

【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26年9月11日(2014.9.11)

【公表番号】特表2013-536179(P2013-536179A)

【公表日】平成25年9月19日(2013.9.19)

【年通号数】公開・登録公報2013-051

【出願番号】特願2013-521954(P2013-521954)

【国際特許分類】

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/661 (2006.01)

C 0 7 F 9/09 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 413/12 C S P

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 27/06

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 45/00

C 0 7 D 413/14

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/661

C 0 7 F 9/09 U

【手続補正書】

【提出日】平成26年7月25日(2014.7.25)

【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

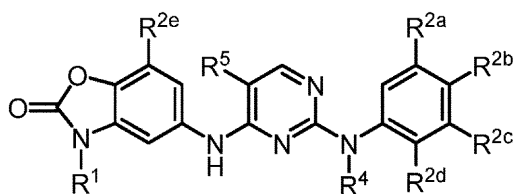
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式IAの化合物またはその塩:



IA

式中、

$R^1$ はH、置換されていてもよい $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C(O)-C_1 \sim 6$ アルキル、 $CO_2-C_1 \sim 6$ アルキルまたは $R^{50}$ であり；

各 $R^{50}$ は $-C(R^9)_2-A-R^{10}$ であり、ここでAはOまたはSであり；各 $R^9$ は出現ごとに独立してH、置換されていてもよい $C_1 \sim 6$ アルキル、置換されていてもよい $C_6 \sim 10$ アリールまたは置換されていてもよい $C_7 \sim 16$ アリールアルキルであり；あるいは、2個の $R^9$ は、それらが結合している炭素と一緒にあって、置換されていてもよい $C_3 \sim 8$ シクロアルキル基または置換されていてもよい3～8員ヘテロアリシクリルを形成し； $R^{10}$ は $R^a$ 、 $-P(O)(OR^{11})_2$ 、 $-P(O)(OR^{11})N(R^{12})_2$ または $-P(O)(N(R^{12})_2)_2$ であり；各 $R^{11}$ は出現ごとに独立して $R^a$ または一価のカチオン性基であり；あるいは、2個の $R^{11}$ は、それらが結合している原子と一緒にあって4～8員環状リン酸基を形成し；各 $R^{12}$ は出現ごとに独立して $R^c$ または $-C_1 \sim 3$ アルキル- $N(R^c)_2$ であり；あるいは、2個の $R^{12}$ は、それぞれ $-P(O)(N(R^{12})_2)_2$ の別々の窒素上にあり、それらが結合している原子と一緒にあって4～8員環状ホスホン酸ビスアミド基を形成し；あるいは、 $-P(O)(OR^{11})N(R^{12})_2$ 基の1個の $R^{12}$ と $R^{11}$ とは、それらが結合している原子と一緒にあって4～8員環状ホスホンアミデート基を形成し；

$R^{2a} \sim R^{2e}$ はそれぞれ出現ごとに独立してH、 $R^e$ 、 $R^b$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $R^e$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-OR^e$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-SR^e$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-C(O)R^e$ 、 $R^e$ が同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-N(R^a)R^e$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-S(O)_2R^e$ 、 $R^e$ が同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-N(R^a)-S(O)_2R^e$ 、 $-B(OR^a)_2$ 、 $-B(N(R^c)_2)_2$ 、 $-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-O-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-S-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-O-(C(R^b)_2)_m-R^a$ 、 $-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-O-(CH_2)_m-CH((CH_2)_mR^b)R^b$ 、 $-C(O)N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-O-(C(R^a)_2)_m-C(O)N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-N((C(R^a)_2)_mR^b)_2$ 、 $-S-(C(R^a)_2)_m-C(O)N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-N(R^a)-C(O)-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-N(R^a)-C(O)-(C(R^a)_2)_m-C(R^a)(R^b)_2$ または $-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-C(O)-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ であり；

各 $R^a$ は出現ごとに独立してH、重水素、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 8$ シクロアルキル、 $C_4 \sim 11$ シクロアルキルアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール、 $C_7 \sim 16$ アリールアルキル、2～6員ヘテロアルキル、3～10員ヘテロアリシクリル、4～11員ヘテロアリシクリルアルキル、5～15員ヘテロアリールまたは6～16員ヘテロアリールアルキルであり；

各 $R^b$ は出現ごとに独立して $=O$ 、 $-OR^a$ 、 $-O-(C(R^a)_2)_m-OR^a$ 、ハロ $C_1 \sim 3$ アルキルオキシ、 $=S$ 、 $-SR^a$ 、 $=NR^a$ 、 $=NOR^a$ 、 $-N(R^c)_2$ 、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NC$ 、 $-OCN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO$ 、 $-NO_2$ 、 $=N_2$ 、 $-N_3$ 、 $-S(O)R^a$ 、 $-S(O)_2R^a$ 、 $-SO_3R^a$ 、 $-S(O)N(R^c)_2$ 、 $-S(O)_2N(R^c)_2$ 、 $-OS(O)R^a$ 、 $-OS(O)_2R^a$ 、 $-OSO_3R^a$ 、 $-OS(O)_2N(R^c)_2$ 、 $-C(O)R^a$ 、 $-CO_2R^a$ 、 $-C(O)N(R^c)_2$ 、 $-C(NR^a)-N(R^c)_2$ 、 $-C(NOH)-R^a$ 、 $-C(NOH)-N(R^c)_2$ 、 $-OC(O)R^a$ 、 $-OC(O)OR^a$ 、 $-OC(O)N(R^c)_2$ 、 $-OC(NH)-N(R^c)_2$ 、 $-OC(NR^a)-N(R^c)_2$ 、 $-N(R^a)-S(O)_2H$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nR^a$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nOR^a$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nN(R^c)_2$ または $-[N(R^a)C(NR^a)]_n-N(R^c)_2$ であり；

各 $R^c$ は出現ごとに独立して $R^a$ であり、あるいは、2個の $R^c$ は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、3～10員ヘテロアリシクリルまたは5～10員ヘテロアリールであって、同一のまたは異なるさらなるヘテロ原子の1個または複数を含んでもよくかつ同一のまたは異なる $R^a$ および/または $R^d$ 基の1個または複数で置換されていてもよいヘテロア

リシクリルまたはヘテロアリールを形成し；

各 $R^d$ は=O、-OR<sup>a</sup>、ハロC<sub>1</sub>～<sub>3</sub>アルキルオキシ、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、=S、-SR<sup>a</sup>、=NR<sup>a</sup>、=NOR<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>、ハロ、-CF<sub>3</sub>、-CN、-NC、-OCN、-SCN、-NO、-NO<sub>2</sub>、=N<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、-S(O)R<sup>a</sup>、-S(O<sub>2</sub>)R<sup>a</sup>、-SO<sub>3</sub>R<sup>a</sup>、-S(O)N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>、-OS(O)R<sup>a</sup>、-OS(O)<sub>2</sub>R<sup>a</sup>、-OSO<sub>3</sub>R<sup>a</sup>、-OS(O)<sub>2</sub>N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>、-C(O)R<sup>a</sup>、-CO<sub>2</sub>R<sup>a</sup>、-C(O)N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>、-C(NR<sup>a</sup>)N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>、-C(NOH)R<sup>a</sup>、-C(NOH)N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>、-OCO<sub>2</sub>R<sup>a</sup>、-OC(O)N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>、-OC(NR<sup>a</sup>)N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>、-[N(R<sup>a</sup>)C(O)]<sub>n</sub>R<sup>a</sup>、-(C(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-OR<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)-S(O)<sub>2</sub>R<sup>a</sup>、-C(O)-C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>ハロアルキル、-S(O)<sub>2</sub>C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>ハロアルキル、-OC(O)R<sup>a</sup>、-O(C(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-OR<sup>a</sup>、-S(C(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-OR<sup>a</sup>、-N(R<sup>a</sup>)C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>ハロアルキル、-P(O)(OR<sup>a</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>a</sup>)-(C(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-OR<sup>a</sup>、-[N(R<sup>a</sup>)C(O)]<sub>n</sub>OR<sup>a</sup>、-[N(R<sup>a</sup>)C(O)]<sub>n</sub>N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>、-[N(R<sup>a</sup>)C(NR<sup>a</sup>)]<sub>n</sub>N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>または-N(R<sup>a</sup>)C(O)C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>ハロアルキルであり；あるいは2個の $R^d$ は、それらが結合している1個または複数の原子と一緒に結合して、3～10員の部分飽和または完全飽和の単環式環または二環式環を形成し、この環は1個または複数のヘテロ原子を含有していてもよくかつ1個または複数の $R^a$ で置換されていてもよく；

各 $R^e$ は出現ごとに独立してC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>4</sub>～<sub>11</sub>シクロアルキルアルキル、C<sub>6</sub>～<sub>10</sub>アリール、C<sub>7</sub>～<sub>16</sub>アリールアルキル、2～6員ヘテロアルキル、3～10員ヘテロアリシクリル、4～11員ヘテロアリシクリルアルキル、5～15員ヘテロアリールまたは6～16員ヘテロアリールアルキルであり；

各 $m$ は1、2または3であり；

各 $n$ は0、1、2または3であり；あるいは

$R^{2a} \sim R^{2d}$ 基の2つは、それらが結合している1個または複数の原子と一緒に結合して、4～10員の部分飽和または完全飽和の単環式環または二環式環を形成し、この環は1個または複数のヘテロ原子を含有していてもよくかつ1個または複数の $R^a$ および/または $R^b$ で置換されていてもよく；

$R^4$ はHまたは置換されていてもよいC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルであり；かつ

$R^5$ はH、ハロ、-CN、置換されていてもよいC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、ニトロ、-N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>、-C(O)N(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>R<sup>a</sup>または-C(O)R<sup>a</sup>である。

#### 【請求項 2】

$R^{2a}$ がHであり； $R^{2b}$ がC<sub>1</sub>～<sub>3</sub>アルキルであり； $R^{2c}$ が-OC<sub>1</sub>～<sub>3</sub>アルキルであり；かつ  $R^{2d}$ がFである、請求項1記載の化合物。

#### 【請求項 3】

$R^{2a}$ がHであり； $R^{2b}$ がCH<sub>3</sub>であり； $R^{2c}$ が-OCH<sub>3</sub>であり；かつ  $R^{2d}$ がFである、請求項2記載の化合物。

#### 【請求項 4】

$R^{2a}$ がHであり； $R^{2b}$ が-OC<sub>1</sub>～<sub>3</sub>アルキルであり； $R^{2c}$ が-OC<sub>1</sub>～<sub>3</sub>アルキルであり；かつ  $R^{2d}$ がHまたはFである、請求項1記載の化合物。

#### 【請求項 5】

$R^{2a}$ がHであり； $R^{2b}$ が-OC<sub>1</sub>～<sub>3</sub>アルキルであり； $R^{2c}$ が-OC<sub>1</sub>～<sub>3</sub>アルキルであり；かつ  $R^{2d}$ がFである、請求項4記載の化合物。

#### 【請求項 6】

$R^{2a}$ がHであり； $R^{2b}$ が-OCH<sub>3</sub>であり； $R^{2c}$ が-OCH<sub>3</sub>であり；かつ  $R^{2d}$ がFである、請求項5記載の化合物。

#### 【請求項 7】

$R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ がそれぞれ独立してCH<sub>3</sub>、-OCH<sub>3</sub>またはFであり；かつ  $R^{2d}$ がHまたはFである、請求項1記載の化合物。

#### 【請求項 8】

$R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の2つがCH<sub>3</sub>であり； $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の残りの1つがFであり；かつ  $R^{2d}$ がHまたはFである、請求項7記載の化合物。

#### 【請求項 9】

$R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の2つがCH<sub>3</sub>であり； $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の残りの1つが-OCH<sub>3</sub>であり；かつ  $R^{2d}$ がHまたはFである、請求項7記載の化合物。

## 【請求項 10】

$R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の2つが $-OCH_3$ であり； $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の残りの1つがFであり；かつ $R^{2d}$ がHまたはFである、請求項7記載の化合物。

## 【請求項 11】

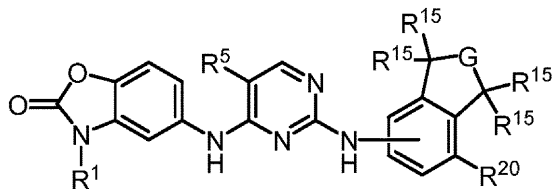
$R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の2つが $-OCH_3$ であり； $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の残りの1つが $CH_3$ であり；かつ $R^{2d}$ がHまたはFである、請求項7記載の化合物。

## 【請求項 12】

$R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の1つが $CH_3$ であり； $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の1つが $-OCH_3$ であり； $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の1つがFであり；かつ $R^{2d}$ がHまたはFである、請求項7記載の化合物。

## 【請求項 13】

構造式ICの、請求項1記載の化合物：



IC

式中、 $R^1$ はHまたは $R^{50}$ であり； $R^5$ はH、ハロ、 $-CN$ 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、ニトロ、 $-N(R^a)_2$ 、 $-C(O)N(R^a)_2$ 、 $-CO_2R^a$ または $-C(O)R^a$ であり； $R^{20}$ はHまたは $C_1 \sim 6$ アルキルであり；各 $R^{15}$ は独立してHまたは $C_1 \sim 6$ アルキルであり、あるいは2個の $R^{15}$ は同一炭素上で一緒になってオキソとなり；かつGはOまたはNHである。

## 【請求項 14】

$R^5$ がH、ハロまたは $C_1 \sim 6$ アルキルである、請求項13記載の化合物。

## 【請求項 15】

以下の化合物：

- I-1: 5-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)-2-メチルベンゾニトリルギ酸塩；
- I-2: 4-(4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)ベンズアミドトリフルオロ酢酸塩；
- I-3: 3-(4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)ベンズアミドトリフルオロ酢酸塩；
- I-4: 5-(5-クロロ-2-(フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩；
- I-5: 5-(5-クロロ-2-(3,4-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩；
- I-6: 5-(5-クロロ-2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩；
- I-7: 5-(5-クロロ-2-(2,4-ジフルオロ-3-メトキシフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩；
- I-8: 5-(5-クロロ-2-(3-クロロ-5-フルオロフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩；
- I-9: 5-(5-クロロ-2-(4-メチル-3-(トリフルオロメチル)フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン；
- I-10: 5-(5-クロロ-2-(3,5-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩；
- I-11: 4-(5-クロロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)ベンズアミドトリフルオロ酢酸塩；
- I-12: 5-(5-クロロ-2-(3-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン；

- I-13: 5-(2-(3,5-ジフルオロフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-14: 5-(5-クロロ-2-(3,5-ジフルオロフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-15: 5-(5-クロロ-2-(4-(トリフルオロメチル)フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-16: 5-(5-ブromo-2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;
- I-17: 5-[2-(3-ジメチルアミノ-4-メチル-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- I-18: 5-[5-エチニル-2-(3,4,5-トリメチル-フェニルアミノ)-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-19: 5-[2-(2-フルオロ-3-メトキシ-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- I-20: 5-(5-フルオロ-2-(2-フルオロ-3-メトキシフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-21: 5-(5-クロロ-2-(2-フルオロ-3-メトキシフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-22: 5-(5-ブromo-2-(2-フルオロ-3-メトキシフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-23: 5-(2-(2-フルオロ-3-メトキシフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-24: 5-[2-(3-ジメチルアミノ-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-25: 5-[2-(4-ジメチルアミノ-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- I-26: 5-[5-メチル-2-(メチル-フェニル-アミノ)-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- I-27: 5-[2-(4-ブromo-2-フルオロ-3-メトキシ-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- I-28: 5-[2-(4-ブromo-2-フルオロ-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- I-29: 5-[2-(2-フルオロ-3-メトキシ-4-メチル-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-30: {4-[5-メチル-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-2-イルアミノ]-フェニル}-アセトアルデヒド;
- I-31: 5-[2-(3-エチニル-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- I-32: 5-(5-クロロ-2-(3-メトキシ-4-メチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-33: 5-(5-クロロ-2-(3-(ジメチルアミノ)-4-メチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-34: 5-[2-(3-アミノ-4-メトキシ-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- I-35: 5-[5-メチル-2-(3,5-ジメチル-4-d<sub>3</sub>-メチル-フェニルアミノ)-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-36: 5-(5-クロロ-2-(3,5-ジメチル-4-d<sub>3</sub>-メチル)フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-37: 5-(5-フルオロ-2-(3,5-ジメチル-4-d<sub>3</sub>-メチル)フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

- I-38: 5-(2-(3,5-ジメチル-4- $d_3$ -メチル)フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-39: 4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-2-フェニルアミノ-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;
- I-40: 4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-2-(3,4,5-トリメチル-フェニルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;
- I-41: 5-(5-ニトロ-2-(フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-42: 5-(5-ニトロ-2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-43: 5-(2-(2,4-ジフルオロ-3-メトキシフェニルアミノ)-5-ニトロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-44: 5-(2-(3-メトキシ-4-メチルフェニルアミノ)-5-ニトロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-45: 5-(2-(3-(ジメチルアミノ)-4-メチルフェニルアミノ)-5-ニトロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-46: 5-(5-メチル-2-(3,5-ジメチル-4- $d_3$ -メチル)フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-47: 5-(2-(3-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニルアミノ)-5-ニトロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-48: 2-(2,4-ジフルオロ-3-メトキシ-フェニルアミノ)-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;
- I-49: 4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-2-(3,4,5-トリメチル-フェニルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸トリフルオロ酢酸塩;
- I-50: 5-[2-(2-フルオロ-3,4-ジメトキシ-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- I-51: 5-(5-クロロ-2-(2-フルオロ-3,4-ジメトキシフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-52: 5-(5-クロロ-2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-53: 5-{2-[2-フルオロ-3-(2-メトキシ-エトキシ)-4-メチル-フェニルアミノ]-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ}-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- I-54: 2-(4-カルバモイル-フェニルアミノ)-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;
- I-55: 2-(3-メトキシ-5-トリフルオロメチル-フェニルアミノ)-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;
- I-56: 2-(3-メトキシ-4-メチル-フェニルアミノ)-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;
- I-57: 2-(3-ジメチルアミノ-4-メチル-フェニルアミノ)-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;
- I-58: 2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチル-フェニルアミノ)-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;
- I-59: 2-(3-メトキシ-4,5-ジメチル-フェニルアミノ)-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;
- I-60: 4-(5-ニトロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピ

- リミジン-2-イルアミノ)ベンズアミドトリフルオロ酢酸塩;
- 1-61: 5-(5-フルオロ-2-(2-フルオロ-3-(2-メトキシエトキシ)-4-メチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-62: 5-(2-(2-フルオロ-3-(2-メトキシエトキシ)-4-メチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- 1-63: 5-[5-ヒドロキシメチル-2-(3,4,5-トリメチル-フェニルアミノ)-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- 1-64: 2,6-ジメチル-4-[5-メチル-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-2-イルアミノ]-ベンゾニトリルトリフルオロ酢酸塩;
- 1-65: 5-[5-メチル-2-(3-ビニル-フェニルアミノ)-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-66: 5-(5-クロロ-2-(2-フルオロ-3-(2-メトキシエトキシ)-4-メチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-67: 5-(5-クロロ-2-(2-フルオロ-3-メトキシ-4-メチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- 1-68: 5-[2-(4-エチル-2-フルオロ-3-メトキシ-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-69: 4-(5-クロロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)-2,6-ジメチルベンゾニトリル]トリフルオロ酢酸塩;
- 1-70: 4-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)-2,6-ジメチルベンゾニトリル;
- 1-71: 5-(5-クロロ-2-(4-エチル-2-フルオロ-3-メトキシフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-72: 2-フルオロ-3-(5-メチル-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)ベンゾニトリルトリフルオロ酢酸塩;
- 1-73: 3-(5-クロロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)-2-フルオロベンゾニトリルトリフルオロ酢酸塩;
- 1-74: 2-(4-フルオロ-3,5-ジメチルフェニルアミノ)-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-5-カルボン酸メチル トリフルオロ酢酸塩;
- 1-75: 5-(2-(2-フルオロ-4-メトキシフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-76: 5-(5-クロロ-2-(2-フルオロ-4-メトキシフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-77: 5-(2-(2-フルオロ-3,4-ビス(2-メトキシエトキシ)フェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-78: 5-(5-クロロ-2-(2-フルオロ-3,4-ビス(2-メトキシエトキシ)フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-79: 5-(2-(4-フルオロ-3,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-(ヒドロキシメチル)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-80: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-(ヒドロキシメチル)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-81: 5-(5-(ヒドロキシメチル)-2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-82: 5-(2-(3-(ジメチルアミノ)-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-83: 5-(5-クロロ-2-(3-(ジメチルアミノ)-4,5-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-84: 5-(2-(3-(ジエチルアミノ)-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;
- 1-85: 5-(2-(3-(エチルアミノ)-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イ

ルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;

I-86: 5-(5-クロロ-2-(3-(ジエチルアミノ)-4,5-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;

I-87: 5-(5-クロロ-2-(3-(エチルアミノ)-4,5-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;

I-88: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-7-(ベンゾ[d][1,3]ジオキサール-6-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

I-89: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-7-(ジメチルアミノ)メチル)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;

I-90: 7-((ジエチルアミノ)メチル)-5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;

I-91: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-7-(ピロリジン-1-イル)メチル)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

I-92: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-7-(ピペリジン-1-イル)メチル)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

I-93: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-7-(4-メチルピペラジン-1-イル)メチル)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

I-94: 4-((5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-2,3-ジヒドロ-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-7-イル)メチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチル;

I-95: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-7-(ピペラジン-1-イル)メチル)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;

I-96: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-7-(E)-3-クロロプロパ-1-エニル)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

I-97: 5-(5-((ジエチルアミノ)メチル)-2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;

I-98: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-((ピロリジン-1-イル)メチル)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

I-99: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-((ピペリジン-1-イル)メチル)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

I-100: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-((4-メチルピペラジン-1-イル)メチル)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

I-101: 5-(2-(3,4-ジエトキシ-2-フルオロフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

I-102: 5-(2-(2-フルオロ-3,4-d<sub>6</sub>-ジメトキシフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

I-103: 5-(2-(3-エトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;

I-104: 5-(5-クロロ-2-(3-エトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;

I-105: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

I-106: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンメタンスルホン酸塩;

I-107: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンベンゼンスルホン酸塩;

I-108: 5-(2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンベンゼンスルホン酸塩;

I-109: 5-(2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロトリフルオロ酢酸塩;



- I-110: 5-(5-フルオロ-2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-111: 5-(2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-7-フルオロベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロトリフルオロ酢酸塩;
- I-112: 7-フルオロ-5-(5-フルオロ-2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-113: 5-(2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-114: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン硫酸塩;
- I-115: リン酸(5-(2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-3(2H)-イル)メチルニナトリウム;
- I-116: 5-(2-(4-フルオロ-3-ヒドロキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-117: 5-(2-(3-ヒドロキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-118: リン酸二水素(5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-3(2H)-イル)メチルカルシウム塩;
- I-119: 5-(5-フルオロ-2-(2-フルオロ-5-メトキシフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-120: 5-(2-(3-フルオロ-5-メトキシ-4-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-121: 5-(5-フルオロ-2-(3-フルオロ-5-メトキシ-4-メチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-122: 5-(2-(2-フルオロ-5-メトキシ-4-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-123: 5-(5-フルオロ-2-(2-フルオロ-5-メトキシ-4-メチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-124: 5-(2-(4-クロロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-125: 5-(2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-3-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-126: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-3-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-127: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-3-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-128: 4-(4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)-5-メチルピリミジン-2-イルアミノ)-2-メトキシ-6-メチル安息香酸エチル;
- I-129: 4-(4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)-5-メチルピリミジン-2-イルアミノ)-2-メトキシ-6-メチルベンジルアルコールトリフルオロ酢酸塩;
- I-130: 5-メチル-N4-[3-(ホスホノオキシ)メチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-2,4-ピリミジンジアミンアルギニン塩;
- I-131: 5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-2,4-ピリミジンジアミンベンゼンスルホン酸塩;
- I-132: 5-メチル-N4-[3-(ホスホノオキシ)メチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-2,4-ピリミジンジアミントリス塩;
- I-133: N4-{3-[2-(N,N-ジメチルアミノ)エトキシ]ホスフィニルオキシメチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル}-5-メチル-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル

ル-2,4-ピリミジンジアミン;

I-134: N4-{3-ビス[2-(N,N-ジメチルアミノ)エトキシ]ホスフィニルオキシメチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル}-5-メチル-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-2,4-ピリミジンジアミン;

I-135: 5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-2,4-ピリミジンジアミンパモ酸塩;

I-136: 5-メチル-N4-[3-(ホスホノオキシ)メチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-2,4-ピリミジンジアミンニカリウム塩;

I-137: 5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-2,4-ピリミジンジアミンメタンスルホン酸塩;

I-138: N2-(3,5-ジメチル-4-メトキシカルボニル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-139: N2-エチル-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-140: N2-(4-カルボキシ-3,5-ジメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-141: N2-(4-ベンジルオキシカルボニル-3,5-ジメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-142: N2-(3,5-ジメチル-4-ヒドロキシメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-143: N2-(3,5-ジメチル-4-メトキシメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-144: N2-(3,4-ジメチル-5-メトキシカルボニル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-145: N2-(3-カルボキシ-4,5-ジメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-146: N2-(3,5-ジメチル-4-フルオロ)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミンベンゼンスルホン酸塩;

I-147: N2-(3,4-ジメチル-5-ヒドロキシメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-148: N2-(4-n-ブチル-3-メチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-149: N2-(4-ブromo-3,5-ジメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-150: N2-(4-tert-ブトキシカルボニル-3,5-ジメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-151: N2-(3,5-ジメチル-4-フルオロ)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン硫酸塩;

I-152: N2-(3-カルボキシ-4-メチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-153: N2-(4-フルオロ-3-メトキシカルボニル-5-メチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-154: N2-(4-フルオロ-3-ヒドロキシメチル-5-メチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-155: N2-(3-カルボキシ-4-フルオロ-5-メチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-156: 5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-2,4-ピリミジンジアミン塩酸塩;

I-157: 5-(2-(4-アセチルフェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[

d) オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;

I-158: 5-(2-(4-(1-(シクロプロピルアミノ)エチル)フェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;

I-159: N-シクロブチル-4-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)ベンズアミドギ酸塩;

I-160: 4-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)-N-プロピルベンズアミドギ酸塩;

I-161: N-シクロプロピル-4-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)ベンズアミドギ酸塩;

I-162: N-エチル-4-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)ベンズアミドギ酸塩;

I-163: 4-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)-N-イソプロピルベンズアミドギ酸塩;

I-164: N-シクロブチル-4-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)-2-メトキシベンズアミドギ酸塩;

I-165: N-シクロプロピル-4-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミドギ酸塩;

I-166: 4-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)-N-フェニル-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミドギ酸塩;

I-167: 5-(2-(4-メチル-3-(メチルスルホニル)フェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-168: 5-(2-(4-フルオロ-3-(メチルスルホニル)フェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-169: 5-(2-(3-フルオロ-5-モルホリノフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;

I-170: 5-(2-(3-フルオロ-5-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;

I-171: 3-(5-フルオロ-4-(7-メチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミドトリフルオロ酢酸塩;

I-172: 5-(2-(3-(メチルスルホニル)フェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-173: 5-(2-(4-フルオロ-3-(メチルスルホニル)フェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-174: 3-(5-フルオロ-4-(7-フルオロ-2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミドトリフルオロ酢酸塩;

I-175: 5-(5-フルオロ-2-(3-d<sub>3</sub>-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-176: 5-(2-(3-(トリフルオロメチル)-5-メトキシフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-177: 5-(2-(3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-178: 5-(2-(4-メトキシ-3-メチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-179: 5-(2-(3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-フルオロベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-180: 5-(2-(4-メトキシ-3-メチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-フルオロベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-181: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

- I-182: 5-(2-(3,4-ジメトキシ-5-メチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-183: 5-(2-(3,4-ジメトキシ-5-メチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-184: 5-(2-(3,4-ジメトキシ-5-メチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-フルオロベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-185: 5-(2-(3-クロロ-4,5-ジメトキシフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-186: 5-(2-(4-(2-モルホリノエトキシ)-3,5-ジメチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;
- I-187: 5-(2-(3,5-ジメチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-フルオロベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-188: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-フルオロベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-189: 5-(2-(4-フルオロ-3,5-ジメチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-フルオロベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-190: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-191: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-フルオロベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-192: 5-(2-(2,4-ジフルオロ-3-メトキシフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-193: 5-(2-(2,4-ジフルオロ-3-メトキシフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-フルオロベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-194: 5-(2-(3,5-ジメトキシ-4-メチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-195: 5-(2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-196: 5-(2-(4-メトキシフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;
- I-197: 5-(2-(3-(ジフルオロメチル)-4-メトキシフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;
- I-198: 5-(2-(3-(ジフルオロメチル)-5-メトキシフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-199: 5-(2-(3-(フルオロメチル)-5-メトキシフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-200: 5-(2-(4-イソプロピルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-201: 5-(2-(4-tert-ブチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-202: 5-(2-(p-トリルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-203: 5-(2-(4-メチル-3-(ピリジン-4-イル)フェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-204: 5-(2-(4-メチル-3-(ピリジン-3-イル)フェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-205: 5-(2-(4-フルオロ-3-(ピリジン-4-イル)フェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-206: 5-(2-(4-フルオロ-3-(ピリジン-3-イル)フェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

- I-207: 5-(2-(3-メトキシ-4-(ピリジン-4-イル)フェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;
- I-208: 5-(2-(4-メトキシ-3-(ピリジン-4-イル)フェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;
- I-209: 5-(2-(4-メトキシ-3-(ピリジン-3-イル)フェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;
- I-210: 5-フルオロ-N2-[3-(1-ヒドロキシ-2,2,2-トリフルオロエチル)]フェニル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;
- I-211: 5-フルオロ-N2-(3-メトキシ-5-トリフルオロメチル)フェニル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;
- I-212: 5-フルオロ-N2-(4-メトキシ-3-トリフルオロメチル)フェニル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;
- I-213: N2-[3-(シクロプロピルアミノカルボニルメトキシ)-4-メトキシ]フェニル-5-フルオロ-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;
- I-214: 5-フルオロ-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;
- I-215: N2-(3,5-ジメチル-4-フルオロ)フェニル-5-フルオロ-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;
- I-216: 5-メチル-N4-[3-(ホスホノオキシ)メチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-2,4-ピリミジンジアミンリジン塩;
- I-217: N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;
- I-218: 5-(2-(2,4-ジフルオロ-3-エチレンオキシフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-219: 5-(2-(2,4-ジフルオロ-3-イソプロポキシフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-220: 5-(2-(4-(アミノメチル)フェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-221: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-6-D-5-トリジュウテロメチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-222: 5-(2-(4-フルオロ-3-トリジュウテロメトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-6-D-5-トリジュウテロメチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-223: 5-(2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-6-D-5-トリジュウテロメチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-224: 5-(2-(3-トリジュウテロメトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-6-D-5-トリジュウテロメチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-225: 5-(2-(4-(ヒドロキシメチル)-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-6-D-5-トリジュウテロメチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-226: リン酸5-(2-(4-フルオロ-3-トリジュウテロメトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-6-D-5-トリジュウテロメチルピリミジン-4-イルアミノ)-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-3(2H)-イル)メチル ジ-tert-ブチル;
- I-227: リン酸水素5-(2-(4-フルオロ-3-トリジュウテロメトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-6-D-5-トリジュウテロメチルピリミジン-4-イルアミノ)-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-3(2H)-イル)メチル tert-ブチル;
- I-228: リン酸二水素5-(2-(4-フルオロ-3-トリジュウテロメトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-6-D-5-トリジュウテロメチルピリミジン-4-イルアミノ)-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-3(2H)-イル)メチル;
- I-229: リン酸(5-(2-(4-フルオロ-3-トリジュウテロメトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-6-D-5-トリジュウテロメチルピリミジン-4-イルアミノ)-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール

-3(2H)-イル)メチルニナトリウム;

I-230: 4-(4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)-5-メチルピリミジン-2-イルアミノ)-2-メトキシ-6-メチルベンジルアルコール; または

I-231: 4-(4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)-5-メチルピリミジン-2-イルアミノ)-2-メトキシ-6-メチル安息香酸。

【請求項 16】

以下の化合物:

II-1: 5-(5-フルオロ-2-(1-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-6-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

II-2: 5-(5-フルオロ-2-(7-(ピロリジン-1-イル)-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ[7]アヌレン-2-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンニギ酸塩;

II-3: 5-(5-フルオロ-2-(7-オキソ-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ[7]アヌレン-2-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンニギ酸塩;

II-4: (Z)-5-(5-フルオロ-2-(2-メチル-1-オキソ-1,2,3,6-テトラヒドロベンゾ[c]アゾシン-9-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;

II-5: 5-(5-フルオロ-2-(5-オキソ-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ[7]アヌレン-2-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;

II-6: 5-(2-(ナフタレン-2-イルアミノ)-5-ニトロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

II-7: 2-(ナフタレン-2-イルアミノ)-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;

II-8: 5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-N2-(1-オキソ-1,3-ジヒドロ-イソベンゾフラン-6-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

II-9: N2-(1,3-ジヒドロ-イソベンゾフラン-5-イル)-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

II-10: 5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-N2-(1-オキソ-1,3-ジヒドロ-イソベンゾフラン-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

II-11: 5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-N2-(1-オキソ-1,3-ジヒドロ-2H-イソインドール-6-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

II-12: 5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-N2-(1-オキソ-1,3-ジヒドロ-7-メチルイソベンゾフラン-4-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

II-13: 5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-N2-(1-オキソ-1,3-ジヒドロ-4-メチルイソベンゾフラン-6-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

II-23: 5-(5-フルオロ-2-(1-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンゾ[c]アゼピン-7-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;

II-24: 5-(5-フルオロ-2-(2-メチル-1-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンゾ[c]アゼピン-7-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;

II-25: 7-(4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)-5-フルオロピリミジン-2-イルアミノ)-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-3(4H)-オンギ酸塩;

II-26: 6-(4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)-5-フルオロピリミジン-2-イルアミノ)-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オントリフルオロ酢酸塩;

II-27: 7-(4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)-5-フルオロピリミジン-2-イルアミノ)-4,5-ジヒドロ-1H-ベンゾ[b]アゼピン-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩; または

II-28: 7-(4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)-5-フルオロピリミジン-2-イルアミノ)-4,5-ジヒドロ-1-メチル-1H-ベンゾ[b]アゼピン-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩。

【請求項 17】

以下の化合物:

II-14: N2-(4,5-ジメチルピリジン-2-イル)-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

II-15: N2-(4,6-ジメチルピリジン-2-イル)-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

II-16: N2-(5-シアノ-6-メチルピリジン-2-イル)-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

II-17: N2-(2-メトキシピリジン-4-イル)-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

II-18: 5-メチル-N2-(2-メチルピリジン-4-イル)-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

II-19: N2-(2,6-ジメチルピリジン-4-イル)-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

II-20: N2-(6-メトキシピリジン-2-イル)-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

II-21: N2-(5,6-ジメチルピリジン-2-イル)-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

II-22: N2-(5-シアノ-4-メチルピリジン-2-イル)-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

II-29: 5-(5-メチル-2-(2-モルホリノピリジン-4-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;

II-30: 5-(5-フルオロ-2-(2-モルホリノピリジン-4-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩; または

II-31: 5-(5-メチル-2-(ピリジン-4-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩。

【請求項 18】

請求項1、15、16または17のいずれか一項記載の化合物を含む薬学的組成物。

【請求項 19】

JAKキナーゼの活性を阻害するために有効な量の請求項1、15、16または17記載の化合物を含む、JAKキナーゼの活性を阻害するための薬学的組成物。

【請求項 20】

T細胞媒介性自己免疫疾患を処置するために有効な量の請求項1、15、16または17記載の化合物を含む、T細胞媒介性自己免疫疾患を処置するための薬学的組成物。

【請求項 21】

化合物が、10  $\mu$ M未満のIC<sub>50</sub>でSykキナーゼを阻害する化合物もしくは薬学的組成物との組み合わせでまたはそれと併用して投与されるように用いられる、請求項20記載の薬学的組成物。

【請求項 22】

移植レシピエントにおける同種移植拒絶反応を処置または予防するために有効な量の請求項1、15、16または17記載の化合物を含む、移植レシピエントにおける同種移植拒絶反応を処置または予防するための薬学的組成物。

【請求項 23】

同種移植が腎臓移植、心臓移植、肝臓移植または肺移植である、請求項22記載の薬学的組成物。

【請求項 24】

化合物が、別の免疫抑制剤との組み合わせでまたはそれと併用して投与されるように用いられる、請求項22記載の薬学的組成物。

【請求項 25】

IV型過敏症反応を処置または予防するために有効な量の請求項1、15、16または17記載の化合物を含む、IV型過敏症反応を処置または予防するための薬学的組成物。

【請求項 26】

JAKキナーゼ媒介性疾患を処置または予防するために有効な量の請求項1、15、16または17記載の化合物を含む、JAKキナーゼ媒介性疾患を処置または予防するための薬学的組成物。

【請求項27】

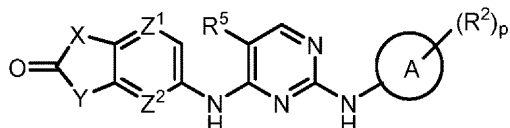
眼の疾患および/または障害を処置するために有効な量の請求項1、15、16または17記載の化合物を含む、眼の疾患および/または障害を処置するための薬学的組成物。

【請求項28】

眼の疾患および/または障害がドライアイ症候群、ぶどう膜炎、アレルギー性結膜炎、緑内障または酒さである、請求項27記載の薬学的組成物。

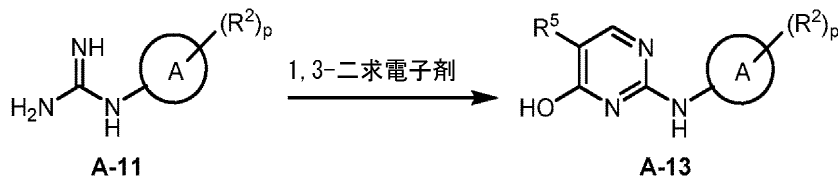
【請求項29】

以下の工程を含む、式A-6の化合物を作製する方法：



A-6

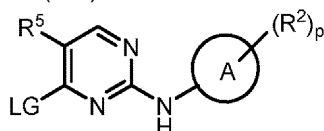
(i) 式A-13の4-ヒドロキシ-ピリミジン-2イル-アミンを作製するために、式A-11のグアニジンと1,3-二求電子剤とを反応させる工程；



A-11

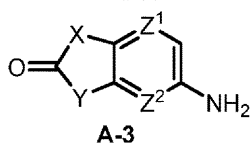
A-13

(ii) A-13を式A-14の4-脱離基-ピリミジン-2イル-アミンに変換する工程；および



A-14

(iii) 4-脱離基-ピリミジン-2イル-アミンA-14とアリールまたはヘテロアリールアミンA-3とを反応させる工程；



A-3

式中、

XおよびYは各々独立してO、S、S(O)、SO<sub>2</sub>またはNR<sup>1</sup>であり；

各R<sup>1</sup>は出現ごとに独立してH、置換されていてもよいC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル、C(O)-C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル、CO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキルまたはR<sup>50</sup>であり；

各R<sup>50</sup>は-C(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>-A-R<sup>10</sup>であり、ここでAはOまたはSであり；各R<sup>9</sup>は出現ごとに独立してH、置換されていてもよいC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル、置換されていてもよいC<sub>6</sub>~<sub>10</sub>アリールまたは置換されていてもよいC<sub>7</sub>~<sub>16</sub>アリールアルキルであり；あるいは、2個のR<sup>9</sup>は、それらが結合している炭素と一緒にあって、置換されていてもよいC<sub>3</sub>~<sub>8</sub>シクロアルキル基または置換されていてもよい3~8員ヘテロアリシクリルを形成し；R<sup>10</sup>はR<sup>a</sup>、-P(O)(OR<sup>11</sup>)<sub>2</sub>、-P(O)(OR<sup>11</sup>)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>または-P(O)(N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>)<sub>2</sub>であり；各R<sup>11</sup>は出現ごとに独立してR<sup>a</sup>または一価のカチオン性基であり；あるいは、2個のR<sup>11</sup>は、それらが結合している原子と一緒にあって4~8員環状リン酸基を形成し、あるいは、2個のR<sup>11</sup>は一緒にあって二価のカチオン性基となり；各R<sup>12</sup>は出現ごとに独立してR<sup>c</sup>または-C<sub>1</sub>~<sub>3</sub>アルキル-N(R<sup>c</sup>)<sub>2</sub>であり；あるいは、2個のR<sup>12</sup>は、それぞれ-P(O)(N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>)<sub>2</sub>の別々の窒素上にあり、それらが結合している原子と一緒にあって4~8員環状ホスホン酸ビスアミド基を形成し；あるいは、-P(O)(OR<sup>11</sup>)N



( $R^{12}$ )<sub>2</sub>基の1個の $R^{12}$ と $R^{11}$ とは、それらが結合している原子と一緒にあって4～8員環状ホスホンアミデート基を形成し；

A環は $C_6 \sim 10$ アリールまたは5～10員ヘテロアリールであり；

各 $R^2$ は出現ごとに独立してH、 $R^e$ 、 $R^b$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $R^e$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-OR^e$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-SR^e$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-C(O)R^e$ 、 $R^e$ が同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-N(R^a)R^e$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-S(O)_2R^e$ 、 $R^e$ が同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-N(R^a)-S(O)_2R^e$ 、 $-B(OR^a)_2$ 、 $-B(N(R^c)_2)_2$ 、 $-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-O-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-S-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-O-(C(R^b)_2)_m-R^a$ 、 $-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-O-(CH_2)_m-CH((CH_2)_mR^b)R^b$ 、 $-C(O)N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-O-(C(R^a)_2)_m-C(O)N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-N((C(R^a)_2)_mR^b)_2$ 、 $-S-(C(R^a)_2)_m-C(O)N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-N(R^a)-C(O)-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-N(R^a)-C(O)-(C(R^a)_2)_m-C(R^a)(R^b)_2$ または $-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-C(O)-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ であり；

各 $R^a$ は出現ごとに独立してH、重水素、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 8$ シクロアルキル、 $C_4 \sim 11$ シクロアルキルアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール、 $C_7 \sim 16$ アリールアルキル、2～6員ヘテロアルキル、3～10員ヘテロアリシクリル、4～11員ヘテロアリシクリルアルキル、5～15員ヘテロアリールまたは6～16員ヘテロアリールアルキルであり；

各 $R^b$ は出現ごとに独立して $=O$ 、 $-OR^a$ 、 $-O-(C(R^a)_2)_m-OR^a$ 、ハロ $C_1 \sim 3$ アルキルオキシ、 $=S$ 、 $-SR^a$ 、 $=NR^a$ 、 $=NOR^a$ 、 $-N(R^c)_2$ 、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NC$ 、 $-OCN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO$ 、 $-NO_2$ 、 $=N_2$ 、 $-N_3$ 、 $-S(O)R^a$ 、 $-S(O)_2R^a$ 、 $-SO_3R^a$ 、 $-S(O)N(R^c)_2$ 、 $-S(O)_2N(R^c)_2$ 、 $-OS(O)R^a$ 、 $-OS(O)_2R^a$ 、 $-OSO_3R^a$ 、 $-OS(O)_2N(R^c)_2$ 、 $-C(O)R^a$ 、 $-CO_2R^a$ 、 $-C(O)N(R^c)_2$ 、 $-C(NR^a)-N(R^c)_2$ 、 $-C(NOH)-R^a$ 、 $-C(NOH)-N(R^c)_2$ 、 $-OC(O)R^a$ 、 $-OC(O)OR^a$ 、 $-OC(O)N(R^c)_2$ 、 $-OC(NH)-N(R^c)_2$ 、 $-OC(NR^a)-N(R^c)_2$ 、 $-N(R^a)-S(O)_2H$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nR^a$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nOR^a$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nN(R^c)_2$ または $-[N(R^a)C(NR^a)]_n-N(R^c)_2$ であり；

各 $R^c$ は出現ごとに独立して $R^a$ であり、あるいは、2個の $R^c$ は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、3～10員ヘテロアリシクリルまたは5～10員ヘテロアリールであって、同一のまたは異なるさらなるヘテロ原子の1個または複数を含んでもよくかつ同一のまたは異なる $R^a$ および/または $R^d$ 基の1個または複数で置換されていてもよいヘテロアリシクリルまたはヘテロアリールを形成し；

各 $R^d$ は $=O$ 、 $-OR^a$ 、ハロ $C_1 \sim 3$ アルキルオキシ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $=S$ 、 $-SR^a$ 、 $=NR^a$ 、 $=NOR^a$ 、 $-N(R^a)_2$ 、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NC$ 、 $-OCN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO$ 、 $-NO_2$ 、 $=N_2$ 、 $-N_3$ 、 $-S(O)R^a$ 、 $-S(O)_2R^a$ 、 $-SO_3R^a$ 、 $-S(O)N(R^a)_2$ 、 $-S(O)_2N(R^a)_2$ 、 $-OS(O)R^a$ 、 $-OS(O)_2R^a$ 、 $-OSO_3R^a$ 、 $-OS(O)_2N(R^a)_2$ 、 $-C(O)R^a$ 、 $-CO_2R^a$ 、 $-C(O)N(R^a)_2$ 、 $-C(NR^a)N(R^a)_2$ 、 $-C(NOH)R^a$ 、 $-C(NOH)N(R^a)_2$ 、 $-OCO_2R^a$ 、 $-OC(O)N(R^a)_2$ 、 $-OC(NR^a)N(R^a)_2$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nR^a$ 、 $-(C(R^a)_2)_n-OR^a$ 、 $-N(R^a)-S(O)_2R^a$ 、 $-C(O)-C_1 \sim 6$ ハロアルキル、 $-S(O)_2C_1 \sim 6$ ハロアルキル、 $-OC(O)R^a$ 、 $-O(C(R^a)_2)_m-OR^a$ 、 $-S(C(R^a)_2)_m-OR^a$ 、 $-N(R^a)C_1 \sim 6$ ハロアルキル、 $-P(O)(OR^a)_2$ 、 $-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-OR^a$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nOR^a$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nN(R^a)_2$ 、 $-[N(R^a)C(NR^a)]_nN(R^a)_2$ または $-N(R^a)C(O)C_1 \sim 6$ ハロアルキルであり；2個の $R^d$ は、それらが結合している1個または複数の原子と一緒にあって結合して、3～10員の部分飽和または完全飽和の単環式環または二環式環を形成し、この環は1個または複数のヘテロ原子を含有していてもよくかつ1個または複数の $R^a$ で置換されていてもよく；

各 $R^e$ は出現ごとに独立して $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 8$ シクロアルキル、 $C_4 \sim 11$ シクロアルキルアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール、 $C_7 \sim 16$ アリールアルキル、2～6員ヘテロアルキル、3～10員ヘテロアリシクリル、4～11員ヘテロアリシクリルアルキル、5～15員ヘテロアリールまたは6～16員ヘテロアリールアルキルであり；

pは0、1、2、3または4であり；

各mは1、2または3であり；

各nは0、1、2または3であり；

2個の $R^2$ 基は、それらが結合している1個または複数の原子と一緒に結合して、4～10員の部分飽和または完全飽和の単環式環または二環式環を形成し、この環は1個または複数のヘテロ原子を含有していてもよくかつ1個または複数の $R^a$ および/または $R^b$ で置換されていてもよく；

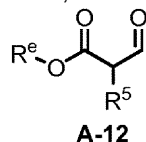
$Z^1$ および $Z^2$ は各々独立してCH、 $CR^2$ またはNであり；

$R^5$ はH、ハロ、-CN、置換されていてもよい $C_1 \sim 6$ アルキル、アルキニル、ヒドロキシ、置換されていてもよい $C_1 \sim 6$ アルコキシ、ニトロ、 $-N(R^a)_2$ 、 $-C(O)N(R^a)_2$ 、 $-CO_2R^a$ または $-C(O)R^a$ であり；

LGはハロゲン、アリアルスルホネート、アルキルスルホネート、ホスホネート、アジドまたは $-S(O)_0 \sim 2R^e$ である。

【請求項 3 0】

1,3-二求電子剤が、式A-12：



の -アルデヒドエステルである、請求項29記載の方法。

【請求項 3 1】

式A-13の4-ヒドロキシ-ピリミジン-2イル-アミンを作製するために式A-11のグアニジンと式A-12の -アルデヒドエステルとを反応させる工程が、アルコール溶媒中、塩基の存在下で加熱することを含む、請求項30記載の方法。

【請求項 3 2】

アルコール溶媒がエタノールであり、塩基がナトリウムエトキシドであり、反応液が約40 ～ 約80 に約24時間～約48時間加熱される、請求項31記載の方法。

【請求項 3 3】

LGがクロリドである、請求項29記載の方法。

【請求項 3 4】

A-13を式A-14の4-脱離基-ピリミジン-2イル-アミンに変換する工程が $POCl_3$ の存在下でA-13を加熱することを含む、請求項33記載の方法。

【請求項 3 5】

XがOであり；Yが $NR^1$ であり； $Z^1$ および $Z^2$ がそれぞれCHである、請求項33記載の方法。

【請求項 3 6】

4-脱離基-ピリミジン-2イル-アミンA-14とアリアルまたはヘテロアリアルアミンA-3とを反応させる工程がA-14とA-3との混合物を溶媒中、酸の存在下で約60 ～ 約80 で加熱することを含む、請求項35記載の方法。

【請求項 3 7】

溶媒がイソプロパノールであり、酸がトリフルオロ酢酸である、請求項36記載の方法。

【請求項 3 8】

A環がフェニルである、請求項36記載の方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 2 2

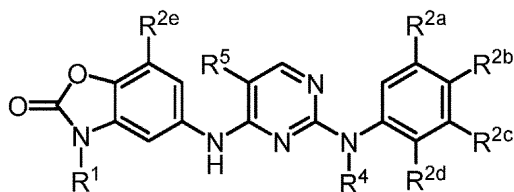
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 2 2】

[本発明1001]

式IAの化合物またはその塩：



IA

式中、

$R^1$ はH、置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル、 $C(O)-C_{1-6}$ アルキル、 $CO_2-C_{1-6}$ アルキルまたは $R^{50}$ であり；

各 $R^{50}$ は $-C(R^9)_2-A-R^{10}$ であり、ここでAはOまたはSであり；各 $R^9$ は出現ごとに独立してH、置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{6-10}$ アリールまたは置換されていてもよい $C_{7-16}$ アリールアルキルであり；あるいは、2個の $R^9$ は、それらが結合している炭素と一緒にあって、置換されていてもよい $C_{3-8}$ シクロアルキル基または置換されていてもよい3~8員ヘテロアリシクリルを形成し； $R^{10}$ は $R^a$ 、 $-P(O)(OR^{11})_2$ 、 $-P(O)(OR^{11})N(R^{12})_2$ または $-P(O)(N(R^{12})_2)_2$ であり；各 $R^{11}$ は出現ごとに独立して $R^a$ または一価のカチオン性基であり；あるいは、2個の $R^{11}$ は、それらが結合している原子と一緒にあって4~8員環状リン酸基を形成し；各 $R^{12}$ は出現ごとに独立して $R^c$ または $-C_{1-3}$ アルキル- $N(R^c)_2$ であり；あるいは、2個の $R^{12}$ は、それぞれ $-P(O)(N(R^{12})_2)_2$ の別々の窒素上にあり、それらが結合している原子と一緒にあって4~8員環状ホスホン酸ビスアミド基を形成し；あるいは、 $-P(O)(OR^{11})N(R^{12})_2$ 基の1個の $R^{12}$ と $R^{11}$ とは、それらが結合している原子と一緒にあって4~8員環状ホスホンアミデート基を形成し；

$R^{2a-2e}$ はそれぞれ出現ごとに独立してH、 $R^e$ 、 $R^b$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $R^e$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-OR^e$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-SR^e$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-C(O)R^e$ 、 $R^e$ が同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-N(R^a)R^e$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-S(O)_2R^e$ 、 $R^e$ が同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-N(R^a)-S(O)_2R^e$ 、 $-B(OR^a)_2$ 、 $-B(N(R^c)_2)_2$ 、 $-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-O-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-S-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-O-(C(R^b)_2)_m-R^a$ 、 $-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-O-(CH_2)_m-CH((CH_2)_mR^b)R^b$ 、 $-C(O)N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-O-(C(R^a)_2)_m-C(O)N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-N((C(R^a)_2)_mR^b)_2$ 、 $-S-(C(R^a)_2)_m-C(O)N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-N(R^a)-C(O)-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-N(R^a)-C(O)-(C(R^a)_2)_m-C(R^a)(R^b)_2$ または $-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-C(O)-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ であり；

各 $R^a$ は出現ごとに独立してH、重水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{4-11}$ シクロアルキルアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{7-16}$ アリールアルキル、2~6員ヘテロアルキル、3~10員ヘテロアリシクリル、4~11員ヘテロアリシクリルアルキル、5~15員ヘテロアリールまたは6~16員ヘテロアリールアルキルであり；

各 $R^b$ は出現ごとに独立して $=O$ 、 $-OR^a$ 、 $-O-(C(R^a)_2)_m-OR^a$ 、ハロ $C_{1-3}$ アルキルオキシ、 $=S$ 、 $-SR^a$ 、 $=NR^a$ 、 $=NOR^a$ 、 $-N(R^c)_2$ 、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NC$ 、 $-OCN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO$ 、 $-NO_2$ 、 $=N_2$ 、 $-N_3$ 、 $-S(O)R^a$ 、 $-S(O)_2R^a$ 、 $-SO_3R^a$ 、 $-S(O)N(R^c)_2$ 、 $-S(O)_2N(R^c)_2$ 、 $-OS(O)R^a$ 、 $-OS(O)_2R^a$ 、 $-OSO_3R^a$ 、 $-OS(O)_2N(R^c)_2$ 、 $-C(O)R^a$ 、 $-CO_2R^a$ 、 $-C(O)N(R^c)_2$ 、 $-C(NR^a)-N(R^c)_2$ 、 $-C(NOH)-R^a$ 、 $-C(NOH)-N(R^c)_2$ 、 $-OC(O)R^a$ 、 $-OC(O)OR^a$ 、 $-OC(O)N(R^c)_2$ 、 $-OC(NH)-N(R^c)_2$ 、 $-OC(NR^a)-N(R^c)_2$ 、 $-N(R^a)-S(O)_2H$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nR^a$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nOR^a$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nN(R^c)_2$ または $-[N(R^a)C(NR^a)]_n-N(R^c)_2$ であり；

各 $R^c$ は出現ごとに独立して $R^a$ であり、あるいは、2個の $R^c$ は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、3~10員ヘテロアリシクリルまたは5~10員ヘテロアリールであって、同一のまたは異なるさらなるヘテロ原子の1個または複数を含んでもよくかつ同一のまたは異なる $R^a$ および/または $R^d$ 基の1個または複数で置換されていてもよいヘテロア

リシクリルまたはヘテロアリールを形成し；

各 $R^d$ は $=O$ 、 $-OR^a$ 、ハロ $C_{1-3}$ アルキルオキシ、 $C_{1-6}$ アルキル、 $=S$ 、 $-SR^a$ 、 $=NR^a$ 、 $=NOR^a$ 、 $-N(R^a)_2$ 、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NC$ 、 $-OCN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO$ 、 $-NO_2$ 、 $=N_2$ 、 $-N_3$ 、 $-S(O)R^a$ 、 $-S(O)_2R^a$ 、 $-SO_3R^a$ 、 $-S(O)N(R^a)_2$ 、 $-S(O)_2N(R^a)_2$ 、 $-OS(O)R^a$ 、 $-OS(O)_2R^a$ 、 $-OSO_3R^a$ 、 $-OS(O)_2N(R^a)_2$ 、 $-C(O)R^a$ 、 $-CO_2R^a$ 、 $-C(O)N(R^a)_2$ 、 $-C(NR^a)N(R^a)_2$ 、 $-C(NOH)R^a$ 、 $-C(NOH)N(R^a)_2$ 、 $-OCO_2R^a$ 、 $-OC(O)N(R^a)_2$ 、 $-OC(NR^a)N(R^a)_2$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nR^a$ 、 $-(C(R^a)_2)_n-OR^a$ 、 $-N(R^a)-S(O)_2R^a$ 、 $-C(O)-C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-S(O)_2C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-OC(O)R^a$ 、 $-O(C(R^a)_2)_m-OR^a$ 、 $-S(C(R^a)_2)_m-OR^a$ 、 $-N(R^a)C_{1-6}$ ハロアルキル、 $-P(O)(OR^a)_2$ 、 $-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-OR^a$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nOR^a$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nN(R^a)_2$ 、 $-[N(R^a)C(NR^a)]_nN(R^a)_2$ または $-N(R^a)C(O)C_{1-6}$ ハロアルキルであり；2個の $R^d$ は、それらが結合している1個または複数の原子と一緒にになって結合して、3～10員の部分飽和または完全飽和の単環式環または二環式環を形成し、この環は1個または複数のヘテロ原子を含有していてもよくかつ1個または複数の $R^a$ で置換されていてもよく；

各 $R^e$ は出現ごとに独立して $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{4-11}$ シクロアルキルアルキル、 $C_{6-10}$ アリール、 $C_{7-16}$ アリールアルキル、2～6員ヘテロアルキル、3～10員ヘテロアリシクリル、4～11員ヘテロアリシクリルアルキル、5～15員ヘテロアリールまたは6～16員ヘテロアリールアルキルであり；

各 $m$ は1、2または3であり；

各 $n$ は0、1、2または3であり；

$R^{2a} \sim R^{2d}$ 基の2つは、それらが結合している1個または複数の原子と一緒にになって結合して、4～10員の部分飽和または完全飽和の単環式環または二環式環を形成し、この環は1個または複数のヘテロ原子を含有していてもよくかつ1個または複数の $R^a$ および/または $R^b$ で置換されていてもよく；

$R^4$ はHまたは置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルであり；かつ

$R^5$ はH、ハロ、 $-CN$ 、置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル、ニトロ、 $-N(R^a)_2$ 、 $-C(O)N(R^a)_2$ 、 $-CO_2R^a$ または $-C(O)R^a$ である。

[本発明1002]

$R^{2a}$ がHであり； $R^{2b}$ が $C_{1-3}$ アルキルであり； $R^{2c}$ が $-OC_{1-3}$ アルキルであり；かつ  $R^{2d}$ がFである、本発明1001の化合物。

[本発明1003]

$R^{2a}$ がHであり； $R^{2b}$ が $CH_3$ であり； $R^{2c}$ が $-OCH_3$ であり；かつ  $R^{2d}$ がFである、本発明1002の化合物。

[本発明1004]

$R^{2a}$ がHであり； $R^{2b}$ が $-OC_{1-3}$ アルキルであり； $R^{2c}$ が $-OC_{1-3}$ アルキルであり；かつ  $R^{2d}$ がHまたはFである、本発明1001の化合物。

[本発明1005]

$R^{2a}$ がHであり； $R^{2b}$ が $-OC_{1-3}$ アルキルであり； $R^{2c}$ が $-OC_{1-3}$ アルキルであり；かつ  $R^{2d}$ がFである、本発明1004の化合物。

[本発明1006]

$R^{2a}$ がHであり； $R^{2b}$ が $-OCH_3$ であり； $R^{2c}$ が $-OCH_3$ であり；かつ  $R^{2d}$ がFである、本発明1005の化合物。

[本発明1007]

$R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ がそれぞれ独立して $CH_3$ 、 $-OCH_3$ またはFであり；かつ  $R^{2d}$ がHまたはFである、本発明1001の化合物。

[本発明1008]

$R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の2つが $CH_3$ であり； $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の残りの1つがFであり；かつ  $R^{2d}$ がHまたはFである、本発明1007の化合物。

[本発明1009]

$R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の2つが $CH_3$ であり； $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の残りの1つが $-OCH_3$ であり；かつ  $R^{2d}$ がHまたはFである、本発明1007の化合物。

[本発明1010]

$R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の2つが $-OCH_3$ であり； $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の残りの1つがFであり；かつ $R^{2d}$ がHまたはFである、本発明1007の化合物。

[本発明1011]

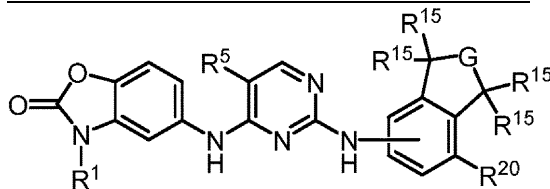
$R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の2つが $-OCH_3$ であり； $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の残りの1つが $CH_3$ であり；かつ $R^{2d}$ がHまたはFである、本発明1007の化合物。

[本発明1012]

$R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の1つが $CH_3$ であり； $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の1つが $-OCH_3$ であり； $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ および $R^{2c}$ の1つがFであり；かつ $R^{2d}$ がHまたはFである、本発明1007の化合物。

[本発明1013]

構造式ICの、本発明1001の化合物：



IC

式中、 $R^1$ はHまたは $R^{50}$ であり； $R^5$ はH、ハロ、 $-CN$ 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、ニトロ、 $-N(R^a)_2$ 、 $-C(O)N(R^a)_2$ 、 $-CO_2R^a$ または $-C(O)R^a$ であり； $R^{20}$ はHまたは $C_1 \sim 6$ アルキルであり；各 $R^{15}$ は独立してHまたは $C_1 \sim 6$ アルキルであり、あるいは2個の $R^{15}$ は同一炭素上で一緒になってオキソとなり；かつGはOまたはNHである。

[本発明1014]

$R^5$ がH、ハロまたは $C_1 \sim 6$ アルキルである、本発明1013の化合物。

[本発明1015]

以下の化合物：

I-1: 5-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)-2-メチルベンゾニトリル酢酸塩；

I-2: 4-(4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)ベンズアミドトリフルオロ酢酸塩；

I-3: 3-(4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)ベンズアミドトリフルオロ酢酸塩；

I-4: 5-(5-クロロ-2-(フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩；

I-5: 5-(5-クロロ-2-(3,4-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩；

I-6: 5-(5-クロロ-2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩；

I-7: 5-(5-クロロ-2-(2,4-ジフルオロ-3-メトキシフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩；

I-8: 5-(5-クロロ-2-(3-クロロ-5-フルオロフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩；

I-9: 5-(5-クロロ-2-(4-メチル-3-(トリフルオロメチル)フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン；

I-10: 5-(5-クロロ-2-(3,5-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩；

I-11: 4-(5-クロロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)ベンズアミドトリフルオロ酢酸塩；

I-12: 5-(5-クロロ-2-(3-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン；

- I-13: 5-(2-(3,5-ジフルオロフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-14: 5-(5-クロロ-2-(3,5-ジフルオロフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-15: 5-(5-クロロ-2-(4-(トリフルオロメチル)フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-16: 5-(5-ブromo-2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;
- I-17: 5-[2-(3-ジメチルアミノ-4-メチル-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- I-18: 5-[5-エチニル-2-(3,4,5-トリメチル-フェニルアミノ)-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-19: 5-[2-(2-フルオロ-3-メトキシ-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- I-20: 5-(5-フルオロ-2-(2-フルオロ-3-メトキシフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-21: 5-(5-クロロ-2-(2-フルオロ-3-メトキシフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-22: 5-(5-ブromo-2-(2-フルオロ-3-メトキシフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-23: 5-(2-(2-フルオロ-3-メトキシフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-24: 5-[2-(3-ジメチルアミノ-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-25: 5-[2-(4-ジメチルアミノ-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- I-26: 5-[5-メチル-2-(メチル-フェニル-アミノ)-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- I-27: 5-[2-(4-ブromo-2-フルオロ-3-メトキシ-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- I-28: 5-[2-(4-ブromo-2-フルオロ-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- I-29: 5-[2-(2-フルオロ-3-メトキシ-4-メチル-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-30: {4-[5-メチル-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-2-イルアミノ]-フェニル}-アセトアルデヒド;
- I-31: 5-[2-(3-エチニル-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- I-32: 5-(5-クロロ-2-(3-メトキシ-4-メチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-33: 5-(5-クロロ-2-(3-(ジメチルアミノ)-4-メチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-34: 5-[2-(3-アミノ-4-メトキシ-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- I-35: 5-[5-メチル-2-(3,5-ジメチル-4-d<sub>3</sub>-メチル-フェニルアミノ)-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-36: 5-(5-クロロ-2-(3,5-ジメチル-4-d<sub>3</sub>-メチル)フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-37: 5-(5-フルオロ-2-(3,5-ジメチル-4-d<sub>3</sub>-メチル)フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

- 1-38: 5-(2-(3,5-ジメチル-4- $d_3$ -メチル)フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-39: 4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-2-フェニルアミノ-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;
- 1-40: 4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-2-(3,4,5-トリメチル-フェニルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;
- 1-41: 5-(5-ニトロ-2-(フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-42: 5-(5-ニトロ-2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-43: 5-(2-(2,4-ジフルオロ-3-メトキシフェニルアミノ)-5-ニトロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-44: 5-(2-(3-メトキシ-4-メチルフェニルアミノ)-5-ニトロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-45: 5-(2-(3-(ジメチルアミノ)-4-メチルフェニルアミノ)-5-ニトロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-46: 5-(5-メチル-2-(3,5-ジメチル-4- $d_3$ -メチル)フェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- 1-47: 5-(2-(3-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニルアミノ)-5-ニトロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-48: 2-(2,4-ジフルオロ-3-メトキシ-フェニルアミノ)-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;
- 1-49: 4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-2-(3,4,5-トリメチル-フェニルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸トリフルオロ酢酸塩;
- 1-50: 5-[2-(2-フルオロ-3,4-ジメトキシ-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- 1-51: 5-(5-クロロ-2-(2-フルオロ-3,4-ジメトキシフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-52: 5-(5-クロロ-2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- 1-53: 5-{2-[2-フルオロ-3-(2-メトキシ-エトキシ)-4-メチル-フェニルアミノ]-5-メチル-ピリミジン-4-イルアミノ}-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;
- 1-54: 2-(4-カルバモイル-フェニルアミノ)-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;
- 1-55: 2-(3-メトキシ-5-トリフルオロメチル-フェニルアミノ)-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;
- 1-56: 2-(3-メトキシ-4-メチル-フェニルアミノ)-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;
- 1-57: 2-(3-ジメチルアミノ-4-メチル-フェニルアミノ)-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;
- 1-58: 2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチル-フェニルアミノ)-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;
- 1-59: 2-(3-メトキシ-4,5-ジメチル-フェニルアミノ)-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;
- 1-60: 4-(5-ニトロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピ

リミジン-2-イルアミノ)ベンズアミドトリフルオロ酢酸塩;

1-61: 5-(5-フルオロ-2-(2-フルオロ-3-(2-メトキシエトキシ)-4-メチルフェニルアミノ)

ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

1-62: 5-(2-(2-フルオロ-3-(2-メトキシエトキシ)-4-メチルフェニルアミノ)ピリミジン-

4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

1-63: 5-[5-ヒドロキシメチル-2-(3,4,5-トリメチル-フェニルアミノ)-ピリミジン-4-イ

ルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン;

1-64: 2,6-ジメチル-4-[5-メチル-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イ

ルアミノ)-ピリミジン-2-イルアミノ]-ベンゾニトリルトリフルオロ酢酸塩;

1-65: 5-[5-メチル-2-(3-ビニル-フェニルアミノ)-ピリミジン-4-イルアミノ]-3H-ベンゾ

オキサゾール-2-オントリフルオロ酢酸塩;

1-66: 5-(5-クロロ-2-(2-フルオロ-3-(2-メトキシエトキシ)-4-メチルフェニルアミノ)ピ

リミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

1-67: 5-(5-クロロ-2-(2-フルオロ-3-メトキシ-4-メチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-

イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

1-68: 5-[2-(4-エチル-2-フルオロ-3-メトキシ-フェニルアミノ)-5-メチル-ピリミジン-4

-イルアミノ]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オントリフルオロ酢酸塩;

1-69: 4-(5-クロロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピ

リミジン-2-イルアミノ)-2,6-ジメチルベンゾニトリル]トリフルオロ酢酸塩;

1-70: 4-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)

ピリミジン-2-イルアミノ)-2,6-ジメチルベンゾニトリル;

1-71: 5-(5-クロロ-2-(4-エチル-2-フルオロ-3-メトキシフェニルアミノ)ピリミジン-4-

イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

1-72: 2-フルオロ-3-(5-メチル-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イ

ルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)ベンゾニトリルトリフルオロ酢酸塩;

1-73: 3-(5-クロロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピ

リミジン-2-イルアミノ)-2-フルオロベンゾニトリルトリフルオロ酢酸塩;

1-74: 2-(4-フルオロ-3,5-ジメチルフェニルアミノ)-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]

]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-5-カルボン酸メチル トリフルオロ酢酸塩;

1-75: 5-(2-(2-フルオロ-4-メトキシフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ

)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

1-76: 5-(5-クロロ-2-(2-フルオロ-4-メトキシフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ

)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

1-77: 5-(2-(2-フルオロ-3,4-ビス(2-メトキシエトキシ)フェニルアミノ)-5-メチルピリ

ミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

1-78: 5-(5-クロロ-2-(2-フルオロ-3,4-ビス(2-メトキシエトキシ)フェニルアミノ)ピリ

ミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

1-79: 5-(2-(4-フルオロ-3,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-(ヒドロキシメチル)ピリミジ

ン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

1-80: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-(ヒドロキシメチル)ピ

リミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

1-81: 5-(5-(ヒドロキシメチル)-2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジ

ン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

1-82: 5-(2-(3-(ジメチルアミノ)-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-

イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

1-83: 5-(5-クロロ-2-(3-(ジメチルアミノ)-4,5-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-

イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

1-84: 5-(2-(3-(ジエチルアミノ)-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-

イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;

1-85: 5-(2-(3-(エチルアミノ)-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イ



ルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;

1-86: 5-(5-クロロ-2-(3-(ジエチルアミノ)-4,5-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;

1-87: 5-(5-クロロ-2-(3-(エチルアミノ)-4,5-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;

1-88: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-7-(ベンゾ[d][1,3]ジオキサール-6-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

1-89: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-7-(ジメチルアミノ)メチル)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;

1-90: 7-((ジエチルアミノ)メチル)-5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;

1-91: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-7-(ピロリジン-1-イル)メチル)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

1-92: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-7-(ピペリジン-1-イル)メチル)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

1-93: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-7-(4-メチルピペラジン-1-イル)メチル)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

1-94: 4-((5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-2,3-ジヒドロ-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-7-イル)メチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチル;

1-95: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-7-(ピペラジン-1-イル)メチル)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;

1-96: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-7-(E)-3-クロロプロパ-1-エニル)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

1-97: 5-(5-((ジエチルアミノ)メチル)-2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;

1-98: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-((ピロリジン-1-イル)メチル)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

1-99: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-((ピペリジン-1-イル)メチル)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

1-100: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-((4-メチルピペラジン-1-イル)メチル)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

1-101: 5-(2-(3,4-ジエトキシ-2-フルオロフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

1-102: 5-(2-(2-フルオロ-3,4-d<sub>6</sub>-ジメトキシフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

1-103: 5-(2-(3-エトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;

1-104: 5-(5-クロロ-2-(3-エトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;

1-105: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

1-106: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンメタンスルホン酸塩;

1-107: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンベンゼンスルホン酸塩;

1-108: 5-(2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンベンゼンスルホン酸塩;

1-109: 5-(2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロトリフルオロ酢酸塩;

- I-110: 5-(5-フルオロ-2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-111: 5-(2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-7-フルオロベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロトリフルオロ酢酸塩;
- I-112: 7-フルオロ-5-(5-フルオロ-2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-113: 5-(2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-114: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン硫酸塩;
- I-115: リン酸(5-(2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-3(2H)-イル)メチルニナトリウム;
- I-116: 5-(2-(4-フルオロ-3-ヒドロキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-117: 5-(2-(3-ヒドロキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-118: リン酸二水素(5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-3(2H)-イル)メチルカルシウム塩;
- I-119: 5-(5-フルオロ-2-(2-フルオロ-5-メトキシフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- I-120: 5-(2-(3-フルオロ-5-メトキシ-4-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-121: 5-(5-フルオロ-2-(3-フルオロ-5-メトキシ-4-メチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-122: 5-(2-(2-フルオロ-5-メトキシ-4-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-123: 5-(5-フルオロ-2-(2-フルオロ-5-メトキシ-4-メチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-124: 5-(2-(4-クロロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-125: 5-(2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-3-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-126: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-3-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-127: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)-3-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- I-128: 4-(4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)-5-メチルピリミジン-2-イルアミノ)-2-メトキシ-6-メチル安息香酸エチル;
- I-129: 4-(4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)-5-メチルピリミジン-2-イルアミノ)-2-メトキシ-6-メチルベンジルアルコールトリフルオロ酢酸塩;
- I-130: 5-メチル-N4-[3-(ホスホノオキシ)メチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-2,4-ピリミジンジアミンアルギニン塩;
- I-131: 5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-2,4-ピリミジンジアミンベンゼンスルホン酸塩;
- I-132: 5-メチル-N4-[3-(ホスホノオキシ)メチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-2,4-ピリミジンジアミントリス塩;
- I-133: N4-[3-[2-(N,N-ジメチルアミノ)エトキシ]ホスフィニルオキシメチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-5-メチル-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル

ル-2,4-ピリミジンジアミン;

I-134: N4-{3-ビス[2-(N,N-ジメチルアミノ)エトキシ]ホスフィニルオキシメチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル}-5-メチル-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-2,4-ピリミジンジアミン;

I-135: 5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-2,4-ピリミジンジアミンパモ酸塩;

I-136: 5-メチル-N4-[3-(ホスホノオキシ)メチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-2,4-ピリミジンジアミンニカリウム塩;

I-137: 5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-2,4-ピリミジンジアミンメタンスルホン酸塩;

I-138: N2-(3,5-ジメチル-4-メトキシカルボニル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-139: N2-エチル-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-140: N2-(4-カルボキシ-3,5-ジメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-141: N2-(4-ベンジルオキシカルボニル-3,5-ジメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-142: N2-(3,5-ジメチル-4-ヒドロキシメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-143: N2-(3,5-ジメチル-4-メトキシメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-144: N2-(3,4-ジメチル-5-メトキシカルボニル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-145: N2-(3-カルボキシ-4,5-ジメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-146: N2-(3,5-ジメチル-4-フルオロ)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミンベンゼンスルホン酸塩;

I-147: N2-(3,4-ジメチル-5-ヒドロキシメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-148: N2-(4-n-ブチル-3-メチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-149: N2-(4-ブromo-3,5-ジメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-150: N2-(4-tert-ブトキシカルボニル-3,5-ジメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-151: N2-(3,5-ジメチル-4-フルオロ)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン硫酸塩;

I-152: N2-(3-カルボキシ-4-メチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-153: N2-(4-フルオロ-3-メトキシカルボニル-5-メチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-154: N2-(4-フルオロ-3-ヒドロキシメチル-5-メチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-155: N2-(3-カルボキシ-4-フルオロ-5-メチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

I-156: 5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-2,4-ピリミジンジアミン塩酸塩;

I-157: 5-(2-(4-アセチルフェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[

d) オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;

I-158: 5-(2-(4-(1-(シクロプロピルアミノ)エチル)フェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;

I-159: N-シクロブチル-4-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)ベンズアミドギ酸塩;

I-160: 4-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)-N-プロピルベンズアミドギ酸塩;

I-161: N-シクロプロピル-4-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)ベンズアミドギ酸塩;

I-162: N-エチル-4-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)ベンズアミドギ酸塩;

I-163: 4-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)-N-イソプロピルベンズアミドギ酸塩;

I-164: N-シクロブチル-4-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)-2-メトキシベンズアミドギ酸塩;

I-165: N-シクロプロピル-4-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミドギ酸塩;

I-166: 4-(5-フルオロ-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)-N-フェニル-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミドギ酸塩;

I-167: 5-(2-(4-メチル-3-(メチルスルホニル)フェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-168: 5-(2-(4-フルオロ-3-(メチルスルホニル)フェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-169: 5-(2-(3-フルオロ-5-モルホリノフェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;

I-170: 5-(2-(3-フルオロ-5-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;

I-171: 3-(5-フルオロ-4-(7-メチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミドトリフルオロ酢酸塩;

I-172: 5-(2-(3-(メチルスルホニル)フェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-173: 5-(2-(4-フルオロ-3-(メチルスルホニル)フェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-174: 3-(5-フルオロ-4-(7-フルオロ-2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)ピリミジン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミドトリフルオロ酢酸塩;

I-175: 5-(5-フルオロ-2-(3-d<sub>3</sub>-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-176: 5-(2-(3-(トリフルオロメチル)-5-メトキシフェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-177: 5-(2-(3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-178: 5-(2-(4-メトキシ-3-メチルフェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-179: 5-(2-(3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-フルオロベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-180: 5-(2-(4-メトキシ-3-メチルフェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-フルオロベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

I-181: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

- 1-182: 5-(2-(3,4-ジメトキシ-5-メチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-183: 5-(2-(3,4-ジメトキシ-5-メチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-184: 5-(2-(3,4-ジメトキシ-5-メチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-フルオロベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-185: 5-(2-(3-クロロ-4,5-ジメトキシフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-186: 5-(2-(4-(2-モルホリノエトキシ)-3,5-ジメチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;
- 1-187: 5-(2-(3,5-ジメチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-フルオロベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-188: 5-(2-(3,4,5-トリメチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-フルオロベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-189: 5-(2-(4-フルオロ-3,5-ジメチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-フルオロベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-190: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-191: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-フルオロベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-192: 5-(2-(2,4-ジフルオロ-3-メトキシフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-メチルベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-193: 5-(2-(2,4-ジフルオロ-3-メトキシフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)-7-フルオロベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-194: 5-(2-(3,5-ジメトキシ-4-メチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-195: 5-(2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-196: 5-(2-(4-メトキシフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;
- 1-197: 5-(2-(3-(ジフルオロメチル)-4-メトキシフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;
- 1-198: 5-(2-(3-(ジフルオロメチル)-5-メトキシフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-199: 5-(2-(3-(フルオロメチル)-5-メトキシフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-200: 5-(2-(4-イソプロピルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-201: 5-(2-(4-tert-ブチルフェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-202: 5-(2-(p-トリルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;
- 1-203: 5-(2-(4-メチル-3-(ピリジン-4-イル)フェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- 1-204: 5-(2-(4-メチル-3-(ピリジン-3-イル)フェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- 1-205: 5-(2-(4-フルオロ-3-(ピリジン-4-イル)フェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- 1-206: 5-(2-(4-フルオロ-3-(ピリジン-3-イル)フェニルアミノ))-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;

- 1-207: 5-(2-(3-メトキシ-4-(ピリジン-4-イル)フェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;
- 1-208: 5-(2-(4-メトキシ-3-(ピリジン-4-イル)フェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;
- 1-209: 5-(2-(4-メトキシ-3-(ピリジン-3-イル)フェニルアミノ)-5-フルオロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンギ酸塩;
- 1-210: 5-フルオロ-N2-[3-(1-ヒドロキシ-2,2,2-トリフルオロエチル)]フェニル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;
- 1-211: 5-フルオロ-N2-(3-メトキシ-5-トリフルオロメチル)フェニル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;
- 1-212: 5-フルオロ-N2-(4-メトキシ-3-トリフルオロメチル)フェニル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;
- 1-213: N2-[3-(シクロプロピルアミノカルボニルメトキシ)-4-メトキシ]フェニル-5-フルオロ-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;
- 1-214: 5-フルオロ-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;
- 1-215: N2-(3,5-ジメチル-4-フルオロ)フェニル-5-フルオロ-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;
- 1-216: 5-メチル-N4-[3-(ホスホノオキシ)メチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル]-N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-2,4-ピリミジンジアミンリジン塩;
- 1-217: N2-(3,4,5-トリメチル)フェニル-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;
- 1-218: 5-(2-(2,4-ジフルオロ-3-エチレンオキシフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- 1-219: 5-(2-(2,4-ジフルオロ-3-イソプロポキシフェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- 1-220: 5-(2-(4-(アミノメチル)フェニルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- 1-221: 5-(2-(4-フルオロ-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-6-D-5-トリジュウテロメチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- 1-222: 5-(2-(4-フルオロ-3-トリジュウテロメトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-6-D-5-トリジュウテロメチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- 1-223: 5-(2-(3-メトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-6-D-5-トリジュウテロメチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- 1-224: 5-(2-(3-トリジュウテロメトキシ-4,5-ジメチルフェニルアミノ)-6-D-5-トリジュウテロメチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- 1-225: 5-(2-(4-(ヒドロキシメチル)-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-6-D-5-トリジュウテロメチルピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オン;
- 1-226: リン酸5-(2-(4-フルオロ-3-トリジュウテロメトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-6-D-5-トリジュウテロメチルピリミジン-4-イルアミノ)-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-3(2H)-イル)メチル ジ-tert-ブチル;
- 1-227: リン酸水素5-(2-(4-フルオロ-3-トリジュウテロメトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-6-D-5-トリジュウテロメチルピリミジン-4-イルアミノ)-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-3(2H)-イル)メチル tert-ブチル;
- 1-228: リン酸二水素5-(2-(4-フルオロ-3-トリジュウテロメトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-6-D-5-トリジュウテロメチルピリミジン-4-イルアミノ)-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-3(2H)-イル)メチル;
- 1-229: リン酸(5-(2-(4-フルオロ-3-トリジュウテロメトキシ-5-メチルフェニルアミノ)-6-D-5-トリジュウテロメチルピリミジン-4-イルアミノ)-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール

-3(2H)-イル)メチルニナトリウム;

11-230: 4-(4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)-5-メチルピリミジン-2-イルアミノ)-2-メトキシ-6-メチルベンジルアルコール; または

11-231: 4-(4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)-5-メチルピリミジン-2-イルアミノ)-2-メトキシ-6-メチル安息香酸。

[本発明1016]

以下の化合物:

11-1: 5-(5-フルオロ-2-(1-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-6-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

11-2: 5-(5-フルオロ-2-(7-(ピロリジン-1-イル)-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ[7]アヌレン-2-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンニギ酸塩;

11-3: 5-(5-フルオロ-2-(7-オキソ-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ[7]アヌレン-2-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンニギ酸塩;

11-4: (Z)-5-(5-フルオロ-2-(2-メチル-1-オキソ-1,2,3,6-テトラヒドロベンゾ[c]アゾシン-9-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンニギ酸塩;

11-5: 5-(5-フルオロ-2-(5-オキソ-6,7,8,9-テトラヒドロ-5H-ベンゾ[7]アヌレン-2-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンニギ酸塩;

11-6: 5-(2-(ナフタレン-2-イルアミノ)-5-ニトロピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩;

11-7: 2-(ナフタレン-2-イルアミノ)-4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-ベンゾオキサゾール-5-イルアミノ)-ピリミジン-5-カルボン酸メチルエステルトリフルオロ酢酸塩;

11-8: 5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-N2-(1-オキソ-1,3-ジヒドロ-イソベンゾフラン-6-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

11-9: N2-(1,3-ジヒドロ-イソベンゾフラン-5-イル)-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

11-10: 5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-N2-(1-オキソ-1,3-ジヒドロ-イソベンゾフラン-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

11-11: 5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-N2-(1-オキソ-1,3-ジヒドロ-2H-イソインドール-6-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

11-12: 5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-N2-(1-オキソ-1,3-ジヒドロ-7-メチルイソベンゾフラン-4-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

11-13: 5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-N2-(1-オキソ-1,3-ジヒドロ-4-メチルイソベンゾフラン-6-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

11-23: 5-(5-フルオロ-2-(1-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンゾ[c]アゼピン-7-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンニギ酸塩;

11-24: 5-(5-フルオロ-2-(2-メチル-1-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンゾ[c]アゼピン-7-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンニギ酸塩;

11-25: 7-(4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)-5-フルオロピリミジン-2-イルアミノ)-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-3(4H)-オンニギ酸塩;

11-26: 6-(4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)-5-フルオロピリミジン-2-イルアミノ)-3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オントリフルオロ酢酸塩;

11-27: 7-(4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)-5-フルオロピリミジン-2-イルアミノ)-4,5-ジヒドロ-1H-ベンゾ[b]アゼピン-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩; または

11-28: 7-(4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソベンゾ[d]オキサゾール-5-イルアミノ)-5-フルオロピリミジン-2-イルアミノ)-4,5-ジヒドロ-1-メチル-1H-ベンゾ[b]アゼピン-2(3H)-オントリフルオロ酢酸塩。

[本発明1017]

以下の化合物:

11-14: N2-(4,5-ジメチルピリジン-2-イル)-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

11-15: N2-(4,6-ジメチルピリジン-2-イル)-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

11-16: N2-(5-シアノ-6-メチルピリジン-2-イル)-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

11-17: N2-(2-メトキシピリジン-4-イル)-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

11-18: 5-メチル-N2-(2-メチルピリジン-4-イル)-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

11-19: N2-(2,6-ジメチルピリジン-4-イル)-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

11-20: N2-(6-メトキシピリジン-2-イル)-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

11-21: N2-(5,6-ジメチルピリジン-2-イル)-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

11-22: N2-(5-シアノ-4-メチルピリジン-2-イル)-5-メチル-N4-(2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1,3-ベンゾオキサゾール-5-イル)-2,4-ピリミジンジアミン;

11-29: 5-(5-メチル-2-(2-モルホリノピリジン-4-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩;

11-30: 5-(5-フルオロ-2-(2-モルホリノピリジン-4-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩; または

11-31: 5-(5-メチル-2-(ピリジン-4-イルアミノ)ピリミジン-4-イルアミノ)ベンゾ[d]オキサゾール-2(3H)-オンジトリフルオロ酢酸塩。

[本発明1018]

本発明1001、1015、1016または1017のいずれかの化合物を含む薬学的組成物。

[本発明1019]

JAKキナーゼの活性を阻害する方法であって、JAKキナーゼと、JAKキナーゼの活性を阻害するために有効な量の本発明1001、1015、1016もしくは1017の化合物または本発明1018の薬学的組成物とを接触させる段階を含む、方法。

[本発明1020]

T細胞媒介性自己免疫疾患を処置する方法であって、そのような自己免疫疾患に罹患した患者に、該自己免疫疾患を処置するために有効な量の本発明1001、1015、1016もしくは1017の化合物または本発明1018の薬学的組成物を投与する段階を含む、方法。

[本発明1021]

化合物が、10  $\mu$ M未満のIC<sub>50</sub>でSykキナーゼを阻害する化合物もしくは薬学的組成物との組み合わせでまたはそれと併用して投与される、本発明1020の方法。

[本発明1022]

移植レシピエントにおいて同種移植拒絶反応を処置する方法であって、移植レシピエントに該拒絶反応を処置または予防するために有効な量の本発明1001、1015、1016もしくは1017の化合物または本発明1018の薬学的組成物を投与する段階を含む、方法。

[本発明1023]

同種移植が腎臓移植、心臓移植、肝臓移植または肺移植である、本発明1022の方法。

[本発明1024]

化合物が、別の免疫抑制剤との組み合わせでまたはそれと併用して投与される、本発明1022の方法。

[本発明1025]

IV型過敏症反応を処置する方法であって、該過敏症反応を処置または予防するために有効な量の本発明1001、1015、1016もしくは1017の化合物または本発明1018の薬学的組成物を対象に投与する段階を含む、方法。



[本発明1026]

JAKキナーゼ媒介性疾患を処置する方法であって、JAKキナーゼ媒介性疾患を処置または予防するために有効な量の本発明1001、1015、1016もしくは1017の化合物または本発明1018の薬学的組成物を対象に投与する段階を含む、方法。

[本発明1027]

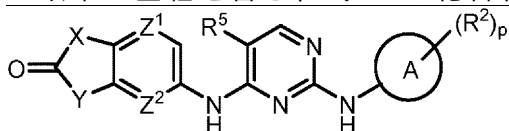
眼の疾患および/または障害を処置する方法であって、眼の疾患および/または障害を処置するために有効な量の本発明1001、1015、1016もしくは1017の化合物または本発明1018の薬学的組成物を対象に投与する段階を含む、方法。

[本発明1028]

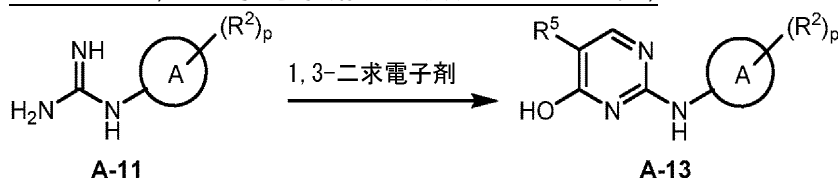
眼の疾患および/または障害がドライアイ症候群、ぶどう膜炎、アレルギー性結膜炎、緑内障または酒さである、本発明1027の方法。

[本発明1029]

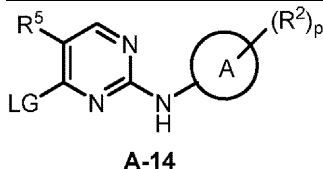
以下の工程を含む、式A-6の化合物を作製する方法：

**A-6**

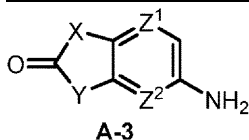
(i) 式A-13の4-ヒドロキシ-ピリミジン-2イル-アミンを作製するために、式A-11のグアニジンと1,3-二求電子剤とを反応させる工程；

**A-11****A-13**

(ii) A-13を式A-14の4-脱離基-ピリミジン-2イル-アミンに変換する工程；および

**A-14**

(iii) 4-脱離基-ピリミジン-2イル-アミンA-14とアリールまたはヘテロアリールアミンA-3とを反応させる工程；

**A-3**

式中、

XおよびYは各々独立してO、S、S(O)、SO<sub>2</sub>またはNR<sup>1</sup>であり；

各R<sup>1</sup>は出現ごとに独立してH、置換されていてもよいC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル、C(O)-C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル、CO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキルまたはR<sup>50</sup>であり；

各R<sup>50</sup>は-C(R<sup>9</sup>)<sub>2</sub>-A-R<sup>10</sup>であり、ここでAはOまたはSであり；各R<sup>9</sup>は出現ごとに独立してH、置換されていてもよいC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル、置換されていてもよいC<sub>6</sub>~<sub>10</sub>アリールまたは置換されていてもよいC<sub>7</sub>~<sub>16</sub>アリールアルキルであり；あるいは、2個のR<sup>9</sup>は、それらが結合している炭素と一緒にあって、置換されていてもよいC<sub>3</sub>~<sub>8</sub>シクロアルキル基または置換されていてもよい3~8員ヘテロアリシクリルを形成し；R<sup>10</sup>はR<sup>a</sup>、-P(O)(OR<sup>11</sup>)<sub>2</sub>、-P(O)(OR<sup>11</sup>)N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>または-P(O)(N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>)<sub>2</sub>であり；各R<sup>11</sup>は出現ごとに独立してR<sup>a</sup>または一価のカチオン性基であり；あるいは、2個のR<sup>11</sup>は、それらが結合している原子と一緒にあって4~8員環状リン酸基を形成し、あるいは、2個のR<sup>11</sup>は一緒にあって二価のカチオン性基となり；各R<sup>12</sup>は出現ごとに独立してR<sup>c</sup>または-C<sub>1</sub>~<sub>3</sub>アルキル-N(R<sup>c</sup>)<sub>2</sub>であり；あるいは、

2個の $R^{12}$ は、それぞれ $-P(O)(N(R^{12})_2)_2$ の別々の窒素上にあり、それらが結合している原子と一緒にあって4~8員環状ホスホン酸ビスアミド基を形成し；あるいは、 $-P(O)(OR^{11})N(R^{12})_2$ 基の1個の $R^{12}$ と $R^{11}$ とは、それらが結合している原子と一緒にあって4~8員環状ホスホンアミデート基を形成し；

A環は $C_6 \sim 10$ アリールまたは5~10員ヘテロアリールであり；

各 $R^2$ は出現ごとに独立してH、 $R^e$ 、 $R^b$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $R^e$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-OR^e$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-SR^e$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-C(O)R^e$ 、 $R^e$ が同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-N(R^a)R^e$ 、同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-S(O)_2R^e$ 、 $R^e$ が同一のもしくは異なる $R^a$ および/もしくは $R^b$ の1個もしくは複数で置換されている $-N(R^a)-S(O)_2R^e$ 、 $-B(OR^a)_2$ 、 $-B(N(R^c)_2)_2$ 、 $-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-O-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-S-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-O-(C(R^b)_2)_m-R^a$ 、 $-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-O-(CH_2)_m-CH((CH_2)_mR^b)R^b$ 、 $-C(O)N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-O-(C(R^a)_2)_m-C(O)N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-N((C(R^a)_2)_mR^b)_2$ 、 $-S-(C(R^a)_2)_m-C(O)N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-N(R^a)-C(O)-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ 、 $-N(R^a)-C(O)-(C(R^a)_2)_m-C(R^a)(R^b)_2$ または $-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-C(O)-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-R^b$ であり；

各 $R^a$ は出現ごとに独立してH、重水素、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 8$ シクロアルキル、 $C_4 \sim 11$ シクロアルキルアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール、 $C_7 \sim 16$ アリールアルキル、2~6員ヘテロアルキル、3~10員ヘテロアリシクリル、4~11員ヘテロアリシクリルアルキル、5~15員ヘテロアリールまたは6~16員ヘテロアリールアルキルであり；

各 $R^b$ は出現ごとに独立して $=O$ 、 $-OR^a$ 、 $-O-(C(R^a)_2)_m-OR^a$ 、ハロ $C_1 \sim 3$ アルキルオキシ、 $=S$ 、 $-SR^a$ 、 $=NR^a$ 、 $=NOR^a$ 、 $-N(R^c)_2$ 、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NC$ 、 $-OCN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO$ 、 $-NO_2$ 、 $=N_2$ 、 $-N_3$ 、 $-S(O)R^a$ 、 $-S(O)_2R^a$ 、 $-SO_3R^a$ 、 $-S(O)N(R^c)_2$ 、 $-S(O)_2N(R^c)_2$ 、 $-OS(O)R^a$ 、 $-OS(O)_2R^a$ 、 $-OSO_3R^a$ 、 $-OS(O)_2N(R^c)_2$ 、 $-C(O)R^a$ 、 $-CO_2R^a$ 、 $-C(O)N(R^c)_2$ 、 $-C(NR^a)-N(R^c)_2$ 、 $-C(NOH)-R^a$ 、 $-C(NOH)-N(R^c)_2$ 、 $-OC(O)R^a$ 、 $-OC(O)OR^a$ 、 $-OC(O)N(R^c)_2$ 、 $-OC(NH)-N(R^c)_2$ 、 $-OC(NR^a)-N(R^c)_2$ 、 $-N(R^a)-S(O)_2H$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nR^a$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nOR^a$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nN(R^c)_2$ または $-[N(R^a)C(NR^a)]_n-N(R^c)_2$ であり；

各 $R^c$ は出現ごとに独立して $R^a$ であり、あるいは、2個の $R^c$ は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、3~10員ヘテロアリシクリルまたは5~10員ヘテロアリールであって、同一のまたは異なるさらなるヘテロ原子の1個または複数を含んでもよくかつ同一のまたは異なる $R^a$ および/または $R^d$ 基の1個または複数で置換されていてもよいヘテロアリシクリルまたはヘテロアリールを形成し；

各 $R^d$ は $=O$ 、 $-OR^a$ 、ハロ $C_1 \sim 3$ アルキルオキシ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $=S$ 、 $-SR^a$ 、 $=NR^a$ 、 $=NOR^a$ 、 $-N(R^a)_2$ 、ハロ、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NC$ 、 $-OCN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO$ 、 $-NO_2$ 、 $=N_2$ 、 $-N_3$ 、 $-S(O)R^a$ 、 $-S(O)_2R^a$ 、 $-SO_3R^a$ 、 $-S(O)N(R^a)_2$ 、 $-S(O)_2N(R^a)_2$ 、 $-OS(O)R^a$ 、 $-OS(O)_2R^a$ 、 $-OSO_3R^a$ 、 $-OS(O)_2N(R^a)_2$ 、 $-C(O)R^a$ 、 $-CO_2R^a$ 、 $-C(O)N(R^a)_2$ 、 $-C(NR^a)N(R^a)_2$ 、 $-C(NOH)R^a$ 、 $-C(NOH)N(R^a)_2$ 、 $-OCO_2R^a$ 、 $-OC(O)N(R^a)_2$ 、 $-OC(NR^a)N(R^a)_2$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nR^a$ 、 $-(C(R^a)_2)_n-OR^a$ 、 $-N(R^a)-S(O)_2R^a$ 、 $-C(O)-C_1 \sim 6$ ハロアルキル、 $-S(O)_2C_1 \sim 6$ ハロアルキル、 $-OC(O)R^a$ 、 $-O(C(R^a)_2)_m-OR^a$ 、 $-S(C(R^a)_2)_m-OR^a$ 、 $-N(R^a)C_1 \sim 6$ ハロアルキル、 $-P(O)(OR^a)_2$ 、 $-N(R^a)-(C(R^a)_2)_m-OR^a$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nOR^a$ 、 $-[N(R^a)C(O)]_nN(R^a)_2$ 、 $-[N(R^a)C(NR^a)]_nN(R^a)_2$ または $-N(R^a)C(O)C_1 \sim 6$ ハロアルキルであり；2個の $R^d$ は、それらが結合している1個または複数の原子と一緒にあって結合して、3~10員の部分飽和または完全飽和の単環式環または二環式環を形成し、この環は1個または複数のヘテロ原子を含有していてもよくかつ1個または複数の $R^a$ で置換されていてもよく；

各 $R^e$ は出現ごとに独立して $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 8$ シクロアルキル、 $C_4 \sim 11$ シクロアルキルアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール、 $C_7 \sim 16$ アリールアルキル、2~6員ヘテロアルキル、3~10員ヘテロアリシクリル、4~11員ヘテロアリシクリルアルキル、5~15員ヘテロアリールまたは6~16員ヘテロアリールアルキルであり；

pは0、1、2、3または4であり；

各mは1、2または3であり；

各nは0、1、2または3であり；

2個の $R^2$ 基は、それらが結合している1個または複数の原子と一緒に結合して、4～10員の部分飽和または完全飽和の単環式環または二環式環を形成し、この環は1個または複数のヘテロ原子を含有していてもよくかつ1個または複数の $R^a$ および/または $R^b$ で置換されていてもよく；

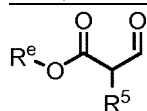
$Z^1$ および $Z^2$ は各々独立してCH、 $CR^2$ またはNであり；

$R^5$ はH、ハロ、-CN、置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル、アルキニル、ヒドロキシ、置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ、ニトロ、 $-N(R^a)_2$ 、 $-C(O)N(R^a)_2$ 、 $-CO_2R^a$ または $-C(O)R^a$ であり；

LGはハロゲン、アリールスルホネート、アルキルスルホネート、ホスホネート、アジドまたは $-S(O)_{0-2}R^e$ である。

[本発明1030]

1,3-二求電子剤が、式A-12：



**A-12**

の -アルデヒドエステルである、本発明1029の方法。

[本発明1031]

式A-13の4-ヒドロキシ-ピリミジン-2イル-アミンを作製するために式A-11のグアニジンと式A-12の -アルデヒドエステルとを反応させる工程が、アルコール溶媒中、塩基の存在下で加熱することを含む、本発明1030の方法。

[本発明1032]

アルコール溶媒がエタノールであり、塩基がナトリウムエトキシドであり、反応液が約40 ～ 約80 に約24時間～約48時間加熱される、本発明1031の方法。

[本発明1033]

LGがクロリドである、本発明1029の方法。

[本発明1034]

A-13を式A-14の4-脱離基-ピリミジン-2イル-アミンに変換する工程が $POCl_3$ の存在下でA-13を加熱することを含む、本発明1033の方法。

[本発明1035]

XがOであり；Yが $NR^1$ であり； $Z^1$ および $Z^2$ がそれぞれCHである、本発明1033の方法。

[本発明1036]

4-脱離基-ピリミジン-2イル-アミンA-14とアリールまたはヘテロアリールアミンA-3とを反応させる工程がA-14とA-3との混合物を溶媒中、酸の存在下で約60 ～ 約80 で加熱することを含む、本発明1035の方法。

[本発明1037]

溶媒がイソプロパノールであり、酸がトリフルオロ酢酸である、本発明1036の方法。

[本発明1038]

A環がフェニルである、本発明1036の方法。

これらのおよび他の態様のより詳細な説明を以下に示す。