

【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30年3月22日 (2018.3.22)

【公表番号】特表2017-510643(P2017-510643A)

【公表日】平成29年4月13日 (2017.4.13)

【年通号数】公開・登録公報2017-015

【出願番号】特願2017-502934(P2017-502934)

【国際特許分類】

C 07 D 403/14 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 37/08 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 37/02 (2006.01)

A 61 P 37/06 (2006.01)

A 61 P 35/02 (2006.01)

A 61 P 7/00 (2006.01)

A 61 P 11/06 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 P 17/00 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

A 61 P 21/00 (2006.01)

A 61 P 17/06 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 11/02 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 K 31/506 (2006.01)

C 07 D 401/14 (2006.01)

A 61 K 45/00 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 403/14 C S P

A 61 P 43/00 1 2 1

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 37/08

A 61 P 29/00

A 61 P 37/02

A 61 P 37/06

A 61 P 35/02

A 61 P 7/00

A 61 P 11/06

A 61 P 11/00

A 61 P 17/00

A 61 P 13/12

A 61 P 21/00

A 61 P 17/06

A 61 P 3/10

A 61 P 11/02

A 61 P 1/04

A 61 P 19/02

A 6 1 P 29/00 1 0 1  
 A 6 1 K 31/506  
 C 0 7 D 401/14  
 A 6 1 K 45/00

## 【手続補正書】

【提出日】平成30年2月9日(2018.2.9)

## 【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

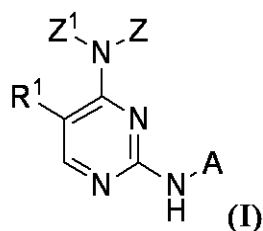
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(I):

【化 1】



[式中、

Zは、C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>スピロビシクロアルキル、C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>縮合ビシクロアルキル、7～12員スピロヘテロビサイクリルまたは7～12員縮合ヘテロビシクロアルキルであり、ここでZは、所望により、1、2、3、4または5つのR<sup>2</sup>基により置換されていてもよく；

Z<sup>1</sup>は、H、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>シクロアルキルまたは3～12員複素環であり、ここでZ<sup>1</sup>は、所望により、1、2、3、4または5つのR<sup>3</sup>基により置換されていてもよく；

Aは、インダゾリルまたはピラゾロピリジニルであり、ここでAは、所望により、1、2、3、4または5つのR<sup>4</sup>基により置換されていてもよく；

R<sup>1</sup>は、H、F、Cl、Br、I、NO<sub>2</sub>、N<sub>3</sub>、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>アルコキシル、C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>シクロアルキル、3～12員複素環、C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>アリール、5～12員ヘテロアリール、-(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>n</sub>-OR<sup>c</sup>、-(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>n</sub>-NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-C(=O)R<sup>5</sup>、-OC(=O)R<sup>5</sup>、-O(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>n</sub>-R<sup>5</sup>、-N(R<sup>c</sup>)C(=O)R<sup>5</sup>、-(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>n</sub>C(=O)OR<sup>c</sup>、-(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>n</sub>C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-C(=NR<sup>c</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-N(R<sup>c</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-N(R<sup>c</sup>)S(=O)<sub>m</sub>R<sup>5</sup>または-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>であり、ここでR<sup>1</sup>は、所望により1、2、3、4または5つのR<sup>8</sup>基により置換されていてもよい；

各R<sup>2</sup>は、独立して、H、F、Cl、Br、I、NO<sub>2</sub>、N<sub>3</sub>、CN、OH、NH<sub>2</sub>、-C(=O)CH<sub>2</sub>CN、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>アルコキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>シクロアルキル、C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>アリール、3～12員複素環、5～12員ヘテロアリール、-(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>n</sub>-OR<sup>c</sup>、-(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>n</sub>-NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-C(=O)R<sup>5</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、-OC(=O)R<sup>5</sup>、-O(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>n</sub>-R<sup>5</sup>、-O(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>n</sub>-OR<sup>c</sup>、-N(R<sup>c</sup>)C(=O)R<sup>5</sup>、-(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>n</sub>C(=O)OR<sup>c</sup>、-(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>n</sub>C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-C(=NR<sup>c</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-N(R<sup>c</sup>)C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-N(R<sup>c</sup>)S(=O)<sub>m</sub>R<sup>5</sup>または-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>であるか、あるいは2つの隣接するR<sup>2</sup>は、それらが結合している原子と共に一体となって、C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>シクロアルキルまたは3～12員ヘテロシクロアルキル基を形成しており、ここで上記置換基の各々は、独立して、1、2、3、4または5つのR<sup>8</sup>基により所望により置換されていてもよく；

各々R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は、独立して、H、F、Cl、Br、I、NO<sub>2</sub>、N<sub>3</sub>、CN、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>シクロアルキル、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキレン)-(C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>シクロアルキル)、C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>アリール、3～12員複素環、-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキレン)-(3～12員複素環)、5～12員ヘテロアリール、-(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>n</sub>-OR<sup>c</sup>、-(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>n</sub>-NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-C(=O)R<sup>5</sup>、-OC(=O)R<sup>5</sup>

、 $-O(CR^6R^7)_n-R^5$ 、 $-N(R^c)C(=O)R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_nC(=O)OR^c$ 、 $-(CR^6R^7)_nC(=O)NR^aR^b$ 、 $-C(=NR^c)NR^aR^b$ 、 $-N(R^c)C(=O)NR^aR^b$ 、 $-N(R^c)S(=O)_mR^5$ または $-S(=O)_2NR^aR^b$ であり、ここで各々 $R^3$ および $R^4$ は、独立して、1、2、3、4または5つの $R^8$ 基により所望により置換されており、よく；

各々 $R^5$ は、独立して、H、 $C_1$ - $C_{12}$ アルキル、 $C_1$ - $C_{12}$ ハロアルキル、 $C_2$ - $C_{12}$ アルケニル、 $C_2$ - $C_{12}$ アルキニル、 $C_3$ - $C_{12}$ シクロアルキル、 $C_6$ - $C_{12}$ アリール、3～12員複素環または5～12員ヘテロアリールであり、ここで各々 $R^5$ は、独立して、1、2、3、4または5つの $R^8$ 基により所望により置換されており、よく；

各々 $R^6$ および $R^7$ は、独立して、H、F、Cl、Br、I、 $NO_2$ 、 $N_3$ 、CN、 $C_1$ - $C_{12}$ アルキル、 $C_2$ - $C_{12}$ アルケニル、 $C_2$ - $C_{12}$ アルキニル、 $C_3$ - $C_{12}$ シクロアルキル、 $C_6$ - $C_{12}$ アリール、3～12員複素環または5～12員ヘテロアリールであるか、あるいは $R^6$ および $R^7$ は、それらが結合している炭素原子と共に一体となって、 $C_3$ - $C_{12}$ シクロアルキル、 $C_6$ - $C_{12}$ アリール、3～12員複素環または5～12員ヘテロアリール基を形成しており、ここで上記置換基の各々は、独立して、1、2、3、4または5つの $R^8$ 基により所望により置換されており、よく；

各 $R^8$ は、独立して、F、Cl、Br、I、CN、 $NO_2$ 、 $N_3$ 、 $C_1$ - $C_{12}$ アルキル、 $C_2$ - $C_{12}$ アルケニル、 $C_2$ - $C_{12}$ アルキニル、 $C_3$ - $C_{12}$ シクロアルキル、 $C_6$ - $C_{12}$ アリール、3～12員複素環、5～12員ヘテロアリール、 $NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_{12}$ アルキル)、 $-NH(CH_2)_n-(C_3-C_{12}$ シクロアルキル)、 $-NH(CH_2)_n-(C_6-C_{12}$ アリール)、 $-NH(CH_2)_n-(3\sim 12$ 員複素環)、 $-NH(CH_2)_n-(5\sim 12$ 員ヘテロアリール)、 $-N(C_1-C_{12}$ アルキル) $_2$ 、 $-N[(CH_2)_n-(C_3-C_{12}$ シクロアルキル)] $_2$ 、 $-N[(CH_2)_n-(C_6-C_{12}$ アリール)] $_2$ 、 $-N[(CH_2)_n-(3\sim 12$ 員複素環)] $_2$ 、 $-N[(CH_2)_n-(5\sim 12$ 員ヘテロアリール)] $_2$ 、OH、 $-O(C_1-C_{12}$ アルキル)、 $-O(CH_2)_n-(C_3-C_{12}$ シクロアルキル)、 $-O(CH_2)_n-(C_6-C_{12}$ アリール)、 $-O(CH_2)_n-(3\sim 12$ 員複素環)または $-O(CH_2)_n-(5\sim 12$ 員ヘテロアリール)であり；

各々 $R^a$ 、 $R^b$ および $R^c$ は、独立して、H、 $C_1$ - $C_6$ アルキル、 $C_2$ - $C_6$ アルケニル、 $C_2$ - $C_6$ アルキニル、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル、 $-(C_1-C_4$ アルキレン)-( $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル)、3～6員複素環、 $-(C_1-C_4$ アルキレン)-( $3\sim 6$ 員複素環)、 $C_6$ - $C_{10}$ アリール、 $-(C_1-C_4$ アルキレン)-( $C_6-C_{10}$ アリール)、5～10員ヘテロアリールまたは $-(C_1-C_4$ アルキレン)-( $5\sim 10$ 員ヘテロアリール)であるか、あるいは $R^a$ および $R^b$ は、それらが結合している窒素原子と共に一体となって、3～8員複素環基を形成しており、ここで上記置換基の各々は、所望により、独立して、F、Cl、Br、CN、 $N_3$ 、OH、 $NH_2$ 、 $C_1$ - $C_6$ アルキル、 $C_1$ - $C_6$ ハロアルキル、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシおよび $C_1$ - $C_6$ アルキルアミノから独立して選択される1、2、3または4つの置換基により置換されており、よく；

各々 $m$ は、独立して、1または2であり；および

各々 $n$ は、独立して、0、1、2、3または4である]

の化合物、あるいはその立体異性体、互変異生体、N-オキシド、溶媒和物、代謝物、医薬的に許容される塩またはプロドラッグ。

#### 【請求項2】

Zが、 $C_8$ - $C_{11}$ スピロビシクロアルキル、 $C_8$ - $C_{10}$ 縮合ビシクロアルキル、8～11員スピロヘテロビサイクリルまたは8～10員縮合ヘテロビシクロアルキルであり、Zは、所望により、1、2、3または4つの $R^2$ 基により置換されており、よく、請求項1記載の化合物。

#### 【請求項3】

$Z^1$ が、H、 $C_1$ - $C_6$ アルキル、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキルまたは3～6員複素環であり、 $Z^1$ は、所望により、1、2または3つの $R^3$ 基により置換されており、よく、あるいは

$Z^1$ が、H、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、イソプロピルまたはシクロプロピルである、請求項1記載の化合物。

#### 【請求項4】

$R^1$ が、H、F、Cl、CN、 $N_3$ 、 $C_1$ - $C_6$ アルキル、 $C_2$ - $C_6$ アルケニル、 $C_2$ - $C_6$ アルキニル、 $C_1$ - $C_6$ ハロアルキル、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシル、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル、3～6員複素環、 $-(CR^6R^7)_n-OR^c$ 、 $-(CR^6R^7)_n-NR^aR^b$ 、 $-C(=O)R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_nC(=O)NR^aR^b$ または $-S(=O)_2NR^aR^b$ であり、 $R^1$ は、所望により、1、2または3つの $R^8$ 基により置換されており、よく、あるいは

$R^1$ が、H、F、Cl、CN、 $N_3$ 、 $C_1$ - $C_4$ アルキル、 $C_2$ - $C_4$ アルケニル、 $C_2$ - $C_4$ アルキニル、 $C_1$ - $C_4$

ハロアルキル、 $C_1$ - $C_4$ アルコキシル、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル、3～6員複素環、 $-(CR^6R^7)_n-OR^c$ 、 $-(CR^6R^7)_n-NR^aR^b$ 、 $-C(=O)R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_nC(=O)NR^aR^b$ または $-S(=O)_2NR^aR^b$ であって、ここで $R^1$ は、所望により、1、2または3つの $R^8$ 基により置換されていてもよい、  
請求項1記載の化合物。

【請求項5】

各 $R^2$ が、独立して、H、F、Cl、CN、 $N_3$ 、 $NO_2$ 、OH、 $NH_2$ 、 $-C(=O)CH_2CN$ 、 $C_1$ - $C_6$ アルキル、 $C_2$ - $C_6$ アルケニル、 $C_2$ - $C_6$ アルキニル、 $C_1$ - $C_6$ ハロアルキル、 $C_1$ - $C_6$ アルコキシ、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル、フェニル、3～6員複素環、5～6員ヘテロアリール、 $-(CR^6R^7)_n-OR^c$ 、 $-(CR^6R^7)_n-NR^aR^b$ 、 $-C(=O)R^5$ 、 $-S(=O)_2R^5$ 、 $-O(CR^6R^7)_n-R^5$ 、 $-O(CR^6R^7)_n-OR^c$ 、 $-N(R^c)C(=O)R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_nC(=O)NR^aR^b$ 、 $-N(R^c)C(=O)NR^aR^b$ 、 $-N(R^c)S(=O)_mR^5$ または $-S(=O)_2NR^aR^b$ であるか、あるいは2つの隣接する $R^2$ は、それらが結合している原子と共に一体となって、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキルまたは3～6員ヘテロシクロアルキル基を形成しており、ここで上記置換基の各々は、所望により、独立して、1、2または3つの $R^8$ 基により置換されていてもよい、請求項1記載の化合物。

【請求項6】

各々 $R^3$ および $R^4$ が、独立して、H、F、Cl、Br、I、 $NO_2$ 、 $N_3$ 、CN、 $C_1$ - $C_6$ アルキル、 $C_2$ - $C_6$ アルケニル、 $C_2$ - $C_6$ アルキニル、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル、 $-(C_1-C_2$ アルキレン) $-(C_3-C_6$ シクロアルキル)、フェニル、3～6員複素環、 $-(C_1-C_2$ アルキレン) $-(3～6$ 員複素環)、5～6員ヘテロアリール、 $-(CR^6R^7)_n-OR^c$ 、 $-(CR^6R^7)_n-NR^aR^b$ 、 $-C(=O)R^5$ 、 $-OC(=O)R^5$ 、 $-O(CR^6R^7)_n-R^5$ 、 $-N(R^c)C(=O)R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_nC(=O)OR^c$ 、 $-(CR^6R^7)_nC(=O)NR^aR^b$ 、 $-N(R^c)S(=O)_mR^5$ または $-S(=O)_2NR^aR^b$ であり、各 $R^3$ および $R^4$ は、独立して、1、2または3つの $R^8$ 基により、所望により置換されていてもよい、請求項1記載の化合物。

【請求項7】

各 $R^5$ が、独立して、H、 $C_1$ - $C_6$ アルキル、 $C_1$ - $C_6$ ハロアルキル、 $C_2$ - $C_6$ アルケニル、 $C_2$ - $C_6$ アルキニル、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル、フェニル、3～6員複素環または5～6員ヘテロアリールであり、ここで各 $R^5$ は、独立して、1、2または3つの $R^8$ 基により、所望により置換されていてもよい、あるいは

各 $R^5$ が、独立して、H、 $C_1$ - $C_4$ アルキル、 $C_1$ - $C_4$ ハロアルキル、 $C_2$ - $C_4$ アルケニル、 $C_2$ - $C_4$ アルキニル、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル、フェニル、3～6員複素環または5～6員ヘテロアリールであり、各 $R^5$ は、所望により、独立して、1、2または3つの $R^8$ 基により置換されていてもよい、

請求項1記載の化合物。

【請求項8】

各々 $R^6$ および $R^7$ が、独立して、H、F、Cl、Br、I、CN、 $N_3$ 、 $NO_2$ 、 $C_1$ - $C_6$ アルキル、 $C_2$ - $C_6$ アルケニル、 $C_2$ - $C_6$ アルキニル、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル、フェニル、3～6員複素環または5～6員ヘテロアリールであるか、あるいは $R^6$ および $R^7$ は、それらが結合している炭素原子と共に一体となって、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル、フェニル、3～6員複素環または5～6員ヘテロアリール基を形成しており、ここで上記置換基の各々は、独立して、1、2または3つの $R^8$ 基により、所望により置換されていてもよく、

各 $R^8$ が、独立して、F、Cl、CN、 $N_3$ 、 $C_1$ - $C_6$ アルキル、 $C_2$ - $C_6$ アルケニル、 $C_2$ - $C_6$ アルキニル、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル、フェニル、3～6員複素環、5～6員ヘテロアリール、 $NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_6$ アルキル)、 $-NH(CH_2)_n-(C_3-C_6$ シクロアルキル)、 $-NH(CH_2)_n$ -フェニル、 $-NH(CH_2)_n-(3～6$ 員複素環)、 $-NH(CH_2)_n-(5～6$ 員ヘテロアリール)、 $-N(C_1-C_4$ アルキル) $_2$ 、 $-N[(CH_2)_n-(C_3-C_6$ シクロアルキル)] $_2$ 、 $-N[(CH_2)_n$ -フェニル] $_2$ 、 $-N[(CH_2)_n-(3～6$ 員複素環)] $_2$ 、 $-N[(CH_2)_n-(5～6$ 員ヘテロアリール)] $_2$ 、OH、 $-O(C_1-C_6$ アルキル)、 $-O(CH_2)_n-(C_3-C_6$ シクロアルキル)、 $-O(CH_2)_n$ -フェニル、 $-O(CH_2)_n-(3～6$ 員複素環)または $-O(CH_2)_n-(5～6$ 員ヘテロアリール)であり、

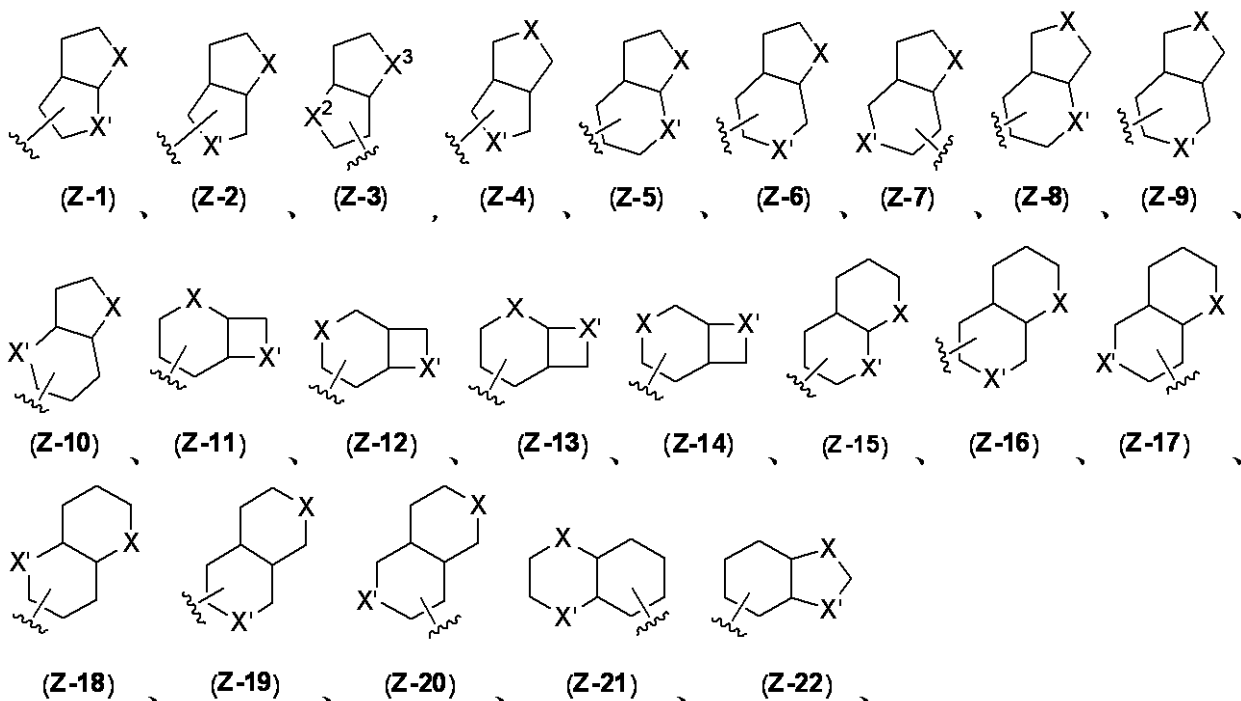
各々 $R^a$ 、 $R^b$ および $R^c$ が、独立して、H、 $C_1$ - $C_4$ アルキル、 $C_2$ - $C_4$ アルケニル、 $C_2$ - $C_4$ アルキニル、 $C_3$ - $C_6$ シクロアルキル、 $-(C_1-C_2$ アルキレン) $-(C_3-C_6$ シクロアルキル)、3～6員複素環、 $-(C_1-C_2$ アルキレン) $-(3～6$ 員複素環)、フェニル、 $-(C_1-C_2$ アルキレン)-フェニル、5

~6員ヘテロアリールまたは-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>アルキレン)-(5~6員ヘテロアリール)であるか、あるいはR<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>は、それらが結合している窒素原子と共に一体となって、3~6員複素環基を形成しており、ここで上記置換基の各々は、独立して、F、Cl、CN、N<sub>3</sub>、OH、NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシおよびC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルアミノから独立して選択される1、2または3つの置換基により所望により置換されていてもよい、請求項1記載の化合物。

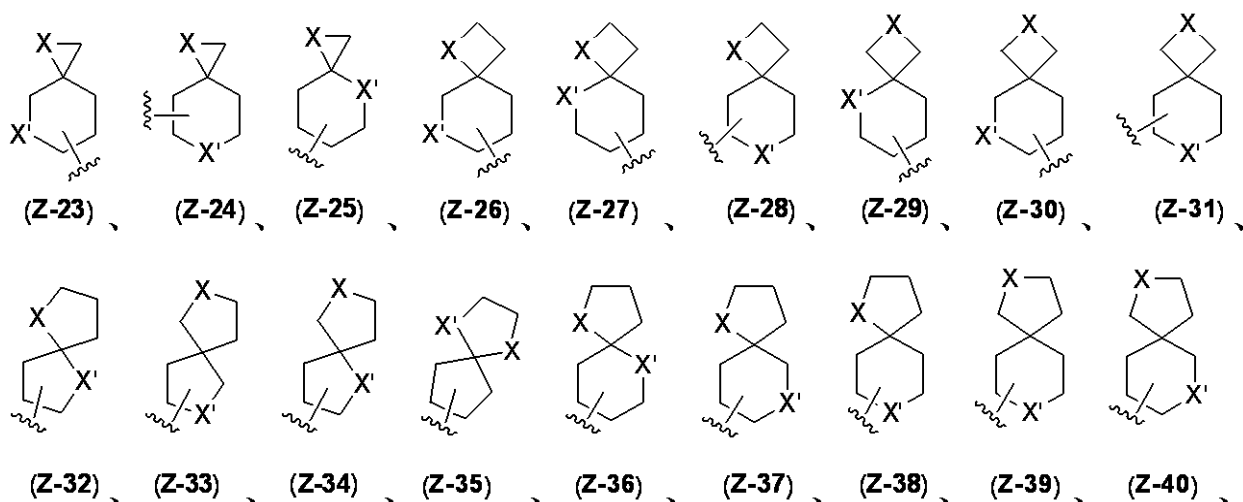
【請求項9】

Zが、

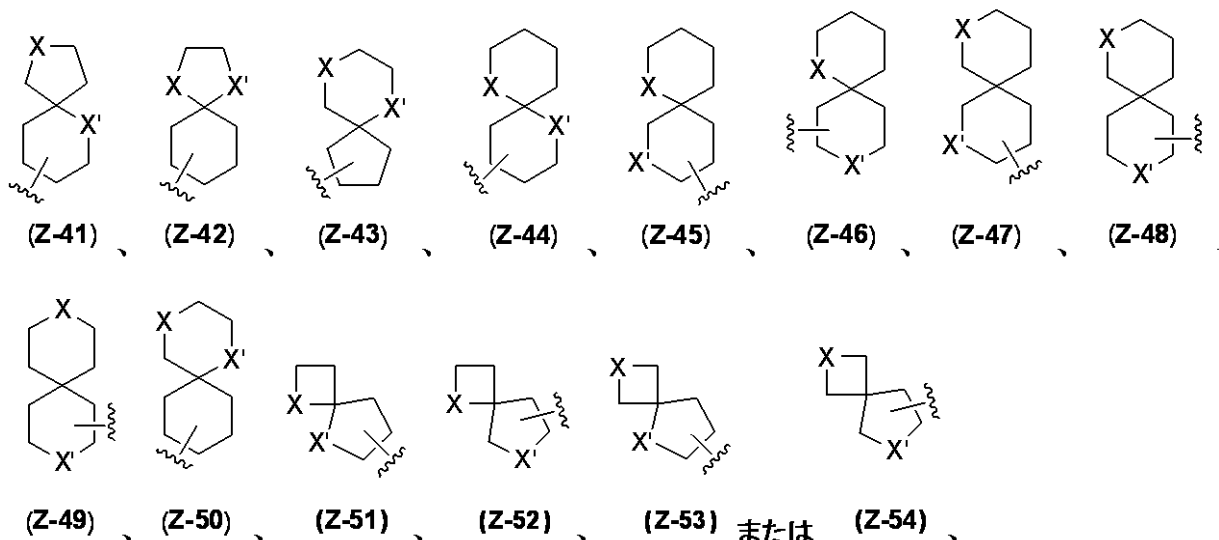
【化2】



【化3】



## 【化 4】

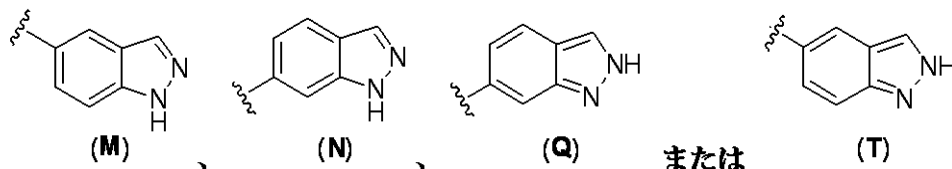


あるいはその立体異性体であって、各々X、X'、X<sup>2</sup>およびX<sup>3</sup>は、独立して、CH<sub>2</sub>、NHまたはOであるが、但しX<sup>2</sup>がOである場合、X<sup>3</sup>はOではない；そして、Zは、1、2または3つのR<sup>2</sup>基により所望により置換されていてもよい、請求項1記載の化合物。

## 【請求項 1 0】

Aが、

## 【化 5】



であり、ここでAは、所望により、1、2または3つのR<sup>4</sup>基により置換されていてもよい、請求項1記載の化合物。

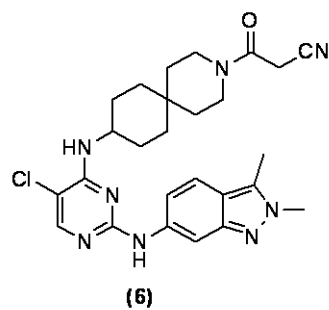
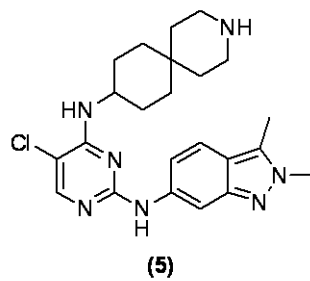
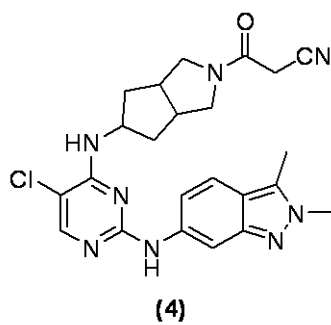
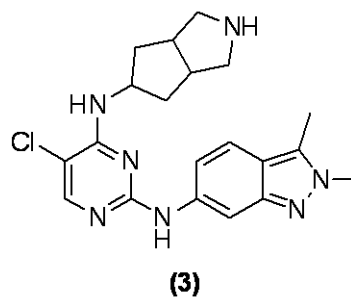
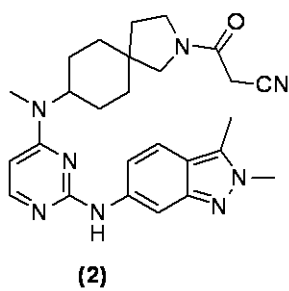
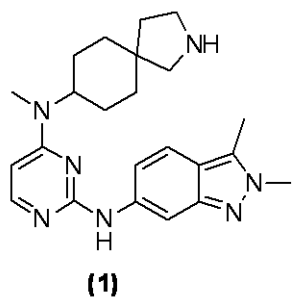
## 【請求項 1 1】

各R<sup>2</sup>は、独立して、H、F、Cl、CN、N<sub>3</sub>、NO<sub>2</sub>、OH、NH<sub>2</sub>、-C(=O)CH<sub>2</sub>CN、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、フェニル、3～6員複素環、5～6員ヘテロアリール、-(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>n</sub>-OR<sup>c</sup>、-(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>n</sub>-NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-C(=O)R<sup>5</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、-O(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>n</sub>-R<sup>5</sup>、-O(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>n</sub>-OR<sup>c</sup>、-N(R<sup>c</sup>)C(=O)R<sup>5</sup>、-(CR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>)<sub>n</sub>C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>、-N(R<sup>c</sup>)S(=O)<sub>m</sub>R<sup>5</sup>または-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>であって、ここで各R<sup>2</sup>は、所望により、1、2または3つのR<sup>8</sup>基により独立して置換されていてもよい、請求項1記載の化合物。

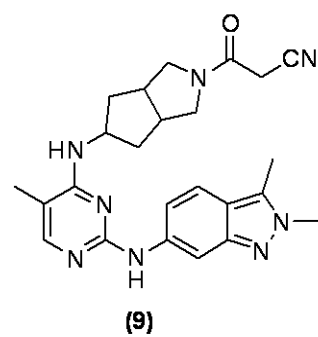
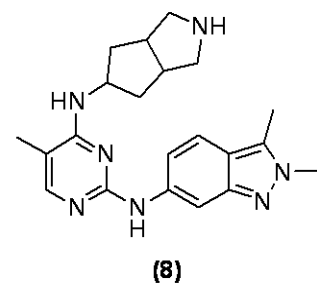
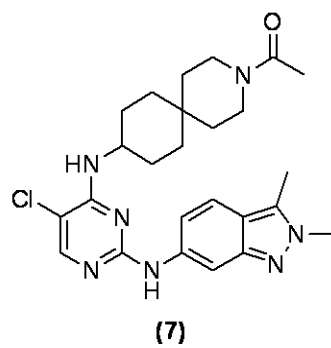
## 【請求項 1 2】

以下の構造：

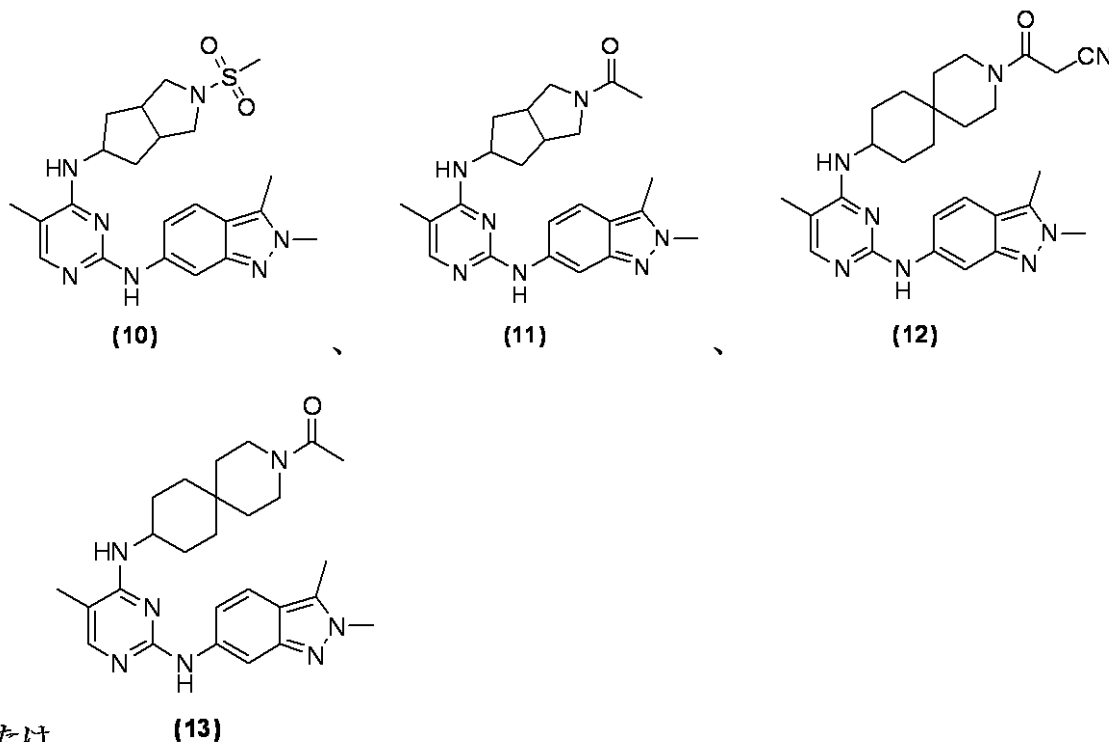
## 【化 6】



## 【化 7】



## 【化 8】



のいずれか1つを有する請求項1記載の化合物、あるいはその立体異性体、互変異生体、N-オキシド、溶媒和物または医薬的に許容される塩。

## 【請求項 1 3】

請求項1～12のいずれか1項記載の化合物、ならびに医薬的に許容される賦形剤、担体、アジュバンド、ビヒクルまたはそれらの組合せを含む、患者におけるタンパク質キナーゼ介在性疾患の重症度を予防、治療または緩和するための、および/またはタンパク質キナーゼの活性を調節するための医薬組成物。

## 【請求項 1 4】

化学療法剤、抗増殖剤、ホスホジエステラーゼ4(PDE4)阻害剤、 $\beta_2$ -アドレナリン作動受容体アゴニスト、コルチコステロイド、非ステロイドGRアゴニスト、抗コリン剤、抗ヒスタミン剤、抗炎症剤、免疫抑制剤、免疫修飾因子、アテローム性動脈硬化症治療剤、肺線維症治療剤およびその組合せからなる群から選択される治療薬を更に含む、請求項13記載の医薬組成物。

## 【請求項 1 5】

患者におけるタンパク質キナーゼ介在性疾患の重症度を予防、治療または緩和する際に使用するための、請求項1～12のいずれか1項記載の化合物または請求項13～14のいずれか1項記載の医薬組成物であって、タンパク質キナーゼ介在性疾患が、JAK-介在性疾患、FLT3-介在性疾患、オーロラ-介在性疾患、増殖性疾患、自己免疫疾患、アレルギー性疾患、炎症性疾患、移植拒絶反応、癌、真性赤血球増加症、本態性血小板増加症、骨髓線維症、慢性骨髓性白血病(CML)、急性骨髓性白血病(AML)、急性リンパ性白血病(ALL)、慢性閉塞性肺疾患(COPD)、喘息、全身性紅斑性狼瘡、皮膚紅斑性狼瘡、ループス腎炎、皮膚筋炎、シェーグレン症候群、乾癬、I型糖尿病、アレルギー性気道疾患、副鼻腔炎、湿疹、蕁麻疹、食品アレルギー、昆虫毒アレルギー、炎症性腸症候群、クローン病疾患、関節リウマチ、若年性関節炎、乾癬性関節炎、臓器移植拒絶反応、組織移植拒絶反応または細胞移植拒絶反応である化合物または医薬組成物。

## 【請求項 1 6】

タンパク質キナーゼ介在性疾患の重症度を予防、治療または緩和するための医薬品製造における、請求項1～12のいずれか1項記載の化合物または請求項13～14のいずれか1項記



載の医薬組成物の使用であって、タンパク質キナーゼ介在性疾患は、JAK-介在性疾患、FLT3-介在性疾患、オーロラ-介在性疾患、増殖性疾患、自己免疫疾患、アレルギー性疾患、炎症性疾患、移植拒絶反応、癌、真性赤血球増加症、本態性血小板増加症、骨髄線維症、慢性骨髄性白血病(CML)、急性骨髄性白血病(AML)、急性リンパ性白血病(ALL)、慢性の閉塞性肺疾患(COPD)、喘息、全身性および皮膚紅斑性狼瘡、ループス腎炎、皮膚筋炎、シェーグレン症候群、乾癬、I型糖尿病、アレルギー性気道疾患、副鼻腔炎、湿疹、蕁麻疹、食品アレルギー、昆虫毒アレルギー、炎症性腸症候群、クローン病疾患、関節リウマチ、若年性関節炎、乾癬性関節炎、臓器移植拒絶反応、組織移植拒絶反応または細胞移植拒絶反応である使用。

【請求項 17】

タンパク質キナーゼの活性を調節するための医薬品製造における、請求項1～12のいずれか1項記載の化合物あるいは請求項13または14のいずれか1項記載の医薬組成物の使用であって、タンパク質キナーゼが、JAKキナーゼ、FLT3キナーゼ、オーロラキナーゼまたはその組み合わせである使用。

【請求項 18】

タンパク質キナーゼの活性を調節する際に使用するための、請求項1～12のいずれか1項記載の化合物または請求項13または14のいずれか1項記載の医薬組成物であって、タンパク質キナーゼが、JAKキナーゼ、FLT3キナーゼ、オーロラキナーゼまたはその組合せである化合物または医薬組成物。