

【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31年3月28日(2019.3.28)

【公表番号】特表2018-505903(P2018-505903A)

【公表日】平成30年3月1日(2018.3.1)

【年通号数】公開・登録公報2018-008

【出願番号】特願2017-543931(P2017-543931)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 19/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 P 5/24 (2006.01)

A 6 1 P 5/14 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/14 C S P

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/517

C 0 7 D 471/04 1 0 8 A

A 6 1 K 31/444

C 0 7 D 471/04 1 0 1

C 0 7 D 471/04 1 1 7 Z

A 6 1 K 31/519

C 0 7 D 487/04 1 4 2

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 19/00

A 6 1 P 21/02

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 K 31/497
 A 6 1 P 5/24
 A 6 1 P 5/14

【手続補正書】

【提出日】平成31年2月14日(2019.2.14)

【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

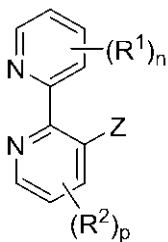
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

構造式(I°):

【化1】



(I°)

[式中]

nは1、2、3または4であり；

R¹は水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁-6アルキル、C₁-6ハロアルキル、C₃-8シクロアルキル、C₃-8シクロアルケニル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、-R^a、または-C₁-6アルキル-R^aであって、ここで、R^aは-OR^{S1}、-SR^{S1}、-NR^{S1}R^{S1}、-C(O)R^{S1}、-C(O)OR^{S1}、-C(O)NR^{S1}R^{S1}、-S(O)₂NR^{S1}R^{S1}、-OC(O)R^{S1}、-N(R^{S1})C(O)R^{S1}、-OC(O)OR^{S1}、-O(CH₂)_mC(O)NR^{S1}R^{S1}、-N(R^{S1})C(O)OR^{S1}、-N(R)C(O)NR^{S1}R^{S1}、-N(R^{S1})S(O)₂NR^{S1}R^{S1}または-N(R^{S1})S(O)₂R^{S1}であり；

ここで、mは0、1、2または3であり；および

ここで、R^{S1}は、各々独立して、水素、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆ハロアルキル、-(C₀-C₆アルキル)-Ar、-(C₀-C₆アルキル)-Het、-(C₀-C₆アルキル)-Cak、または-(C₀-C₆アルキル)-Hcaであり、ここでAr、Het、Cak、Hca、アルキル、およびハロアルキルは、C₁-C₆アルキル、ハロゲン、C₁-C₆ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよく；

pは1、2、3または4であり；

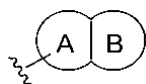
R²は水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁-6アルキル、C₁-6ハロアルキル、C₃-8シクロアルキル、C₃-8シクロアルケニル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、-R^b、または-C₁-6アルキル-R^bであって、ここでR^bは-OR^{S4}、-SR^{S4}、-NR^{S4}R^{S4}、-C(O)R^{S4}、-C(O)OR^{S4}、-C(O)NR^{S4}R^{S4}、-S(O)₂NR^{S4}R^{S4}、-OC(O)R^{S4}、-N(R^{S4})C(O)R^{S4}、-OC(O)OR^{S4}、-O(CH₂)_qC(O)NR^{S4}R^{S4}、-N(R^{S4})C(O)OR^{S4}、-N(R)C(O)NR^{S4}R^{S4}、-N(R^{S4})S(O)₂NR^{S4}R^{S4}、または-N(R^{S4})S(O)₂R^{S4}であり；

ここで、qは0、1、2または3であり；および

ここで、 R^{S4} は、各々独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Ar$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Het$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Cak$ 、または $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Hca$ であり、ここで Ar 、 Het 、 Cak 、 Hca 、アルキル、およびハロアルキルは、 $C_1 - C_6$ アルキル、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよく；

Z は、式：

【化 2】



(式中

環 A は Ar または 6 員の Het であり、

環 B は 5 または 6 員の Het である)

で示される縮合した二環式環であり；

ここで

Z は、1 または 2 個の、各々が独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-C_1 - C_6$ アルコキシ、 $-OR^{S2}$ 、 $-SR^{S2}$ 、 $-NR^{S2}$ 、 $-C(O)R^{S2}$ 、 $-C(O)OR^{S2}$ 、 $-C(O)NR^{S2}$ 、 $-S(O)_2NR^{S2}$ 、 $-S(O)_2R^{S2}$ 、 $-OC(O)R^{S2}$ 、 $-N(R^{S2})C(O)R^{S2}$ 、 $-OC(O)OR^{S2}$ 、 $-OC(O)NR^{S2}$ 、 $-N(R^{S2})C(O)OR^{S2}$ 、 $-N(R^{S2})C(O)NR^{S2}$ 、 $-N(R^{S2})S(O)_2R^{S2}$ 、 $-OP(O)(OR^{S2})_2$ または $-CH_2 - OP(O)(OR^{S2})$ である、 $-R^Z$ 基により置換されてもよく、ここで各アルキル、ハロアルキルおよびアルコキシは、1 または 2 個の $-R^Z$ 基で置換されてもよく；

ここで R^{S2} は、各々独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル - $O - C_1 - C_6$ アルキル、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Ar$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Het$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Cak$ 、または $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Hca$ であって、ここで Ar 、 Het 、 Cak 、 Hca 、アルキルおよびハロアルキルは、 $C_1 - C_6$ アルキル、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよく；および

$-R^{Z2}$ は、各々独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-C_1 - C_6$ アルコキシ、 $-OR^{S3}$ 、 $-SR^{S3}$ 、 $-NR^{S3}$ 、 $-C(O)R^{S3}$ 、 $-C(O)OR^{S3}$ 、 $-C(O)NR^{S3}$ 、 $-S(O)_2NR^{S3}$ 、 $-S(O)_2R^{S3}$ 、 $-OC(O)R^{S3}$ 、 $-N(R^{S3})C(O)R^{S3}$ 、 $-OC(O)OR^{S3}$ 、 $-OC(O)NR^{S3}$ 、 $-N(R^{S3})C(O)OR^{S3}$ 、 $-N(R^{S3})C(O)NR^{S3}$ 、 $-N(R^{S3})S(O)_2R^{S3}$ 、 $-OP(O)(OR^{S3})_2$ または $-CH_2 - OP(O)(OR^{S3})$ であり；および

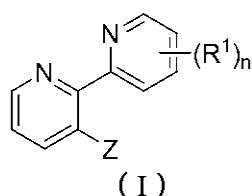
ここで、 R^{S3} は、各々独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Ar$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Het$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Cak$ 、または $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Hca$ であって、ここで Ar 、 Het 、 Cak 、 Hca 、アルキルおよびハロアルキルは、 $C_1 - C_6$ アルキル、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよい]

で示される化合物、あるいはその医薬的に許容される塩、プロドラッグもしくは N - オキシド、またはそれらの溶媒和物もしくは水和物。

【請求項 2】

構造式 (I)：

【化 3】



[式中、

n は、0、1、2、3 または 4 であり；

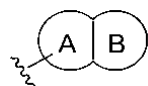
R¹ は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ ハロアルキル、C₃ - C₈ シクロアルキル、C₃ - C₈ シクロアルケニル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、- R^a、または - C₁ - C₆ アルキル - R^a であり、ここで R^a は - OR^{S1}、- SR^{S1}、- NR^{S1}R^{S1}、- C(O)R^{S1}、- C(O)OR^{S1}、- C(O)NR^{S1}R^{S1}、- S(O)₂NR^{S1}R^{S1}、- OC(O)R^{S1}、- N(R^{S1})C(O)R^{S1}、- OC(O)OR^{S1}、- O(CH₂)_mC(O)NR^{S1}R^{S1}、- N(R^{S1})C(O)OR^{S1}、- N(R)C(O)NR^{S1}R^{S1}、- N(R^{S1})S(O)₂NR^{S1}R^{S1}、または - N(R^{S1})S(O)₂R^{S1} であり；

ここで m は 0、1、2 または 3 であり；および

ここで、R^{S1} は、各々独立して、水素、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ ハロアルキル、- (C₀ - C₆ アルキル) - Ar、- (C₀ - C₆ アルキル) - Het、- (C₀ - C₆ アルキル) - Cak、または - (C₀ - C₆ アルキル) - Hca であり、ここで Ar、Het、Cak、Hca、アルキル、およびハロアルキルは、C₁ - C₆ アルキル、ハロゲン、C₁ - C₆ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよく；

Z は、式：

【化 4】



(式中、

環 A は Ar または 6 員の Het であり、

環 B は 5 または 6 員の Het である)

で示される縮合した二環式環であり；

ここで

Z は、1 または 2 個の、各々独立して、ハロゲン、シアノ、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ ハロアルキル、- C₁ - C₆ アルコキシ、- OR^{S2}、- SR^{S2}、- NR^{S2}、- C(O)R^{S2}、- C(O)OR^{S2}、- C(O)NR^{S2}、- S(O)₂NR^{S2}、- S(O)₂R^{S2}、- OC(O)R^{S2}、- N(R^{S2})C(O)R^{S2}、- OC(O)OR^{S2}、- OC(O)NR^{S2}、- N(R^{S2})C(O)OR^{S2}、- N(R^{S2})C(O)NR^{S2}、- N(R^{S2})S(O)₂R^{S2}、- OP(O)(OR^{S2})₂ または - CH₂ - OP(O)(OR^{S2}) である、- R^Z 基により置換されてもよく、ここで各アルキル、ハロアルキルおよびアルコキシは、1 または 2 個の - R^{Z2} 基で置換されてもよく；

ここで、R^{S2} は、各々独立して、水素、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ ハロアルキル、- (C₀ - C₆ アルキル) - Ar、- (C₀ - C₆ アルキル) - Het、- (C₀ - C₆ アルキル) - Cak、または - (C₀ - C₆ アルキル) - Hca であり、ここで Ar、Het、Cak、Hca、アルキルおよびハロアルキルは、C₁ - C₆ アルキル、ハロゲン、C₁ - C₆ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよく；および

- R^{Z2} は、各々独立して、ハロゲン、シアノ、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ ハロアルキル、- C₁ - C₆ アルコキシ、- OR^{S3}、- SR^{S3}、- NR^{S3}、- C(O)R^{S3}、- C(O)OR^{S3}、- C(O)NR^{S3}、- S(O)₂NR^{S3}、- S(O)₂R^{S3}、- OC(O)R^{S3}、- N(R^{S3})C(O)R^{S3}、- OC(O)OR^{S3}、- OC(O)NR^{S3}、- N(R^{S3})C(O)OR^{S3}、- N(R^{S3})C(O)NR^{S3}、- N(R^{S3})S(O)₂R^{S3}、- OP(O)(OR^{S3})₂ または - CH₂ - OP(O)(OR^{S3}) である、- R^Z 基により置換されてもよく；

$\text{O})_2 \text{R}^{\text{S}3}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{\text{S}3}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{S}3})\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{S}3}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{OR}^{\text{S}3}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^{\text{S}3}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{S}3})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{\text{S}3}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{S}3})\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{S}3}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{S}3})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{\text{S}3}$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}^{\text{S}3})_2$ または $-\text{CH}_2-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}^{\text{S}3})$ であり；および

ここで、 $\text{R}^{\text{S}3}$ は、各々独立して、水素、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-(\text{C}_0 - \text{C}_6 \text{ アルキル}) - \text{Ar}$ 、 $-(\text{C}_0 - \text{C}_6 \text{ アルキル}) - \text{Het}$ 、 $-(\text{C}_0 - \text{C}_6 \text{ アルキル}) - \text{Cak}$ 、または $-(\text{C}_0 - \text{C}_6 \text{ アルキル}) - \text{Hca}$ であり、ここで Ar 、 Het 、 Cak 、 Hca 、アルキル、およびハロアルキルは、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、ハロゲン、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよい]

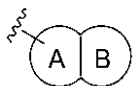
で示される化合物、あるいはその医薬的に許容される塩、プロドラッグもしくは N - オキシド、またはそれらの溶媒和物もしくは水和物；

ただし、該化合物は 5 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) - 1 H - インダゾール以外の化合物。

【請求項 3】

Z が、式：

【化 5】



[式中

- (1) 環 A は Ar または 6 員の Het であり、
環 B は 6 員の Het であるか；または
(2) 環 A は 6 員の Het であり、
環 B は 5 員の Het である]

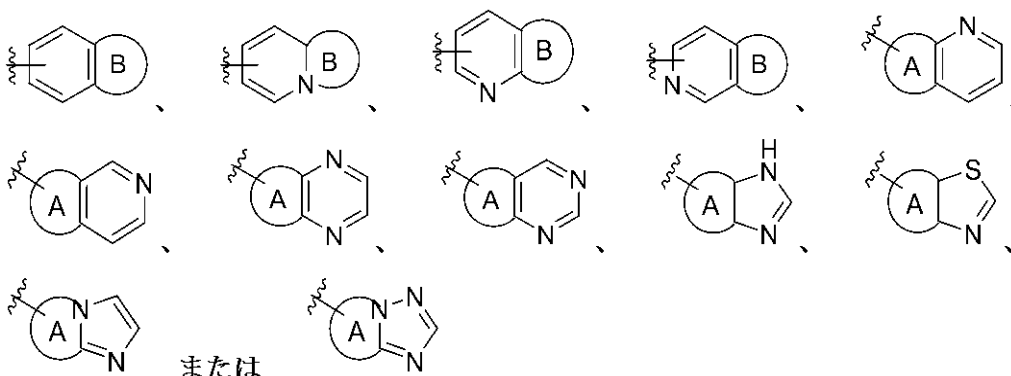
で示される縮合した二環式環であり；

ここで、Z は 1 または 2 個の $-\text{R}^{\text{Z}}$ 基で置換されてもよい、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

Z が

【化 6】



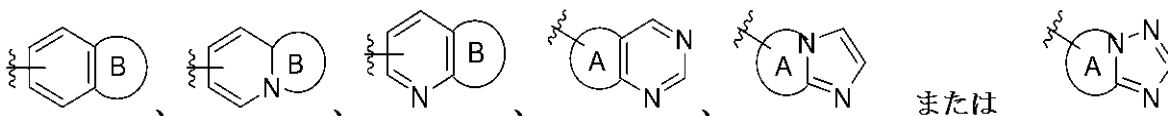
であり；

ここで、Z は 1 または 2 個の $-\text{R}^{\text{Z}}$ 基で置換されてもよい、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 5】

Z が

【化 7】



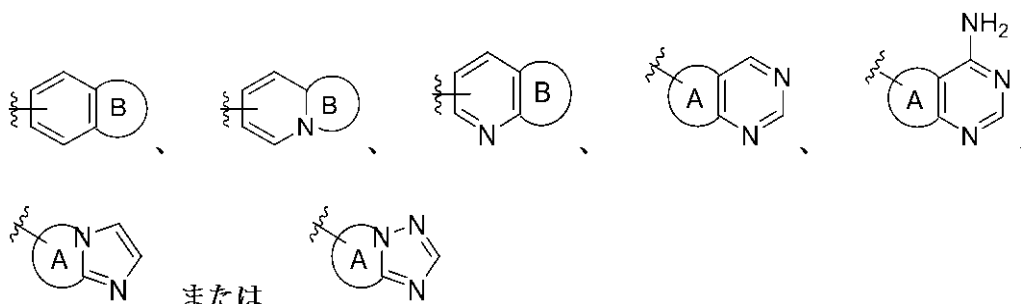
であり；

ここで、Z は 1 または 2 個の $-\text{R}^{\text{Z}}$ 基で置換されてもよい、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 6】

Z が

【化 8】

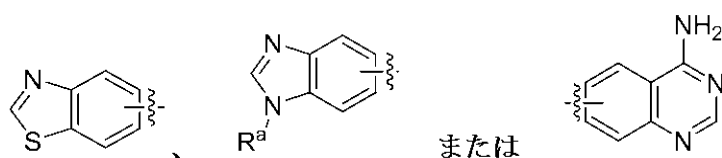


である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 7】

Z が

【化 9】

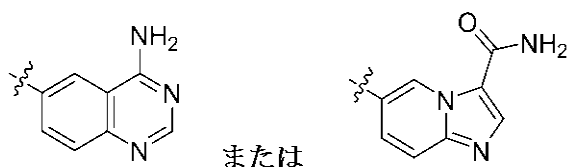


である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 8】

Z が

【化 10】



である、請求項 1 に記載の化合物。

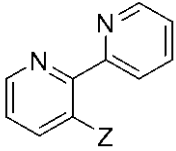
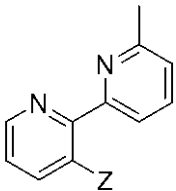
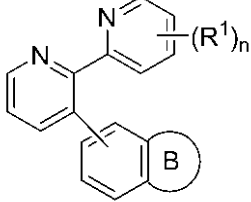
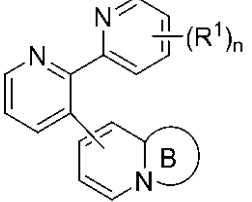
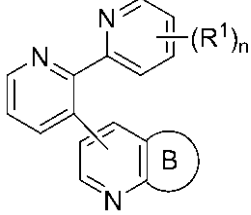
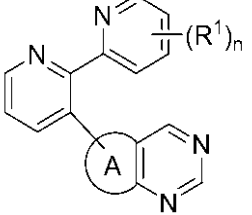
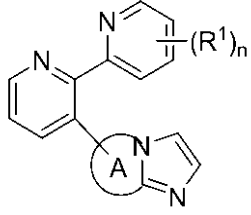
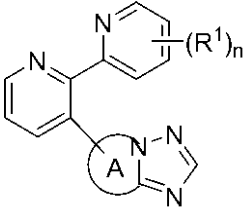
【請求項 9】

n が 1 または 2 であり、 R^1 が、各々独立して、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキルまたは C_{3-8} シクロアルキルである、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 10】

構造式 (I a) - (I h) :

【表 1】

			
(Ia)	(Ib)	(Ic)	(Id)
			
(Ie)	(If)	(Ig)	(Ih)

で示される 1 の化合物である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 11】

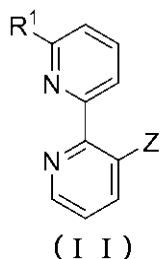
4 - (6' - メチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) キノリン ;
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) キナゾリン - 4 - アミン ;
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) キナゾリン - 4 - アミニウム 2, 2, 2 - トリフルオロアセタート ;
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) キナゾリン - 4 - アミニウム ホルマート ;
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル ;
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン ;
 7 - (6' - メチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン ;
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド ;
 6 - ([2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル ;
 6 - ([2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン ;
 6 - ([2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド ;
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) ピリド [3, 2 - d] ピリミジン - 4 - アミン ;
 6 - (6' - フルオロ - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) キナゾリン - 4 - アミン ;
 6 - (6' - フルオロ - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) キナゾリン - 4 - アミニウム 2, 2, 2 - トリフルオロアセタート ;
 6 - ([2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) キナゾリン - 4 - アミン ; または
 6 - ([2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) キナゾリン - 4 - アミニウム ホルマート

である化合物、あるいはその医薬的に許容される塩、プロドラッグもしくはN - オキシドまたはそれらの溶媒和物もしくは水和物。

【請求項 1 2】

構造式 (I I) :

【化 1 1】

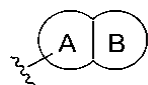


[式中

R¹ は水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ - C₆ アルキルまたは C₁ - C₆ ハロアルキルであり；

Z は、式：

【化 1 2】



(式中

環 A は A r または 6 員の H e t であり、

環 B は 5 員または 6 員の H e t である)

で示される縮合した二環式環であり、

ここで

Z は、1 または 2 個の、各々独立して、ハロゲン、シアノ、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ ハロアルキル、- C₁ - C₆ アルコキシ、- O R^{S 2}、- S R^{S 2}、- N R^{S 2}、- C (O) R^{S 2}、- C (O) O R^{S 2}、- C (O) N R^{S 2}、- S (O)₂ N R^{S 2}、- S (O)₂ R^{S 2}、- O C (O) R^{S 2}、- N (R^{S 2}) C (O) R^{S 2}、- O C (O) O R^{S 2}、- O C (O) N R^{S 2}、- N (R^{S 2}) C (O) O R^{S 2}、- N (R^{S 2}) C (O) N R^{S 2}、- N (R^{S 2}) S (O)₂ R^{S 2}、- O P (O) (O R^{S 2})₂ または - C H₂ - O P (O) (O R^{S 2}) である、- R^Z 基で置換されてもよく；

ここで、R^{S 2} は、各々独立して、水素、C₁ - C₆ アルキル、C₁ - C₆ ハロアルキル、- (C₀ - C₆ アルキル) - A r、- (C₀ - C₆ アルキル) - H e t、- (C₀ - C₆ アルキル) - C a k、または - (C₀ - C₆ アルキル) - H c a であり、ここで A r、H e t、C a k、H c a、アルキル、およびハロアルキルは、C₁ - C₆ アルキル、ハロゲン、C₁ - C₆ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよい]

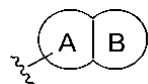
で示される化合物、あるいはその医薬的に許容される塩、プロドラッグもしくはN - オキシド、またはそれらの溶媒和物もしくは水和物；

ただし、5 - (6 ' - メチル - [2 , 2 ' - ビピリジン] - 3 - イル) - 1 H - インダゾール以外の化合物。

【請求項 1 3】

Z が、式：

【化 1 3】



[式中

(1) 環 A は A r または 6 員の H e t であり、

環 B は 6 員の H e t であるか ; または
 (2) 環 A は 6 員の H e t であり、
 環 B は 5 員の H e t である]

で示される縮合した二環式環であり、

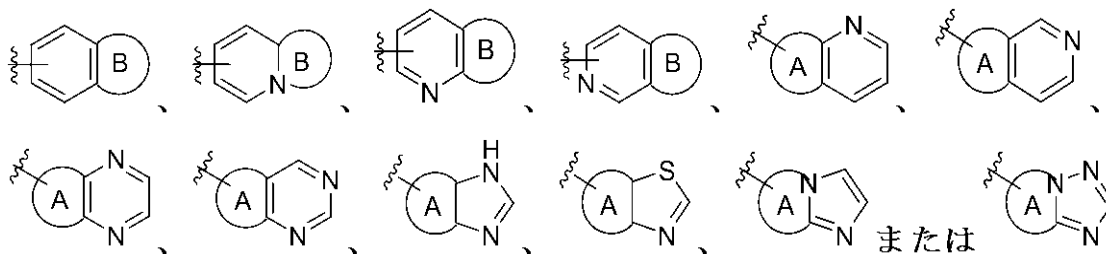
ここで、Z は 1 または 2 個の - R ² 基で置換されてもよい、請求項 1 2 に記載の化合物

。

【請求項 1 4】

Z が

【化 1 4】



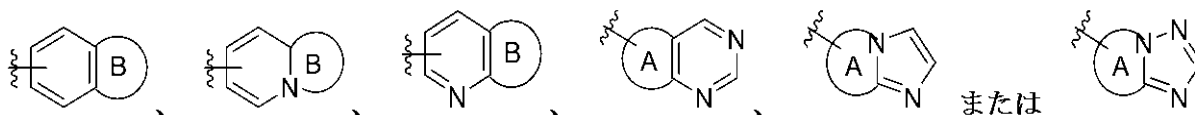
であり ;

ここで、Z は、1 または 2 個の - R ² 基で置換されてもよい、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

Z が

【化 1 5】



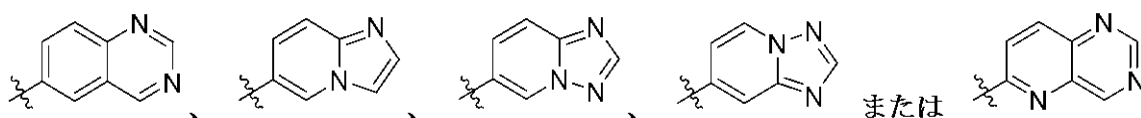
であり ;

ここで、Z は、1 または 2 個の - R ² 基で置換されてもよい、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 1 6】

Z が

【化 1 6】



であり ;

ここで、Z は、1 または 2 個の - R ² 基で置換されてもよい、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 1 7】

Z が置換されていない、請求項 1 2 に記載の化合物。

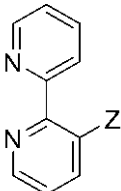
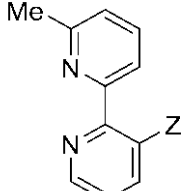
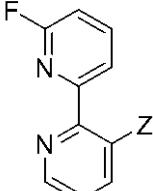
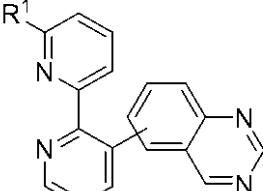
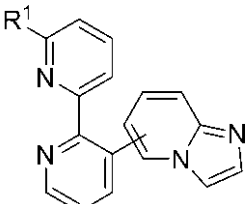
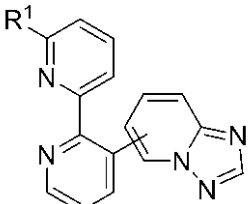
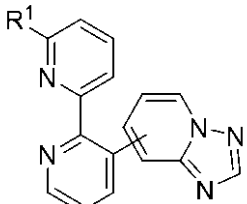
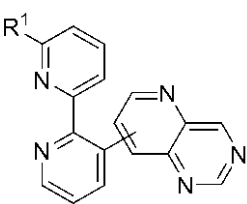
【請求項 1 8】

R ¹ が水素またはメチルである、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 1 9】

構造式 (I I a) - (I I h) :

【表 2】

			
(IIa)	(IIb)	(IIc)	(IIId)
			
(IIe)	(IIIf)	(IIg)	(IIh)

で示される 1 の化合物である、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 20】

6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) キナゾリン - 4 - アミン ;
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) キナゾリン - 4 - アミニウム 2, 2, 2 - トリフルオロアセタート ;
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル ;
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン ;
 7 - (6' - メチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン ;
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド ;
 6 - ([2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド ;
 6 - (6' - フルオロ - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) キナゾリン - 4 - アミン ;
 6 - (6' - フルオロ - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) キナゾリン - 4 - アミニウム 2, 2, 2 - トリフルオロアセタート ;
 6 - ([2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) キナゾリン - 4 - アミン ;
 6 - ([2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) キナゾリン - 4 - アミニウム ホルマー ト

である化合物、あるいはその医薬的に許容される塩、プロドラッグもしくは N - オキシドまたはそれらの溶媒和物もしくは水和物。

【請求項 21】

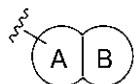
請求項 1 - 20 のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩と、医薬的に許容される担体、賦形剤または希釈剤とを含む、医薬組成物。

【請求項 22】

式 (I) :

(I)

【化 1 8】



- R^{Z 2} は、各々独立して、ハロゲン、シアノ、C₁ - 6 アルキル、C₁ - 6 ハロアルキル、- C₁ - C₆ アルコキシ、- OR^{S 3}、- SR^{S 3}、- NR^{S 3}₂、- C(O)R^{S 3}、- C(O)OR^{S 3}、- C(O)NR^{S 3}₂、- S(O)₂NR^{S 3}₂、- S(

$\text{O})_2 \text{R}^{\text{S}3}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{\text{S}3}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{S}3})\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{S}3}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{OR}^{\text{S}3}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^{\text{S}3}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{S}3})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{\text{S}3}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{S}3})\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{S}3}_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{S}3})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{\text{S}3}$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}^{\text{S}3})_2$ または $-\text{CH}_2-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}^{\text{S}3})$ であり；および

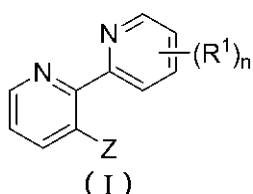
ここで、 $\text{R}^{\text{S}3}$ は、各々独立して、水素、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-(\text{C}_0 - \text{C}_6 \text{ アルキル}) - \text{Ar}$ 、 $-(\text{C}_0 - \text{C}_6 \text{ アルキル}) - \text{Het}$ 、 $-(\text{C}_0 - \text{C}_6 \text{ アルキル}) - \text{Cak}$ 、または $-(\text{C}_0 - \text{C}_6 \text{ アルキル}) - \text{Hca}$ であり、ここで Ar 、 Het 、 Cak 、 Hca 、アルキル、およびハロアルキルは、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、ハロゲン、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよい]

で示される構造を有する化合物、あるいはその医薬的に許容される塩、プロドラッグもしくは N -オキシド、またはそれらの溶媒和物もしくは水和物を含む、GDF-8 阻害剤。

【請求項 23】

式 (I) :

【化 19】



[式中

n は 0、1、2、3 または 4 であり；

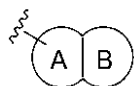
R^1 は水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ シクロアルキル、 $\text{C}_3 - \text{C}_8$ シクロアルケニル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、 $-\text{R}^a$ 、または $-\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル $-\text{R}^a$ であり、ここで R^a は $-\text{OR}^{\text{S}1}$ 、 $-\text{SR}^{\text{S}1}$ 、 $-\text{NR}^{\text{S}1}\text{R}^{\text{S}1}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{S}1}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{\text{S}1}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{S}1}\text{R}^{\text{S}1}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{\text{S}1}\text{R}^{\text{S}1}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{\text{S}1}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{S}1})\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{S}1}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{OR}^{\text{S}1}$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{S}1}\text{R}^{\text{S}1}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{S}1})\text{C}(\text{O})\text{OR}^{\text{S}1}$ 、 $-\text{N}(\text{R})\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{S}1}\text{R}^{\text{S}1}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{S}1})\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{\text{S}1}\text{R}^{\text{S}1}$ または $-\text{N}(\text{R}^{\text{S}1})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{\text{S}1}$ であり；

ここで、 m は 0、1、2 または 3 であり；および

ここで、 $\text{R}^{\text{S}1}$ は、各々独立して、水素、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-(\text{C}_0 - \text{C}_6 \text{ アルキル}) - \text{Ar}$ 、 $-(\text{C}_0 - \text{C}_6 \text{ アルキル}) - \text{Het}$ 、 $-(\text{C}_0 - \text{C}_6 \text{ アルキル}) - \text{Cak}$ 、または $-(\text{C}_0 - \text{C}_6 \text{ アルキル}) - \text{Hca}$ であり、ここで Ar 、 Het 、 Cak 、 Hca 、アルキルおよびハロアルキルは、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、ハロゲン、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよく；

Z は、式：

【化 20】



(式中

環 A は Ar または 6 員の Het であり、

環 B は 5 または 6 員の Het である)

で示される縮合した二環式環であり；

ここで

Z は、1 または 2 個の、各々独立して、ハロゲン、シアノ、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキル、 $-\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルコキシ、 $-\text{OR}^{\text{S}2}$ 、 $-\text{SR}^{\text{S}2}$ 、 $-\text{NR}^{\text{S}2}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{S}2}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{\text{S}2}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{S}2}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{\text{S}2}_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{\text{S}2}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{\text{S}2}$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{\text{S}2})\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{S}2}$ 、 $-\text{OC}$

(O)OR^{S 2}、-OC(O)NR^{S 2}₂、-N(R^{S 2})C(O)OR^{S 2}、-N(R^{S 2})C(O)NR^{S 2}₂、-N(R^{S 2})S(O)₂R^{S 2}、-OP(O)(OR^{S 2})₂または-CH₂-OP(O)(OR^{S 2})である、-R^Z基で置換されてもよく、ここで各アルキル、ハロアルキルおよびアルコキシは、1または2個の-R^Z基で置換されてもよく；

ここで、R^{S 2}は、各々独立して、水素、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆ハロアルキル、-(C₀-C₆アルキル)-Ar、-(C₀-C₆アルキル)-Het、-(C₀-C₆アルキル)-Cak、または-(C₀-C₆アルキル)-Hcaであり、ここでAr、Het、Cak、Hca、アルキルおよびハロアルキルは、C₁-C₆アルキル、ハロゲン、C₁-C₆ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよく；および

-R^Zは、各々独立して、ハロゲン、シアノ、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆ハロアルキル、-C₁-C₆アルコキシ、-OR^{S 3}、-SR^{S 3}、-NR^{S 3}₂、-C(O)R^{S 3}、-C(O)OR^{S 3}、-C(O)NR^{S 3}₂、-S(O)₂NR^{S 3}₂、-S(O)₂R^{S 3}、-OC(O)R^{S 3}、-N(R^{S 3})C(O)R^{S 3}、-OC(O)OR^{S 3}、-OC(O)NR^{S 3}₂、-N(R^{S 3})C(O)OR^{S 3}、-N(R^{S 3})C(O)NR^{S 3}₂、-N(R^{S 3})S(O)₂R^{S 3}、-OP(O)(OR^{S 3})₂または-CH₂-OP(O)(OR^{S 3})であり；および

ここで、R^{S 3}は、各々独立して、水素、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆ハロアルキル、-(C₀-C₆アルキル)-Ar、-(C₀-C₆アルキル)-Het、-(C₀-C₆アルキル)-Cak、または-(C₀-C₆アルキル)-Hcaであり、ここでAr、Het、Cak、Hca、アルキル、およびハロアルキルは、C₁-C₆アルキル、ハロゲン、C₁-C₆ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよい]

で示される構造を有する化合物、あるいはその医薬的に許容される塩、プロドラッグもしくはN-オキシド、またはそれらの溶媒和物もしくは水和物を含む、疾患または障害に罹患する患者における筋肉組織の量または強度を増加させるための医薬組成物。

【請求項 24】

疾患または障害が、筋肉障害、脂肪組織障害、神経筋障害、代謝性障害、糖尿病、または骨変性障害である、請求項 23 に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

疾患または障害が筋肉障害である、請求項 23 に記載の医薬組成物。

【請求項 26】

疾患または障害が、筋ジストロフィー、筋萎縮、鬱血性閉塞性肺疾患、筋肉疲労症候群、サルコペニアまたは悪液質である、請求項 23 に記載の医薬組成物。

【請求項 27】

疾患または障害が筋ジストロフィーである、請求項 23 に記載の医薬組成物。

【請求項 28】

疾患または障害が、肥満、2型糖尿病、耐糖能異常、シンドローム X、外傷により誘発されるインスリン耐性、または骨粗鬆症である、請求項 23 に記載の医薬組成物。

【請求項 29】

疾患または障害が骨粗鬆症である、請求項 23 に記載の医薬組成物。

【請求項 30】

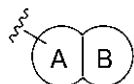
疾患または障害が、グルココルチコイドの長期治療に起因する骨量の低下、早期性腺機能不全、アンドロゲン抑制、ビタミンD欠乏症、二次性副甲状腺機能亢進症、栄養失調、および神経性食欲不振である、請求項 23 に記載の医薬組成物。

【請求項 31】

式(I)：

c1ccc2c(c1)c(c3ccccc32)C(=O)O

【化 2 2】



- R^{Z 2} は、各々独立して、ハロゲン、シアノ、C₁ - 6 アルキル、C₁ - 6 ハロアルキル、- C₁ - C₆ アルコキシ、- OR^{S 3}、- SR^{S 3}、- NR^{S 3}₂、- C(O)R^{S 3}、- C(O)OR^{S 3}、- C(O)NR^{S 3}₂、- S(O)₂NR^{S 3}₂、- S(

$O)_2 R^{S^3}$ 、 $-OC(O)R^{S^3}$ 、 $-N(R^{S^3})C(O)R^{S^3}$ 、 $-OC(O)OR^{S^3}$ 、 $-OC(O)NR^{S^3}_2$ 、 $-N(R^{S^3})C(O)OR^{S^3}$ 、 $-N(R^{S^3})C(O)NR^{S^3}_2$ 、 $-N(R^{S^3})S(O)_2 R^{S^3}$ 、 $-OP(O)(OR^{S^3})_2$ または $-CH_2-OP(O)(OR^{S^3})$ であり；および

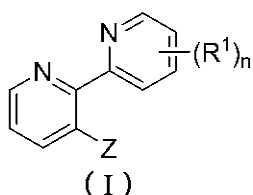
ここで、 R^{S^3} は、各々独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Ar$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Het$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Cak$ 、または $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Hca$ であり、ここで Ar 、 Het 、 Cak 、 Hca 、アルキル、およびハロアルキルは、 $C_1 - C_6$ アルキル、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよい]

で示される構造を有する化合物、あるいはその医薬的に許容される塩、プロドラッグもしくは N -オキシド、またはそれらの溶媒和物もしくは水和物を含む、哺乳動物における筋肉量を増加させるための治療剤。

【請求項 3 2】

式 (I)：

【化 2 3】



[式中

n は 0、1、2、3 または 4 であり；

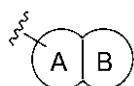
R^1 は水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルケニル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、 $-R^a$ 、または $-C_1 - C_6$ アルキル $-R^a$ であり、ここで R^a は $-OR^{S^1}$ 、 $-SR^{S^1}$ 、 $-NR^{S^1}R^{S^1}$ 、 $-C(O)R^{S^1}$ 、 $-C(O)OR^{S^1}$ 、 $-C(O)NR^{S^1}R^{S^1}$ 、 $-S(O)_2 NR^{S^1}R^{S^1}$ 、 $-OC(O)R^{S^1}$ 、 $-N(R^{S^1})C(O)R^{S^1}$ 、 $-OC(O)OR^{S^1}$ 、 $-O(CH_2)_m C(O)NR^{S^1}R^{S^1}$ 、 $-N(R^{S^1})C(O)OR^{S^1}$ 、 $-N(R)C(O)NR^{S^1}R^{S^1}$ 、 $-N(R^{S^1})S(O)_2 NR^{S^1}R^{S^1}$ または $-N(R^{S^1})S(O)_2 R^{S^1}$ であり；

ここで、 m は 0、1、2 または 3 であり；および

ここで、 R^{S^1} は、各々独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Ar$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Het$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Cak$ 、または $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Hca$ であり、ここで Ar 、 Het 、 Cak 、 Hca 、アルキルおよびハロアルキルは、 $C_1 - C_6$ アルキル、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよく；

Z は、式：

【化 2 4】



(式中

環 A は Ar または 6 員の Het であり、

環 B は 5 または 6 員の Het である)

で示される縮合した二環式環であり；

ここで

Z は、1 または 2 個の、各々独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-C_1 - C_6$ アルコキシ、 $-OR^{S^2}$ 、 $-SR^{S^2}$ 、 $-NR^{S^2}_2$ 、 $-C(O)R^{S^2}$ 、 $-C(O)OR^{S^2}$ 、 $-C(O)NR^{S^2}_2$ 、 $-S(O)_2 NR^{S^2}$

2 、 $-S(O)_2R^{S2}$ 、 $-OC(O)R^{S2}$ 、 $-N(R^{S2})C(O)R^{S2}$ 、 $-OC(O)OR^{S2}$ 、 $-OC(O)NR^{S2}$ 、 $-N(R^{S2})C(O)OR^{S2}$ 、 $-N(R^{S2})C(O)NR^{S2}$ 、 $-N(R^{S2})S(O)_2R^{S2}$ 、 $-OP(O)(OR^{S2})_2$ または $-CH_2-OP(O)(OR^{S2})$ である、 $-R^Z$ 基で置換されてもよく、ここで各アルキル、ハロアルキルおよびアルコキシは、1 または 2 個の $-R^Z$ 基で置換されてもよく；

ここで、 R^{S2} は、各々独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Ar$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Het$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Cak$ 、または $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Hca$ であり、ここで Ar 、 Het 、 Cak 、 Hca 、アルキルおよびハロアルキルは、 $C_1 - C_6$ アルキル、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよく；および

$-R^Z$ は、各々独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-C_1 - C_6$ アルコキシ、 $-OR^{S3}$ 、 $-SR^{S3}$ 、 $-NR^{S3}$ 、 $-C(O)R^{S3}$ 、 $-C(O)OR^{S3}$ 、 $-C(O)NR^{S3}$ 、 $-S(O)_2NR^{S3}$ 、 $-S(O)_2R^{S3}$ 、 $-OC(O)R^{S3}$ 、 $-N(R^{S3})C(O)R^{S3}$ 、 $-OC(O)OR^{S3}$ 、 $-OC(O)NR^{S3}$ 、 $-N(R^{S3})C(O)OR^{S3}$ 、 $-N(R^{S3})C(O)NR^{S3}$ 、 $-N(R^{S3})S(O)_2R^{S3}$ 、 $-OP(O)(OR^{S3})_2$ または $-CH_2-OP(O)(OR^{S3})$ であり；および

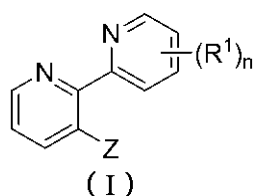
ここで、 R^{S3} は、各々独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Ar$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Het$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Cak$ 、または $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Hca$ であり、ここで Ar 、 Het 、 Cak 、 Hca 、アルキル、およびハロアルキルは、 $C_1 - C_6$ アルキル、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよい]

で示される構造を有する化合物、あるいはその医薬的に許容される塩、プロドラッグもしくは N - オキシド、またはそれらの溶媒和物もしくは水和物を含む、哺乳動物における筋力を増大させるための治療剤。

【請求項 33】

式 (I)：

【化 25】



[式中

n は 0、1、2、3 または 4 であり；

R^1 は水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルケニル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、 $-R^a$ 、または $-C_1 - C_6$ アルキル $-R^a$ であり、ここで R^a は $-OR^{S1}$ 、 $-SR^{S1}$ 、 $-NR^{S1}R^{S1}$ 、 $-C(O)R^{S1}$ 、 $-C(O)OR^{S1}$ 、 $-C(O)NR^{S1}R^{S1}$ 、 $-S(O)_2NR^{S1}R^{S1}$ 、 $-OC(O)R^{S1}$ 、 $-N(R^{S1})C(O)R^{S1}$ 、 $-OC(O)OR^{S1}$ 、 $-O(CH_2)_mC(O)NR^{S1}R^{S1}$ 、 $-N(R^{S1})C(O)OR^{S1}$ 、 $-N(R)C(O)NR^{S1}R^{S1}$ 、 $-N(R^{S1})S(O)_2NR^{S1}R^{S1}$ または $-N(R^{S1})S(O)_2R^{S1}$ であり；

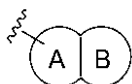
ここで、 m は 0、1、2 または 3 であり；および

ここで、 R^{S1} は、各々独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Ar$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Het$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Cak$ 、または $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Hca$ であり、ここで Ar 、 Het 、 Cak 、 Hca 、アルキルおよびハロアルキルは、 $C_1 - C_6$ アルキル、ハ

ロゲン、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよく；

Z は、式：

【化 2 6】



(式中

環 A は Ar または 6 員の Het であり、

環 B は 5 または 6 員の Het である)

で示される縮合した二環式環であり；

ここで

Z は、1 または 2 個の、各々独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-C_1 - C_6$ アルコキシ、 $-OR^{S2}$ 、 $-SR^{S2}$ 、 $-NR^{S2}_2$ 、 $-C(O)R^{S2}$ 、 $-C(O)OR^{S2}$ 、 $-C(O)NR^{S2}_2$ 、 $-S(O)_2NR^{S2}_2$ 、 $-S(O)_2R^{S2}$ 、 $-OC(O)R^{S2}$ 、 $-N(R^{S2})C(O)R^{S2}$ 、 $-OC(O)OR^{S2}$ 、 $-OC(O)NR^{S2}_2$ 、 $-N(R^{S2})C(O)OR^{S2}$ 、 $-N(R^{S2})C(O)NR^{S2}_2$ 、 $-N(R^{S2})S(O)_2R^{S2}$ 、 $-OP(O)(OR^{S2})_2$ または $-CH_2 - OP(O)(OR^{S2})$ である、 $-R^Z$ 基で置換されてもよく、ここで各アルキル、ハロアルキルおよびアルコキシは、1 または 2 個の $-R^Z$ 基で置換されてもよく；

ここで、 R^{S2} は、各々独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Ar$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Het$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Cak$ 、または $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Hca$ であり、ここで Ar、Het、Cak、Hca、アルキルおよびハロアルキルは、 $C_1 - C_6$ アルキル、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよく；および

$-R^Z$ は、各々独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-C_1 - C_6$ アルコキシ、 $-OR^{S3}$ 、 $-SR^{S3}$ 、 $-NR^{S3}_2$ 、 $-C(O)R^{S3}$ 、 $-C(O)OR^{S3}$ 、 $-C(O)NR^{S3}_2$ 、 $-S(O)_2NR^{S3}_2$ 、 $-S(O)_2R^{S3}$ 、 $-OC(O)R^{S3}$ 、 $-N(R^{S3})C(O)R^{S3}$ 、 $-OC(O)OR^{S3}$ 、 $-OC(O)NR^{S3}_2$ 、 $-N(R^{S3})C(O)OR^{S3}$ 、 $-N(R^{S3})C(O)NR^{S3}_2$ 、 $-N(R^{S3})S(O)_2R^{S3}$ 、 $-OP(O)(OR^{S3})_2$ または $-CH_2 - OP(O)(OR^{S3})$ であり；および

ここで、 R^{S3} は、各々独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Ar$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Het$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Cak$ 、または $-(C_0 - C_6 \text{ アルキル}) - Hca$ であり、ここで Ar、Het、Cak、Hca、アルキル、およびハロアルキルは、 $C_1 - C_6$ アルキル、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよい]

で示される構造を有する化合物、あるいはその医薬的に許容される塩、プロドラッグもしくは N - オキシド、またはそれらの溶媒和物もしくは水和物を含む、骨梁密度の増加を必要とする患者においてそれを増加させるための治療剤。

【請求項 3 4】

患者が哺乳動物である、請求項 2 3 - 3 0 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 3 5】

哺乳動物がヒトである、請求項 3 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 6】

構造式 (I i) - (I m)、(I I i) - (I I k) および (I I I)：

【表 3】

(Ii)	(Ij)	(Ik)	(Il)
(Im)	(Ili)	(Ilj)	(Illk)
(III)			

で示される 1 の化合物である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 37】

6 - ([2 , 2 ' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル

6 - (6 ' - (トリフルオロメチル) - [2 , 2 ' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル

6 - (5 ' - フルオロ - 6 ' - メチル - [2 , 2 ' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル

6 - (4 ' - フルオロ - [2 , 2 ' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル

6 - (6 ' - メトキシ - [2 , 2 ' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル

6 - (6 ' - (トリフルオロメチル) - [2 , 2 ' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド

6 - (5 ' - フルオロ - 6 ' - メチル - [2 , 2 ' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド

6 - (5 ' - フルオロ - [2 , 2 ' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル

6 - (5 ' - フルオロ - [2 , 2 ' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド

6 - (4 ' - フルオロ - [2 , 2 ' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド

6 - (6' - (ジフルオロメチル) - 5' - フルオロ - [2, 2' - ビピリジン] - 3
 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (6' - (ジフルオロメチル) - 5' - フルオロ - [2, 2' - ビピリジン] - 3
 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 メチル 3' - (3 - シアノイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 6 - イル) - [2, 2' -
 - ビピリジン] - 5 - カルボキシラート
 メチル 3' - (3 - カルバモイルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 6 - イル) - [2, 2' -
 - ビピリジン] - 5 - カルボキシラート
 3' - (3 - カルバモイルイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 6 - イル) - [2, 2' -
 - ビピリジン] - 5 - カルボン酸
 6 - (6' - (ジフルオロメチル) - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ
 [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (6' - (ジフルオロメチル) - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ
 [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (6' - エチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピ
 リジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (6' - イソプロピル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 -
 a] ピリジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (6' - イソプロピル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 -
 a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (6' - メトキシ - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a]
 ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (6' - シクロプロピル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2
 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (6' - シクロプロピル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2
 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (6' - フルオロ - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a]
 ピリジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (6' - フルオロ - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a]
 ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (6' - (ベンジルオキシ) - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a]
 ピリジン - 3 - カルボニトリル
 6 - ([2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カ
 ルボキシアミド
 6 - (6' - アセチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a]
 ピリジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (6' - 6 - (6' - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - [2, 2' - ビピ
 リジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (4', 6' - ジメチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2
 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (5' - フルオロ - 6' - メチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダ
 ザ [1, 2 - b] ピリダジン - 3 - カルボキシアミド
 N - (3' - (3 - シアノイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 6 - イル) - [2, 2' -
 - ビピリジン] - 6 - イル) メタンスルホンアミド
 N - (3' - (3 - シアノイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 6 - イル) - [2, 2' -
 - ビピリジン] - 6 - イル) アセトアミド
 6 - (6' - クロロ - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピ
 リジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビピリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピ
 リジン

6 - (6' - (ジフルオロメチル) - 5' - フルオロ - [2, 2' - ビビリジン] - 3
 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン
 6 - (6' - (ジフルオロメチル) - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ
 [1, 2 - b] ピリダジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (6' - メトキシ - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - b]
 ピリダジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (6' - メトキシ - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - b]
 ピリダジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (6' - (ジフルオロメチル) - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ
 [1, 2 - b] ピリダジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (5' - フルオロ - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - b]
 ピリダジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (5' - フルオロ - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - b]
 ピリダジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (5' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - b] ピ
 リダジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (5' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - b] ピ
 リダジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - b] ピ
 リダジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - b] ピ
 リダジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (4' - フルオロ - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - b]
 ピリダジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (4' - フルオロ - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - b]
 ピリダジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (5' - フルオロ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダ
 ザ [1, 2 - b] ピリダジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (6' - イソプロピル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 -
 b] ピリダジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (6' - イソプロピル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 -
 b] ピリダジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (6' - フルオロ - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - b]
 ピリダジン - 3 - カルボニトリル
 2, 2, 2 - トリフルオロ - N - (6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3
 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - イル) アセトアミド
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピ
 リジン - 3 - カルボン酸
 N - (2, 2 - ジフルオロエチル) - 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] -
 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) - N - (2, 2, 2 - トリ
 フルオロエチル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 N - (2 - メトキシエチル) - 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 -
 イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 N - (²H₃) メチル - 6 - [2 - (6 - メチルピリジン - 2 - イル) ピリジン - 3 -
 イル] イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 メチル - 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2
 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - b] ピ
 リダジン - 3 - カルボン酸

6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) - N - (オキセタン - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - b] ピリダジン - 3 - カルボキシアミド
 N - シクロプロピル - 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - b] ピリダジン - 3 - カルボキシアミド
 N - (6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) アセトアミド
 N - (6 - (5' - フルオロ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - イル) アセトアミド
 6 - (5' - フルオロ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - カルボキシアミド
 6 - (6' - (トリフルオロメチル) - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - カルボキシアミド
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - カルボキシアミド
 6 - (5 - フルオロ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (5 - フルオロ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (6' - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (6' - (ジフルオロメチル) - 5 - フルオロ - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (5, 5' - ジフルオロ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (6, 6' - ジメチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (6, 6' - ジメチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (6' - (ジフルオロメチル) - 6 - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (6' - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (6' - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 メチル 3 - (3 - シアノイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 6 - イル) - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 4 - カルボキシラート
 6 - (4 - (ヒドロキシメチル) - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (4 - (ジフルオロメチル) - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボニトリル
 6 - (4 - (ジフルオロメチル) - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (6 - アセトアミド - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 N - (3 - (3 - シアノイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 6 - イル) - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 5 - イル) アセトアミド
 6 - (5 - アセトアミド - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (5 - アミノ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド

6 - (5 - アミノ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボン酸
 N - (3 - (3 - シアノイミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 6 - イル) - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 4 - イル) アセトアミド
 6 - (4 - アミノ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (4 - アセトアミド - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - カルボキシアミド
 6 - (5' - フルオロ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピリド [3, 2 - d] ピリミジン - 4 - アミン
 6 - (5' - フルオロ - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピリド [3, 2 - d] ピリミジン - 4 - アミン
 6 - (6' - (ジフルオロメチル) - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピリド [3, 2 - d] ピリミジン - 4 - アミン
 6 - (6' - シクロプロピル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピリド [3, 2 - d] ピリミジン - 4 - アミン
 6 - (6' - エチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) キナゾリン - 4 - アミン
 6 - (6' - イソプロピル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) キナゾリン - 4 - アミン
 6 - (6' - (ジフルオロメチル) - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) キナゾリン - 4 - アミン
 6 - (5' - フルオロ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - カルボキシアミド
 6 - (6' - イソプロピル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) キナゾリン - 4 - アミン
 6 - (5' - フルオロ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) キノキサリン
 6 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) キノキサリン
 6 - (6' - (トリフルオロメチル) - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) キノキサリン
 5 - (6' - (ジフルオロメチル) - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) - 1 H - インダゾール
 5 - (5' - フルオロ - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) - 1 H - インダゾール
 5 - (5' - フルオロ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) - 1 H - インダゾール
 3 - (ジフルオロメチル) - 5 - (6' - (ジフルオロメチル) - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) - 1 H - インダゾール
 5 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル
 5 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキシアミド
 5 - (6' - (トリフルオロメチル) - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル
 5 - (5' - フルオロ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボニトリル
 エチル 5 - (6' - (トリフルオロメチル) - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキシラート
 5 - (6' - (トリフルオロメチル) - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸
 N - メチル - 5 - (6' - (トリフルオロメチル) - [2, 2' - ビビリジン] - 3 -

イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキシアミド

N - シクロプロピル - 5 - (6' - (トリフルオロメチル) - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキシアミド

N - メチル - 5 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキシアミド

N - シクロプロピル - 5 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキシアミド

5 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) - N - (オキセタン - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキシアミド

エチル 5 - (5' - フルオロ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキシラート

5 - (5' - フルオロ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸

N - シクロプロピル - 5 - (5' - フルオロ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキシアミド

5 - (5' - フルオロ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) - N - (オキセタン - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキシアミド

エチル 5 - (6' - (ジフルオロメチル) - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボキシラート

5 - (6' - (ジフルオロメチル) - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン - 3 - カルボン酸

5 - (6' - (トリフルオロメチル) - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン

5 - (5' - フルオロ - 6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン

5 - (6' - メチル - [2, 2' - ビビリジン] - 3 - イル) ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン

である化合物、あるいはその医薬的に許容される塩、プロドラッグもしくはN - オキシドまたはそれらの溶媒和物もしくは水和物。

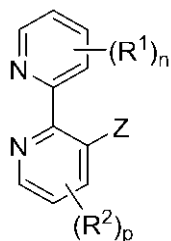
【請求項 38】

請求項 36 または 37 に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩と、医薬的に許容される担体、賦形剤または希釈剤とを含む、医薬組成物。

【請求項 39】

式 (I°) :

【化 27】



(I°)

[式中

n は 1、2、3 または 4 であり ;

R¹ は水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ - 6 アルキル、C₁ - 6 ハロアルキル、C₃ - 8 シクロアルキル、C₃ - 8 シクロアルケニル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、- Rᵃ、または - C₁ - 6 アルキル - Rᵃ であって、ここで、Rᵃ は - ORˢ¹、- SRˢ¹、- NRˢ¹Rˢ¹、- C(O)Rˢ¹、- C(O)ORˢ¹、- C(O)NRˢ¹Rˢ¹、- S(O)₂NRˢ¹Rˢ¹、- OC(O)Rˢ¹、- N(Rˢ¹

) $C(O)R^{S1}$ 、 $-OC(O)OR^{S1}$ 、 $-O(CH_2)_mC(O)NR^{S1}R^{S1}$ 、 $-N(R^{S1})C(O)OR^{S1}$ 、 $-N(R)C(O)NR^{S1}R^{S1}$ 、 $-N(R^{S1})S(O)_2NR^{S1}R^{S1}$ または $-N(R^{S1})S(O)_2R^{S1}$ であり；

ここで、 m は0、1、2または3であり；および

ここで、 R^{S1} は、各々独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-(C_0 - C_6 \text{アルキル}) - Ar$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{アルキル}) - Het$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{アルキル}) - Cak$ 、または $-(C_0 - C_6 \text{アルキル}) - Hca$ であり、ここで Ar 、 Het 、 Cak 、 Hca 、アルキル、およびハロアルキルは、 $C_1 - C_6$ アルキル、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよく；

p は1、2、3または4であり；

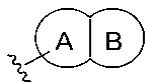
R^2 は水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルケニル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、 $-R^b$ 、または $-C_1 - C_6 \text{アルキル} - R^b$ であって、ここで R^b は $-OR^{S4}$ 、 $-SR^{S4}$ 、 $-NR^{S4}R^{S4}$ 、 $-C(O)R^{S4}$ 、 $-C(O)OR^{S4}$ 、 $-C(O)NR^{S4}R^{S4}$ 、 $-S(O)_2NR^{S4}R^{S4}$ 、 $-OC(O)R^{S4}$ 、 $-N(R^{S4})C(O)R^{S4}$ 、 $-OC(O)OR^{S4}$ 、 $-O(CH_2)_qC(O)NR^{S4}R^{S4}$ 、 $-N(R^{S4})C(O)OR^{S4}$ 、 $-N(R)C(O)NR^{S4}R^{S4}$ 、 $-N(R^{S4})S(O)_2NR^{S4}R^{S4}$ 、または $-N(R^{S4})S(O)_2R^{S4}$ であり；

ここで、 q は0、1、2または3であり；および

ここで、 R^{S4} は、各々独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-(C_0 - C_6 \text{アルキル}) - Ar$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{アルキル}) - Het$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{アルキル}) - Cak$ 、または $-(C_0 - C_6 \text{アルキル}) - Hca$ であり、ここで Ar 、 Het 、 Cak 、 Hca 、アルキル、およびハロアルキルは、 $C_1 - C_6$ アルキル、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよく；

Z は、式：

【化28】



(式中

環Aは Ar または6員の Het であり、

環Bは5または6員の Het である)

で示される縮合した二環式環であり；

ここで

Z は、1または2個の、各々が独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-C_1 - C_6 \text{アルコキシ}$ 、 $-OR^{S2}$ 、 $-SR^{S2}$ 、 $-NR^{S2}_2$ 、 $-C(O)R^{S2}$ 、 $-C(O)OR^{S2}$ 、 $-C(O)NR^{S2}_2$ 、 $-S(O)_2NR^{S2}_2$ 、 $-S(O)_2R^{S2}$ 、 $-OC(O)R^{S2}$ 、 $-N(R^{S2})C(O)R^{S2}$ 、 $-OC(O)OR^{S2}$ 、 $-OC(O)NR^{S2}_2$ 、 $-N(R^{S2})C(O)OR^{S2}$ 、 $-N(R^{S2})C(O)NR^{S2}_2$ 、 $-N(R^{S2})S(O)_2R^{S2}$ 、 $-OP(O)(OR^{S2})_2$ または $-CH_2 - OP(O)(OR^{S2})$ である、 $-R^Z$ 基により置換されてもよく、ここで各アルキル、ハロアルキルおよびアルコキシは、1または2個の $-R^Z$ 基で置換されてもよく；

ここで R^{S2} は、各々独立して、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_1 - C_6 \text{アルキル} - O - C_1 - C_6 \text{アルキル}$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{アルキル}) - Ar$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{アルキル}) - Het$ 、 $-(C_0 - C_6 \text{アルキル}) - Cak$ 、または $-(C_0 - C_6 \text{アルキル}) - Hca$ であって、ここで Ar 、 Het 、 Cak 、 Hca 、アルキルおよびハロアルキルは、 $C_1 - C_6$ アルキル、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよく；および

$-R^Z$ は、各々独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロア

ルキル、 $-C_1-C_6$ アルコキシ、 $-OR^{S3}$ 、 $-SR^{S3}$ 、 $-NR^{S3}_2$ 、 $-C(O)R^{S3}$ 、 $-C(O)OR^{S3}$ 、 $-C(O)NR^{S3}_2$ 、 $-S(O)_2NR^{S3}_2$ 、 $-S(O)_2R^{S3}$ 、 $-OC(O)R^{S3}$ 、 $-N(R^{S3})C(O)R^{S3}$ 、 $-OC(O)OR^{S3}$ 、 $-OC(O)NR^{S3}_2$ 、 $-N(R^{S3})C(O)OR^{S3}$ 、 $-N(R^{S3})C(O)NR^{S3}_2$ 、 $-N(R^{S3})S(O)_2R^{S3}$ 、 $-OP(O)(OR^{S3})_2$ または $-CH_2-OP(O)(OR^{S3})$ であり；および

ここで、 R^{S3} は、各々独立して、水素、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 ハロアルキル、 $-(C_0-C_6 \text{ アルキル})-Ar$ 、 $-(C_0-C_6 \text{ アルキル})-Het$ 、 $-(C_0-C_6 \text{ アルキル})-Cak$ 、または $-(C_0-C_6 \text{ アルキル})-Hca$ であって、ここで Ar 、 Het 、 Cak 、 Hca 、アルキルおよびハロアルキルは、 C_1-C_6 アルキル、ハロゲン、 C_1-C_6 ハロアルキルまたはシアノで置換されてもよい]

で示される化合物、あるいはその医薬的に許容される塩、プロドラッグもしくは N - オキシド、またはそれらの溶媒和物もしくは水和物を含む、GDF - 8 阻害剤。