

【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20年5月1日(2008.5.1)

【公表番号】特表2007-529484(P2007-529484A)

【公表日】平成19年10月25日(2007.10.25)

【年通号数】公開・登録公報2007-041

【出願番号】特願2007-503401(P2007-503401)

【国際特許分類】

C 07 D 471/04	(2006.01)
A 61 K 31/437	(2006.01)
A 61 K 31/444	(2006.01)
A 61 P 1/00	(2006.01)
A 61 P 1/04	(2006.01)
A 61 P 1/12	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 11/02	(2006.01)
A 61 P 11/00	(2006.01)
A 61 P 11/06	(2006.01)
A 61 P 11/08	(2006.01)
A 61 P 13/12	(2006.01)
A 61 P 17/00	(2006.01)
A 61 P 17/04	(2006.01)
A 61 P 17/06	(2006.01)
A 61 P 19/02	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 25/04	(2006.01)
A 61 P 25/24	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 27/14	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 31/04	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 37/08	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 471/04	1 0 6 C
C 07 D 471/04	C S P
A 61 K 31/437	
A 61 K 31/444	
A 61 P 1/00	
A 61 P 1/04	
A 61 P 1/12	
A 61 P 9/10	
A 61 P 11/02	
A 61 P 11/00	
A 61 P 11/06	
A 61 P 11/08	
A 61 P 13/12	
A 61 P 17/00	

A 6 1 P	17/04
A 6 1 P	17/06
A 6 1 P	19/02
A 6 1 P	25/00
A 6 1 P	25/04
A 6 1 P	25/24
A 6 1 P	25/28
A 6 1 P	27/14
A 6 1 P	29/00
A 6 1 P	29/00
	1 0 1
A 6 1 P	31/04
A 6 1 P	35/00
A 6 1 P	37/08
A 6 1 P	43/00
	1 1 1

## 【手続補正書】

【提出日】平成20年3月12日(2008.3.12)

## 【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

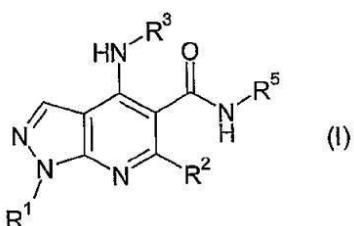
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式(I)の化合物またはその塩:

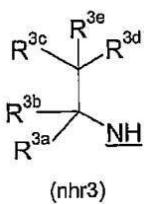
## 【化1】



[式中、

R<sup>1</sup>は、エチル、n-プロピル、イソプロピル、C<sub>2</sub>フルオロアルキル、または-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OHであり；R<sup>2</sup>は、水素原子(H)、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、C<sub>1</sub>～<sub>2</sub>フルオロアルキル、シクロプロピル、または(シクロプロピル)メチル-であり；NHR<sup>3</sup>は、下位式(nhr3)を有し：

## 【化2】

式中、下位式(nhr3)では、式(I)の二環系へのNHR<sup>3</sup>基の-NH-接続点を下線で示し、かつ式中、(a)R<sup>3b</sup>がメチルもしくはエチルであり、かつ/または(b)R<sup>3c</sup>およびR<sup>3d</sup>が独立に、メチルもしくはエチルであることを条件とし；かつ

(c)  $R^{3c}$  がエチルであり、かつ/または  $R^{3d}$  がエチルであり、かつ/または  $R^{3e}$  がメチルである場合、 $R^{3a}$  はメチルであり、かつ/または  $R^{3b}$  は水素原子(H)もしくはメチルであることを条件として、

$R^{3a}$  は、メチルまたはエチルであり；

$R^{3b}$  は、水素原子(H)、メチル、またはエチルであり，

$R^{3c}$  は、水素原子(H)、メチル、またはエチルであり、

$R^{3d}$  は、水素原子(H)、メチル、またはエチルであり、かつ

$R^{3e}$  は、水素原子(H)、またはメチルであり；

かつ式中、

$R^5$  は、 $C_{3\sim 8}$ アルキル； $C_{1\sim 2}$ アルキル基で場合によっては置換されていてもよい $C_{3\sim 8}$ シクロアルキル；または $-(CH_2)_n^4$ -部分もしくは $C_{3\sim 8}$ シクロアルキル部分において、 $C_{1\sim 2}$ アルキル基で場合によっては置換されていてもよい $-(CH_2)_n^4-C_{3\sim 8}$ シクロアルキル(式中、 $n^4$ は、1、2、または3である)であり；

あるいは $R^5$ は、1または2個の独立した置換基 $R^{11}$ で置換されている $C_{2\sim 6}$ アルキルであり；

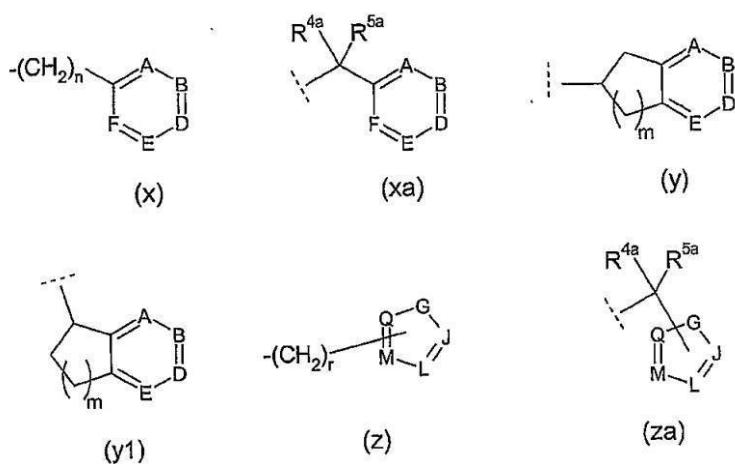
式中、置換基 $R^{11}$ はそれぞれ、存在する他の $R^{11}$ 置換基とは独立に、ヒドロキシ(OH)； $C_{1\sim 6}$ アルコキシ；フェニルオキシ；ベンジルオキシ； $-NR^{12}R^{13}$ ； $-NR^{15}-C(O)R^{16}$ ； $-NR^{15}-C(O)-NH-R^{15}$ ；または $-NR^{15}-SO_2R^{16}$ であり；かつ式中、OH、アルコキシ、または $-NR^{12}R^{13}$ である $R^{11}$ 置換基は、 $NHR^5$ の窒素に結合している $R^5$ 置換アルキルの炭素原子においては置換しておらず；

あるいは $R^5$ は、 $-(CH_2)_n^{12}-SO_2-NR^{12}R^{13}$ または $-(CH_2)_n^{12}-SO_2R^{16}$ (式中、 $n^{12}$ は、2、3、または4である)であり；

あるいは $R^5$ は、 $-(CH_2)_n^{13}-Het$ (式中、 $n^{13}$ は、0、1、2、3、または4であり、かつHetは、O、S、およびNから独立に選択される1または2個の環ヘテロ原子を含む4、5、6、または7員の飽和または部分飽和複素環であり、式中、 $n^{13}$ が1である場合、存在する環ヘテロ原子は、 $-(CH_2)_n^{13}$ -部分に結合しておらず、 $n^{13}$ が0である場合、 $NHR^5$ の窒素に結合しておらず；式中、存在しているが不飽和ではない(すなわち、二重結合に関与していない)環窒素は、 $NR^{17}$ として存在し；かつ式中、炭素環原子のうちの1または2個は独立に、 $C_{1\sim 2}$ アルキルで場合によっては置換されていてもよい)であり；

あるいは $R^5$ は、下位式(x)、(xa)、(y)、(y1)、(z)、または(za)を有し：

### 【化3】



式中、下位式(x)では、 $n=0$ 、1、または2；下位式(y)および(y1)では、 $m=1$ または2；かつ下位式(z)では、 $r=0$ 、1、または2；

式中、下位式(y)および(y1)は独立に、6員芳香族環に隣接する環炭素においてオキソ(=O)で場合によっては置換されていてもよく；

かつ式中、下位式(xa)および(za)では、

$R^{4a}$ および $R^{5a}$ の少なくとも1個は水素原子(H)ではないことを条件として、

$R^{4a}$ は、水素原子(H)；メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、 $C_{1-2}$ フルオロアルキル、シクロプロピル、 $-CH_2OR^{4aa}$ 、 $-CH(Me)OR^{4aa}$ 、または $-CH_2CH_2OR^{4aa}$ (式中、 $R^{4aa}$ は、水素原子(H)、メチル(Me)、または $C_1$ フルオロアルキルである)であり；かつ

$R^{5a}$ は、水素原子(H)； $C_{1-8}$ アルキル； $C_{1-3}$ フルオロアルキル； $C_{1-2}$ アルキル基で場合によっては置換されていてもよい $C_{3-8}$ シクロアルキル；または $-(CH_2)_n^{4a}$ -部分または $C_{3-8}$ シクロアルキル部分において、 $C_{1-2}$ アルキル基で場合によっては置換されていてもよい $-(CH_2)_n^{4a}-C_{3-8}$ シクロアルキル(式中、 $n^{4a}$ は1または2である)であり；

あるいは $R^{5a}$ は、1個の置換基 $R^{11a}$ で置換されている $C_{1-4}$ アルキル(式中、 $R^{11a}$ は、ヒドロキシ(OH)； $C_{1-6}$ アルコキシ； $C_{1-2}$ フルオロアルコキシ；フェニルオキシ；(モノフルオロ-またはジフルオロ-フェニル)オキシ；(モノメチル-またはジメチル-フェニル)オキシ；ベンジルオキシ； $-NR^{12}R^{13}$ ； $-NR^{15}-C(O)R^{16}$ ； $-NR^{15}-C(O)-NH-R^{15}$ ；または $-NR^{15}-S(O)_2R^{16}$ である)であり；

あるいは $R^{5a}$ は、異なる炭素原子上において2個のヒドロキシ(OH)置換基で置換されている $C_{2-4}$ アルキルであり；

あるいは $R^{5a}$ は、 $-(CH_2)_n^{11a}-C(O)R^{16}$ ； $-(CH_2)_n^{11a}-C(O)NR^{12}R^{13}$ ； $-CHR^{19a}-C(O)NR^{12}R^{13}$ ； $-(CH_2)_n^{11a}-C(O)OR^{16}$ ； $-(CH_2)_n^{11a}-C(O)OH$ ； $-CHR^{19a}-C(O)OR^{16}$ ； $-CHR^{19a}-C(O)OH$ ； $-(CH_2)_n^{11a}-S(O)_2-NR^{12}R^{13}$ ； $-(CH_2)_n^{11a}-S(O)_2R^{16}$ ；または $-(CH_2)_n^{11a}-CN$ (式中、 $n^{11a}$ は、0、1、2、または3(ただし、各 $R^{5a}$ 基について、 $n^{11a}$ は他の $R^{5a}$ 基における $n^{11a}$ の値とは独立である)であり；かつ式中、 $R^{19a}$ は $C_{1-2}$ アルキルである)であり；

あるいは $R^{5a}$ は、 $-(CH_2)_n^{13a}-Het^A$ (式中、 $n^{13a}$ は、0、1、または2であり、かつ $Het^A$ は、O、S、およびNから独立に選択される1または2個の環ヘテロ原子を含む、 $-NR^{12}R^{13}$ 以外の4、5、6、または7員の飽和または不飽和の複素環であり、式中、 $n^{13a}$ が0である場合、存在する環ヘテロ原子は、 $-(CH_2)_n^{13a}$ -部分に結合しておらず；式中、存在しているが、不飽和でなく(すなわち、二重結合に関与していない)、接続している窒素ではない(すなわち、 $-(CH_2)_n^{13a}$ -部分に、または $R^{5a}$ が結合している炭素原子に結合している窒素ではない)環窒素は、 $NR^{17a}$ として存在し；かつ式中、炭素環原子の1または2個は独立に、 $C_{1-2}$ アルキルで場合によっては置換されていてもよい)であり；

あるいは $R^{5a}$ は、フェニル(Ph)、 $-CH_2-Ph$ 、 $-CHMe-Ph$ 、 $-CHEt-Ph$ 、 $CM_{e2}Ph$ 、または $-CH_2CH_2-Ph$ (式中、フェニル環Phは、独立にハロゲン原子； $C_{1-4}$ アルキル； $C_{1-2}$ フルオロアルキル； $C_{1-4}$ アルコキシ； $C_{1-2}$ フルオロアルコキシ；シクロプロピル；シクロプロピルオキシ； $-C(O)-C_{1-4}$ アルキル； $-C(O)OH$ ； $-C(O)-OC_{1-4}$ アルキル； $C_{1-4}$ アルキル-S(O)<sub>2</sub>-； $C_{1-4}$ アルキル-S(O)<sub>2</sub>-NR<sup>8a</sup>-； $R^{7a}R^{8a}N-S(O)_2-$ ； $R^{7a}R^{8a}N-C(O)-$ ； $-NR^{8a}-C(O)-C_{1-4}$ アルキル； $R^{7a}R^{8a}N-OH$ ；ニトロ(-NO<sub>2</sub>)；またはシアノ(-CN)である1もしくは2個の置換基で場合によっては置換されていてもよい)であり；

あるいは $R^{4a}$ および $R^{5a}$ は一緒になって、 $-(CH_2)_p^{1-}$ または $-(CH_2)_p^{3-X^5}-(CH_2)_p^{4-}$ (式中、 $X^5$ は、0または $NR^{17a}$ であり、 $p^1=2$ 、3、4、5、または6、 $p^3$ が3の場合、 $p^4$ は1または2であり、 $p^4$ が3である場合、 $p^3$ は1または2であることを条件として、 $p^3$ および $p^4$ は独立に、1、2、または3である)であり；

かつ式中、下位式(x)および下位式(xa)では、

A、B、D、E、およびFのうちの少なくとも2個が独立に、C-H(炭素-水素)、C-F(炭素-フッ素)、窒素(N)、または窒素-オキシド( $N^+-O^-$ )であり；

かつA、B、D、E、およびFのうちの2個以下が独立に、窒素または窒素-オキシド( $N^+-O^-$ )であり、

かつA、B、D、E、およびFのうちの1個以下が窒素-オキシド( $N^+-O^-$ )であることを条件として、

Aは、 $C-R^{6A}$ 、窒素(N)、または窒素-オキシド( $N^+-O^-$ )であり、

Bは、 $C-R^{6B}$ 、窒素(N)、または窒素-オキシド( $N^+-O^-$ )であり、

Dは、 $C-R^{6D}$ 、窒素(N)、または窒素-オキシド( $N^+-O^-$ )であり、

Eは、 $C-R^{6E}$ 、窒素(N)、または窒素-オキシド( $N^+-O^-$ )であり、

Fは、 $C-R^{6F}$ 、窒素(N)、または窒素-オキシド( $N^+-O^-$ )であり、

式中、 $R^{6A}$ 、 $R^{6B}$ 、 $R^{6D}$ 、 $R^{6E}$ 、および $R^{6F}$ は独立に、水素原子(H)、ハロゲン原子;  $C_{1\sim 6}$ アルキル;  $C_{1\sim 4}$ フルオロアルキル;  $C_{3\sim 6}$ シクロアルキル;  $C_{1\sim 4}$ アルコキシ;  $C_{1\sim 2}$ フルオロアルコキシ;  $C_{3\sim 6}$ シクロアルキルオキシ;  $-C(O)R^{16a}$ ;  $-C(O)OR^{30}$ ;  $-S(O)_2-R^{16a}$ ;  $R^{16a}-S(O)_2-NR^{15a}$ ;  $R^7R^8N-S(O)_2-$ ;  $C_{1\sim 2}$ アルキル- $C(O)-R^{15a}N-S(O)_2-$ ;  $C_{1\sim 4}$ アルキル- $S(O)-$ 、 $Ph-S(O)-$ 、 $R^7R^8N-CO-$ ;  $-NR^{15a}-C(O)R^{16a}$ ;  $R^7R^8N$ ; ニトロ(-NO<sub>2</sub>); OH(その互変異性体を含めて);  $C_{1\sim 4}$ アルコキシメチル;  $C_{1\sim 4}$ アルコキシエチル;  $C_{1\sim 2}$ アルキル- $S(O)_2-CH_2-$ ;  $R^7R^8N-S(O)_2-CH_2-$ ;  $C_{1\sim 2}$ アルキル- $S(O)_2-NR^{15a}-CH_2-$ ;  $-CH_2-OH$ ;  $-CH_2CH_2-OH$ ;  $-CH_2-NR^7R^8$ ;  $-CH_2-CH_2-NR^7R^8$ ;  $-CH_2-C(O)OR^{30}$ ;  $-CH_2-C(O)-NR^7R^8$ ;  $-CH_2-NR^{15a}-C(O)-C_{1\sim 3}$ アルキル;  $-(CH_2)_n^{14}-Het^1$ (式中、 $n^1$ は0または1である); シアノ(-CN); Ar<sup>5b</sup>; またはフェニル、ピリジニル、もしくはピリミジニル(ただし、フェニル、ピリジニル、またはピリミジニルは独立に、フルオロ、クロロ、 $C_{1\sim 2}$ アルキル、 $C_1$ フルオロアルキル、 $C_{1\sim 2}$ アルコキシ、または $C_1$ フルオロアルコキシのうちの1または2個で場合によっては置換されていてもよい)であり;

かつ/または $R^{6A}$ 、 $R^{6B}$ 、 $R^{6D}$ 、 $R^{6E}$ 、および $R^{6F}$ から選択される隣接する2個の基は一緒になって、 $-CH=CH-CH=CH_2-$ 、 $-(CH_2)_n^{14a}$ (式中、 $n^{14a}$ は、3、4、または5である)、 $-O-(CMe_2)-O-$ 、 $-O-(CH_2)_n^{14b}-O-$ (式中、 $n^{14b}$ は、1または2である);  $-CH=CH-NR^{15b}-$ ;  $-N=CH-NR^{15b}-$ ;  $-CH=N-NR^{15b}-$ ;  $-N=N-NR^{15b}-$ ;  $-CH=CH-O-$ ;  $-N=CH-O-$ ;  $-CH=CH-S-$ ; または $-N=CH-S-$ (式中、 $R^{15b}$ は、Hまたは $C_{1\sim 2}$ アルキルである)であり;

かつ式中、下位式(z)および下位式(za)では、

J、L、M、およびQのうちの少なくとも2個が独立に、C-H、C-F、C-C<sub>1~2</sub>アルキル、C-[式(I)への接続点]、または窒素(N)であり、

かつJ、L、M、およびQの3個以下が窒素(N)であることを条件として、

Gは、OまたはSまたはNR<sup>9</sup>(式中、R<sup>9</sup>は、水素原子(H)、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、または $C_{1\sim 2}$ フルオロアルキルである)であり;

Jは、C-R<sup>6J</sup>、C-[式(I)への接続点]、または窒素(N)であり、

Lは、C-R<sup>6L</sup>、C-[式(I)への接続点]、または窒素(N)であり、

Mは、C-R<sup>6M</sup>、C-[式(I)への接続点]、または窒素(N)であり、

Qは、C-R<sup>6Q</sup>、C-[式(I)への接続点]、または窒素(N)であり、

式中、 $R^{6J}$ 、 $R^{6L}$ 、 $R^{6M}$ 、および $R^{6Q}$ は独立に、水素原子(H)、ハロゲン原子;  $C_{1\sim 4}$ アルキル;  $C_{1\sim 3}$ フルオロアルキル;  $C_{3\sim 6}$ シクロアルキル;  $C_{1\sim 4}$ アルコキシ;  $C_{1\sim 2}$ フルオロアルコキシ;  $C_{3\sim 6}$ シクロアルキルオキシ; OH(その互変異性体を含めて); または独立にフルオロ、クロロ、 $C_{1\sim 2}$ アルキル、 $C_1$ フルオロアルキル、 $C_{1\sim 2}$ アルコキシ、もしくは $C_1$ フルオロアルコキシである1もしくは2個の置換基で場合によっては置換されていてもよいフェニルであり;

かつ式中、

$R^7$ および $R^8$ は独立に、水素原子(H);  $C_{1\sim 4}$ アルキル;  $C_{3\sim 6}$ シクロアルキル; または独立にフルオロ、クロロ、 $C_{1\sim 2}$ アルキル、 $C_1$ フルオロアルキル、 $C_{1\sim 2}$ アルコキシ、もしくは $C_1$ フルオロアルコキシである1もしくは2個の置換基で場合によっては置換されていてもよいフェニルであり;

あるいは $R^7$ および $R^8$ は一緒になって、 $-(CH_2)_n^{6a}-$ 、または $-C(O)-(CH_2)_n^{7a}-$ 、または $-C(O)-(CH_2)_n^{10a}-C(O)-$ 、または $-(CH_2)_n^{8a}-X^7-(CH_2)_n^{9a}-$ 、または $-C(O)-X^7-(CH_2)_n^{10a}$ (式中、 $n^6$ は、3、4、5、または6であり、 $n^7$ は、2、3、4、または5であり、 $n^8$ および $n^9$ および $n^{10}$ は独立に、2または3であり、かつ $X^7$ は、OまたはNR<sup>14</sup>である)であり;

$R^{7a}$ は、水素原子(H)または $C_{1\sim 4}$ アルキルであり;

$R^{8a}$ は、水素原子(H)またはメチルであり;

$R^{12}$ および $R^{13}$ (他の $R^{12}$ または $R^{13}$ とは独立には独立に)は独立に、H;  $C_{1\sim 4}$ アルキル;  $C_{3\sim 6}$ シクロアルキル; または独立にフルオロ、クロロ、 $C_{1\sim 2}$ アルキル、 $C_1$ フルオロアルキル、 $C_{1\sim 2}$ アルコキシ、または $C_1$ フルオロアルコキシである1もしくは2個の置換基で場合によっては置換されていてもよいフェニルであり;

あるいは $R^{12}$ および $R^{13}$ (他の $R^{12}$ または $R^{13}$ とは独立には独立に)は一緒になって、 $-(CH_2)_n^{6a}-$ 、または $-C(O)-(CH_2)_n^{7a}-$ 、または $-C(O)-(CH_2)_n^{10a}-C(O)-$ 、または $-(CH_2)_n^{8a}-X^{12}-(CH_2)_n^{9a}-$

、または $-C(O)-X^{12}-\left(CH_2\right)_n^{10a}$ -である(式中、 $n^{6a}$ は、3、4、5、または6であり、 $n^{7a}$ は、2、3、4、または5であり、 $n^{8a}$ および $n^{9a}$ および $n^{10a}$ は独立に、2または3であり、 $X^{12}$ は、0または $NR^{14a}$ である)であり;

$R^{14}$ 、 $R^{14a}$ 、および $R^{17a}$ (他の $R^{14}$ 、 $R^{14a}$ 、または $R^{17a}$ とは独立に)は独立に、水素原子(H); $C_{1~4}$ アルキル; $C_{1~2}$ フルオロアルキル;シクロプロピル; $-C(O)-C_{1~4}$ アルキル; $-C(O)NR^{7a}R^{8a}$ ;または $-S(O)_2-C_{1~4}$ アルキルであり;

$R^{15}$ は、他の $R^{15}$ とは独立に、水素原子(H); $C_{1~4}$ アルキル; $C_{3~6}$ シクロアルキル;または独立にハロゲン原子、 $C_{1~2}$ アルキル、 $C_1$ フルオロアルキル、 $C_{1~2}$ アルコキシ、もしくは $C_1$ フルオロアルコキシである1もしくは2個の置換基で場合によっては置換されていてもよいフェニルであり;

$R^{15a}$ は、他の $R^{15a}$ とは独立に、水素原子(H)または $C_{1~4}$ アルキルであり;

$R^{16}$ は、他の $R^{16}$ とは独立に、 $C_{1~4}$ アルキル; $C_{3~6}$ シクロアルキル; $C_{3~6}$ シクロアルキル- $CH_2-$ ;またはフェニルもしくはベンジル(ただし、フェニルおよびベンジルは独立に、その環において、独立にフルオロ、クロロ、メチル、 $C_1$ フルオロアルキル、メトキシ、または $C_1$ フルオロアルコキシである1または2個の置換基で場合によっては置換されていてもよい)であり;

$R^{16a}$ は、他の $R^{16a}$ とは独立に、

$C_{1~6}$ アルキル;

1個のオキソ(=O)、OH、または $C_{1~2}$ アルキル置換基で場合によっては置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルキル;

$C_{3~6}$ シクロアルキル- $CH_2-$ ;

環炭素原子において、ハロゲン原子、 $C_{1~2}$ アルキル、 $C_1$ フルオロアルキル、 $C_{1~2}$ アルコキシ、または $C_1$ フルオロアルコキシのうちの1個で場合によっては置換されていてもよいピリジニル;

$Ar^{5c}$ ;

独立にハロゲン原子、 $C_{1~2}$ アルキル、 $C_1$ フルオロアルキル、 $C_{1~2}$ アルコキシ、または $C_1$ フルオロアルコキシである1または2個の置換基で場合によっては置換されていてもよいフェニル;

その環において、独立にハロゲン原子、 $C_{1~2}$ アルキル、 $C_1$ フルオロアルキル、 $C_{1~2}$ アルコキシ、または $C_1$ フルオロアルコキシである1または2個の置換基で場合によっては置換されていてもよいベンジル;あるいは

環炭素において接続し、かつO、S、およびNから独立に選択される1または2個の環ヘテロ原子を含む4、5、6、または7員の飽和複素環(式中、存在する環窒素は、 $NR^{27}$ として存在しており(式中、 $R^{27}$ は、H、 $C_{1~2}$ アルキル、または $-C(O)Me$ である)、かつ式中、オキソ(=O)置換基が、環窒素に結合している環炭素原子において置換されていることを条件として、環は、炭素において、1個の $C_{1~2}$ アルキルまたはオキソ(=O)置換基で場合によっては置換されていてもよい)であり;

$R^{17}$ は、他の $R^{17}$ とは独立に、水素原子(H); $C_{1~4}$ アルキル; $C_{1~2}$ フルオロアルキル; $C_{3~6}$ シクロアルキル; $-(CH_2)_p^6-C(O)R^{16}$ (式中、 $p^6$ は、0、1、2、または3である); $-(CH_2)_p^6-C(O)NR^{12}R^{13}$ ;  $-(CH_2)_p^6-C(O)OR^{16}$ ;  $-(CH_2)_p^6-C(O)OH$ ;  $-SO_2R^{16}$ ;  $-C(O)-CH_2-NR^{12}R^{13}$ ;  $-C(O)-CH_2-NR^{15a}-C(O)-C_{1~3}$ アルキル;  $-C(O)-CH_2-O-C_{1~3}$ アルキル;またはフェニルもしくはベンジル(ただし、フェニルもしくはベンジルは、その環において、独立にハロゲン原子、 $C_{1~2}$ アルキル、 $C_1$ フルオロアルキル、 $C_{1~2}$ アルコキシ、または $C_1$ フルオロアルコキシである1または2個の置換基で場合によっては置換されていてもよい)であり;

$R^{30}$ は、他の $R^{30}$ とは独立に、水素原子(H)、 $C_{1~4}$ アルキル、または $C_{3~6}$ シクロアルキルであり;

$Ar^{5b}$ および $Ar^{5c}$ は独立に、5員環に1個のO、S、または $NR^{15a}$ を含む5員芳香族複素環(式中、5員環は、場合によってはさらに1または2個のN原子を含むことができ、かつ式中、複素環は、環炭素原子において、ハロゲン原子、 $C_{1~2}$ アルキル、 $C_1$ フルオロアルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2-OC_{1~2}$ アルキル、OH(そのケト互変異性体を含めて)、または $-CH_2-NR^{28}R^{29}$ (式

中、 $R^{28}$ および $R^{29}$ は、独立にHまたはメチルである)のうちの1個で場合によっては置換されていてもよい)であり;かつ

$Het^1$ は、他の $Het^1$ とは独立に、環炭素において接続し、かつO、S、およびNから独立に選択される1または2個の環ヘテロ原子を含む4、5、6、または7員の飽和複素環(式中、存在する環窒素は、 $NR^{31}$ として存在しており(式中、 $R^{31}$ は、H、 $C_{1-2}$ アルキル、または $-C(O)Me$ である)、かつ式中、オキソ(=O)置換基が、環窒素に結合している環炭素原子において置換されていることを条件として、環は、炭素において、1個の $C_{1-2}$ アルキルまたはオキソ(=O)置換基で場合によっては置換されていてもよい)である]。

【請求項2】

$R^1$ が、エチルまたは $C_2$ フルオロアルキルである請求項1に記載の化合物または塩。

【請求項3】

$R^1$ がエチルである請求項1に記載の化合物または塩。

【請求項4】

$R^2$ が水素原子(H)またはメチルである請求項1、2、または3に記載の化合物または塩。

【請求項5】

$R^{3a}$ がメチルであり、 $R^{3b}$ が水素原子(H)またはメチルであり、かつ $R^{3e}$ が水素原子(H)である、請求項1、2、3、または4に記載の化合物または塩。

【請求項6】

$R^{3b}$ がメチルまたはエチルであり、 $R^{3c}$ および $R^{3d}$ が独立に、水素原子(H)またはメチルであり、かつ $R^{3e}$ が水素原子(H)である、請求項1、2、3、または4に記載の化合物または塩。

【請求項7】

$R^3$ がt-ブチルである、請求項6に記載の化合物または塩。

【請求項8】

$R^{3c}$ および $R^{3d}$ が独立に、メチルまたはエチルであり、 $R^{3a}$ がメチルであり、かつ $R^{3b}$ が水素原子(H)またはメチルである、請求項1、2、3、4、または5に記載の化合物または塩。

【請求項9】

$R^3$ が1,2-ジメチル-プロピル(すなわち、 $NHR^3$ が

【化4】

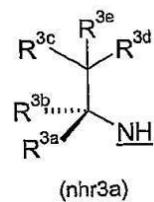


である(1,2-ジメチルプロピル)アミノ)である、請求項8に記載の化合物または塩。

【請求項10】

$R^{3c}$ および $R^{3d}$ が独立に、メチルまたはエチルであり、 $R^{3b}$ が水素原子(H)であり、かつ $NH R^3$ が下位式(nhr3a)を有する、請求項1、2、3、4、5、8、または9に記載の化合物または塩:

【化5】

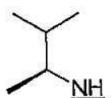


[式中、下位式(nhr3a)は、存在している化合物または塩の50%超が、 $R^{3a}$ 基および $R^{3b}$ 基を有する炭素原子において図示の立体化学を有することを意味する]。

【請求項11】

$NHR^3$ が下記の下位式を有し

## 【化6】



すなわち、 $\text{NHR}^3$ が、[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノである、請求項10に記載の化合物または塩。

## 【請求項12】

$\text{R}^5$ が、 $\text{C}_3 \sim 8$ アルキル;  $\text{C}_5 \sim 6$ シクロアルキル; ( $\text{C}_5 \sim 6$ シクロアルキル)メチル-; - $(\text{CH}_2)_n^5$ - $\text{R}^{11}$ であり(式中、 $n^5$ は、2または3であり、かつ $\text{R}^{11}$ は、 $-\text{NR}^{15}-\text{SO}_2\text{R}^{16}$ である)、あるいは $\text{R}^5$ が、下位式(x)、(xa)、(y)、(y1)、(z)、または(za)を有する、請求項1～11のいずれかに記載の化合物または塩。

## 【請求項13】

$\text{R}^5$ が、下位式(x)、(xa)、(y)、(y1)、(z)、または(za)を有する、請求項12に記載の化合物または塩。

## 【請求項14】

$\text{R}^5$ が、下位式(x)、(xa)、(y)、または(z)を有する、請求項13に記載の化合物または塩。

## 【請求項15】

$\text{R}^5$ が、下位式(x)または(xa)を有する、請求項14に記載の化合物または塩。

## 【請求項16】

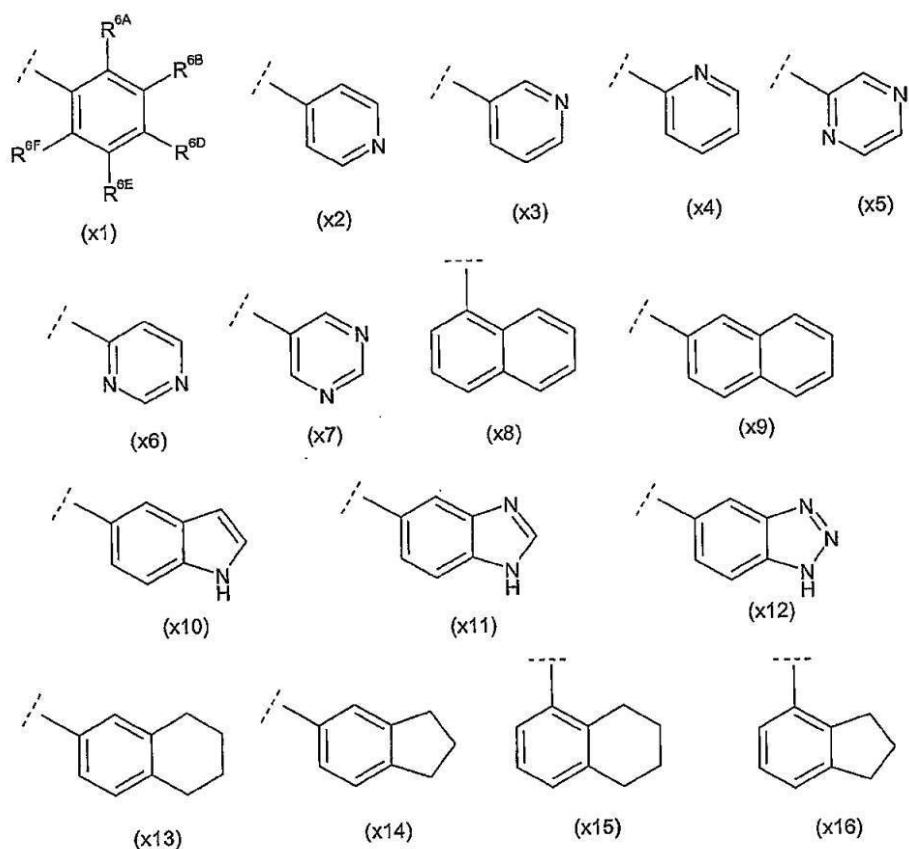
$n=1$ 、 $m=1$ 、および $r=1$ である、請求項1～15のいずれかに記載の化合物または塩。

## 【請求項17】

$\text{R}^5$ が、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{Ar}^X$ である下位式(x)を有し、または $-(\text{CR}^{4a}\text{R}^{5a})-\text{Ar}^X$ である下位式(xa)を有し、

かつ $\text{Ar}^X$ が、下位式(x1)、(x2)、(x3)、(x4)、(x5)、(x6)、(x7)、(x8)、(x9)、(x10)、(x11)、(x12)、(x13)、(x14)、(x15)、もしくは(x16)を有する、請求項15または請求項15に従属する請求項16に記載の化合物または塩:

## 【化7】



## 【請求項18】

$\text{Ar}^X$ が下位式(x1)を有する、請求項17に記載の化合物または塩。

## 【請求項19】

下位式(x)および下位式(xa)において、好ましくはR<sup>6A</sup>、R<sup>6B</sup>、R<sup>6D</sup>、R<sup>6E</sup>、およびR<sup>6F</sup>が相互に独立に、水素原子(H)、フッ素、塩素、臭素、もしくはヨウ素原子、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、イソブチル、トリフルオロメチル、-CH<sub>2</sub>OH、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、C<sub>1</sub>フルオロアルコキシ、ニトロ(-NO<sub>2</sub>)、OH、C<sub>1</sub>~<sub>3</sub>アルキルS(O)<sub>2</sub>-、C<sub>1</sub>~<sub>2</sub>アルキルS(O)<sub>2</sub>-NH-、-CONH<sub>2</sub>、シアノ(-CN)、またはC<sub>1</sub>~<sub>2</sub>アルキルS(O)<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-である、請求項1~18のいずれかに記載の化合物または塩。

## 【請求項20】

R<sup>6A</sup>、R<sup>6B</sup>、R<sup>6D</sup>、R<sup>6E</sup>、およびR<sup>6F</sup>が相互に独立に、水素原子(H)、フッ素、塩素、もしくは臭素原子、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、トリフルオロメチル、-CH<sub>2</sub>OH、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、ジフルオロメトキシ、ニトロ(-NO<sub>2</sub>)、OH、MeS(O)<sub>2</sub>-、Me-S(O)<sub>2</sub>-NH-、またはMe-S(O)<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-である、請求項19に記載の化合物または塩。

## 【請求項21】

R<sup>5</sup>が下位式(x)を有し、かつベンジル、(モノアルキル-フェニル)メチル、[モノ(フルオロアルキル)-フェニル]メチル、(モノハロ-フェニル)メチル、(モノアルコキシ-フェニル)メチル、[モノ(フルオロアルコキシ)-フェニル]メチル、[モノ(N,N-ジメチルアミノ)-フェニル]メチル、[モノ(メチル-SO<sub>2</sub>-NH-)フェニル]メチル、[モノ(メチル-SO<sub>2</sub>-)フェニル]メチル、(ジアルキル-フェニル)メチル、(モノアルキル-モノハロ-フェニル)メチル、[モノ(フルオロアルキル)-モノハロ-フェニル]メチル、(ジハロ-フェニル)メチル、(ジハロ-モノアルキル-フェニル)メチル、[ジハロ-モノ(ヒドロキシメチル)-フェニル]メチル、または(ジアルコキシ-フェニル)メチルである請求項1~20のいずれかに記載の化合物または塩。

## 【請求項22】

R<sup>5</sup>が下位式(X)を有し、かつ、

(モノ $C_{1\sim 4}$ アルキル-フェニル)メチル;  
 (モノ $C_1$ フルオロアルキル-フェニル)メチル;  
 (モノ $C_{1\sim 3}$ アルコキシ-フェニル)メチル;  
 [モノ( $C_1$ フルオロアルコキシ)-フェニル]メチル;  
 ( $\text{ジ}C_{1\sim 2}$ アルキル-フェニル)メチル;  
 (モノ $C_{1\sim 4}$ アルキル-モノハロ-フェニル)メチル;  
 (ジハロ-フェニル)メチル;  
 (ジハロ-モノ $C_{1\sim 2}$ アルキル-フェニル)メチル;または  
 [ジハロ-モノ(ヒドロキシメチル)-フェニル]メチルである請求項22に記載の化合物または塩。

## 【請求項23】

N-ベンジル-4-{{[(1R)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
 4-{{[(1R)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
 4-{{[(1R)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
 N-(2,3-ジヒドロ-1H-インден-2-イル)-4-{{[(1R)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
 4-{{[(1R)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-[4-(メチルスルホニル)ベンジル]-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
 N-[4-(ジフルオロメトキシ)ベンジル]-4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
 4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-[(2-メチル-1,3-チアゾール-4-イル)メチル]-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
 N-[(5-クロロピリジン-2-イル)メチル]-4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
 N-(2-クロロ-6-フルオロベンジル)-4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
 4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-{1-[4-(メチルスルホニル)フェニル]エチル}-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
 4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-[(6-メトキシピリジン-3-イル)メチル]-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
 4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-{3-[(メチルアミノ)カルボニル]ベンジル}-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
 4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-[(1R)-1-フェニルプロピル]-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
 N-[2-(ジメチルアミノ)ベンジル]-4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
 4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-(4-フルオロベンジル)-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
 4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-N-(ジフェニルメチル)-1-エチル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
 4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-{4-[(メチルアミノ)カルボニル]ベンジル}-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
 メチル 4-({{[(4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル)カルボニル]アミノ}メチル)ベンゾエート、  
 4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-(4-メトキシフェニル)-1H-ピラゾロ

口[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-(4-ヒドロキシベンジル)-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-[3-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-(4-メトキシベンジル)-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
N-(3,4-ジフルオロベンジル)-4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
N-(2,6-ジフルオロベンジル)-4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-[(1R)-1-フェニルエチル]-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
N-(2,5-ジフルオロベンジル)-4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-(3-フルオロベンジル)-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-[2-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
N-(5-クロロ-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イル)-4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
メチル 3-({{[(4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル)カルボニル]アミノ}メチル)ベンゾエート、  
N-[2-(アミノカルボニル)ベンジル]-4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-{4-[(メチルスルホニル)アミノ]ベンジル}-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-{3-[(メチルスルホニル)アミノ]ベンジル}-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
N-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イル)-4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-[4-(メチルスルホニル)ベンジル]-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
N-ベンジル-4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
N-[2-(アミノスルホニル)エチル]-4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-[(6-オキソ-1,6-ジヒドロピリジン-3-イル)メチル]-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-{2-[(メチルスルホニル)アミノ]エチル}-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-[(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル]-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-[3-(メチルスルホニル)ベンジル]-

1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-(ピリジン-3-イルメチル)-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
N-[3-(アミノカルボニル)ベンジル]-4-{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-  
1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
N-{4-[(ジメチルアミノ)スルホニル]ベンジル}-4-{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-  
-1-エチル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-{[(1S)-1,2-ジメチルプロピル]アミノ}-1-エチル-N-(2-エチルブチル)-1H-ピラゾロ[3,  
4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、  
4-(tert-ブチルアミノ)-1-エチル-N-ベンジル-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-カルボキ  
サミド、  
4-(tert-ブチルアミノ)-1-エチル-N-(4-フルオロフェニル)-1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン  
-5-カルボキサミド、  
4-(tert-ブチルアミノ)-1-エチル-N-[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1H-ピラゾロ[3,  
4-b]ピリジン-5-カルボキサミド、または  
4-(tert-ブチルアミノ)-1-エチル-N-[4-(メチルスルホニル)ベンジル]-1H-ピラゾロ[3,4-  
b]ピリジン-5-カルボキサミド；

または薬剤として許容できるその塩である請求項1に記載の化合物または塩。

#### 【請求項24】

請求項1～23のいずれかに記載の式(I)の化合物または薬剤として許容できるその塩、ならびに1つまたは複数の薬剤として許容できる担体および/または賦形剤を含む薬剤組成物。

#### 【請求項25】

哺乳類において活性治療物質として使用するための、請求項1～23のいずれかに記載の式(I)の化合物または薬剤として許容できるその塩。

#### 【請求項26】

哺乳類において炎症性および/またはアレルギー性疾患の治療および/または予防のための医薬品の製造における、請求項1～23のいずれかに記載の式(I)の化合物または薬剤として許容できるその塩の使用。

#### 【請求項27】

炎症性および/またはアレルギー性疾患が、ヒトにおける慢性閉塞性肺疾患(COPD)、喘息、リウマチ様関節炎またはアレルギー性鼻炎である請求項26に記載の使用。

#### 【請求項28】

哺乳類において喘息、慢性閉塞性肺疾患(COPD)、アトピー性皮膚炎、じんま疹、アレルギー性鼻炎、アレルギー性結膜炎、春季力タル、好酸球性肉芽腫、乾癬、リウマチ様関節炎、敗血症性ショック、潰瘍性大腸炎、クローン病、心筋および脳の再灌流障害、慢性糸球体腎炎、内毒素性ショック、成人呼吸窮迫症候群、多発性硬化症、神経疾患における認知機能障害、うつ病、または疼痛の治療および/または予防のための医薬品の製造における、請求項1～23のいずれかに記載の式(I)の化合物または薬剤として許容できるその塩の使用。