR^d$ 、 $-OR^b$ 、 $-OC(O)R^a$ 、 $-OC(O)NR^cR^d$ 、 $-SR^b$ 、 $-S(O)R^e$ 、 $-S(O)_2R^e$ 、 $-S(O)(=NH)R^e$ 、 $-S(O)_2NR^cR^d$ 、 $-NR^cR^d$ 、 $-N(R^f)C(O)R^a$ 、 $-N(R^f)C(O)OR^b$ 、 $-N(R^f)C(O)NR^cR^d$ 、 $-N(R^f)S(O)_2R^e$ 、 $-N(R^f)S(O)_2NR^cR^d$  又は  $-P(O)R^gR^h$  であり、ここで、 $R^{10}$  の  $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_2 \sim 6$  アルケニル、 $C_2 \sim 6$  アルキニル、 $C_3 \sim 8$  シクロアルキル、 $C_6 \sim 14$  アリール、5～14員ヘテロアリール及び3～14員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{11}$  から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

各  $R^a$  は独立して、水素、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_2 \sim 6$  アルケニル、 $C_2 \sim 6$  アルキニル、 $C_3 \sim 8$  シクロアルキル、 $C_6 \sim 10$  アリール、5～10員ヘテロアリール又は3～12員ヘテロシクリルであり、ここで、 $R^a$  の  $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_2 \sim 6$  アルケニル、 $C_2 \sim 6$  アルキニル、 $C_3 \sim 8$  シクロアルキル、 $C_6 \sim 10$  アリール、5～10員ヘテロアリール及び3～12員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{11}$  から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

各  $R^b$  は独立して、水素、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_3 \sim 8$  シクロアルキル、 $C_6 \sim 10$  アリール、5～10員ヘテロアリール又は3～12員ヘテロシクリルであり、ここで、 $R^b$  の  $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_3 \sim 8$  シクロアルキル、 $C_6 \sim 10$  アリール、5～10員ヘテロアリール及び3～12員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{11}$  から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

各  $R^c$  及び  $R^d$  は独立して、水素、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_3 \sim 8$  シクロアルキル、 $C_6 \sim 10$  アリール、5～10員ヘテロアリール又は3～12員ヘテロシクリルであり、ここで、 $R^c$  及び  $R^d$  の  $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_3 \sim 8$  シクロアルキル、 $C_6 \sim 10$  アリール、5～10員ヘテロアリール及び3～12員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{11}$  から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

又は、 $R^c$  及び  $R^d$  は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、 $R^{11}$  から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよい4～12員ヘテロシクリルを形成し、

各  $R^e$  は独立して、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_3 \sim 8$  シクロアルキル、 $C_6 \sim 10$  アリール、5～10員ヘテロアリール又は3～12員ヘテロシクリルであり、ここで  $R^e$  の  $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_3 \sim 8$  シクロアルキル、 $C_6 \sim 10$  アリール、5～10員ヘテロアリール及び3～12員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{11}$  から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

各  $R^f$  は独立して、水素又は  $C_1 \sim 6$  アルキルであり、

各  $R^g$  及び  $R^h$  は、独立して、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_3 \sim 8$  シクロアルキル、 $C_6 \sim 10$  アリール、5～10員ヘテロアリール、3～12員ヘテロシクリル又は  $-O-C_1 \sim 6$  アルキルであり、ここで、 $R^g$  及び  $R^h$  の  $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_3 \sim 8$  シクロアルキル、 $C_6 \sim 10$  アリール、5～10員ヘテロアリール及び3～12員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{11}$  から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

或いは、 $R^g$  及び  $R^h$  は、それらが結合しているリン原子と一緒にあって、 $R^{11}$  から

独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよい4～12員ヘテロシクリルを形成し、

各 $R^{11}$ は独立して、オキソ、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、5～10員ヘテロアリール、3～8員ヘテロシクリル、ハロゲン、シアノ、 $-C(O)R^{a1}$ 、 $-C(O)OR^{b1}$ 、 $-C(O)NR^{c1}R^{d1}$ 、 $-OR^{b1}$ 、 $-OC(O)R^{a1}$ 、 $-OC(O)NR^{c1}R^{d1}$ 、 $-SR^{b1}$ 、 $-S(O)R^{e1}$ 、 $-S(O)_2R^{e1}$ 、 $-S(O)_2NR^{c1}R^{d1}$ 、 $-NR^{c1}R^{d1}$ 、 $-N(R^{f1})C(O)R^{a1}$ 、 $-N(R^{f1})C(O)OR^{b1}$ 、 $-N(R^{f1})C(O)NR^{c1}R^{d1}$ 、 $-N(R^{f1})S(O)_2R^{e1}$ 、 $-N(R^{f1})S(O)_2NR^{c1}R^{d1}$ 又は $-P(O)R^{g1}R^{h1}$ であり、ここで、 $R^{11}$ の $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、5～10員ヘテロアリール及び3～8員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{12}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

各 $R^{a1}$ は独立して、水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、5～10員ヘテロアリール又は3～8員ヘテロシクリルであり、ここで、 $R^{a1}$ の $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{2-6}$ アルケニル、 $C_{2-6}$ アルキニル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、5～10員ヘテロアリール及び3～8員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{12}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

各 $R^{b1}$ は独立して、水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、5～10員ヘテロアリール又は3～8員ヘテロシクリルであり、ここで、 $R^{b1}$ の $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、5～10員ヘテロアリール及び3～8員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{12}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

各 $R^{c1}$ 及び $R^{d1}$ は独立して、水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、5～10員ヘテロアリール又は3～8員ヘテロシクリルであり、ここで、 $R^{c1}$ 及び $R^{d1}$ の $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、5～10員ヘテロアリール及び3～8員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{12}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

或いは、 $R^{c1}$ 及び $R^{d1}$ は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、 $R^{12}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよい4～8員ヘテロシクリルを形成し、

各 $R^{e1}$ は、独立して、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、5～10員ヘテロアリール又は3～8員ヘテロシクリルであり、ここで、 $R^{e1}$ の $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、5～10員ヘテロアリール及び3～8員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{12}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

各 $R^{f1}$ は、独立して、水素又は $C_{1-6}$ アルキルであり、

各 $R^{g1}$ 及び $R^{h1}$ は、独立して、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、5～10員ヘテロアリール、3～8員ヘテロシクリル、又は $-O-C_{1-6}$ アルキルであり、ここで、 $R^{g1}$ 及び $R^{h1}$ の $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、5～10員ヘテロアリール及び3～8員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{12}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

或いは、 $R^{g1}$ 及び $R^{h1}$ は、それらが結合しているリン原子と一緒にあって、 $R^{12}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよい4～8員ヘテロシクリルを形成し、

各 $R^{12}$ は、独立して、オキソ、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_6$ アリール、5～6員ヘテロアリール、3～6員ヘテロシクリル、ハロゲン、シアノ、 $-C(O)R^{a2}$ 、 $-C(O)OR^{b2}$ 、 $-C(O)NR^{c2}R^{d2}$ 、 $-OR^{b2}$ 、 $-OC(O)R$

10

20

30

40

50

$a^2$ 、 $-OC(O)NR^{c2}R^{d2}$ 、 $-S(O)_2R^{e2}$ 、 $-S(O)_2NR^{c2}R^{d2}$ 、 $-NR^{c2}R^{d2}$ 、 $-N(R^{f2})C(O)R^{a2}$ 、 $-N(R^{f2})C(O)OR^{b2}$ 、 $-N(R^{f2})C(O)NR^{c2}R^{d2}$ 、 $-N(R^{f2})S(O)_2R^{e2}$ 、 $-N(R^{f2})S(O)_2NR^{c2}R^{d2}$ 又は $-P(O)R^{g2}R^{h2}$ であり、ここで、 $R^{13}$ の $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_6$ アリーール、5～6員ヘテロアリーール及び3～6員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{13}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

各 $R^{a2}$ は、独立して、水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_6$ アリーール、5～6員ヘテロアリーール又は3～6員ヘテロシクリルであり、ここで、 $R^{a2}$ の $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_6$ アリーール、5～6員ヘテロアリーール及び3～6員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{13}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

各 $R^{b2}$ は、独立して、水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル又は3～6員ヘテロシクリルであり、ここで、 $R^{b2}$ の $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル及び3～6員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{13}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

各 $R^{c2}$ 及び $R^{d2}$ は、独立して、水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル又は3～8員ヘテロシクリルであり、ここで、 $R^{c2}$ 及び $R^{d2}$ の $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル及び3～8員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{13}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

或いは、 $R^{c2}$ 及び $R^{d2}$ は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、 $R^{13}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよい4～6員ヘテロシクリルを形成し、

各 $R^{e2}$ は、独立して、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_6$ アリーール、5～6員ヘテロアリーール又は3～6員ヘテロシクリルであり、ここで、 $R^{e2}$ の $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、 $C_6$ アリーール、5～6員ヘテロアリーール及び3～6員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{13}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

各 $R^{f2}$ は、独立して、水素又は $C_{1-6}$ アルキルであり、

各 $R^{g2}$ 及び $R^{h2}$ は、独立して、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、3～8員ヘテロシクリル又は $-O-C_{1-6}$ アルキルであり、ここで、 $R^{g2}$ 及び $R^{h2}$ の $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-6}$ シクロアルキル、及び3～8員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{13}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよく、

或いは、 $R^{g2}$ 及び $R^{h2}$ は、それらが結合しているリン原子と一緒にあって、 $R^{13}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていてもよい4～6員ヘテロシクリルを形成し、且つ

各 $R^{13}$ は、独立して、オキソ、ハロゲン、ヒドロキシル、 $-O(C_{1-6}$ アルキル)、シアノ、 $C_{1-6}$ アルキル又は $C_{1-6}$ ハロアルキルであり、

ただし、化合物は、表1Xの化合物及びその塩以外である、

式(I)の化合物又はそのN-オキシド又はその薬学的に許容される塩。

【請求項2】

$G^1$ 及び $G^2$ の両方がNである請求項1に記載の化合物であって、式(IA)の化合物

:

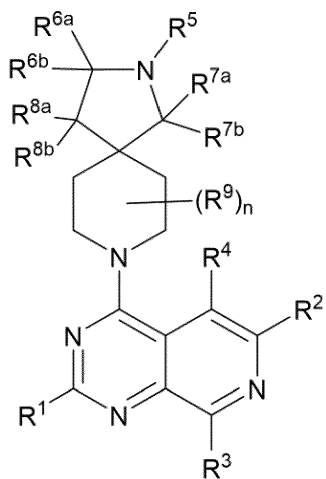
10

20

30

40

50



( I A )

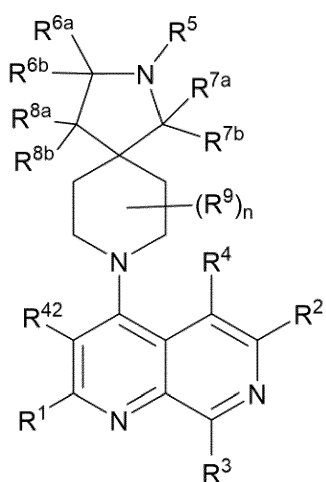
10

( 式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^{6a}$ 、 $R^{6b}$ 、 $R^{7a}$ 、 $R^{7b}$ 、 $R^{8a}$ 、 $R^{8b}$ 、 $R^9$  及び  $n$  は請求項 1 に定義されている通りである )  
 である化合物又はその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 3】

$G^1$  が N であり、 $G^2$  が  $C R^{42}$  である請求項 1 に記載の化合物であって、式 ( I B )  
 の化合物 :

20



( I B )

30

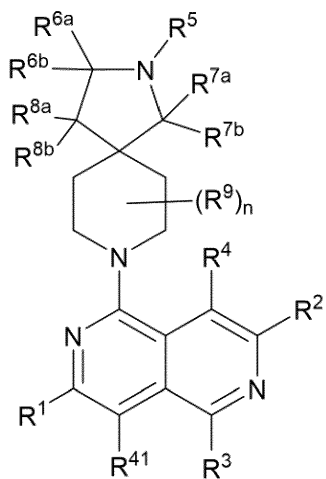
( 式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^{42}$ 、 $R^5$ 、 $R^{6a}$ 、 $R^{6b}$ 、 $R^{7a}$ 、 $R^{7b}$ 、 $R^{8a}$ 、 $R^{8b}$ 、 $R^9$  及び  $n$  は請求項 1 に定義されている通りである )  
 である化合物又はその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 4】

$G^1$  が  $C R^{41}$  であり、 $G^2$  が N である請求項 1 に記載の化合物であって、式 ( I C )  
 の化合物 :

40

50



( I C )

10

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^{41}$ 、 $R^5$ 、 $R^{6a}$ 、 $R^{6b}$ 、 $R^{7a}$ 、 $R^{7b}$ 、 $R^{8a}$ 、 $R^{8b}$ 、 $R^9$ 及び $n$ は請求項1に定義されている通りである)である化合物又はその薬学的に許容される塩。

## 【請求項5】

$R^1$ が、 $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていて、1又は2個の環窒素原子を有する6員ヘテロアールである、請求項1に記載の化合物。

20

## 【請求項6】

$R^1$ が、 $R^{10}$ から独立して選択される1～5個の置換基で置換されていて、よい4-ピリジルである、請求項5に記載の化合物。

## 【請求項7】

$R^1$ が、 $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3又は4個の置換基で置換されていて、1又は2個の環窒素原子を有する5員ヘテロアールである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項8】

$R^1$ が、 $R^{10}$ から独立して選択される1～3個の置換基で置換されていて、よいイソチアゾール-5-イル又はピラゾール-4-イルである、請求項7に記載の化合物。

30

## 【請求項9】

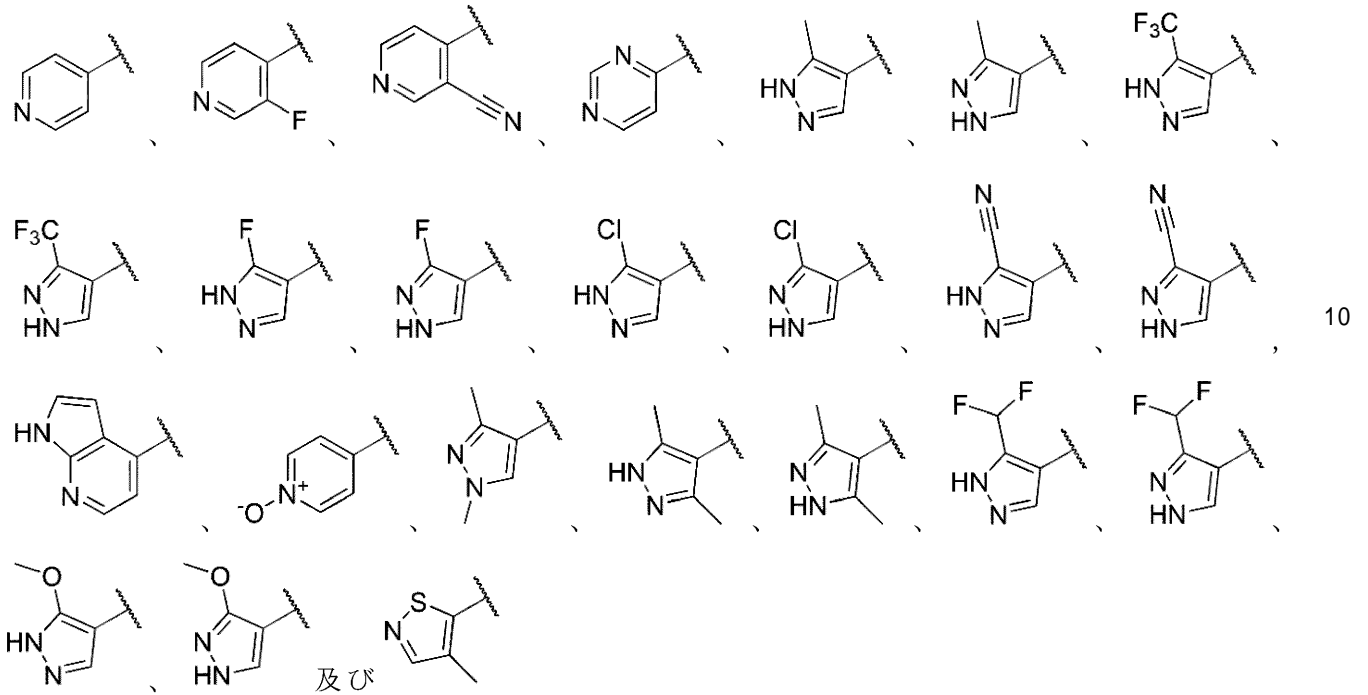
$R^1$ が、 $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3、4又は5個の置換基で置換されていて、よい、1又は2個の環窒素原子を有する5,6-縮合ヘテロアールである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項10】

$R^1$ が、

40

50



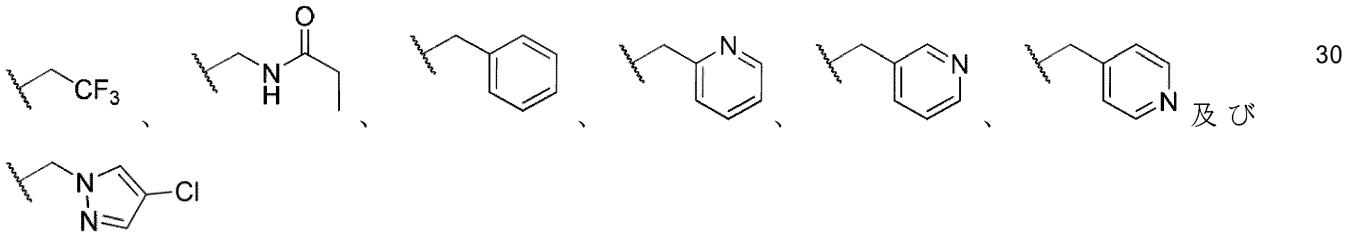
からなる群から選択され、各基の波線は、親構造への結合点を示す、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 1】

$R^2$  が、水素、 $-NH(C_{1-6}$ アルキル)、又は  $R^{10}$  から独立して選択される 1、2、3、4 若しくは 5 個の置換基で置換されているもよい  $C_{1-6}$  アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 2】

$R^2$  が、水素、NHMe、メチル、 $CF_3$ 、



からなる群から選択され、各基の波線が、親構造への結合点を示す、請求項 1 1 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

$R^3$  が水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、 $-O(C_{1-6}$ アルキル)、 $C_{1-6}$ アルキル又は  $C_{2-6}$ アルキニルであり、 $C_{1-6}$ アルキル及び  $C_{2-6}$ アルキニルがそれぞれ、 $R^{10}$  から独立して選択される 1、2、3、4 又は 5 個の置換基で置換されているもよい、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

$R^3$  が、水素、クロロ、シアノ、ヒドロキシル、メトキシ、3-ヒドロキシプロパ-1-イン-1-イル、3-ヒドロキシ-3-メチルブタ-1-イン-1-イル、メチル、メトキシメチル及び 2, 2, 2-トリフルオロエチルからなる群から選択される、請求項 1 3 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

$R^4$  が水素、ハロゲン、 $-NR^{43a}R^{43b}$ 、 $-OR^{44}$ 、 $C_{1-6}$ アルキル又は  $C_3$

40

50

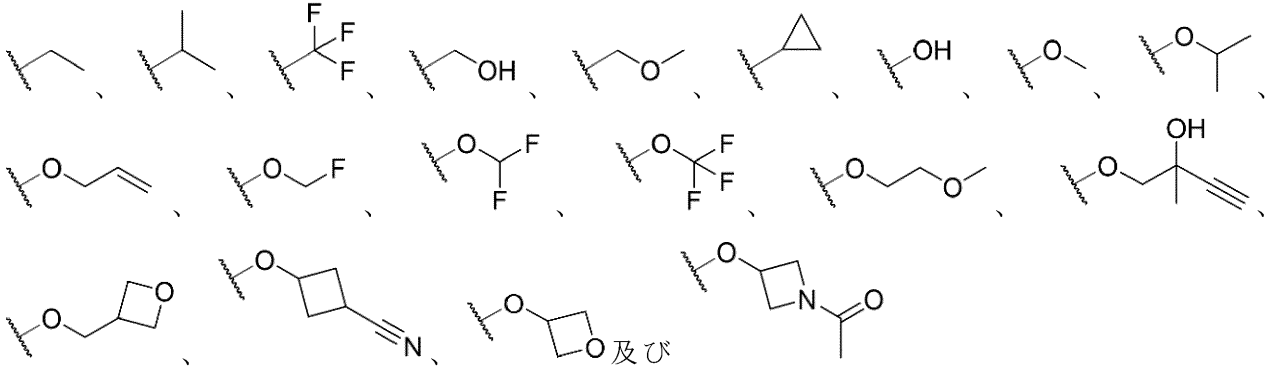
~6シクロアルキルであり、 $C_{1-6}$ アルキル及び $C_{3-6}$ シクロアルキルがそれぞれ、 $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3、4又は5個の置換基で置換されていてもよい、請求項1に記載の化合物。

【請求項16】

$R^4$ が、水素、ハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル又は $-O(C_{1-6}$ アルキル)であり、各 $C_{1-6}$ アルキルが、 $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3、4又は5個の置換基で置換されていてもよい、請求項15に記載の化合物。

【請求項17】

$R^4$ が、水素、フルオロ、クロロ、プロモ、メチル、



からなる群から選択される、請求項15に記載の化合物。

【請求項18】

$R^5$ が、水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{6-14}$ アリール、5~14員ヘテロアリール、3~14員ヘテロシクリル又は $-C(O)R^{14}$ であり、 $R^5$ の $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{6-14}$ アリール、5~14員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルがそれぞれ、 $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3、4又は5個の置換基で置換されていてもよい、請求項1に記載の化合物。

【請求項19】

$R^5$ が水素又は $-C(O)R^{14}$ である、請求項18に記載の化合物。

【請求項20】

$R^5$ が、水素、又は $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3、4若しくは5個の置換基で置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルである、請求項18に記載の化合物。

【請求項21】

$R^5$ が、メチル、エチル、1-プロピル、2-プロピル、2-メチル-1-プロピル及び2-メチル-2-プロピル、

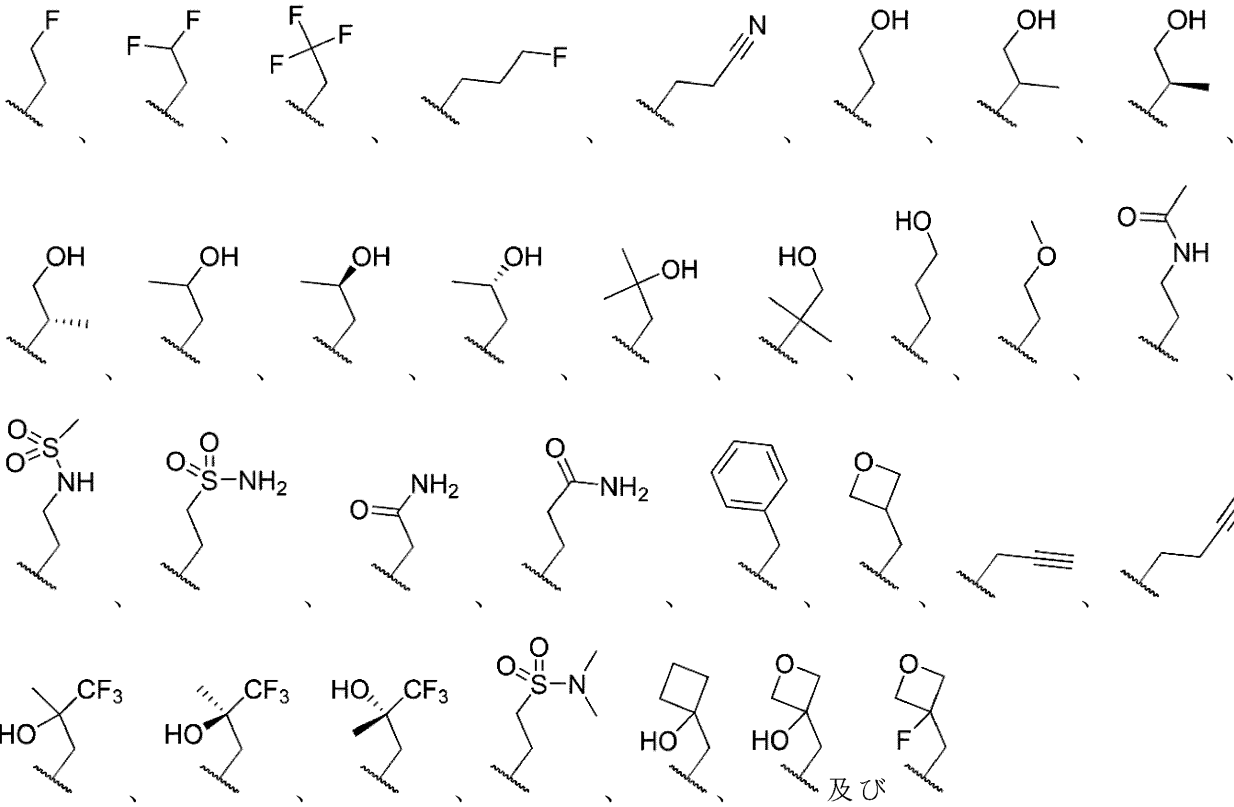
10

20

30

40

50



10

20

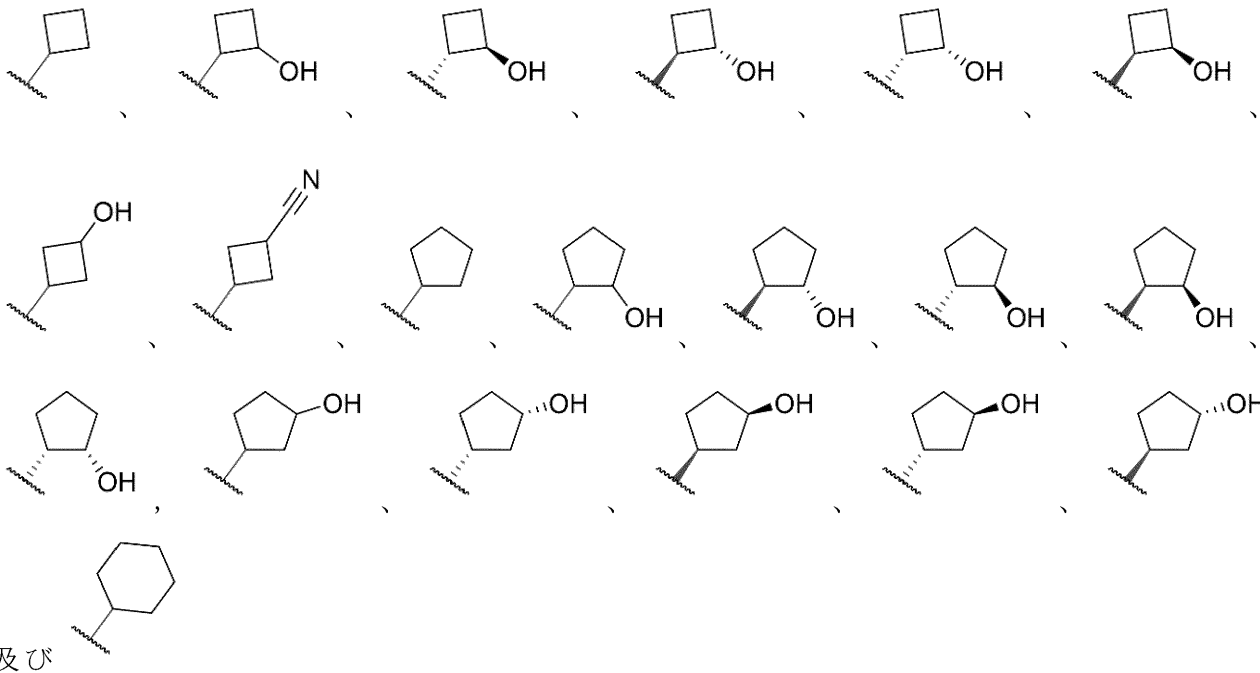
からなる群から選択され、各基の波線は、親構造への結合点を示す、請求項 2 0 に記載の化合物。

【請求項 2 2】

R<sup>5</sup> が、R<sup>1 0</sup> から独立して選択される 1、2、3、4 又は 5 個の置換基で置換されていてもよい C<sub>4</sub> ~ 8 シクロアルキルである、請求項 1 8 に記載の化合物。

【請求項 2 3】

R<sup>5</sup> が、



30

40

からなる群から選択され、各基の波線は、親構造への結合点を示す、請求項 2 2 に記載の

50

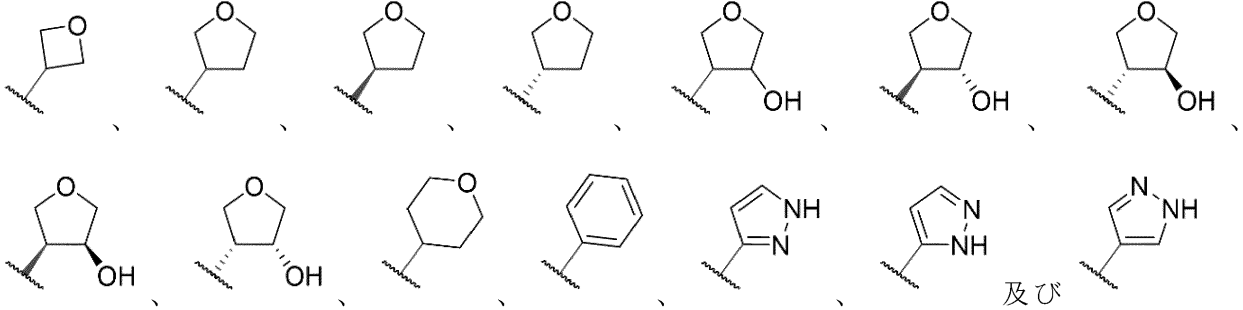
化合物。

【請求項 24】

$R^5$  が、 $R^{10}$  から独立して選択される 1、2、3、4 若しくは 5 個の置換基で置換されていてもよい 3 ~ 14 員ヘテロシクリル、 $R^{10}$  から独立して選択される 1、2、3、4 若しくは 5 個の置換基で置換されていてもよい  $C_6 \sim 14$  アリール、又は  $R^{10}$  から独立して選択される 1、2、3、4 若しくは 5 個の置換基で置換されていてもよい 5 ~ 14 員ヘテロアリールである、請求項 17 に記載の化合物。

【請求項 25】

$R^5$  が、



10

からなる群から選択され、これらの各々は、 $R^{10}$  から独立して選択される 1、2、3、4 又は 5 個の置換基で置換されていてもよく、各基の波線は、親構造への結合点を示す、請求項 24 に記載の化合物。

20

【請求項 26】

各  $R^{6a}$  及び  $R^{6b}$  が独立して水素又は  $C_1 \sim 6$  アルキルであり、或いは、 $R^{6a}$  及び  $R^{6b}$  は、それらが結合している炭素と一緒にカルボニルを形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 27】

$R^{6a}$  及び  $R^{6b}$  の一方が水素であり、 $R^{6a}$  及び  $R^{6b}$  の他方が水素、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)NR^{16a}R^{16b}$ 、又は  $R^{10}$  から独立して選択される 1、2、3、4 若しくは 5 個の置換基で置換されていてもよい  $C_1 \sim 6$  アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

30

【請求項 28】

$R^{6a}$  及び  $R^{6b}$  の一方が水素であり、 $R^{6a}$  及び  $R^{6b}$  の他方が  $-C(O)OR^{15}$  又は  $-C(O)NR^{16a}R^{16b}$  であり、式中、各  $R^{16a}$  及び  $R^{16b}$  は、独立して、水素又は  $C_1 \sim 6$  アルキルである、請求項 27 に記載の化合物。

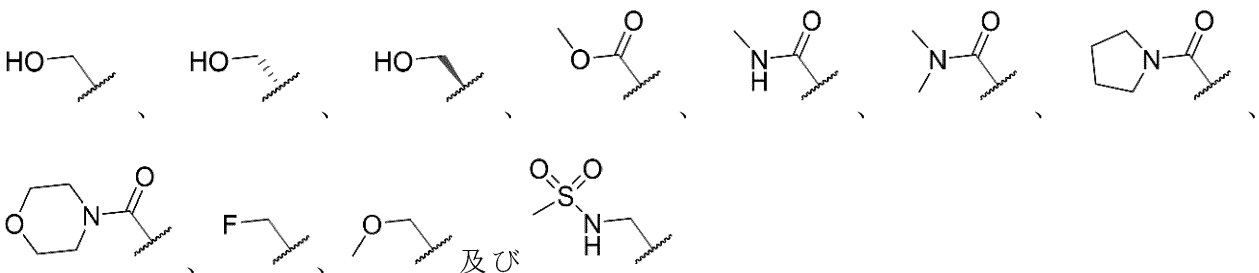
【請求項 29】

$R^{6a}$  及び  $R^{6b}$  の一方が水素であり、 $R^{6a}$  及び  $R^{6b}$  の他方が  $-C(O)NR^{16a}R^{16b}$  であり、式中、 $R^{16a}$  及び  $R^{16b}$  は、それらが結合している窒素原子と一緒に、 $R^{10}$  から独立して選択される 1、2、3、4 又は 5 個の置換基で置換されていてもよい 4 ~ 12 員ヘテロシクリルを形成する、請求項 27 に記載の化合物。

40

【請求項 30】

$R^{6a}$  及び  $R^{6b}$  の一方が水素であり、 $R^{6a}$  及び  $R^{6b}$  の他方が水素、メチル、



50

からなる群から選択され、各基の波線は親構造への結合点を示す、請求項 27 に記載の化合物。

【請求項 31】

$R^5$  が、 $R^{6a}$  及び  $R^{6b}$  の一方並びにそれらが結合している原子と一緒にあって、 $R^{10}$  から独立して選択される 1、2、3、4 又は 5 個の置換基で置換されていてもよい 3 ~ 14 員ヘテロシクリルを形成し、 $R^{6a}$  及び  $R^{6b}$  の他方が、水素、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $C_{6-10}$  アリール、5 ~ 14 員ヘテロアリール、3 ~ 12 員ヘテロシクリル、 $-C(O)R^{14}$ 、 $-C(O)OR^{15}$  又は  $-C(O)NR^{16a}R^{16b}$  であり、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $C_{6-10}$  アリール、5 ~ 14 員ヘテロアリール、及び 3 ~ 12 員ヘテロシクリルがそれぞれ、 $R^{10}$  から独立して選択される 1、2、3、4 又は 5 個の置換基で置換されていてもよい、請求項 1 に記載の化合物。

10

【請求項 32】

$R^5$  が、 $R^{6a}$  及び  $R^{6b}$  の一方並びにそれらが結合している原子と一緒にあって、 $R^{10}$  から独立して選択される 1、2、3、4 又は 5 個の置換基で置換されていてもよい 4 ~ 8 員ヘテロシクリルを形成し、 $R^{6a}$  及び  $R^{6b}$  の他方が水素である、請求項 31 に記載の化合物。

【請求項 33】

各  $R^{7a}$  及び  $R^{7b}$  が独立して、水素又は  $C_{1-6}$  アルキルであり、或いは、 $R^{7a}$  及び  $R^{7b}$  は、それらが結合している炭素と一緒にあってカルボニルを形成する、請求項 1 に記載の化合物。

20

【請求項 34】

$R^{8a}$  及び  $R^{8b}$  の一方が水素であり、 $R^{8a}$  及び  $R^{8b}$  の他方が水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_{1-6}$  アルキル又は  $-O(C_{1-6}$  アルキル) である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 35】

各  $R^{8a}$  及び  $R^{8b}$  が水素であるか、 $R^{8a}$  及び  $R^{8b}$  の一方は水素で  $R^{8a}$  及び  $R^{8b}$  の他方は水素、フルオロ又はヒドロキシルであるか、或いは各  $R^{8a}$  及び  $R^{8b}$  はフルオロである、請求項 32 に記載の化合物。

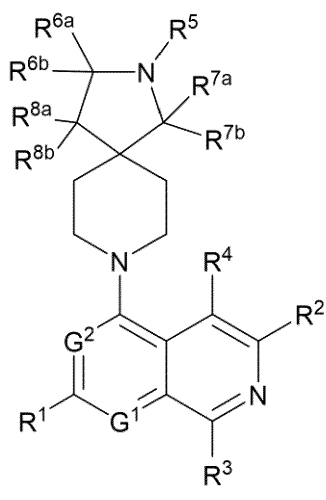
【請求項 36】

$n$  が、0 である、請求項 1 に記載の化合物。

30

【請求項 37】

式 (II) の化合物：



40

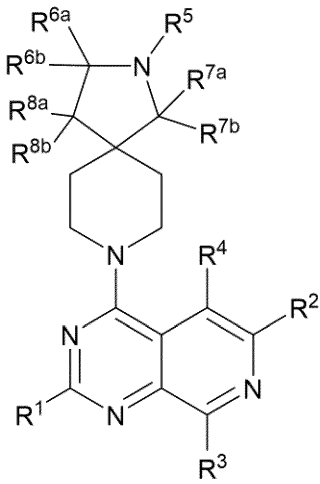
(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $G^1$ 、 $G^2$ 、 $R^5$ 、 $R^{6a}$ 、 $R^{6b}$ 、 $R^{7a}$ 、 $R^{7b}$ 、 $R^{8a}$  及び  $R^{8b}$  は請求項 1 に定義されている通りである) である、請求項 1 に記載の化合物

50

物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 38】

G<sup>1</sup> 及び G<sup>2</sup> の両方が N である請求項 37 に記載の化合物であって、式 (II - A) の化合物：



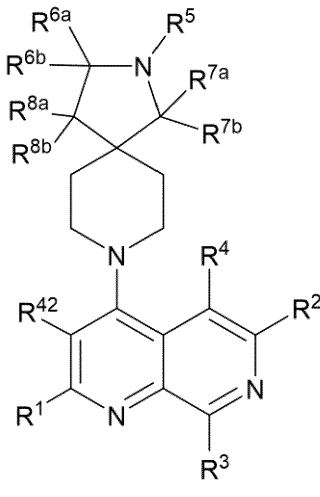
10

(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6a</sup>、R<sup>6b</sup>、R<sup>7a</sup>、R<sup>7b</sup>、R<sup>8a</sup>、及び R<sup>8b</sup> は請求項 37 に定義されている通りである) である化合物又はその薬学的に許容される塩。

20

【請求項 39】

G<sup>1</sup> が N であり、G<sup>2</sup> が C R<sup>42</sup> である請求項 37 に記載の化合物であって、式 (II - B) の化合物：



30

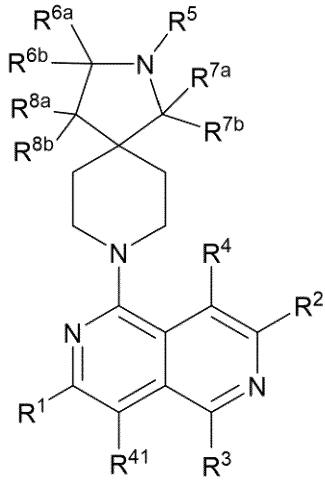
(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>42</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6a</sup>、R<sup>6b</sup>、R<sup>7a</sup>、R<sup>7b</sup>、R<sup>8a</sup>、及び R<sup>8b</sup> は請求項 37 に定義されている通りである) である化合物又はその薬学的に許容される塩。

40

【請求項 40】

G<sup>1</sup> が C R<sup>41</sup> であり、G<sup>2</sup> が N である請求項 37 に記載の化合物であって、式 (II - C) の化合物：

50



10

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^{41}$ 、 $R^5$ 、 $R^{6a}$ 、 $R^{6b}$ 、 $R^{7a}$ 、 $R^{7b}$ 、 $R^{8a}$ 、及び $R^{8b}$ は請求項37に定義されている通りである)である化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項41】

$R^1$ は、ピラゾリル、ピリジニル、イソチアゾリル又はピロロ-ピリジニルであり、これらはそれぞれ、 $R^{10}$ から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてよく、

20

$R^2$ は、水素又は $R^{10}$ から独立して選択される1~5個の置換基で置換されていてよい $C_{1-6}$ アルキルであり、

$R^3$ は、水素、ハロゲン又は $C_{1-6}$ アルキルであり、

$R^4$ は、水素、ハロゲン、 $-O(C_{1-6}$ アルキル)又は $C_{1-6}$ アルキルであり、

$R^5$ は、水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{6-14}$ アリール、5~14員ヘテロアリール、3~14員ヘテロシクリル又は $-C(O)R^{14}$ であり、ここで、 $R^5$ の $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{6-14}$ アリール、5~14員ヘテロアリール及び3~14員ヘテロシクリルはそれぞれ、 $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3、4又は5個の置換基で置換されていてよく、

30

各 $R^{6a}$ 及び $R^{6b}$ は、独立して、水素であるか、 $-C(O)OR^{15}$ 、 $-C(O)NR^{16a}R^{16b}$ 若しくは $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3、4若しくは5個の置換基で置換されていてよい $C_{1-6}$ アルキルであるか、又は $R^{6a}$ 及び $R^{6b}$ は、それらが結合している炭素と一緒になってカルボニルを形成し、

各 $R^{7a}$ 及び $R^{7b}$ は、独立して、水素又は $C_{1-6}$ アルキルであるか、或いは $R^{7a}$ 及び $R^{7b}$ は、それらが結合している炭素と一緒になってカルボニルを形成し、

$R^{8a}$ 及び $R^{8b}$ の一方は水素であり、 $R^{8a}$ 及び $R^{8b}$ の他方は水素、ハロゲン、ヒドキシル、 $C_{1-6}$ アルキル又は $-O(C_{1-6}$ アルキル)であり、

$R^{14}$ は $C_{1-6}$ アルキルであり、

40

$R^{15}$ は $C_{1-6}$ アルキルであり、且つ

各 $R^{16a}$ 及び $R^{16b}$ は、独立して、水素又は $C_{1-6}$ アルキルであるか、又は $R^{16a}$ 及び $R^{16b}$ は、それらが結合している窒素原子と一緒になって、窒素、酸素及び硫黄から選択される1~2個の環状ヘテロ原子を有する5又は6員ヘテロシクリルを形成し、 $R^{10}$ から独立して選択される1、2、3、4又は5個の置換基で置換されていてよい

請求項37に記載の化合物。

【請求項42】

$R^1$ は、ピラゾール-4-イル、4-ピリジル、イソチアゾール-5-イル又はピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イルであり、これらのそれぞれは、ハロゲン、シアノ、非

50

置換  $C_1 \sim 6$  アルキル及び  $C_1 \sim 6$  ハロアルキルからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよく、

各  $R^2$  及び  $R^3$  は、独立して、水素又は  $C_1 \sim 6$  アルキルであり、

$R^4$  は、水素、ハロゲン、 $-O(C_1 \sim 6$  アルキル) 又は  $C_1 \sim 6$  アルキルであり、

$R^5$  は、(i) ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、 $-O(C_1 \sim 6$  アルキル)、 $-NH$   
 $C(O)(C_1 \sim 6$  アルキル)、 $-NHS(O)_2(C_1 \sim 6$  アルキル)、 $-S(O)_2NH_2$ 、 $-C(O)NH_2$ 、フェニル及び 3 ~ 12 員ヘテロシクリルからなる群から独立して  
 選択される 1、2、3、4 又は 5 個の置換基で置換されていてもよい  $C_1 \sim 6$  アルキル

、  
 (ii) ハロゲン、シアノ及びヒドロキシルからなる群から独立して選択される 1、2、3、4 又は 5 個の置換基で置換された  $C_3 \sim 6$  シクロアルキル、

(iii) 酸素である環状ヘテロ原子を 1 個有する単環式 3 ~ 6 員ヘテロシクリル、

(iv) フェニル、或いは

(v) ピラゾリル

であり、

$R^{6a}$  及び  $R^{6b}$  の一方は水素であり、 $R^{6a}$  及び  $R^{6b}$  の他方は水素、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $-C(O)O(C_1 \sim 6$  アルキル) 若しくは  $-C(O)NR^{16a}R^{16b}$  であるか、  
 又は  $R^{6a}$  及び  $R^{6b}$  は、それらが結合している炭素と一緒にあってカルボニルを形成し

、  
 $R^{7a}$  及び  $R^{7b}$  の一方は水素であり、 $R^{7a}$  及び  $R^{7b}$  の他方は水素又は  $C_1 \sim 6$  アルキルであるか、又は  $R^{7a}$  及び  $R^{7b}$  は、それらが結合している炭素と一緒にあってカルボニルを形成し、

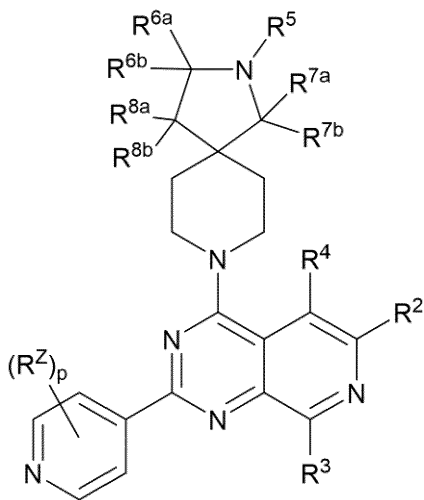
$R^{8a}$  及び  $R^{8b}$  は水素であり、且つ

各  $R^{16a}$  及び  $R^{16b}$  は、独立して、水素又は  $C_1 \sim 6$  アルキルであるか、或いは  $R^{16a}$  及び  $R^{16b}$  は、それらが結合している窒素原子と一緒にあってピロリジン - 1 - イル又はモルホリン - 4 - イルを形成する、

請求項 37 に記載の化合物。

【請求項 43】

式 (III) の化合物：



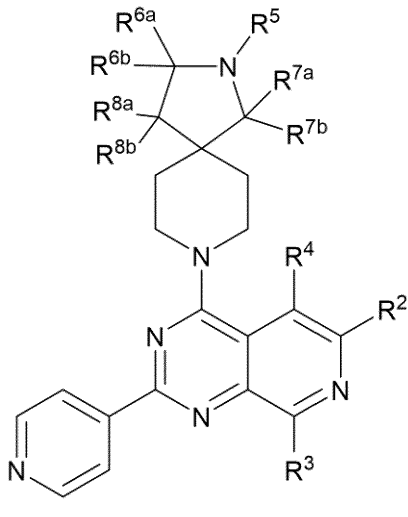
(式中、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^{6a}$ 、 $R^{6b}$ 、 $R^{7a}$ 、 $R^{7b}$ 、 $R^{8a}$  及び  $R^{8b}$  は、  
 該当する場合、請求項 1 に定義されている通りであり、

$p$  は、0、1、2、3 又は 4 であり、且つ

各  $R^Z$  は、独立して、水素、ハロゲン、シアノ又は  $R^{10}$  から独立して選択される 1、  
 2、3、4 若しくは 5 個の置換基で置換されていてもよい  $C_1 \sim 6$  アルキルである) である  
 請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 4 4】

p が 0 である請求項 4 3 に記載の化合物であって、式 ( V ) の化合物：

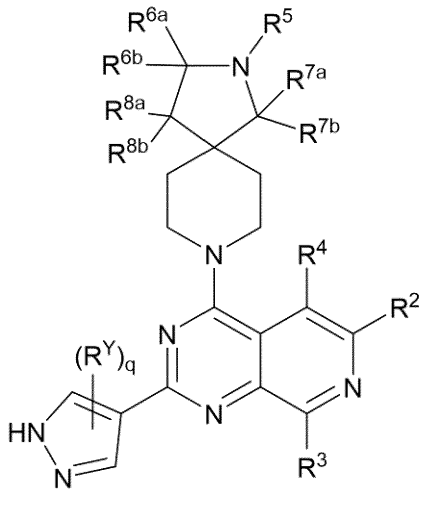


10

である化合物又はその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 4 5】

式 ( I V ) の化合物：



20

30

(式中、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^{6a}$ 、 $R^{6b}$ 、 $R^{7a}$ 、 $R^{7b}$ 、 $R^{8a}$  及び  $R^{8b}$  は、該当する場合、請求項 1 に定義されている通りであり、

$q$  は 0、1、2 又は 3 であり、且つ

各  $R^Y$  は、独立して、水素、ハロゲン、シアノ、 $-O(C_{1-6}$ アルキル)又は  $C_{1-6}$ アルキルであり、 $R^Y$  の  $C_{1-6}$ アルキルは、 $R^{10}$  から独立して選択される 1、2、3、4 又は 5 個の置換基で置換されていてもよい)、である請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

40

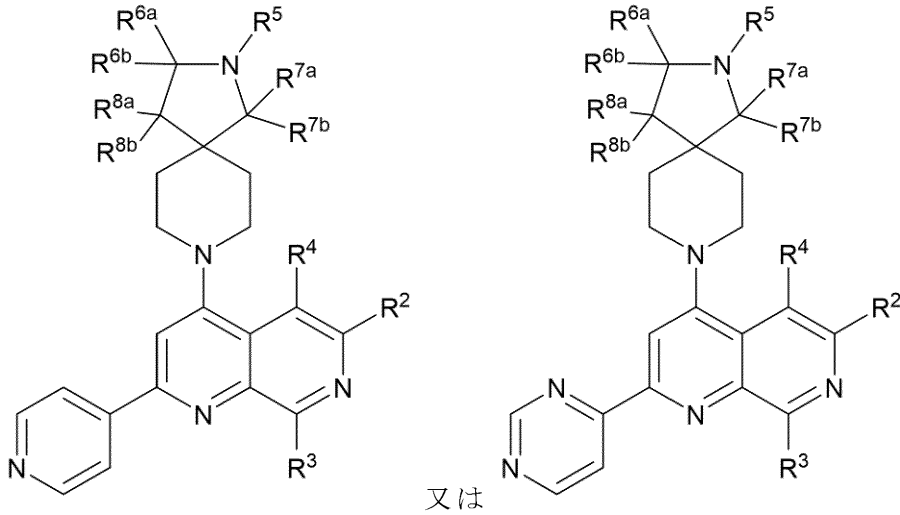
## 【請求項 4 6】

$q$  が 1 であり、 $R^Y$  がメチル、フルオロ、クロロ、シアノ又はトリフルオロメチルである、請求項 4 5 に記載の化合物。

## 【請求項 4 7】

式 ( V I I ) 又は ( V I I I ) の化合物：

50



10

(VII)

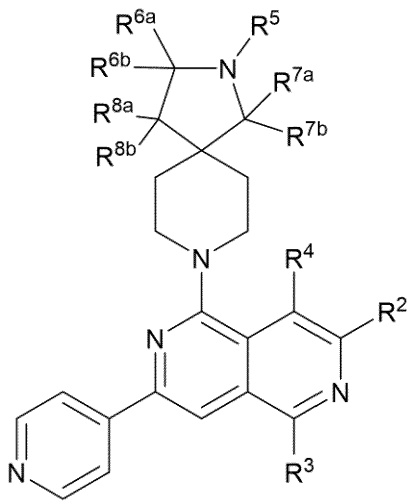
(VIII)

(式中、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6a</sup>、R<sup>6b</sup>、R<sup>7a</sup>、R<sup>7b</sup>、R<sup>8a</sup>及びR<sup>8b</sup>は、該当する場合、請求項1に定義されている通りである)である請求項1に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

20

【請求項48】

式(I X)の化合物:



30

(IX)

(式中、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6a</sup>、R<sup>6b</sup>、R<sup>7a</sup>、R<sup>7b</sup>、R<sup>8a</sup>及びR<sup>8b</sup>は、該当する場合、請求項1に定義されている通りである)である請求項1に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

40

【請求項49】

各R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>が水素である、請求項1に記載の化合物。

【請求項50】

表1の化合物番号101~292からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

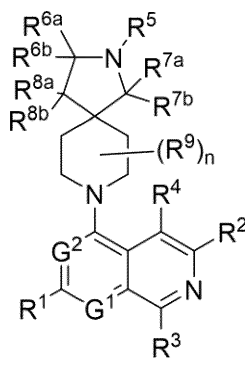
【請求項51】

請求項1から50のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩;及び、薬学的に許容される添加物を含む、薬学的組成物。

【請求項52】

式(I)の化合物:

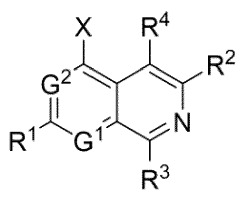
50



10

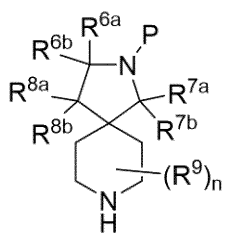
( 式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $G^1$ 、 $G^2$ 、 $R^5$ 、 $R^{6a}$ 、 $R^{6b}$ 、 $R^{7a}$ 、 $R^{7b}$ 、 $R^{8a}$ 、 $R^{8b}$ 、 $R^9$  及び  $n$  は、請求項 1 に定義されている通りである ) 又はその薬学的に許容される塩を製造する方法であって、

a) 式 ( I - 4 ) の化合物 :



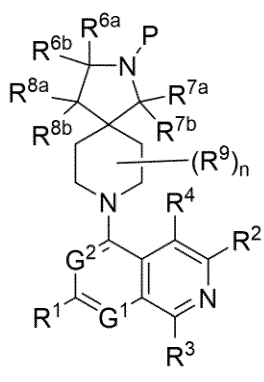
20

[ 式中、 $X$  は、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $F$ 、 $OM$  及び  $OT$  からなる群から選択される ] を、式 ( I - 3 ) の化合物 :



30

[ 式中、 $P$  は、保護基である ] と、塩基の存在下で反応させて、式 ( I - 2 ) の化合物 :

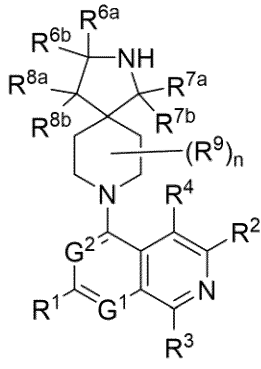


40

を生産することと、

b) 式 ( I - 2 ) の化合物から保護基  $P$  を除去して、式 ( I - 1 ) の化合物 :

50



10

を生産することと、

c) 式 ( I - 1 ) の化合物を式 ( I ) の化合物に変換することと、  
を含む、方法。

【請求項 5 3】

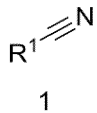
( i ) 塩基の存在下で、式 ( I - 1 ) の化合物を式  $R^5 - X'$  ( 式中、 $X'$  は脱離基である ) の化合物と接触させることによって、又は ( ii ) 式 ( I - 1 ) の化合物を還元剤の存在下で式  $R^5 - CHO$  のアルデヒドと接触させることによって、式 ( I - 1 ) の化合物が、式 ( I ) の化合物に変換される、請求項 5 2 に記載の方法。

20

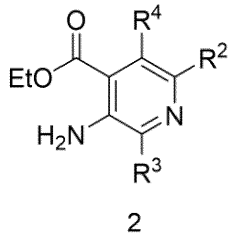
【請求項 5 4】

$G^1$  及び  $G^2$  の両方が N である請求項 5 2 に記載の方法であって、

d) 式 1 の化合物：

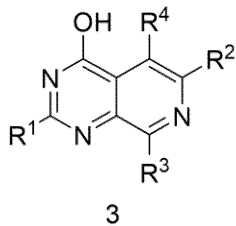


を式 2 の化合物：



30

と塩基の存在下で混合して、式 3 の化合物：



40

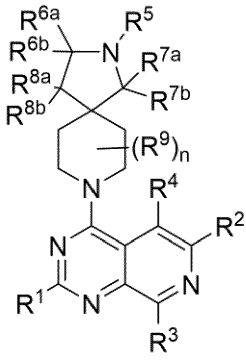
を形成することと、

e) 式 3 の化合物を活性化剤と接触させて、 $G^1$  及び  $G^2$  の両方が N である式 ( I - 4 ) の化合物を形成することと、  
を更に含む、方法。

【請求項 5 5】

50

式 ( I A ) の化合物 :

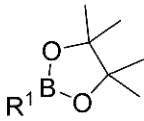


10

( 式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^{6a}$ 、 $R^{6b}$ 、 $R^{7a}$ 、 $R^{7b}$ 、 $R^{8a}$ 、 $R^{8b}$ 、 $R^9$  及び  $n$  は請求項 1 に定義されている通りである ) 又はその薬学的に許容される塩を製造する方法であって、

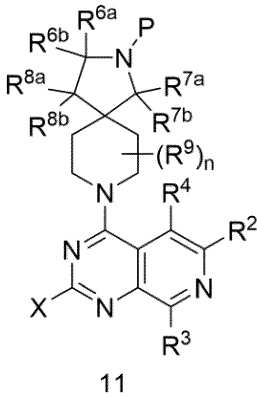
a ) 式 1 2 の化合物 :

12



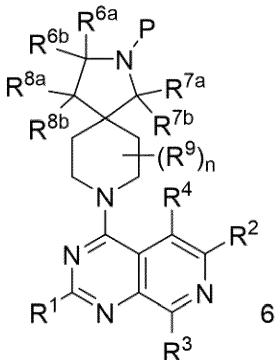
20

を、式 1 1 の化合物 :



30

と、パラジウム触媒及び塩基の存在下で接触させて、式 6 の化合物 :

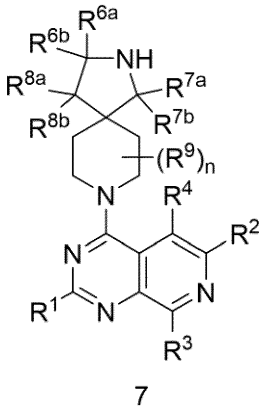


40

[ 式中、 $X$  は  $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $F$ 、 $OM$  及び  $OT$  からなる群から選択され、 $P$  は保護基である ] を形成することと、

b ) 式 6 の化合物から保護基  $P$  を除去して、式 7 の化合物 :

50



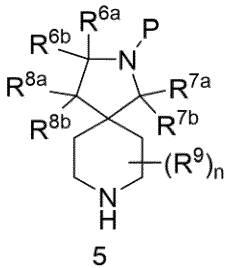
10

を生産することと、

c) 式 7 の化合物を式 ( I A ) の化合物に変換することとを含む、方法。

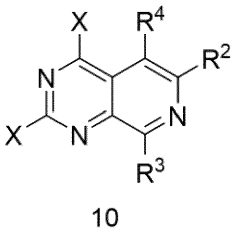
【請求項 5 6】

d) 塩基の存在下で、式 5 の化合物：



20

を、式 10 の化合物：



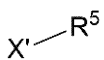
30

( 式中、X は、Cl、Br、I、F、OM 及び OT からなる群から選択される ) とカップリングさせて、式 11 の化合物を形成することを更に含む、請求項 5 5 に記載の方法。

【請求項 5 7】

( i ) 塩基の存在下で、式 7 の化合物を式 8 の化合物：

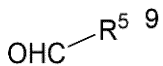
8



40

[ 式中、X' は、脱離基である ] と接触させることによって、又は

( i i ) 還元剤の存在下で、式 7 の化合物を式 9 の化合物：



と接触させることによって、

式 7 の化合物が式 ( I A ) の化合物に変換される、請求項 5 5 又は 5 6 に記載の方法。

50

## 【請求項 58】

(i) 請求項 1 から 50 のいずれか一項に記載の化合物若しくはその薬学的に許容される塩、又は、

(ii) 請求項 1 から 50 のいずれか一項に記載の化合物若しくはその薬学的に許容される塩；及び、薬学的に許容される添加物を含む、薬学的組成物

と細胞を接触させることを含む、細胞における L A T S 1 / 2 を阻害する方法。

## 【請求項 59】

(i) 請求項 1 から 50 のいずれか一項に記載の化合物若しくはその薬学的に許容される塩、又は、

(ii) 請求項 1 から 50 のいずれか一項に記載の化合物若しくはその薬学的に許容される塩；及び、薬学的に許容される添加物を含む、薬学的組成物 10

を含む、疾患又は状態を治療するための医薬であって、

治療を必要とする対象に、上記 (i) 又は (ii) の有効量が投与される、医薬。

## 【請求項 60】

疾患又は状態が急性呼吸窮迫症候群 ( A R D S ) である、請求項 59 に記載の医薬。

20

30

40

50