

【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

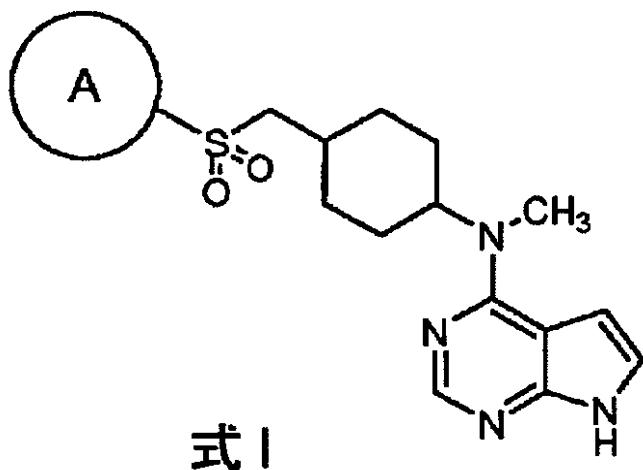
【補正の内容】

【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、(C₁ ~ C₈)アルキル、-OP(O)(R¹⁰)_n、-OR¹¹、-OC(O)R¹²、-C(O)OR¹²、-C(O)R¹³、-C(O)NR¹⁴R¹⁵、-NR¹⁶R¹⁷、-N(R¹⁸)C(O)R¹⁹、-N(R¹⁸)S(O)₂R¹⁹、-SO₂R²⁰および-SO₂NR²¹R²²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(C₁ ~ C₈)アルキルは、ハロ、シアノ、アリール、ヘテロシクリル、-OR²³、-OC(O)R²⁴、-NR²⁵R²⁶、-C(O)NR²⁷R²⁸、-SR²⁹、-SO₂R³⁰、-SO₂NR³¹R³²、-N(R³³)C(O)R³⁴および-N(R³⁵)S(O)₂R³⁶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、

R¹⁰は、ヒドロキシおよび(C₁ ~ C₆)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、

$R^{1\ 1}$ は、水素、(C₁ ~ C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ ~ C₆)アルキル、アリール、(C₁ ~ C₆)アルキルアミノカルボニル(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₁ ~ C₆)アルコキシ(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₁ ~ C₆)アルコキシカルボニル(C₁ ~ C₆)アルキル、ハロ(C₁ ~ C₆)アルコキシ(C₁ ~ C₆)アルキル、ヘテロシクリルカルボニル(C₁ ~ C₆)アルキルおよびアミノカルボニル(C₁ ~ C₆)アルキルからなる群から選択され、

$R^{1\ 2}$ 、 $R^{1\ 3}$ 、 $R^{1\ 4}$ 、 $R^{1\ 5}$ 、 $R^{1\ 6}$ 、 $R^{1\ 7}$ 、 $R^{1\ 8}$ 、 $R^{2\ 1}$ 、 $R^{2\ 2}$ 、 $R^{2\ 4}$ 、 $R^{2\ 5}$ 、 $R^{2\ 6}$ 、 $R^{2\ 7}$ 、 $R^{2\ 8}$ 、 $R^{3\ 1}$ 、 $R^{3\ 2}$ 、 $R^{3\ 3}$ 、 $R^{3\ 4}$ 、 $R^{3\ 5}$ および $R^{3\ 6}$ は、水素および(C₁ ~ C₆)アルキルからなる群から独立に選択され、

$R^{1\ 9}$ は、水素、(C₁ ~ C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ ~ C₆)アルキルおよびアリール(C₁ ~ C₆)アルコキシからなる群から選択され、

$R^{2\ 0}$ は、水素、(C₁ ~ C₆)アルキル、アリール、アリール(C₁ ~ C₆)アルキルおよび(C₃ ~ C₈)シクロアルキル(C₁ ~ C₆)アルキルからなる群から選択され、 $R^{2\ 3}$ は、水素、(C₁ ~ C₆)アルキル、アリール、ヘテロシクリル(C₁ ~ C₆)アルキルおよび(C₃ ~ C₈)シクロアルキル(C₁ ~ C₆)アルキルからなる群から選択され、

$R^{2\ 9}$ は、水素およびヘテロシクリルからなる群から選択され、

$R^{3\ 0}$ は、水素、(C₁ ~ C₆)アルキルおよび(C₃ ~ C₈)シクロアルキル(C₁ ~ C₆)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、(C₁ ~ C₆)アルキル、ハロ(C₁ ~ C₆)アルキルおよび(C₁ ~ C₆)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、(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₃ ~ C₈)シクロアルキルアミノカルボニルおよび(C₁ ~ C₆)アルキルスルホニル(C₁ ~ C₆)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、(C₁ ~ C₈)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^{1 0})_n、-OR^{1 1}、-OC(O)R^{1 2}、-C(O)OR^{1 2}、-C(O)R^{1 3}、-C(O)NR^{1 4}R^{1 5}、-NR^{1 6}R^{1 7}、-N(R^{1 8})C(O)R^{1 9}、-N(R^{1 8})S(O)₂R^{1 9}、-SO₂R^{2 0} および -SO₂NR^{2 1}R^{2 2} 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(C₁ ~ C₈)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、-OR^{2 3}、-OC(O)R^{2 4}、-NR^{2 5}R^{2 6}、-C(O)NR^{2 7}R^{2 8}、-SR^{2 9}、-SO₂R^{3 0}、-SO₂NR^{3 1}R^{3 2} および -N(R^{3 3})C(O)R^{3 4} 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、

$R^{1\ 0}$ が、ヒドロキシおよび(C₁ ~ C₆)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、

$R^{1\ 1}$ 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、
 $R^{1\sim 2}$ 、 $R^{1\sim 3}$ 、 $R^{1\sim 4}$ 、 $R^{1\sim 5}$ 、 $R^{1\sim 6}$ 、 $R^{1\sim 7}$ 、 $R^{1\sim 8}$ 、 $R^{2\sim 1}$ 、 $R^{2\sim 2}$ 、 $R^{2\sim 4}$ 、
 $R^{2\sim 5}$ 、 $R^{2\sim 6}$ 、 $R^{2\sim 7}$ 、 $R^{2\sim 8}$ 、 $R^{3\sim 1}$ 、 $R^{3\sim 2}$ 、 $R^{3\sim 3}$ および $R^{3\sim 4}$ 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、

$R^{1\sim 9}$ 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、

$R^{2\sim 0}$ 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、

$R^{2\sim 3}$ 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、

$R^{2\sim 9}$ が、水素およびピリジニルからなる群から選択され、

$R^{3\sim 0}$ 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、 $R^{2\sim 3}$ 置換基および $R^{2\sim 9}$ 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、

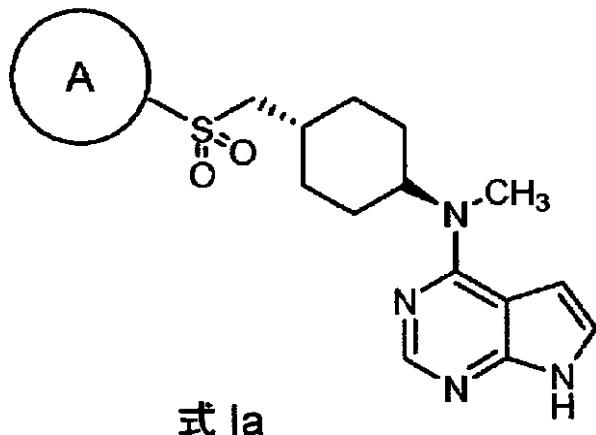
請求項2に記載の化合物または薬学的に許容できるその塩

。

【請求項4】

式Iaの化合物

【化2】



または薬学的に許容できるその塩

[式中、A環は、ピベリジニル、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、(C₁~C₈)アルキル、-OP(O)(R^{1~0})_n、-OR^{1~1}、-OC(O)R^{1~2}、-C(O)OR^{1~2}、-C(O)R^{1~3}、-C(O)NR^{1~4}R^{1~5}、-NR^{1~6}R^{1~7}、-N(R^{1~8})C(O)R^{1~9}、-N(R^{1~8})S(O)₂R^{1~9}、-SO₂R^{2~0}および-SO₂NR^{2~1}R^{2~2}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(C₁~C₈)アルキルは、ハロ、シアノ、アリール、ヘテロシクリル、-OR^{2~3}、-OC(O)R^{2~4}、-NR^{2~5}R^{2~6}、-C(O)NR^{2~7}R^{2~8}、-SR^{2~9}、-SO₂R^{3~0}、-SO₂NR^{3~1}R^{3~2}、-N(R^{3~3})C(O)R^{3~4}および-N(R^{3~5})S(O)₂R^{3~6}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^{1^0} 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^{1^1} 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、

$R^{1^2} \sim R^{1^3}$ 、 $R^{1^4} \sim R^{1^5}$ 、 $R^{1^6} \sim R^{1^7}$ 、 $R^{1^8} \sim R^{1^9}$ 、 $R^{2^1} \sim R^{2^2}$ 、 $R^{2^4} \sim R^{2^5}$ 、 $R^{2^6} \sim R^{2^7}$ 、 $R^{2^8} \sim R^{3^1}$ 、 $R^{3^2} \sim R^{3^3}$ 、 $R^{3^4} \sim R^{3^5}$ および R^{3^6} 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^{1^9} 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^{2^0} 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^{2^3} 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^{2^9} 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^{3^0} 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、A 環置換基、 R^{2^3} 置換基および R^{2^9} 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、-O-P(O)(R^{1^0})_n、-OR^{1^1}、-OC(O)R^{1^2}、-C(O)OR^{1^2}、-C(O)R^{1^3}、-C(O)NR^{1^4}R^{1^5}、-NR^{1^6}R^{1^7}、-N(R^{1^8})C(O)R^{1^9}、-N(R^{1^8})S(O)₂R^{1^9}、-SO₂R^{2^0} および -SO₂NR^{2^1}R^{2^2} 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^{2^3}、-OC(O)R^{2^4}、-NR^{2^5}R^{2^6}、-C(O)NR^{2^7}R^{2^8}、-SR^{2^9}、-SO₂R^{3^0}、-SO₂NR^{3^1}R^{3^2} および -N(R^{3^3})C(O)R^{3^4} 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^{1^0} 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^{1^1} 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、

$R^{1^2} \sim R^{1^3}$ 、 $R^{1^4} \sim R^{1^5}$ 、 $R^{1^6} \sim R^{1^7}$ 、 $R^{1^8} \sim R^{2^1}$ 、 $R^{2^2} \sim R^{2^4}$ 、 $R^{2^5} \sim R^{2^6}$ 、 $R^{2^7} \sim R^{2^8}$ 、 $R^{3^1} \sim R^{3^2}$ 、 $R^{3^3} \sim R^{3^4}$ 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^{1^9} 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、

$R^{2\ 0}$ 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、

$R^{2\ 3}$ 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、

$R^{2\ 9}$ が、水素およびピリジニルからなる群から選択され、

$R^{3\ 0}$ 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、 $R^{2\ 3}$ 置換基および $R^{2\ 9}$ 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、

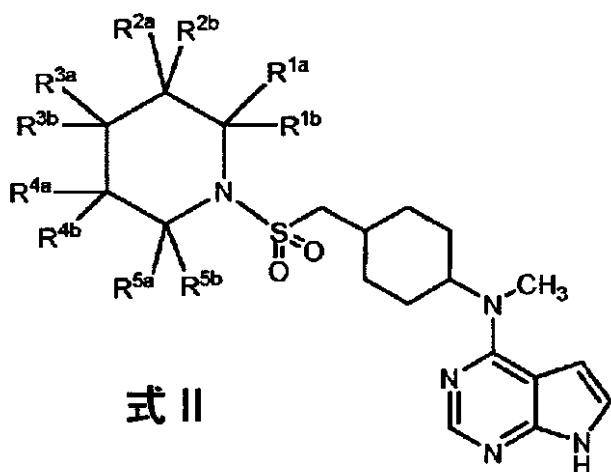
請求項 4 に記載の化合物または薬学的に許容できるその塩

。

【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、 $R^{1\ a}$ 、 $R^{1\ b}$ 、 $R^{2\ a}$ 、 $R^{2\ b}$ 、 $R^{3\ a}$ 、 $R^{3\ b}$ 、 $R^{4\ a}$ 、 $R^{4\ b}$ 、 $R^{5\ a}$ および $R^{5\ b}$ は、水素、カルボキシ、シアノ、ハロ、(C₁ ~ C₈) アルキル、アリール、ヘテロシクリル、-OP(O)(R¹⁰)_n、-OR¹¹、-OC(O)R¹²、-C(O)R¹³、-C(O)NR¹⁴R¹⁵、-NR¹⁶R¹⁷ および-N(R¹⁸)C(O)R¹⁹ からなる群から独立に選択され、ここで、前記(C₁ ~ C₈) アルキルは、ハロ、ヘテロシクリル、-OR²³、-NR²⁵R²⁶、-C(O)NR²⁷R²⁸、-SO₂R³⁰ および-SO₂NR³¹R³² 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、

$R^{1\ 0}$ は、ヒドロキシおよび(C₁ ~ C₆) 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、

$R^{1\ 1}$ は、水素、(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₁ ~ C₆) アルコキシ(C₁ ~ C₆) アルキルおよびアミノカルボニル(C₁ ~ C₆) アルキルからなる群から選択され、

$R^{1\ 2}$ 、 $R^{1\ 3}$ 、 $R^{1\ 4}$ 、 $R^{1\ 5}$ 、 $R^{1\ 6}$ 、 $R^{1\ 7}$ 、 $R^{1\ 8}$ 、 $R^{2\ 5}$ 、 $R^{2\ 6}$ 、 $R^{2\ 7}$ 、 $R^{2\ 8}$ 、 $R^{3\ 1}$ および $R^{3\ 2}$ は、水素および(C₁ ~ C₆) アルキルからなる群から独立に選択され、

$R^{1\sim 9}$ 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、
 $R^{2\sim 3}$ 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、
 $R^{3\sim 0}$ 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】

$R^{1\sim a}$ 、 $R^{1\sim b}$ 、 $R^{2\sim a}$ 、 $R^{2\sim b}$ 、 $R^{3\sim a}$ 、 $R^{3\sim b}$ 、 $R^{4\sim a}$ 、 $R^{4\sim b}$ 、 $R^{5\sim a}$ および $R^{5\sim b}$ 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^{1~0})_n、-OR^{1~1}、-OC(O)R^{1~2}、-C(O)R^{1~3}、-C(O)NR^{1~4}R^{1~5}、-NR^{1~6}R^{1~7} および -N(R^{1~8})C(O)R^{1~9} 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^{2~3}、-C(O)NR^{2~7}R^{2~8}、-SO₂R^{3~0}、-SO₂NR^{3~1}R^{3~2} および -N(R^{3~3})C(O)R^{3~4} 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、 $R^{1\sim 0}$ 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、

$R^{1\sim 1}$ 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、

$R^{1\sim 2}$ 、 $R^{1\sim 3}$ 、 $R^{1\sim 4}$ 、 $R^{1\sim 5}$ 、 $R^{1\sim 6}$ 、 $R^{1\sim 7}$ 、 $R^{1\sim 8}$ 、 $R^{2\sim 7}$ 、 $R^{2\sim 8}$ 、 $R^{3\sim 1}$ 、 $R^{3\sim 2}$ 、 $R^{3\sim 3}$ および $R^{3\sim 4}$ 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、

$R^{1\sim 9}$ 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、

$R^{2\sim 3}$ 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、

$R^{3\sim 0}$ 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】

$R^{1\sim a}$ 、 $R^{1\sim b}$ 、 $R^{5\sim a}$ および $R^{5\sim b}$ が水素であり、
 $R^{2\sim a}$ および $R^{2\sim b}$ 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、
 $R^{3\sim a}$ および $R^{3\sim b}$ が、水素、シアノ、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、

$R^{4\sim a}$ および $R^{4\sim b}$ 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

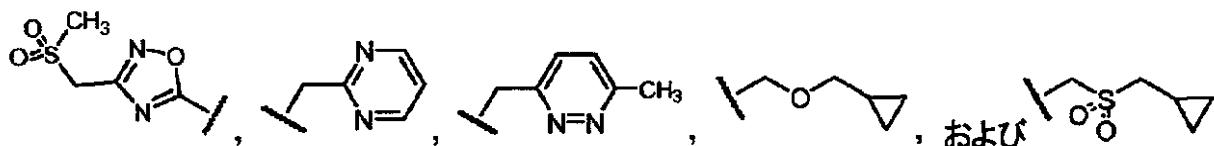
。

【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、

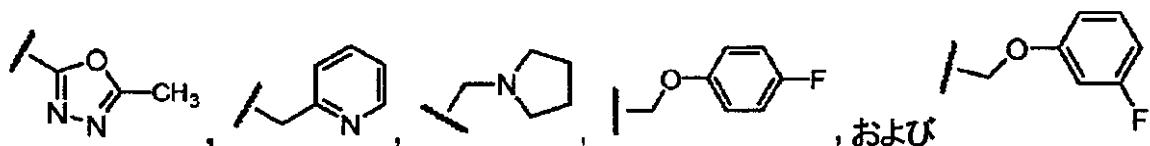
【化 4】



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、(C₁ ~ C₈)アルキル、-OP(O)(R¹⁰)_n、-OR¹¹、-OC(O)R¹²および-C(O)NR¹⁴R¹⁵からなる群から独立に選択され、ここで、前記(C₁ ~ C₈)アルキルは、-OR²³で置換されていてもよく、

R¹⁰が、ヒドロキシおよび(C₁ ~ C₆)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、

R¹¹が、水素、(C₁ ~ C₆)アルキルおよび(C₁ ~ C₆)アルコキシ(C₁ ~ C₆)

) アルキルからなる群から選択され、

R^{1-2} 、 R^{1-4} および R^{1-5} 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^{2-3} が、水素および(C₁ ~ C₆)アルキルからなる群から選択される、

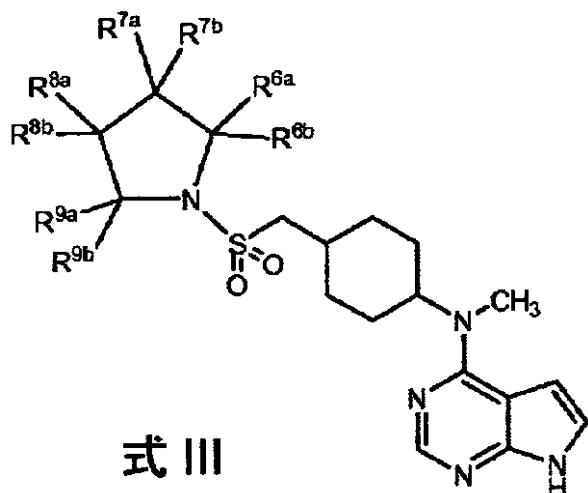
請求項 6 に記載の化合物または薬学的に許容できるその塩

○

【請求項 11】

式 I I I の化合物

【化 6】



式 III

または薬学的に許容できるその塩[式中、

R⁶a、R⁶b、R⁷a、R⁷b、R⁸a、R⁸b、R⁹aおよびR⁹bは、水素、シアノ、ハロ、(C₁~C₈)アルキル、アリール、ヘテロシクリル、-OP(O)(R¹0)_n、-OR¹1、-OC(O)R¹2、-C(O)NR¹4R¹5、-NR¹6R¹7、-N(R¹8)C(O)R¹9、-SO₂R²0および-SO₂NR²1R²2からなる群から独立に選択され、ここで、前記(C₁~C₈)アルキルは、シアノ、アリール、ヘテロシクリル、-OR²3、-NR²5R²6および-SR²9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、

R¹ = 0 は、ヒドロキシおよび (C₁ ~ C₆) 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^{1-1} は、水素、(C₁ ~ C₆)アルキル、アリール、ハロ(C₁ ~ C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₁ ~ C₆)アルキルアミノカルボニル(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₁ ~ C₆)アルコキシ(C₁ ~ C₆)アルキル、ハロ(C₁ ~ C₆)アルコキシ(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₁ ~ C₆)アルコキシカルボニル(C₁ ~ C₆)アルキル、アミノカルボニル(C₁ ~ C₆)アルキルおよびヘテロシクリルカルボニル(C₁ ~ C₆)アルキルからなる群から選択され、

$R^{1\ 2}$ 、 $R^{1\ 6}$ 、 $R^{1\ 7}$ 、 $R^{1\ 8}$ 、 $R^{2\ 1}$ 、 $R^{2\ 2}$ 、 $R^{2\ 5}$ および $R^{2\ 6}$ 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^{1-9} は、水素、(C₁ ~ C₆) アルコキシおよびハロ(C₁ ~ C₆) アルキルからなる群から選択され、

R^{2-0} は、水素、(C₁ ~ C₆) アルキルおよびアリール(C₁ ~ C₆) アルキルからなる群から選択され、

R^{2-3} は、水素、(C₁~C₆)アルキル、アリールおよびヘテロシクリル-(C₁~C₆)アルキルからなる群から選択され、

B^{2-9} 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、(C₁ ~ C₆)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、(C₁ ~ C₆)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^{6a}、R^{6b}、R^{7a}、R^{7b}、R^{8a}、R^{8b}、R^{9a}およびR^{9b}が、水素、シアノ、フルオロ、(C₁ ~ C₈)アルキル、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、-O R¹¹、-O C(O) R¹²、-C(O) N R¹⁴ R¹⁵、-N R¹⁶ R¹⁷、-N(R¹⁸)C(O) R¹⁹、-SO₂ R²⁰および-SO₂ N R²¹ R²²からなる群から独立に選択され、ここで、前記(C₁ ~ C₈)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、-OR²³、-NR²⁵ R²⁶および-SR²⁹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、

R¹¹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、

R¹²、R¹⁶、R¹⁷、R¹⁸、R²¹、R²²、R²⁵およびR²⁶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、

R¹⁹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、

R²⁰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、

R²³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、

R²⁵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

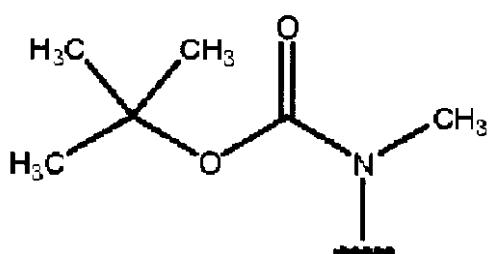
。

【請求項13】

R^{6a}、R^{6b}およびR^{9b}が水素であり、

R^{7a}およびR^{7b}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】

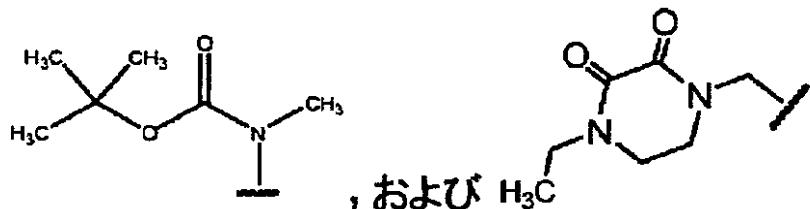


からなる群から独立に選択され、

R^{8a}およびR^{8b}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^9 ^a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、

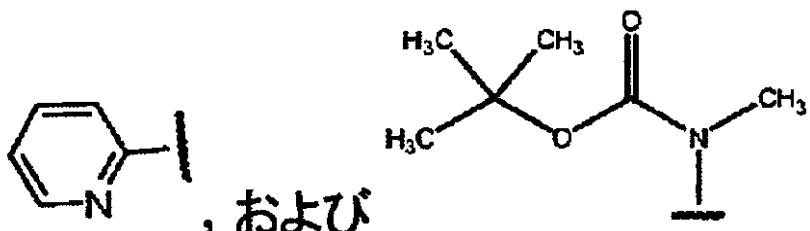
請求項12に記載の化合物または薬学的に許容できるその塩

。

【請求項14】

R^6 ^a、 R^6 ^bおよび R^9 ^bが水素であり、
 R^7 ^aおよび R^7 ^b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、

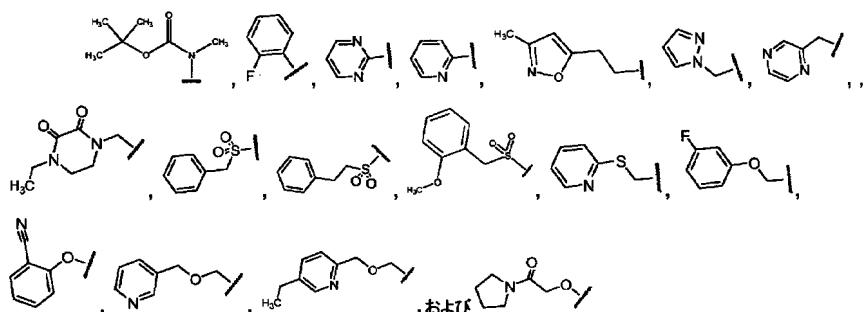
【化9】



からなる群から独立に選択され、

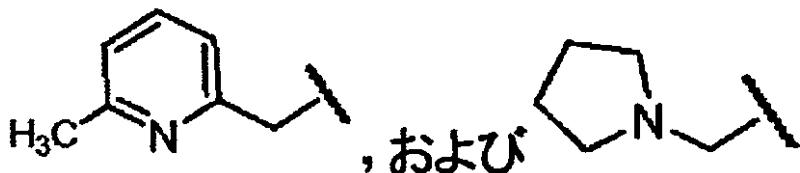
R^8 ^aおよび R^8 ^bが、水素、フルオロ、ヒドロキシ、アミノ、アミノカルボニル、エチルアミノエチル、エトキシエトキシ、ジメチルアミノカルボニルメトキシ、ジエチルアミノカルボニルメトキシ、メチルアミノスルホニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルカルボニルアミノ、ヒドロキシメチル、シアノメチル、フェニル、ベンジル、

【化 1 0】



からなる群から独立に選択され、
 R^9 ^a が、水素、メチル、メトキシメチル、ヒドロキシメチル、
【化 11】

【化 1 1】



からなる群から選択される、
請求項 1 3 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、ハロウ、($C_1 \sim C_8$)アルキル、-OR^{1~1}および-N(R^{1~8})C(O)R^{1~9}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^{2~3}で置換されていてもよく、

R^{1-1} 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。

B^{1-8} が、水素および (C_{1-4}) アルキルからなる群から選択され、

B^{19} が、水素および ($C_1 \sim C_5$) アルコキシからなる群から選択され、

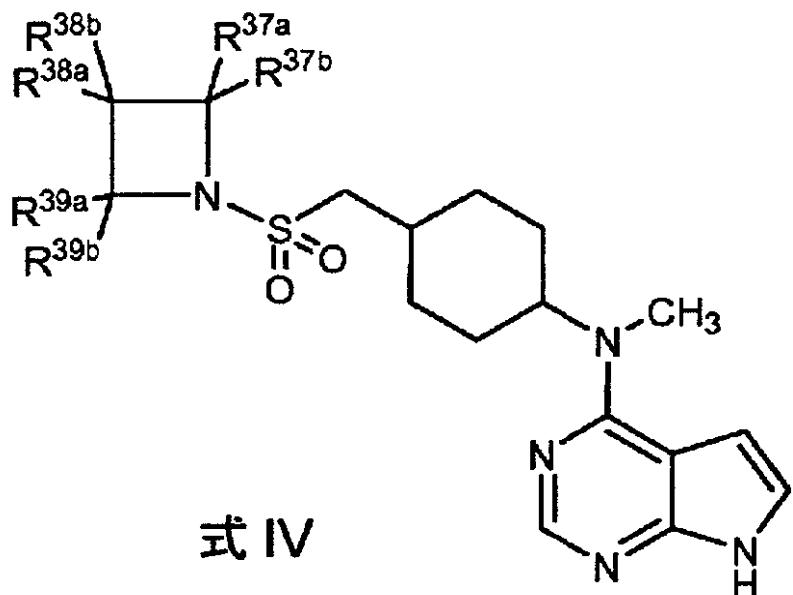
$R^{2,3}$ が 水素および ($C_1 \sim C_6$) アルキルからなる群から選択される。

請求項1-1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 16】

式 IV の化合物

【化12】



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 ($C_1 \sim C_6$) アルコキ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、

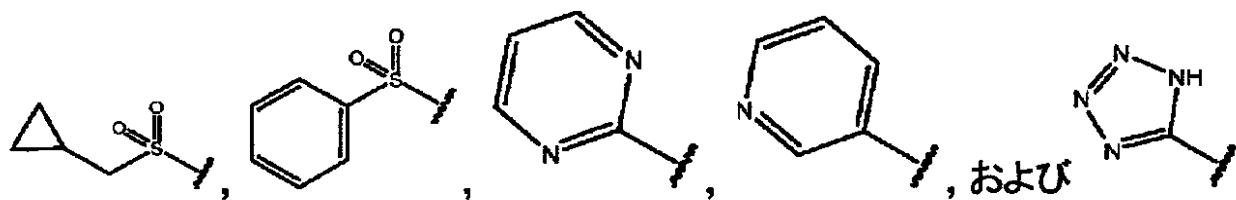
請求項17に記載の化合物または薬学的に許容できるその塩

。

【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、メトキカルボニルアミノ、

【化13】



からなる群から選択される、

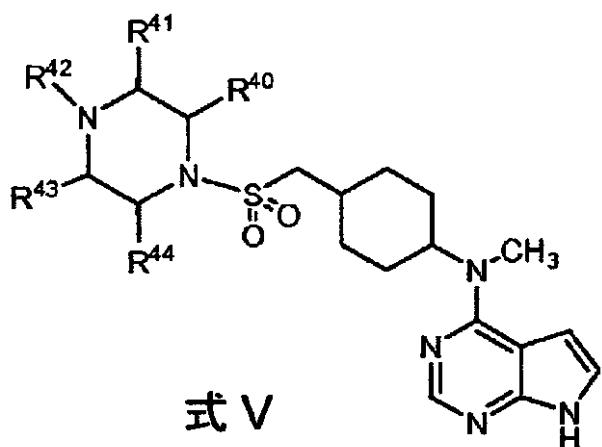
請求項18に記載の化合物または薬学的に許容できるその塩

。

【請求項20】

式Vの化合物

【化14】



または薬学的に許容できるその塩

[式中、R⁴⁰、R⁴¹、R⁴²、R⁴³およびR⁴⁴は、水素、(C₁～C₈)アルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロシクリル(C₁～C₆)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、(C₁～C₆)アルキルおよび(C₃～C₈)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21】

R⁴⁰、R⁴¹、R⁴²、R⁴³およびR⁴⁴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20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22】

R⁴⁰、R⁴¹およびR⁴³が、水素であり、

R^{4-2} が、メチル、ピリジニル、ピリジニルメチル、メチルピリジニル、シアノピリジニルおよびシクロプロピルアミノカルボニルピリジニルからなる群から選択され、

R^{4-4} が、水素およびメチルからなる群から選択される、

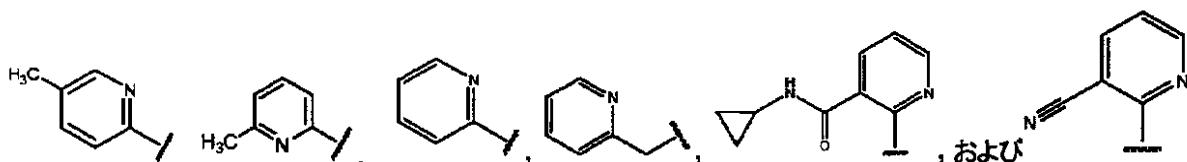
請求項 2 1 に記載の化合物または薬学的に許容できるその塩

。

【請求項 2 3】

R^{4-0} 、 R^{4-1} および R^{4-3} が水素であり、
 R^{4-2} が、メチル、

【化 1 5】



からなる群から選択され、

R^{4-4} が、水素およびメチルからなる群から選択される、

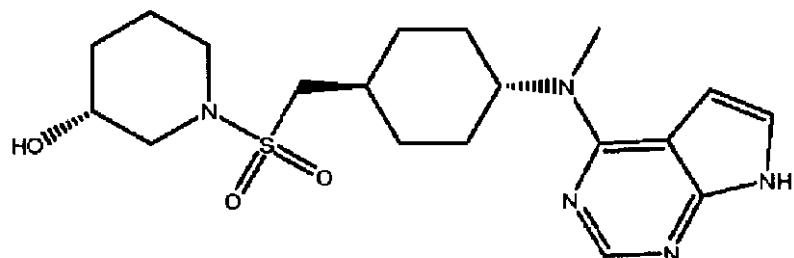
請求項 2 2 に記載の化合物または薬学的に許容できるその塩

。

【請求項 2 4】

構造：

【化 1 6】



を有する化合物または薬学的に許容できるその塩。

【請求項 2 5】

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

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

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

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

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

(3 S) - 1 - [({ t r a n s - 4 - [メチル (7 H - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - アミン ;

{ 1 - [({ t r a n s - 4 - [メチル (7 H - ピロ口 [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 - ピロ口 [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - アミン ;

(1 - ((T r a n s - 4 - (メチル (7 H - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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。

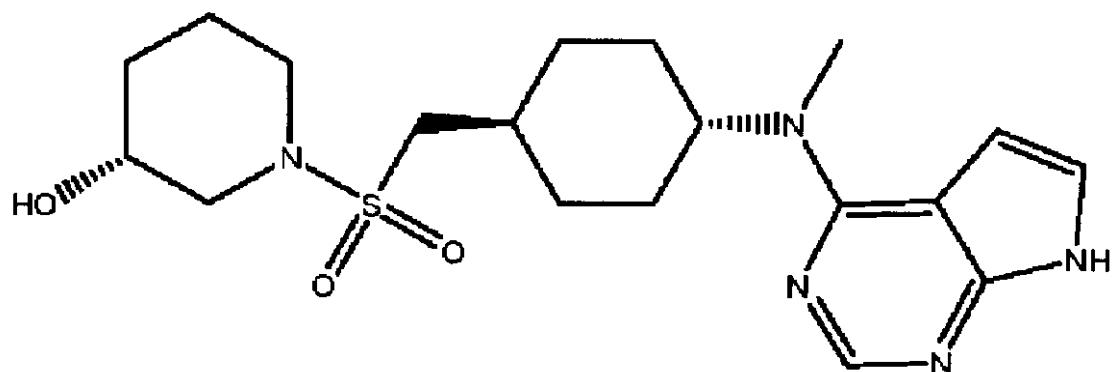
【請求項 27】

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。