

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】令和5年4月14日(2023.4.14)

【国際公開番号】WO2020/223728

【公表番号】特表2022-531088(P2022-531088A)

【公表日】令和4年7月6日(2022.7.6)

【年通号数】公開公報(特許)2022-122

【出願番号】特願2021-561745(P2021-561745)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 5 4 5 (2 0 0 6 . 0 1)

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

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

A 6 1 P 3 7 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

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

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

A 6 1 P 2 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

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

A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 7 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 7 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

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

A 6 1 P 1 9 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 9 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 9 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)

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

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

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

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

A 6 1 P 2 7 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 7 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 1 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 2 8 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 7 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 5 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

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

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

A 6 1 P 3 7 / 0 8 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 4 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

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

A 6 1 K 3 1 / 5 7 3 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 9 6 (2 0 0 6 . 0 1)

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

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

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

10

20

30

40

50

A 6 1 K 39/395(2006.01)
C 0 7 J 5/00(2006.01)
C 0 7 D 405/06(2006.01)
C 0 7 D 473/18(2006.01)
C 0 7 D 475/08(2006.01)
C 0 7 D 307/88(2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z
A 6 1 K 31/4545
A 6 1 K 31/506 10
A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 P 37/02
A 6 1 P 31/04
A 6 1 P 31/12
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 3/00
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 9/00
A 6 1 P 17/00
A 6 1 P 17/14 20
A 6 1 P 21/00
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 29/00 1 0 1
A 6 1 P 19/06
A 6 1 P 9/10 1 0 1
A 6 1 P 13/12
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 1/02
A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 11/06 30
A 6 1 P 27/02
A 6 1 P 7/06
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 25/16
A 6 1 P 25/14
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 25/04
A 6 1 P 17/04
A 6 1 P 5/14
A 6 1 P 3/10 40
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 37/08
A 6 1 K 45/00
A 6 1 P 43/00 1 2 1
A 6 1 P 1/04
A 6 1 K 31/573
A 6 1 K 31/496
A 6 1 K 31/522
A 6 1 K 31/519
A 6 1 K 31/365 50

A 6 1 K 39/395 N
 C 0 7 J 5/00 C S P
 C 0 7 D 405/06
 C 0 7 D 473/18
 C 0 7 D 475/08
 C 0 7 D 307/88

【手続補正書】

【提出日】令和5年4月5日(2023.4.5)

【手続補正1】

10

【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

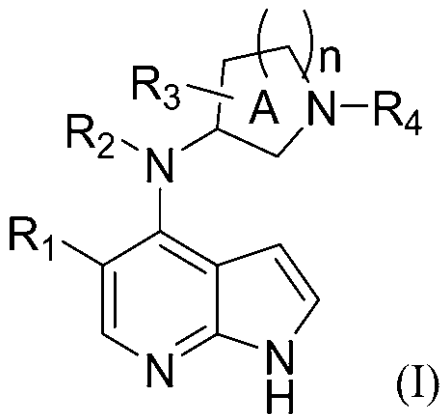
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物、またはその誘導体。

【化1】



20

(式中、

30

R_1 は、CNまたはヘテロアリール基から選択され、1個または複数の利用可能な窒素原子において、Hまたは $C_1 - C_5$ アルキルから独立して選択される基で置換されていても良く、および置換基を有する1個または複数の利用可能な炭素原子において、前記置換基はH、ハロゲン、CN、 $-C_1 - C_4$ アルキル、 $-C_0 - C_6$ アルキル $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $-(C_0 - C_6$ アルキル) $C_3 - C_6$ 複素環、 $-OH$ 、 $-SO_2R_9$ 、 $-SOR_9$ 、 $-SR_9$ 、 $-NH SO_2R_9$ 、 $-OSO_2R_9$ 、 $-C_0 - C_6$ アルキル SO_2R_9 、 $C_0 - C_6$ アルキル COR_9 、 $C_0 - C_6$ アルキル $NR_7C(O)NR_7R_8$ 、 $C_0 - C_6$ アルキル $OC(O)NR_7R_8$ 、 $C_0 - C_6$ アルキル $NR_7SO_2R_9$ 、 $-C_0 - C_6$ アルキル NR_7COR_9 、 $-OC_1 - C_6$ アルキル、 $-OC_0 - C_6$ アルキル $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $-OC_0 - C_6$ アルキル $C_3 - C_6$ 複素環、 $-OC_0 - C_6$ アルキル $NR_7C(O)NR_7R_8$ 、 $-OC_0 - C_6$ アルキル $OC(O)NR_7R_8$ 、 $-OC_0 - C_6$ アルキル $NR_7SO_2R_9$ 、 $-OC_0 - C_6$ アルキル NR_7COR_9 、 $-NR_7R_8$ 、 $-NR_7C_0 - C_6$ アルキル $C_1 - C_6$ アルキル、 $-NR_7C_0 - C_6$ アルキル $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $-NR_7C_0 - C_6$ アルキル $NR_7C(O)NR_7R_8$ 、 $-NR_7C_0 - C_6$ アルキル $OC(O)NR_7R_8$ 、 $-NR_7C_0 - C_6$ アルキル $NR_7SO_2R_9$ 、 $-NR_7C_0 - C_6$ アルキル NR_7COR_9 、 $-NR_7C_0 - C_6$ アルキル $C_3 - C_6$ 複素環、アリールおよびヘテロアリールから各々が独立して選択されてよく、各アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、またはヘテロアリール基は、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-C_0 - C_6$ アルキル NR_7R_8 、 $-C_0 - C_6$ アルキル OH 、 $-SO_2R_9$ 、 $-SOR_9$ 、 $-NH SO_2R_9$ 、 $-C_0 - C_6$ アルキル NR_7R_4 、CN、 $-C_1 - C_5$ アルキル

40

50

アルコキシ、 $C_1 - C_5$ アルコキシまたは $-O - C_1 - C_5$ アルキルから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

R_2 は、 H 、 $-C_1 - C_4$ アルキル、 $-C_3 - C_6$ シクロアルキル、または $-C_1 - C_2$ アルキル $-C_3 - C_6$ シクロアルキルから選択され、該アルキルまたはシクロアルキル基は、ハロゲン、 $-OH$ 、または $-O - C_1 - C_5$ アルキルから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

n は0、1または2であり、

環Aは、1個または複数の炭素において、1、2、または3つの R_3 置換基で置換されており、各 R_3 置換基は、独立して、 H 、ハロゲン、 $-C_1 - C_4$ アルキル、 $-C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $-OH$ 、または $-O - C_1 - C_5$ アルキルから選択され、各アルキルまたはシクロアルキル基は、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-C_1 - C_5$ アルキルアルコキシ、または $-O - C_1 - C_5$ アルキルから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、環Aの同じまたは異なる炭素原子上の2つの R_3 基は、連結して、環Aと共にスピロ環式または二環式を形成してもよく、

10

R_4 は、 $-C(O) - R_6$ 、 $-CH_2R_6$ 、 $-C(O) - C_1 - C_5$ アルキル、または $-C(O) - C_3 - C_6$ シクロアルキルから選択され、該アルキルまたはシクロアルキル基は、 $-OH$ 、ハロゲン、アルキン、または $-CN$ から選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

R_5 は、 $-C_1 - C_5$ アルキル、または $-C_3 - C_6$ シクロアルキルから選択され、該アルキルまたはシクロアルキル基は、ハロゲン、 $-OH$ 、または $-O - C_1 - C_5$ アルキルから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

20

R_6 は、 $-C_1 - C_5$ アルキル、 $-C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $-C_1 - C_5$ アルキル $-C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $-NR_7R_8$ 、 $-O$ -アリアル、 $-O$ -ヘテロアリアル、アリアル、またはヘテロアリアルから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリアルまたはヘテロアリアル基は、ハロゲン、 $-CN$ 、アルキン、 $-OH$ 、トリフルオロメチル、 $-O - C_1 - C_5$ アルキル、または $-O - C_3 - C_6$ シクロアルキルから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

R_7 および R_8 は、独立して、 H 、 $-C_1 - C_5$ アルキル、 $-C_1 - C_5$ アルコキシ、または $-C_3 - C_5$ シクロアルキルから選択され、該アルキル基は、ハロゲン、 $-OH$ 、または $-CN$ から選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

30

R_7 および R_8 は、環を形成するために連結して、ピペリジン、ピロリジンなどの複素環を形成してもよいし、または他のヘテロ原子と共に、モルホリンなどの環を形成してもよく、該複素環式環はハロゲン、 $-OH$ 、 NH_2 、 $NHMe$ 、 NMe_2 、または $-CN$ から選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

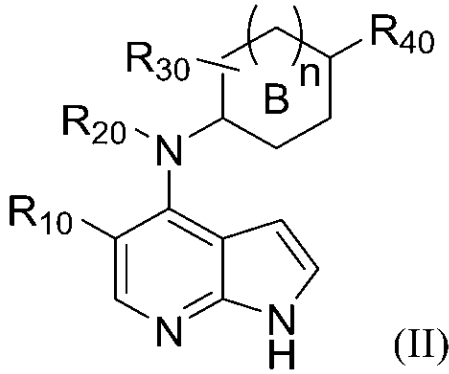
R_9 は、 H 、 $-C_1 - C_5$ アルキル、 $-OC_1 - C_5$ アルキル、 $-C_3 - C_6$ シクロアルキル、および NR_7R_8 から選択され、該アルキル、複素環、またはシクロアルキル基は、ハロゲン、 $-OH$ 、 NH_2 、 $NHMe$ 、 NMe_2 、または $-CN$ から選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよい)

【請求項2】

式(I I)の化合物、またはその誘導体。

40

【化 2】



10

(式中、

R₁₀は、CNまたはヘテロアリアル基から選択され、1個または複数の利用可能な窒素原子において、HまたはC₁-C₅アルキルから独立して選択される基で置換されていてもよく、および置換基を有する1個または複数の利用可能な炭素原子において、前記置換基はH、ハロゲン、CN、-C₁-C₄アルキル、-C₀-C₆アルキルC₃-C₆シクロアルキル、-(C₀-C₆アルキル)C₃-C₆複素環、-OH、-SO₂R₉₀、-NHSO₂R₉₀、-OSO₂R₉₀、-C₀-C₆アルキルSO₂R₉₀、C₀-C₆アルキルCOR₉₀、C₀-C₆アルキルNR₇₀C(O)NR₇₀R₈₀、C₀-C₆アルキルOC(O)NR₇₀R₈₀、C₀-C₆アルキルNR₇₀SO₂R₉₀、-C₀-C₆アルキルNR₇₀COR₉₀-OC₁-C₆アルキル、-OC₀-C₆アルキルC₃-C₆シクロアルキル、-OC₀-C₆アルキルC₃-C₆複素環、-OC₀-C₆アルキルNR₇₀C(O)NR₇₀R₈₀、-OC₀-C₆アルキルOC(O)NR₇₀R₈₀、-OC₀-C₆アルキルNR₇₀SO₂R₉₀、-OC₀-C₆アルキルNR₇₀COR₉₀、-NR₇₀R₈₀、-NR₇₀C₀-C₆アルキルC₁-C₆アルキル、-NR₇₀C₀-C₆アルキルC₃-C₆シクロアルキル、-NR₇₀C₀-C₆アルキルNR₇₀C(O)NR₇₀R₈₀、-NR₇₀C₀-C₆アルキルOC(O)NR₇₀R₈₀、-NR₇₀C₀-C₆アルキルNR₇₀SO₂R₉₀、-NR₇₀C₀-C₆アルキルNR₇₀COR₉₀、-NR₇₀C₀-C₆アルキルC₃-C₆複素環、アリールおよびヘテロアリールから各々が独立して選択されてよく、各アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、またはヘテロアリール基は、ハロゲン、-OH、-C₀-C₆アルキルNR₇₀R₈₀、-C₀-C₆アルキルOH、-SO₂R₉₀、-SOR₉₀、-NHSO₂R₉₀、-C₀-C₆アルキルNR₇₀R₄₀、CN、-C₁-C₅アルキルアルコキシ、C₁-C₅アルコキシまたは-O-C₁-C₅アルキルから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

20

30

R₂₀は、H、-C₁-C₄アルキル、-C₃-C₆シクロアルキル、または-C₁-C₂アルキル-C₃-C₆シクロアルキルから選択され、該アルキルまたはシクロアルキル基は、ハロゲン、-OH、または-O-C₁-C₅アルキルから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

nは0、1または2であり、

環Bは、1個または複数の炭素において、1、2、または3つのR₃₀置換基で置換されており、各R₃₀置換基は、独立して、H、ハロゲン、-C₁-C₄アルキル、-C₃-C₆シクロアルキル、-OH、または-O-C₁-C₅アルキルから選択され、各アルキルまたはシクロアルキル基は、ハロゲン、-OH、-C₁-C₅アルキルアルコキシ、または-O-C₁-C₅アルキルから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、環Bの同じまたは異なる炭素原子上の2つのR₃₀基は、連結して、環Bと共にスピロ環式または二環式を形成してもよく、

40

R₄₀は、-C(O)-R₆₀、-CH₂R₆₀、-C(O)-C₁-C₅アルキル、または-C(O)-C₃-C₆シクロアルキルから選択され、該アルキルまたはシクロアルキル基は、-OH、ハロゲン、アルキン、または-CNから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

50

R₅₀は、-C₁-C₅アルキル、または-C₃-C₆シクロアルキルから選択され、該アルキルまたはシクロアルキル基は、ハロゲン、-OH、または-O-C₁-C₅アルキルから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

R₆₀は、-C₁-C₅アルキル、-C₃-C₆シクロアルキル、-C₁-C₅アルキル-C₃-C₆シクロアルキル、-NR₇₀R₈₀、-O-アリール、-O-ヘテロアリール、アリール、またはヘテロアリールから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリール基は、ハロゲン、-CN、アルキン、-OH、トリフルオロメチル、-O-C₁-C₅アルキル、または-O-C₃-C₆シクロアルキルから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

R₇₀およびR₈₀は、独立して、H、-C₁-C₅アルキル、-C₁-C₅アルコキシ、または-C₃-C₅シクロアルキルから選択され、該アルキル基は、ハロゲン、-OH、または-CNから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

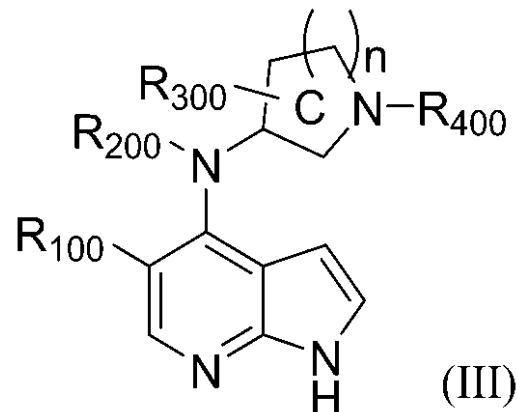
R₇₀およびR₈₀は、環を形成するために連結して、ピペリジン、ピロリジンなどの複素環を形成してもよいし、または他のヘテロ原子と共に、モルホリンなどの環を形成してもよく、該複素環式環は、ハロゲン、-OH、NH₂、NHMe、NMe₂、または-CNから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

R₉₀は、H、-C₁-C₅アルキル、-C₃-C₆シクロアルキル、およびNR₇₀R₈₀から選択され、該アルキル、複素環、またはシクロアルキル基は、ハロゲン、-OH、NH₂、NHMe、NMe₂、または-CNから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよい)

【請求項3】

式(III)の化合物、またはその誘導体。

【化3】



(式中、

R₁₀₀は、CNまたはヘテロアリール基から選択され、1個または複数の利用可能な窒素原子においてHまたはC₁-C₅アルキルから独立して選択される基で置換されていてもよく、および1個または複数の利用可能な炭素原子において、H、ハロゲン、CN、-C₁-C₄アルキル、-C₃-C₆シクロアルキル、-OH、-O-C₁-C₅アルキル、-SO₂R₉₀₀、-NH₂SO₂R₉₀₀、-OSO₂R₉₀₀、-CH₂SO₂R₉₀₀、(CH₂)_nCO₂R₉₀₀、アリールおよびヘテロアリールから各々が独立して選択される置換基で置換されており、各アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリール基は、ハロゲン、-OH、NH₂、NH-C₁-C₅アルキル、CN、-C₁-C₅アルキルアルコキシ、C₁-C₅アルコキシまたは-O-C₁-C₅アルキルから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

R₂₀₀は、H、-C₁-C₄アルキル、-C₃-C₆シクロアルキル、または-C₁-C₂アルキル-C₃-C₆シクロアルキルから選択され、該アルキルまたはシクロアルキル基は、ハロゲン、-OH、または-O-C₁-C₅アルキルから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

n は 0、1 または 2 であり、

環 C は、1 個または複数の炭素において、1、2、または 3 つの R₃₀₀ 置換基で置換されており、各 R₃₀₀ 置換基は、独立して、H、ハロゲン、-C₁-C₄アルキル、-C₃-C₆シクロアルキル、-OH、または -O-C₁-C₅アルキルから選択され、各アルキルまたはシクロアルキル基は、ハロゲン、-OH、-C₁-C₅アルキルアルコキシ、または -O-C₁-C₅アルキルから選択される 1 つまたは複数の基で置換されていてもよく、環 C の同じまたは異なる炭素原子上の 2 つの R₃₀₀ 基は、連結して、環 C と共にスピロ環式または二環式を形成してもよく、

R₄₀₀ は、-C(O)-R₆₀₀、-CH₂R₆₀₀、-C(O)-C₁-C₅アルキル、または -C(O)-C₃-C₆シクロアルキルから選択され、該アルキルまたはシクロアルキル基は、-OH、ハロゲン、アルキン、または -CN から選択される 1 つまたは複数の基で置換されていてもよく、

10

R₅₀₀ は、-C₁-C₅アルキル、または -C₃-C₆シクロアルキルから選択され、該アルキルまたはシクロアルキル基は、ハロゲン、-OH、または -O-C₁-C₅アルキルから選択される 1 つまたは複数の基で置換されていてもよく、

R₆₀₀ は、-C₁-C₅アルキル、-C₃-C₆シクロアルキル、-C₁-C₅アルキル-C₃-C₆シクロアルキル、-NR₇₀₀R₈₀₀、-O-アリアル、-O-ヘテロアリアル、アリアル、またはヘテロアリアルから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリアルまたはヘテロアリアル基は、ハロゲン、-CN、アルキン、-OH、トリフルオロメチル、-O-C₁-C₅アルキル、または -O-C₃-C₆シクロアルキルから選択される 1 つまたは複数の基で置換されていてもよく、

20

R₇₀₀ および R₈₀₀ は、独立して、H、-C₁-C₅アルキル、-C₁-C₅アルコキシ、または -C₃-C₅シクロアルキルから選択され、該アルキル基は、ハロゲン、-OH、または -CN から選択される 1 つまたは複数の基で置換されていてもよく、

R₇₀₀ および R₈₀₀ は、環を形成するために連結して、ピペリジン、ピロリジンなどの複素環を形成してもよいし、または他のヘテロ原子と共に、モルホリンなどの環を形成してもよく、

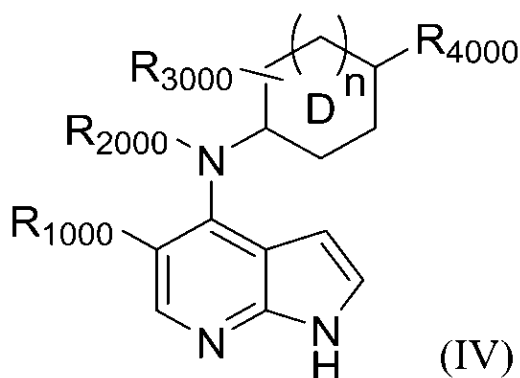
R₉₀₀ は、H、-C₁-C₅アルキル、-C₃-C₆シクロアルキル、および NR₇₀₀R₈₀₀ から選択され、該アルキル基は、ハロゲン、-OH、または -CN から選択される 1 つまたは複数の基で置換されていてもよい)

30

【請求項 4】

式 (IV) の化合物、またはその誘導体。

【化 4】



40

(式中、

R₁₀₀₀ は、CN またはヘテロアリアル基から選択され、1 個または複数の利用可能な窒素原子において H または C₁-C₅アルキルから独立して選択される基で置換されていてもよく、および 1 個または複数の利用可能な炭素原子において、H、ハロゲン、CN、-C₁-C₄アルキル、-C₃-C₆シクロアルキル、-OH、-O-C₁-C₅アルキル、-SO₂R₉₀₀₀、-NH-SO₂R₉₀₀₀、-OSO₂R₉₀₀₀、-CH₂SO₂R₉₀₀₀、(CH

50

2) nC_{000} 、アリーールおよびヘテロアリーールから各々が独立して選択される置換基で置換されており、各アルキル、シクロアルキル、アリーールまたはヘテロアリーール基は、ハロゲン、 $-OH$ 、 NH_2 、 $NH-C_1-C_5$ アルキル、 CN 、 $-C_1-C_5$ アルキルアルコキシ、 C_1-C_5 アルコキシまたは $-O-C_1-C_5$ アルキルから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

R_{2000} は、 H 、 $-C_1-C_4$ アルキル、 $-C_3-C_6$ シクロアルキル、または $-C_1-C_2$ アルキル- C_3-C_6 シクロアルキルから選択され、該アルキルまたはシクロアルキル基は、ハロゲン、 $-OH$ 、または $-O-C_1-C_5$ アルキルから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

n は0、1または2であり、

環Dは、1個または複数の炭素において、1、2、または3つの R_{3000} 置換基で置換されており、各 R_{3000} 置換基は、独立して、 H 、ハロゲン、 $-C_1-C_4$ アルキル、 $-C_3-C_6$ シクロアルキル、 $-OH$ 、または $-O-C_1-C_5$ アルキルから選択され、各アルキルまたはシクロアルキル基は、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-C_1-C_5$ アルキルアルコキシ、または $-O-C_1-C_5$ アルキルから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

環Dの同じまたは異なる炭素原子上の2つの R_{3000} 基は、連結して、環Dと共にスピロ環式または二環式を形成してもよく、

R_{4000} は、 $-C(O)-R_{6000}$ 、 $-CH_2R_{6000}$ 、 $-C(O)-C_1-C_5$ アルキル、または $-C(O)-C_3-C_6$ シクロアルキルから選択され、該アルキルまたはシクロアルキル基は、 $-OH$ 、ハロゲン、アルキン、または $-CN$ から選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

R_{5000} は、 $-C_1-C_5$ アルキル、または $-C_3-C_6$ シクロアルキルから選択され、該アルキルまたはシクロアルキル基は、ハロゲン、 $-OH$ 、または $-O-C_1-C_5$ アルキルから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

R_{6000} は、 $-C_1-C_5$ アルキル、 $-C_3-C_6$ シクロアルキル、 $-C_1-C_5$ アルキル- C_3-C_6 シクロアルキル、 $-NR_{7000}R_{8000}$ 、 $-O$ -アリーール、 $-O$ -ヘテロアリーール、アリーール、またはヘテロアリーールから選択され、該アルキル、シクロアルキル、アリーールまたはヘテロアリーール基は、ハロゲン、 $-CN$ 、アルキン、 $-OH$ 、トリフルオロメチル、 $-O-C_1-C_5$ アルキル、または $-O-C_3-C_6$ シクロアルキルから選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

R_{7000} および R_{8000} は、独立して、 H 、 $-C_1-C_5$ アルキル、 $-C_1-C_5$ アルコキシ、または $-C_3-C_5$ シクロアルキルから選択され、該アルキル基は、ハロゲン、 $-OH$ 、または $-CN$ から選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよく、

R_{7000} および R_{8000} は、環を形成するために連結して、ピペリジン、ピロリジンなどの複素環を形成してもよいし、または他のヘテロ原子と共に、モルホリンなどの環を形成してもよく、

R_{9000} は、 H 、 $-C_1-C_5$ アルキル、 $-C_3-C_6$ シクロアルキル、および $NR_{7000}R_{8000}$ から選択され、該アルキル基は、ハロゲン、 $-OH$ 、または $-CN$ から選択される1つまたは複数の基で置換されていてもよい)

【請求項5】

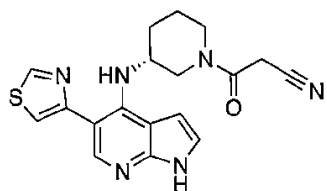
10

20

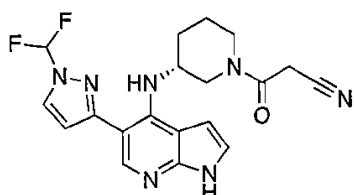
30

40

50

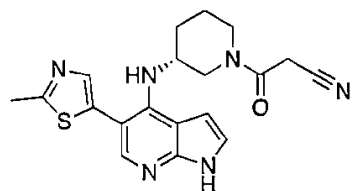


(R)-3-オキソ-3-(3-((5-(チアゾール-4-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロパンニトリル、

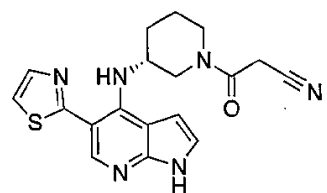


(R)-3-(3-((5-(1-(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-3-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

10

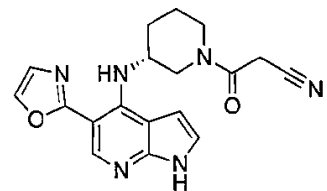


(R)-3-(3-((5-(2-メチルチアゾール-5-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

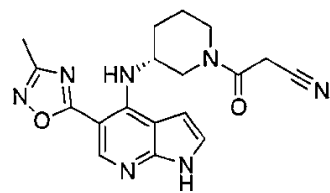


(R)-3-オキソ-3-(3-((5-(チアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロパンニトリル、

20

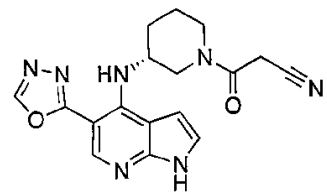


(R)-3-(3-((5-(オキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、



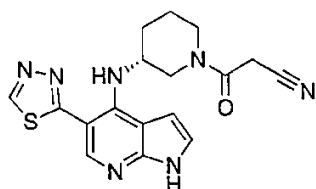
(R)-3-(3-((5-(3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

30

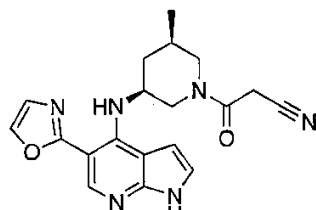


(R)-3-(3-((5-(1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

40

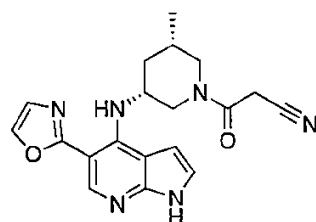


rac-(R)-3-(3-((5-(1,3,4-チアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

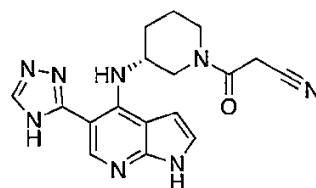


3-((3R,5S)-3-メチル-5-((5-(オキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

10

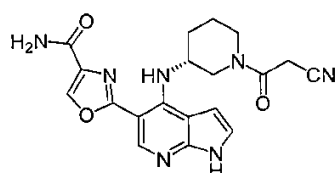


3-((3S,5R)-3-メチル-5-((5-(オキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

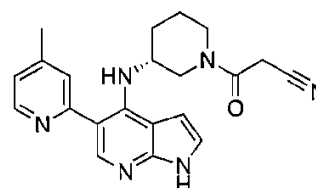


(R)-3-(3-((5-(4H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

20

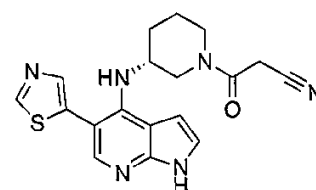


(R)-2-(4-((1-(2-シアノアセチル)ピペリジン-3-イル)アミノ)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)オキサゾール-4-カルボキサミド、



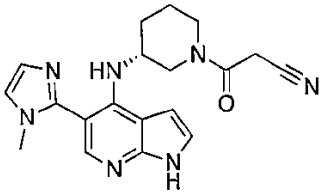
(R)-3-(3-((5-(4-メチルピリジン-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

30

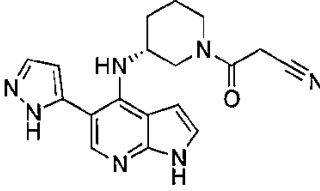


(R)-3-オキソ-3-(3-((5-(チアゾール-5-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロパンニトリル、

40

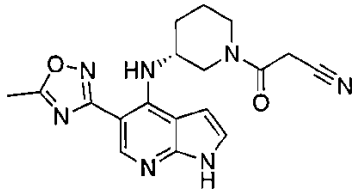


(R)-3-(3-((5-(1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

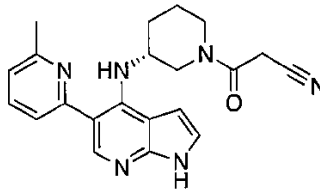


(R)-3-(3-((5-(1H-ピラゾール-5-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

10

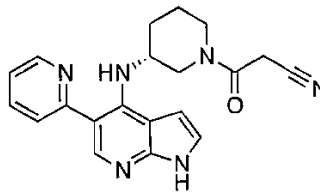


(R)-3-(3-((5-(5-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

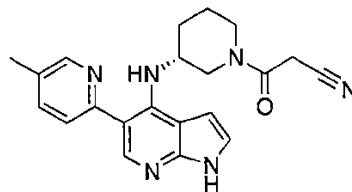


(R)-3-(3-((5-(6-メチルピリジン-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

20

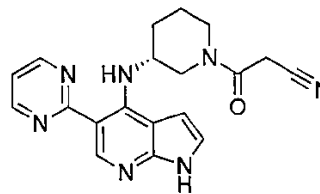


(R)-3-オキソ-3-(3-((5-(ピリジン-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロパンニトリル、



(R)-3-(3-((5-(5-メチルピリジン-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

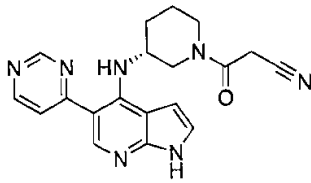
30



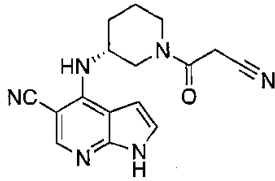
(R)-3-オキソ-3-(3-((5-(ピリミジン-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロパンニトリル、

40

50

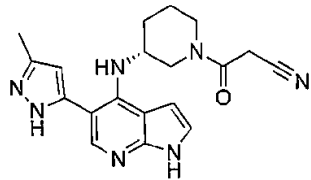


(R)-3-オキソ-3-(3-((5-(ピリミジン-4-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロパンニトリル、

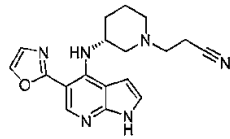


(R)-4-((1-(2-シアノアセチル)ピペリジン-3-イル)アミノ)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-カルボニトリル、

10

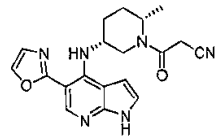


(R)-3-(3-((5-(3-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

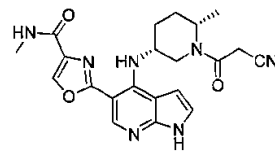


(R)-3-(3-((5-(オキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロパンニトリル、

20

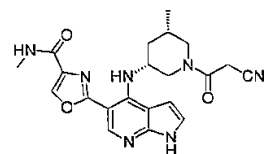


3-((2S,5R)-2-メチル-5-((5-(オキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

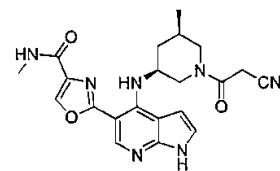


2-(4-(((3R,6S)-1-(2-シアノアセチル)-6-メチルピペリジン-3-イル)アミノ)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-N-メチルオキサゾール-4-カルボキサミド、

30

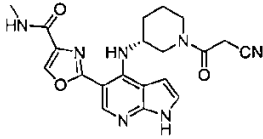


2-(4-(((3R,5S)-1-(2-シアノアセチル)-5-メチルピペリジン-3-イル)アミノ)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-N-メチルオキサゾール-4-カルボキサミド、

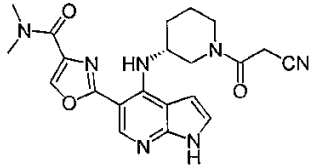


2-(4-(((3S,5R)-1-(2-シアノアセチル)-5-メチルピペリジン-3-イル)アミノ)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-N-メチルオキサゾール-4-カルボキサミド、

40

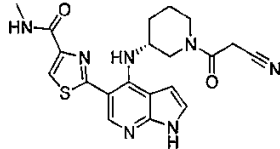


(R)-2-(4-((1-(2-シアノアセチル)ピペリジン-3-イル)アミノ)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-N-メチルオキサゾール-4-カルボキサミド、

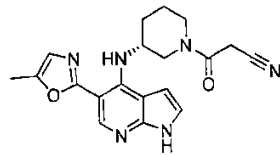


(R)-2-(4-((1-(2-シアノアセチル)ピペリジン-3-イル)アミノ)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-N,N-ジメチル-オキサゾール-4-カルボキサミド、

10

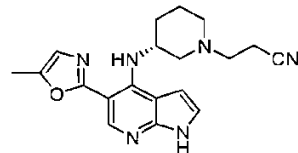


(R)-2-(4-((1-(2-シアノアセチル)ピペリジン-3-イル)アミノ)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-N-メチルチアゾール-4-カルボキサミド、

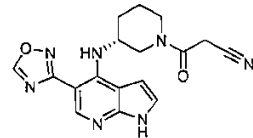


(R)-3-(3-((5-(5-メチルオキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

20

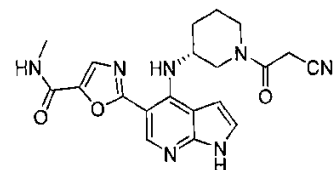


(R)-3-(3-((5-(5-メチルオキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロパンニトリル、

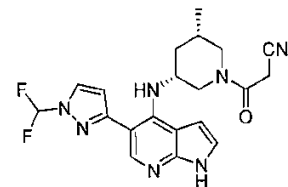


(R)-3-(3-((5-(1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

30

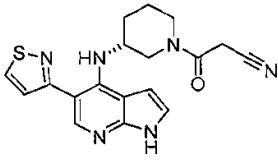


(R)-2-(4-((1-(2-シアノアセチル)ピペリジン-3-イル)アミノ)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-N-メチルオキサゾール-5-カルボキサミド、

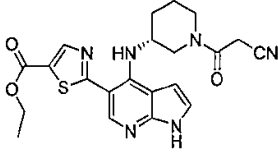


3-((3R,5S)-3-((5-(1-(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-3-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

40

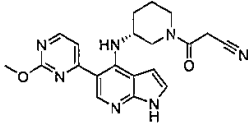


(R)-3-(3-((5-(イソチアゾール-3-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

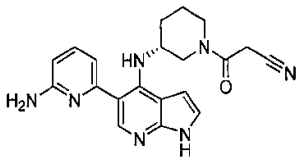


(R)-2-(4-((1-(2-シアノアセチル)ピペリジン-3-イル)アミノ)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)チアゾール-5-カルボキシレート、

10

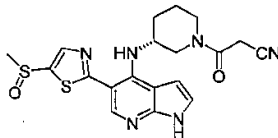


(R)-3-(3-((5-(2-メトキシピリミジン-4-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

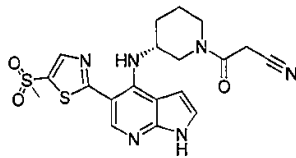


(R)-3-(3-((5-(6-アミノピリジン-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

20

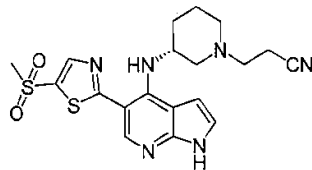


3-(3R)-3-(3-((5-(5-(メチルスルフィニル)チアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

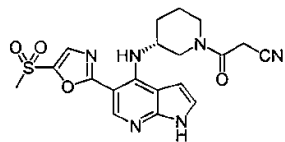


(R)-3-(3-((5-(5-(メチルスルホニル)チアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

30

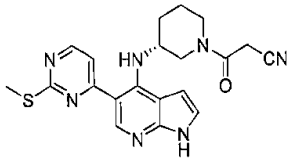


(R)-3-(3-((5-(5-(メチルスルホニル)チアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロパンニトリル、

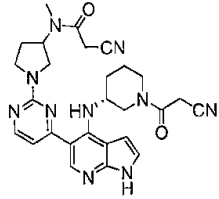


(R)-3-(3-((5-(5-(メチルスルホニル)オキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

40

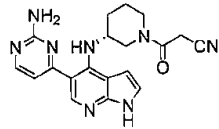


(R)-3-(3-(5-(2-(メチルチオ)ピリミジン-4-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

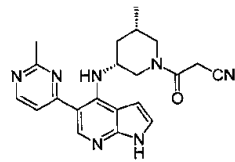


2-シアノ-N-(1-(4-(4-((R)-1-(2-シアノアセチル)ピペリジン-3-イル)アミノ)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)ピリミジン-2-イル)ピロリジン-3-イル)-N-メチルアセトアミド、

10

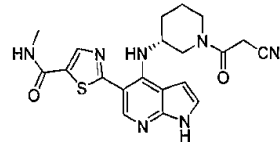


(R)-3-(3-(5-(2-アミノピリミジン-4-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

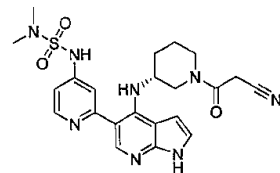


3-(3S,5R)-3-メチル-5-(5-(2-メチルピリミジン-4-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

20

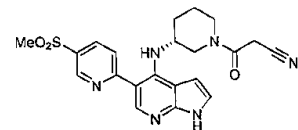


(R)-2-(4-(1-(2-シアノアセチル)ピペリジン-3-イル)アミノ)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-N-メチルチアゾール-5-カルボキサミド、

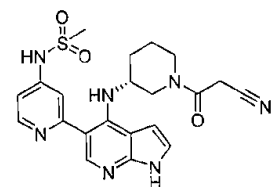


(R)-N-(2-(4-(1-(2-シアノアセチル)ピペリジン-3-イル)アミノ)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)ピリジン-4-イル)N,N-ジメチル硫酸ジアミド、

30



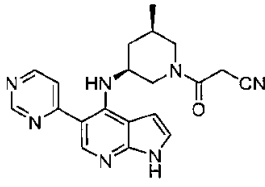
(R)-3-(3-(5-(5-(メチルスルホニル)ピリジン-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、



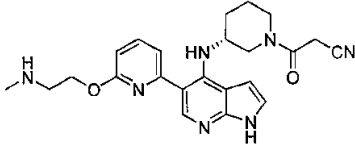
(R)-N-(2-(4-(1-(2-シアノアセチル)ピペリジン-3-イル)アミノ)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)ピリジン-4-イル)メタンスルホンアミド、

40

50

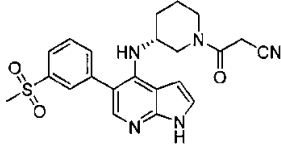


3-((3R, 5S)-3-メチル-5-(5-(ピリミジン-4-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

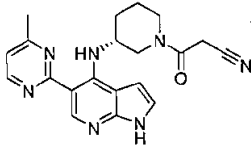


(R)-3-(3-(5-(1H-ピラゾール-5-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

10

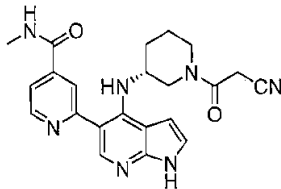


(R)-3-(3-(5-(3-(メチルスルホニル)フェニル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

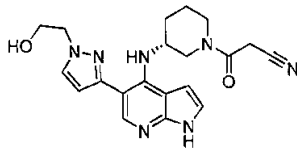


(R)-3-(3-(5-(4-メチルピリジン-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

20

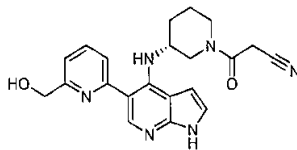


(R)-2-(4-((1-(2-シアノアセチル)ピペリジン-3-イル)アミノ)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル)-N-メチルイソニコチンアミド、

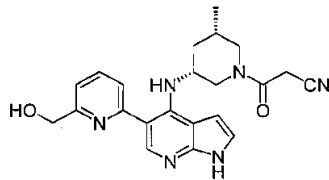


(R)-3-(3-(5-(1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピラゾール-3-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

30

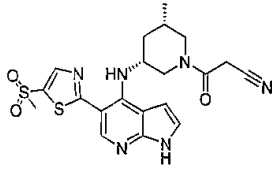


(R)-3-(3-(5-(3-(ヒドロキシメチル)フェニル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

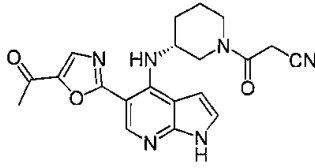


3-((3R, 5S)-3-(5-(6-(ヒドロキシメチル)ピリジン-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

40

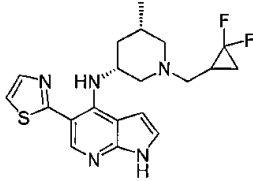


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(5-(メチルスルホニル)チアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

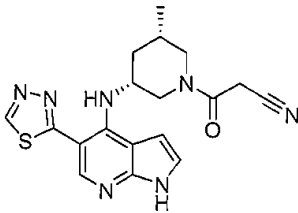


(R)-3-(3-((5-(5-アセチルオキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

10

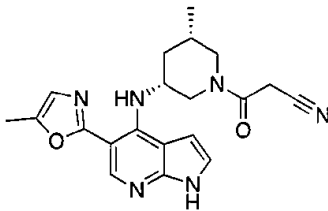


N-((3R, 5S)-1-((2, 2-ジフルオロシクロプロピル)メチル)-5-メチルピペリジン-3-イル)-5-(チアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-アミン、

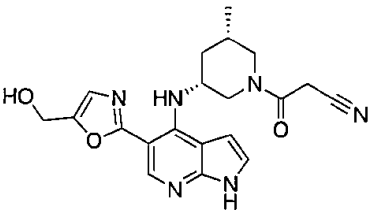


3-((3R, 5S)-3-((5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

20

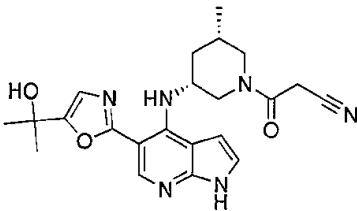


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(5-メチルオキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、



3-((3R, 5S)-3-((5-(5-(ヒドロキシメチル)オキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

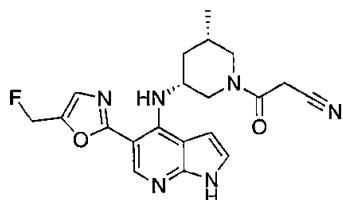
30



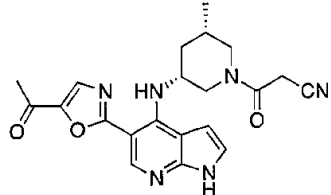
3-((3R, 5S)-3-((5-(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)オキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

40

50

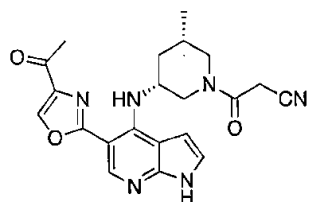


3-((3R, 5S)-3-((5-(5-(フルオロメチル)オキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

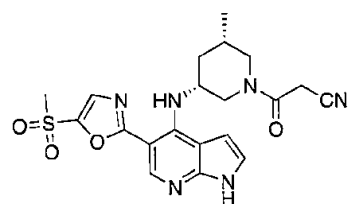


3-((3R, 5S)-3-((5-(5-アセチルオキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

10

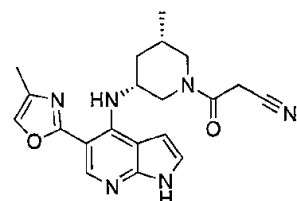


3-((3R, 5S)-3-((5-(4-アセチルオキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

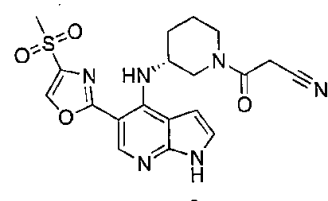


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(5-(メチルスルホニル)オキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

20

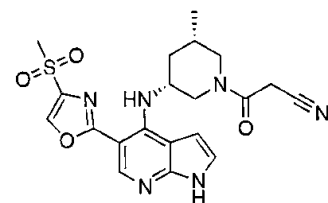


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(4-メチルオキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、



(R)-3-((3-((5-(4-(メチルスルホニル)オキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

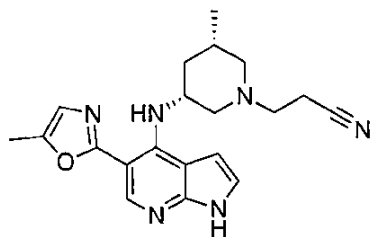
30



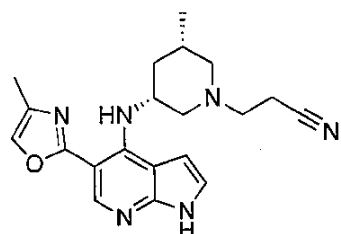
3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(4-(メチルスルホニル)オキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

40

50

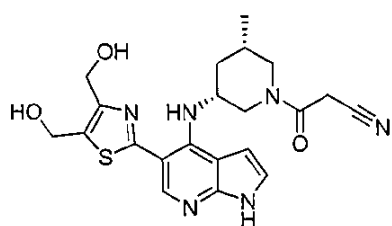


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(5-メチルオキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロパンニトリル、



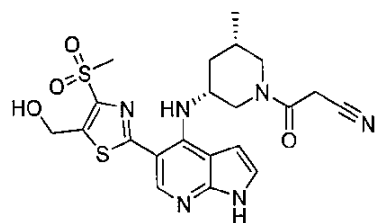
3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(4-メチルオキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロパンニトリル、

10

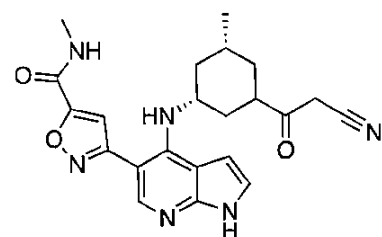


3-((3R, 5S)-3-((5-(4,5-ビス(ヒドロキシメチル)チアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

20

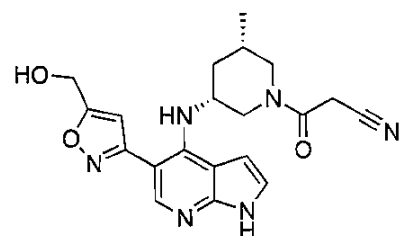


3-((3R, 5S)-3-((5-(5-(ヒドロキシメチル)-4-(メチルスルホニル)チアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、



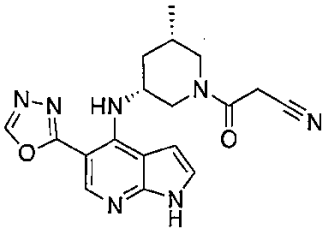
3-(4-(((1R, 5R)-3-(2-シアノアセチル)-5-メチルシクロヘキシル)アミノ)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-N-メチルイソオキサゾール-5-カルボキサミド、

30

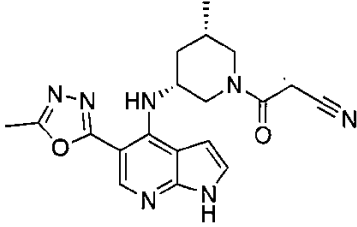


3-((3R, 5S)-3-((5-(5-(ヒドロキシメチル)イソオキサゾール-3-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

40

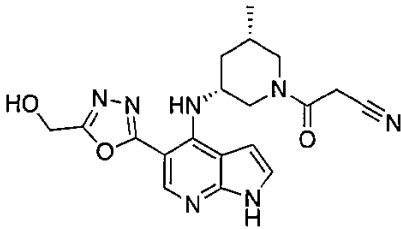


3-((3R, 5S)-3-((5-(1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、



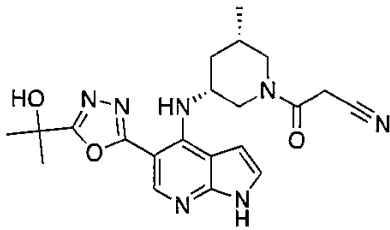
3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(5-メチル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

10

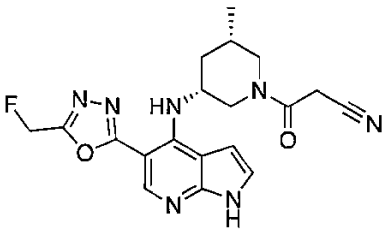


3-((3R, 5S)-3-((5-(5-(ヒドロキシメチル)-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

20

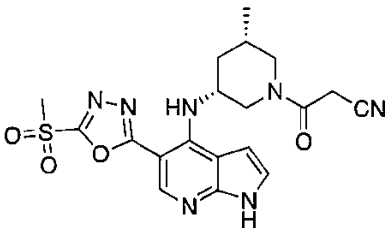


3-((3R, 5S)-3-((5-(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、



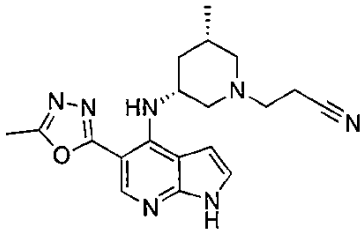
3-((3R, 5S)-3-((5-(5-(フルオロメチル)-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

30

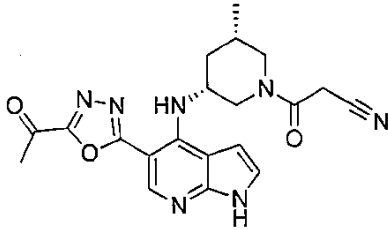


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(5-(メチルスルホニル)-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

40

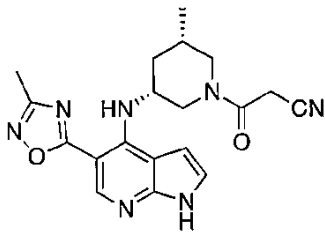


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(5-メチル-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロパンニトリル、



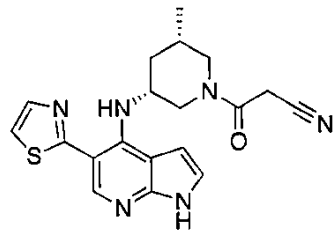
3-((3R, 5S)-3-((5-(5-アセチル-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

10

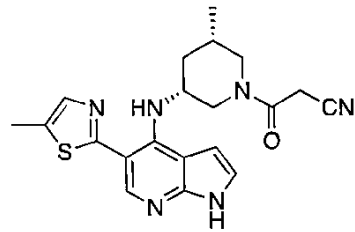


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

20

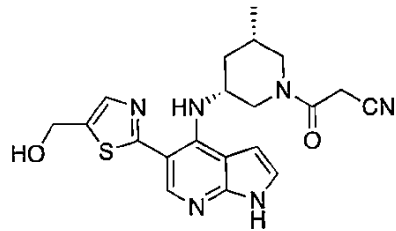


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(チアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、



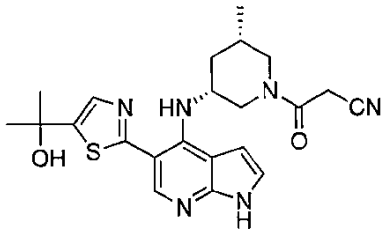
3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(5-メチルチアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

30

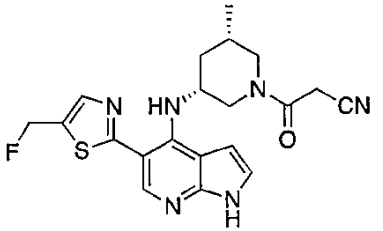


3-((3R, 5S)-3-((5-(5-(ヒドロキシメチル)チアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

40

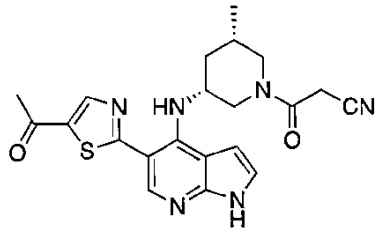


3-((3R, 5S)-3-((5-(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)チアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、



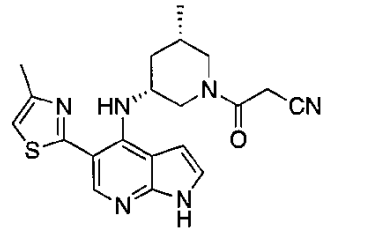
3-((3R, 5S)-3-((5-(5-(フルオロメチル)チアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

10

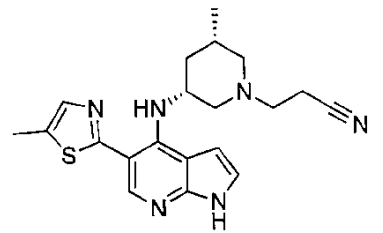


3-((3R, 5S)-3-((5-(5-(アセチルチアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

20

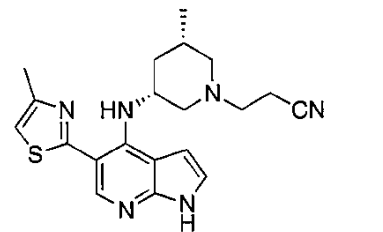


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(4-メチルチアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、



3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(5-メチルチアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロパンニトリル、

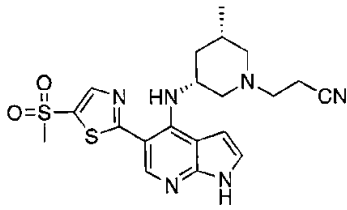
30



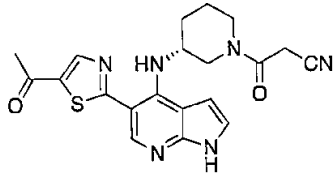
3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(4-メチルチアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロパンニトリル、

40

50

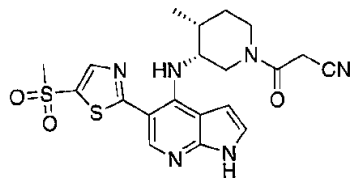


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(5-(メチルスルホニル)チアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロパンニトリル、

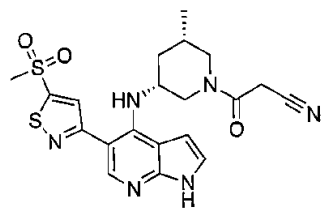


(R)-3-((5-(5-アセチルチアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

10

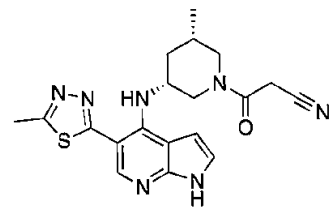


3-((3R, 4R)-4-メチル-3-((5-(5-(メチルスルホニル)チアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

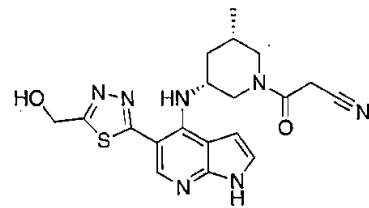


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(5-(メチルスルホニル)イソチアゾール-3-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

20

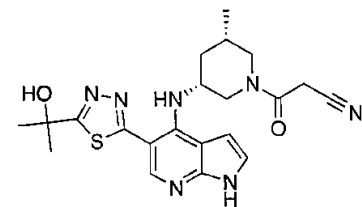


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(5-(メチル-1,3,4-チアジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、



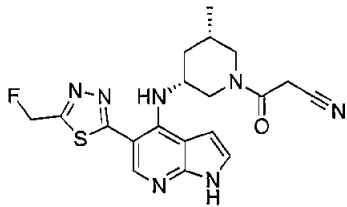
3-((3R, 5S)-3-((5-(5-(ヒドロキシメチル)-1,3,4-チアジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

30

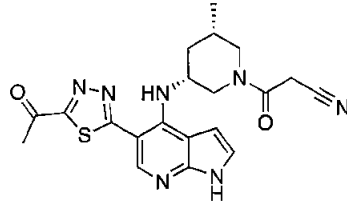


3-((3R, 5S)-3-((5-(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-1,3,4-チアジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

40

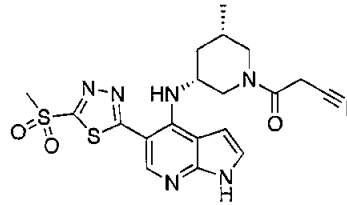


3-((3R, 5S)-3-(5-(5-(フルオロメチル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

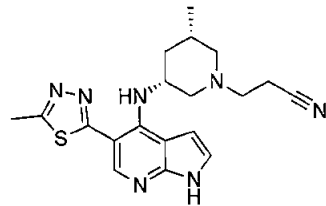


3-((3R, 5S)-3-(5-(5-アセチル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

10

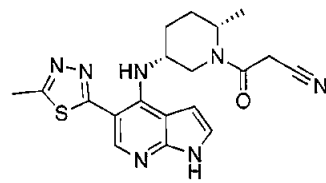


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-(5-(5-(メチルスルホニル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

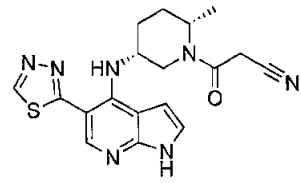


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-(5-(5-メチル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロパンニトリル、

20

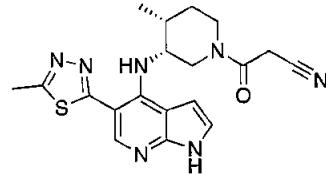


3-((2S, 5R)-2-メチル-5-(5-(5-メチル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、



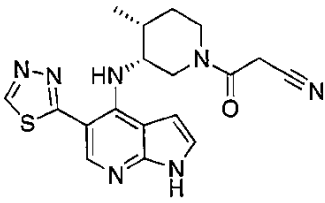
3-((2S, 5R)-5-(5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-2-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

30

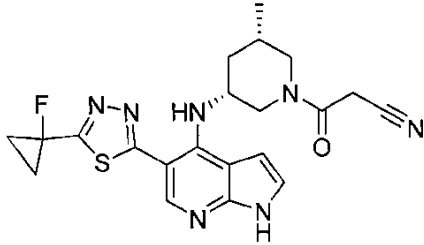


3-((3R, 4R)-4-メチル-3-(5-(5-メチル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

40

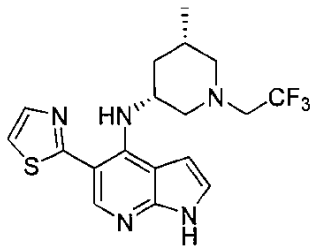


3-((3R, 4R)-3-(5-(1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-4-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、



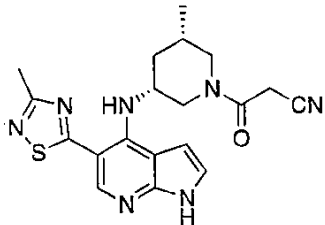
3-((3R, 5S)-3-(5-(5-(1-フルオロシクロプロピル)-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

10

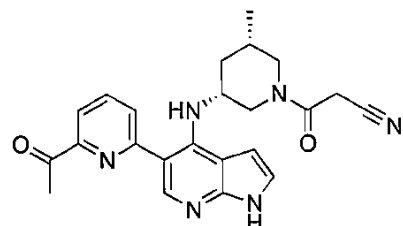


N-((3R, 5S)-5-メチル-1-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)ピペリジン-3-イル)-5-(チアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-アミン、

20

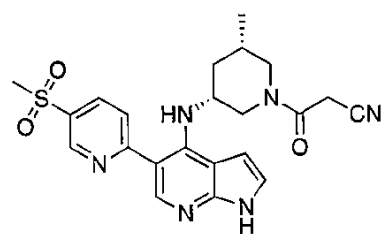


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-(5-(3-メチル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、



3-((3R, 5S)-3-(5-(6-アセチルピリジン-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

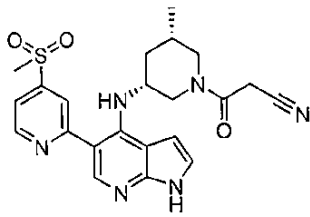
30



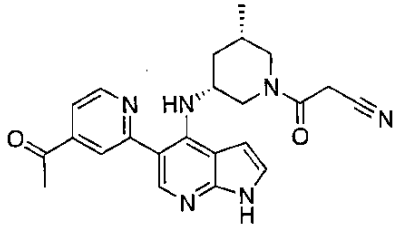
3-((3S, 5R)-3-メチル-5-(5-(5-(メチルスルホニル)ピリジン-2-イル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

40

50

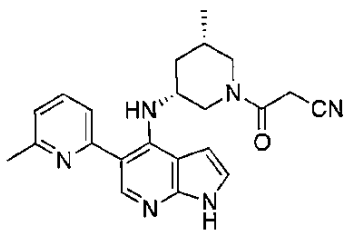


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-(5-(4-(メチルスルホニル)ピリジン-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、



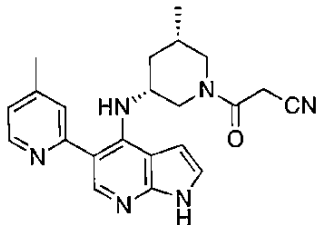
3-((3R, 5S)-3-(5-(4-アセチルピリジン-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

10

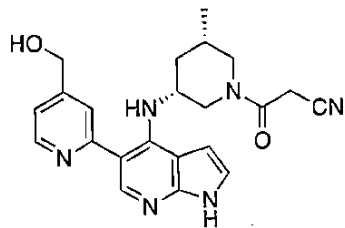


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-(5-(6-メチルピリジン-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

20

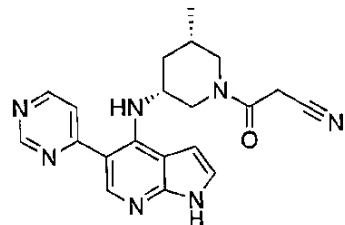


3-((3S, 5R)-3-メチル-5-(5-(4-メチルピリジン-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、



3-((3R, 5S)-3-(5-(4-(ヒドロキシメチル)ピリジン-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

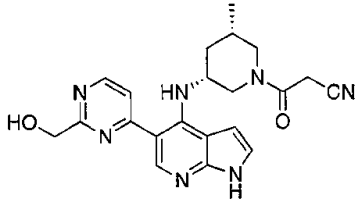
30



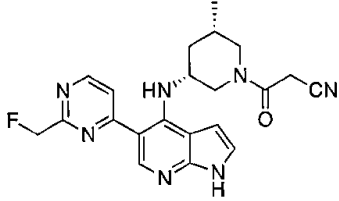
3-((3S, 5R)-3-メチル-5-(5-(ピリミジン-4-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

40

50

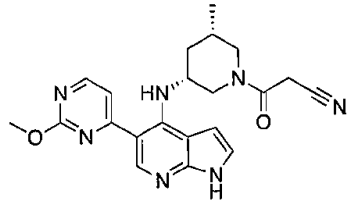


3-((3R, 5S)-3-((5-(2-(ヒドロキシメチル)ピリミジン-4-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

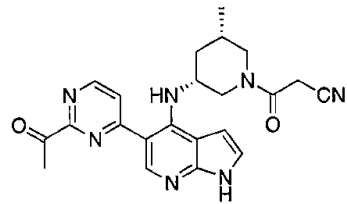


3-((3R, 5S)-3-((5-(2-(フルオロメチル)ピリミジン-4-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

10

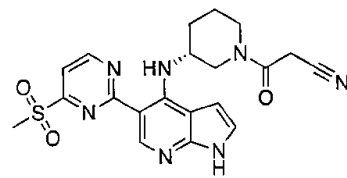


3-((3R, 5S)-3-((5-(2-(メトキシピリミジン-4-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

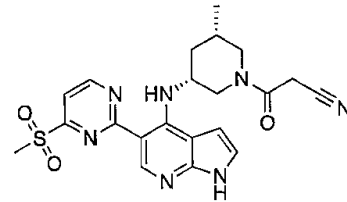


3-((3R, 5S)-3-((5-(2-(アセチルピリミジン-4-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

20

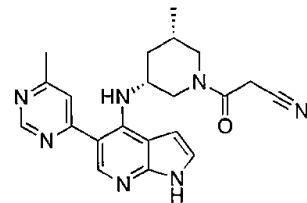


(R)-3-((3-((5-(4-(メチルスルホニル)ピリミジン-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、



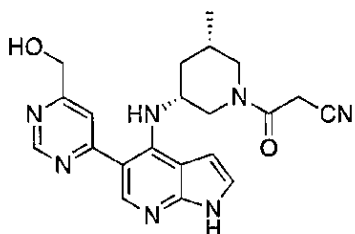
3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(4-(メチルスルホニル)ピリミジン-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

30



3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(6-メチルピリミジン-4-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、および

40

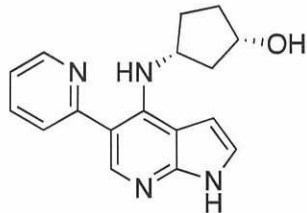


3-((3R, 5S)-3-((5-(6-(ヒドロキシメチル)ピリミジン-4-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル

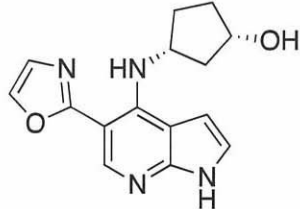
50

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】



(1S, 3R)-3-((5-(ピリジン-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)シクロペンタン-1-オール、



(1S, 3R)-3-((5-(オキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)シクロペンタン-1-オール、
および



2-(4-(((1S, 3R)-3-ヒドロキシシクロペンチル)アミノ)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)オキサゾール-4-カルボキサミド

10

20

からなる群から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 7】

請求項 1 ~ 6 に記載の化合物、その誘導体、またはその組合せを含む医薬組成物。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 7 に記載の化合物、その誘導体、またはその組合せを含む、対象において JAK 媒介性疾患を処置するための医薬組成物。

【請求項 9】

他の治療剤をさらに含む、請求項 8 に記載の医薬組成物。

30

【請求項 10】

前記 JAK 媒介性疾患が、自己免疫障害または自己免疫応答、免疫応答の広範な活性化、細菌感染症、ウイルス感染症、炎症、慢性および/もしくは急性炎症性障害もしくは状態、ならびに/または自己炎症性障害、線維性障害、代謝障害、新生物、または心血管障害もしくは脳血管障害、皮膚障害、掻痒症、脱毛障害、がんまたは悪性腫瘍、自己免疫性結合組織疾患および自己免疫性状態；ステイル病、成人発症型ステイル病、Th17 関連炎症、多発軟骨炎（例えば再発性多発軟骨炎）；筋炎、多発性筋炎、自己免疫性筋炎、皮膚筋炎、若年性皮膚筋炎；重症筋無力症；関節炎（例えば関節リウマチ、若年性関節リウマチ、全身性若年性関節リウマチ、骨関節炎、感染性関節炎、炎症性関節炎、炎症性腸疾患関連関節炎、特発性関節炎、若年性特発性関節炎、全身性若年性特発性関節炎、乾癬性関節炎）、椎骨炎/脊椎関節炎/脊椎関節症（強直性脊椎炎）、痛風、強皮症（全身性強皮症、若年性強皮症）、ライター症候群/反応性関節炎、ライム病、狼瘡/全身性エリテマトーデス（SLE）、エリテマトーデス、小児性全身性エリテマトーデス、皮膚ループス（準急性皮膚ループス、慢性皮膚ループス/円板状ループス、凍瘡エリテマトーデス）、リウマチ性多発筋痛症、腱付着部炎、混合性結合組織疾患、腱付着部症、心炎、心筋炎、血管新生障害、骨髄異形成症候群、アテローム性動脈硬化症、再狭窄（アテローム硬化型冠動脈の再狭窄）、急性冠不全症候群、心筋梗塞、心臓同種異系移植血管障害、移植動脈症；血管炎（大血管血管炎、小血管血管炎、巨細胞動脈炎、結節性多発動脈炎、血管炎症候群：高安動脈炎、ウェゲナー肉芽腫症、ベーチェット氏病を含む）、乳児発症性の

40

50

インターフェロン遺伝子刺激物質（S T I N G）関連血管障害（S A V I）；消化器疾患、小腸結腸炎、大腸炎、炎症性腸疾患（潰瘍性大腸炎、クローン病）、過敏性腸症候群、腸炎症候群／瘻性結腸、セリアック病；急性および慢性膵炎；原発性胆汁性肝硬変、原発性硬化性胆管炎、黄疸、肝硬変症、例えば、原発性胆汁性肝硬変または脂肪肝疾患による肝硬変症（例えば、アルコール性および非アルコール性脂肪変性）；食道炎、胃炎、胃および十二指腸潰瘍、腹膜炎；腎症、免疫媒介性糸球体腎症、自己免疫性腎症、膜性糸球体症、慢性進行性腎症、糖尿病性腎臓疾患／糖尿病性腎症、腎臓線維症、腎臓虚血性／再灌流傷害、H I V関連腎症、尿管閉塞性腎症、糸球体硬化症、タンパク質尿、ネフローゼ症候群、多発性嚢胞腎、常染色体優性多発性嚢胞腎、免疫媒介性腎症である腎症、自己免疫性腎症、慢性進行性腎症、糖尿病性腎症、腎臓線維症、関連の虚血性／再灌流傷害、H I V関連腎症、尿管閉塞性腎症、糸球体腎炎、慢性腎臓疾患（例えば、糖尿病性腎症）、高血圧誘発性腎症、糸球体硬化症、タンパク質尿、ネフローゼ症候群、多発性嚢胞腎、常染色体優性多発性嚢胞腎、糖尿病性腎臓疾患、ループス腎炎；間質性膀胱炎；歯周炎、歯肉炎；肺炎症、副鼻腔炎、肺炎、気管支炎、喘息、気管支喘息、アレルギー性喘息、非アレルギー性喘息、アレルギー性気管支肺真菌症、アスピリン誘発製喘息、成人発症型喘息、固定性気流閉塞を伴う喘息、運動誘発喘息、咳喘息、職業関連喘息、夜間（夜行性）喘息、肥満を伴う喘息、好酸球性喘息、ステロイド耐性喘息／重症喘息、外因性喘息、内因性／原因不明の喘息、チャグストラウス症候群、細気管支炎、閉塞性細気管支炎、慢性閉塞性肺疾患（C O P D）、間質性肺疾患（肺線維症、特発性肺線維症）、急性肺損傷、肺線維症（例えば、特発性肺線維症または嚢胞性線維症）、慢性閉塞性肺疾患、成人呼吸促迫症候群、急性肺損傷、薬物誘発性肺損傷；メニエール病；眼の障害、（例えば）、眼の炎症、ブドウ膜炎、ドライアイ／乾性角結膜炎、強膜炎、上強膜炎、角膜炎／角膜症、脈絡膜炎、レチナル血管炎、視神経炎、網膜症（糖尿病性網膜症、免疫介在性網膜症、黄斑変性、湿性黄斑変性、乾性（加齢に伴う）黄斑変性）を含めたものなど；肥満細胞症、鉄欠損症貧血、尿毒症、好酸球増加症候群（H E S）、全身性肥満細胞疾患（S M C D）、骨髓異形成症候群、特発性血小板減少性紫斑病；骨吸収疾患；神経変性障害、神経系／神経筋の障害（例えば）、多発性硬化症、パーキンソン病、ハンチントン病、筋萎縮性側索硬化症（A L S）（家族性A L S、散発性A L S）、アルツハイマー病、重症筋無力症、ランバートイートン筋無力症候群（L E M S）、ギランバレー症候群、髄膜炎、脳炎、外傷性脳傷害；神経系損傷、寄生虫妄想症、ニューロンプロセスおよび感覚性認知の異常調節、脳卒中／ニューロンの虚血、脊髄損傷、末梢神経障害、幻触、脊髄損傷、精神疾患；疼痛（急性疼痛、慢性疼痛、神経障害性疼痛、または線維筋痛）知覚異常、神経刺激、末梢神経障害；掻痒症／かゆみ（アトピー性掻痒症、乾性掻痒症、乾癬関連の掻痒症／乾癬のかゆみ／乾癬関連のかゆみ）、急性掻痒症、慢性掻痒症、特発性掻痒症、慢性特発性のかゆみ、胆管性のかゆみ、肝胆道関連のかゆみ、腎臓関連のかゆみ／腎臓のかゆみ、尿毒性かゆみ、胆汁うっ滞、妊娠時の肝内胆汁うっ滞、慢性単純性苔癬関連の掻痒症、リンパ腫関連のかゆみ、白血病関連のかゆみ、結節性痒疹、アトピー性皮膚炎関連のかゆみ、アトピー性かゆみ／アトピー性掻痒症、水疱性かゆみ、腕橈骨の掻痒症、神経原性かゆみ、神経障害性かゆみ、背部錯感覚症、H I Vのそう痒性丘疹状発疹、心因性かゆみ、水泳性痒疹、掻痒症または尿毒性かゆみ、じんま疹性かゆみ；皮膚の障害（例えば）、皮膚の薬物反応／薬疹、乾燥症／乾燥皮膚、皮膚発疹、皮膚増感作用、皮膚刺激、日焼け、髭剃り疹、ヒトジラミ、アタマジラミ／シラミ寄生症、毛ジラミ、皮膚幼虫移行症、疥癬、寄生虫感染症、昆虫寄生、じんま疹性／発疹、丘疹状じんま疹、虫刺され、昆虫刺傷、フケ、皮膚上の異物またはデバイス、真菌感染症、ヘルペス、水痘／水疱瘡、好酸球性毛包炎、妊娠時の皮膚病／妊娠時のそう痒性じんま疹性丘疹およびプラーク（P U P P）、炎症性皮膚病、好中球皮膚病、組織球好中球皮膚病、腸バイパス症候群皮膚病、乾癬／尋常性乾癬、扁平苔癬、硬化性苔癬、ざ瘡（尋常性ざ瘡、面皰性のざ瘡、炎症性ざ瘡、小節嚢胞性ざ瘡、瘢痕性ざ瘡、ケロイドざ瘡頂部）、アトピー（アレルギー性接触感作、アレルギー性皮膚炎）皮膚炎（アトピー性皮膚炎／湿疹、接触性皮膚炎、光線皮膚炎、脂漏性皮膚炎、うっ血皮膚炎、急性熱性好中球皮膚病（スイート症候群）、リポジストロフィおよ

10
20
30
40
50

び高温症候群を伴う慢性非定型好中球皮膚病（C A N D L E 症候群）、化膿性汗腺炎、発疹、壊疽性膿皮症、脱毛症（眉脱毛症、鼻孔間毛髪脱毛症、癬痕性脱毛症（例えば、癬痕性の脱毛症、頭頂部遠心性癬痕性脱毛症、扁平毛孔性苔癬、前頭部線維形成性脱毛症、脱毛性毛包炎）、非癬痕性脱毛症（円形脱毛症（A A）（斑点状A A、全頭脱毛症（A T））、汎発性脱毛症（A U）、蛇行性パターン円形脱毛症、シサイフォ(sisaihpo)パターン円形脱毛症）、アンドロゲン性／男性ホルモン性脱毛症（A G A）／男性および女性パターンのA G A）、休止期脱毛、頭部白癬、貧毛症（遺伝性単純性貧毛症）、扁平毛孔性苔癬（前頭部線維形成性脱毛症）、点状掌蹠角皮症、持久性隆起性紅斑（E E D）、好中球性漏出分泌汗腺炎、柵状好中球肉芽腫性皮膚炎、好中球じんま疹性皮膚病、分節型尋常性白斑を含む白斑（単分節型尋常性白斑、二分節型尋常性白斑、多分節型尋常性白斑）非分節型尋常性白斑（指趾、顔面、または四肢顔面型尋常性白斑、顔面中央型尋常性白斑、粘膜型尋常性白斑、コンフェッティ型尋常性白斑、三色尋常性白斑、辺縁炎症性尋常性白斑、四色尋常性白斑、青色尋常性白斑、ケブネル現象、尋常性白斑、汎発型尋常性白斑、全身型尋常性白斑）、混合型尋常性白斑／分節型関連の非分節型尋常性白斑、限局型尋常性白斑、単独の粘膜型尋常性白斑または白毛症（体毛を含む）を伴うもしくは伴わない尋常性白斑；水疱性疾患、免疫水疱性疾患（水疱性類天疱瘡、癬痕性類天疱瘡、尋常性天疱瘡、線状I g A 疾患）、妊娠性類天疱瘡、色素性乾皮症；線維症および癬痕性の障害：類線維腫、肝臓線維症、肺線維症、特発性肺線維症、軽度の癬痕、例えば、強皮症、線維症の増大、ケロイド、手術後癬痕；創傷治癒、手術後癬痕、放射線誘発性線維症（例えば、頭頸部、消化器系または肺）、C N S 癬痕、消化管または消化器系線維症、腎臓線維症、肝臓または胆管線維症、肝線維症（例えば、非アルコール性脂肪性肝炎、C 型肝炎、または肝細胞癌）、心臓線維症（例えば、心内膜心筋線維症または心房線維症）、眼用癬痕、線維性硬化症、癬痕増大、外傷または疥癬治癒、ケロイド、縦隔線維症、骨髄線維症、後腹膜線維症／オーモンド病、進行性塊状線維症、腎原性全身性線維症；シェーグレン症候群、サルコイドーシス、家族性地中海熱、クリオピリン関連周期性症候群（マックルウェルズ症候群、家族性低温性自己炎症症候群／家族性寒冷じんま疹／T N F 受容体関連周期性症候群、新生児期発症多臓器性炎症性疾患）、過酸素症誘発性炎症、再灌流傷害、手術後外傷、組織傷害、高温症候群；糖尿病（I 型糖尿病、I I 型糖尿病）／真性糖尿病、橋本甲状腺炎、グレーブス病、アジソン病、キャスルマン病、副甲状腺機能亢進症、更年期障害、肥満、ステロイド - 耐性、耐糖能障害、メタボリックシンドローム、甲状腺疾患、下垂体炎；全身性免疫老化；自己免疫性萎縮性胃炎、悪性貧血の自己免疫性萎縮性胃炎、自己免疫性脳脊髄炎、自己免疫性睾丸炎、グッドパスチャー病、シェーグレン症候群、自己免疫性血小板減少症、交感神経性眼炎；自己免疫疾患の2次的血液系所見（例えば、貧血）、自己免疫性溶血性症候群（自己免疫性溶血性貧血）、自己免疫性および炎症性肝炎、自己免疫性卵巣不全、自己免疫性血小板減少症、シリコーンインプラント関連自己免疫疾患、薬物誘発性自己免疫病、H I V 関連自己免疫性症候群、金属誘発性自己免疫病、自己免疫性難聴、自己免疫性甲状腺障害；過敏性反応を含むアレルギーおよびアレルギー反応、例えば、I 型過敏性反応（例えば、アナフィラキシーを含む）、I I 型過敏性反応（例えば、グッドパスチャー病、自己免疫性溶血性貧血）、I I I 型過敏性反応疾患（例えばアルチュス反応、血清病）、およびI V 型過敏性反応（例えば接触性皮膚炎、同種移植片拒絶反応）；急性および慢性感染症、敗血症症候群（敗血症、敗血症性ショック、エンドトキシンショック、外毒素誘発性毒素性ショック、グラム陰性敗血症、グラム陽性敗血症、真菌性敗血症、トキシックショック症候群）；急性および慢性感染症、敗血症症候群（敗血症、敗血症性ショック、エンドトキシンショック、外毒素誘発性毒素性ショック、グラム陰性敗血症、グラム陽性敗血症、真菌性敗血症、トキシックショック症候群）；拒絶：移植片対宿主反応／移植片対宿主疾患、同種移植片拒絶反応（例えば、急性同種移植片拒絶反応または慢性同種移植片拒絶反応）、早期の移植拒絶；悪性腫瘍、がん、リンパ腫、白血病、多発性骨髄腫、固形腫瘍、奇形腫、転移性および骨障害、内部がん、骨、口／咽頭、食道、喉頭、胃、腸、結腸、直腸、肺のがん（例えば、非小細胞肺癌または小細胞肺癌）、肝臓のがん（肝臓がん）、膵臓、神経、脳のがん（例えば、神経膠腫、多

10

20

30

40

50

形神経膠芽腫、星状細胞腫、神経芽細胞腫、およびシュワン細胞腫)、頭頸部、喉、卵巣、子宮、前立腺、精巣、膀胱、腎臓のがん(腎臓がん)、乳房、胆嚢、子宮頸部、甲状腺、前立腺、眼のがん(眼の悪性腫瘍)、および皮膚のがん(黒色腫、角化棘細胞腫); ならびに線維性がん、線維腫、線維腺腫、線維肉腫、骨髄増殖性障害、新生物(造血性新生物、骨髄性新生物、リンパ新生物(骨髄線維症、原発性骨髄線維症、真性赤血球増加症、本態性血小板血症))、白血病(急性リンパ性白血病、急性および慢性骨髄性白血病、慢性リンパ球性白血病、急性リンパ芽球性白血病、慢性骨髄単球性白血病(CMML)、または前骨髄球性白血病)、多発性骨髄腫および他の骨髄性悪性腫瘍(骨髄線維症を伴う骨髄性化生(MMM)、原発性骨髄線維症(PMF)、特発性骨髄線維症(IMF))、リンパ腫(ホジキン病、皮膚リンパ腫(皮膚T細胞リンパ腫、菌状息肉腫)、リンパ腫(例

10

えば、B細胞リンパ腫、T細胞リンパ腫、マントル細胞リンパ腫、有毛細胞リンパ腫、パーキットリンパ腫、肥満細胞腫瘍、ホジキン病または非ホジキン病); カポジ肉腫、横紋筋肉腫、精上皮腫、奇形癌、骨肉腫、甲状腺濾胞細胞がん; 外因性オピオイドまたは合成オピオイド蓄積の増加、錯覚性背痛、強迫性障害、強迫性障害関連ノスタルジア、ならびにこれらの組合せからなる群から選択される、請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項11】

他の治療剤が、化学療法剤、抗増殖剤、抗炎症剤、免疫調節剤、免疫抑制剤、神経栄養因子、心血管疾患を処置するための薬剤、糖尿病を処置するための薬剤、免疫不全障害を処置するための薬剤、およびこれらの組合せから選択される、請求項9に記載の医薬組成物。

20

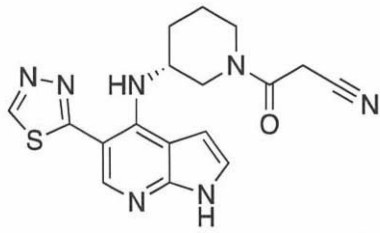
【請求項12】

JAK媒介性疾患が炎症性腸疾患である、請求項10に記載の医薬組成物。

【請求項13】

化合物が、対象において腸に限定された方式でJAK活性を阻害する、請求項12に記載の医薬組成物。

【請求項14】



rac-(R)-3-(3-((5-(1,3,4-チアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル

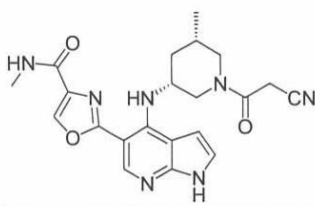
30

である、請求項5記載の化合物。

【請求項15】

請求項14記載の化合物、その誘導体、またはその組合せを含む医薬組成物。

【請求項16】



2-(4-(((3R,5S)-1-(2-シアノアセチル)-5-メチルピペリジン-3-イル)アミノ)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-N-メチルオキサゾール-4-カルボキサミド

40

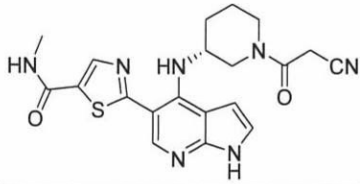
である、請求項5記載の化合物。

【請求項17】

50

請求項 1 6 記載の化合物、その誘導体、またはその組合せを含む医薬組成物。

【請求項 1 8】



(R)-2-(4-((1-(2-シアノアセチル)ピペリジン-3-イル)アミノ)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル)-N-メチルチアゾール-5-カルボキサミド

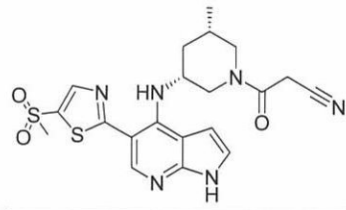
である、請求項 5 記載の化合物。

10

【請求項 1 9】

請求項 1 8 記載の化合物、その誘導体、またはその組合せを含む医薬組成物。

【請求項 2 0】



3-((3S,5R)-3-メチル-5-((5-(5-(メチルスルホニル)チアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル

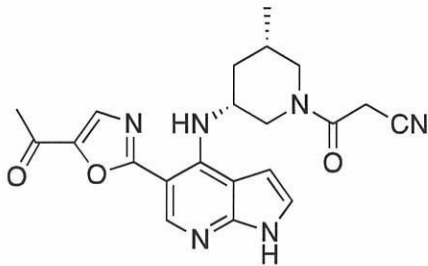
である、請求項 5 記載の化合物。

20

【請求項 2 1】

請求項 2 0 記載の化合物、その誘導体、またはその組合せを含む医薬組成物。

【請求項 2 2】



3-((3R,5S)-3-((5-(5-アセチルオキサゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)-5-メチルピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル

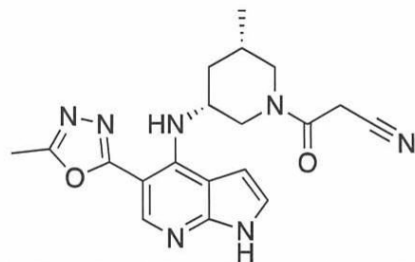
である、請求項 5 記載の化合物。

30

【請求項 2 3】

請求項 2 2 記載の化合物、その誘導体、またはその組合せを含む医薬組成物。

【請求項 2 4】



3-((3S,5R)-3-メチル-5-((5-(5-メチル-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)-3-オキソプロパンニトリル、

である、請求項 5 記載の化合物。

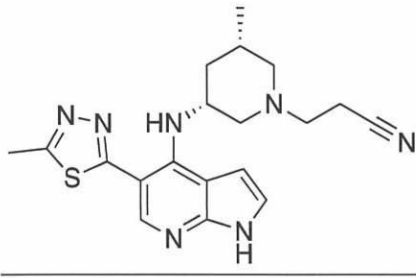
40

50

【請求項 2 5】

請求項 2 4 記載の化合物、その誘導体、またはその組合せを含む医薬組成物。

【請求項 2 6】



3-((3S, 5R)-3-メチル-5-((5-(5-メチル-1,3,4-チ
アジアゾール-2-イル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン
-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロパンニト
リル、

10

である、請求項 5 記載の化合物、その誘導体、またはその組合せを含む医薬組成物。

【請求項 2 7】

請求項 2 6 記載の化合物、その誘導体、またはその組合せを含む医薬組成物。

20

30

40

50