

【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5月14日 (2009.5.14)

【公表番号】特表2008-534555(P2008-534555A)

【公表日】平成20年8月28日 (2008.8.28)

【年通号数】公開・登録公報2008-034

【出願番号】特願2008-503513(P2008-503513)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 27/16 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 471/04 1 0 7 Z

C 0 7 D 471/04 C S P

A 6 1 K 31/55

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 27/06
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 27/16
 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 9/00
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 25/14
 A 6 1 P 21/00
 A 6 1 P 25/06
 A 6 1 P 25/18
 A 6 1 P 9/10

【手続補正書】

【提出日】平成21年3月26日(2009.3.26)

【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

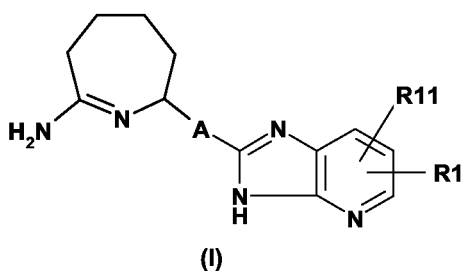
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I

【化1】



〔式中、

Aは、C₁～C₄-アルキレン又はC₃～C₇-シクロアルキレンであり、

R1は、フェニル、R2及び／又はR3で置換されたフェニル、Har1又は、R4及び／又はR5で置換されたHar1であり、

R11は、水素、ハロゲン、C₁～C₄-アルキル又はC₁～C₄-アルコキシであり、その際、

R2は、シアノ、ハロゲン、カルボキシル、C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-アルコキシ、アミノカルボニル、モノ-もしくはジ-C₁～C₄-アルキルアミノカルボニル、C₁～C₄-アルキルカルボニルアミノ、C₁～C₄-アルコキシカルボニル、アミノ、モノ-もしくはジ-C₁～C₄-アルキルアミノ、トリフルオロメチル、ヒドロキシル、C₁～C₄-アルキルスルホニルアミノ、フェニルスルホニルアミノ、フェニル-C₁～C₄-アルコキシ

シ又は $-SO_2-N(R_{21})R_{22}$ であり、その際、
 R_{21} は、水素、 $C_1\sim C_4$ -アルキル、 $C_3\sim C_7$ -シクロアルキル、フェニル- $C_1\sim C_4$ -アルキル、 $Har_{21}-C_1\sim C_4$ -アルキル、ヒドロキシ- $C_2\sim C_4$ -アルキル、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ- $C_2\sim C_4$ -アルキル、フェニル、ピリジル又は R_{211} 及び／又は R_{212} で置換されたフェニルであり、その際、
 Har_{21} は、ピリジル、チエニル、フリル又はテトラヒドロフリルであり、
 R_{211} は、 $C_1\sim C_4$ -アルキル、ハロゲン、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ又はモノーもしくはジ- $C_1\sim C_4$ -アルキルアミノであり、
 R_{212} は、 $C_1\sim C_4$ -アルキル又はハロゲンであり、
 R_{22} は、水素、 $C_1\sim C_4$ -アルキル、ヒドロキシ- $C_2\sim C_4$ -アルキル又は $C_1\sim C_4$ -アルコキシ- $C_2\sim C_4$ -アルキルであるか、又は
 R_{21} 及び R_{22} は、一緒になって、それらが結合される窒素原子を含んで、複素環式の環 Het_1 を形成し、その際、
 Het_1 は、第一の構成成分と、場合により該第一の構成成分に縮合された第二の構成成分とから構成される、完全飽和もしくは部分不飽和の単環式もしくは縮合二環式の環もしくは環系であり、前記の第一の構成成分は、3員ないし7員の単環式の完全飽和の非芳香族の複素環式の環 B であり、該複素環式の環 B は、窒素、酸素及び硫黄から無関係に選択される1～3個のヘテロ原子を有し、かつ該複素環式の環 B は、1もしくは2個のオキシ基によって置換されていてよく、かつ前記の第二の構成成分は、ベンゼン環であり、かつ前記の環 Het_1 は、 R_{23} によって環炭素原子上で置換されていてよい及び／又は前記の環 Het_1 は、 R_{24} によって更なる環炭素原子上で置換されていてよい及び／又は前記の環 Het_1 は、エチレンジオキシ基によって環炭素原子上で置換されていてよい及び／又は前記の環 Het_1 は、 R_{25} によって環窒素原子上で置換されていてよく、その際、
 R_{23} は、 $C_1\sim C_4$ -アルキル、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ又はフェニルカルボニルであり、
 R_{24} は、 $C_1\sim C_4$ -アルキル又は $C_1\sim C_4$ -アルコキシであり、
 R_{25} は、 $C_1\sim C_4$ -アルキル、フェニル- $C_1\sim C_4$ -アルキル、 $C_1\sim C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ- $C_2\sim C_4$ -アルキル、モノーもしくはジ- $C_1\sim C_4$ -アルキルアミノ- $C_2\sim C_4$ -アルキル、フェニル、ピリミジル、ピリジル、ホルミル、 $C_3\sim C_7$ -シクロアルキル、 $C_3\sim C_7$ -シクロアルキルメチル又は R_{251} 及び／又は R_{252} で置換されたフェニルであり、その際、
 R_{251} は、ハロゲン、シアノ又は $C_1\sim C_4$ -アルキルであり、
 R_{252} は、ハロゲン又は $C_1\sim C_4$ -アルキルであり、
 R_3 は、水素、 $C_1\sim C_4$ -アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換された $C_1\sim C_4$ -アルコキシであり、
 Har_1 は、親分子基に環炭素原子を介して結合されており、かつ窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される1～3個のヘテロ原子を有する、単環式もしくは縮合二環式の5員ないし10員の不飽和もしくは部分飽和のヘテロアリール基であり、
 R_4 は、 $C_1\sim C_4$ -アルキル、ハロゲン、シアノ、トリフルオロメチル、フェニル、モノーもしくはジ- $C_1\sim C_4$ -アルキルアミノ、ホルミル、 $C_1\sim C_4$ -アルキルカルボニル、カルボキシル又は $C_1\sim C_4$ -アルコキシであり、
 R_5 は、 $C_1\sim C_4$ -アルキル又はハロゲンである]で示される化合物、それらのエナンチオマー並びにこれらの化合物及びエナンチオマーの塩。

【請求項2】

式Iで示され、その式中、

A は、 $C_1\sim C_4$ -アルキレン又は $C_3\sim C_7$ -シクロアルキレンであり、
 R_1 は、フェニル、 R_2 及び／又は R_3 で置換されたフェニル、 Har_1 又は、 R_4 及び／又は R_5 で置換された Har_1 であり、
 R_{11} は、水素、ハロゲン、 $C_1\sim C_4$ -アルキル又は $C_1\sim C_4$ -アルコキシであり、その際、

R 2 は、シアノ、ハロゲン、カルボキシル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、アミノカルボニル、モノーもしくはジ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシカルボニル、アミノ、モノーもしくはジ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノ、トリフルオロメチル、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルホニルアミノ、フェニルスルホニルアミノ、フェニル- $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又は $-SO_2-N(R\ 2\ 1)$ R 2 2 であり、その際、

R 2 1 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_3 \sim C_7$ -シクロアルキル、フェニル- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、Har 2- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ヒドロキシ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル、フェニル、ピリジル又はR 2 1 1 及び／又はR 2 1 2 で置換されたフェニルであり、その際、

Har 2 は、ピリジル、チエニル又はフリルであり、

R 2 1 1 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又はモノーもしくはジ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノであり、

R 2 1 2 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル又はハロゲンであり、

R 2 2 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ヒドロキシ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル又は $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ- $C_2 \sim C_4$ -アルキルであるか、又は

R 2 1 及びR 2 2 は、一緒になって、それらが結合される窒素原子を含んで、複素環式の環Het 1 を形成し、その際、

Het 1 は、第一の構成成分と、場合により該第一の構成成分に縮合された第二の構成成分とから構成される、完全飽和もしくは部分不飽和の単環式もしくは縮合二環式の環もしくは環系であり、前記の第一の構成成分は、3員ないし7員の単環式の完全飽和の非芳香族の複素環式の環Bであり、該複素環式の環Bは、窒素、酸素及び硫黄から無関係に選択される1～3個のヘテロ原子を有し、かつ該複素環式の環Bは、1もしくは2個のオキソ基によって置換されていてよく、かつ前記の第二の構成成分は、ベンゼン環であり、かつ前記の環Het 1 は、R 2 3 によって環炭素原子上で置換されていてよい及び／又は前記の環Het 1 は、R 2 4 によって更なる環炭素原子上で置換されていてよい及び／又は前記の環Het 1 は、エチレンジオキシ基によって環炭素原子上で置換されていてよい及び／又は前記の環Het 1 は、R 2 5 によって環窒素原子上で置換されていてよく、その際、

R 2 3 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又はフェニルカルボニルであり、

R 2 4 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル又は $C_1 \sim C_4$ -アルコキシであり、

R 2 5 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、フェニル- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル、モノーもしくはジ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル、フェニル、ピリミジル、ピリジル、ホルミル、 $C_3 \sim C_7$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ -シクロアルキルメチル又はR 2 5 1 及び／又はR 2 5 2 で置換されたフェニルであり、その際、

R 2 5 1 は、ハロゲン、シアノ又は $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、

R 2 5 2 は、ハロゲン又は $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、

R 3 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換された $C_1 \sim C_4$ -アルコキシであり、

Har 1 は、親分子基に環炭素原子を介して結合されており、かつ窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される1～3個のヘテロ原子を有する、単環式もしくは縮合二環式の5員ないし10員の不飽和もしくは部分飽和のヘテロアリール基であり、

R 4 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ハロゲン、シアノ、トリフルオロメチル、フェニル、モノーもしくはジ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノ、ホルミル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニル、カルボキシル又は $C_1 \sim C_4$ -アルコキシであり、

R 5 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル又はハロゲンである、請求項1記載の化合物、それらのエナンチオマー並びにこれらの化合物及びエナンチオマーの塩。

【請求項3】

式Iで示され、その式中、

A は、エチレン又はシクロプロピレンであり、

R 1 は、イミダゾピリジン骨格の 6 位に結合されており、かつフェニル、R 2 及び／又は R 3 で置換されたフェニル又は H a r 1 であり、

R 1 1 は、水素であり、その際、

R 2 は、シアノ、ハロゲン、カルボキシル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、アミノカルボニル、モノーもしくはジ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシカルボニル、アミノ、モノーもしくはジ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノ、トリフルオロメチル、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルホニルアミノ、フェニルスルホニルアミノ、フェニル- $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又は $-SO_2-N(R 2 1)$ R 2 2 であり、その際、

R 2 1 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_3 \sim C_7$ -シクロアルキル、フェニル- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、H a r 2- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ヒドロキシ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル、フェニル、ピリジル又は R 2 1 1 及び／又は R 2 1 2 で置換されたフェニルであり、その際、

H a r 2 は、ピリジル、チエニル又はフリルであり、

R 2 1 1 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又はモノーもしくはジ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノであり、

R 2 1 2 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル又はハロゲンであり、

R 2 2 は、水素、ヒドロキシ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル又は $C_1 \sim C_4$ -アルキルであるか、又は

R 2 1 及び R 2 2 は、一緒になって、それらが結合される窒素原子を含んで、複素環式の環 H e t 1 を形成し、その際、

H e t 1 は、ペリリジニル、ピロリジニル、アゼチジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、S-オキソ-チオモルホリニル又は S, S-ジオキソ-チオモルホリニル、又はインドリニル、イソインドリニル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリニル又は 1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリニル、又はピペラジニル又はホモピペラジニル、又は 4 N- (R 2 5)-ピペラジニル又は 4 N- (R 2 5)-ホモピペラジニル、2-オキソピロリジニル、2-オキソイミダゾリジニル、2-オキソペリリジニル、2, 5-ジオキソピロリジニル、2, 5-ジオキソイミダゾリジニル、2, 6-ジオキソペリリジニル、2-オキソピペラジニル、2, 6-ジオキソピペラジニル又は 5-オキソ-1, 4-ジアゼパニル、3- (R 2 5)-イミダゾリジン-2-オン-イル、3- (R 2 5)-イミダゾリジン-2, 5-ジオン-イル、4- (R 2 5)-ピペラジン-2-オン-イル、4- (R 2 5)-ピペラジン-2, 6-ジオン-イル又は 4- (R 2 5)-1, 4-ジアゼパン-5-オン-イルであり、その際、

R 2 5 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、フェニル- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル、モノーもしくはジ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル、フェニル、ピリミジル、ピリジル、ホルミル、 $C_3 \sim C_7$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ -シクロアルキルメチル又は R 2 5 1 及び／又は R 2 5 2 で置換されたフェニルであり、その際、

R 2 5 1 は、ハロゲン、シアノ又は $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、

R 2 5 2 は、ハロゲン又は $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、

R 3 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換された $C_1 \sim C_4$ -アルコキシであり、

H a r 1 は、親分子基に環炭素原子を介して結合されており、かつピリジル、チエニル、フラニル、インドリル、ベンゾチエニル、ベンゾフラニル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、キノリル又はイソキノリルである、請求項 1 又は 2 記載の化合物、それらのエナンチオマー並びにこれらの化合物及びエナンチオマーの塩。

【請求項 4】

式 I で示され、その式中、

A は、エチレンであり、

R 1 は、イミダゾピリジン骨格の 6 位に結合されており、かつフェニル又は R 2 及び／又は R 3 で置換されたフェニルであり、

R 1 1 は、水素であり、その際、

R 2 は、シアノ、ハロゲン、カルボキシル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、アミノカルボニル、モノーもしくはジ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシカルボニル、アミノ、モノーもしくはジ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノ、トリフルオロメチル、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルスルホニルアミノ、フェニルスルホニルアミノ又はフェニル- $C_1 \sim C_4$ -アルコキシであり、

R 3 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換された $C_1 \sim C_4$ -アルコキシである、請求項 1 から 3 までのいずれか 1 項記載の化合物、それらのエナンチオマー並びにこれらの化合物及びエナンチオマーの塩。

【請求項 5】

式 I で示され、その式中、

A は、エチレンであり、

R 1 は、イミダゾピリジン骨格の 6 位に結合されており、かつ R 2 及び／又は R 3 で置換されたフェニル又は H a r 1 であり、

R 1 1 は、水素であり、その際、

R 2 は、 $-SO_2-N(R 2 1)R 2 2$ であり、その際、

R 2 1 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_3 \sim C_7$ -シクロアルキル、フェニル- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、H a r 2- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ヒドロキシ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル、フェニル、ピリジル又は R 2 1 1 及び／又は R 2 1 2 で置換されたフェニルであり、その際、

H a r 2 は、ピリジル、チエニル又はフリルであり、

R 2 1 1 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又はモノーもしくはジ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノであり、

R 2 1 2 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル又はハロゲンであり、

R 2 2 は、水素、ヒドロキシ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル又は $C_1 \sim C_4$ -アルキルであるか、又は

R 2 1 及び R 2 2 は、一緒になって、それらが結合される窒素原子を含んで、複素環式の環 H e t 1 を形成し、その際、

H e t 1 は、ペリリジニル、ピロリジニル、アゼチジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、S-オキソ-チオモルホリニル又は S, S-ジオキソ-チオモルホリニル、又はインドリニル、イソインドリニル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリニル又は 1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリニル、又はペラジニル又はホモペラジニル、又は 4N-(R 2 5)-ペラジニル又は 4N-(R 2 5)-ホモペラジニル、2-オキソピロリジニル、2-オキソイミダゾリジニル、2-オキソペリリジニル、2, 5-ジオキソピロリジニル、2, 5-ジオキソイミダゾリジニル、2, 6-ジオキソペリリジニル、2-オキソペラジニル、2, 6-ジオキソペラジニル又は 5-オキソ-1, 4-ジアゼパニル、3-(R 2 5)-イミダゾリジン-2-オン-イル、3-(R 2 5)-イミダゾリジン-2, 5-ジオン-イル、4-(R 2 5)-ペラジン-2-オン-イル、4-(R 2 5)-ペラジン-2, 6-ジオン-イル又は 4-(R 2 5)-1, 4-ジアゼパン-5-オン-イルであり、その際、

R 2 5 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、フェニル- $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル、モノーもしくはジ- $C_1 \sim C_4$ -アルキルアミノ- $C_2 \sim C_4$ -アルキル、フェニル、ピリミジル、ピリジル、ホルミル、 $C_3 \sim C_7$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ -シクロアルキルメチル又は R 2 5 1 及び／又は R 2 5 2 で置換されたフェニルであり、その際、

R 2 5 1 は、ハロゲン、シアノ又は $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、

R 2 5 2 は、ハロゲン又は $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、
R 3 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、ハロゲン、トリフルオロメチル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又は完全にもしくは大部分がフッ素で置換された $C_1 \sim C_4$ -アルコキシである、請求項 1 から 3 までのいずれか 1 項記載の化合物、それらのエナンチオマー並びにこれらの化合物及びエナンチオマーの塩。

【請求項 6】

式 I で示され、その式中、
A は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキレンであり、
R 1 は、フェニル、R 2 で置換されたフェニル又は H a r 1 であり、
R 1 1 は、水素であり、その際、
R 2 は、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又は $-SO_2-N(R 2 1) R 2 2$ であり、その際、
R 2 1 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、H a r 2 - $C_1 \sim C_4$ -アルキル、フェニル又は R 2 1 1 及び／又は R 2 1 2 で置換されたフェニルであり、その際、
H a r 2 は、フリル又はテトラヒドロフラニルであり、
R 2 1 1 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル又はハロゲンであり、
R 2 1 2 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル又はハロゲンであり、
R 2 2 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ -アルキルであるか、又は
R 2 1 及び R 2 2 は、一緒になって、それらが結合される窒素原子を含んで、複素環式の環 H e t 1 を形成し、その際、
H e t 1 は、窒素、酸素及び硫黄から無関係に選択される 1 ～ 3 個のヘテロ原子を有する、3 員ないし 7 員の単環式の完全飽和の非芳香族の複素環式の環 B であり、かつ前記の環 H e t 1 は、R 2 3 によって環炭素原子上で置換されていてよい及び／又は前記の環 H e t 1 は、R 2 5 によって環窒素原子上で置換されていてよく、その際、
R 2 3 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、
R 2 5 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、
H a r 1 は、親分子基に環炭素原子を介して結合されており、かつ窒素、酸素及び硫黄からなる群からそれぞれ選択される 1 ～ 3 個のヘテロ原子を有する、単環式のもしくは縮合二環式の 5 員ないし 10 員の不飽和のヘテロアリール基である、請求項 1 記載の化合物、それらのエナンチオマー並びにこれらの化合物及びエナンチオマーの塩。

【請求項 7】

式 I で示され、その式中、
A は、エチレンであり、
R 1 は、フェニル、R 2 で置換されたフェニル又は H a r 1 であり、
R 1 1 は、水素であり、その際、
R 2 は、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ又は $-SO_2-N(R 2 1) R 2 2$ であり、その際、
R 2 1 は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、H a r 2 - $C_1 \sim C_4$ -アルキル又は R 2 1 1 及び／又は R 2 1 2 で置換されたフェニルであり、その際、
H a r 2 は、テトラヒドロフラニルであり、
R 2 1 1 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル又はハロゲンであり、
R 2 1 2 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、
R 2 2 は、水素又は $C_1 \sim C_4$ -アルキルであるか、又は
R 2 1 及び R 2 2 は、一緒になって、それらが結合される窒素原子を含んで、複素環式の環 H e t 1 を形成し、その際、
H e t 1 は、1 ～ 3 個の窒素原子を有する、4 員ないし 6 員の単環式の完全飽和の非芳香族の複素環式の環 B であり、かつ前記の環 H e t 1 は、R 2 5 によって環窒素原子上で置換されていてよく、その際、
R 2 5 は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルであり、
H a r 1 は、親分子基に環炭素原子を介して結合されており、かつ 1 個の酸素原子を有す

る、縮合二環式の 9 員の不飽和のヘテロアリール基である、請求項 1 又は 6 記載の化合物、それらのエナンチオマー並びにこれらの化合物及びエナンチオマーの塩。

【請求項 8】

式 I で示され、その式中、

A は、エチレンであり、

R 1 は、フェニル、R 2 で置換されたフェニル又は H a r 1 であり、

R 1 1 は、水素であり、その際、

R 2 は、シアノ、C₁～C₄-アルコキシ又は -S O₂-N (R 2 1) R 2 2 であり、その際、

R 2 1 は、水素、C₁～C₄-アルキル、H a r 2 - C₁～C₄-アルキル又は R 2 1 1 及び / 又は R 2 1 2 で置換されたフェニルであり、その際、

H a r 2 は、テトラヒドロフラニルであり、

R 2 1 1 は、C₁～C₄-アルキル又はハロゲンであり、

R 2 1 2 は、C₁～C₄-アルキルであり、

R 2 2 は、水素又は C₁～C₄-アルキルであるか、又は

R 2 1 及び R 2 2 は、一緒になって、それらが結合される窒素原子を含んで、複素環式の環 H e t 1 を形成し、その際、

H e t 1 は、アゼチジニル環又はピペラジニル環であり、前記の環 H e t 1 は、R 2 5 によって環窒素原子上で置換されていてよく、その際、

R 2 5 は、C₁～C₄-アルキルであり、

H a r 1 は、親分子基に環炭素原子を介して結合されており、かつベンゾフラニル環である、請求項 1、6 又は 7 のいずれか 1 項記載の化合物、それらのエナンチオマー並びにこれらの化合物及びエナンチオマーの塩。

【請求項 9】

請求項 8 記載の化合物であって、7 - [2 - (6 - フェニル - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル) - エチル] - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 3 H - アゼピン - 2 - イルアミン、7 - [2 - (6 - { 4 - シアノ - フェン - 1 - イル } - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル) - エチル] - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 3 H - アゼピン - 2 - イルアミン、7 - { 2 - [6 - (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] - エチル } - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 3 H - アゼピン - 2 - イルアミン、7 - [2 - (6 - ベンゾフラン - 2 - イル - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル) - エチル] - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 3 H - アゼピン - 2 - イルアミン、4 - { 2 - [2 - (7 - アミノ - 3 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - 2 H - アゼピン - 2 - イル) - エチル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 6 - イル } - N , N - ジメチル - ベンゼンスルホンアミド、7 - (2 - { 6 - [4 - (アゼチジン - 1 - スルホニル) - フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル } - エチル) - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 3 H - アゼピン - 2 - イルアミン、7 - (2 - { 6 - [4 - (4 - エチル - ピペラジン - 1 - スルホニル) - フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル } - エチル) - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 3 H - アゼピン - 2 - イルアミン、4 - { 2 - [2 - (7 - アミノ - 3 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - 2 H - アゼピン - 2 - イル) - エチル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 6 - イル } - N - (2 - フルオロ - 4 - メチル - フェニル) - ベンゼンスルホンアミド、4 - { 2 - [2 - (7 - アミノ - 3 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - 2 H - アゼピン - 2 - イル) - エチル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 6 - イル } - N - o - トリル - ベンゼンスルホンアミド、及び 4 - { 2 - [2 - (7 - アミノ - 3 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロ - 2 H - アゼピン - 2 - イル) - エチル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 6 - イル } - N - メチル - N - (テトラヒドロフラン - 2 - イルメチル) - ベンゼンスルホンアミドからなる群から選択される化合物。

【請求項 10】

請求項 1 から 9 までのいずれか 1 項記載の 1 種以上の化合物と一緒に通常の医薬品助剤及び／又は賦形剤を含有する、急性炎症性疾患もしくは慢性炎症性疾患の治療用の医薬組成物。

【請求項 1 1】

請求項 1 から 9 までのいずれか 1 項記載の化合物を、急性炎症性疾患の治療のための医薬組成物の製造のために用いる使用。

【請求項 1 2】

請求項 1 から 9 までのいずれか 1 項記載の化合物を、末梢器官及び C N S の慢性炎症性疾患の治療のための医薬組成物の製造のために用いる使用。