

【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29年4月13日 (2017.4.13)

【公表番号】特表2016-514710(P2016-514710A)

【公表日】平成28年5月23日 (2016.5.23)

【年通号数】公開・登録公報2016-031

【出願番号】特願2016-503522(P2016-503522)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/4545 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 0 6 H

C 0 7 D 471/04 C S P

A 6 1 K 31/437

C 0 7 D 519/00 3 0 1

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/541

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 29/00 1 0 1

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29年3月8日 (2017.3.8)

【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】

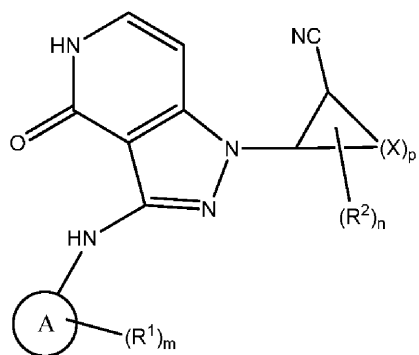
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

(式中、

【化 1】



A は、アリールおよびヘテロアリールから選択され；

X は、独立に、CH₂、NH、S および O から選択され、ここで少なくとも 1 つの X が CH₂ 以外であり；

n は、0、1、2、3 または 4 であり；

m は、0、1、2、3 または 4 であり；

p は、1、2、3、4 または 5 であり；

R¹ は、ハロゲン、オキソ (=O)、C₀₋₁₀ アルキルイミノ C₀₋₁₀ アルキル、C₁₋₁₀ アルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、C₁₋₁₀ ヘテロアルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、アリール C₀₋₁₀ アルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、C₃₋₁₂ シクロアルキル C₀₋₁₀ アルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、ヘテロアリール C₀₋₁₀ アルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、(C₃₋₁₂) ヘテロシクロアルキル C₀₋₁₀ アルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、C₀₋₁₀ アルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アミノ C₀₋₁₀ アルキル、(C₁₋₁₀) ヘテロアルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アミノ C₀₋₁₀ アルキル、C₃₋₁₂ シクロアルキル C₀₋₁₀ アルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アミノ C₀₋₁₀ アルキル、アリール C₀₋₁₀ アルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アミノ C₀₋₁₀ アルキル、ヘテロアリール C₀₋₁₀ アルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アミノ C₀₋₁₀ アルキル、(C₃₋₁₂) ヘテロシクロアルキル C₀₋₁₀ アルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アミノ C₀₋₁₀ アルキル、C₀₋₁₀ アルキルアミノ (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、(C₁₋₁₀) ヘテロアルキルアミノ (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、C₃₋₁₂ シクロアルキルアミノ (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、アリール C₀₋₁₀ アルキルアミノ (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、ヘテロアリール C₀₋₁₀ アルキルアミノ (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、(C₃₋₁₂) ヘテロシクロアルキルアミノ (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、C₀₋₁₀ アルキルスルホニル C₀₋₁₀ アルキル、C₁₋₁₀ ヘテロアルキルスルホニル C₀₋₁₀ アルキル、(C₃₋₁₂) シクロアルキル C₀₋₁₀ アルキルスルホニル C₀₋₁₀ アルキル、(C₃₋₁₂) シクロヘテロアルキル C₀₋₁₀ アルキルスルホニル C₀₋₁₀ アルキル、ヘテロアリール C₀₋₁₀ ア

ルキルスルホニル C_{0-10} アルキル、アリール C_{0-10} アルキルスルホニル C_{0-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルスルファモイル C_{0-10} アルキル、 C_{1-10} ヘテロアルキルスルファモイル C_{0-10} アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル C_{0-10} アルキルスルファモイル C_{0-10} アルキル、(C_{3-12}) シクロヘテロアルキル C_{0-10} アルキルスルファモイル C_{0-10} アルキル、ヘテロアリール C_{0-10} アルキルスルファモイル C_{0-10} アルキル、アリール C_{0-10} アルキルスルファモイル C_{0-10} アルキル、(C_{0-10} アルキル) $1-2$ アミノ、 $-CO_2$ (C_{0-10} アルキル)、 $-(C_{0-10}$ アルキル) CO_2H 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NH$ (C_{1-10} アルキル)、 $-SO_2N$ (C_{1-10} アルキル) 2 、 $-SO_2CF_3$ 、 $-SO_2CF_2H$ 、 C_{1-10} アルキルスルフィニル C_{0-10} アルキル、 C_{1-10} ヘテロアルキルスルフィニル C_{0-10} アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル C_{0-10} アルキルスルフィニル C_{0-10} アルキル、(C_{3-12}) シクロヘテロアルキル C_{0-10} アルキルスルフィニル C_{0-10} アルキル、ヘテロアリール C_{0-10} アルキルスルフィニル C_{0-10} アルキル、アリール C_{0-10} アルキルスルフィニル C_{0-10} アルキル、 C_{0-10} アルキルスルフィニルアミノ C_{0-10} アルキル、 C_{1-4} アシルアミノ C_{0-10} アルキル、チオ C_{1-10} アルキル、ヒドロキシ、 $-(C_{1-10}$ アルキル) OH 、 $-C_{0-10}$ アルキルアルコキシ、シアノ、(C_{1-6} アルキル) シアノおよび C_{1-6} ハロアルキルから選択され；

R^2 は、ハロゲン、オキソ ($=O$)、 C_{1-10} アルキル (オキシ) $0-1$ (カルボニル) $0-1$ C_{0-10} アルキル、 C_{3-12} シクロアルキル、(C_{3-12}) ヘテロシクロアルキル C_{0-10} アルキル (オキシ) $0-1$ (カルボニル) $0-1$ C_{0-10} アルキル、 C_{0-10} アルキルアミノ C_{0-10} アルキル、(C_{1-10}) ヘテロアルキルアミノ C_{0-10} アルキル、 C_{3-12} シクロアルキル C_{0-10} アルキルアミノ C_{0-10} アルキル、アリール C_{0-10} アルキルアミノ C_{0-10} アルキル、ヘテロアリール C_{0-10} アルキルアミノ C_{0-10} アルキル、(C_{3-12}) ヘテロシクロアルキル C_{0-10} アルキルアミノ C_{0-10} アルキル、 C_{1-10} アルキルスルホニル、(C_{3-12}) シクロアルキル C_{0-10} アルキルスルホニル、(C_{3-12}) シクロヘテロアルキル C_{0-10} アルキルスルホニル、(C_{0-10} アルキル) $1-2$ アミノ、 $-CO_2$ (C_{0-10} アルキル)、 $-(C_{0-10}$ アルキル) CO_2H 、 $-SO_2CF_3$ 、 $-SO_2CF_2H$ 、 C_{1-10} アルキルスルフィニル、ヒドロキシ、 $-(C_{1-10}$ アルキル) OH 、 $-C_{0-10}$ アルキルアルコキシ、シアノ、(C_{1-6} アルキル) シアノおよび C_{1-6} ハロアルキルから選択され、ここで R^1 および R^2 は、それぞれ、1、2、3または4個の R^3 置換基で置換されていてもよく；

R^3 は、独立に、ハロゲン、 C_{1-10} アルキル (オキシ) $0-1$ (カルボニル) $0-1$ C_{0-10} アルキル、 C_{1-10} ヘテロアルキル (オキシ) $0-1$ (カルボニル) $0-1$ C_{0-10} アルキル、アリール C_{0-10} アルキル (オキシ) $0-1$ (カルボニル) $0-1$ C_{0-10} アルキル、 C_{3-12} シクロアルキル C_{0-10} アルキル (オキシ) $0-1$ (カルボニル) $0-1$ C_{0-10} アルキル、ヘテロアリール C_{0-10} アルキル (オキシ) $0-1$ (カルボニル) $0-1$ C_{0-10} アルキル、(C_{3-12}) ヘテロシクロアルキル C_{0-10} アルキル (オキシ) $0-1$ (カルボニル) $0-1$ C_{0-10} アルキル、(C_{0-10}) アルキル) $1-2$ アミノカルボニルオキシ、アリール (C_{0-10}) アルキルアミノカルボニルオキシ、 $-CO_2$ (C_{0-10} アルキル)、 $-(C_{0-10}$ アルキル) CO_2H 、オキソ ($=O$)、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NH$ (C_{1-10} アルキル)、 $-SO_2N$ (C_{1-10} アルキル) 2 、 $-SO_2CF_3$ 、 $-SO_2CF_2H$ 、 C_{1-10} アルキルスルフィニル、アミノ、(C_{0-10} アルキル) $1-2$ アミノ、 $-(O$ キシ) $0-1$ (カルボニル) $0-1$ N (C_{0-10} アルキル) $1-2$ 、ヒドロキシ、(C_{1-10} アルキル) OH 、 C_{1-10} アルコキシ、(C_{0-10} アルキル) シアノ、シアノおよび C_{1-6} ハロアルキルから選択され；

R^3 は、ヒドロキシ、(C_{1-6}) アルキル、(C_{1-6}) アルコキシ、(C_{1-10} アルキル) OH 、ハロゲン、 CO_2H 、 $-(C_{0-6})$ アルキル CN 、 $-O$ ($C=O$) C

の化合物または医薬的に許容可能な塩またはその立体異性体。

A が、フェニル、ピリジニル、イソインドリニル、インドリル、1, 3 - ベンゾタゾリル (benzothazolyl)、ベンゾジオキサリル、ベンゾ [d] [1, 3] ジオキサリル、ジヒドロイソインドリル、キノリニル、キノキサリニル、ジヒドロベンゾイソチアゾリル、2, 3 - ジヒドロベンゾ [d] イソチアゾリル、ジヒドロインデニル、ジヒドロベンゾフラニル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラニル、2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデニル、イソインドリル、ジヒドロベンゾ [b] チオフェニル、2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] チオフェニルおよび

*c1ccc2c(c1)sc(=O)(=O)n2

A が、フェニル、ピリジニル、2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インドリル、1, 3 - ベンゾチアゾリル、2, 3 - ジヒドロイソインドリル、ジヒドロベンゾイソチアゾリル、2, 3 - ジヒドロベンゾ [d] イソチアゾリルおよび

*c1ccc2c(c1)sc(=O)(=O)n2

R¹ が、ハロゲン、オキソ (= O)、C₁₋₁₀ アルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、C₁₋₁₀ ヘテロアルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、アリール C₀₋₁₀ アルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、C₃₋₁₂ シクロアルキル C₀₋₁₀ アルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、ヘテロアリール C₀₋₁₀ アルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、(C₃₋₁₂) ヘテロシクロアルキル C₀₋₁₀ アルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、C₀₋₁₀ アルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アミノ C₀₋₁₀ アルキル、アリール C₀₋₁₀ アルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アミノ C₀₋₁₀ アルキル、ヘテロアリール C₀₋₁₀ アルキル (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アミノ C₀₋₁₀ アルキル、C₀₋₁₀ アルキルアミノ (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、アリール C₀₋₁₀ アルキルアミノ (オキシ) C₀₋₁ (カルボニル) C₀₋₁₀ アルキル、ヘテロアリール C₀₋₁₀ アルキルアミノ (オキシ)

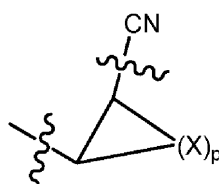
シ) $C_0 - 1$ (カルボニル) $C_0 - 1$ $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_0 - 1_0$ アルキルスルホニル $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_1 - 1_0$ ヘテロアルキルスルホニル $C_0 - 1_0$ アルキル、($C_3 - 1_2$) シクロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキルスルホニル $C_0 - 1_0$ アルキル、($C_3 - 1_2$) シクロヘテロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキルスルホニル $C_0 - 1_0$ アルキル、ヘテロアリール $C_0 - 1_0$ アルキルスルホニル $C_0 - 1_0$ アルキル、アリーール $C_0 - 1_0$ アルキルスルホニル $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_1 - 1_0$ アルキルスルファモイル $C_0 - 1_0$ アルキル、 $C_1 - 1_0$ ヘテロアルキルスルファモイル $C_0 - 1_0$ アルキル、($C_3 - 1_2$) シクロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキルスルファモイル $C_0 - 1_0$ アルキル、($C_3 - 1_2$) シクロヘテロアルキル $C_0 - 1_0$ アルキルスルファモイル $C_0 - 1_0$ アルキル、ヘテロアリーール $C_0 - 1_0$ アルキルスルファモイル $C_0 - 1_0$ アルキル、アリーール $C_0 - 1_0$ アルキルスルファモイル $C_0 - 1_0$ アルキル、($C_0 - 1_0$ アルキル) $1 - 2$ アミノ、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SO_2NH(C_1 - 1_0$ アルキル)、 $-SO_2N(C_1 - 1_0$ アルキル) $_2$ 、 $-SO_2CF_3$ 、 $-SO_2CF_2H$ 、 $C_1 - 4$ アシルアミノ $C_0 - 1_0$ アルキル、ヒドロキシ、 $-(C_1 - 1_0$ アルキル)OH、 $-C_0 - 1_0$ アルキルアルコキシ、シアノ、($C_1 - 6$ アルキル)シアノおよび $C_1 - 6$ ハロアルキルから選択され；ここで R^1 が、1、2、3 または 4 個の R^3 置換基で置換されていてもよい、請求項 3 に記載の化合物または医薬的に許容可能な塩またはその立体異性体。

【請求項 5】

R^1 が、から選択され： R^1 が、トリフルオロエチル、イミノメチル、オキソ、tert-ブチルスルファモイル、イソブチル、シアノ、メチルチオ、フルオロ、メトキシ、tert-ブチルオキシカルボニルメチル、クロロ、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、ヒドロキシ、tert-ブチルアミノメチル、イソブチルアミノメチル、シクロペンチルアミノメチル、ジメチルプロピルアミノメチル、シクロブチルアミノメチル、ピリジニルメチル、ジメチルアミノスルホニル、メチル、トリフルオロメチル、メチルアミノメチル、ピペラジニルメチル、tert-ブチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、オキサビシクロ[2.2.2]オクチル、トリアゾリルメチル、tert-ブチルアミノスルホニル、(1, 1-ジメチルプロピル)スルホニル、(1, 1, 2-トリメチルプロピル)スルホニル、ジメチルアミノメチル、ピロリジニルメチル、シクロプロピルアミノメチル、イソプロピルアミノメチル、エチルアミノメチル、アゼチジニルスルホニル、モルホリニルスルホニル、ピロリジニルスルホニル、メトキシエト-2-イル、tert-ブチルスルホニル、アミノメチル、イソプロピルカルボニル、イソプロピルスルホニル、イソプロピル、ピロリジニル、ピペリジニル、チオモルホリニルメチル、ピペリジニルカルボニル、アゼチジニルメチル、1-ヒドロキシ-1-メチルエチル、1-メチルエチルアミノおよびヒドロキシメチルから選択され、ここで R^1 が、1、2、3 または 4 個の R^3 置換基で置換されていてもよい、請求項 4 に記載の化合物または医薬的に許容可能な塩またはその立体異性体。

【請求項 6】

【化 4】



により形成される式 I で見られる環系が、テトラヒドロピラニル、ピペリジニルおよびアゼチジニルから選択される、請求項 5 に記載の化合物または医薬的に許容可能な塩またはその立体異性体。

【請求項 7】

次のもの：

3 - (3 - ((4 - (メチルスルホニル)フェニル)アミノ) - 4 - オキソ - 4, 5 -

ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - (4 - オキソ - 3 - (フェニルアミノ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - (3 - ((2 - メチル - 1 , 1 - ジオキシド - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [d] イソチアゾール - 5 - イル) アミノ) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - (3 - ((2 - (t e r t - ブチル) - 1 , 1 - ジオキシド - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [d] イソチアゾール - 5 - イル) アミノ) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

4 - ((1 - (4 - シアノテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 - イル) アミノ) - N , N - ジメチルベンゼンスルホンアミド ;

3 - (3 - ((1 , 1 - ジオキシド - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [d] イソチアゾール - 5 - イル) アミノ) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - (3 - ((4 - (1 - アミノ - 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) フェニル) アミノ) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

N - (t e r t - ブチル) - 4 - ((1 - (4 - シアノテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 - イル) アミノ) ベンゼンスルホンアミド ;

3 - (3 - ((4 - (イソプロピルスルホニル) フェニル) アミノ) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

N - (t e r t - ブチル) - 4 - ((1 - (4 - シアノテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 - イル) アミノ) - N - メチルベンゼンスルホンアミド ;

3 - (3 - ((4 - (t e r t - ブチルスルホニル) フェニル) アミノ) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - (3 - { [2 - (2 - メチルプロピル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 5 - イル] アミノ } - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - (3 - { [2 - (1 - メチルエチル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 5 - イル] アミノ } - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

メチル 5 - ({ 1 - [4 - シアノテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル] - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 - イル } アミノ) - 2 - ヒドロキシベンゼンカルボキシミドアート ;

3 - { 3 - [(4 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) アミノ] - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル } テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - [3 - ({ 4 - [1 - (ジメチルアミノ) - 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル] フェニル } アミノ) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル] テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - (3 - { [4 - (5 , 5 - ジメチル - 3 - オキソ - 2 - オキサビシクロ [2 . 2 . 2] オクト - 1 - イル) フェニル] アミノ } - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピ

ラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - (3 - { [4 - (t e r t - ブチルスルホニル) フェニル] アミノ } - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) オキセパン - 4 - カルボニトリル ;

3 - (3 - { [4 - (t e r t - ブチルスルホニル) フェニル] アミノ } - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) オキセパン - 4 - カルボニトリル ;

5 - (3 - { [4 - (t e r t - ブチルスルホニル) フェニル] アミノ } - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) オキセパン - 4 - カルボニトリル ;

5 - (3 - { [4 - (t e r t - ブチルスルホニル) フェニル] アミノ } - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) オキセパン - 4 - カルボニトリル ;

3 - { 3 - [(2 - フルオロピリジン - 4 - イル) アミノ] - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル } テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - { 3 - [(4 - シアノフェニル) アミノ] - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル } テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - { 3 - [(4 - シアノ - 3 - フルオロフェニル) アミノ] - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル } テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - (4 - オキソ - 3 - ((4 - ((S または R) - 1 , 1 , 1 - トリフルオロ - 2 - メトキシプロパン - 2 - イル) フェニル) アミノ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - (3 - ((2 , 3 - ジメチル - 1 , 1 - ジオキシド - 2 , 3 - ジヒドロベンゾ [d] イソチアゾール - 5 - イル) アミノ) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - (3 - ((4 - (4 , 4 - ジフルオロピペリジン - 1 - カルボニル) - 3 - メチルフェニル) アミノ) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - [4 - オキソ - 3 - ({ 4 - [2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) エチル] フェニル } アミノ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル] テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - [4 - オキソ - 3 - ({ 4 - [2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - ピペラジン - 1 - イル] エチル] フェニル } アミノ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル] テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

t e r t - ブチル N - { 1 - [4 - ({ 1 - [4 - シアノテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル] - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 - イル } アミノ) フェニル] - 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル } グリシナート ;

3 - [4 - オキソ - 3 - ({ 4 - [2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - ピロリジン - 1 - イル] エチル] フェニル } アミノ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル] テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - [4 - オキソ - 3 - ({ 4 - [1 - (2 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 2 - イル) エチル] フェニル } アミノ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル] テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - { 3 - [{ [(2 , 2 - ジメチルシクロプロピル) アミノ] - 2 , 2 , 2 - トリフ

ルオロエチル}フェニル)アミノ]-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-1-イル}テトラヒドロ-2H-ピラン-4-カルボニトリル;
 3-[3-(4-[1-(tert-ブチルアミノ)-2,2,2-トリフルオロエチル]フェニル)アミノ)-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-1-イル]テトラヒドロ-2H-ピラン-4-カルボニトリル;
 3-{4-オキソ-3-[(4-{2,2,2-トリフルオロ-1-[(1-メチルエチル)アミノ]エチル}フェニル)アミノ]-4,5-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-1-イル}テトラヒドロ-2H-ピラン-4-カルボニトリル;
 3-[3-(4-[1-(エチルアミノ)-2,2,2-トリフルオロエチル]フェニル)アミノ)-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-1-イル]テトラヒドロ-2H-ピラン-4-カルボニトリル;
 3-[3-(4-[1-アゼチジン-1-イル-2,2,2-トリフルオロエチル]フェニル)アミノ)-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-1-イル]テトラヒドロ-2H-ピラン-4-カルボニトリル;
 3-[3-(4-[1-(ジメチルアミノ)-2,2,2-トリフルオロエチル]フェニル)アミノ)-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-1-イル]テトラヒドロ-2H-ピラン-4-カルボニトリル;
 3-(3-{[4-(1-アミノ-1-メチルエチル)フェニル]アミノ}-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-1-イル)テトラヒドロ-2H-ピラン-4-カルボニトリル;
 3-{3-[(4-{1-メチル-1-[(1-メチルエチル)アミノ]エチル}フェニル)アミノ]-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-1-イル}テトラヒドロ-2H-ピラン-4-カルボニトリル;
 3-(3-{[1,1-ジオキシド-2-(2,2,2-トリフルオロエチル)-2,3-ジヒドロ-1,2-ベンゾイソチアゾール-5-イル]アミノ}-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-1-イル)テトラヒドロ-2H-ピラン-4-カルボニトリル;
 N-tert-ブチル-4-({1-[4-シアノテトラヒドロ-2H-ピラン-3-イル]-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-イル}アミノ)-N-メチルベンゼンスルホンアミド;
 tert-ブチル[5-({1-[4-シアノテトラヒドロ-2H-ピラン-3-イル]-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-イル}アミノ)-1,1-ジオキシド-1,2-ベンゾイソチアゾール-2(3H)-イル]アセタート;
 3-[3-(4-[(1,1-ジメチルプロピル)スルホニル]フェニル)アミノ)-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-1-イル]テトラヒドロ-2H-ピラン-4-カルボニトリル;
 3-[4-オキソ-3-(4-[(1,1,2-トリメチルプロピル)スルホニル]フェニル)アミノ)-4,5-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-1-イル]テトラヒドロ-2H-ピラン-4-カルボニトリル;
 5-({1-[4-シアノテトラヒドロ-2H-ピラン-3-イル]-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-イル}アミノ)-N,N-ジメチルピリジン-2-スルホンアミド;
 3-{3-[(3,4-ジメチルフェニル)アミノ]-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-1-イル}テトラヒドロ-2H-ピラン-4-カルボニトリル;
 3-(3-{[4-(アゼチジン-1-イルスルホニル)フェニル]アミノ}-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-1-イル)テトラヒドロ-2H-ピラン-4-カルボニトリル;
 3-[3-(4-[(3-メチルアゼチジン-1-イル)スルホニル]フェニル)ア

ミノ) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル] テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - [3 - ({ 4 - [(2 , 2 - ジメチルモルホリン - 4 - イル) スルホニル] フェニル } アミノ) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル] テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - [3 - ({ 4 - [(2 , 2 - ジメチルピロリジン - 1 - イル) スルホニル] フェニル } アミノ) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル] テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - { 3 - [(4 - { [2 , 6 - ジメチルモルホリン - 4 - イル] スルホニル } フェニル) アミノ] - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル } テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - { 3 - [(4 - { [2 - メチルモルホリン - 4 - イル] スルホニル } フェニル) アミノ] - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル } テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - { 3 - [(4 - { [2 , 6 - ジメチルモルホリン - 4 - イル] スルホニル } フェニル) アミノ] - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル } テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - { 3 - [(4 - { [2 - メチルアゼチジン - 1 - イル] スルホニル } フェニル) アミノ] - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル } テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

N - (t e r t - ブチル) - 4 - ((1 - (4 - シアノテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 3 - イル) アミノ) - N - エチルベンゼンスルホンアミド ;

3 - [3 - ({ 4 - [1 - (シクロプロピルアミノ) - 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル] フェニル } アミノ) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル] テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - { 3 - [(4 - { 1 - [(2 , 2 - ジメチルプロピル) アミノ] - 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル } フェニル) アミノ] - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル } テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - [3 - ({ 4 - [1 - (シクロペンチルアミノ) - 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル] フェニル } アミノ) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル] テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - { 4 - オキソ - 3 - [(4 - { 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - [2 - メチルピロリジン - 1 - イル] エチル } フェニル) アミノ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル } テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - { 4 - オキソ - 3 - [(4 - { 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - [(2 - メチルプロピル) アミノ] エチル } フェニル) アミノ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル } テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - [3 - ({ 4 - [1 - (シクロブチルアミノ) - 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル] フェニル } アミノ) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル] テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - (4 - オキソ - 3 - ((4 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - ヒドロキシ - 1 - (ピリジン - 4 - イル) エチル) フェニル) アミノ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - (4 - オキソ - 3 - ((4 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - ヒドロキシ - 1 - (ピリジン - 2 - イル) エチル) フェニル) アミノ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - (4 - オキソ - 3 - ((4 - ((3 - トリフルオロメチル) ピロリジン - 3 - イル) フェニル) アミノ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル } テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - [3 - ({ 3 - メチル - 3 - [(1 - メチルエチル) アミノ] - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 6 - イル } アミノ) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル] テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - { 3 - [(2 - メチル - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 6 - イル) アミノ] - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル } テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - { 3 - [(3 , 3 - ジメチル - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 6 - イル) アミノ] - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル } テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - [4 - オキソ - 3 - ({ 4 - [2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル] フェニル } アミノ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル] テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - (3 - ((4 - クロロ - 3 - (メチルスルホニル) フェニル) アミノ) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル ;

3 - (3 - ((4 - フルオロ - 3 - (メチルスルフィニル) フェニル) アミノ) - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリルおよび

3 - (3 - { [4 - クロロ - 3 - (メチルスルフィニル) フェニル] アミノ } - 4 - オキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 H - ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン - 1 - イル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - カルボニトリル

から選択される、請求項 1 に記載の化合物または医薬的に許容可能な塩またはその立体異性体。

【請求項 8】

請求項 1 に記載の化合物または医薬的に許容可能なその塩と、医薬的に許容可能な担体と、を含む医薬組成物。

【請求項 9】

請求項 1 に記載の化合物または医薬的に許容可能な塩またはその立体異性体を含む、JAK 介在性疾患の処置のための医薬組成物。

【請求項 10】

ヤヌスキナーゼ JAK 1 および JAK 2 の阻害によって緩和され得る、哺乳動物における、関節炎、喘息および閉塞性気道疾患、自己免疫疾患または障害および癌から選択される状態を処置するための、請求項 1 に記載の化合物または医薬的に許容可能な塩またはその立体異性体を含む医薬組成物。

【請求項 11】

前記状態が関節炎である、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

前記状態が、関節リウマチ、若年性関節炎および乾癬性関節炎から選択される、請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

前記状態が喘息または閉塞性気道疾患である、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記状態が、慢性喘息、遅発性喘息、気道過敏症、気管支炎、気管支喘息、アレルギー性喘息、内因性喘息、外因性喘息、塵埃喘息、再発性気道閉塞および慢性閉塞性肺疾患 (COPD) および肺気腫から選択される、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

前記状態が自己免疫疾患または障害である、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

請求項 1 に記載の化合物または医薬的に許容可能なその塩を含む、喘息を処置するための医薬組成物。

【請求項 17】

請求項 1 に記載の化合物または医薬的に許容可能なその塩を含む、関節炎の処置を必要とする哺乳動物において関節炎を処置するための医薬組成物。

【請求項 18】

ヤヌスキナーゼ J A K 1 および J A K 2 の阻害によって緩和される疾患または障害の処置のための薬剤の製造における、請求項 1 に記載の化合物または医薬的に許容可能な塩またはその立体異性体の使用。

【請求項 19】

ヤヌスキナーゼ J A K 1 および J A K 2 の阻害によって緩和される疾患または障害の処置のための薬剤の製造における、請求項 1 に記載の化合物または医薬的に許容可能な塩またはその立体異性体および第二の活性剤の使用。