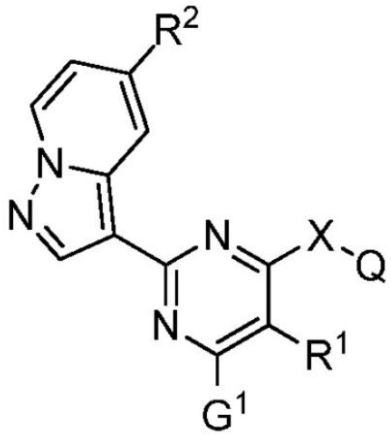
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和2年6月18日(2020.6.18)

【公表番号】特表2018-516954(P2018-516954A)
【公表日】平成30年6月28日(2018.6.28)
【年通号数】公開・登録公報2018-024
【出願番号】特願2017-563955(P2017-563955)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 471/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/08 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/14 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 21/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 7/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 29/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 7/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/14 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/14 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 45/00 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/5377 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/506 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 471/04 １０６Ａ
Ｃ０７Ｄ 471/04 ＣＳＰ
Ａ６１Ｐ 43/00 １１１
Ａ６１Ｐ 37/08
Ａ６１Ｐ 17/00
Ａ６１Ｐ 17/06
Ａ６１Ｐ 17/04
Ａ６１Ｐ 35/00
Ａ６１Ｐ 43/00 １０５
Ａ６１Ｐ 17/14

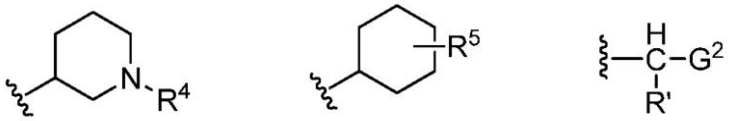
Ａ６１Ｐ　37/02
Ａ６１Ｐ　 9/00
Ａ６１Ｐ　21/00
Ａ６１Ｐ　 7/00
Ａ６１Ｐ　35/02
Ａ６１Ｐ　29/00　　１０１
Ａ６１Ｐ　19/02
Ａ６１Ｐ　25/00
Ａ６１Ｐ　25/02
Ａ６１Ｐ　 7/06
Ａ６１Ｐ　 3/10
Ａ６１Ｐ　11/06
Ａ６１Ｐ　11/00
Ａ６１Ｐ　11/14
Ａ６１Ｐ　11/02
Ａ６１Ｐ　 1/04
Ａ６１Ｐ　27/04
Ａ６１Ｐ　27/02
Ａ６１Ｐ　27/14
Ａ６１Ｋ　45/00
Ａ６１Ｐ　43/00　　１２１
Ａ６１Ｋ　31/5377
Ａ６１Ｋ　31/506

【誤訳訂正書】
【提出日】令和2年5月11日(2020.5.11)
【誤訳訂正１】
【訂正対象書類名】特許請求の範囲
【訂正対象項目名】全文
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
２－(ピラゾロピリジン－３－イル)ピリミジン誘導体を含む医薬であって、該２－(ピラゾロピリジン－３－イル)ピリミジン誘導体が、式（Ｉ）：
【化１】



式（Ｉ）

［式中、
・Ｘは、－Ｏ－または－ＮＲ^{3}－基を表し、
・Ｒ^{1}およびＲ^{2}は、独立して、水素原子、ハロゲン原子、直鎖または分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルキル、直鎖または分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルコキシ基および－ＣＮ基からなる群から選択され；
・Ｒ^{3}は、水素原子、直鎖または分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルキル基、－(ＣＨ$_{2}$)$_{1-3}$ＮＲ'Ｒ''基および－(ＣＨ$_{2}$)$_{1-3}$－ピロリジン基からなる群から選択され；
・Ｇ^{1}は、－ＣＮ基、－ＣＯ－Ｒ^{a}基、－Ｏ－Ｒ^{6}基、－(ＣＨＲ^{7})$_{m}$－ＮＲ'Ｒ''基、フェニル基、単環式Ｃ$_{5-7}$シクロアルキル基、Ｏ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式５～６員ヘテロアリール基、ならびにＯ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式５～６員ヘテロシクリル基からなる群から選択され、ここで、該フェニル基、該シクロアルキル基、該ヘテロアリール基および該ヘテロシクリル基は、非置換であるか、またはハロゲン原子、ヒドロキシル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルキル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-6}$－ヒドロキシアルキル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルコキシ基、－(ＣＨ$_{2}$)$_{0-2}$ＮＲ'Ｒ''基、－(ＣＨ$_{2}$)$_{0-2}$ＣＮ基および－ＣＯ－Ｒ^{a}基から選択される１個以上の置換基で置換されており、ここで、Ｒ^{a}は、水素原子、ヒドロキシル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-3}$アルキル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-3}$アルコキシ基、またはアミノ基を表し；
・Ｑは、
【化２】



Ｑ$_{a}$　　Ｑ$_{b}$　　Ｑ$_{c}$

（式中、
・Ｒ^{4}は、直鎖または分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルキル基、－ＣＯ－Ｒ'基、－ＣＯ(ＣＨ$_{2}$)$_{1-2}$－ＯＨ基；－ＣＯ(ＣＨ$_{2}$)$_{1-2}$－ＣＮ基、－ＣＯ(ＣＨ$_{2}$)$_{1-2}$－ＣＦ$_{3}$基、シアノチアゾール基、Ｏ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式４～６員ヘテロシクリル基、ならびにＯ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式５～６員ヘテロアリール基からなる群から選択され、ここで、該ヘテロシクリル基および該ヘテロアリール基は、独立して、非置換であるか、または－(ＣＨ$_{2}$)$_{m}$－ＣＮ基およびＣ$_{1-2}$ヒドロキシアルキル基から選択される１個以上の置換基で置換されており；
・Ｒ^{5}は、－(ＣＨ$_{2}$)$_{m}$－ＣＮ基または－(ＣＨ$_{2}$)$_{m}$－ＯＨ基を表し；
・Ｇ^{2}は、フェニル基、ピリミジン基またはピリジン基を表し、ここで、該フェニル基、該ピリミジン基および該ピリジン基は、非置換であるか、またはハロゲン原子、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルキル基、ヒドロキシル基、－ＣＮ基から選択される１個以上の置換基で置換されている）
からなる群から選択され；
・Ｒ^{6}は、水素原子、－(ＣＨ$_{2}$)$_{(1-2)}$－ＣＯ－Ｏ－Ｒ'''基、直鎖または分枝鎖(Ｃ$_{1-6}$アルコキシ)－(Ｃ$_{1-6}$アルキル)基および直鎖または分枝鎖Ｃ$_{1-6}$アルキル基からなる群から選択され、ここで、該直鎖または分枝鎖Ｃ$_{1-6}$アルキル基は、非置換であるか、またはハロゲン原子、ヒドロキシル基および－ＮＲ'Ｒ''基から選択される１個以上の置換基で置換されており；
・Ｒ^{7}は、水素原子、ヒドロキシル基またはＣ$_{1-2}$アルキル基を表し；
・Ｒ'およびＲ''は、独立して、水素原子、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-3}$アルキル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-3}$ヒドロキシアルキル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-3}$アルコキシ基を表し；
・Ｒ'''は、Ｃ$_{1-2}$アルキル基またはベンジル基を表し；

・ｍは、独立して、０～３の数値を有する］
で示される化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物もしくはＮ－オキシドもしくは立体異性体もしくは重水素化誘導体である（ただし、該２－(ピラゾロピリジン－３－イル)ピリミジン誘導体は、
・３－{(３Ｒ)－３－[[２－(ジメチルアミノ)エチル](５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]ピペリジン－１－イル}オキセタン－３－イル)アセトニトリル；
・(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]ピペリジン－１－カルボン酸エチル；
・２－{(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]ピペリジン－１－イル}－２－オキソエタノール；
・３－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[４－(ヒドロキシメチル)ピペリジン－１－イル]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－({５－フルオロ－６－[４－(ヒドロキシメチル)フェニル]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－{[５－フルオロ－６－(４－ホルミルフェニル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[(５－フルオロ－６－{３－ヒドロキシ－４－[(メチルアミノ)メチル]フェニル}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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
・３－{(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－{４－ヒドロキシ－３－[(メチルアミノ)メチル]フェニル}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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
ではない）医薬。
【請求項２】
２－(ピラゾロピリジン－３－イル)ピリミジン誘導体が、さらに
・３－{(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－ピペラジン－１－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－({６－[４－(ヒドロキシメチル)フェニル]－５－メチル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－{[６－(４－ホルミルフェニル)－５－メチル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－({５－フルオロ－６－[２－フルオロ－４－(ヒドロキシメチル)フェニル]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－{[５－フルオロ－６－(２－フルオロ－４－ホルミルフェニル)－

２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－({５－フルオロ－６－[３－(ヒドロキシメチル)フェニル]－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－{[５－フルオロ－６－(３－ホルミルフェニル)－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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－フルオロ－６－(３－ヒドロキシ－４－(ヒドロキシメチル)フェニル)－２－(ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イル)ピリミジン－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
・(Ｒ)－３－(３－((５－フルオロ－６－(４－ホルミル－３－ヒドロキシフェニル)－２－(ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イル)ピリミジン－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
ではない、請求項１記載の医薬。
【請求項３】
R^1が水素原子、フッ素原子、塩素原子またはメチル基を表す、請求項１または２記載の医薬。
【請求項４】
R^1がフッ素原子、水素原子またはメチル基を表す、請求項１～３いずれか１項記載の医薬。
【請求項５】
R^2が水素原子またはフッ素原子を表す、請求項１～４いずれか１項記載の医薬。
【請求項６】
R^2が水素原子を表す、請求項１～５いずれか１項記載の医薬。
【請求項７】
Ｘが－Ｏ－または－ＮR^3－基を表す、請求項１～６いずれか１項記載の医薬。
【請求項８】
R^3が水素原子を表す、請求項７記載の医薬。
【請求項９】
ＱがQ_aを表す、請求項１～８いずれか１項記載の医薬。
【請求項１０】
R^4が－ＣＯ$(CH_2)_{1-2}$－ＯＨ基または－ＣＯ$(CH_2)_{1-2}$－ＣＮ基を表す、請求項９記載の医薬。
【請求項１１】
R^4が－Ｃ(Ｏ)CH_2ＯＨ基または－Ｃ(Ｏ)CH_2ＣＮ基を表す、請求項９または１０記載の医薬。
【請求項１２】
G^1が、－Ｏ－R^6基、ＣＮ基、またはＯ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式５～６員ヘテロアリール基を表し、ここで、該ヘテロアリール基が、非置換であるか、またはハロゲン原子、ヒドロキシル基、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-4}アルキル基、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-2}ヒドロキシアルキル基または直鎖もしくは分枝鎖C_{1-4}アルコキシ基から選択される１個以上の置換基で置換されている、請求項１～１１いずれか１項記載の医薬。
【請求項１３】
R^6が、直鎖もしくは分枝鎖(C_{1-6}アルコキシ)－(C_{1-6}アルキル)基または直鎖もしくは分枝鎖C_{1-6}アルキル基を表し、ここで、該直鎖もしくは分枝鎖C_{1-6}アルキル基が、非置換であるか、またはハロゲン原子およびヒドロキシル基から選択される１個以上の置換基で置換されている、請求項１２記載の医薬。
【請求項１４】

・R^1が、水素原子、フッ素原子、塩素原子またはメチル基を表し；
・R^2が、水素原子またはフッ素原子を表し；
・Xが、－O－または－NR^3－基を表し；
・R^3が、水素原子を表し；
・Qが、Q_aを表し；
・R^4が、－$CO(CH_2)_{1-2}$－OH基または－$CO(CH_2)_{1-2}$－CN基を表し；
・G^1が、－O－R^6基、CN基、またはO、SおよびNから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式５～６員ヘテロアリール基を表し、ここで、該ヘテロアリール基が、非置換であるか、またはハロゲン原子、ヒドロキシル基、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-4}アルキル基、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-2}ヒドロキシアルキル基、または直鎖もしくは分枝鎖C_{1-4}アルコキシ基から選択される１個以上の置換基で置換されており；
・R^6が、直鎖もしくは分枝鎖(C_{1-6}アルコキシ)－(C_{1-6}アルキル)基または直鎖もしくは分枝鎖C_{1-6}アルキル基を表し、ここで、該直鎖もしくは分枝鎖C_{1-6}アルキル基が、非置換であるか、またはハロゲン原子およびヒドロキシル基から選択される１個以上の置換基で置換されている、
請求項１記載の医薬。
【請求項１５】
R^1が、フッ素原子、水素原子またはメチル基を表す、請求項１４記載の医薬。
【請求項１６】
R^2が、水素原子を表す、請求項１４または１５記載の医薬。
【請求項１７】
R^4が、－C(O)CH_2OH基または－C(O)CH_2CN基を表す、請求項１４～１６いずれか１項記載の医薬。
【請求項１８】
・Xが、－O－または－NR^3－基を表し；
・R^1およびR^2が、独立して、水素原子、フッ素原子およびメチル基からなる群から選択され；
・R^3が、水素原子およびメチル基からなる群から選択され；
・G^1が、－CN基、－$CONH_2$基、－CO_2Et基、－CO_2iPr基、－O－R^6基、－$NHCH_2CH_2OH$基、フェニル基、ピリジニル基、ピラゾリル基、ピペリジニル基、ピペラジニル基、モルホリニル基からなる群から選択され、ここで、該フェニル基、該ピリジニル基、該ピラゾリル基、該ピペリジニル基、該ピペラジニル基、および該モルホリニル基が、非置換であるか、またはヒドロキシル基、メチル基、－CH_2OH基、－CH_2－C(OH)$(CH_3)_2$基、メトキシ基、アミノ基、－$N(CH_3)_2$基、－COOH基および－CO_2Et基から選択される１個以上の置換基で置換されており；
・R^4が、－$CO(CH_2)$－OH基；－$CO(CH_2)$－CN基、ピラジニル基およびピリミジニル基からなる群から選択され、ここで、該ピラジニル基および該ピリミジニル基が、独立して、非置換であるか、またはCN基または－CH_2OH基で置換されており；
・R^5が、－CH_2－CN基を表し；
・G^2が、ピリミジン基またはピリジン基を表し、ここで、該ピリミジン基および該ピリジン基が、非置換であるか、またはフッ素原子で置換されており；
・R^6が、水素原子、－$CH_2CO_2CH_2Ph$基、－$(CH_2)_2OCH_3$基、－$(CH_2)_2OCH_2CH_3$基、－$CH(CH_3)CH_2OCH_3$基、メチル基、エチル基、ブチル基、－CH_2CF_3基、－CH_2CHF_2基、$CH(CH_3)_2$基、－$(CH_2)_{2-3}$－OH基、－$(CH_2)_{2-3}N(CH_3)_2$基、－$CH(CH_3)$－CH_2OH基、－$CH_2CH(OH)CH_2$OH基からなる群から選択される、
請求項１記載の医薬。
【請求項１９】
２－(ピラゾロピリジン－３－イル)ピリミジン誘導体が、以下のもののうちの１つまたはその薬学的に許容される塩、Ｎ－オキシド、溶媒和物、立体異性体もしくは重水素化誘

導体である、請求項１記載の医薬：
(trans－４－{[５－フルオロ－６－(４－ヒドロキシピペリジン－１－イル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}シクロヘキシル)アセトニトリル；
(trans－４－{[６－(４－アミノピペリジン－１－イル)－５－フルオロ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}シクロヘキシル)アセトニトリル；
{trans－４－[(５－フルオロ－６－ピペラジン－１－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]シクロヘキシル}アセトニトリル；
[trans－４－({６－[４－(ジメチルアミノ)ピペリジン－１－イル]－５－フルオロ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル}アミノ)シクロヘキシル]アセトニトリル；
(trans－４－{[５－フルオロ－６－(２－ヒドロキシエトキシ)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}シクロヘキシル)アセトニトリル；
{trans－４－[(６－{[(２Ｓ)－２,３－ジヒドロキシプロピル]オキシ}－５－フルオロ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]シクロヘキシル}アセトニトリル；
{trans－４－[(６－{[(２Ｒ)－２,３－ジヒドロキシプロピル]オキシ}－５－フルオロ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]シクロヘキシル}アセトニトリル；
[trans－４－({５－フルオロ－６－[(２－ヒドロキシエチル)アミノ]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル}アミノ)シクロヘキシル]アセトニトリル；
[trans－４－({６－[２－(ジメチルアミノ)エトキシ]－５－フルオロ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル}アミノ)シクロヘキシル]アセトニトリル；
[trans－４－({６－[２－(ジメチルアミノ)エトキシ]－５－フルオロ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル}アミノ)シクロヘキシル]アセトニトリル；
６－(４－アミノピペリジン－１－イル)－５－フルオロ－Ｎ－[(１Ｓ)－１－(５－フルオロピリジン－２－イル)エチル]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－アミン；
２－[(５－フルオロ－６－{[(１Ｓ)－１－(５－フルオロピリミジン－２－イル)エチル]アミノ}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)オキシ]エタノール；
(２Ｓ)－３－[(５－フルオロ－６－{[(１Ｓ)－１－(５－フルオロピリミジン－２－イル)エチル]アミノ}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)オキシ]プロパン－１,２－ジオール；
３－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－６－(２－ヒドロキシエトキシ)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[(６－ブトキシ－５－フルオロ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－{[６－(２－エトキシエトキシ)－５－フルオロ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－({５－フルオロ－６－[４－(ヒドロキシメチル)フェニル]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－{[６－(６－アミノピリジン－３－イル)－５－フルオロ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－{[５－フルオロ－６－(６－メトキシピリジン－３－イル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－{[５－フルオロ－６－(２－メチルピリジン－４－イル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[[５－フルオロ－６－(２－メチルピリジン－４－イル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル](メチル)アミノ]ピペリジン－１－イル}－３－オキソプロパンニトリル；
１－(５－フルオロ－６－{[(３Ｒ)－１－グリコロイルピペリジン－３－イル]アミノ}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)ピペリジン－４－オール；
２－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[４－(ヒドロキシメチル)ピペリジン－１－イル]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル}アミノ)ピペリジン－１－イル]－２－オキソエタノール；
２－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[(２－ヒドロキシエチル)アミノ]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル}アミノ)ピペリジン－１－イル]－２－オキソエタノール；
２－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－６－(４－メチルピペラジン－１－イル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；
２－{(３Ｒ)－３－[(５－メチル－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]ピペリジン－１－イル}－２－オキソエタノール；
２－((３Ｒ)－３－{[６－(２－メトキシエトキシ)－５－メチル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；
１－(５－フルオロ－６－{[(３Ｒ)－１－グリコロイルピペリジン－３－イル]アミノ}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)－４－メチルピペリジン－４－カルボン酸エチル；
２－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－２－(５－メチルピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イル)－６－モルホリン－４－イルピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；
１－(６－{[(３Ｒ)－１－(シアノアセチル)ピペリジン－３－イル]アミノ}－５－フルオロ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)ピペリジン－４－カルボン酸エチル；
１－(６－{[(３Ｒ)－１－(シアノアセチル)ピペリジン－３－イル]アミノ}－５－フルオロ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)ピペリジン－４－カルボン酸；
２－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イル－６－(１Ｈ－ピラゾール－４－イル)ピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；
１－[４－(５－フルオロ－６－{[(３Ｒ)－１－グリコロイルピペリジン－３－イル]アミノ}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)－１Ｈ－ピラゾール－１－イル]－２－メチルプロパン－２－オール；
２－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－６－(２－メチルピリジン－４－イル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イ

ル)－２－オキソエタノール；
２－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－６－(６－メトキシピリジン－３－イル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；
２－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－６－(６－メチルピリジン－３－イル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；
２－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[２－(ヒドロキシメチル)ピリジン－４－イル]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル}アミノ)ピペリジン－１－イル]－２－オキソエタノール；
５－(５－フルオロ－６－{[(３Ｒ)－１－グリコロイルピペリジン－３－イル]アミノ}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)ピリジン－２－カルボン酸エチル；
２－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－６－(２－メトキシエトキシ)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；
２－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－６－(２－ヒドロキシエトキシ)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；
３－[(５－フルオロ－６－{[(３Ｒ)－１－グリコロイルピペリジン－３－イル]アミノ}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)オキシ]プロパン－１－オール；
２－{(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－メトキシ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]ピペリジン－１－イル}－２－オキソエタノール；
５－フルオロ－６－{[(３Ｒ)－１－グリコロイルピペリジン－３－イル]アミノ}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－オール；
[(５－フルオロ－６－{[(３Ｒ)－１－グリコロイルピペリジン－３－イル]アミノ}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)オキシ]酢酸ベンジル；
２－{(３Ｒ)－３－[(６－エトキシ－５－フルオロ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]ピペリジン－１－イル}－２－オキソエタノール；
５－フルオロ－６－{[(３Ｒ)－１－グリコロイルピペリジン－３－イル]アミノ}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－カルボン酸エチル；
５－フルオロ－６－{[(３Ｒ)－１－グリコロイルピペリジン－３－イル]アミノ}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－カルボニトリル；
５－フルオロ－６－{[(３Ｒ)－１－グリコロイルピペリジン－３－イル]アミノ}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－カルボキサミド；
２－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イル－６－(２,２,２－トリフルオロエトキシ)ピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；
２－((３Ｒ)－３－{[６－(２,２－ジフルオロエトキシ)－５－フルオロ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；
２－{(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－イソプロポキシ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]ピペリジン－１－イル}－２－オキソエタノール；
２－{(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)オキシ]ピペリジン－１－イル}－２－オ

キソエタノール；
３－{(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)オキシ]ピペリジン－１－イル}－３－オキソプロパンニトリル；
５－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－６－(２－ヒドロキシエトキシ)－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)ピラジン－２－カルボニトリル；
(５－{(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－メトキシ－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]ピペリジン－１－イル}ピラジン－２－イル)メタノール；
５－{(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－メトキシ－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]ピペリジン－１－イル}ピラジン－２－カルボニトリル；
２－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－６－(２－ヒドロキシエトキシ)－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)ピリミジン－５－カルボニトリル；
２－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[(１Ｓ)－２－メトキシ－１－メチルエトキシ]－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル}アミノ)ピペリジン－１－イル]－２－オキソエタノール；
(２Ｓ)－２－[(５－フルオロ－６－{[(３Ｒ)－１－グリコロイルピペリジン－３－イル]アミノ}－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)オキシ]プロパン－１－オール；
２－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[(１Ｒ)－２－メトキシ－１－メチルエトキシ]－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル}アミノ)ピペリジン－１－イル]－２－オキソエタノール；
(２Ｒ)－２－[(５－フルオロ－６－{[(３Ｒ)－１－グリコロイルピペリジン－３－イル]アミノ}－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)オキシ]プロパン－１－オール；
２－{(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イル－６－ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]ピペリジン－１－イル}－２－オキソエタノール；
２－{(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－メトキシ－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)オキシ]ピペリジン－１－イル}－２－オキソエタノール；
３－{(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－メトキシ－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)オキシ]ピペリジン－１－イル}－３－オキソプロパンニトリル；
２－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－６－(２－ヒドロキシエトキシ)－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]オキシ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；
３－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－６－(２－ヒドロキシエトキシ)－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]オキシ}ピペリジン－１－イル)－３－オキソプロパンニトリル；
２－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－６－(４－メチルピペラジン－１－イル)－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]オキシ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；
３－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－６－(４－メチルピペラジン－１－イル)－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]オキシ}ピペリジン－１－イル)－３－オキソプロパンニトリル；
２－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[(２－ヒドロキシエチル)アミノ]－２－ピラ

ゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル}オキシ)ピペリジン－１－イル]－２－オキソエタノール；
３－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[(２－ヒドロキシエチル)アミノ]－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル}オキシ)ピペリジン－１－イル]－３－オキソプロパンニトリル；
２－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－６－(２－メチルピリジン－４－イル)－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]オキシ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；
３－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－６－(２－メチルピリジン－４－イル)－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]オキシ}ピペリジン－１－イル)－３－オキソプロパンニトリル；
３－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[２－(ヒドロキシメチル)ピリジン－４－イル]－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル}オキシ)ピペリジン－１－イル]－３－オキソプロパンニトリル；
２－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[２－(ヒドロキシメチル)ピリジン－４－イル]－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル}オキシ)ピペリジン－１－イル]－２－オキソエタノール；
１－(５－フルオロ－６－{[(３Ｒ)－１－グリコロイルピペリジン－３－イル]オキシ}－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)ピペリジン－４－オール；
３－((３Ｒ)－３－{[５－フルオロ－６－(４－ヒドロキシピペリジン－１－イル)－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]オキシ}ピペリジン－１－イル)－３－オキソプロパンニトリル；
２－{(３Ｒ)－３－[[５－フルオロ－６－(２－メチルピリジン－４－イル)－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル](メチル)アミノ]ピペリジン－１－イル}－２－オキソエタノール；
３－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[２－(ヒドロキシメチル)ピリジン－４－イル]－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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；
５－(５－フルオロ－６－{[(３Ｒ)－１－グリコロイルピペリジン－３－イル]アミノ}－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)ピリジン－２－カルボン酸；
２－{(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イル－６－ピリジン－４－イルピリミジン－４－イル)アミノ]ピペリジン－１－イル}－２－オキソエタノール；
２－[(３Ｒ)－３－({６－[６－(ジメチルアミノ)ピリジン－３－イル]－５－フルオロ－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル}アミノ)ピペリジン－１－イル]－２－オキソエタノール；
２－{(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－２'－メチル－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イル－４，５'－ビピリミジン－６－イル)アミノ]ピペリジン－１－イル}－２－オキソエタノール；
２－((３Ｒ)－３－{[６－(２－エトキシエトキシ)－５－フルオロ－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；
２－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[６－(ヒドロキシメチル)ピリジン－３－イル]－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル}アミノ)ピペリジン－１－イル]－２－オキソエタノール；
３－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[６－(ヒドロキシメチル)ピリジン－３－イル]－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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－((３Ｒ)－３－{[６－(２,６－ジメチルピリジン－４－イル)－５－フルオロ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；

３－((３Ｒ)－３－{[６－(２,６－ジメチルピリジン－４－イル)－５－フルオロ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[５－(ヒドロキシメチル)ピリジン－３－イル]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル}アミノ)ピペリジン－１－イル]－２－オキソエタノール；

３－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[５－(ヒドロキシメチル)ピリジン－３－イル]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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；

(２Ｓ)－１－[(５－フルオロ－６－{[(３Ｒ)－１－グリコロイルピペリジン－３－イル]オキシ}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)オキシ]プロパン－２－オール；

５－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[(１Ｒ)－２－メトキシ－１－メチルエトキシ]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル}アミノ)ピペリジン－１－イル]ピラジン－２－カルボニトリル；

５－フルオロ－６－{[(３Ｒ)－１－グリコロイルピペリジン－３－イル]アミノ}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－カルボン酸イソプロピル；

２－{(３Ｒ)－３－[(６－メトキシ－５－メチル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]ピペリジン－１－イル}－２－オキソエタノール；

２－{(３Ｒ)－３－[(６－メトキシ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]ピペリジン－１－イル}－２－オキソエタノール；

３－{(３Ｒ)－３－[(６－メトキシ－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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－((３Ｒ)－３－{[６－(２－メトキシエトキシ)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；

３－((３Ｒ)－３－{[６－(２－メトキシエトキシ)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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－((３Ｒ)－３－{[６－(２－メトキシピリジン－４－イル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；

２－((３Ｒ)－３－{[６－(６－メチルピリジン－３－イル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；

３－((３Ｒ)－３－{[６－(６－メチルピリジン－３－イル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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－((３Ｒ)－３－{[６－(２,６－ジメチルピリジン－４－イル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)－２－オキソエタノール；

３－((３Ｒ)－３－{[６－(２,６－ジメチルピリジン－４－イル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－{[６－(２－ヒドロキシエトキシ)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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；
５－((３Ｒ)－３－{[６－(２－ヒドロキシエトキシ)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル]アミノ}ピペリジン－１－イル)ピラジン－２－カルボニトリル；
５－(６－{[(３Ｒ)－１－グリコロイルピペリジン－３－イル]アミノ}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)ピリジン－３－オール；
３－((３Ｒ)－３－{[６－(５－ヒドロキシピリジン－３－イル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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
２－{(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)(メチル)アミノ]ピペリジン－１－イル}－２－オキソエタノール。

【請求項２０】
ヤヌスキナーゼの阻害による寛解を受けやすい病態または疾患の処置用の、請求項１～１９いずれか１項に記載の医薬。

【請求項２１】
ヤヌスキナーゼの阻害による寛解を受けやすい病態または疾患が、アトピー性皮膚炎、乾癬、接触性皮膚炎、湿疹、慢性手湿疹、基底細胞癌、扁平上皮癌、光線角化症、メラノーマ、尋常性白斑、円形脱毛症、皮膚エリテマトーデス、皮膚血管炎、皮膚筋炎、皮膚Ｔ細胞リンパ腫、セザリー症候群、壊疽性膿皮症、扁平苔癬、水疱形成疾患、白血病、リンパ腫および固形腫瘍、関節リウマチ、多発性硬化症、筋萎縮性側索硬化症、全身性エリテマトーデス、自己免疫性溶血性貧血、Ｉ型糖尿病、喘息、慢性閉塞性肺疾患（ＣＯＰＤ）、嚢胞性線維症、気管支拡張症、咳、特発性肺線維症、サルコイドーシス、アレルギー性鼻炎、炎症性腸疾患、潰瘍性大腸炎、クローン病、ドライアイ、ぶどう膜炎、アレルギー性結膜炎および乾性角結膜炎から選択される病態または疾患である、請求項２０記載の医薬。

【請求項２２】
水疱形成疾患が尋常性天疱瘡、水疱性類天疱瘡または表皮水疱症である、請求項２１記載の医薬。

【請求項２３】
ヤヌスキナーゼの阻害による寛解を受けやすい病態または疾患が、アトピー性皮膚炎、乾癬、慢性手湿疹、皮膚ループス、円形脱毛症および尋常性白斑から選択される病態または疾患である、請求項２０または２１記載の医薬。

【請求項２４】
請求項２０～２３いずれか１項記載の医薬の製造のための、請求項１～１９いずれか１項において定義されている２－(ピラゾロピリジン－３－イル)ピリミジン誘導体の使用。

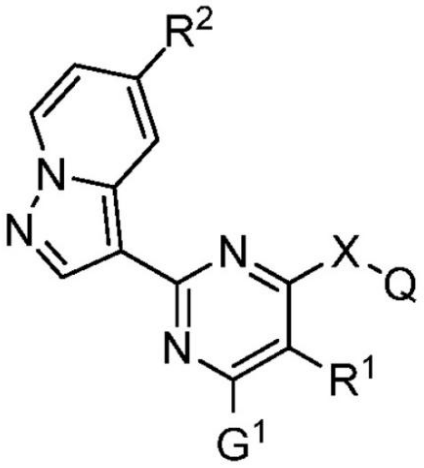
【請求項２５】
（ｉ）少なくとも１種類の、請求項１～１９いずれか１項において定義されている２－(ピラゾロピリジン－３－イル)ピリミジン誘導体、および（ｉｉ）以下のものから選択される１種類以上の活性成分を含む、組合せ医薬品：
ｇｇ）コルチコイドおよびグルココルチコイド；
ｈｈ）ジヒドロ葉酸レダクターゼ阻害剤；
ｉｉ）ジヒドロオロト酸デヒドロゲナーゼ（ＤＨＯＤＨ）阻害剤；
ｊｊ）プリンアンタゴニスト；
ｋｋ）抗マラリア剤；
ｌｌ）カルシニューリン阻害剤；
ｍｍ）イノシン一リン酸デヒドロゲナーゼ（ＩＭＰＤＨ）阻害剤；
ｎｎ）フマル酸エステル；
ｏｏ）ビタミンＤ３誘導体；
ｐｐ）レチノイド；

ｑｑ）抗腫瘍壊死因子α（抗ＴＮＦα）モノクローナル抗体；
ｒｒ）可溶性腫瘍壊死因子α（ＴＮＦα）受容体；
ｓｓ）抗インターロイキン６受容体（ＩＬ－６Ｒ）抗体；
ｔｔ）抗インターロイキン１２受容体（ＩＬ－１２Ｒ）／インターロイキン２３受容体（ＩＬ－２３Ｒ）抗体；
ｕｕ）抗インターロイキン１７受容体（ＩＬ－１７Ｒ）抗体；
ｖｖ）抗ＣＤ２０（Ｂリンパ球タンパク質）抗体；
ｗｗ）抗インターロイキン５（ＩＬ－５）抗体；
ｘｘ）抗インターロイキン５受容体（ＩＬ－５Ｒ）抗体；
ｙｙ）抗インターロイキン１３（ＩＬ－１３）抗体；
ｚｚ）抗インターロイキン４受容体（ＩＬ－４Ｒ）／インターロイキン１３受容体（ＩＬ－１３Ｒ）抗体；
ａａａ）抗インターロイキン１７（ＩＬ－１７）抗体；
ｂｂｂ）抗インターロイキン１受容体（ＩＬ－１Ｒ）抗体；
ｃｃｃ）抗免疫グロブリンＥ（ＩｇＥ）抗体；
ｄｄｄ）抗Ｂ細胞活性化因子（ＢＡＦＦ）；
ｅｅｅ）抗ＣＤ１９（Ｂリンパ球タンパク質）モノクローナル抗体；
ｆｆｆ）κオピオイド刺激薬；
ｇｇｇ）ニューロキニン１受容体遮断薬；
ｈｈｈ）ジヒドロプテロイン酸シンターゼ阻害剤；
ｉｉｉ）ヒスタミン１（Ｈ１）受容体遮断薬；
ｊｊｊ）システイニルロイコトリエン（ＣｙｓＬＴ）受容体遮断薬；
ｋｋｋ）ＴＨ２細胞に発現する化学誘引物質受容体類似分子（ＣＲＴＨ２）阻害剤；および
ｌｌｌ）局所消毒薬。

【請求項２６】
コルチコイドまたはグルココルチコイドが、ベクロメタゾン、ベタメタゾン、ジプロピオン酸ベタメタゾン、ブデソニド、デキサメタゾン、フロ酸フルチカゾン、プロピオン酸フルチカゾン、ヒドロコルチゾン、メチルプレドニゾロン、フロ酸モメタゾン、プレドニカルベート、プレドニゾロンまたはプレドニゾンであり；
ジヒドロ葉酸レダクターゼ阻害剤が、メトトレキサートまたはプララトレキサートであり；
ジヒドロオロト酸デヒドロゲナーゼ（ＤＨＯＤＨ）阻害剤が、レフルノミド、テリフルノミドまたはＡＳＬＡＮ－００３またはＬＡＳ１８６３２３であり；
プリンアンタゴニストが、アザチオプリン、メルカプトプリンまたはチオグアニンであり；
抗マラリア剤が、ヒドロキシクロロキン、クロロキンまたはキナクリンであり；
カルシニューリン阻害剤が、シクロスポリンＡ、タクロリムス、ピメクロリムスまたはボクロスポリンであり；
イノシン一リン酸デヒドロゲナーゼ（ＩＭＰＤＨ）阻害剤が、ミコフェノール酸モフェチル、リバビリンまたはミゾリビンであり；
フマル酸エステルが、フマル酸ジメチルであり；
ビタミンＤ３誘導体が、カルシポトリオール、カルシトリオールまたはタカルシトールであり；
レチノイドが、タザロテン、アリトレチノイン、アシトレチンまたはイソトレチノインであり；
抗腫瘍壊死因子α（抗ＴＮＦα）モノクローナル抗体が、インフリキシマブ、アダリムマブ、セルトリズマブペゴルまたはゴリムマブであり；
可溶性腫瘍壊死因子α（ＴＮＦα）受容体が、エタネルセプトまたはＣＣ－１１０５０であり；

抗インターロイキン６受容体（ＩＬ－６Ｒ）抗体が、トシリズマブ、サリルマブ、ＳＡ－２３７またはＡＬＸ－００６１であり；
抗インターロイキン１２受容体（ＩＬ－１２Ｒ）／インターロイキン２３受容体（ＩＬ－２３Ｒ）抗体が、ウステキヌマブであり；
抗インターロイキン１７受容体（ＩＬ－１７Ｒ）抗体が、ブロダルマブであり；
抗ＣＤ２０（Ｂリンパ球タンパク質）抗体が、リツキシマブ、オファツムマブ、オビヌツズマブ、オクレリズマブ、ウブリツキシマブ、ベルツズマブ、オカラツズマブであり；
抗インターロイキン５（ＩＬ－５）抗体が、メポリズマブであり；
抗インターロイキン５受容体（ＩＬ－５Ｒ）抗体が、ベンラリズマブであり；
抗インターロイキン１３（ＩＬ－１３）抗体が、レブリキズマブまたはトラロキヌマブであり；
抗インターロイキン４受容体（ＩＬ－４Ｒ）／インターロイキン１３受容体（ＩＬ－１３Ｒ）抗体が、デュピルマブであり；
抗インターロイキン１７（ＩＬ－１７）抗体が、セクキヌマブ、イキセキズマブまたはビメキズマブ（bimekizumab）であり；
抗免疫グロブリンＥ（ＩｇＥ）抗体が、オマリズマブまたはキリズマブ（quilizumab）であり；
抗Ｂ細胞活性化因子（ＢＡＦＦ）が、ベリムマブまたはアタシセプトであり；
抗ＣＤ１９（Ｂリンパ球タンパク質）モノクローナル抗体が、ブリナツモマブ、ＭＥＤＩ－５５１またはＭＯＲ－２０８であり；
κオピオイド刺激薬が、ナルフラフィン、ナルブフィン、アシマドリンまたはＣＲ－８４５であり；
ニューロキニン１受容体遮断薬が、アプレピタント、ホスアプレピタント、ロラピタント、オルベピタント、トラジピタント（tradipitant）またはセルロピタントであり；
ジヒドロプテロイン酸シンターゼ阻害剤が、ダプソンまたはスルファドキシンであり；
ヒスタミン１（Ｈ１）受容体遮断薬が、アゼラスチン、エバスチン、デスロラタジン、プロメタジン、ミゾラスチンまたはセチリジンであり；
システイニルロイコトリエン（ＣｙｓＬＴ）受容体遮断薬が、モンテルカスト、ザフィルルカスト、タイペルカストまたはマシルカストであり；
ＴＨ２細胞に発現する化学誘引物質受容体類似分子（ＣＲＴＨ２）阻害剤が、ＯＣ－４５９、ＡＺＤ－１９８１、ＡＤＣ－３６８０、ＡＲＲＹ－５０２またはセチプリパント（setipripant）であり；
局所消毒薬が、トリクロサン、クロルヘキシジン、クリスタルバイオレット０．３％または次亜塩素酸ナトリウム水浴である、
請求項２５記載の組合せ医薬品。
【請求項２７】
式（Ｉ）：

【化３】



式（Ｉ）

［式中、

・Ｘは、－Ｏ－または－ＮＲ^{3}－基を表し、

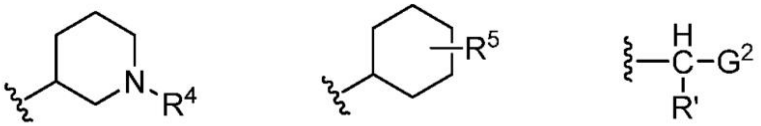
・Ｒ^{1}およびＲ^{2}は、独立して、水素原子、ハロゲン原子、直鎖または分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルキル、直鎖または分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルコキシ基および－ＣＮ基からなる群から選択され；

・Ｒ^{3}は、水素原子、直鎖または分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルキル基、－(ＣＨ$_{2}$)$_{1-3}$ＮＲ'Ｒ''基および－(ＣＨ$_{2}$)$_{1-3}$－ピロリジン基からなる群から選択され；

・Ｇ^{1}は、－ＣＮ基、－ＣＯ－Ｒ^{a}基、－Ｏ－Ｒ^{6}基、－(ＣＨＲ^{7})$_{m}$－ＮＲ'Ｒ''基、フェニル基、単環式Ｃ$_{5-7}$シクロアルキル基、Ｏ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式５～６員ヘテロアリール基、ならびにＯ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式５～６員ヘテロシクリル基からなる群から選択され、ここで、該フェニル基、該シクロアルキル基、該ヘテロアリール基および該ヘテロシクリル基は、非置換であるか、またはハロゲン原子、ヒドロキシル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルキル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-6}$－ヒドロキシアルキル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルコキシ基、－(ＣＨ$_{2}$)$_{0-2}$ＮＲ'Ｒ''基、－(ＣＨ$_{2}$)$_{0-2}$ＣＮ基および－ＣＯ－Ｒ^{a}基から選択される１個以上の置換基で置換されており、ここで、Ｒ^{a}は、水素原子、ヒドロキシル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-3}$アルキル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-3}$アルコキシ基、またはアミノ基を表し；

・Ｑは、

【化４】



Ｑ$_{a}$　　Ｑ$_{b}$　　Ｑ$_{c}$

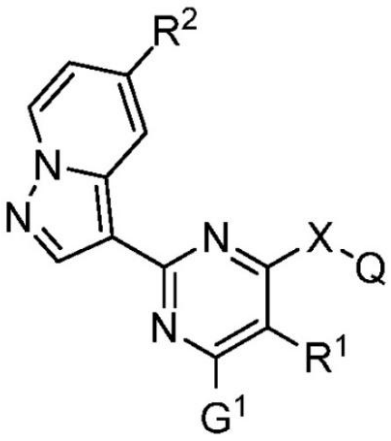
（式中、

・Ｒ^{4}は、直鎖または分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルキル基、－ＣＯ－Ｒ'基、－ＣＯ(ＣＨ$_{2}$)$_{1-2}$－ＯＨ基；－ＣＯ(ＣＨ$_{2}$)$_{1-2}$－ＣＮ基、－ＣＯ(ＣＨ$_{2}$)$_{1-2}$－ＣＦ$_{3}$基、シアノチアゾール基、Ｏ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式４～６員ヘテロシクリル基、ならびにＯ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式５～６員ヘテロアリール基からなる群から選択され、ここで、該ヘテロシクリル基および該ヘテロアリール基は、独立して、非置換であるか、または－(ＣＨ$_{2}$)$_{m}$－ＣＮ基およびＣ$_{1-2}$ヒドロキシアルキル基から選択される１個以上の置換基で置換されており；

・R^5は、－$(CH_2)_m$－ＣＮ基または－$(CH_2)_m$－ＯＨ基を表し；
・G^2は、フェニル基、ピリミジン基またはピリジン基を表し、ここで、該フェニル基、該ピリミジン基および該ピリジン基は、非置換であるか、またはハロゲン原子、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-4}アルキル基、ヒドロキシル基、および－ＣＮ基から選択される１個以上の置換基で置換されている）
からなる群から選択され；
・R^6は、水素原子、－$(CH_2)_{(1-2)}$－ＣＯ－Ｏ－Ｒ'''基、直鎖または分枝鎖(C_{1-6}アルコキシ)－(C_{1-6}アルキル)基および直鎖または分枝鎖C_{1-6}アルキル基からなる群から選択され、ここで、該直鎖または分枝鎖C_{1-6}アルキル基は、非置換であるか、またはハロゲン原子、ヒドロキシル基および－ＮＲ'Ｒ''基から選択される１個以上の置換基で置換されており；
・R^7は、水素原子、ヒドロキシル基またはC_{1-2}アルキル基を表し；
・Ｒ'およびＲ''は、独立して、水素原子、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-3}アルキル基、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-3}ヒドロキシアルキル基、または直鎖もしくは分枝鎖C_{1-3}アルコキシ基を表し；
・Ｒ'''は、C_{1-2}アルキル基またはベンジル基を表し；
・ｍは、独立して、０～３の数値を有する］
で示される化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物もしくはＮ－オキシドもしくは立体異性体もしくは重水素化誘導体である、２－(ピラゾロピリジン－３－イル)ピリミジン誘導体（ただし、該２－(ピラゾロピリジン－３－イル)ピリミジン誘導体は
・３－{(３Ｒ)－３－[[２－(ジメチルアミノ)エチル](５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]ピペリジン－１－イル}オキセタン－３－イル)アセトニトリル；
・(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]ピペリジン－１－カルボン酸エチル；
・２－{(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]ピペリジン－１－イル}－２－オキソエタノール；
・３－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[４－(ヒドロキシメチル)ピペリジン－１－イル]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－({５－フルオロ－６－[４－(ヒドロキシメチル)フェニル]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－{[５－フルオロ－６－(４－ホルミルフェニル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[(５－フルオロ－６－ピペラジン－１－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－({６－[４－(ヒドロキシメチル)フェニル]－５－メチル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－{[６－(４－ホルミルフェニル)－５－メチル－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－({５－フルオロ－６－[２－フルオロ－４－(ヒドロキシメチル)フェニル]－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－{[５－フルオロ－６－(２－フルオロ－４－ホルミルフェニル)－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－({５－フルオロ－６－[３－(ヒドロキシメチル)フェニル]－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－{[５－フルオロ－６－(３－ホルミルフェニル)－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[(５－フルオロ－６－{３－ヒドロキシ－４－[(メチルアミノ)メチル]フェニル}－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[(５－フルオロ－６－{４－ヒドロキシ－３－[(メチルアミノ)メチル]フェニル}－２－ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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－フルオロ－６－(３－ヒドロキシ－４－(ヒドロキシメチル)フェニル)－２－(ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イル)ピリミジン－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
・(Ｒ)－３－(３－((５－フルオロ－６－(４－ホルミル－３－ヒドロキシフェニル)－２－(ピラゾロ[１，５－ａ]ピリジン－３－イル)ピリミジン－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
ではない)。
【請求項２８】
請求項３～１９いずれか１項において定義されている式（Ｉ）で示される化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物もしくはＮ－オキシドもしくは立体異性体もしくは重水素化誘導体である、請求項２７記載の２－(ピラゾロピリジン－３－イル)ピリミジン誘導体。
【誤訳訂正２】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】００１５
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【００１５】
発明の概要
かくして、本発明は、人体または動物体の処置における使用のための２－(ピラゾロピリジン－３－イル)ピリミジン誘導体を対象とし、該２－(ピラゾロピリジン－３－イル)ピリミジン誘導体は、式（Ｉ）：

【化１】



式（Ｉ）

［式中、

・Ｘは、－Ｏ－または－ＮＲ^{3}－基を表し、

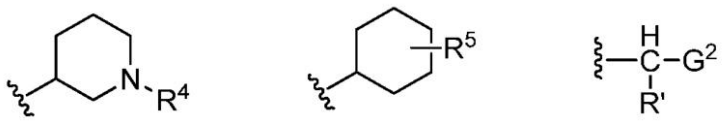
・Ｒ^{1}およびＲ^{2}は、独立して、独立して、水素原子、ハロゲン原子、直鎖または分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルキル、直鎖または分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルコキシ基および－ＣＮ基からなる群から選択され；

・Ｒ^{3}は、水素原子、直鎖または分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルキル基、－(ＣＨ$_{2}$)$_{1-3}$ＮＲ'Ｒ''基および－(ＣＨ$_{2}$)$_{1-3}$－ピロリジン基からなる群から選択され；

・Ｇ^{1}は、－ＣＮ基、－ＣＯ－Ｒ^{a}基、－Ｏ－Ｒ^{6}基、－(ＣＨＲ^{7})$_{m}$－ＮＲ'Ｒ''基、フェニル基、単環式Ｃ$_{5-7}$シクロアルキル基、Ｏ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式５～６員ヘテロアリール基、ならびにＯ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式５～６員ヘテロシクリル基からなる群から選択され、ここで、該フェニル基、該シクロアルキル基、該ヘテロアリール基および該ヘテロシクリル基は、非置換であるか、またはハロゲン原子、ヒドロキシル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルキル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-6}$－ヒドロキシアルキル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルコキシ基、－(ＣＨ$_{2}$)$_{0-2}$ＮＲ'Ｒ''基、－(ＣＨ$_{2}$)$_{0-2}$ＣＮ基および－ＣＯ－Ｒ^{a}基から選択される１個以上の置換基で置換されており、ここで、Ｒ^{a}は、水素原子、ヒドロキシル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-3}$アルキル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-3}$アルコキシ基、またはアミノ基を表し；

・Ｑは、

【化２】



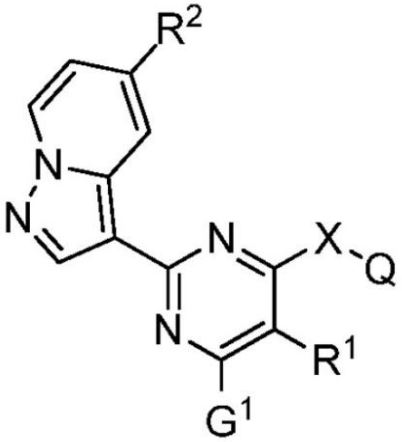
Ｑ$_{a}$　　Ｑ$_{b}$　　Ｑ$_{c}$

（式中、

・Ｒ^{4}は、直鎖または分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルキル基、－ＣＯ－Ｒ'基、－ＣＯ(ＣＨ$_{2}$)$_{1-2}$－ＯＨ基；－ＣＯ(ＣＨ$_{2}$)$_{1-2}$－ＣＮ基、－ＣＯ(ＣＨ$_{2}$)$_{1-2}$－ＣＦ$_{3}$基、シアノチアゾール基、Ｏ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式４～６員ヘテロシクリル基、ならびにＯ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式５～６員ヘテロアリール基からなる群から選択され、ここで、該ヘテロシクリル基および該ヘテロアリール基は、独立して、非置換であるか、または－(ＣＨ$_{2}$)$_{m}$－ＣＮ基およびＣ$_{1-2}$ヒドロキシアルキル基から選択される１個以上の置換基で置換されており；

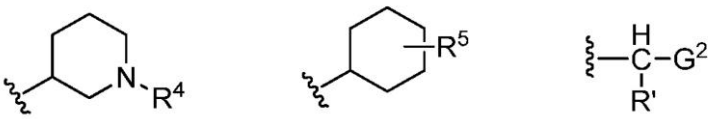
・R^5は、－$(CH_2)_m$－ＣＮ基または－$(CH_2)_m$－ＯＨ基を表し；
・G^2は、フェニル基、ピリミジン基またはピリジン基を表し、ここで、該フェニル基、該ピリミジン基および該ピリジン基は、非置換であるか、またはハロゲン原子、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-4}アルキル基、ヒドロキシル基、－ＣＮ基から選択される１個以上の置換基で置換されている）
からなる群から選択され；
・R^6は、水素原子、－$(CH_2)_{(1-2)}$－ＣＯ－Ｏ－Ｒ'''基、直鎖または分枝鎖(C_{1-6}アルコキシ)－(C_{1-6}アルキル)基および直鎖または分枝鎖C_{1-6}アルキル基からなる群から選択され、ここで、該直鎖または分枝鎖C_{1-6}アルキル基は、非置換であるか、またはハロゲン原子、ヒドロキシル基および－ＮＲ'Ｒ''基から選択される１個以上の置換基で置換されており；
・R^7は、水素原子、ヒドロキシル基またはC_{1-2}アルキル基を表し；
・Ｒ'およびＲ''は、独立して、水素原子、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-3}アルキル基、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-3}ヒドロキシアルキル基、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-3}アルコキシ基を表し；
・Ｒ'''は、C_{1-2}アルキル基またはベンジル基を表し；
・ｍは、独立して、０～３の数値を有する］
で示される化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物もしくはＮ－オキシドもしくは立体異性体もしくは重水素化誘導体であるが、該２－(ピラゾロピリジン－３－イル)ピリミジン誘導体は、
・３－{(３Ｒ)－３－[[２－(ジメチルアミノ)エチル](５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル）アミノ]ピペリジン－１－イル}オキセタン－３－イル)アセトニトリル；
・(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]ピペリジン－１－カルボン酸エチル；
・２－{(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル）アミノ]ピペリジン－１－イル}－２－オキソエタノール；
・３－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[４－(ヒドロキシメチル)ピペリジン－１－イル]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－({５－フルオロ－６－[４－(ヒドロキシメチル)フェニル]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－{[５－フルオロ－６－(４－ホルミルフェニル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[(５－フルオロ－６－{３－ヒドロキシ－４－[(メチルアミノ)メチル]フェニル}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[(５－フルオロ－６－{４－ヒドロキシ－３－[(メチルアミノ)メチル]フェニル}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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

ではない。
【誤訳訂正３】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】００１６
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【００１６】
本発明は、また、２－(ピラゾロピリジン－３－イル)ピリミジン誘導体を提供し、２－(ピラゾロピリジン－３－イル)ピリミジン誘導体は、式（Ｉ）：
【化３】



式（Ｉ）

［式中、
・Ｘは、－Ｏ－または－ＮＲ^{3}－基を表し；
・Ｒ^{1}およびＲ^{2}は、独立して、水素原子、ハロゲン原子、直鎖または分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルキル、直鎖または分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルコキシ基および－ＣＮ基からなる群から選択され；
・Ｒ^{3}は、水素原子、直鎖または分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルキル基、－(ＣＨ$_{2}$)$_{1-3}$ＮＲ'Ｒ''基および－(ＣＨ$_{2}$)$_{1-3}$－ピロリジン基からなる群から選択され；
・Ｇ^{1}は、－ＣＮ基、－ＣＯ－Ｒ^{a}基、－Ｏ－Ｒ^{6}基、－(ＣＨＲ^{7})$_{m}$－ＮＲ'Ｒ''基、フェニル基、単環式Ｃ$_{5-7}$シクロアルキル基、Ｏ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式５～６員ヘテロアリール基、ならびにＯ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式５～６員ヘテロシクリル基からなる群から選択され、ここで、該フェニル基、シクロアルキル基、ヘテロアリール基およびヘテロシクリル基は、非置換であるか、またはハロゲン原子、ヒドロキシル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルキル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-6}$－ヒドロキシアルキル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-4}$アルコキシ基、－(ＣＨ$_{2}$)$_{0-2}$ＮＲ'Ｒ''基、－(ＣＨ$_{2}$)$_{0-2}$ＣＮ基および－ＣＯ－Ｒ^{a}基から選択される１個以上の置換基で置換されており、ここで、Ｒ^{a}は、水素原子、ヒドロキシル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-3}$アルキル基、直鎖もしくは分枝鎖Ｃ$_{1-3}$アルコキシ基またはアミノ基を表し；
・Ｑは、
【化４】



Ｑ$_{a}$　　Ｑ$_{b}$　　Ｑ$_{c}$

（式中、

・R^4は、直鎖または分枝鎖C_{1-4}アルキル基、－ＣＯ－Ｒ'基、－ＣＯ$(CH_2)_{1-2}$－ＯＨ基；－ＣＯ$(CH_2)_{1-2}$－ＣＮ基、－ＣＯ$(CH_2)_{1-2}$－CF_3基、シアノチアゾール基、Ｏ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式４～６員ヘテロシクリル基、ならびにＯ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式５～６員ヘテロアリール基からなる群から選択され、ここで、該ヘテロシクリル基および該ヘテロアリール基は、独立して、非置換であるか、または－$(CH_2)_m$－ＣＮ基およびC_{1-2}ヒドロキシアルキル基から選択される１個以上の置換基で置換されており；

・R^5は、－$(CH_2)_m$－ＣＮ基または－$(CH_2)_m$－ＯＨ基を表し；

・G^2は、フェニル基、ピリミジン基またはピリジン基を表し、ここで、該フェニル基、ピリミジン基およびピリジン基は、非置換であるか、またはハロゲン原子、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-4}アルキル基、ヒドロキシル基、－ＣＮ基から選択される１個以上の置換基で置換されている）

からなる群から選択され；

・R^6は、水素原子、－$(CH_2)_{(1-2)}$－ＣＯ－Ｏ－Ｒ'''基、直鎖または分枝鎖(C_{1-6}アルコキシ)－(C_{1-6}アルキル)基および直鎖または分枝鎖C_{1-6}アルキル基からなる群から選択され、ここで、該直鎖または分枝鎖C_{1-6}アルキル基は、非置換であるか、またはハロゲン原子、ヒドロキシル基および－ＮＲ'Ｒ''基から選択される１個以上の置換基で置換されており；

・R^7は、水素原子、ヒドロキシル基またはC_{1-2}アルキル基を表し；

・Ｒ'およびＲ''は、独立して、水素原子、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-3}アルキル基、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-3}ヒドロキシアルキル基、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-3}アルコキシ基を表し；

・Ｒ'''は、C_{1-2}アルキル基またはベンジル基を表し；

・ｍは、独立して、０～３の数値を有する］

で示される化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物もしくはＮ－オキシドもしくは立体異性体もしくは重水素化誘導体であるが、該２－(ピラゾロピリジン－３－イル)ピリミジン誘導体は

・３－{(３Ｒ)－３－[[２－(ジメチルアミノ)エチル](５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル）アミノ]ピペリジン－１－イル}オキセタン－３－イル)アセトニトリル；

・(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル)アミノ]ピペリジン－１－カルボン酸エチル；

・２－{(３Ｒ)－３－[(５－フルオロ－６－モルホリン－４－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－４－イル）アミノ]ピペリジン－１－イル}－２－オキソエタノール；

・３－[(３Ｒ)－３－({５－フルオロ－６－[４－(ヒドロキシメチル)ピペリジン－１－イル]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－({５－フルオロ－６－[４－(ヒドロキシメチル)フェニル]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－{[５－フルオロ－６－(４－ホルミルフェニル)－２－ピラゾロ[１

,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[(５－フルオロ－６－ピペラジン－１－イル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－({６－[４－(ヒドロキシメチル)フェニル]－５－メチル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－{[６－(４－ホルミルフェニル)－５－メチル－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－({５－フルオロ－６－[２－フルオロ－４－(ヒドロキシメチル)フェニル]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－{[５－フルオロ－６－(２－フルオロ－４－ホルミルフェニル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－({５－フルオロ－６－[３－(ヒドロキシメチル)フェニル]－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－{[５－フルオロ－６－(３－ホルミルフェニル)－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[(５－フルオロ－６－{３－ヒドロキシ－４－[(メチルアミノ)メチル]フェニル}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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)－３－[(５－フルオロ－６－{４－ヒドロキシ－３－[(メチルアミノ)メチル]フェニル}－２－ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イルピリミジン－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－フルオロ－６－(３－ヒドロキシ－４－(ヒドロキシメチル)フェニル)－２－(ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イル)ピリミジン－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－フルオロ－６－(４－ホルミル－３－ヒドロキシフェニル)－２－(ピラゾロ[１,５－ａ]ピリジン－３－イル）ピリミジン－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
ではない。
【誤訳訂正４】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】００７４
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【００７４】
特に好ましくは、
ａ．Ｘは、－Ｏ－を表すか；または
ｂ．Ｘは、－ＮＲ^{3}－を表し、Ｒ^{3}は、
ｉ．－$(CH_2)_{1-3}$ＮＲ'Ｒ''基（ここで、Ｒ'およびＲ''は、独立して、直鎖もしくは分枝鎖$Ｃ_{1-3}$ヒドロキシアルキル基または直鎖もしくは分枝鎖$Ｃ_{1-3}$アルコキシ基を表す）；または
ｉｉ．－CH_2ＮＲ'Ｒ''基（ここで、Ｒ'およびＲ''は、独立し得、水素原子、直鎖もしくは分枝鎖$Ｃ_{1-3}$アルキル基、直鎖もしくは分枝鎖$Ｃ_{1-3}$ヒドロキシアルキル基、直鎖

もしくは分枝鎖C_{1-3}アルコキシ基を表す）；または
ｉｉｉ．CH_2－ピロリジン基
から選択されるか；または
ｃ．R^1は、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-4}アルコキシ基または－ＣＮ基であるか；または
ｄ．R^2は、ハロゲン原子または－ＣＮ基であるか；または
ｅ．G^1は、－ＣＮ基、－ＣＯ－R^a基、－Ｏ－R^6基、および－$(CHR^7)_m$－ＮＲ'Ｒ''基からなる群から選択されるか；または
ｆ．G^1は、フェニル基、単環式C_{5-7}シクロアルキル基、Ｏ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式５～６員ヘテロアリール基ならびにＯ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式５～６員ヘテロシクリル基から選択され、ここで、該フェニル基、該シクロアルキル基、該ヘテロアリール基および該ヘテロシクリル基は、直鎖もしくは分枝鎖C_{3-6}ヒドロキシアルキル基、－$(CH_2)_{0-2}$ＣＮ基および－ＣＯ－R^a基から選択される１個以上の置換基で置換されており、ここで、R^aは、ヒドロキシル基、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-3}アルキル基、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-3}アルコキシ基、またはアミノ基を表すか；または
ｇ．Ｑは、Q^aであり、R^4は、シアノチアゾール基、ならびにＯ、ＳおよびＮから選択される少なくとも１個のヘテロ原子を含有する単環式５～６員ヘテロアリール基からなる群から選択され、ここで、該ヘテロアリール基は、非置換であるか、または－$(CH_2)_m$－ＣＮ基およびC_{1-2}ヒドロキシアルキル基から選択される１個以上の置換基で置換されているか；または
ｈ．Ｑは、Q_cであり、Ｒ'は、直鎖もしくは分枝鎖C_{1-3}ヒドロキシアルキル基または直鎖もしくは分枝鎖C_{1-3}アルコキシ基である。