

【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25年10月24日 (2013.10.24)

【公表番号】特表2013-508266(P2013-508266A)

【公表日】平成25年3月7日 (2013.3.7)

【年通号数】公開・登録公報2013-012

【出願番号】特願2012-533715(P2012-533715)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 5/14 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

C 0 7 F 9/6561 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 487/04 1 4 0

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 5/14

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 11/06  
 A 6 1 P 11/00  
 A 6 1 P 37/08  
 A 6 1 P 31/12  
 A 6 1 P 1/04  
 A 6 1 P 27/02  
 A 6 1 P 17/06  
 A 6 1 K 31/541  
 C 0 7 D 519/00 3 1 1  
 C 0 7 F 9/6561 C S P Z

## 【手続補正書】

【提出日】平成25年9月3日(2013.9.3)

## 【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

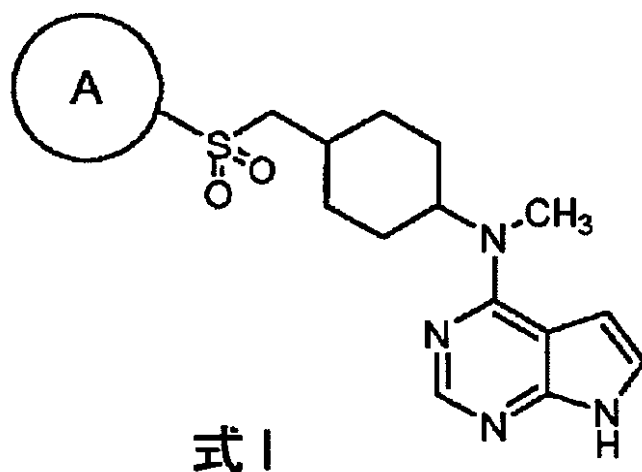
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物

【化 1】



または薬学的に許容できるその塩

[ 式中、A 環はヘテロシクリルであり、

ここで、A 環は、ハロ、カルボキシ、シアノ、オキソ、アリール、ヘテロシクリル、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキル、-OP(O)(R<sup>10</sup>)<sub>n</sub>、-OR<sup>11</sup>、-OC(O)R<sup>12</sup>、-C(O)OR<sup>12</sup>、-C(O)R<sup>13</sup>、-C(O)NR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>、-NR<sup>16</sup>R<sup>17</sup>、-N(R<sup>18</sup>)C(O)R<sup>19</sup>、-N(R<sup>18</sup>)S(O)<sub>2</sub>R<sup>19</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>20</sup> および -SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup> からなる群から選択される 1 個または複数の置換基で置換されていてもよく、前記 (C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>) アルキルは、ハロ、シアノ、アリール、ヘテロシクリル、-OR<sup>23</sup>、-OC(O)R<sup>24</sup>、-NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>、-C(O)NR<sup>27</sup>R<sup>28</sup>、-SR<sup>29</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>30</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>31</sup>R<sup>32</sup>、-N(R<sup>33</sup>)C(O)R<sup>34</sup> および -N(R<sup>35</sup>)S(O)<sub>2</sub>R<sup>36</sup> からなる群から選択される 1 個または複数の置換基で置換されていてもよく、

R<sup>10</sup> は、ヒドロキシおよび (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>) アルコキシからなる群から選択され、

$n$  は 1 または 2 であり、

$R^{11}$  は、水素、 $(C_1 \sim C_6)$  アルキル、ヒドロキシ $(C_1 \sim C_6)$  アルキル、アリー  
ル、 $(C_1 \sim C_6)$  アルキルアミノカルボニル $(C_1 \sim C_6)$  アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$   
アルコキシ $(C_1 \sim C_6)$  アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシカルボニル $(C_1 \sim C_6)$   
アルキル、ハロ $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシ $(C_1 \sim C_6)$  アルキル、ヘテロシクリルカ  
ルボニル $(C_1 \sim C_6)$  アルキルおよびアミノカルボニル $(C_1 \sim C_6)$  アルキルからな  
る群から選択され、

$R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$ 、 $R^{16}$ 、 $R^{17}$ 、 $R^{18}$ 、 $R^{21}$ 、 $R^{22}$ 、 $R^{24}$ 、  
 $R^{25}$ 、 $R^{26}$ 、 $R^{27}$ 、 $R^{28}$ 、 $R^{31}$ 、 $R^{32}$ 、 $R^{33}$ 、 $R^{34}$ 、 $R^{35}$  および  $R^{36}$   
は、水素および $(C_1 \sim C_6)$  アルキルからなる群から独立に選択され、

$R^{19}$  は、水素、 $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシ、ハロ $(C_1 \sim C_6)$  アルキルおよびアリー  
ル $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシからなる群から選択され、

$R^{20}$  は、水素、 $(C_1 \sim C_6)$  アルキル、アリール、アリール $(C_1 \sim C_6)$  アルキル  
および $(C_3 \sim C_8)$  シクロアルキル $(C_1 \sim C_6)$  アルキルからなる群から選択され、

$R^{23}$  は、水素、 $(C_1 \sim C_6)$  アルキル、アリール、ヘテロシクリル $(C_1 \sim C_6)$  ア  
ルキルおよび $(C_3 \sim C_8)$  シクロアルキル $(C_1 \sim C_6)$  アルキルからなる群から選択  
され、

$R^{29}$  は、水素およびヘテロシクリルからなる群から選択され、

$R^{30}$  は、水素、 $(C_1 \sim C_6)$  アルキルおよび $(C_3 \sim C_8)$  シクロアルキル $(C_1 \sim C_6)$   
アルキルからなる群から選択され、

ここで、アリールは、どこに存在していても、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、 $(C_1 \sim C_6)$   
アルキル、ハロ $(C_1 \sim C_6)$  アルキルおよび $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシからなる群か  
ら選択される 1 個または複数の置換基で置換されていてもよく、

ここで、ヘテロシクリルは、どこに存在していても、オキソ、シアノ、 $(C_1 \sim C_6)$  ア  
ルキル、 $(C_3 \sim C_8)$  シクロアルキルアミノカルボニルおよび $(C_1 \sim C_6)$  アルキル  
スルホニル $(C_1 \sim C_6)$  アルキルからなる群から選択される 1 個または複数の置換基で  
独立に置換されていてもよい】。

#### 【請求項 2】

A 環が、置換されていてもよいピペリジニル、ピロリジニル、アゼチジニルおよびピペ  
ラジニルからなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容できる  
その塩

。

#### 【請求項 3】

A 環が、ピペリジニル、ピロリジニル、アゼチジニルおよびピペラジニルからなる群か  
ら選択され、

ここで、A 環は、カルボキシ、シアノ、オキソ、フルオロ、 $(C_1 \sim C_8)$  アルキル、フ  
ェニル、オキサジアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、テトラゾリル、ピロリジニル、  
-OP(O)( $R^{10}$ ) $_n$ 、-OR $^{11}$ 、-OC(O)R $^{12}$ 、-C(O)OR $^{12}$ 、-  
C(O)R $^{13}$ 、-C(O)NR $^{14}$ R $^{15}$ 、-NR $^{16}$ R $^{17}$ 、-N(R $^{18}$ )C(O)  
R $^{19}$ 、-N(R $^{18}$ )S(O) $_2$ R $^{19}$ 、-SO $_2$ R $^{20}$  および -SO $_2$ NR $^{21}$ R $^{22}$   
からなる群から選択される 1 個または複数の置換基で置換されていてもよく、前記  
( $C_1 \sim C_8$ ) アルキルは、フルオロ、シアノ、フェニル、ピリジニル、ピペラジニル、ピ  
ラジニル、ピラゾリル、ピラダジニル、イソオキサゾリル、ピリミジニル、ピロリジニル  
、-OR $^{23}$ 、-OC(O)R $^{24}$ 、-NR $^{25}$ R $^{26}$ 、-C(O)NR $^{27}$ R $^{28}$ 、-  
SR $^{29}$ 、-SO $_2$ R $^{30}$ 、-SO $_2$ NR $^{31}$ R $^{32}$  および -N(R $^{33}$ )C(O)R $^{34}$   
からなる群から選択される 1 個または複数の置換基で置換されていてもよく、

$R^{10}$  が、ヒドロキシおよび $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシからなる群から選択され、

$n$  が 1 または 2 であり、

$R^{11}$  が、水素、メチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル、アミノカルボニル  
メチル、エトキシエチル、ジメチルアミノカルボニルアミノ、ジエチルアミノカルボニル

メチル、フェニルおよびピロリジニルカルボニルメチルからなる群から選択され、  
 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$ 、 $R^{16}$ 、 $R^{17}$ 、 $R^{18}$ 、 $R^{21}$ 、 $R^{22}$ 、 $R^{24}$ 、  
 $R^{25}$ 、 $R^{26}$ 、 $R^{27}$ 、 $R^{28}$ 、 $R^{31}$ 、 $R^{32}$ 、 $R^{33}$  および  $R^{34}$  が、水素、メチル  
 およびエチルからなる群から独立に選択され、  
 $R^{19}$  が、水素、tert-ブトキシ、トリフルオロメチル、メトキシおよびフェニルメ  
 トキシからなる群から選択され、  
 $R^{20}$  が、水素、メチル、フェニル、ベンジル、フェニルエチルおよびシクロプロピルメ  
 チルからなる群から選択され、  
 $R^{23}$  が、水素、メチル、フェニル、ピリジニルメチルおよびシクロプロピルメチルから  
 なる群から選択され、  
 $R^{29}$  が、水素およびピリジニルからなる群から選択され、  
 $R^{30}$  が、水素、メチル、プロピルおよびシクロプロピルメチルからなる群から選択され

ここで、フェニルは、どこに存在していても、フルオロ、シアノおよびメトキシからなる  
 群から選択される 1 個または複数の置換基で置換されていてもよく、

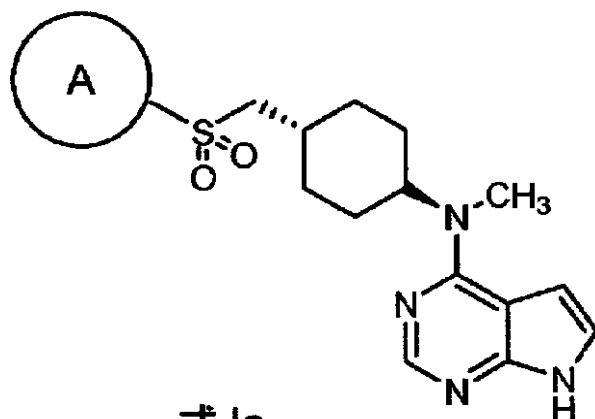
ここで、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、ピリジニル、ピペラジニルおよびピリダ  
 ジニルは、A 環置換基、 $R^{23}$  置換基および  $R^{29}$  置換基中のどこに存在していても、オ  
 キソ、シアノ、メチル、エチル、メチルスルホニルメチルおよびシクロプロピルアミノカ  
 ルボニルからなる群から選択される 1 個または複数の置換基で独立に置換されていてもよ  
 い、

請求項 2 に記載の化合物または薬学的に許容できるその塩

【請求項 4】

式 I a の化合物

【化 2】



式 Ia

または薬学的に許容できるその塩

[ 式中、A 環は、ピペリジニル、ピロリジニル、アゼチジニルおよびピペラジニルから選  
 択され、

ここで、A 環は、ハロ、カルボキシ、シアノ、オキソ、アリール、ヘテロシクリル、( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキル、- OP ( O ) ( R<sup>10</sup> )<sub>n</sub>、- OR<sup>11</sup>、- OC ( O ) R<sup>12</sup>、- C ( O ) OR<sup>12</sup>、- C ( O ) R<sup>13</sup>、- C ( O ) NR<sup>14</sup> R<sup>15</sup>、- NR<sup>16</sup> R<sup>17</sup>、- N ( R<sup>18</sup> ) C ( O ) R<sup>19</sup>、- N ( R<sup>18</sup> ) S ( O )<sub>2</sub> R<sup>19</sup>、- SO<sub>2</sub> R<sup>20</sup> およ  
 び - SO<sub>2</sub> NR<sup>21</sup> R<sup>22</sup> からなる群から選択される 1 個または複数の置換基で置換され  
 ていてもよく、前記 ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> ) アルキルは、ハロ、シアノ、アリール、ヘテロシクリ  
 ル、- OR<sup>23</sup>、- OC ( O ) R<sup>24</sup>、- NR<sup>25</sup> R<sup>26</sup>、- C ( O ) NR<sup>27</sup> R<sup>28</sup>、- SR<sup>29</sup>、- SO<sub>2</sub> R<sup>30</sup>、- SO<sub>2</sub> NR<sup>31</sup> R<sup>32</sup>、- N ( R<sup>33</sup> ) C ( O ) R<sup>34</sup>  
 および - N ( R<sup>35</sup> ) S ( O )<sub>2</sub> R<sup>36</sup> からなる群から選択される 1 個または複数の置換

基で置換されていてもよく、

$R^{10}$  は、ヒドロキシおよび  $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシからなる群から選択され、

$n$  は 1 または 2 であり、

$R^{11}$  は、水素、 $(C_1 \sim C_6)$  アルキル、ヒドロキシ  $(C_1 \sim C_6)$  アルキル、アリー  
ル、 $(C_1 \sim C_6)$  アルキルアミノカルボニル  $(C_1 \sim C_6)$  アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$   
アルコキシ  $(C_1 \sim C_6)$  アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシカルボニル  $(C_1 \sim C_6)$   
アルキル、ハロ  $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシ  $(C_1 \sim C_6)$  アルキル、ヘテロシクリルカ  
ルボニル  $(C_1 \sim C_6)$  アルキルおよびアミノカルボニル  $(C_1 \sim C_6)$  アルキルからな  
る群から選択され、

$R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$ 、 $R^{16}$ 、 $R^{17}$ 、 $R^{18}$ 、 $R^{21}$ 、 $R^{22}$ 、 $R^{24}$ 、  
 $R^{25}$ 、 $R^{26}$ 、 $R^{27}$ 、 $R^{28}$ 、 $R^{31}$ 、 $R^{32}$ 、 $R^{33}$ 、 $R^{34}$ 、 $R^{35}$  および  $R^{36}$   
は、水素および  $(C_1 \sim C_6)$  アルキルからなる群から独立に選択され、

$R^{19}$  は、水素、 $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシ、ハロ  $(C_1 \sim C_6)$  アルキルおよびアリー  
ル  $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシからなる群から選択され、

$R^{20}$  は、水素、 $(C_1 \sim C_6)$  アルキル、アリール、アリール  $(C_1 \sim C_6)$  アルキル  
および  $(C_3 \sim C_8)$  シクロアルキル  $(C_1 \sim C_6)$  アルキルからなる群から選択され、

$R^{23}$  は、水素、 $(C_1 \sim C_6)$  アルキル、アリール、ヘテロシクリル  $(C_1 \sim C_6)$  ア  
ルキルおよび  $(C_3 \sim C_8)$  シクロアルキル  $(C_1 \sim C_6)$  アルキルからなる群から選択  
され、

$R^{29}$  は、水素およびヘテロシクリルからなる群から選択され、

$R^{30}$  は、水素、 $(C_1 \sim C_6)$  アルキルおよび  $(C_3 \sim C_8)$  シクロアルキル  $(C_1 \sim C_6)$   
 $(C_1 \sim C_6)$  アルキルからなる群から選択され、

ここで、アリールは、どこに存在していても、ハロ、ヒドロキシ、シアノ、 $(C_1 \sim C_6)$   
 $(C_1 \sim C_6)$  アルキル、ハロ  $(C_1 \sim C_6)$  アルキルおよび  $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシからなる群か  
ら選択される 1 個または複数の置換基で置換されていてもよく、

ここで、ヘテロシクリルは、A 環置換基、 $R^{23}$  置換基および  $R^{29}$  置換基中のどこに存  
在していても、オキソ、シアノ、 $(C_1 \sim C_6)$  アルキル、 $(C_3 \sim C_8)$  シクロアルキ  
ルアミノカルボニルおよび  $(C_1 \sim C_6)$  アルキルスルホニル  $(C_1 \sim C_6)$  アルキルか  
らなる群から選択される 1 個または複数の置換基で独立に置換されていてもよい】。

#### 【請求項 5】

A 環が、カルボキシ、シアノ、オキソ、フルオロ、 $(C_1 \sim C_8)$  アルキル、フェニル  
、オキサジアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、テトラゾリル、ピロリジニル、 $-OP$   
 $(O)(R^{10})_n$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-OC(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)$   
 $R^{13}$ 、 $-C(O)NR^{14}R^{15}$ 、 $-NR^{16}R^{17}$ 、 $-N(R^{18})C(O)R^{19}$ 、 $-N(R^{18})S(O)_2R^{19}$ 、 $-SO_2R^{20}$  および  $-SO_2NR^{21}R^{22}$  か  
らなる群から選択される 1 個または複数の置換基で置換されていてもよく、前記  $(C_1 \sim C_8)$   
アルキルは、フルオロ、シアノ、フェニル、ピリジニル、ピペラジニル、ピラジニ  
ル、ピラゾリル、ピリダジニル、イソオキサゾリル、ピリミジニル、ピロリジニル、 $-O$   
 $R^{23}$ 、 $-OC(O)R^{24}$ 、 $-NR^{25}R^{26}$ 、 $-C(O)NR^{27}R^{28}$ 、 $-SR^{29}$ 、 $-SO_2R^{30}$ 、 $-SO_2NR^{31}R^{32}$  および  $-N(R^{33})C(O)R^{34}$  から  
なる群から選択される 1 個または複数の置換基で置換されていてもよく、

$R^{10}$  が、ヒドロキシおよび  $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシからなる群から選択され、

$n$  が 1 または 2 であり、

$R^{11}$  が、水素、メチル、エチル、イソプロピル、tert-ブチル、アミノカルボニル  
メチル、エトキシエチル、ジメチルアミノカルボニルアミノ、ジエチルアミノカルボニル  
メチル、フェニルおよびピロリジニルカルボニルメチルからなる群から選択され、

$R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$ 、 $R^{16}$ 、 $R^{17}$ 、 $R^{18}$ 、 $R^{21}$ 、 $R^{22}$ 、 $R^{24}$ 、  
 $R^{25}$ 、 $R^{26}$ 、 $R^{27}$ 、 $R^{28}$ 、 $R^{31}$ 、 $R^{32}$ 、 $R^{33}$  および  $R^{34}$  が、水素、メチ  
ルおよびエチルからなる群から独立に選択され、

$R^{19}$  が、水素、tert-ブトキシ、トリフルオロメチル、メトキシおよびフェニルメ

トキシからなる群から選択され、

$R^{20}$  が、水素、メチル、フェニル、ベンジル、フェニルエチルおよびシクロプロピルメチルからなる群から選択され、

$R^{23}$  が、水素、メチル、フェニル、ピリジニルメチルおよびシクロプロピルメチルからなる群から選択され、

$R^{29}$  が、水素およびピリジニルからなる群から選択され、

$R^{30}$  が、水素、メチル、プロピルおよびシクロプロピルメチルからなる群から選択され、

ここで、フェニルは、どこに存在していても、フルオロ、シアノおよびメトキシからなる群から選択される 1 個または複数の置換基で置換されていてもよく、

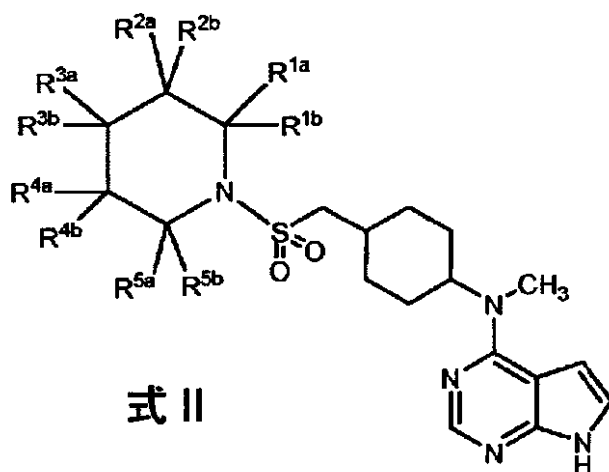
ここで、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、ピリジニル、ピペラジニルおよびピリダジニルは、A 環置換基、 $R^{23}$  置換基および  $R^{29}$  置換基中のどこに存在していても、オキソ、シアノ、メチル、エチル、メチルスルホニルメチルおよびシクロプロピルアミノカルボニルからなる群から選択される 1 個または複数の置換基で独立に置換されていてもよい、

請求項 4 に記載の化合物または薬学的に許容できるその塩

【請求項 6】

式 I I の化合物

【化 3】



または薬学的に許容できるその塩

[ 式中、 $R^{1a}$ 、 $R^{1b}$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^{5a}$  および  $R^{5b}$  は、水素、カルボキシ、シアノ、ハロ、( $C_1 \sim C_8$ ) アルキル、アリール、ヘテロシクリル、 $-OP(O)(R^{10})_n$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-OC(O)R^{12}$ 、 $-C(O)R^{13}$ 、 $-C(O)NR^{14}R^{15}$ 、 $-NR^{16}R^{17}$  および  $-N(R^{18})C(O)R^{19}$  からなる群から独立に選択され、ここで、前記 ( $C_1 \sim C_8$ ) アルキルは、ハロ、ヘテロシクリル、 $-OR^{23}$ 、 $-NR^{25}R^{26}$ 、 $-C(O)NR^{27}R^{28}$ 、 $-SO_2R^{30}$  および  $-SO_2NR^{31}R^{32}$  からなる群から選択される 1 個または複数の置換基で置換されていてもよく、

$R^{10}$  は、ヒドロキシおよび ( $C_1 \sim C_6$ ) アルコキシからなる群から選択され、

$n$  は 1 または 2 であり、

$R^{11}$  は、水素、( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、( $C_1 \sim C_6$ ) アルコキシ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルおよびアミノカルボニル( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルからなる群から選択され、

$R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$ 、 $R^{16}$ 、 $R^{17}$ 、 $R^{18}$ 、 $R^{25}$ 、 $R^{26}$ 、 $R^{27}$ 、 $R^{28}$ 、 $R^{31}$  および  $R^{32}$  は、水素および ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルからなる群から独立に選択され、

$R^{19}$  は、水素およびアリール ( $C_1 \sim C_6$ ) アルコキシからなる群から選択され、  
 $R^{23}$  は、水素、( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、アリールおよび ( $C_3 \sim C_8$ ) シクロアルキル ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルからなる群から選択され、  
 $R^{30}$  は、水素、( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルおよび ( $C_3 \sim C_8$ ) シクロアルキル ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルからなる群から選択され、

ここで、アリールは、どこに存在していても、1個または複数のハロで置換されていてもよく、

ここで、ヘテロシクリルは、どこに存在していても、( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルおよび ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルスルホニル ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルからなる群から選択される1個または複数の置換基で独立に置換されていてもよい]。

【請求項7】

$R^{1a}$ 、 $R^{1b}$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^{5a}$  および  $R^{5b}$  が、水素、フルオロ、カルボキシ、シアノ、( $C_1 \sim C_8$ ) アルキル、フェニル、オキサジアゾリル、 $-OP(O)(R^{10})_n$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-OC(O)R^{12}$ 、 $-C(O)R^{13}$ 、 $-C(O)NR^{14}R^{15}$ 、 $-NR^{16}R^{17}$  および  $-N(R^{18})C(O)R^{19}$  からなる群から独立に選択され、ここで、前記 ( $C_1 \sim C_8$ ) アルキルは、フルオロ、ピリダジニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピロリジニル、 $-OR^{23}$ 、 $-C(O)NR^{27}R^{28}$ 、 $-SO_2R^{30}$ 、 $-SO_2NR^{31}R^{32}$  および  $-N(R^{33})C(O)R^{34}$  からなる群から選択される1個または複数の置換基で置換されていてもよく、 $R^{10}$  が、ヒドロキシおよびエトキシからなる群から選択され、

$n$  が1または2であり、

$R^{11}$  が、水素、メチル、エチル、tert-ブチル、イソプロピルおよびアミノカルボニルメチルからなる群から選択され、

$R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$ 、 $R^{16}$ 、 $R^{17}$ 、 $R^{18}$ 、 $R^{27}$ 、 $R^{28}$ 、 $R^{31}$ 、 $R^{32}$ 、 $R^{33}$  および  $R^{34}$  が、水素、メチルおよびエチルからなる群から独立に選択され、

$R^{19}$  が、水素およびフェニルメトキシからなる群から選択され、

$R^{23}$  が、水素、メチル、シクロプロピルメチルおよびフェニルからなる群から選択され、

$R^{30}$  が、水素、メチル、プロピルおよびシクロプロピルメチルからなる群から選択され、

ここで、フェニルは、どこに存在していても、1個または複数のフルオロで置換されていてもよく、

ここで、オキサジアゾリルまたはピリダジニルは、どこに存在していても、メチルおよびメチルスルホニルメチルからなる群から選択される1個または複数の置換基で独立に置換されていてもよい、

請求項6に記載の化合物または薬学的に許容できるその塩

。

【請求項8】

$R^{1a}$ 、 $R^{1b}$ 、 $R^{5a}$  および  $R^{5b}$  が水素であり、

$R^{2a}$  および  $R^{2b}$  が、水素、エチル、メトキシおよびベンジルオキシカルボニルアミノからなる群から独立に選択され、

$R^{3a}$  および  $R^{3b}$  が、水素、シアノ、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシプロピル、メチル、エチル、メトキシ、メトキシメチル、メトキシエチル、メチルアミノカルボニル、ジエチルアミノカルボニル、アミノ、アミノカルボニル、アミノカルボニルメチル、フェニル、メチルスルホニルメチルオキサジアゾリル、ピリミジニルメチル、メチルピリダジニル、シクロプロピルメトキシメチルおよびシクロプロピルメチルスルホニルメチルからなる群から独立に選択され、

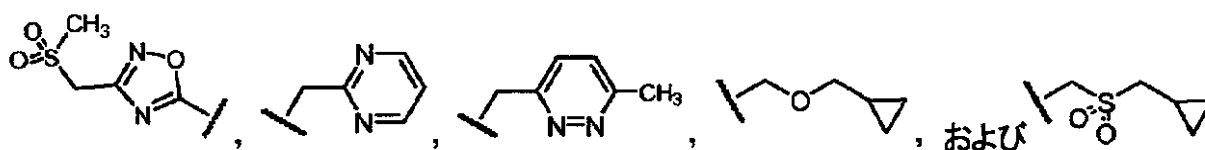
$R^{4a}$  および  $R^{4b}$  が、水素、ヒドロキシ、カルボキシ、フルオロ、トリフルオロメチル、シアノ、メチル、エトキシ、メチルカルボニル、メチルカルボニルアミノ、メチルカル

ボニルアミノメチル、メチルスルホニルメチル、ジメチルアミノスルホニルメチル、プロピルスルホニルメチル、ヒドロキシメチル、アミノカルボニル、アミノカルボニルメトキシ、アミノスルホニルメチル、メチルオキサジアゾリル、ピリジニルメチル、ピロリジニルメチルおよびフルオロフェノキシメチルからなる群から独立に選択される、  
請求項 7 に記載の化合物 または薬学的に許容できるその塩

【請求項 9】

$R^{1a}$ 、 $R^{1b}$ 、 $R^{5a}$  および  $R^{5b}$  が水素であり、  
 $R^{2a}$  および  $R^{2b}$  が、水素、エチル、メトキシおよびベンジルオキシカルボニルアミノからなる群から選択され、  
 $R^{3a}$  および  $R^{3b}$  が、水素、シアノ、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシプロピル、メチル、エチル、メトキシ、メトキシメチル、メトキシエチル、メチルアミノカルボニル、ジエチルアミノカルボニル、アミノ、アミノカルボニル、アミノカルボニルメチル、フェニル、

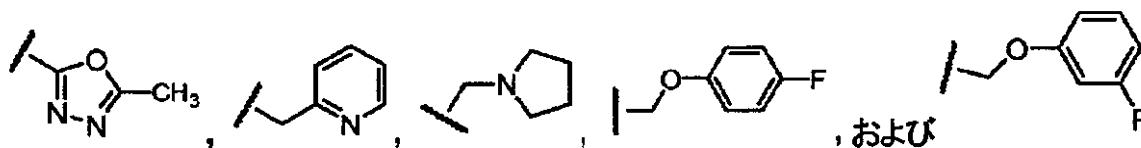
【化 4】



からなる群から選択され、

$R^{4a}$  および  $R^{4b}$  が、水素、ヒドロキシ、カルボキシ、フルオロ、トリフルオロメチル、シアノ、メチル、エトキシ、メチルカルボニル、メチルカルボニルアミノ、メチルカルボニルアミノメチル、メチルスルホニルメチル、ジメチルアミノスルホニルメチル、プロピルスルホニルメチル、ヒドロキシメチル、アミノカルボニル、アミノカルボニルメトキシ、アミノスルホニルメチル、

【化 5】



からなる群から選択される、

請求項 8 に記載の化合物 または薬学的に許容できるその塩

【請求項 10】

$R^{1a}$ 、 $R^{1b}$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{3b}$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ 、 $R^{5a}$  および  $R^{5b}$  が、( $C_1 \sim C_8$ ) アルキル、 $-OP(O)(R^{10})_n$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-OC(O)R^{12}$  および  $-C(O)NR^{14}R^{15}$  からなる群から独立に選択され、ここで、前記( $C_1 \sim C_8$ ) アルキルは、 $-OR^{23}$  で置換されていてもよく、  
 $R^{10}$  が、ヒドロキシおよび( $C_1 \sim C_6$ ) アルコキシからなる群から選択され、  
 $n$  が 1 または 2 であり、  
 $R^{11}$  が、水素、( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルおよび( $C_1 \sim C_6$ ) アルコキシ( $C_1 \sim C_6$



) アルキルからなる群から選択され、

$R^{12}$ 、 $R^{14}$  および  $R^{15}$  が、水素および ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルからなる群から独立に選択され、

$R^{23}$  が、水素および ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルからなる群から選択される、

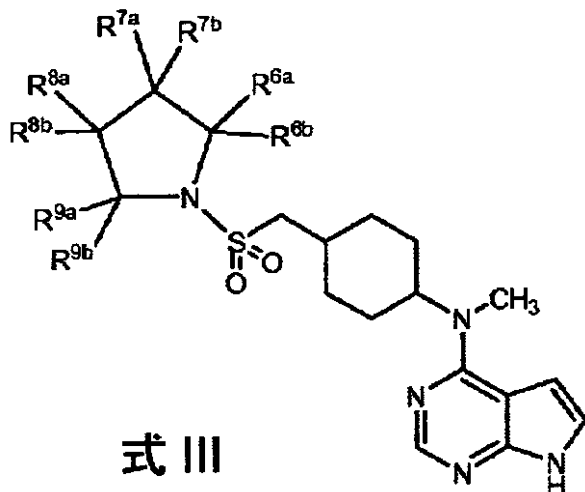
請求項 6 に記載の化合物 または薬学的に許容できるその塩

。

【請求項 11】

式 III の化合物

【化 6】



または薬学的に許容できるその塩 [ 式中、

$R^{6a}$ 、 $R^{6b}$ 、 $R^{7a}$ 、 $R^{7b}$ 、 $R^{8a}$ 、 $R^{8b}$ 、 $R^{9a}$  および  $R^{9b}$  は、水素、シアノ、ハロ、( $C_1 \sim C_8$ ) アルキル、アリール、ヘテロシクリル、 $-OP(O)(R^{10})_n$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-OC(O)R^{12}$ 、 $-C(O)NR^{14}R^{15}$ 、 $-NR^{16}R^{17}$ 、 $-N(R^{18})C(O)R^{19}$ 、 $-SO_2R^{20}$  および  $-SO_2NR^{21}R^{22}$  からなる群から独立に選択され、ここで、前記 ( $C_1 \sim C_8$ ) アルキルは、シアノ、アリール、ヘテロシクリル、 $-OR^{23}$ 、 $-NR^{25}R^{26}$  および  $-SR^{29}$  からなる群から選択される 1 個または複数の置換基で置換されていてもよく、

$R^{10}$  は、ヒドロキシおよび ( $C_1 \sim C_6$ ) アルコキシからなる群から選択され、

$n$  は 1 または 2 であり、

$R^{11}$  は、水素、( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、アリール、ハロ ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、ヒドロキシ ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルアミノカルボニル ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、( $C_1 \sim C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、ハロ ( $C_1 \sim C_6$ ) アルコキシ ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、( $C_1 \sim C_6$ ) アルコキシカルボニル ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、アミノカルボニル ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルおよびヘテロシクリルカルボニル ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルからなる群から選択され、

$R^{12}$ 、 $R^{16}$ 、 $R^{17}$ 、 $R^{18}$ 、 $R^{21}$ 、 $R^{22}$ 、 $R^{25}$  および  $R^{26}$  は、水素および ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルからなる群から独立に選択され、

$R^{19}$  は、水素、( $C_1 \sim C_6$ ) アルコキシおよびハロ ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルからなる群から選択され、

$R^{20}$  は、水素、( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルおよびアリール ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルからなる群から選択され、

$R^{23}$  は、水素、( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、アリールおよびヘテロシクリル - ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルからなる群から選択され、

$R^{29}$  は、水素およびヘテロシクリルからなる群から選択され、

ここで、アリールは、どこに存在していても、ハロ、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>)アルコキシおよびシアノからなる群から選択される１個または複数の置換基で置換されていてもよく、  
 ここで、ヘテロシクリルは、どこに存在していても、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>)アルキルおよびオキソからなる群から選択される１個または複数の置換基で独立に置換されていてもよい。

【請求項１２】

R<sup>6a</sup>、R<sup>6b</sup>、R<sup>7a</sup>、R<sup>7b</sup>、R<sup>8a</sup>、R<sup>8b</sup>、R<sup>9a</sup>およびR<sup>9b</sup>が、水素、シアノ、フルオロ、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキル、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、-OR<sup>11</sup>、-OC(O)R<sup>12</sup>、-C(O)NR<sup>14</sup>R<sup>15</sup>、-NR<sup>16</sup>R<sup>17</sup>、-N(R<sup>18</sup>)C(O)R<sup>19</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>20</sup>および-SO<sub>2</sub>NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>からなる群から独立に選択され、ここで、前記(C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub>)アルキルは、シアノ、フェニル、イソオキサゾリル、ピペラジニル、ピラジニル、ピラゾリル、ピリジニル、ピロリジニル、-OR<sup>23</sup>、-NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>および-SR<sup>29</sup>からなる群から選択される１個または複数の置換基で置換されていてもよく、

R<sup>11</sup>が、水素、メチル、tert-ブチル、イソプロピル、エトキシエチル、ジメチルアミノカルボニルメチル、ジエチルアミノカルボニルメチル、フェニルおよびピロリジニルカルボニルメチルからなる群から選択され、

R<sup>12</sup>、R<sup>16</sup>、R<sup>17</sup>、R<sup>18</sup>、R<sup>21</sup>、R<sup>22</sup>、R<sup>25</sup>およびR<sup>26</sup>が、水素、メチルおよびエチルからなる群から独立に選択され、

R<sup>19</sup>が、水素、tert-ブトキシおよびトリフルオロメチルからなる群から選択され、

R<sup>20</sup>が、水素、メチル、ベンジルおよびフェニルエチルからなる群から選択され、

R<sup>23</sup>が、水素、メチル、フェニルおよびピリジニルメチルからなる群から選択され、

R<sup>29</sup>が、水素およびピリジニルからなる群から選択され、

ここで、フェニルは、どこに存在していても、フルオロおよびメトキシからなる群から独立に選択される１個または複数の置換基で置換されていてもよく、

ここで、イソオキサゾリル、ピリジニルまたはピペラジニルは、どこに存在していても、オキソ、メチルおよびエチルからなる群から選択される１個または複数の置換基で独立に置換されていてもよい、

請求項１１に記載の化合物または薬学的に許容できるその塩

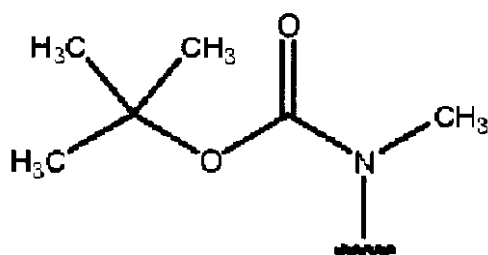
。

【請求項１３】

R<sup>6a</sup>、R<sup>6b</sup>およびR<sup>9b</sup>が水素であり、

R<sup>7a</sup>およびR<sup>7b</sup>が、水素、フルオロ、ヒドロキシ、シアノ、メチル、メトキシ、メトキシメチル、ヒドロキシメチル、フェニル、ピリジニルおよび

【化７】

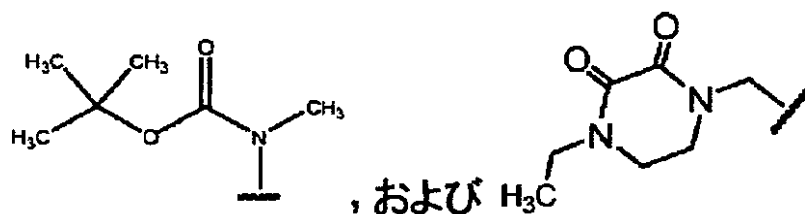


からなる群から独立に選択され、

R<sup>8a</sup>およびR<sup>8b</sup>が、水素、フルオロ、ヒドロキシ、アミノ、アミノカルボニル、エチルアミノエチル、エトキシエトキシ、ジメチルアミノカルボニルメトキシ、ジエチルアミノカルボニルメトキシ、メチルアミノスルホニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチ

ルカルボニルアミノ、ヒドロキシメチル、シアノメチル、フェニル、ベンジル、フルオロフェニル、ピリミジニル、ピリジニル、メチルイソオキサゾリルエチル、ピラゾリルメチル、ピリミジニルメチル、ベンジルスルホニル、ベンジルメチルスルホニル、メトキシベンジルスルホニル、ピリジニルチオメチル、フルオロフェノキシメチル、シアノフェノキシ、ピリジニルメトキシメチル、エチルピリジニルメトキシメチル、ピロリジニルカルボニルメトキシ、

【化 8】



からなる群から独立に選択され、

R<sup>9a</sup> が、水素、メチル、メトキシメチル、ヒドロキシメチル、メチルピリジニルおよびピロリジニルからなる群から選択される、

請求項 12 に記載の化合物または薬学的に許容できるその塩

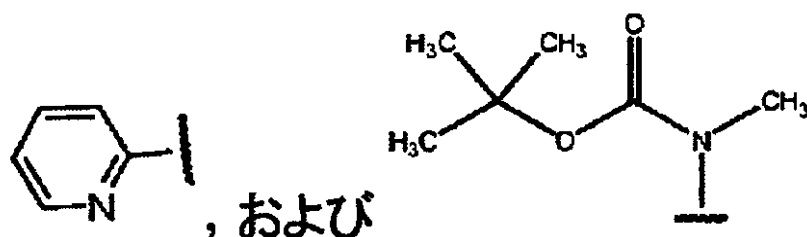
。

【請求項 14】

R<sup>6a</sup>、R<sup>6b</sup> および R<sup>9b</sup> が水素であり、

R<sup>7a</sup> および R<sup>7b</sup> が、水素、フルオロ、ヒドロキシ、シアノ、メチル、メトキシ、メトキシメチル、ヒドロキシメチル、フェニル、

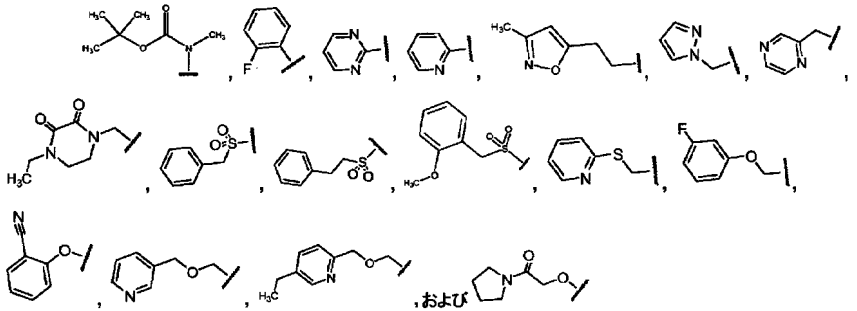
【化 9】



からなる群から独立に選択され、

R<sup>8a</sup> および R<sup>8b</sup> が、水素、フルオロ、ヒドロキシ、アミノ、アミノカルボニル、エチルアミノエチル、エトキシエトキシ、ジメチルアミノカルボニルメトキシ、ジエチルアミノカルボニルメトキシ、メチルアミノスルホニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルカルボニルアミノ、ヒドロキシメチル、シアノメチル、フェニル、ベンジル、

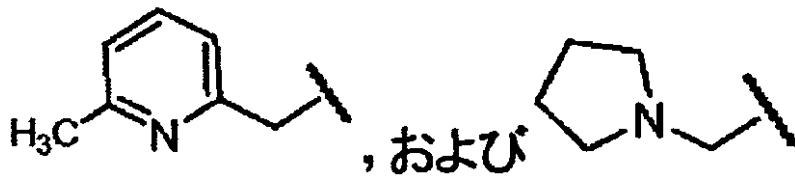
## 【化 10】



からなる群から独立に選択され、

$R^{9a}$  が、水素、メチル、メトキシメチル、ヒドロキシメチル、

## 【化 11】



からなる群から選択される、

請求項 13 に記載の化合物 または薬学的に許容できるその塩

。

## 【請求項 15】

$R^{6a}$ 、 $R^{6b}$ 、 $R^{7a}$ 、 $R^{7b}$ 、 $R^{8a}$ 、 $R^{8b}$ 、 $R^{9a}$  および  $R^{9b}$  が、ハロ、 $(C_1 \sim C_8)$  アルキル、 $-OR^{11}$  および  $-N(R^{18})C(O)R^{19}$  からなる群から独立に選択され、ここで、前記  $(C_1 \sim C_8)$  アルキルは、 $-OR^{23}$  で置換されていてよく、

$R^{11}$  が、水素および  $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシ  $(C_1 \sim C_6)$  アルキルからなる群から選択され、

$R^{18}$  が、水素および  $(C_1 \sim C_6)$  アルキルからなる群から選択され、

$R^{19}$  が、水素および  $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシからなる群から選択され、

$R^{23}$  が、水素および  $(C_1 \sim C_6)$  アルキルからなる群から選択される、

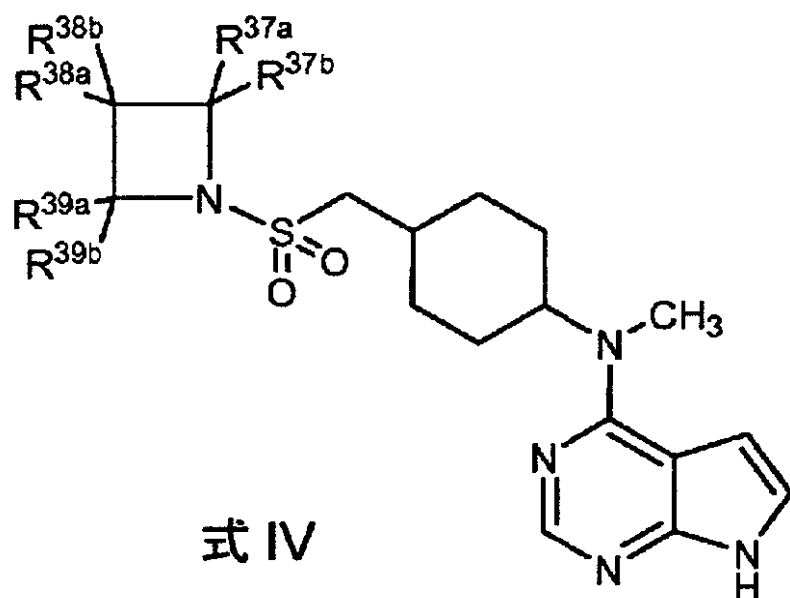
請求項 11 に記載の化合物 または薬学的に許容できるその塩

。

## 【請求項 16】

式 I V の化合物

【化 1 2】



または薬学的に許容できるその塩〔式中、 $R^{37a}$ 、 $R^{37b}$ 、 $R^{38a}$ 、 $R^{38b}$ 、 $R^{39a}$ および $R^{39b}$ は、水素、ハロ、ヒドロキシ、ヘテロシクリル、( $C_3 \sim C_8$ )シクロアルキル( $C_1 \sim C_6$ )アルキルスルホニル、アリールスルホニルおよび( $C_1 \sim C_6$ )アルコシカルボニルアミノからなる群から選択される〕。

【請求項 17】

$R^{37a}$ 、 $R^{37b}$ 、 $R^{38a}$ 、 $R^{38b}$ 、 $R^{39a}$ および $R^{39b}$ が、水素、ヒドロキシ、フルオロ、ピリミジニル、ピリジニル、テトラゾリル、シクロプロピルメチルスルホニル、フェニルスルホニルおよびメトキシカルボニルアミノからなる群から独立に選択される、

請求項 16 に記載の化合物 または薬学的に許容できるその塩

。

【請求項 18】

$R^{37a}$ 、 $R^{37b}$ 、 $R^{38b}$ 、 $R^{39a}$ および $R^{39b}$ が水素であり、 $R^{38a}$ が、水素、フルオロ、ヒドロキシ、メトキシカルボニルアミノ、シクロプロピルメチルスルホニル、フェニルスルホニル、ピリミジニル、ピリジニルおよびテトラゾリルからなる群から選択される、

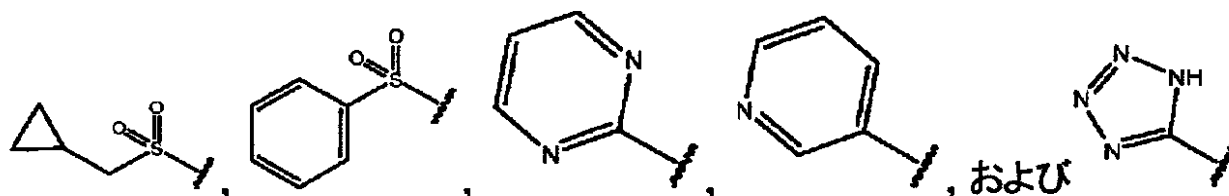
請求項 17 に記載の化合物 または薬学的に許容できるその塩

。

【請求項 19】

$R^{37a}$ 、 $R^{37b}$ 、 $R^{38b}$ 、 $R^{39a}$ および $R^{39b}$ が水素であり、 $R^{38a}$ が、水素、フルオロ、ヒドロキシ、メトキシカルボニルアミノ、

## 【化 1 3】

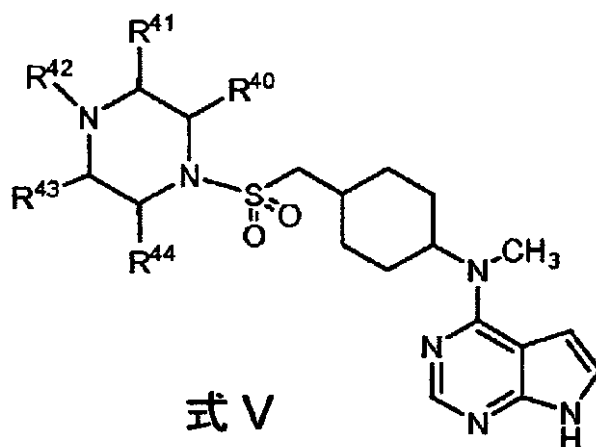


からなる群から選択される、  
請求項 1 8 に記載の化合物 または薬学的に許容できるその塩  
。

## 【請求項 2 0】

式 V の化合物

## 【化 1 4】



または薬学的に許容できるその塩

[ 式中、 $R^{40}$ 、 $R^{41}$ 、 $R^{42}$ 、 $R^{43}$  および  $R^{44}$  は、水素、 $(C_1 \sim C_8)$  アルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロシクリル  $(C_1 \sim C_6)$  アルキルからなる群から独立に選択され、

ここで、ヘテロシクリルは、どこに存在していても、シアノ、 $(C_1 \sim C_6)$  アルキルおよび  $(C_3 \sim C_8)$  シクロアルキルアミノカルボニルからなる群から選択される 1 個または複数の置換基で置換されていてもよい]。

## 【請求項 2 1】

$R^{40}$ 、 $R^{41}$ 、 $R^{42}$ 、 $R^{43}$  および  $R^{44}$  が、水素、メチル、ピリジニルおよびピリジニルメチルからなる群から独立に選択され、

ここで、ピリジニルは、どこに存在していても、シアノ、メチルおよびシクロプロピルアミノカルボニルからなる群から選択される 1 個または複数の置換基で置換されていてもよい、

請求項 2 0 に記載の化合物 または薬学的に許容できるその塩  
。

## 【請求項 2 2】

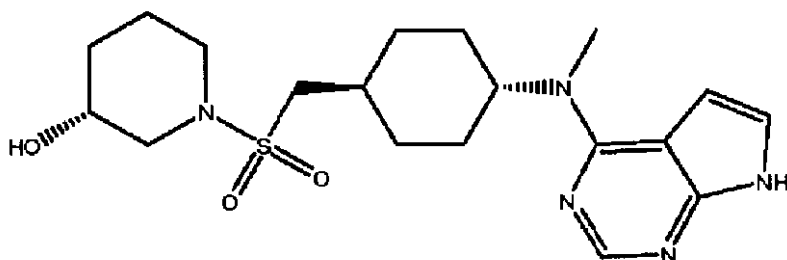
$R^{40}$ 、 $R^{41}$  および  $R^{43}$  が、水素であり、

○

$R^{40}$ 、 $R^{41}$  および  $R^{43}$  が水素であり、  
 $R^{42}$  が、メチル、

○

【化 1 6】



trans - ( R ) - 1 - ( ( 4 - ( メチル ( 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン  
- 4 - イル ) アミノ ) シクロヘキシル ) - メチルスルホニル ) ピペリジン - 3 - イルピバ  
レート ;

(3S) - 1 - [ ( { t r a n s - 4 - [ メチル ( 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 - イル ) アミノ ] シクロヘキシル } - メチル ) スルホニル ] - ピペリジン - 3 - オール ;

ジエチル ( 3 R ) - 1 - [ ( { t r a n s - 4 - [ メチル ( 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 - イル ) アミノ ] - シクロヘキシル } メチル ) スルホニル ] ピペリジン - 3 - イルホスフェート ;

N - [ t r a n s - 4 - ( { [ 3 - ( 2 - メトキシエトキシ ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } メチル ) シクロヘキシル ] - N - メチル - 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 - アミン ;

N - ( t r a n s - 4 - { [ ( 3 - イソブトキシピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] メチル } シクロヘキシル ) - N - メチル - 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 - アミン ;

N - ( t r a n s - 4 - { [ ( 3 - エトキシピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] メチル } シクロヘキシル ) - N - メチル - 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 - アミン ;

{ 1 - [ ( { t r a n s - 4 - [ メチル ( 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 - イル ) アミノ ] シクロヘキシル } メチル ) - スルホニル ] ピペリジン - 3 - イル } メタノール ;

N - [ t r a n s - 4 - ( { [ 4 - ( メトキシメチル ) ピペリジン - 1 - イル ] スルホニル } メチル ) シクロヘキシル ] - N - メチル - 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 - アミン ;

( 1 - ( ( T r a n s - 4 - ( メチル ( 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 - イル ) アミノ ) シクロヘキシル ) - メチルスルホニル ) ピペリジン - 4 - イル ) メタノール ;

( 3 S ) - 1 - [ ( { ( 1 S , 3 R , 4 S ) - 3 - メチル - 4 - [ メチル ( 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 - イル ) アミノ ] - シクロヘキシル } メチル ) スルホニル ] ピペリジン - 3 - オール ;

( 3 R , 4 R ) - 1 - [ ( { t r a n s - 4 - [ メチル ( 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 - イル ) アミノ ] シクロヘキシル } - メチル ) スルホニル ] ピペリジン - 3 , 4 - ジオール ;

1 - [ ( { t r a n s - 4 - [ メチル ( 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 - イル ) アミノ ] シクロヘキシル } メチル ) - スルホニル ] ピペリジン - 4 - オール ;

( 3 R , 4 S ) - 1 - [ ( { t r a n s - 4 - [ メチル ( 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 - イル ) アミノ ] シクロヘキシル } - メチル ) スルホニル ] ピペリジン - 3 , 4 - ジオール ;

4 - ( 2 - メトキシエチル ) - 1 - [ ( { t r a n s - 4 - [ メチル ( 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 - イル ) アミノ ] - シクロヘキシル } メチル ) スルホニル ] ピペリジン - 4 - カルボキサミド ;

N - ( t r a n s - 4 - { [ ( 4 - メトキシピペリジン - 1 - イル ) スルホニル ] メチル } シクロヘキシル ) - N - メチル - 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 - アミン ;

( R ) - 1 - ( t r a n s - 4 - ( メチル ( 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 - イル ) アミノ ) シクロヘキシル ) - メチルスルホニル ) - ピロリジン - 3 - オール ;

{ ( 3 r , 4 r ) - 4 - メチル - 1 - [ ( { t r a n s - 4 - [ メチル ( 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 - イル ) アミノ ] - シクロヘキシル } メチル ) - スルホニル ] ピロリジン - 3 - イル } メタノール ;

{ ( 3 R , 4 R ) - 4 - メチル - 1 - [ ( { t r a n s - 4 - [ メチル ( 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 4 - イル ) アミノ ] - シクロヘキシル } メチル ) - スルホニル ] ピロリジン - 3 - イル } メタノール ;

3 - メチル - 1 - [ ( { t r a n s - 4 - [ メチル ( 7 H - ピロロ [ 2 , 3 - d ] ピリ



ミジン - 4 - イル) アミノ] シクロヘキシル} - メチル) スルホニル] - ピロリジン - 3 - オール;

(3R, 4S) - 1 - [(trans - 4 - [メチル(7H - ピロロ[2, 3 - d]ピリミジン - 4 - イル) アミノ] シクロヘキシル} - メチル) スルホニル] - ピロリジン - 3, 4 - ジオール;

N - [trans - 4 - ({[(2R) - 2 - (メトキシメチル) ピロリジン - 1 - イル] スルホニル} メチル) シクロヘキシル] - N - メチル - 7H - ピロロ[2, 3 - d]ピリミジン - 4 - アミン;

((3S) - 1 - ((3 - メチル - 4 - (メチル(7H - ピロロ[2, 3 - d]ピリミジン - 4 - イル) アミノ) シクロヘキシル) - メチルスルホニル) - ピロリジン - 3 - イル) メタノール;

(3R, 4R) - 1 - [(trans - 4 - [メチル(7H - ピロロ[2, 3 - d]ピリミジン - 4 - イル) アミノ] シクロヘキシル} - メチル) スルホニル] - ピロリジン - 3, 4 - ジオール;

N - [trans - 4 - ({[(3R) - 3 - (2 - エトキシエトキシ) ピロリジン - 1 - イル] スルホニル} メチル) シクロヘキシル] - N - メチル - 7H - ピロロ[2, 3 - d]ピリミジン - 4 - アミン;

3 - メチル - 1 - [(trans - 4 - [メチル(7H - ピロロ[2, 3 - d]ピリミジン - 4 - イル) アミノ] シクロヘキシル} - メチル) スルホニル] - ピロリジン - 3 - オール;

tert - ブチル{((3S) - 1 - [(trans - 4 - [メチル(7H - ピロロ[2, 3 - d]ピリミジン - 4 - イル) アミノ] - シクロヘキシル} メチル) - スルホニル] ピロリジン - 3 - イル} カルバメート;

N - [trans - 4 - ({[(3R, 4R) - 3, 4 - ジフルオロピロリジン - 1 - イル] スルホニル} メチル) シクロヘキシル] - N - メチル - 7H - ピロロ[2, 3 - d]ピリミジン - 4 - アミン;

N - [trans - 4 - ({[3 - (メトキシメチル) ピロリジン - 1 - イル] スルホニル} メチル) シクロヘキシル] - N - メチル - 7H - ピロロ[2, 3 - d]ピリミジン - 4 - アミン; および

N - [trans - 4 - ({[(3R) - 3 - メトキシピロリジン - 1 - イル] スルホニル} メチル) シクロヘキシル] - N - メチル - 7H - ピロロ[2, 3 - d]ピリミジン - 4 - アミン

からなる群から選択される、化合物、または薬学的に許容できるその塩。

【請求項 26】

請求項 1 から 25 のいずれか一項に記載の式 I の化合物または薬学的に許容できるその塩と、薬学的に許容できる担体とを含む医薬組成物。

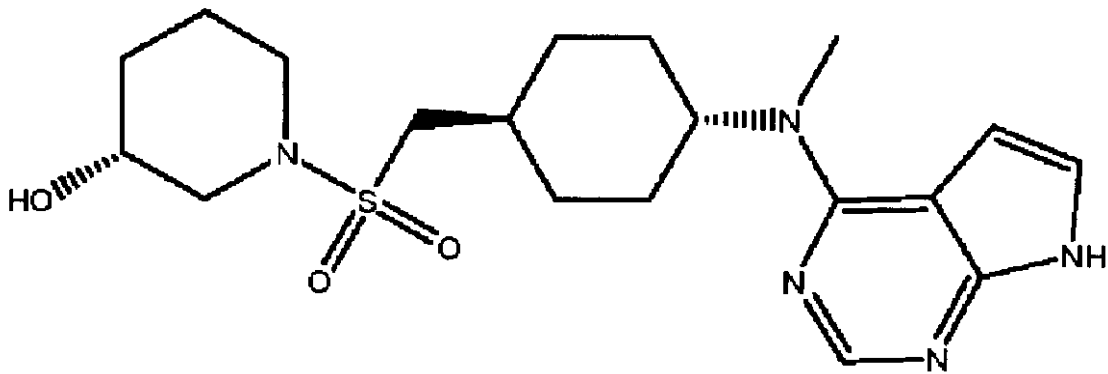
【請求項 27】

請求項 1 から 25 のいずれか一項に記載の式 I a の化合物または薬学的に許容できるその塩と、薬学的に許容できる担体とを含む医薬組成物。

【請求項 28】

構造:

## 【化 17】



を有する化合物または薬学的に許容できるその塩を含む医薬組成物。

## 【請求項 29】

ヤヌスキナーゼ媒介性状態の治療のための、請求項 26 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 30】

ヤヌスキナーゼ媒介性状態の治療のための、請求項 27 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 31】

ヤヌスキナーゼ媒介性状態の治療のための、請求項 28 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 32】

前記ヤヌスキナーゼ媒介性状態が、アルツハイマー病、関節炎、自己免疫性甲状腺障害、がん、糖尿病、白血病、T細胞前リンパ球性白血病、リンパ腫、骨髄増殖性障害、ループス、多発性骨髄腫、多発性硬化症、骨関節炎、敗血症、乾癬性関節炎、前立腺がん、T細胞自己免疫疾患、炎症性疾患、慢性および急性同種移植片拒絶反応、骨髄移植、脳卒中、喘息、慢性閉塞性肺疾患、アレルギー、気管支炎、ウイルス性疾患、またはI型糖尿病および糖尿病による合併症である、請求項 29 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 33】

前記ヤヌスキナーゼ媒介性状態が、喘息、クローン病、ドライアイ、ブドウ膜炎、炎症性腸疾患、臓器移植拒絶反応、乾癬、関節リウマチおよび潰瘍性結腸炎からなる群から選択される、請求項 29 に記載の医薬組成物。