

【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24年7月12日(2012.7.12)

【公表番号】特表2012-502890(P2012-502890A)

【公表日】平成24年2月2日(2012.2.2)

【年通号数】公開・登録公報2012-005

【出願番号】特願2011-526518(P2011-526518)

【国際特許分類】

C 0 7 D	471/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/437	(2006.01)
A 6 1 K	31/4545	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/02	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/16	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/04	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D	471/04	1 0 6 H
C 0 7 D	471/04	C S P
A 6 1 K	31/437	
A 6 1 K	31/4545	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	11/16	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	1/16	

A 6 1 P 3/10  
A 6 1 P 9/04  
A 6 1 P 9/10 1 0 3

## 【手続補正書】

【提出日】平成24年5月25日(2012.5.25)

## 【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

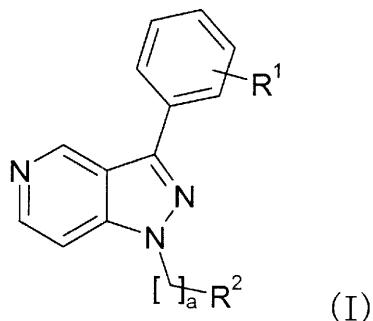
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式(I)：

## 【化1】



(式中、

R<sup>1</sup> は、ハロゲン、シアノ、C<sub>1-6</sub>-アルキル、ハロ-C<sub>1-6</sub>-アルキルおよびC<sub>1-6</sub>-アルコキシから独立して選択される1、2または3つの置換基であり；

R<sup>2</sup> は、O、SおよびN(R<sup>3</sup>)から独立して選択される1または2個のヘテロ原子を含む4-~7-員のヘテロ環であり、ここで、環炭素原子はR<sup>4</sup>で任意に置換されていてもよく；

R<sup>3</sup> は、水素、C<sub>1-6</sub>-アルキル、ヒドロキシ-C<sub>1-6</sub>-アルキル、シアノ-C<sub>1-6</sub>-アルキル、ハロ-C<sub>1-6</sub>-アルキル、C<sub>1-6</sub>-アルコキシ-C<sub>1-6</sub>-アルキル、C<sub>1-6</sub>-アシルおよびC<sub>1-6</sub>-アルキルスルホニルから選択され；

R<sup>4</sup> は、ハロゲン、ヒドロキシ、C<sub>1-6</sub>-アルキル、ヒドロキシ-C<sub>1-6</sub>-アルキル、C<sub>1-6</sub>-アルコキシ-C<sub>1-6</sub>-アルキル、シアノ-C<sub>1-6</sub>-アルキル、ハロ-C<sub>1-6</sub>-アルキルおよびC<sub>1-6</sub>-アルコキシから選択され；

a は 0、1または2である)

[ここで、

・3-(3,4-ジクロロフェニル)-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン、または

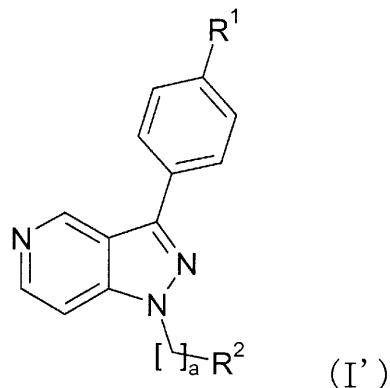
・1-(1-メチルピペリジン-4-イル)-3-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジンではないことを条件とする。]

の化合物、またはその医薬的に許容な塩、溶媒和物、水和物、幾何異性体、互変異性体、光学異性体もしくはN-オキサイド。

## 【請求項2】

式(I')：

## 【化2】



(式中、

R<sup>1</sup> は、ハロゲン、シアノおよびC<sub>1-4</sub>-アルキルから選択され；R<sup>2</sup> は、O、SおよびN(R<sup>3</sup>)から独立して選択される1または2個のヘテロ原子を含む5-~6-員のヘテロ環であり、ここで、環炭素原子はR<sup>4</sup>で任意に置換されてもよく；R<sup>3</sup> は、水素、C<sub>1-4</sub>-アルキル、ヒドロキシ-C<sub>1-4</sub>-アルキル、シアノ-C<sub>1-4</sub>-アルキル、ハロ-C<sub>1-4</sub>-アルキル、C<sub>1-4</sub>-アルコキシ-C<sub>1-4</sub>-アルキル、C<sub>1-4</sub>-アシルおよびC<sub>1-4</sub>-アルキルスルホニルから選択され；R<sup>4</sup> は、もし存在するなら、C<sub>1-4</sub>-アルキル、ハロ-C<sub>1-4</sub>-アルキル、ヒドロキシ-C<sub>1-4</sub>-アルキルおよびC<sub>1-4</sub>-アルコキシ-C<sub>1-4</sub>-アルキルから独立して選択され；

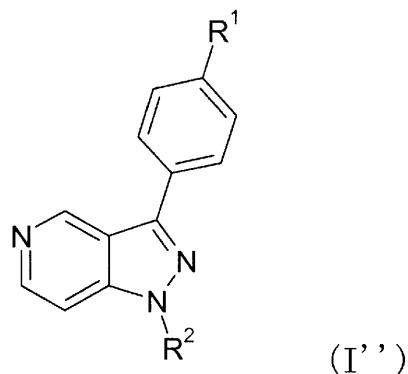
a は0または1である)

を有する、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項3】

式(II')：

## 【化3】



(式中、

R<sup>1</sup> は、ハロゲン、シアノおよびC<sub>1-4</sub>-アルキルから選択され；R<sup>2</sup> は、OおよびN(R<sup>3</sup>)から選択される1個のヘテロ原子を含む飽和の5-~6-員のヘテロ環であり、ここで、環炭素原子はR<sup>4</sup>で任意に置換されてもよく；R<sup>3</sup> は、水素、C<sub>1-4</sub>-アルキルまたはシアノ-C<sub>1-4</sub>-アルキルであり；R<sup>4</sup> は、もし存在するなら、独立してメチルまたはエチルである)

を有する、請求項1または2に記載の化合物。

## 【請求項4】

- ・3-(4-フルオロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン；
- ・3-(4-クロロフェニル)-2-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-2H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン；

- ・ 3-(4-メチルフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン；
- ・ 3-(4-クロロフェニル)-1-[(3R)-テトラヒドロフラン-3-イル]-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン；
- ・ 3-(4-クロロフェニル)-1-ピペリジン-4-イル-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン；
- ・ 3-(4-クロロフェニル)-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン；
- ・ {4-[3-(4-クロロフェニル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-1-イル]ピペリジン-1-イル}アセトニトリル；
- ・ 3-(4-クロロフェニル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イルメチル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン；
- ・ 3-(4-クロロフェニル)-1-[1-(メチルスルホニル)ピペリジン-4-イル]-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン；
- ・ 1-(1-アセチルピペリジン-4-イル)-3-(4-クロロフェニル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン；
- ・ 3-(4-クロロフェニル)-1-[1-(2-メトキシエチル)ピペリジン-4-イル]-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン；
- ・ 3-(4-クロロフェニル)-1-ピペリジン-3-イル-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン；
- ・ 3-(4-クロロフェニル)-1-[(3S)-テトラヒドロフラン-3-イル]-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン；
- ・ 3-(4-クロロフェニル)-1-(テトラヒドロフラン-3-イルメチル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン；
- ・ 3-(4-クロロフェニル)-1-(1-エチルピペリジン-4-イル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン；
- ・ 3-(4-クロロフェニル)-1-(1-イソプロピルピペリジン-4-イル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン；
- ・ 3-(4-フルオロフェニル)-1-(1-メチルピペリジン-4-イル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン；
- ・ 3-(4-フルオロフェニル)-1-ピペリジン-4-イル-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン；
- ・ 4-[1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-イル]ベンゾニトリル；および
- ・ 4-[1-(1-メチルピペリジン-4-イル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-イル]ベンゾニトリル

から選択される、請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項5】

医薬的に許容される希釈剤または担体と組み合わせて、請求項1～4のいずれか1つに記載の化合物を活性成分として含む医薬組成物。

#### 【請求項6】

炎症、炎症性疾患、免疫性または自己免疫性障害の治療または予防のための、請求項5に記載の医薬組成物。

#### 【請求項7】

炎症もしくは炎症性疾患または免疫性もしくは自己免疫性障害が、関節炎（関節リウマチ、若年性関節リウマチ、骨関節炎および乾癬性関節炎を含む）、滑膜炎、脈管炎、腸の炎症に関連する病状（クローン病、潰瘍性大腸炎、炎症性腸疾患および過敏性腸症候群を含む）、アテローム性動脈硬化症、多発性硬化症、アルツハイマー病、血管性認知症、肺の炎症性疾患（喘息、慢性閉塞性肺疾患および急性呼吸窮迫症候群を含む）、線維性疾患（特発性肺線維症、心線維症および全身性硬化症（強皮症）を含む）、皮膚の炎症性疾患（接触性皮膚炎、アトピー性皮膚炎および乾癬を含む）、全身性炎症反応症候群、敗血症、肝の炎症性および/または自己免疫性の病状（自己免疫性肝炎、原発性胆汁性肝硬変、アルコール性肝臓疾患、硬化性胆管炎および自己免疫性胆管炎を含む）、糖尿病（IまたはII型

)および／またはそれらの合併症、慢性心不全、うっ血性心不全、虚血性疾患（脳卒中および虚血再灌流傷害を含む）、ならびに心筋梗塞および／またはその合併症である、請求項6に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

炎症性疾患が脈管炎である、請求項6に記載の医薬組成物。