

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成21年11月12日 (2009.11.12)

【公表番号】特表2009-510161 (P2009-510161A)

【公表日】平成21年3月12日 (2009.3.12)

【年通号数】公開・登録公報2009-010

【出願番号】特願2008-534484 (P2008-534484)

【国際特許分類】

C 07 D 471/04 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 21/00 (2006.01)

A 61 P 25/14 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 17/14 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 19/00 (2006.01)

A 61 K 31/496 (2006.01)

A 61 K 31/4545 (2006.01)

A 61 K 31/5377 (2006.01)

A 61 K 31/444 (2006.01)

A 61 K 31/437 (2006.01)

A 61 K 31/551 (2006.01)

A 61 K 31/501 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 471/04 1 0 7 K

A 61 P 25/28

A 61 P 25/16

A 61 P 25/00

A 61 P 21/00

A 61 P 25/14

A 61 P 9/10

A 61 P 25/24

A 61 P 17/14

A 61 P 3/10

A 61 P 19/00

A 61 K 31/496

A 61 K 31/4545

A 61 K 31/5377

A 61 K 31/444

A 61 K 31/437

A 61 K 31/551

A 61 K 31/501

【手続補正書】

【提出日】平成21年9月18日 (2009.9.18)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

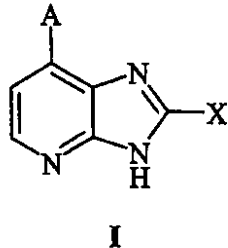
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

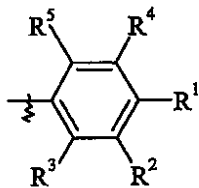
式 I :

【化 1】



[式中、X は、

【化 2】



または Y であり；

R^1 は、水素、ハロゲン、CN、 CO_2H 、 NO_2 、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} ハロアルキル、 OR^a 、 $\text{SO}_2\text{NR}^b\text{R}^c$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^b\text{R}^c$ 、 $\text{CH}_2\text{NR}^b\text{R}^c$ 、 CH_2OR^h 、 SO_2R^i 、および $\text{C}(\text{O})\text{R}^j$ から選択され；

R^2 および R^4 は、独立して、水素、ハロ、CN、 NO_2 、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} ハロアルキル、 OR^a 、 $\text{SO}_2\text{NR}^b\text{R}^c$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^b\text{R}^c$ 、 $\text{CH}_2\text{NR}^b\text{R}^c$ 、 CH_2OR^h 、 SO_2R^i 、および $\text{C}(\text{O})\text{R}^j$ から選択され；

R^3 および R^5 は、独立して、水素、 C_{1-3} アルキル、および C_{1-3} ハロアルキルから選択され；

A は、場合により 1 個またはそれ以上の CN、 CO_2H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、ハロ、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 OR^k 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^b\text{R}^c$ 、または $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^m$ で置換されたフェニルまたはピリジルであり、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により少なくとも 1 個の CN、 OR^a 、または NR^bR^c で置換され；

Y は、Z、 C_{1-6} アルキル、 CH_2OR^d 、および CH_2Z から選択され；

Z は、場合により、1 個またはそれ以上の CN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、ハロ、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 OR^k 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^b\text{R}^c$ 、または $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^m$ で置換されたヘテロアリアルであり、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により少なくとも 1 個の CN、 OR^a 、または NR^bR^c で置換され；

R^a は、水素、 C_{1-3} アルキル、および C_{1-3} ハロアルキルから選択され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合により 1 個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^b および R^c は、独立して、水素、ヘテロアリアル、 C_{1-6} アルキル、および C_{1-6} ハロアルキルから選択され、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により 1 個またはそれ以上の CN、 OR^a 、または NR^dR^e で置換され；または

R^b および R^c は、それらが結合している原子と一緒に、N、O または S から選択される 1 個またはそれ以上のヘテロ原子を含む 4、5、6 または 7 員の複素環を形成して

もよく、ここにおいて該複素環は、場合により 1 個またはそれ以上のハロ、 OR^a 、 NR^d 、 R^e 、 C_{1-3} アルキル、または C_{1-3} ハロアルキルで置換され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合によりさらに 1 個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^d および R^e は、独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、または C_{1-6} ハロアルキルから選択され、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により 1 個またはそれ以上の OR^a で置換され；または

R^d および R^e は、それらが結合している原子と一緒に、N、OまたはSから選択される 1 個またはそれ以上のヘテロ原子を含む 4、5、6または7員の複素環を形成してもよく、ここにおいて該複素環は、場合により 1 個またはそれ以上のハロ、 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルで置換され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキル、または C_{1-3} ハロアルキルは、場合によりさらに 1 個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^h は、水素、 C_{1-3} アルキル、または C_{1-3} ハロアルキルであり、該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合により 1 個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^i は、 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルであり、該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合により 1 個またはそれ以上の OR^a で置換され；

R^j は、アリールまたはヘテロアリールであり、ここにおいて該アリールまたはヘテロアリールは、場合により 1 個またはそれ以上の C_{1-3} アルキル、 OR^a 、ハロまたはCNで置換され；

R^k は、 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルであり、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により、少なくとも 1 つのCN、 OR^a 、 NR^bR^c 、 $C(O)NR^bR^c$ 、または $NR^bC(O)R^c$ で置換され；

R^m は、場合により少なくとも 1 個のハロ、CN、 OR^a 、 NR^bR^c 、または $C(O)NR^bR^c$ で置換された C_{1-3} アルキルであり；

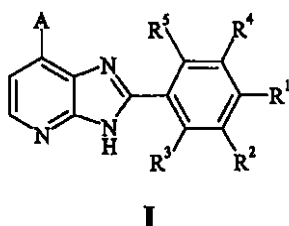
n は、0 ~ 2 である]

で示される遊離塩基、または製薬上許容できる塩、溶媒和物、またはその塩の溶媒和物としての化合物。

【請求項 2】

式 I：

【化 3】



[式中、

R^1 は、水素、ハロゲン、CN、 NO_2 、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} ハロアルキル、 OR^a 、 $SO_2NR^bR^c$ 、 $C(O)NR^bR^c$ 、 $CH_2NR^bR^c$ 、 CH_2OR^h 、 SO_2R^i 、または $C(O)R^j$ であり；

R^2 および R^4 は、独立して、水素、ハロ、CN、 NO_2 、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} ハロアルキル、 OR^a 、 $SO_2NR^bR^c$ 、 $C(O)NR^bR^c$ 、 $CH_2NR^bR^c$ 、 CH_2OR^h 、 SO_2R^i 、および $C(O)R^j$ から選択され；

R^3 および R^5 は、独立して、水素、 C_{1-3} アルキル、および C_{1-3} ハロアルキルから選択され；

Aは、場合により 1 個またはそれ以上のCN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、ハロ、 OR^k 、 $C(O)NR^bR^c$ 、または $S(O)_nR^m$ で置換されたフェニルまたはピリジルであり、該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により少なくとも 1 つの OR^a または NR^bR^c で置換され；

R^a は、水素、 C_{1-3} アルキル、または C_{1-3} ハロアルキルであり、該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合により1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^b および R^c は、独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、および C_{1-6} ハロアルキルから選択され、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により1個またはそれ以上の OR^a または NR^dR^e で置換され；または

R^b および R^c は、それらが結合している原子と一緒に、N、OまたはSから選択される1個またはそれ以上のヘテロ原子を含む4、5または6員の複素環を形成してもよく、ここにおいて該複素環は、場合により1個またはそれ以上のハロ、 C_{1-3} アルキル、または C_{1-3} ハロアルキルで置換され、該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合によりさらに1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^d および R^e は、独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、または C_{1-6} ハロアルキルから選択され、該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により1個またはそれ以上の OR^a で置換され；または

R^d および R^e は、それらが結合している原子と一緒に、N、OまたはSから選択される1個またはそれ以上のヘテロ原子を含む4、5または6員の複素環を形成してもよく、ここにおいて該複素環は、場合により1個またはそれ以上のハロ、 C_{1-3} アルキル、または C_{1-3} ハロアルキルで置換され、該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合によりさらに1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^h は、水素、 C_{1-3} アルキル、または C_{1-3} ハロアルキルであり、該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合により1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^i は、 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルであり、該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合により1個またはそれ以上の OR^a で置換され；

R^j は、アリールまたはヘテロアリールであり、ここにおいて該アリールまたはヘテロアリールは、場合により1個またはそれ以上の C_{1-3} アルキル、 OR^a 、ハロまたはCNで置換され；

R^k は、場合により少なくとも1個のCN、 OR^a 、 NR^bR^c 、または $C(O)NR^bR^c$ で置換された C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルであり；

R^m は、場合により少なくとも1個のハロ、CN、 OR^a 、 NR^bR^c 、または $C(O)NR^bR^c$ で置換された C_{1-3} アルキルであり；

n は、0～2である]

で示される遊離塩基、または製薬上許容できる塩、溶媒和物、またはその塩の溶媒和物としての化合物。

【請求項3】

R^1 は、水素、ハロゲン、CN、 NO_2 、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} ハロアルキル、 OR^a 、 $SO_2NR^bR^c$ 、 $C(O)NR^bR^c$ 、 $CH_2NR^bR^c$ 、 CH_2OR^h 、 SO_2R^i 、または $C(O)R^j$ であり；

R^2 および R^4 は、独立して、水素、ハロ、CN、 NO_2 、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} ハロアルキル、 OR^a 、 $SO_2NR^bR^c$ 、 $C(O)NR^bR^c$ 、 $CH_2NR^bR^c$ 、 CH_2OR^h 、 SO_2R^i 、および $C(O)R^j$ から選択され；

R^3 および R^5 は、独立して、水素、 C_{1-3} アルキル、および C_{1-3} ハロアルキルから選択され；

Aは、場合により1個またはそれ以上のCN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、ハロ、 OR^k 、 $C(O)NR^bR^c$ 、または $S(O)_nR^m$ で置換されたフェニルまたはピリジルであり、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により少なくとも1個の OR^a または NR^bR^c で置換され；

R^a は、水素、 C_{1-3} アルキル、または C_{1-3} ハロアルキルであり、該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合により1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^b および R^c は、独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、および C_{1-6} ハロアルキルから選択され、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により1個またはそれ以上の OR^a または NR^dR^e で置換され；または

R^b および R^c は、それらが結合している原子と一緒に、N、OまたはSから選択される1個またはそれ以上のヘテロ原子を含む4、5または6員の複素環を形成してもよく、ここにおいて該複素環は、場合により1個またはそれ以上のハロ、 C_{1-3} アルキル、または C_{1-3} ハロアルキルで置換され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合によりさらに1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^d および R^e は、独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、または C_{1-6} ハロアルキルから選択され、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により1個またはそれ以上の OR^a で置換され；または

R^d および R^e は、それらが結合している原子と一緒に、N、OまたはSから選択される1個またはそれ以上のヘテロ原子を含む4、5または6員の複素環を形成してもよく、ここにおいて該複素環は、場合により1個またはそれ以上のハロ、 C_{1-3} アルキル、または C_{1-3} ハロアルキルで置換され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合によりさらに1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^h は、水素、 C_{1-3} アルキル、または C_{1-3} ハロアルキルであり、該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合により1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^i は、 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルであり、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合により1個またはそれ以上の OR^a で置換され；

R^j は、アリールまたはヘテロアリールであり、ここにおいて該アリールまたはヘテロアリールは、場合により1個またはそれ以上の C_{1-3} アルキル、 OR^a 、ハロまたはCNで置換され；

R^k は、場合により少なくとも1個のCN、 OR^a 、 NR^bR^c 、または $C(O)NR^bR^c$ で置換された C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルであり；

R^m は、場合により少なくとも1個のハロ、CN、 OR^a 、 NR^bR^c 、または $C(O)NR^bR^c$ で置換された C_{1-3} アルキルであり；

nは、0～2である、

遊離塩基、または製薬上許容できる塩、溶媒和物、またはその塩の溶媒和物としての請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

R^1 は、水素、 $SO_2NR^bR^c$ 、 $C(O)NR^bR^c$ 、 $CH_2NR^bR^c$ 、 CH_2OR^h 、または SO_2R^i であり；

R^2 および R^4 は、独立して、水素、ハロ、CN、 NO_2 、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} ハロアルキル、 OR^a 、 $C(O)NR^bR^c$ 、 $CH_2NR^bR^c$ 、 CH_2OR^h 、および SO_2R^i から選択され；

R^3 および R^5 は、水素であり；

Aは、場合により1個またはそれ以上のCN、 C_{1-6} アルキル、ハロ、 OR^k 、または $C(O)NR^bR^c$ で置換されたフェニルまたはピリジルであり、該 C_{1-6} アルキルは、場合により少なくとも1個の OR^a または NR^bR^c で置換され；

R^a は、 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルであり、該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合により1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^b および R^c は、独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、または C_{1-6} ハロアルキルから選択され、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により1個またはそれ以上の OR^a または NR^dR^e で置換され；または

R^b および R^c は、それらが結合している原子と一緒に、N、OまたはSから選択される1個またはそれ以上のヘテロ原子を含む4、5または6員の複素環を形成してもよく、ここにおいて該複素環は、場合により1個またはそれ以上のハロ、 C_{1-3} アルキル、または、 C_{1-3} ハロアルキルで置換され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合によりさらに1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^d および R^e は、それらが結合している原子と一緒に、N、OまたはSから選択される1個またはそれ以上のヘテロ原子を含む4、5または6員の複素環を形成し、ここにおいて該複素環は、場合により1個またはそれ以上のハロ、 C_{1-3} アルキル、または C_1

C_{1-3} ハロアルキルで置換され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合によりさらに 1 個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^h は、水素、 C_{1-3} アルキル、または C_{1-3} ハロアルキルであり；

R^i は、 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルであり；

R^k は、場合により少なくとも 1 個の CN 、 OR^a 、 NR^bR^c 、または $C(O)NR^bR^c$ で置換された C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルである、遊離塩基、または製薬上許容できる塩、溶媒和物、またはその塩の溶媒和物としての請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 5】

R^1 は、 $SO_2NR^bR^c$ 、 $C(O)NR^bR^c$ 、または $CH_2NR^bR^c$ であり；

R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 は、水素であり；

A は、場合により 1 個またはそれ以上の CN 、 C_{1-6} アルキル、ハロ、 OR^k 、または $C(O)NR^bR^c$ で置換されたフェニルまたはピリジルであり、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルは、場合により少なくとも 1 個の NR^bR^c で置換され；

R^b および R^c は、独立して水素または C_{1-6} アルキルから選択され、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルは、場合により 1 個またはそれ以上の NR^dR^e で置換され；または、

R^b および R^c は、それらが結合している原子と一緒にあって、N または O から選択される 1 個またはそれ以上のヘテロ原子を含む 6 員の複素環を形成してもよく、ここにおいて該複素環は、場合により 1 個またはそれ以上の C_{1-3} アルキルで置換され；

R^d および R^e は、それらが結合している原子と一緒にあって、N、O または S から選択される 1 個またはそれ以上のヘテロ原子を含む 6 員の複素環を形成し；

R^k は、 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルである、遊離塩基、または製薬上許容できる塩、溶媒和物、またはその塩の溶媒和物としての請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 6】

R^1 は、水素、ハロゲン、 CN 、 CO_2H 、 NO_2 、 OR^a 、 $SO_2NR^bR^c$ 、 $C(O)NR^bR^c$ 、 $CH_2NR^bR^c$ 、 CH_2OR^h 、 SO_2R^i 、および $C(O)R^j$ から選択され；

R^2 および R^4 は、独立して、水素、ハロ、 CN 、 NO_2 、 OR^a 、 $SO_2NR^bR^c$ 、 $C(O)NR^bR^c$ 、 $CH_2NR^bR^c$ 、 CH_2OR^h 、 SO_2R^i 、および $C(O)R^j$ から選択され；

R^3 および R^5 は、独立して、水素、 C_{1-3} アルキル、および C_{1-3} ハロアルキルから選択され；

A は、場合により 1 個またはそれ以上の CN 、 CO_2H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、ハロ、 $C(O)R^a$ 、 OR^k 、 $C(O)NR^bR^c$ 、または $S(O)_nR^m$ で置換されたフェニルまたはピリジルであり、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により少なくとも 1 個の CN 、 OR^a 、または NR^bR^c で置換され；

Y は、Z、 C_{1-6} アルキル、 CH_2OR^d 、および CH_2Z から選択され；

Z は、場合により 1 個またはそれ以上の CN 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、ハロ、 $C(O)NR^bR^c$ 、または $S(O)_nR^m$ で置換されたヘテロアリールであり、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により少なくとも 1 個の CN 、 OR^a 、または NR^bR^c で置換され；

R^a は、水素、 C_{1-3} アルキル、および C_{1-3} ハロアルキルから選択され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合により 1 個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^b および R^c は、独立して、水素、ヘテロアリール、 C_{1-6} アルキル、および C_{1-6} ハロアルキルから選択され、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により 1 個またはそれ以上の CN 、 OR^a 、または NR^dR^e で置換され；または

R^b および R^c は、それらが結合している原子と一緒にあって、N、O または S から選択される 1 個またはそれ以上のヘテロ原子を含む 4、5、6 または 7 員の複素環を形成してもよく、ここにおいて該複素環は、場合により 1 個またはそれ以上のハロ、 OR^a 、 NR^d

R^e 、 C_{1-3} アルキルで置換され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルは、場合によりさらに1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^d および R^e は、独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、または C_{1-6} ハロアルキルから選択され、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により1個またはそれ以上の OR^a で置換され；または

R^d および R^e は、それらが結合している原子と一緒に、N、OまたはSから選択される1個またはそれ以上のヘテロ原子を含む4、5、6または7員の複素環を形成してもよく、ここにおいて該複素環は、場合により1個またはそれ以上のハロ、 C_{1-3} アルキル、または C_{1-3} ハロアルキルで置換され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合によりさらに1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^h は、水素、 C_{1-3} アルキル、または C_{1-3} ハロアルキルであり、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合により1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^i は、 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルであり、該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合により1個またはそれ以上の OR^a で置換され；

R^j は、アリールまたはヘテロアリールであり、ここにおいて該アリールまたはヘテロアリールは、場合により1個またはそれ以上の C_{1-3} アルキル、 OR^a 、ハロまたはCNで置換され；

R^k は、 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルであり、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により、少なくとも1つのCN、 OR^a 、または NR^b $C(O)R^c$ で置換され；

R^m は、場合により少なくとも1個のハロ、CN、 OR^a 、 NR^bR^c 、または $C(O)NR^bR^c$ で置換された C_{1-3} アルキルであり；

nは、0～2である、

遊離塩基、または製薬上許容できる塩、溶媒和物、またはその塩の溶媒和物としての請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

R^1 は、水素、ハロゲン、 CO_2H 、 NO_2 、 OR^a 、 $SO_2NR^bR^c$ 、 $C(O)NR^bR^c$ 、 $CH_2NR^bR^c$ 、 CH_2OR^h 、および SO_2R^i から選択され；

R^2 および R^4 は、独立して、水素、ハロ、 OR^a 、 $SO_2NR^bR^c$ 、 $C(O)NR^bR^c$ 、 $CH_2NR^bR^c$ 、 CH_2OR^h 、および SO_2R^i から選択され；

R^3 および R^5 は、独立して、水素、 C_{1-3} アルキル、および C_{1-3} ハロアルキルから選択され；

Aは、場合により1個またはそれ以上のCN、 CO_2H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、ハロ、 $C(O)R^a$ 、 OR^k 、または $C(O)NR^bR^c$ で置換されたフェニルまたはピリジルであり、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により少なくとも1個のCN、 OR^a 、または NR^bR^c で置換され；

Yは、Z、 C_{1-6} アルキル、 CH_2OR^d 、および CH_2Z から選択され；

Zは、場合により1個またはそれ以上のCN、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、ハロ、 $C(O)NR^bR^c$ 、または $S(O)_nR^m$ で置換されたヘテロアリールであり、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により少なくとも1個のCN、 OR^a 、または NR^bR^c で置換され；

R^a は、水素、 C_{1-3} アルキル、および C_{1-3} ハロアルキルから選択され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合により1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^b および R^c は、独立して、水素、ヘテロアリール、 C_{1-6} アルキル、および C_{1-6} ハロアルキルから選択され、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により1個またはそれ以上のCN、 OR^a 、または NR^dR^e で置換され；または

R^b および R^c は、それらが結合している原子と一緒に、N、OまたはSから選択される1個またはそれ以上のヘテロ原子を含む4、5、6または7員の複素環を形成して

もよく、ここにおいて該複素環は、場合により 1 個またはそれ以上のハロ、 OR^a 、 NR^d 、 R^e 、 C_{1-3} アルキルで置換され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルは、場合によりさらに 1 個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^d および R^e は、独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、または C_{1-6} ハロアルキルから選択され、該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により 1 個またはそれ以上の OR^a で置換され；または

R^d および R^e は、それらが結合している原子と一緒にあって、N、OまたはSから選択される 1 個またはそれ以上のヘテロ原子を含む 4、5、6または7員の複素環を形成してもよく、ここにおいて該複素環は、場合により 1 個またはそれ以上のハロ、 C_{1-3} アルキル、または C_{1-3} ハロアルキルで置換され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合によりさらに 1 個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^h は、水素、 C_{1-3} アルキル、または、 C_{1-3} ハロアルキルであり、該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合により 1 個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^i は、 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルであり、該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合により 1 個またはそれ以上の OR^a で置換され；

R^k は、 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルであり、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により、少なくとも 1 つの CN 、 OR^a 、または NR^b $C(O)R^c$ で置換され；

R^m は、場合により少なくとも 1 個のハロ、 CN 、 OR^a 、 NR^bR^c 、または $C(O)NR^bR^c$ で置換された C_{1-3} アルキルである、遊離塩基、または製薬上許容できる塩、溶媒和物、またはその塩の溶媒和物としての請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

R^1 は、水素、 CO_2H 、 $SO_2NR^bR^c$ 、 $C(O)NR^bR^c$ 、 $CH_2NR^bR^c$ 、および SO_2R^i から選択され；

R^2 および R^4 は、独立して、水素、 $C(O)NR^bR^c$ 、 $CH_2NR^bR^c$ 、および SO_2R^i から選択され；

R^3 および R^5 は、水素であり；

A は、場合により 1 個またはそれ以上の CN 、 CO_2H 、 C_{1-6} アルキル、ハロ、 $C(O)R^a$ 、 OR^k 、 $C(O)NR^bR^c$ 、または $S(O)_nR^m$ で置換されたフェニルまたはピリジルであり、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルは、場合により少なくとも 1 個の CN 、 OR^a 、または NR^bR^c で置換され；

Y は、Z、 C_{1-6} アルキル、 CH_2OR^d 、および、 CH_2Z から選択され；

Z は、場合により 1 個またはそれ以上の CN 、 C_{1-6} アルキル、または $C(O)NR^bR^c$ で置換されたヘテロアリールであり；

R^a は、水素および C_{1-3} アルキルから選択され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルは、場合により 1 個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^b および R^c は、独立して、水素、ヘテロアリール、および C_{1-6} アルキルから選択され、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルは、場合により 1 個またはそれ以上の CN 、 OR^a 、または NR^dR^e で置換され；または

R^b および R^c は、それらが結合している原子と一緒にあって、N、OまたはSから選択される 1 個またはそれ以上のヘテロ原子を含む 4、5、6または7員の複素環を形成してもよく、ここにおいて該複素環は、場合により 1 個またはそれ以上のハロ、 OR^a 、 NR^d 、 R^e 、 C_{1-3} アルキルで置換され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルは、場合によりさらに 1 個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^d および R^e は、 C_{1-6} アルキルであり；または

R^d および R^e は、それらが結合している原子と一緒にあって、NまたはOから選択される 1 個またはそれ以上のヘテロ原子を含む 4、5、6または7員の複素環を形成してもよく；

R^i は、 C_{1-3} アルキルであり；

R^k は、 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルであり、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により、少なくとも1つの CN 、 OR^a 、または $NR^bC(O)R^c$ で置換されている、

遊離塩基、または製薬上許容できる塩、溶媒和物、またはその塩の溶媒和物としての請求項1に記載の化合物。

【請求項9】

R^3 および R^5 は、水素である、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項10】

Aは、ピリジルである、請求項9に記載の化合物。

【請求項11】

Aは、場合により1個またはそれ以上の CN 、 CO_2H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、ハロ、 $C(O)R^a$ 、 OR^k 、 $C(O)NR^bR^c$ 、または $S(O)_nR^m$ で置換されたフェニルであり、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により少なくとも1個の CN 、 OR^a 、または NR^bR^c で置換されている、請求項9に記載の化合物。

【請求項12】

Aは、1個またはそれ以上の CN 、 CO_2H 、 C_{1-6} アルキル、ハロ、 $C(O)R^a$ 、 OR^k 、または $C(O)NR^bR^c$ で置換され、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルは、場合により少なくとも1個の CN 、 OR^a 、または NR^bR^c で置換されている、請求項11に記載の化合物。

【請求項13】

Aは、 OR^k 、 C_{1-6} アルキル、ハロ、または $C(O)NR^bR^c$ で置換されている、請求項12に記載の化合物。

【請求項14】

Aは、 OR^k で置換され、 R^k は、 C_{1-6} アルキルである、請求項13に記載の化合物。

【請求項15】

R^k は、メチルである、請求項14に記載の化合物。

【請求項16】

R^1 および R^2 は、水素であり；

R^4 は、 $C(O)NR^bR^c$ であり；

R^b および R^c は、独立して、水素、ヘテロアリール、および C_{1-6} アルキルから選択され、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルは、場合により1個またはそれ以上の CN 、 OR^a 、または NR^dR^e で置換され；または

R^b および R^c は、それらが結合している原子と一緒に、NまたはOから選択される1個またはそれ以上のヘテロ原子を含む4、5、6または7員の複素環を形成してもよく、ここにおいて該複素環は、場合により1個またはそれ以上のハロ、 OR^a 、 NR^dR^e 、 C_{1-3} アルキルで置換され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルは、場合によりさらに1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；

R^a は、 C_{1-3} アルキルであり、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルは、場合により1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換され；そして

R^d および R^e は、それらが結合している原子と一緒に、Nから選択される1個またはそれ以上のヘテロ原子を含む5員の複素環を形成してもよい、請求項12～15のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項17】

R^1 および R^4 は、水素であり；

R^2 は、 SO_2R^i であり；そして

R^i は、 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルである、請求項12～15のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項18】

R^i はメチルである、請求項 17 に記載の化合物。

【請求項 19】

R^2 および R^4 は、水素であり；

Aは、1個またはそれ以上のハロ、 OR^k 、または $C(O)NR^bR^c$ で置換されており、
、ここにおいて R^k は、 C_{1-6} アルキルであり；そして

R^b および R^c は、それらが結合している原子と一緒に、NまたはOから選択される1個またはそれ以上のヘテロ原子を含む4、5または6員の複素環を形成し、ここにおいて該複素環は、場合により1個またはそれ以上のハロ、 C_{1-3} アルキル、または C_{1-3} ハロアルキルで置換され、該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合によりさらに1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換されている、
請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 20】

Aは、 OR^k または $C(O)NR^bR^c$ で置換されている、請求項 19 に記載の化合物。

【請求項 21】

R^k は、 C_{1-6} アルキルである、請求項 20 に記載の化合物。

【請求項 22】

R^k は、メチルである、請求項 21 に記載の化合物。

【請求項 23】

R^b および R^c は、独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、および C_{1-6} ハロアルキルから選択され、ここにおいて該 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} ハロアルキルは、場合により1個またはそれ以上のCN、 OR^a 、または NR^dR^e で置換され；または

R^b および R^c は、それらが結合している原子と一緒に、N、OまたはSから選択される1個またはそれ以上のヘテロ原子を含む4、5、6または7員の複素環を形成してもよく、ここにおいて該複素環は、場合により1個またはそれ以上のハロ、 OR^a 、 NR^dR^e 、 C_{1-3} アルキル、または C_{1-3} ハロアルキルで置換され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルまたは C_{1-3} ハロアルキルは、場合によりさらに1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換されている、

請求項 20 に記載の化合物。

【請求項 24】

R^b および R^c は、それらが結合している原子と一緒に、NまたはOから選択される1個またはそれ以上のヘテロ原子を含む5、6または7員の複素環を形成し、ここにおいて該複素環は、場合により1個またはそれ以上のハロ、または C_{1-3} アルキルで置換され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルは、場合によりさらに1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換されている、請求項 23 に記載の化合物。

【請求項 25】

R^1 は、ハロゲン、 CO_2H 、 $C(O)NR^bR^c$ 、そして $CH_2NR^bR^c$ から選択される、請求項 19 ~ 24 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 26】

R^1 は、 $C(O)NR^bR^c$ または $CH_2NR^bR^c$ であり；そして

R^b および R^c は、それらが結合している原子と一緒に、NまたはOから選択される1個またはそれ以上のヘテロ原子を含む5、6または7員の複素環を形成し、ここにおいて該複素環は、場合により1個またはそれ以上のハロまたは C_{1-3} アルキルで置換され、ここにおいて該 C_{1-3} アルキルは、場合によりさらに1個またはそれ以上の C_{1-3} アルコキシで置換されている、

請求項 25 に記載の化合物。

【請求項 27】

以下：

7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) スルホニル] フェニル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩；

7 - (3 - メトキシフェニル) - 2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) ス

ルホニル } フェニル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カ
 ルボニル } フェニル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
 7 - (3 - メトキシフェニル) - 2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カ
 ルボニル } フェニル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
 7 - (4 - クロロフェニル) - 2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カル
 ボニル } フェニル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - [4 - (ピペリジン - 1 - イルメチル) フェニル
] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
 4 - [7 - (4 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 -
 イル] - N - (2 - モルホリン - 4 - イルエチル) ベンズアミド塩酸塩 ;
 2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボニル } フェニル } - 7 - [4
 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩
 ;
 2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボニル } フェニル } - 7 - ピリ
 ジン - 3 - イル - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
 7 - (2 , 4 - ジメトキシフェニル) - 2 - [4 - (モルホリン - 4 - イルカルボニル
) フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
 4 - (2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボニル } フェニル } - 3
 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 7 - イル) ベンゾニトリル塩酸塩 ;
 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - [4 - (モルホリン - 4 - イルメチル) フェニル
] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
 2 - { 4 - [4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボニル } フェニル } - 7 - [3 -
 (モルホリン - 4 - イルメチル) フェニル] - 1 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン ;
 N - (2 - シアノエチル) - 3 - { 2 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボ
 ニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 7 - イル } ベンズアミド ;
 7 - { 3 - [2 - (2 - メトキシエトキシ) エトキシ] フェニル } - 2 - { 4 - [(4
 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボニル } フェニル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b
] ピリジン ;
 3 - [3 - (2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボニル } フェニル
 } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 7 - イル) プロパン - 1 - オール ;
 7 - [3 - (3 - メトキシプロポキシ) フェニル] - 2 - { 4 - [(4 - メチルピペラ
 ジン - 1 - イル) カルボニル } フェニル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン ;
 N - { 3 - [3 - (2 - { 4 - [4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボニル } フェ
 ニル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 7 - イル) フェノキシ] プロピル } ア
 セトアミド ;
 4 - [3 - (2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボニル } フェニル
 } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 7 - イル) フェノキシ] ブタンニトリル ;
 3 - [3 - (2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボニル } フェニル
 } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 7 - イル) フェノキシ] プロパン - 1 - オ
 ール ;
 3 - [3 - (2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボニル } フェニル
 } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 7 - イル) フェノキシ] アセトニトリル ;
 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - { 5 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カ
 ルボニル] ピリジン - 2 - イル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン ;
 2 - { 4 - [(3 , 3 - ジフルオロピロリジン - 1 - イル) カルボニル } フェニル } -
 7 - (4 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン ;
 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - (4 - { [(3 R) - 3 - メチルモルホリン - 4
 - イル] カルボニル } フェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン ;
 2 - { 4 - [(4 - エチルピペラジン - 1 - イル) カルボニル } フェニル } - 7 - (4

- メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン ;
- 4 - [7 - (4 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル] - N - (2 - ピペリジン - 1 - イルエチル) ベンズアミド ;
- 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - { 4 - [(4 - メチル - 1 , 4 - ジアゼパン - 1 - イル) カルボニル] フェニル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン ;
- 1 - { 4 - [7 - (4 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル] ベンゾイル } - N , N - ジメチルピロリジン - 3 - アミン ;
- 2 - (4 - { [4 - (2 - メトキシエチル) ピペラジン - 1 - イル] カルボニル } フェニル) - 7 - (4 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン ;
- 2 - { 4 - [(4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) カルボニル] フェニル } - 7 - (4 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン ;
- 2 - (4 - { [(3 S) - 3 - フルオロピロリジン - 1 - イル] カルボニル } フェニル) - 7 - (4 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン ;
- 1 - { 4 - [7 - (4 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル] ベンゾイル } ピロリジン - 3 - オール塩酸塩 ;
- 7 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボニル] フェニル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
- 7 - (4 - イソプロポキシフェニル) - 2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボニル] フェニル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
- 7 - (4 - エトキシフェニル) - 2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボニル] フェニル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
- 7 - (4 - メトキシ - 2 - メチルフェニル) - 2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボニル] フェニル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
- 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - { 2 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボニル] ピリジン - 4 - イル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン ;
- 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - { 5 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボニル] ピリジン - 3 - イル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン ;
- 7 - (2 - メトキシフェニル) - 2 - [4 - (モルホリン - 4 - イルカルボニル) フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
- N - (3 - メトキシプロピル) - 4 - (7 - ピリジン - 4 - イル - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル) ベンズアミド塩酸塩 ;
- 2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボニル] フェニル } - 7 - ピリジン - 4 - イル - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
- 2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) メチル] フェニル } - 7 - ピリジン - 4 - イル - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
- 4 - (2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) メチル] フェニル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 7 - イル) ベンズアミド塩酸塩 ;
- 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) メチル] フェニル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
- 7 - (4 - エトキシフェニル) - 2 - { 4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) メチル] フェニル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
- (4 - { 2 - [4 - (モルホリン - 4 - イルメチル) フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 7 - イル } フェニル) メタノール塩酸塩 ;
- N - メチル - 4 - { 2 - [4 - (モルホリン - 4 - イルメチル) フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 7 - イル } ベンズアミド塩酸塩 ;
- 2 - [4 - (モルホリン - 4 - イルメチル) フェニル] - 7 - [4 - (ピロリジン - 1 - イルカルボニル) フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
- 4 - { 2 - [4 - (モルホリン - 4 - イルメチル) フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 7 - イル } ベンズアミド塩酸塩 ;
- (4 - { 2 - [4 - (モルホリン - 4 - イルメチル) フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 ,

5 - b] ピリジン - 7 - イル } フェニル) アセトニトリル塩酸塩 ;
 4 - { 2 - [4 - (モルホリン - 4 - イルメチル) フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 ,
 5 - b] ピリジン - 7 - イル } 安息香酸塩酸塩 ;
 4 , 4 ' - (3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 , 7 - ジイル) ニ安息香酸 ;
 7 - [4 - (アゼチジン - 1 - イルカルボニル) フェニル] - 2 - [4 - (モルホリン
 - 4 - イルメチル) フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
 1 - (4 - { 2 - [4 - (モルホリン - 4 - イルメチル) フェニル] - 3 H - イミダゾ
 [4 , 5 - b] ピリジン - 7 - イル } フェニル) エタノン塩酸塩 ;
 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - [3 - (モルホリン - 4 - イルメチル) フェニル
] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - { 3 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) メ
 チル] フェニル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - フェニル - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジ
 ン ;
 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - [3 - (メチルスルホニル) フェニル] - 3 H -
 イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン ;
 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - [4 - (メチルスルホニル) フェニル] - 3 H -
 イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン ;
 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - (1 H - ピロール - 2 - イル) - 3 H - イミダゾ
 [4 , 5 - b] ピリジン ;
 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - ピリダジン - 4 - イル - 3 H - イミダゾ [4 , 5
 - b] ピリジン ;
 5 - [7 - (4 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 -
 イル] ピリジン - 2 - カルボニトリル ;
 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - (6 - メチルピリジン - 3 - イル) - 3 H - イミ
 ダゾ [4 , 5 - b] ピリジン ;
 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - (1 - メチルシクロプロピル) - 3 H - イミダゾ
 [4 , 5 - b] ピリジン ;
 2 - (2 - フリルメチル) - 7 - (4 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5
 - b] ピリジン ;
 2 - (ブトキシメチル) - 7 - (4 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 -
 b] ピリジン ;
 2 - (メトキシメチル) - 7 - (4 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 -
 b] ピリジン ;
 3 - [7 - (4 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 -
 イル] - N - (3 - メトキシプロピル) ベンズアミド塩酸塩 ;
 3 - { 7 - [4 - (アミノカルボニル) フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピ
 リジン - 2 - イル } - N - (3 - メトキシプロピル) ベンズアミド塩酸塩 ;
 4 - { 2 - [3 - (モルホリン - 4 - イルカルボニル) フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピ
 リジン - 7 - イル } ベンズアミド塩酸塩 ;
 N - (2 - メトキシエチル) - 3 - [7 - (4 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ
 [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル] ベンズアミド塩酸塩 ;
 3 - [7 - (4 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 -
 イル] - N - (2 - ピロリジン - 1 - イルエチル) ベンズアミド塩酸塩 ;
 N - (2 - シアノエチル) - 3 - [7 - (4 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピ
 リジン - 2 - イル] ベンズアミド塩酸塩 ;
 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - [3 - (モルホリン - 4 - イルカルボニル) フェ
 ニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ;
 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - { 3 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カ
 ルボニル] フェニル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン塩酸塩 ; および

3 - [7 - (4 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル] - N - ピリジン - 3 - イルベンズアミド塩酸塩

から選択される遊離塩基、または製薬上許容できる塩、溶媒和物、またはその塩の溶媒和物としての請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 28】

活性成分として、治療上有効な量の請求項 1 ~ 27 のいずれか一項に記載の化合物を、製薬上許容できる添加剤、キャリアーまたは希釈剤と共に含む医薬製剤。

【請求項 29】

治療に使用するための、請求項 1 ~ 27 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 30】

認知症、アルツハイマー病、パーキンソン病、パーキンソン型の前頭側頭認知症、グアム島のパーキンソン認知症複合、HIV 認知症、神経原線維変化の病変に関連する疾患、およびボクサー認知症を予防または治療するための医薬の製造における、請求項 1 ~ 27 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 31】

疾患は、アルツハイマー病である、請求項 30 に記載の化合物の使用。

【請求項 32】

筋萎縮性側索硬化症、大脳皮質基底核変性症、ダウン症候群、ハンチントン病、脳炎後パーキンソン症候群、進行性核上麻痺、ピック病、ニーマン - ピック病、卒中、頭部外傷およびその他の慢性神経変性疾患、双極性障害、情動障害、うつ病、統合失調症、認知障害、脱毛、および避妊投薬を予防または治療するための医薬の製造における、請求項 1 ~ 27 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 33】

前認知症の状態、軽度認知機能障害、加齢に伴う記憶障害、加齢関連認知低下、認知症ではない認知障害、軽度の認知力低下、軽度の神経系認知力低下、高齢期の健忘、記憶障害および認知障害、脳血管性認知症、レヴィー小体型認知症、前頭側頭認知症、および男性型脱毛症、ならびに I 型および II 型糖尿病、糖尿病性神経障害および糖尿病に関連する障害を予防または治療するための医薬の製造における、請求項 1 ~ 27 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 34】

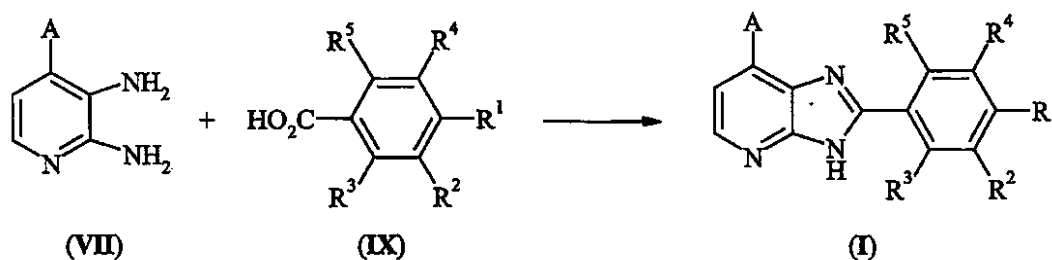
骨関連障害を予防または治療するための医薬の製造における、請求項 1 ~ 27 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 35】

式 I (式中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^b 、 R^c 、および A は、特に他の規定がない限り請求項 1 で定義した通りである) で示される化合物の製造方法であって、

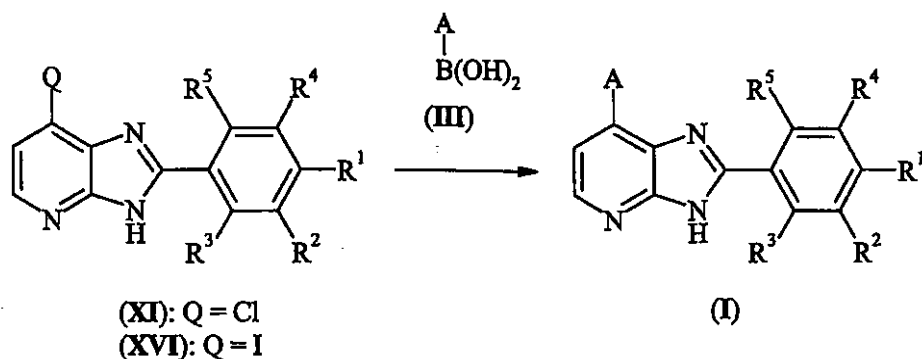
(i) ジアミン VII とタイプ IX のカルボン酸とを縮合させて、タイプ I の生成物を得ること；

【化 4】



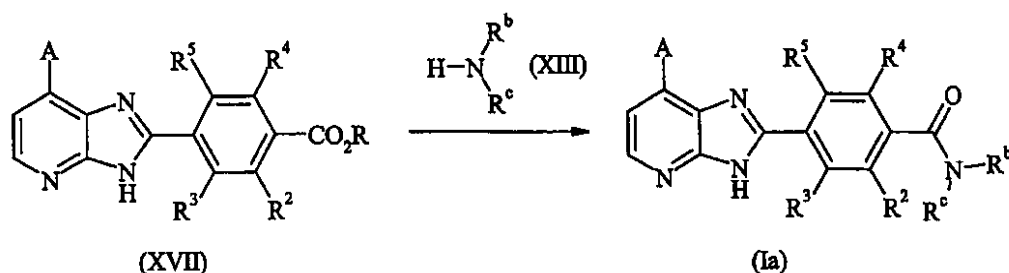
(ii) 式 XI ($Q = C1$) または XVI ($Q = I$) で示される化合物と、適切なアリール種 II とをクロスカップリングさせ、式 I で示される化合物を得ること；

【化 5】



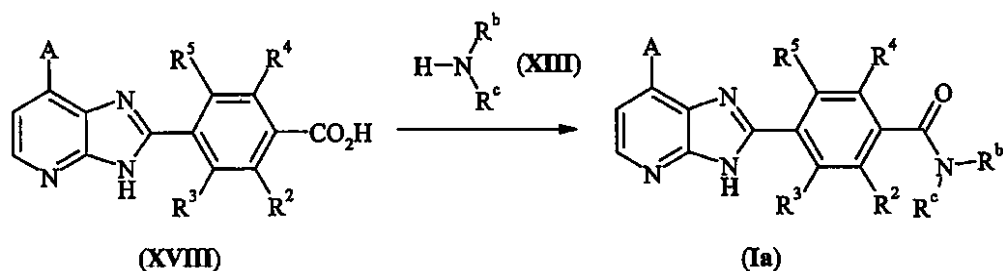
(iii) エステルXVIIを、タイプI aの化合物(Iにおいて、AはC(O)NR^bR^cであり、Rはアルキルである)に変換すること、この変換は、(a)第一に、未希釈のエステルXVIIをアミンXIIIと共に+180 ~ +220 の温度範囲で加熱すること、および(b)第二に、冷却した後、適切な触媒を添加し、この反応を0 ~ +20 の温度範囲で継続させることによってなされる；

【化 6】



(iv) タイプXVIIIのカルボン酸と、タイプXIIIのアミンとを反応させることによってタイプI aのアミドを形成させること；

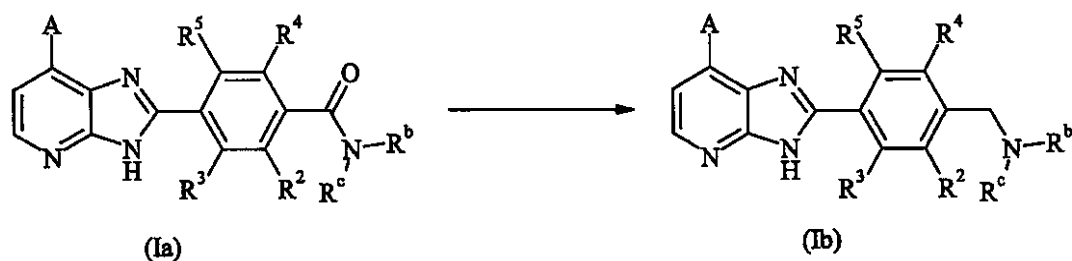
【化 7】



または

(v) タイプI aの化合物を、タイプI bの化合物(I、ここにおいてAは、C(O)NR^bR^cである)に還元によって変換させること；

【化 8】



を含む、上記方法

【請求項 36】

以下：

- 2 - (ベンジルオキシ) - 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - ニトロピリジン；
- 4 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - ニトロピリジン - 2 - アミン；
- 4 - (4 - メトキシフェニル)ピリジン - 2, 3 - ジアミン；
- 2 - (ベンジルオキシ) - 4 - (3 - メトキシフェニル) - 3 - ニトロピリジン；
- 4 - (3 - メトキシフェニル)ピリジン - 2, 3 - ジアミン；
- 4 - [7 - (4 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン - 2 - イル]安息香酸メチル；
- 4 - [7 - (3 - メトキシフェニル) - 3 H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン - 2 - イル]安息香酸メチル；
- 7 - クロロ - 2 - {4 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル)カルボニル]フェニル} - 3 H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン；
- 7 - クロロ - 2 - [4 - (ピペリジン - 1 - イルカルボニル)フェニル] - 3 H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン；
- 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - [4 - (ピペリジン - 1 - イルカルボニル)フェニル] - 3 H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン；
- 4 - (7 - クロロ - 3 H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン - 2 - イル) - N - (2 - モルホリン - 4 - イルエチル)ベンズアミド；
- 4 - [7 - (4 - シアノフェニル) - 3 H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン - 2 - イル]安息香酸メチル；
- 7 - (4 - メトキシフェニル) - 2 - [4 - (モルホリン - 4 - イルカルボニル)フェニル] - 3 H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン；
- 4 - [3 - (モルホリン - 4 - イルカルボニル)フェニル] - 3 - ニトロピリジン - 2 - アミン；
- 4 - [3 - (モルホリン - 4 - イルカルボニル)フェニル]ピリジン - 2, 3 - ジアミン；
- 4 - [3 - (モルホリン - 4 - イルメチル)フェニル]ピリジン - 2, 3 - ジアミン；
- 4 - {7 - [3 - (モルホリン - 4 - イルメチル)フェニル] - 1 H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン - 2 - イル}安息香酸メチル；
- 4 - {7 - [3 - (モルホリン - 4 - イルメチル)フェニル] - 1 H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン - 2 - イル}安息香酸；
- 4 - (7 - ヨード - 3 H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン - 2 - イル)安息香酸メチル；
- 4 - (7 - ヨード - 3 - {[2 - (トリメチルシリル)エトキシ]メチル} - 3 H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン - 2 - イル)安息香酸メチル；
- 4 - (7 - (3 - {[(2 - シアノエチル)アミノ]カルボニル}フェニル) - 3 - {[2 - (トリメチルシリル)エトキシ]メチル} - 3 H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン - 2 - イル)安息香酸メチル；
- 4 - (7 - (3 - {[(2 - シアノエチル)アミノ]カルボニル}フェニル) - 3 - {[2 - (トリメチルシリル)エトキシ]メチル} - 3 H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン - 2 - イル)安息香酸；
- N - (2 - シアノエチル) - 3 - (2 - [(4 - メチルピペラジン - 1 - イル)カルボニル] - 3 - {[2 - (トリメチルシリル)エトキシ]メチル} - 3 H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン - 7 - イル)ベンズアミン；
- 4 - (7 - [3 - (ベンジルオキシ)フェニル] - 3 H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン - 2 - イル)安息香酸メチル；
- 4 - (7 - [3 - (ベンジルオキシ)フェニル] - 3 - {[2 - (トリメチルシリル)エトキシ]メチル} - 3 H - イミダゾ[4, 5 - b]ピリジン - 2 - イル)安息香酸メチル；
- 4 - (7 - [3 - (ベンジルオキシ)フェニル] - 3 - {[2 - (トリメチルシリル)

エトキシ]メチル}-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-2-イル)安息香酸;

7-[3-(ベンジルオキシ)フェニル]-2-{4-[(メチルピペラジン-1-イル)カルボニル]フェニル}-3-{[2-(トリメチルシリル)エトキシ]メチル}-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン;

3-(2-{4-[(4-メチルピペラジン-1-イル)カルボニル]フェニル}-3-{[2-(トリメチルシリル)エトキシ]メチル}-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-イル)フェノール;

4-(7-[3-(3-ヒドロキシプロピル)フェニル]-3-{[2-(トリメチルシリル)エトキシ]メチル}-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-2-イル)安息香酸メチル;

4-(7-[3-(3-ヒドロキシプロピル)フェニル]-3-{[2-(トリメチルシリル)エトキシ]メチル}-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-2-イル)安息香酸;

3-[3-(2-{4-メチルピペラジン-1-イル)カルボニル]フェニル}-3-{[2-(トリメチルシリル)エトキシ]メチル}-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-イル)フェニル]プロパン-1-オール;

7-[3-(3-メトキシプロポキシ)フェニル]-2-{4-[(4-メチルピペラジン-1-イル)カルボニル]フェニル}-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン;

N-{3-[3-(2-{4-[(4-メチルピペラジン-1-イル)カルボニル]フェニル}-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-イル)フェノキシ]プロピル}アセトアミド;

4-[3-(2-{4-[(4-メチルピペラジン-1-イル)カルボニル]フェニル}-3-{[2-(トリメチルシリル)エトキシ]メチル}-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-イル)フェノキシ]ブタンニトリル;

3-[3-(2-{4-[(4-メチルピペラジン-1-イル)カルボニル]フェニル}-3-{[2-(トリメチルシリル)エトキシ]メチル}-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-イル)フェノキシ]プロパン-1-オール;

3-[3-(2-{4-[(4-メチルピペラジン-1-イル)カルボニル]フェニル}-3-{[2-(トリメチルシリル)エトキシ]メチル}-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-イル)フェノキシ]アセトニトリル;

6-[7-(4-メトキシフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-2-イル]ニコチン酸メチル;

4-[7-(4-メトキシフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-2-イル]安息香酸;

メチル4-[7-(4-メトキシフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-2-イル]ピリジン-2-カルボキシラート;

5-[7-(4-メトキシフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-2-イル]ニコチン酸;

4-(7-ヨード-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-2-イル)安息香酸;

7-ヨード-2-[4-(3-メトキシプロピル-4-イルカルボニル)フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン;

7-クロロ-2-{4-[(4-メチルピペラジン-1-イル)メチル]フェニル}-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン;

4-{2-[4-(モルホリン-4-イルメチル)フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-イル}安息香酸メチル;

3-[7-(4-メトキシフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-2-イル]安息香酸メチル;

3-[7-(4-メトキシフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-2-イル]安息香酸;

7-クロロ-2-[4-(モルホリン-4-イルカルボニル)フェニル]-3H-イミ

ダゾ [4 , 5 - b] ピリジン ;

3 - (3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル) 安息香酸メチル ;

[4 - [2 - [3 - (3 - メトキシプロボキシ) フェニル] - 7 - (2 - トリメチルシリルエトキシメチル) - 5 , 7 , 9 - トリアザピシクロ [4 . 3 . 0] ノナ - 1 , 3 , 5 , 8 - テトラエン - 8 - イル] フェニル] - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - メタノン ;

N - [3 - [3 - [8 - [4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) カルボニルフェニル] - 7 - (2 - トリメチルシリルエトキシメチル) - 5 , 7 , 9 - トリアザピシクロ [4 . 3 . 0] ノナ - 1 , 3 , 5 , 8 - テトラエン - 2 - イル] フェノキシ] プロピル] アセトアミド ;

7 - クロロ - 2 - [4 - (モルホリン - 4 - イルメチル) フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン ;

3 - (7 - クロロ - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル) 安息香酸メチル ; および

3 - { 7 - [4 - (アミノカルボニル) フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル } 安息香酸
から選択される化合物。

【請求項 37】

請求項 1 ~ 27 のいずれか一項に記載の化合物の製造方法における中間体としての、請求項 36 に記載の化合物の使用。