

【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28年8月4日(2016.8.4)

【公表番号】特表2015-523996(P2015-523996A)

【公表日】平成27年8月20日(2015.8.20)

【年通号数】公開・登録公報2015-052

【出願番号】特願2015-518468(P2015-518468)

【国際特許分類】

C 07 D 401/12	(2006.01)
A 61 K 31/4439	(2006.01)
C 07 D 413/12	(2006.01)
A 61 K 31/4725	(2006.01)
A 61 K 31/4709	(2006.01)
C 07 D 413/14	(2006.01)
A 61 K 31/444	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)
A 61 P 3/10	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 11/06	(2006.01)
A 61 P 17/06	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 37/00	(2006.01)
A 61 P 35/02	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
C 07 D 417/12	(2006.01)
C 07 D 417/14	(2006.01)

【F I】

C 07 D 401/12	C S P
A 61 K 31/4439	
C 07 D 413/12	
A 61 K 31/4725	
A 61 K 31/4709	
C 07 D 413/14	
A 61 K 31/444	
C 07 D 471/04	1 1 3
A 61 P 3/10	
A 61 P 9/00	
A 61 P 9/10	
A 61 P 9/10	1 0 1
A 61 P 11/06	
A 61 P 17/06	
A 61 P 29/00	
A 61 P 37/00	
A 61 P 35/02	
A 61 P 25/00	
A 61 P 43/00	1 1 1
C 07 D 417/12	

C 0 7 D 417/14
C 0 7 D 471/04 1 0 6 A

【手続補正書】

【提出日】平成28年6月10日(2016.6.10)

【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

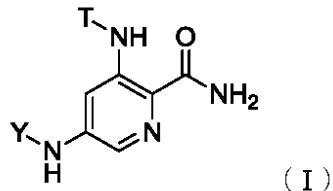
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化91-1】



の化合物であって、式中、

Tが $(CH_2)_d(X^1)$ であり、 X^1 が、アリール、ならびにS、O、およびNから選択される1～4個のヘテロ原子を含む单環式または二環式ヘテロアリールからなる群から選択され、アリールおよびヘテロアリールが、1～5個のR¹で任意に置換され、dが0または1であり、

各R¹が独立して、ハロ、C₁～8アルキル、C₂～8アルケニル、ハロC₁～8アルキル、 $(CH_2)_nSR^{1a}$ 、 $(CH_2)_nOR^{1a}$ 、 $O(CH_2)_jOR^{1a}$ 、 $(CH_2)_nNR^{1b}R^{1c}$ 、 $(CH_2)_nCOR^{1e}$ 、 $(CH_2)_nCONR^{1b}R^{1c}$ 、 $(CH_2)_nNR^{1b}COR^{1e}$ 、 $(CH_2)_nCONR^{1b}(OR^{1a})$ 、 $(CH_2)_nCO_2R^{1a}$ 、 $O(CH_2)_nCO_2R^{1a}$ 、 $(CH_2)_nNR^{1b}CO_2R^{1a}$ 、 $(CH_2)_nSO_2NR^{1b}R^{1c}$ 、 $(CH_2)_nNR^{1b}SO_2R^{1e}$ 、 $(CH_2)_nSOR^{1e}$ 、 $(CH_2)_nSO_2R^{1e}$ 、オキソ、 $(CH_2)_nCN$ 、N₃、NO₂、および-L-Wからなる群から選択され、式中、nが、0、1、2、3、4、5、または6であり、jが、1、2、3、4、5、または6であり、

Lが、-O(CH₂)_b-、-SO-、-SO₂-、-CO-、-NR^{1d}-、-CONR^{1d}(CH₂)_b-、-NR^{1d}CO-、-NR^{1d}SO₂-、-SO₂NR^{1d}-、結合、および-(CH₂)_z-からなる群から選択され、式中、bが、0、1、2、3、4、または5であり、zが、1、2、3、4、または5であり、

Wが、アリール、S、O、およびNから選択される1～4個のヘテロ原子を含む单環式または二環式ヘテロアリール、C₃～8シクロアルキル、ならびにS、O、およびNから選択される1～4個のヘテロ原子を含む3～8員のヘテロシクリルからなる群から選択され、各々が、1～3個のR²で任意に置換され、

各R²が独立して、ハロ、C₁～8アルキル、C₂～8アルケニル、ハロC₁～8アルキル、 $(CH_2)_mSR^{2a}$ 、 $(CH_2)_mOR^{2a}$ 、 $O(CH_2)_kOR^{2a}$ 、 $(CH_2)_mNR^{2b}R^{2c}$ 、 $(CH_2)_mCOR^{2e}$ 、 $(CH_2)_mCONR^{2b}R^{2c}$ 、 $(CH_2)_mNR^{2b}COR^{2e}$ 、 $(CH_2)_mCONR^{2b}(OR^{2a})$ 、 $(CH_2)_mCO_2R^{2a}$ 、 $O(CH_2)_mCO_2R^{2a}$ 、 $(CH_2)_mNR^{2b}CO_2R^{2a}$ 、 $(CH_2)_mSO_2NR^{2b}R^{2c}$ 、 $(CH_2)_mNR^{2b}SO_2R^{2e}$ 、 $(CH_2)_mSOR^{2e}$ 、 $(CH_2)_mSO_2R^{2e}$ 、オキソ、 $(CH_2)_mCN$ 、N₃、およびNO₂からな

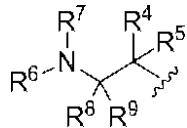
る群から選択され、式中、 m が、0、1、2、3、4、5、または6であり、 k が、1、2、3、4、5、または6であり、

$R^{1\text{ a}}$ 、 $R^{1\text{ b}}$ 、 $R^{1\text{ c}}$ 、 $R^{1\text{ d}}$ 、 $R^{2\text{ a}}$ 、 $R^{2\text{ b}}$ 、および $R^{2\text{ c}}$ が独立して、H、 $C_{1\text{ - }8}$ アルキル、 $C_{2\text{ - }8}$ アルケニル、およびハロ $C_{1\text{ - }8}$ アルキルからなる群から選択され、

$R^{1\text{ e}}$ および $R^{2\text{ e}}$ が独立して、 $C_{1\text{ - }8}$ アルキル、 $C_{2\text{ - }8}$ アルケニル、およびハロ $C_{1\text{ - }8}$ アルキルからなる群から選択され、

Y が、

【化91-2】



または $(CH_2)_v(X^2)$ であり、式中、

v が、0、1、2、または3であり、

X^2 が、 CH_2CH_3 、 $(CH_2)_3NH_2$ 、 $C_{3\text{ - }8}$ シクロアルキル、S、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む3~8員のヘテロシクリル、アリール、ならびにS、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む单環式または二環式ヘテロアリールからなる群から選択され、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、およびヘテロアリールが各々、1~3個の $R^{1\text{ o}}$ で任意に置換され、

R^4 が、H、ハロ、 $C_{1\text{ - }8}$ アルキル、 $C_{2\text{ - }8}$ アルケニル、ハロ $C_{1\text{ - }8}$ アルキル、 $(CH_2)_pSR^{4\text{ a}}$ 、 $(CH_2)_pSOR^{4\text{ a}}$ 、 $(CH_2)_pSO_2R^{4\text{ a}}$ 、 $(CH_2)_pOR^{4\text{ a}}$ 、 $(CH_2)_pNR^{4\text{ b}}R^{4\text{ c}}$ 、 $(CH_2)_fCONR^{4\text{ b}}R^{4\text{ c}}$ 、 $(CH_2)_pNR^{4\text{ b}}COR^{4\text{ d}}$ 、 $(CH_2)_fCO_2R^{4\text{ a}}$ 、 $(CH_2)_pNR^{4\text{ b}}CO_2R^{4\text{ a}}$ 、 $(CH_2)_fC_{3\text{ - }8}$ シクロアルキル、 $(CH_2)_p(O)C_{3\text{ - }8}$ シクロアルキル、 $(CH_2)_p(S)C_{3\text{ - }8}$ シクロアルキル、 $(CH_2)_pSO_2NR^{4\text{ b}}R^{4\text{ c}}$ 、 $(CH_2)_pNHC_{3\text{ - }8}$ シクロアルキル、 $(CH_2)_fCN$ 、 $(CH_2)_f$ (アリール)、 $(CH_2)_f(S, O$ 、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む单環式または二環式ヘテロアリール)、 $(CH_2)_f$ (アリール)(S、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む单環式または二環式ヘテロアリール)、 $(CH_2)_f(S$ 、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む3~8員のヘテロシクリル)、 $(CH_2)_p(O)(CH_2)_f$ (アリール)、 $(CH_2)_p(O)(CH_2)_f$ (S、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む单環式または二環式ヘテロアリール)、 $(CH_2)_p(O)(CH_2)_fC_{3\text{ - }8}$ シクロアルキル、ならびに $(CH_2)_p(O)(CH_2)_f(S, O$ 、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む3~8員のヘテロシクリル)からなる群から選択され、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、およびヘテロシクリルが各々、1~3個の $R^{1\text{ 1 a}}$ で任意に置換され、 f が、0、1、2、3、4、5、または6であり、 p が、1、2、3、4、5、または6であるか、あるいは、 R^4 および R^5 が一緒になって、=Oを形成するか、または1~3個の $R^{1\text{ 1 a}}$ で任意に置換される3~8員の炭素環式もしくは複素環式環を形成し、

R^5 が、Hおよび $C_{1\text{ - }8}$ アルキルからなる群から選択され、

R^6 が、H、 $C_{1\text{ - }8}$ アルキル、OH、O($C_{1\text{ - }8}$ アルキル)、 $CO_2R^{6\text{ a}}$ 、 $CO(NR^{6\text{ a}}R^{6\text{ b}})$ 、および $C_{3\text{ - }8}$ シクロアルキルからなる群から選択されるか、または R^6 が、 R^7 およびそれらが結合する原子と一緒にになって、1~3個の $R^{1\text{ 1 b}}$ で任意に置換されるヘテロシクリル環を形成し、

R^7 が、H、 $C_{1\text{ - }8}$ アルキル、およびシクロアルキルからなる群から選択され、

R^8 が、H、 $C_{1\text{ - }8}$ アルキル、 $(CH_2)_uNR^{8\text{ b}}R^{8\text{ c}}$ 、 $(CH_2)_gCONR^{8\text{ b}}$ 、 $(CH_2)_gCO(CH_2)_uNR^{8\text{ b}}R^{8\text{ c}}$ 、 $(CH_2)_gCO_2R^{8\text{ a}}$ 、

$(C_2H_2)_uOR^8$ ^a、 $CH(C_{1-8}\text{アルキル})OR^8$ ^a、 $(C_2H_2)_gC_{3-8}$ シクロアルキル、 $(C_2H_2)(S, O, \text{および} N)$ から選択される1~4個のヘテロ原子を含む3~8員のヘテロシクリル)、 $(C_2H_2)_g\text{アリール}$ 、 $(C_2H_2)(S, O, \text{および} N)$ から選択される1~4個のヘテロ原子を含む単環式または二環式ヘテロアリール)、ならびに $(C_2H_2)_u(O)$ (アリール)からなる群から選択され、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、およびヘテロシクリルが各々、1~3個の R^{1-1} ^cで任意に置換され、 g が、0、1、2、3、4、5、または6であり、 u が、1、2、3、4、5、または6であるか、あるいは R^8 が、 R^9 およびそれらが結合する原子と一緒にになって、=O、=Sを形成するか、または R^{1-1} ^cで任意に置換されるシクロアルキルもしくはヘテロシクリル環を形成し、

R^9 が、Hまたはアルキルであり、

R^{1-0} が独立して、ハロ、 C_{1-8} アルキル、 C_{2-8} アルケニル、ハロ C_{1-8} アルキル、 $(C_2H_2)_qSR^{1-0}$ ^a、 $(C_2H_2)_qOR^{1-0}$ ^a、 $(C_2H_2)_qNR^{1-0}$ ^b R^{1-0} ^c、 $(C_2H_2)_qCOR^{1-0}$ ^d、 $(C_2H_2)_qCONR^{1-0}$ ^b R^{1-0} ^c、 $(C_2H_2)_qN$ R^{1-0} ^b COR^{1-0} ^d、 $(C_2H_2)_qCONR^{1-0}$ ^b(OR^{1-0} ^a)、 $(C_2H_2)_qCO$ ₂ R^{1-0} ^a、 $O(C_2H_2)_qCO_2R^{1-0}$ ^a、 $(C_2H_2)_qNR^{1-0}$ ^b CO_2R^{1-0} ^a、 $(C_2H_2)_qSO_2NR^{1-0}$ ^b R^{1-0} ^c、 $(C_2H_2)_qNR^{1-0}$ ^b SO_2R^{1-0} ^d、 $(C_2H_2)_qSOR^{1-0}$ ^d、 $(C_2H_2)_qSO_2R^{1-0}$ ^d、オキソ、 $(C_2H_2)_qCN$ 、 N_3 、 $N=CH_2$ 、 NO_2 、 $C(O)(S, O, \text{および} N)$ から選択される1~4個のヘテロ原子を含む3~8員のヘテロシクリル)、アリール、S、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む単環式または二環式ヘテロアリール、 C_{3-8} シクロアルキル、ならびにS、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む3~8員のヘテロシクリルからなる群から選択され、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、およびヘテロシクリルが各々、1~3個の R^{1-1} ^dで任意に置換され、 q が、0、1、2、3、4、5、または6であり、

R^{1-1} ^a、 R^{1-1} ^b、 R^{1-1} ^c、および R^{1-1} ^dが独立して、ハロ、 C_{1-8} アルキル、ハロ C_{1-8} アルキル、OH、 C_{1-8} アルコキシ、ハロ C_{1-8} アルコキシ、C(O) C_{1-8} アルキル、 CO_2C_{1-8} アルキル、および SO_2C_{1-8} アルキルからなる群から選択され、

R^{4-0} ^a、 R^{4-0} ^b、 R^{4-0} ^c、 R^{6-0} ^a、 R^{6-0} ^b、 R^{8-0} ^a、 R^{8-0} ^b、 R^{8-0} ^c、 R^{1-0} ^a、 R^{1-0} ^b、および R^{1-0} ^cが独立して、H、 C_{1-8} アルキル、 C_{2-8} アルケニル、およびハロ C_{1-8} アルキルからなる群から選択され、

R^{4-0} ^dおよび R^{1-0} ^dが独立して、 C_{1-8} アルキル、 C_{2-8} アルケニル、およびハロ C_{1-8} アルキルからなる群から選択され、

式中、波線が、分子の残りへの結合点を示し、

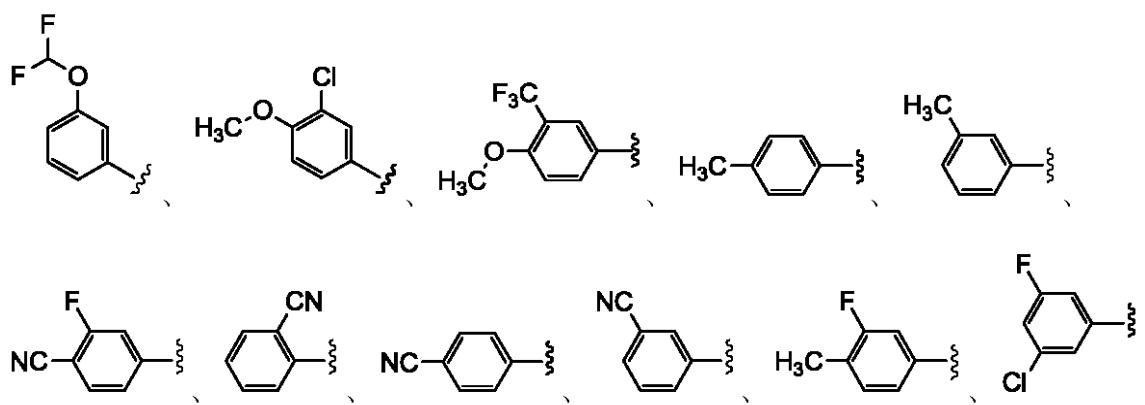
但し、Yが2-アミノシクロヘキシリルまたはジメチルアミノエチルであり、Tがフェニルまたはナフタレンであるとき、Tが、 C_{2-8} アルケニル、 $O(C_2H_2)_jOR^{1-0}$ ^a、 $(C_2H_2)_nCONR^{1-0}$ ^b R^{1-0} ^c、 $(C_2H_2)_nNR^{1-0}$ ^b COR^{1-0} ^e、 $(C_2H_2)_nCON$ R^{1-0} ^b(OR^{1-0} ^a)、 $(C_2H_2)_nCO_2R^{1-0}$ ^a、 $O(C_2H_2)_nCO_2R^{1-0}$ ^a、 $(C_2H_2)_nNR^{1-0}$ ^b CO_2R^{1-0} ^a、 $(C_2H_2)_nSO_2NR^{1-0}$ ^b R^{1-0} ^c、 $(C_2H_2)_nNR^{1-0}$ ^b SO_2R^{1-0} ^e、 $(C_2H_2)_nSOR^{1-0}$ ^e、 $(C_2H_2)_nSO_2R^{1-0}$ ^e、 N_3 、および-L-Wからなる群から選択される少なくとも1個の R^1 で置換され、式中、Lが、-SO-、-SO₂-、-CO-、-NR¹⁻⁰^d-、-CONR¹⁻⁰^d($C_2H_2)_b$ -、-NR¹⁻⁰^dCO-、-NR¹⁻⁰^dSO₂-、-SO₂NR¹⁻⁰^d-、結合、および-($C_2H_2)_z$ -からなる群から選択されるものとする、化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項2】

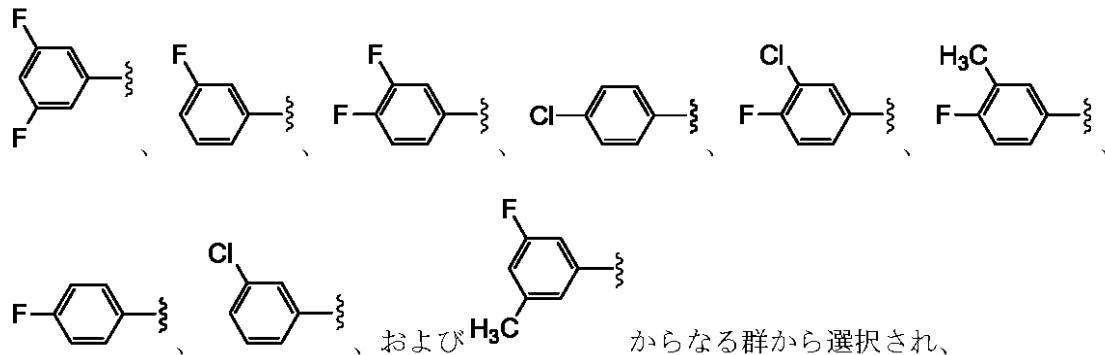
Tが、1~5個の R^1 で置換されるフェニルである、請求項1に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項3】

T が、
【化 9 2 - 1】



【化 9 2 - 2】



式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項 1 に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

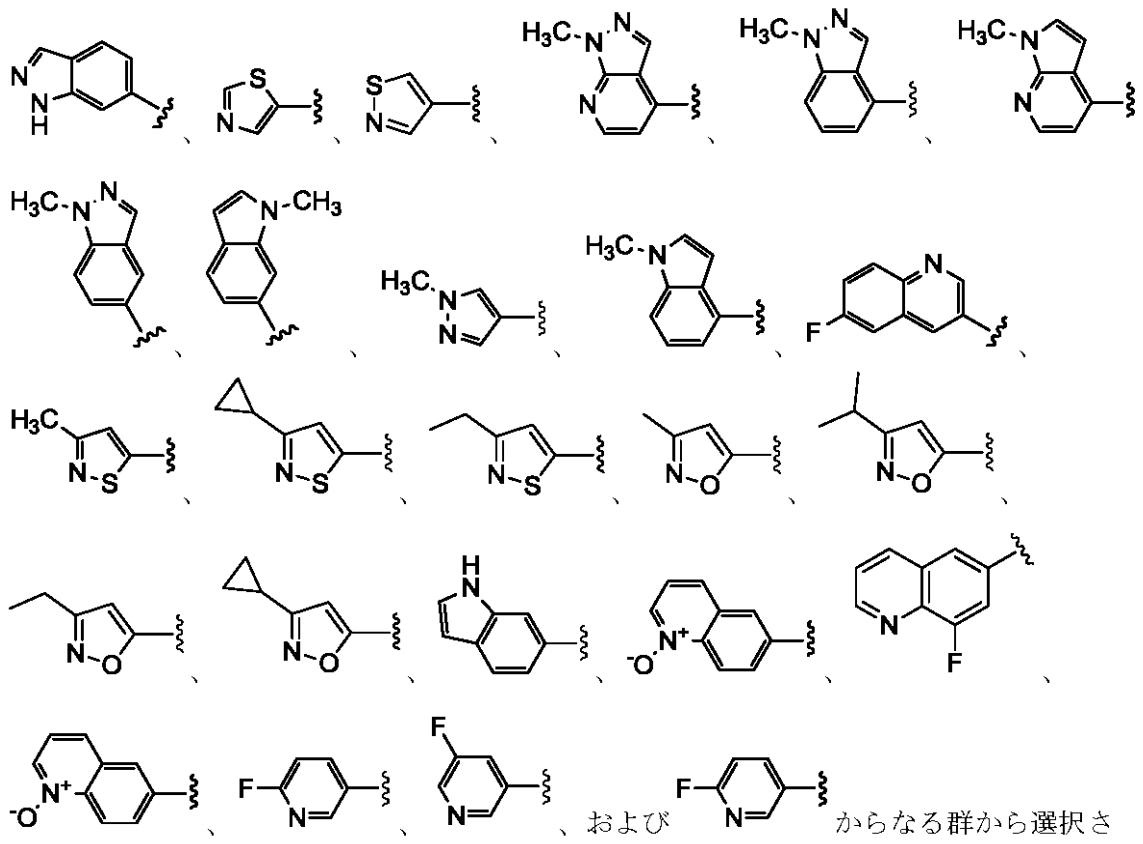
【請求項 4】

T が、S、O、およびN から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含み、1 ~ 5 個の R¹ で任意に置換される单環式または二環式ヘテロアリールである、請求項 1 に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 5】

T が、

【化93】



式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項1に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

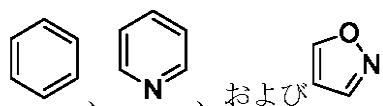
【請求項6】

少なくとも1個のR¹が-L-Wである、請求項1～5のいずれかに記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項7】

-L-Wが-CO-NR^aR^bであり、R^aおよびR^bが一緒になって、ハロ、C₁～₈アルキル、およびハロC₁～₈アルキルから独立して選択される1～3個の基で任意に置換される4～6員環を形成するか、または、Lが結合であり、Wが、

【化94】

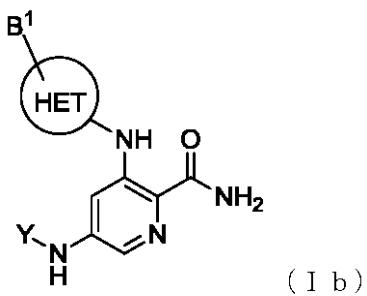
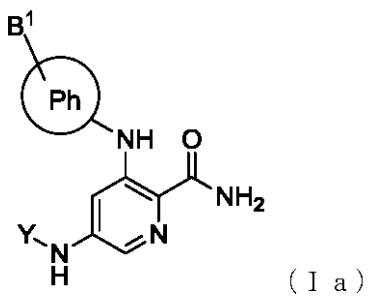


からなる群から選択される、請求項6に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項8】

式(Ia)または(Ib)

【化 9 5】



の請求項 1 に記載の化合物であって、式中、

Ph が、1～3個の R' で任意に置換されるフェニルであり、

HETが、S、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含み、1~3個のR¹で任意に置換される単環式または二環式ヘテロアリールであり、

B^1 が、 $\text{CO-NR}^a\text{R}^b$ 、フェニル、S、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む单環式または二環式ヘテロアリール、ならびにS、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む3~8員のヘテロシクリルからなる群から選択され、フェニル、ヘテロアリール、およびヘテロシクリルが各々、1~3個の R^2 で任意に置換され、 R^a および R^b が一緒になって、ハロ、 C_{1-8} アルキル、およびハロ C_{1-8} アルキルから独立して選択される1~3個の基で任意に置換される4~6員の複素環式環を形成する、化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項9】

式(Ia)中のB¹が、S、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む单環式または二環式ヘテロアリールであるか、またはS、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含み、各々が、1~3個のR²で任意に置換される3~8員のヘテロシクリルであり、

式 (I b) 中の B¹ が、フェニル、または S、O、および N から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含み、各々が、1 ~ 3 個の R² で任意に置換される 3 ~ 8 員のヘテロシクリルである、請求項 8 に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 10】

W または B¹ が、1～3個の R² で置換される、請求項 1 または 8 に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

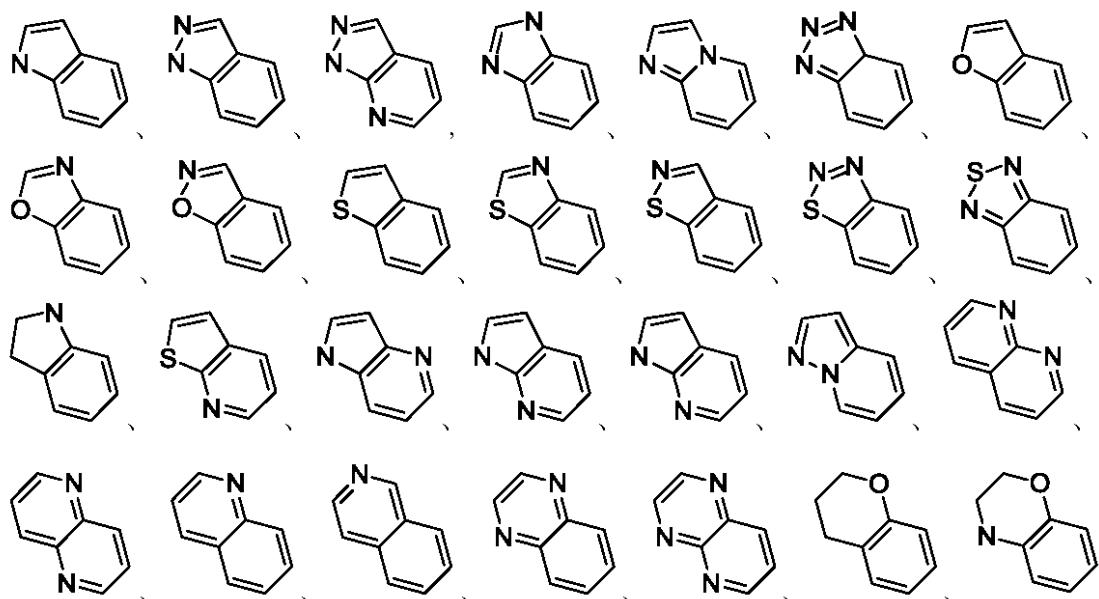
【請求項 11】

R¹ および R² が独立して、ハロ、C₁ - 8 アルキル、ハロC₁ - 8 アルキル、シアノ、オキソ、OH、O(C₁ - 8 アルキル)、およびO(ハロC₁ - 8 アルキル)からなる群から選択される、請求項 8 ~ 10 に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

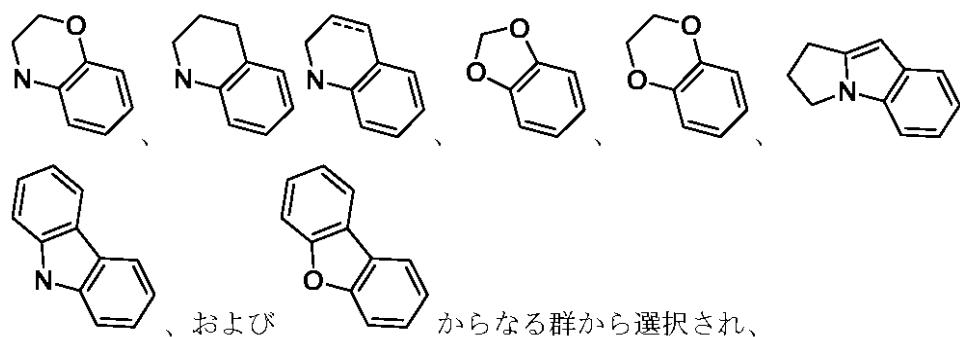
【請求項 1 2】

X¹ または H E T が、

【化96-1】



【化96-2】

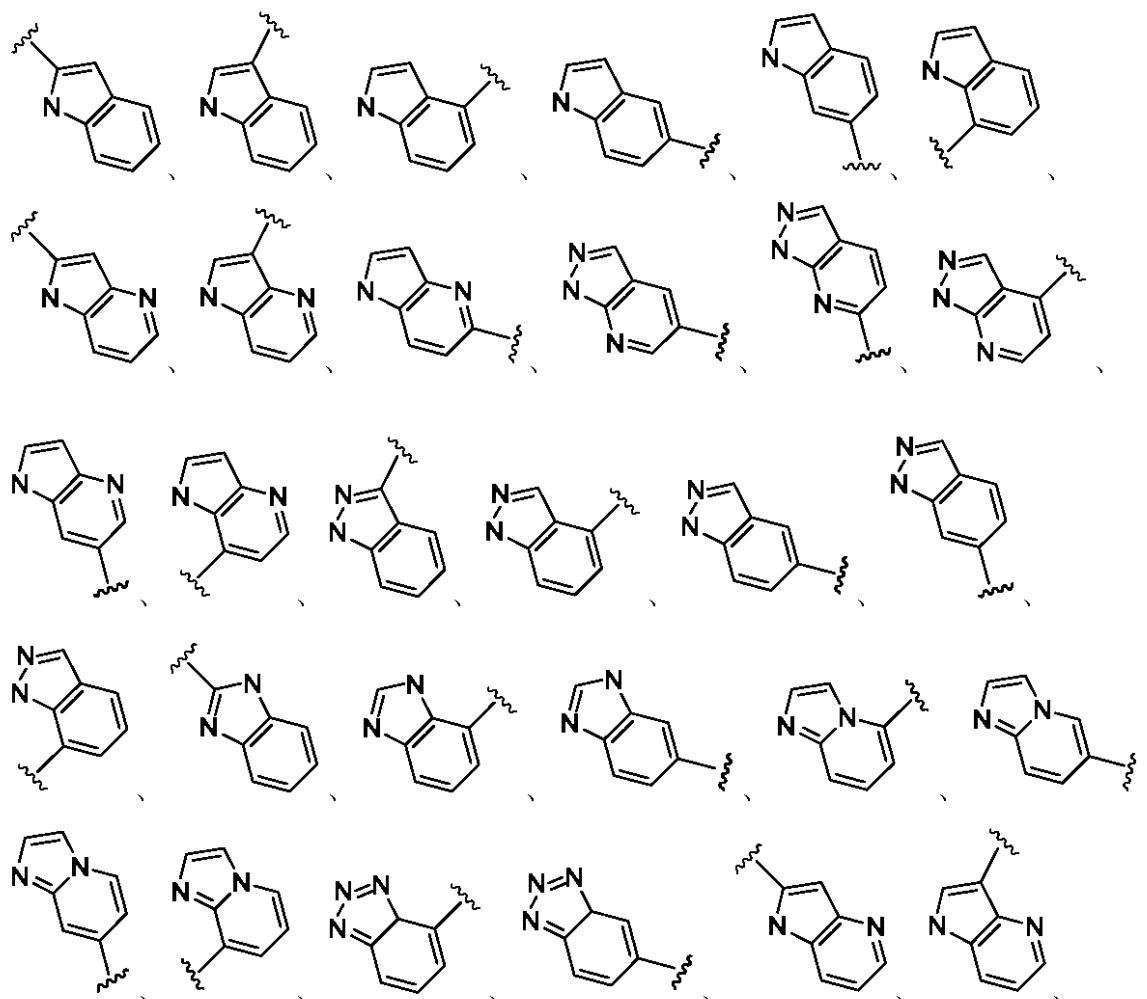


式中、前記分子の残りへの結合点が炭素環原子上にある、請求項4～11に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

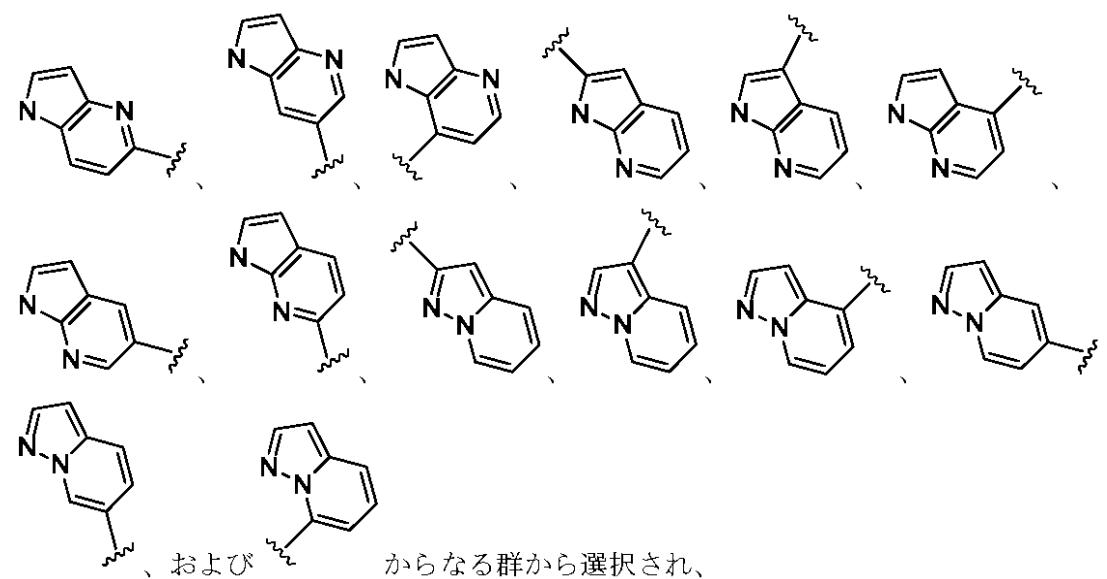
【請求項13】

X¹またはHETが、

【化 9 7 - 1】



【化 9 7 - 2】

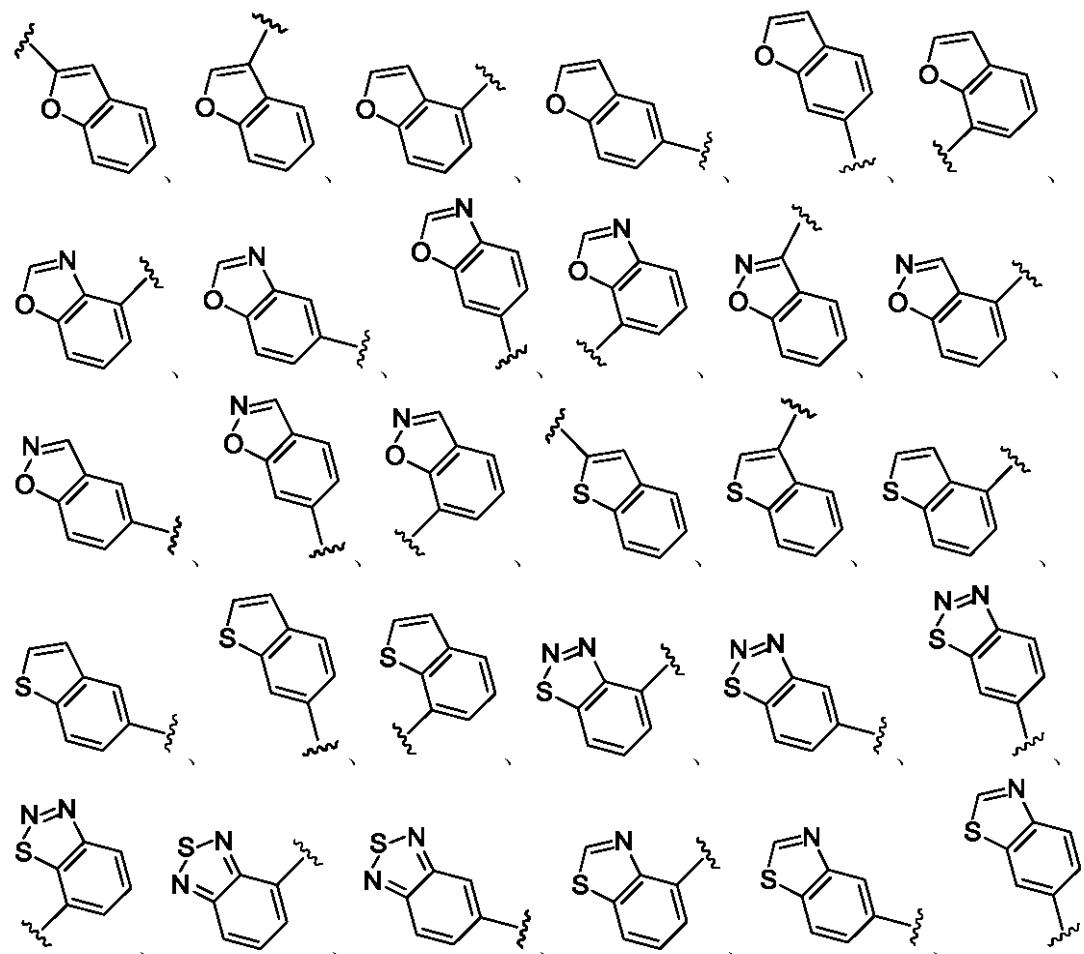


、および からなる群から選択され、

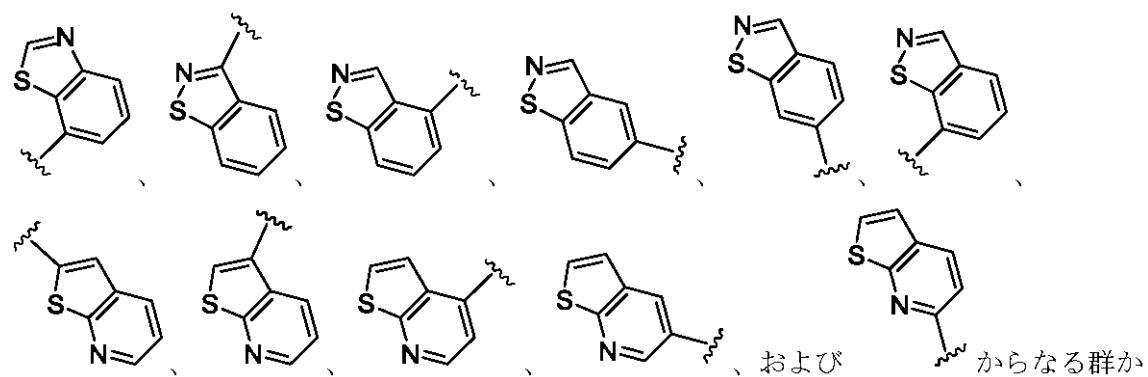
式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項 1 2 に記載の化合物またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 1 4】

X^1 または HET が、
【化 98-1】



【化 98-2】

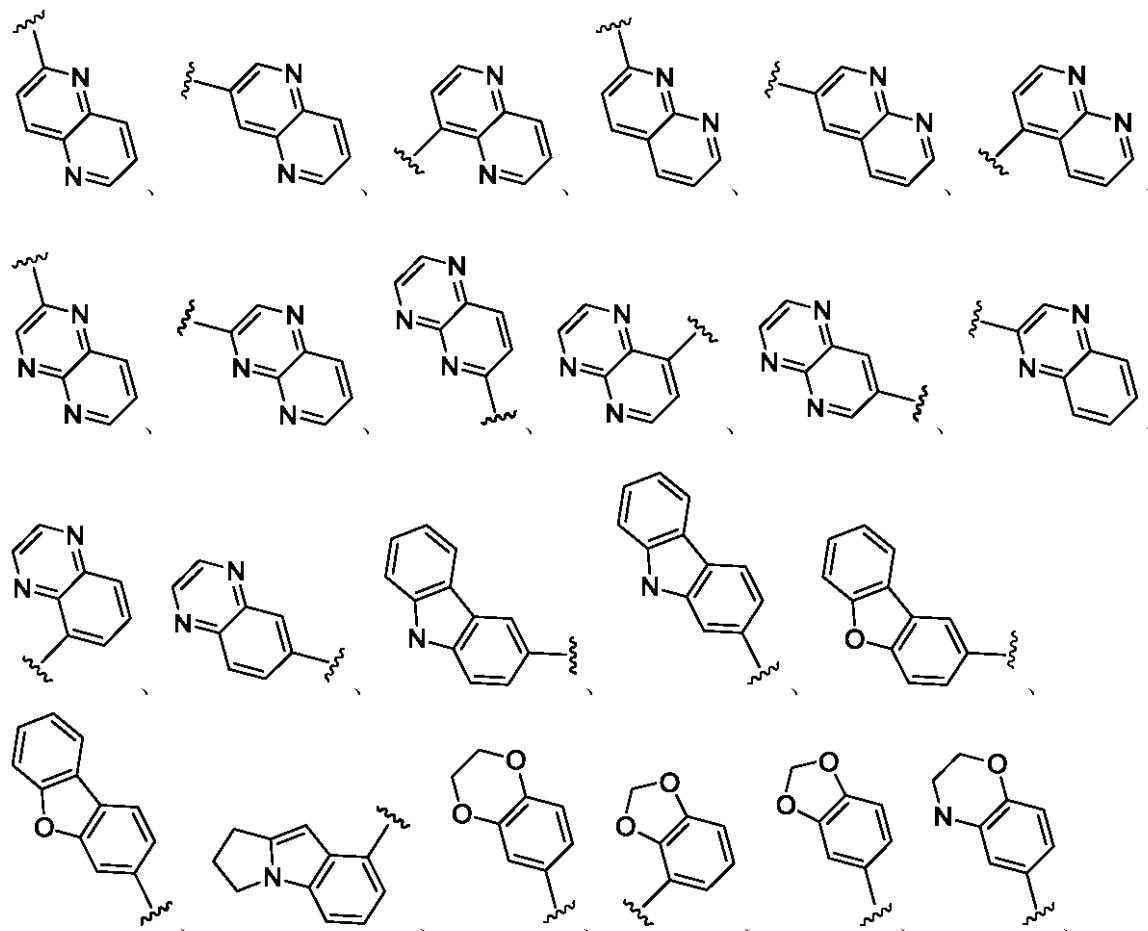


式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項 1-2 に記載の化合物またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

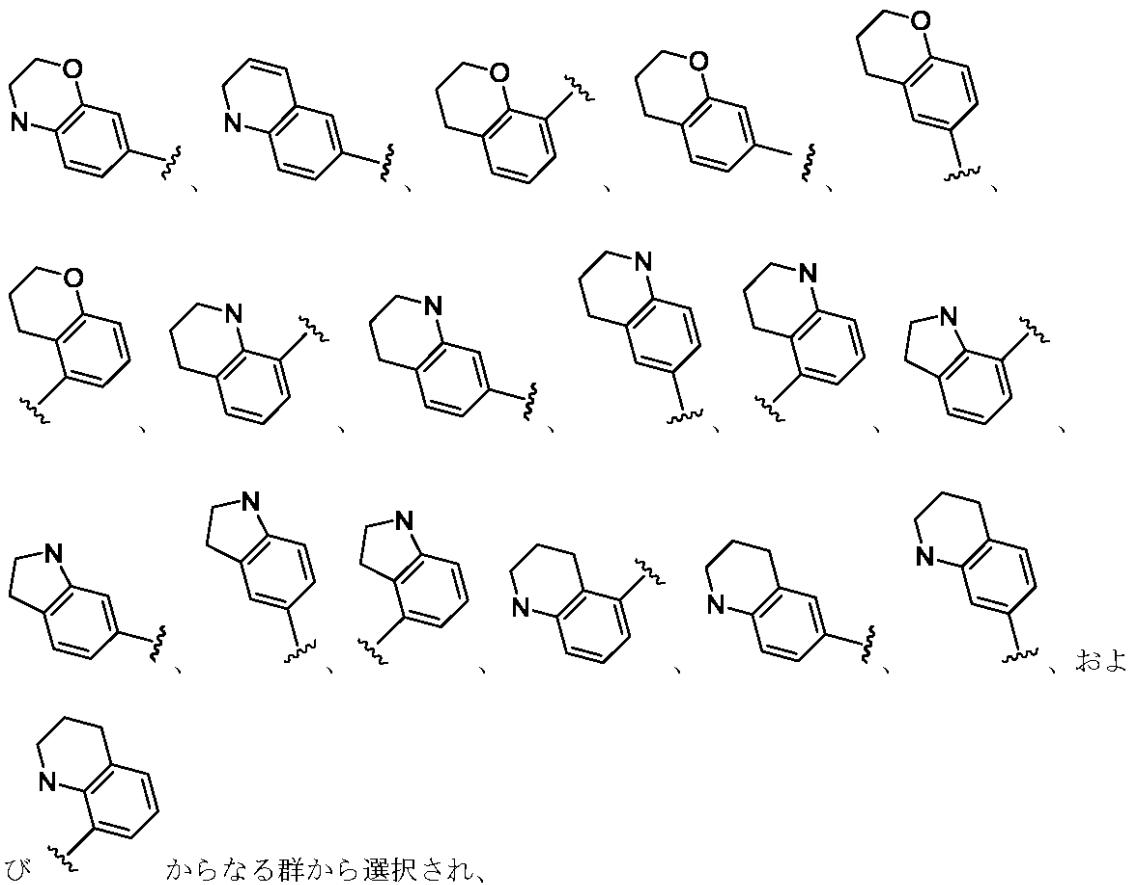
【請求項 1-5】

X^1 または HET が、

【化 9 9 - 1】



【化 9 9 - 2】

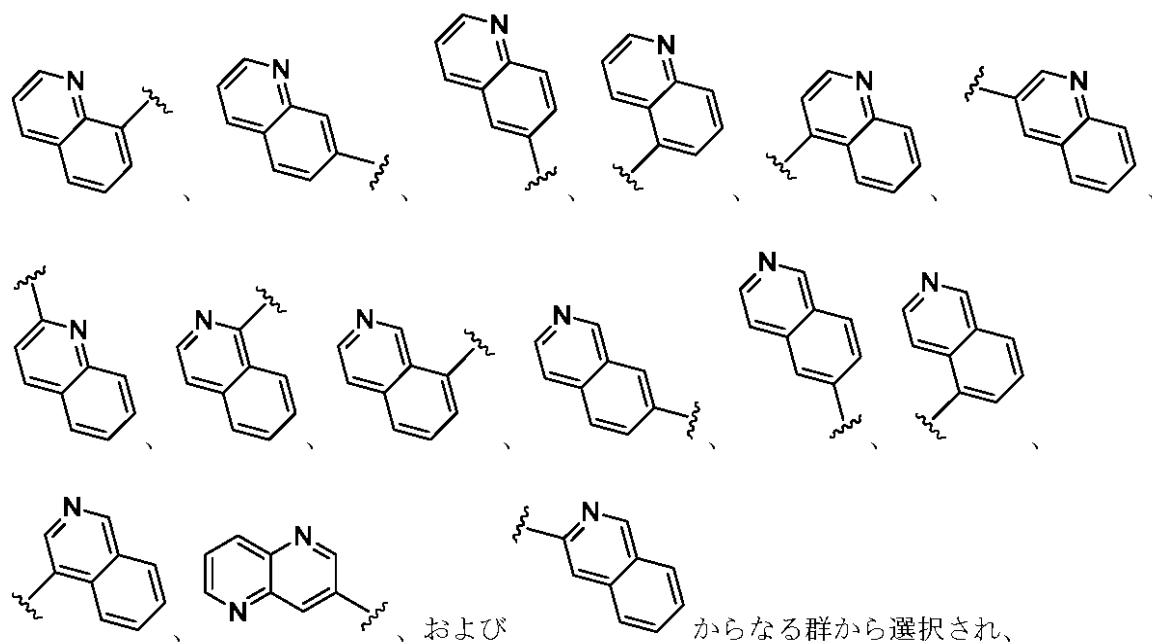


式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項 1 2 に記載の化合物またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 1 6】

X¹ または H E T が、

【化 1 0 0】

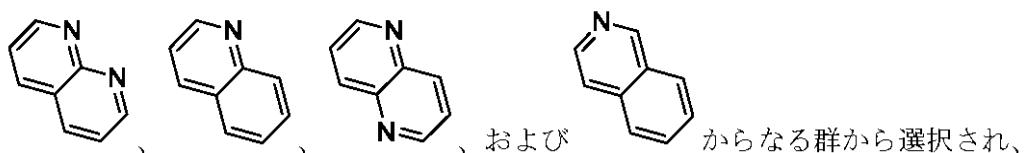
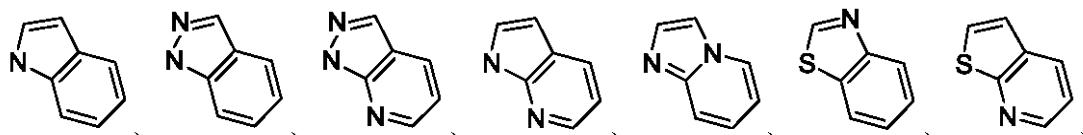


式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項 1 2 に記載の化合物またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 1 7】

X¹ または H E T が、

【化 1 0 1】

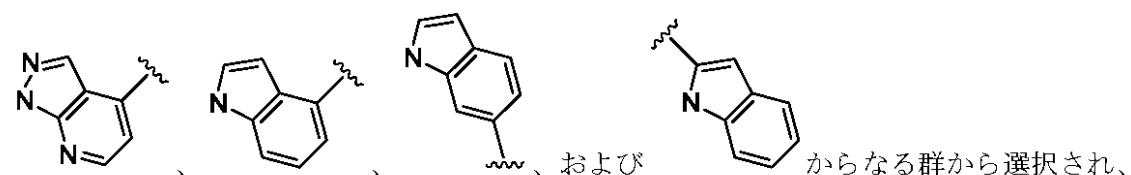
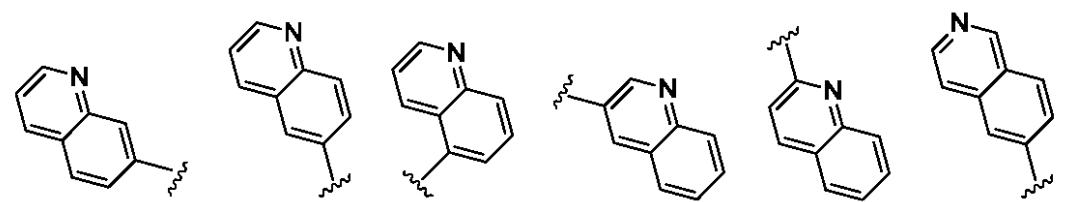
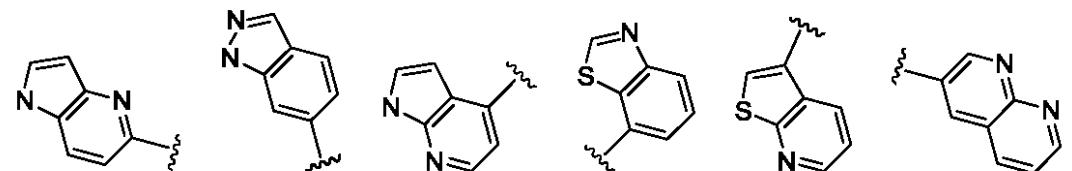


式中、前記分子の残りへの結合点が炭素環原子上である、請求項 1 2 に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 1 8】

X¹ または H E T が、

【化 1 0 2】

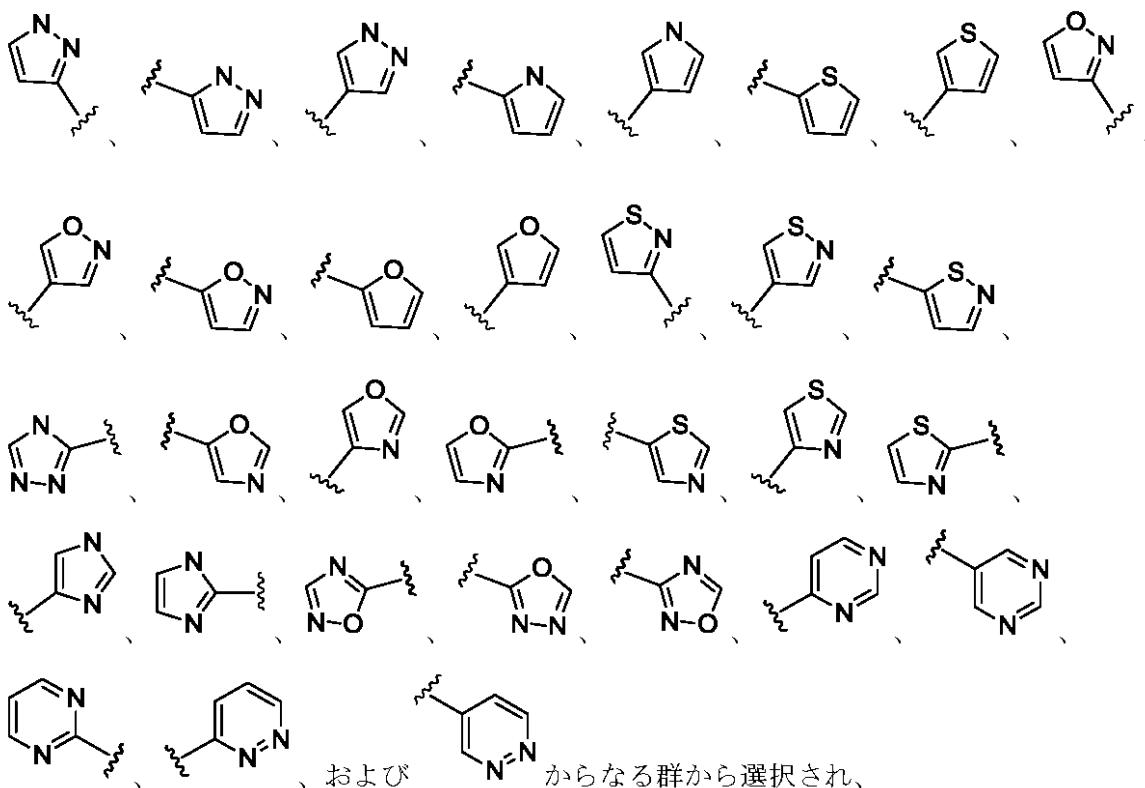


式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項 1 7 に記載の化合物またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 1 9】

X¹ または H E T が、

【化 1 0 3】

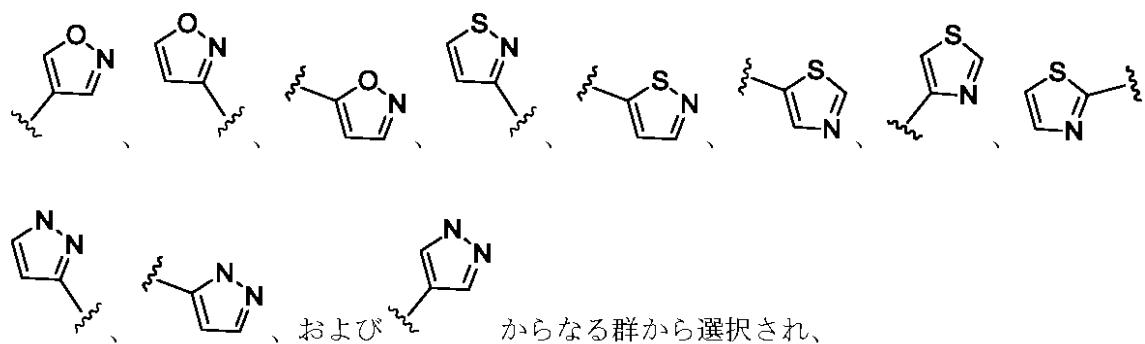


式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項 4 ~ 11 のいずれか一項に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 20】

X¹ または H E T が、

【化 1 0 4】

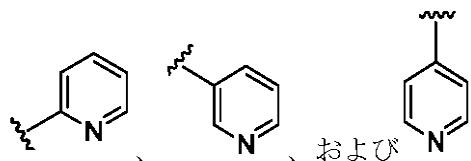


式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項 1 9 に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 21】

X¹ または H E T が、

【化105】



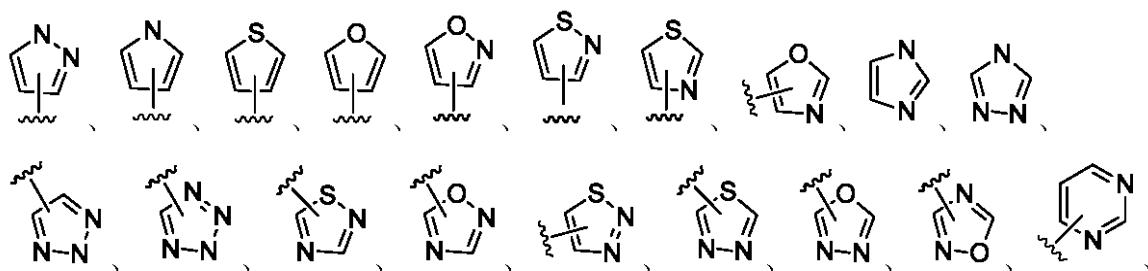
からなる群から選択され、

式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項4～11のいずれか一項に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

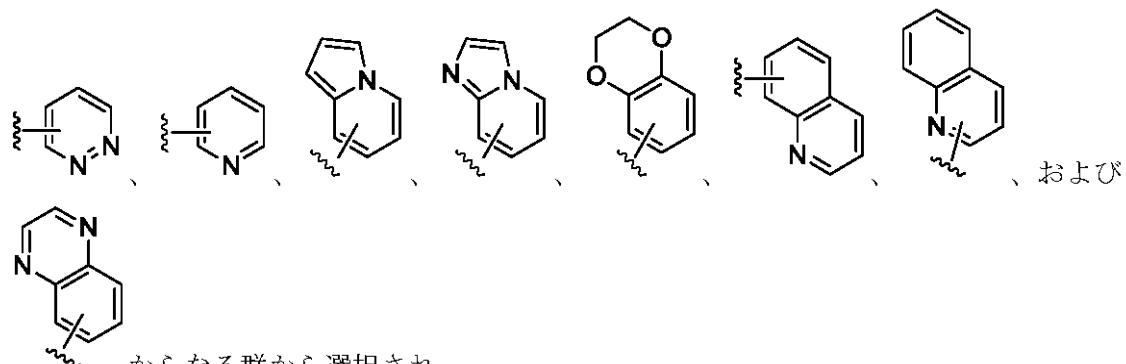
【請求項22】

WまたはB¹が、

【化106-1】



【化106-2】



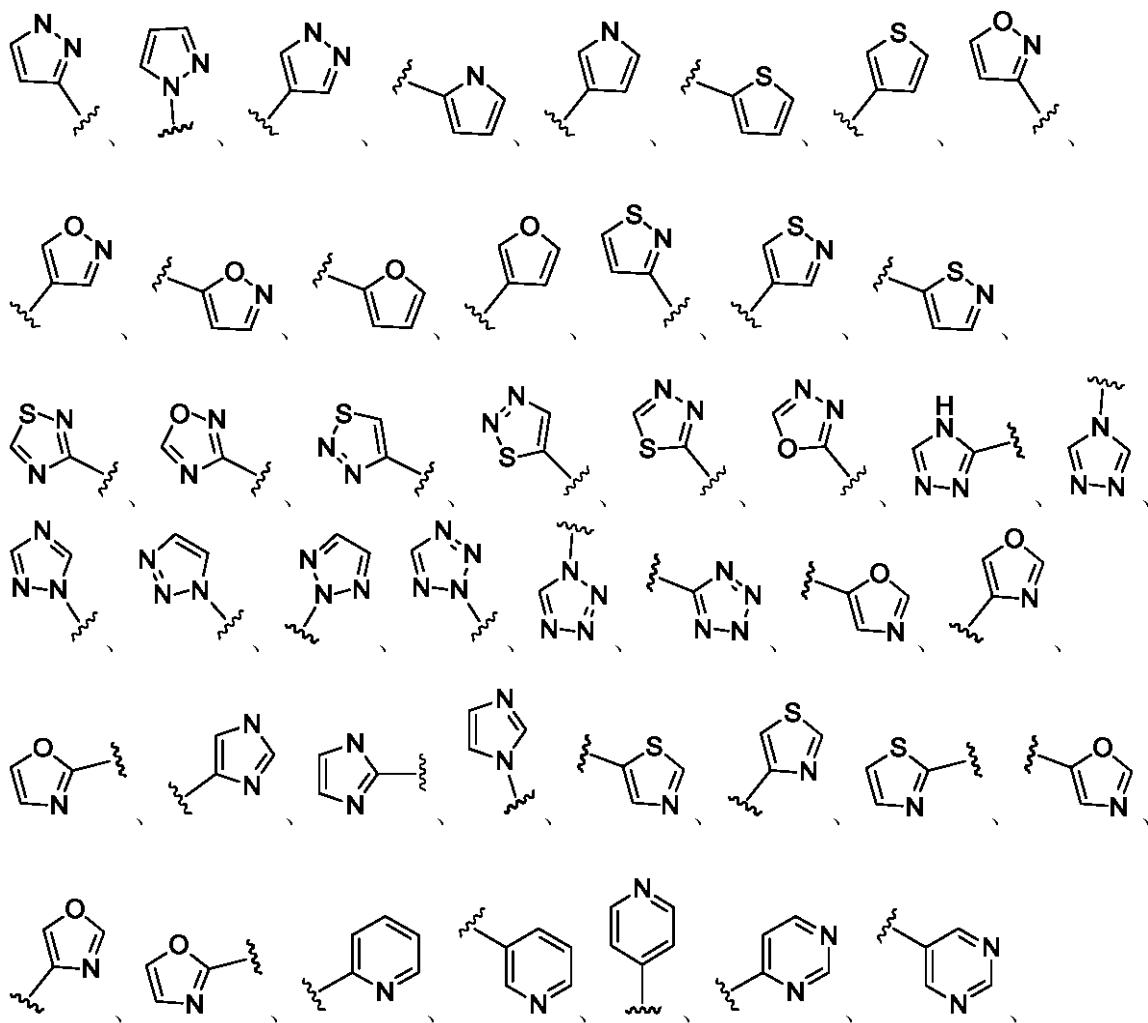
からなる群から選択され、

式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項1～21のいずれか一項に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

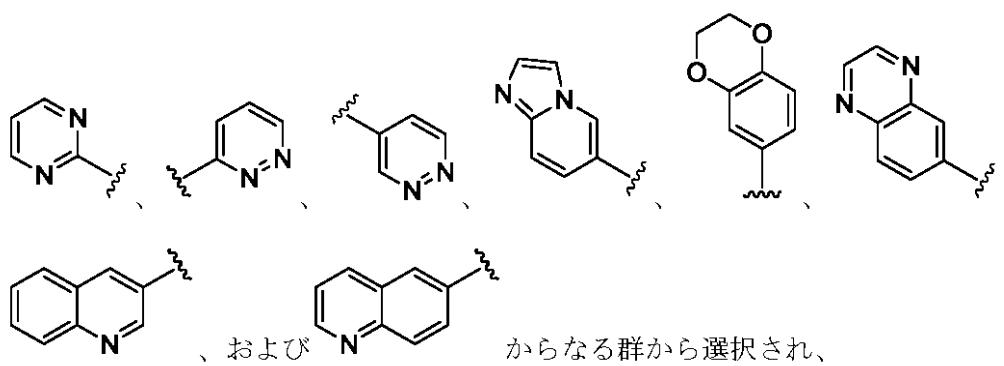
【請求項23】

WまたはB¹が、

【化 1 0 7 - 1】



【化 1 0 7 - 2】

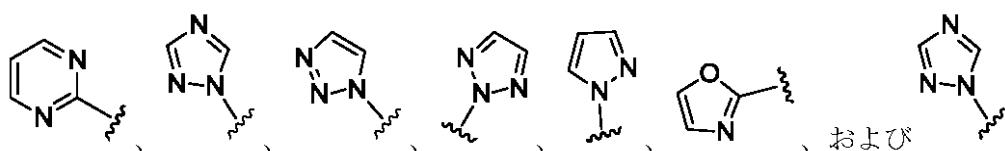


式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項 2 2 に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 2 4】

W または B⁻¹ が、

【化108】

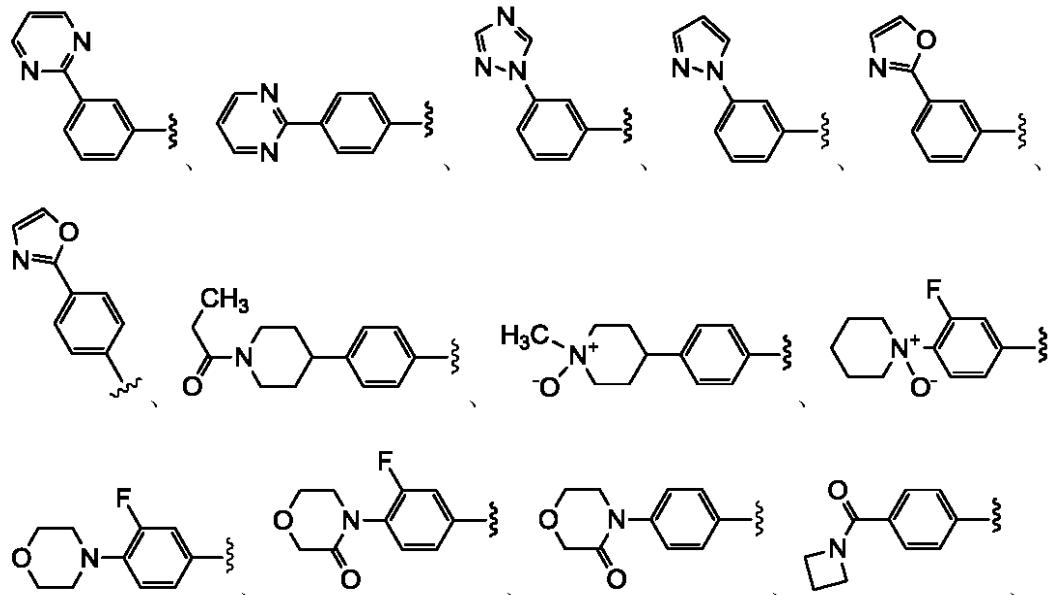


からなる群から選択される、請求項23に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

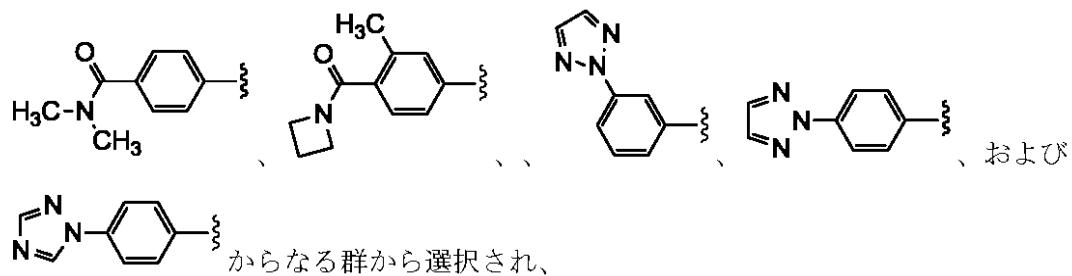
【請求項25】

B¹-P h - が、

【化109-1】



【化109-2】

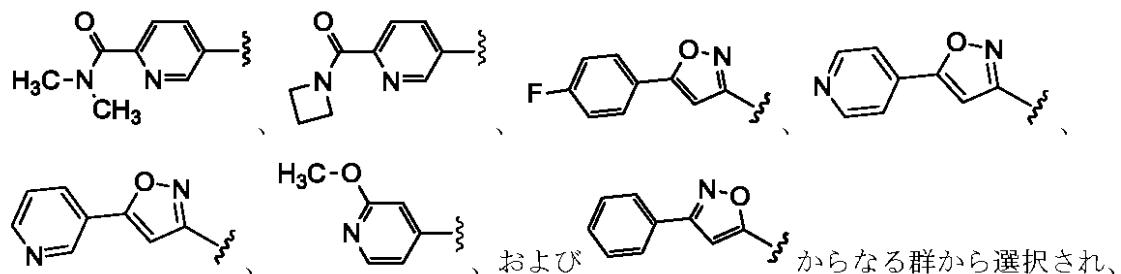


式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項1～24のいずれか一項に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項26】

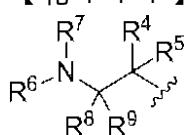
B¹-H E T - が、

【化110】



【請求項27】
Yが、

【化111】

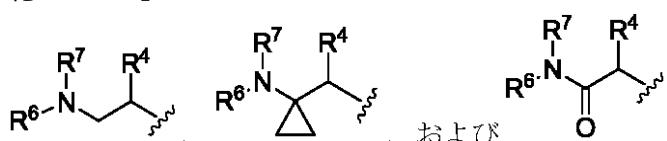


であり、

式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項1～26のいずれか一項に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項28】
Yが、

【化112】

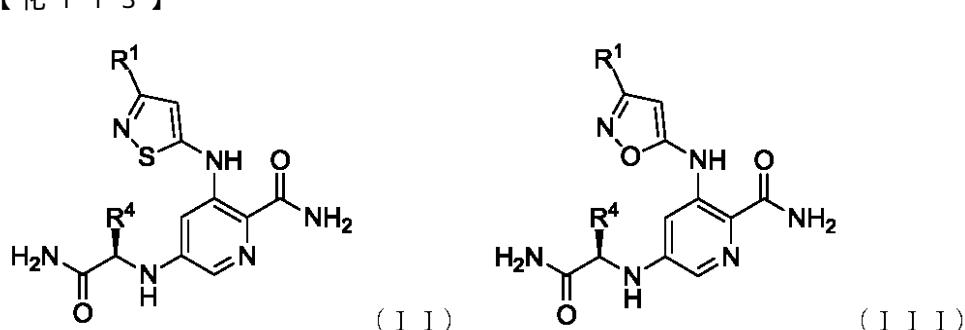


からなる群から選択され、

式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項1～27のいずれか一項に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項29】
式(I I)または式(I I I)

【化113】



の請求項28に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項30】

R^6 および R^7 が H であり、 R^4 が、H、C₁ ~ 8 アルキル、ハロ C₁ ~ 8 アルキル、シクロアルキル、(シクロアルキル) C₁ ~ 4 アルキル、(ヒドロキシ) C₁ ~ 4 アルキル、(C₁ ~ 4 アルコキシ) C₁ ~ 4 アルキル、(ハロ C₁ ~ 4 アルコキシ) C₁ ~ 4 アルキル、(CH₂)_p NR⁴^b R⁴^c、(CH)_p SO₂ NR⁴^b R⁴^c、(CH₂)_p SOR⁴^a、(CH₂)_p SO₂ R⁴^a、(CH₂)_f CONR⁴^b R⁴^c、(CH₂)_p NR⁴^b COR⁴^d、フェニル、ヘテロアリール、(フェニル) C₁ ~ 8 アルキル、および(ヘテロアリール) C₁ ~ 8 アルキルからなる群から選択され、前記フェニルおよびヘテロアリールが、ハロ、C₁ ~ 4 アルキル、ハロ C₁ ~ 4 アルキル、C₁ ~ 4 アルコキシ、およびハロ C₁ ~ 4 アルコキシから独立して選択される 1 ~ 3 個の基で任意に置換される、請求項 28 または 29 に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

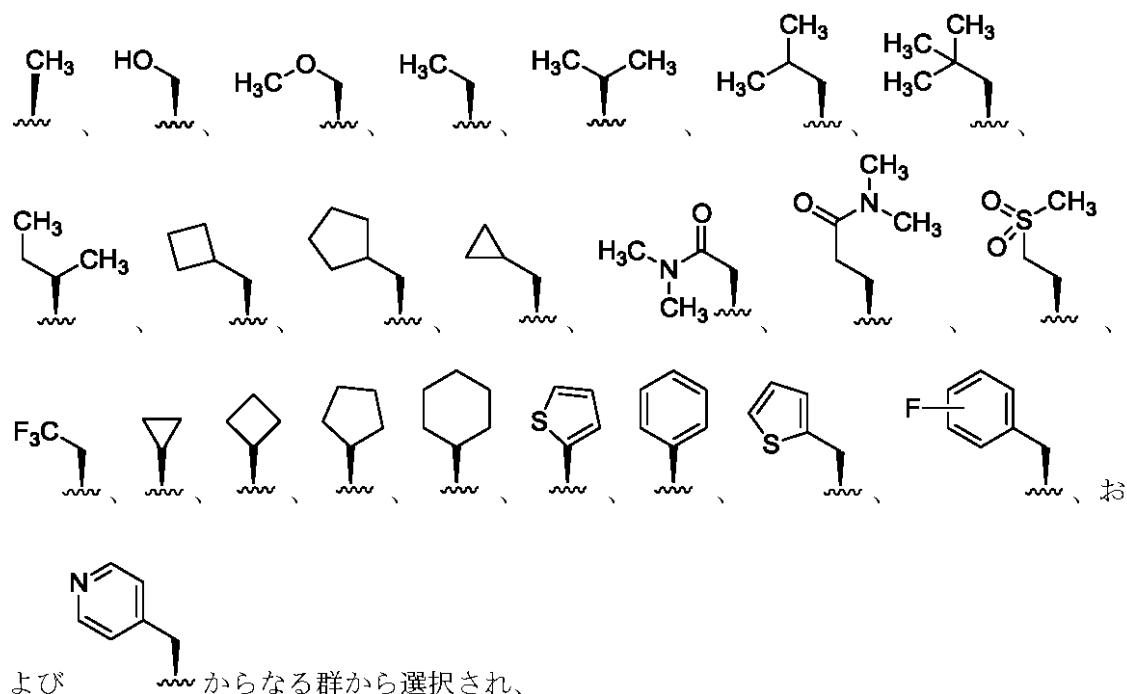
【請求項 31】

R^4 が、H、メチル、エチル、プロピル、イソブチル、ヒドロキシメチル、ピリジル、およびフェニルからなる群から選択され、前記ピリジルおよびフェニルが、ハロ、C₁ ~ 4 アルキル、ハロ C₁ ~ 4 アルキル、C₁ ~ 4 アルコキシ、およびハロ C₁ ~ 4 アルコキシから独立して選択される 1 ~ 3 個の基で任意に置換される、請求項 30 に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 32】

R^4 が、

【化 114】



式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項 28 または 29 に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 33】

R^1 が、ハロ、C₁ ~ 8 アルキル、ハロ C₁ ~ 8 アルキル、シアノ、オキソ、OH、O(C₁ ~ 8 アルキル)、O(ハロ C₁ ~ 8 アルキル)、CO-NR^aR^b、フェニル、ヘテロアリール、およびヘテロシクリルからなる群から選択され、前記フェニル、ヘテロアリール、およびヘテロシクリルが各々、1 ~ 3 個の R^2 で任意に置換され、 R^a および R^b が一緒になって、ハロ、C₁ ~ 8 アルキル、およびハロ C₁ ~ 8 アルキルから独立して選択される 1 ~ 3 個の基で任意に置換される 4 ~ 6 員の複素環を形成する、請求項 29 ~

3 2 のいずれか一項に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

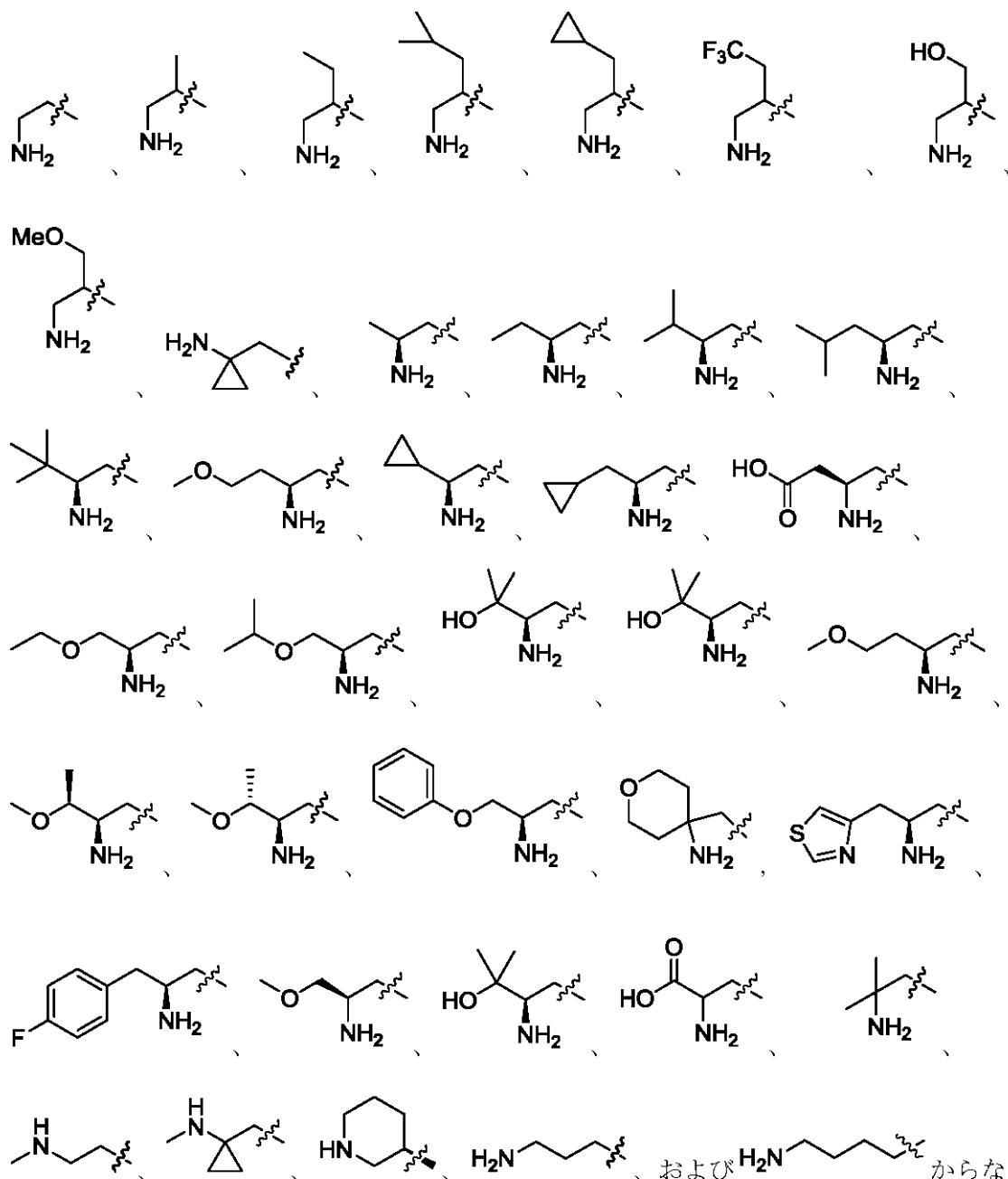
【請求項 3 4】

R^1 がメチルである、請求項 3 3 に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 3 5】

Y が、

【化 1 1 5】



群から選択され、

式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項 2 7 に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 3 6】

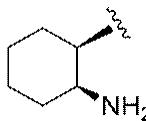
Y が $(CH_2)_v(X)$ であり、式中、 v が 0 であり、X がシクロアルキルまたはヘテロシクロアルキルであり、各々が、1 ~ 3 個の $R^{1~0}$ で任意に置換される、請求項 1 ~ 2

6のいずれか一項に記載の化合物、またはその互変異性体もしくはその薬学的に許容される塩。

【請求項 3 7】

Yが、

【化 1 1 6】



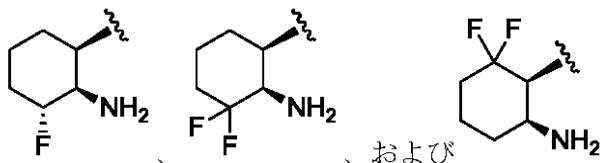
であり、

1～2個のハロで任意に置換され、式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項36に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 3 8】

Yが、

【化 1 1 7】



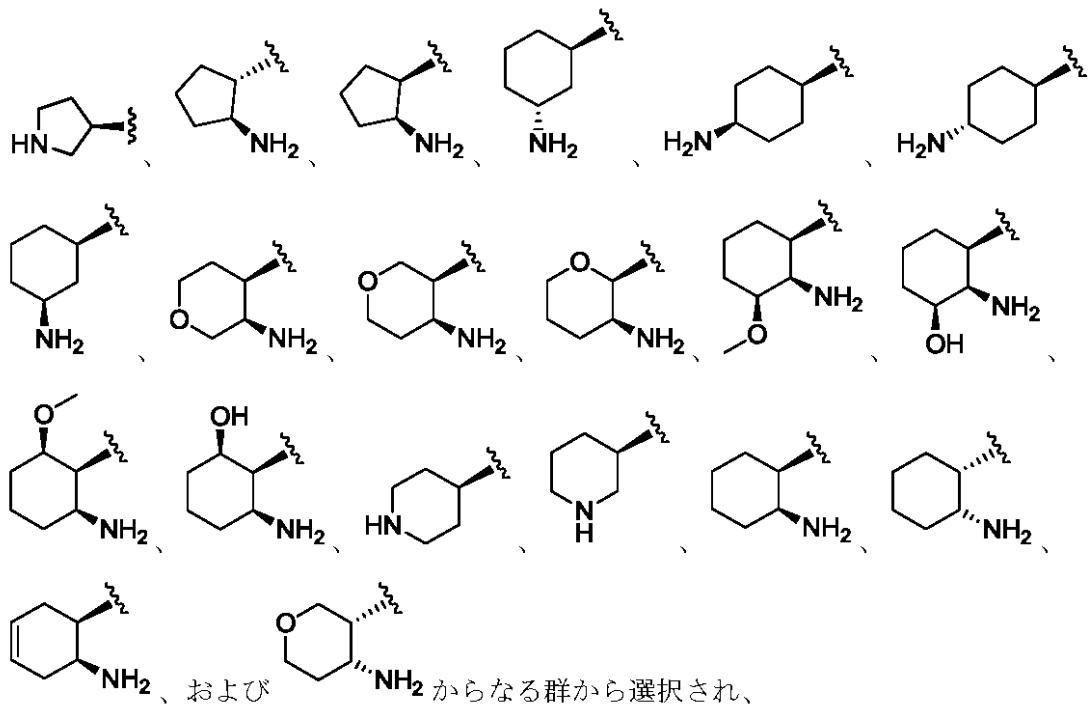
からなる群から選択され、

式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項37に記載の化合物またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 3 9】

Yが、

【化 1 1 8】

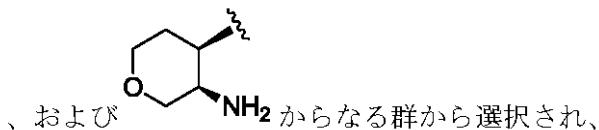
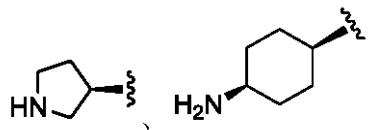


式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項36に記載の化合物またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

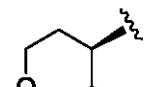
【請求項 4 0】

Yが、

【化 1 1 9】



、および

NH₂からなる群から選択され、

式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、請求項 3 9 に記載の化合物またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 4 1】

(R) - 5 - (1 - アミノ - 4 - メチル - 1 - オキソペンタン - 2 - イルアミノ) - 3 - (3 - メチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ)ピコリンアミド、
 5 - ((1 R, 2 R) - 2 - アミノ - 3, 3 - ジフルオロシクロヘキシルアミノ) - 3 - (3 - メチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ)ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 3 - シクロプロピル - 1 - オキソプロパン - 2 - イルアミノ) - 3 - (3 - メチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ)ピコリンアミド、
 5 - ((1 R, 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシルアミノ) - 3 - (3 - メチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ)ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 1 - オキソブタン - 2 - イルアミノ) - 3 - (3 - メチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ)ピコリンアミド、
 3 - (3 - (2 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 2 - イル)フェニルアミノ) - 5 - ((1 R, 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシルアミノ)ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 3 - メチル - 1 - オキソブタン - 2 - イルアミノ) - 3 - (3 - メチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ)ピコリンアミド、
 5 - ((1 R, 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシルアミノ) - 3 - (3 - フェニルイソオキサゾール - 5 - イルアミノ)ピコリンアミド、
 5 - ((1 R, 2 R) - 2 - アミノ - 3, 3 - ジフルオロシクロヘキシルアミノ) - 3 - (3 - フェニルイソオキサゾール - 5 - イルアミノ)ピコリンアミド、
 5 - ((1 R, 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシルアミノ) - 3 - (3 - メチルイソオキサゾール - 5 - イルアミノ)ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 4 - メチル - 1 - オキソペンタン - 2 - イルアミノ) - 3 - (3 - フェニルイソオキサゾール - 5 - イルアミノ)ピコリンアミド、
 5 - ((1 R, 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシルアミノ) - 3 - (イソキノリン - 6 - イルアミノ)ピコリンアミド、
 5 - ((1 R, 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシルアミノ) - 3 - (キノリン - 3 - イルアミノ)ピコリンアミド、
 5 - ((1 R, 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシルアミノ) - 3 - (イソキノリン - 7 - イルアミノ)ピコリンアミド、
 5 - ((1 R, 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシルアミノ) - 3 - (キノリン - 7 - イルアミノ)ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 4 - メチル - 1 - オキソペンタン - 2 - イルアミノ) - 3 - (キノリン - 6 - イルアミノ)ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 4 - メチル - 1 - オキソペンタン - 2 - イルアミノ) - 3 - (イソキノリン - 6 - イルアミノ)ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 3 - シクロヘキシル - 1 - オキソプロパン - 2 - イルアミノ) - 3 - (3 - メチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ)ピコリンアミド、
 (R) - 3 - (3 - (2 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 2 - イル)フェニルアミノ) - 5 - (1 - アミノ - 4 - メチル - 1 - オキソペンタン - 2 - イルアミノ)ピコリンアミド

、
(R) - 5 - (1 - アミノ - 4 - メチル - 1 - オキソペンタン - 2 - イルアミノ) - 3 -
(キノリン - 3 - イルアミノ) ピコリンアミド、
(R) - 5 - (1 - アミノ - 4 - メチル - 1 - オキソベンタン - 2 - イルアミノ) - 3 -
(イソキノリン - 7 - イルアミノ) ピコリンアミド、
(R) - 5 - (1 - アミノ - 4 - メチル - 1 - オキソベンタン - 2 - イルアミノ) - 3 -
(キノリン - 7 - イルアミノ) ピコリンアミド、
5 - ((3 R , 4 R) - 3 - アミノテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イルアミノ) - 3 -
- (3 - メチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
5 - ((1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシリアミノ) - 3 - (1 - メチル - 1 H -
ピラゾール - 4 - イルアミノ) ピコリンアミド、
5 - ((1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシリアミノ) - 3 - (ピラゾロ [1 , 5 -
a] ピリジン - 3 - イルアミノ) ピコリンアミド、
5 - ((1 S , 4 S) - 4 - アミノシクロヘキシリアミノ) - 3 - (3 - メチルイソチア
ゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
5 - ((1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシリアミノ) - 3 - (イソチアゾール - 4
- イルアミノ) ピコリンアミド、
5 - (1 - カルバモイルシクロプロピルアミノ) - 3 - (3 - メチルイソチアゾール - 5
- イルアミノ) ピコリンアミド、
(R) - 5 - (1 - アミノ - 3 - メチル - 1 - オキソブタン - 2 - イルアミノ) - 3 -
(3 - エチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
5 - ((1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシリアミノ) - 3 - (3 - シクロプロピル
イソオキサゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
(R) - 5 - (1 - アミノ - 3 - メチル - 1 - オキソブタン - 2 - イルアミノ) - 3 -
(3 - シクロプロピルイソオキサゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
5 - ((1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシリアミノ) - 3 - (3 - イソプロピルイ
ソオキサゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
5 - ((1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシリアミノ) - 3 - (3 - エチルイソオキ
サゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
(R) - 5 - (1 - アミノ - 1 - オキソブタン - 2 - イルアミノ) - 3 - (3 - シクロプロ
ピルイソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
(R) - 5 - (1 - アミノ - 3 , 3 - ジメチル - 1 - オキソブタン - 2 - イルアミノ) -
3 - (3 - シクロプロピルイソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
(R) - 5 - (1 - アミノ - 4 , 4 - ジメチル - 1 - オキソベンタン - 2 - イルアミノ)
- 3 - (8 - フルオロキノリン - 6 - イルアミノ) ピコリンアミド、
(R) - 5 - (1 - アミノ - 4 , 4 - ジメチル - 1 - オキソベンタン - 2 - イルアミノ)
- 3 - (キノリン - 7 - イルアミノ) ピコリンアミド、
(R) - 5 - (2 - アミノ - 2 - オキソ - 1 - フェニルエチルアミノ) - 3 - (3 - メチ
ルイソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
(R) - 5 - (1 - アミノ - 1 - オキソプロパン - 2 - イルアミノ) - 3 - (3 - メチル
イソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
(R) - 5 - (1 - アミノ - 4 , 4 , 4 - トリフルオロ - 1 - オキソブタン - 2 - イルア
ミノ) - 3 - (3 - メチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
(R) - 5 - (1 - アミノ - 4 - (メチルスルホニル) - 1 - オキソブタン - 2 - イルア
ミノ) - 3 - (3 - メチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
(R) - 5 - (2 - アミノ - 1 - シクロプロピル - 2 - オキソエチルアミノ) - 3 - (3
- メチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
(R) - 5 - (1 - アミノ - 4 - メチル - 1 - オキソベンタン - 2 - イルアミノ) - 3 -
(3 - (ピリジン - 4 - イル) イソオキサゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
(R) - 5 - (1 - アミノ - 3 - メトキシ - 1 - オキソプロパン - 2 - イルアミノ) - 3

- (3 - メチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 5 - ((1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシリルアミノ) - 3 - (3 - (ピリジン - 4
 - イル) イソオキサゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 5 - ((1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシリルアミノ) - 3 - (3 - (ピリジン - 3
 - イル) イソオキサゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 4 , 4 , 4 - トリフルオロ - 1 - オキソブタン - 2 - イルア
 ミノ) - 3 - (キノリン - 7 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 5 - ((3 R , 4 R) - 3 - アミノテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イルアミノ) - 3
 - (3 - (ピリジン - 4 - イル) イソオキサゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 5 - ((3 R , 4 R) - 3 - アミノテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イルアミノ) - 3
 - (3 - (ピリジン - 3 - イル) イソオキサゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 (R) - 3 - (1 , 5 - ナフチリジン - 3 - イルアミノ) - 5 - (1 - アミノ - 1 - オキ
 ソブタン - 2 - イルアミノ) ピコリンアミド、および
 5 - (((1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシリル) アミノ) - 3 - ((3 - (オキサ
 ゾール - 2 - イル) フェニル) アミノ) ピコリンアミド、から選択される構造を有する、
 化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 4 2】

請求項 4 1 に見られる構造を有する、式 (I a) または式 (I b) の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 4 3】

請求項 4 1 に見られる構造を有する、式 (I I) または式 (I I I) の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

【請求項 4 4】

薬学的に許容される担体または希釈剤と組み合わせて、請求項 1 ~ 4 3 のいずれかに記載の化合物、またはその互変異性体もしくはその薬学的に許容される塩を含む、組成物。

【請求項 4 5】

s y k キナーゼ活性により少なくとも一部媒介される s y k もしくは J A K キナーゼ、またはシグナル変換経路を阻害するための組成物であって、請求項 1 ~ 4 3 のいずれか一項に記載の化合物を含む、細胞が前記組成物に接触させられることを特徴とする、組成物。

【請求項 4 6】

s y k キナーゼ活性により少なくとも一部媒介される状態または障害を治療するための請求項 4 4 に記載の組成物。

【請求項 4 7】

前記状態または障害が、心臓血管疾患、炎症性疾患、自己免疫疾患、および細胞増殖性障害からなる群から選択される、請求項 4 6 に記載の組成物。

【請求項 4 8】

前記心臓血管疾患が、再狭窄、血栓形成、免疫性血小板減少性紫斑病、ヘパリン起因性血小板減少症、拡張型心筋症、鎌状赤血球病、アテローム性動脈硬化症、心筋梗塞症、血管炎症、不安定狭心症、および急性冠症候群からなる群から選択され、

前記炎症性疾患が、アレルギー、喘息、リウマチ性関節炎、B 細胞媒介性疾患、非ホジキンリンパ腫、抗リン脂質症候群、狼瘡、乾癬、多発性硬化症、および末期の腎疾患からなる群から選択され、

前記自己免疫疾患が、溶血性貧血、免疫性血小板減少性紫斑病、多発性硬化症、シェーベレン症候群、糖尿病、リウマチ性関節炎、狼瘡、および乾癬からなる群から選択され、前記細胞増殖障害が、白血病、リンパ腫、骨髄増殖性障害、血液悪性腫瘍、および慢性特発性骨髄線維症である、請求項 4 7 に記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】 0 0 3 3

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【0 0 3 3】

本発明のこれらおよび他の実施形態、目的、特徴、および利点は、以下の詳細な説明を参照することにより明らかとなるであろう。この目的を達成するために、特定の背景情報、手順、化合物および/または組成物をより詳細に記載する様々な参照が本明細書で明記され、そのそれぞれは参照によりその全体が本明細書に組み込まれる。

本発明は、例えば、以下を提供する。

(項目1)

式(I) :

【化91-1】



(I)

の化合物であって、式中、

Tが $(CH_2)_d(X^1)$ であり、 X^1 が、アリール、ならびにS、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む单環式または二環式ヘテロアリールからなる群から選択され、アリールおよびヘテロアリールが、1~5個のR¹で任意に置換され、dが0または1であり、

各R¹が独立して、ハロ、C_{1~8}アルキル、C_{2~8}アルケニル、ハロC_{1~8}アルキル、 $(CH_2)_nSR^{1a}$ 、 $(CH_2)_nOR^{1a}$ 、 $O(CH_2)_jOR^{1a}$ 、 $(CH_2)_nNR^{1b}R^{1c}$ 、 $(CH_2)_nCOR^{1e}$ 、 $(CH_2)_nCONR^{1b}R^{1c}$ 、 $(CH_2)_nNR^{1b}COR^{1e}$ 、 $(CH_2)_nCONR^{1b}(OR^{1a})$ 、 $(CH_2)_nCO_2R^{1a}$ 、 $O(CH_2)_nCO_2R^{1a}$ 、 $(CH_2)_nNR^{1b}CO_2R^{1a}$ 、 $(CH_2)_nSO_2NR^{1b}R^{1c}$ 、 $(CH_2)_nNR^{1b}SO_2R^{1e}$ 、 $(CH_2)_nSOR^{1e}$ 、 $(CH_2)_nSO_2R^{1e}$ 、オキソ、 $(CH_2)_nCN$ 、 N_3 、 NO_2 、および-L-Wからなる群から選択され、式中、nが、0、1、2、3、4、5、または6であり、jが、1、2、3、4、5、または6であり、

Lが、-O(CH₂)_b-、-SO-、-SO₂-、-CO-、-NR^{1d}-、-CONR^{1d}(CH₂)_b-、-NR^{1d}CO-、-NR^{1d}SO₂-、-SO₂NR^{1d}-、結合、および-L(CH₂)_z-からなる群から選択され、式中、bが、0、1、2、3、4、または5であり、zが、1、2、3、4、または5であり、

Wが、アリール、S、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む单環式または二環式ヘテロアリール、C_{3~8}シクロアルキル、ならびにS、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む3~8員のヘテロシクリルからなる群から選択され、各々が、1~3個のR²で任意に置換され、

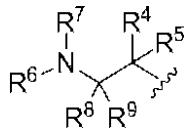
各R²が独立して、ハロ、C_{1~8}アルキル、C_{2~8}アルケニル、ハロC_{1~8}アルキル、 $(CH_2)_mSR^{2a}$ 、 $(CH_2)_mOR^{2a}$ 、 $O(CH_2)_kOR^{2a}$ 、 $(CH_2)_mNR^{2b}R^{2c}$ 、 $(CH_2)_mCOR^{2e}$ 、 $(CH_2)_mCONR^{2b}R^{2c}$ 、 $(CH_2)_mNR^{2b}COR^{2e}$ 、 $(CH_2)_mCONR^{2b}(OR^{2a})$ 、 $(CH_2)_mCO_2R^{2a}$ 、 $O(CH_2)_mCO_2R^{2a}$ 、 $(CH_2)_mNR^{2b}CO_2R^{2a}$ 、 $(CH_2)_mSO_2NR^{2b}R^{2c}$ 、 $(CH_2)_mNR^{2b}SO_2R^{2e}$ 、 $(CH_2)_mSOR^{2e}$ 、 $(CH_2)_mSO_2R^{2e}$ 、オキソ、 $(CH_2)_mCN$ 、 N_3 、および NO_2 からなる群から選択され、式中、mが、0、1、2、3、4、5、または6であり、kが、1、2、3、4、5、または6であり、

R¹^a、R¹^b、R¹^c、R¹^d、R²^a、R²^b、およびR²^cが独立して、H、C₁-₈アルキル、C₂-₈アルケニル、およびハロC₁-₈アルキルからなる群から選択され、

R¹^eおよびR²^eが独立して、C₁-₈アルキル、C₂-₈アルケニル、およびハロC₁-₈アルキルからなる群から選択され、

Yが、

【化91-2】



または(C H₂)_v(X²)であり、式中、

vが、0、1、2、または3であり、

X²が、C H₂C H₃、(C H₂)₃N H₂、C₃-₈シクロアルキル、S、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む3~8員のヘテロシクリル、アリール、ならびにS、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む单環式または二環式ヘテロアリールからなる群から選択され、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、およびヘテロアリールが各々、1~3個のR¹⁰で任意に置換され、

R⁴が、H、ハロ、C₁-₈アルキル、C₂-₈アルケニル、ハロC₁-₈アルキル、(C H₂)_pS R⁴^a、(C H₂)_pS O R⁴^a、(C H₂)_pS O₂R⁴^a、(C H₂)_pO R⁴^a、(C H₂)_pN R⁴^bR⁴^c、(C H₂)_fC O N R⁴^bR⁴^c、(C H₂)_pN R⁴^bC O R⁴^d、(C H₂)_fC O₂R⁴^a、(C H₂)_pN R⁴^bC O₂R⁴^a、(C H₂)_fC₃-₈シクロアルキル、(C H₂)_p(O)C₃-₈シクロアルキル、(C H₂)_p(S)C₃-₈シクロアルキル、(C H)_pS O₂N R⁴^bR⁴^c、(C H₂)_pN H C₃-₈シクロアルキル、(C H₂)_fC N、(C H₂)_f(アリール)、(C H₂)_f(S、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む单環式または二環式ヘテロアリール)、(C H₂)_f(アリール)(S、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む单環式または二環式ヘテロアリール)、(C H₂)_f(S、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む3~8員のヘテロシクリル)からなる群から選択され、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、およびヘテロシクリルが各々、1~3個のR¹¹^aで任意に置換され、fが、0、1、2、3、4、5、または6であり、pが、1、2、3、4、5、または6であるか、あるいは、R⁴およびR⁵が一緒になって、=Oを形成するか、または1~3個のR¹¹^aで任意に置換される3~8員の炭素環式もしくは複素環式環を形成し、

R⁵が、HおよびC₁-₈アルキルからなる群から選択され、

R⁶が、H、C₁-₈アルキル、O H、O(C₁-₈アルキル)、C O₂R⁶^a、C O(N R⁶^aR⁶^b)、およびC₃-₈シクロアルキルからなる群から選択されるか、またはR⁶が、R⁷およびそれらが結合する原子と一緒にになって、1~3個のR¹¹^bで任意に置換されるヘテロシクリル環を形成し、

R⁷が、H、C₁-₈アルキル、およびシクロアルキルからなる群から選択され、

R⁸が、H、C₁-₈アルキル、(C H₂)_uN R⁸^bR⁸^c、(C H₂)_gC O N R⁸^bR⁸^c、(C H₂)_gC O(C H₂)_uN R⁸^bR⁸^c、(C H₂)_gC O₂R⁸^a、(C H₂)_uO R⁸^a、C H(C₁-₈アルキル)O R⁸^a、(C H₂)_gC₃-₈シクロアルキル、(C H₂)(S、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む

3 ~ 8 員のヘテロシクリル)、(CH₂)_gアリール、(CH₂)(S、O、およびNから選択される1 ~ 4個のヘテロ原子を含む単環式または二環式ヘテロアリール)、ならびに(CH₂)_u(O)(アリール)からなる群から選択され、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、およびヘテロシクリルが各々、1 ~ 3個のR^{1~1c}で任意に置換され、gが、0、1、2、3、4、5、または6であり、uが、1、2、3、4、5、または6であるか、あるいはR⁸が、R⁹およびそれらが結合する原子と一緒にになって、=O、=Sを形成するか、またはR^{1~1c}で任意に置換されるシクロアルキルもしくはヘテロシクリル環を形成し、

R⁹が、Hまたはアルキルであり、

R^{1~0}が独立して、ハロ、C_{1~8}アルキル、C_{2~8}アルケニル、ハロC_{1~8}アルキル、(CH₂)_qSR^{1~0a}、(CH₂)_qOR^{1~0a}、(CH₂)_qNR^{1~0b}R^{1~0c}、(CH₂)_qCOR^{1~0d}、(CH₂)_qCONR^{1~0b}R^{1~0c}、(CH₂)_qNR^{1~0b}COR^{1~0d}、(CH₂)_qCONR^{1~0b}(OR^{1~0a})、(CH₂)_qCO₂R^{1~0a}、O(CH₂)_qCO₂R^{1~0a}、(CH₂)_qNR^{1~0b}CO₂R^{1~0a}、(CH₂)_qSO₂NR^{1~0b}R^{1~0c}、(CH₂)_qNR^{1~0b}SO₂R^{1~0d}、(CH₂)_qSOR^{1~0d}、(CH₂)_qSO₂R^{1~0d}、オキソ、(CH₂)_qCN、N₃、N=CH₂、NO₂、C(O)(S、O、およびNから選択される1 ~ 4個のヘテロ原子を含む3 ~ 8員のヘテロシクリル)、アリール、S、O、およびNから選択される1 ~ 4個のヘテロ原子を含む単環式または二環式ヘテロアリール、C_{3~8}シクロアルキル、ならびにS、O、およびNから選択される1 ~ 4個のヘテロ原子を含む3 ~ 8員のヘテロシクリルからなる群から選択され、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、およびヘテロシクリルが各々、1 ~ 3個のR^{1~1d}で任意に置換され、qが、0、1、2、3、4、5、または6であり、

R^{1~1a}、R^{1~1b}、R^{1~1c}、およびR^{1~1d}が独立して、ハロ、C_{1~8}アルキル、ハロC_{1~8}アルキル、OH、C_{1~8}アルコキシ、ハロC_{1~8}アルコキシ、C(O)C_{1~8}アルキル、CO₂C_{1~8}アルキル、およびSO₂C_{1~8}アルキルからなる群から選択され、

R^{4a}、R^{4b}、R^{4c}、R^{6a}、R^{6b}、R^{8a}、R^{8b}、R^{8c}、R^{1~0a}、R^{1~0b}、およびR^{1~0c}が独立して、H、C_{1~8}アルキル、C_{2~8}アルケニル、およびハロC_{1~8}アルキルからなる群から選択され、

R^{4d}およびR^{1~0d}が独立して、C_{1~8}アルキル、C_{2~8}アルケニル、およびハロC_{1~8}アルキルからなる群から選択され、

式中、波線が、分子の残りへの結合点を示し、

但し、Yが2-アミノシクロヘキシリルまたはジメチルアミノエチルであり、Tがフェニルまたはナフタレンであるとき、Tが、C_{2~8}アルケニル、O(CH₂)_jOR^{1~a}、(CH₂)_nCONR^{1~b}R^{1~c}、(CH₂)_nNR^{1~b}COR^{1~e}、(CH₂)_nCONR^{1~b}(OR^{1~a})、(CH₂)_nCO₂R^{1~a}、O(CH₂)_nCO₂R^{1~a}、(CH₂)_nNR^{1~b}CO₂R^{1~a}、(CH)_nSO₂NR^{1~b}R^{1~c}、(CH₂)_nNR^{1~b}SO₂R^{1~e}、(CH₂)_nSOR^{1~e}、(CH₂)_nSO₂R^{1~e}、N₃、および-L-Wからなる群から選択される少なくとも1個のR¹で置換され、式中、Lが、-SO₂-、-SO₂-、-CO-、-NR^{1~d}-、-CONR^{1~d}(CH₂)_b-、-NR^{1~d}C_{2~8}O-、-NR^{1~d}SO₂-、-SO₂NR^{1~d}-、結合、および-(CH₂)_z-からなる群から選択されるものとする、化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

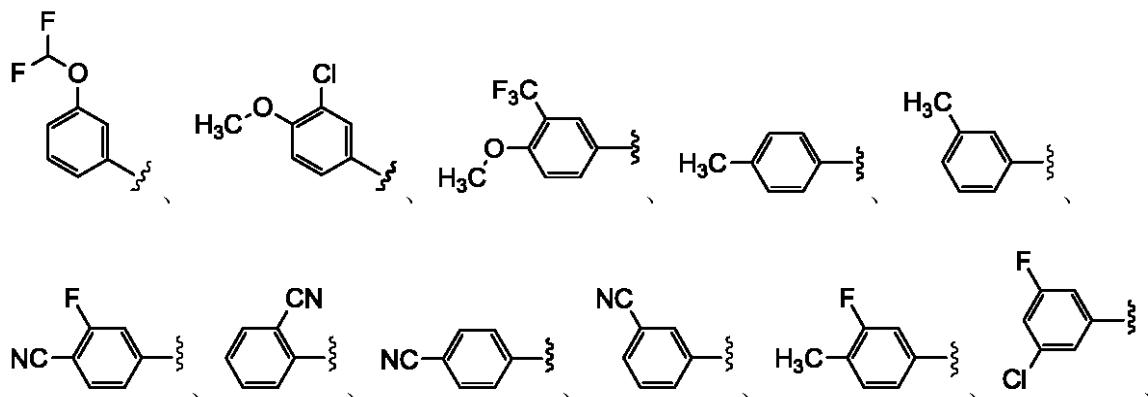
(項目2)

Tが、1 ~ 5個のR¹で置換されるフェニルである、項目1に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

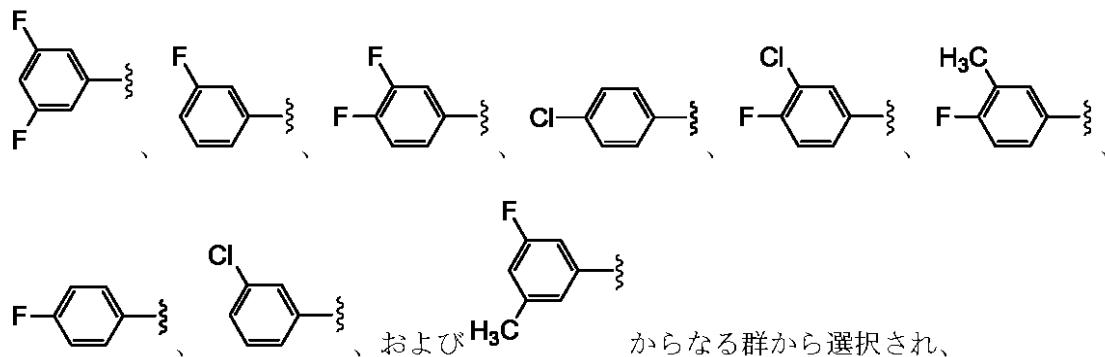
(項目3)

Tが、

【化92-1】



【化92-2】



式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目1に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

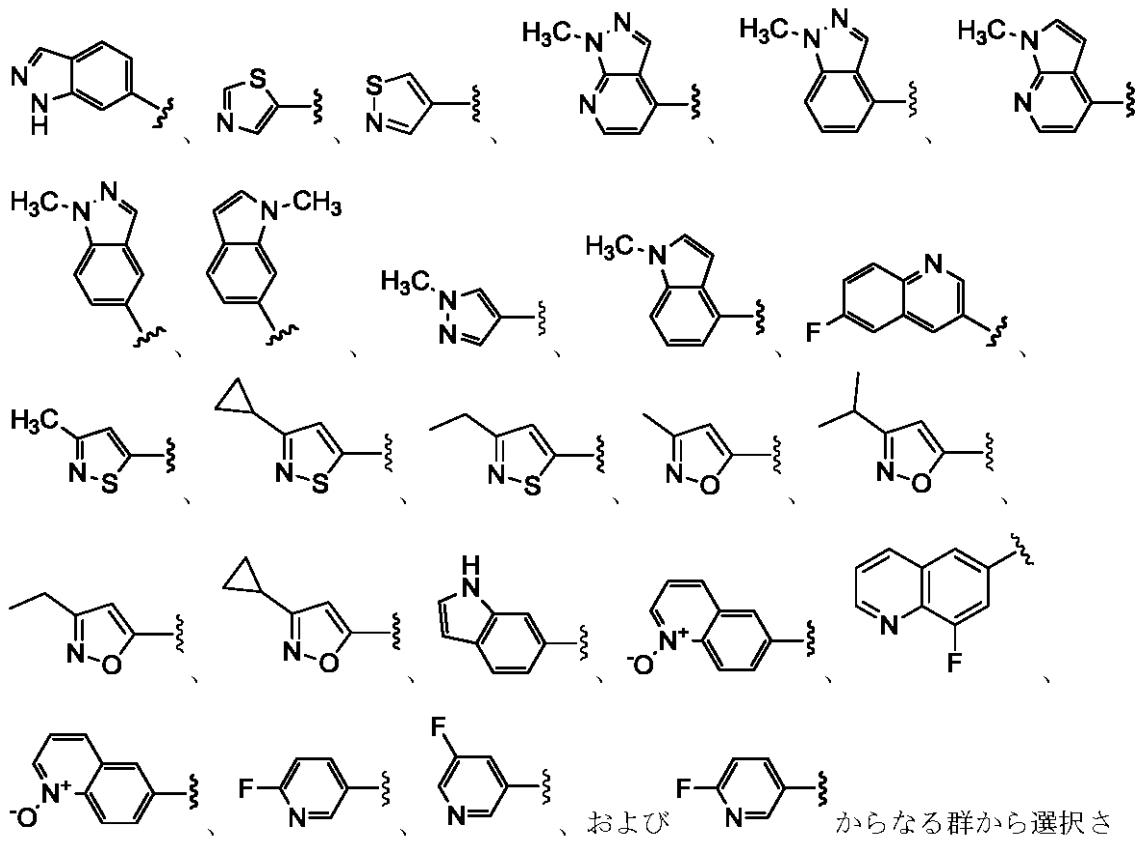
(項目4)

Tが、S、O、およびNから選択される1～4個のヘテロ原子を含み、1～5個のR¹で任意に置換される単環式または二環式ヘテロアリールである、項目1に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目5)

Tが、

【化 9 3】



式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目1に記載の化合物、またはその互変異性体をしくは薬理的に許容される複

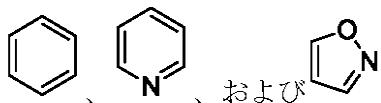
本じりは

少なくとも 1 個の R¹ が -L-W である、項目 1 ~ 5 のいずれかに記載の化合物、またはその互変異性体をしくは薬学的に許容される塩

三、 (項目7)

(場合 7)
- L - W が - C O - N R ^a R ^b であり、 R ^a および R ^b が一緒にになって、ハロ、 C ₁ -
₈ アルキル、およびハロ C ₁ - ₈ アルキルから独立して選択される 1 ~ 3 個の基で任意に
置換される 4 ~ 6 員環を形成するか、または、 L が結合であり、 W が、

【化 9 4】

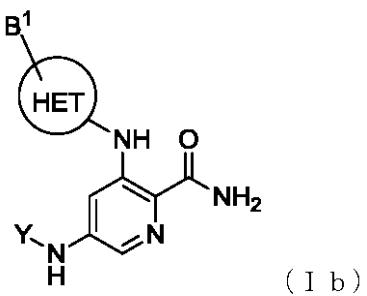
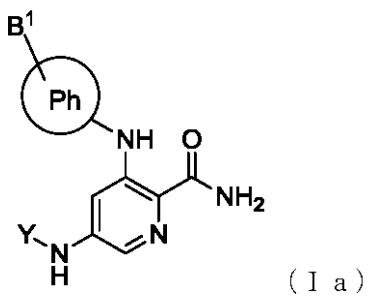


からなる群から選択される、項目 6 に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目 8)

式 (I a) または (I b)

【化 9 5】



の項目 1 に記載の化合物であって、式中、

Ph が、1～3個の R' で任意に置換されるフェニルであり、

HETが、S、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含み、1~3個のR¹で任意に置換される単環式または二環式ヘテロアリールであり、

B¹が、CO-NR^aR^b、フェニル、S、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む単環式または二環式ヘテロアリール、ならびにS、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む3~8員のヘテロシクリルからなる群から選択され、フェニル、ヘテロアリール、およびヘテロシクリルが各々、1~3個のR²で任意に置換され、R^aおよびR^bが一緒になって、ハロ、C_{1~8}アルキル、およびハロC_{1~8}アルキルから独立して選択される1~3個の基で任意に置換される4~6員の複素環式環を形成する、化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩が提供される。

(項目 9)

式 (I a) 中の B¹ が、S、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含む单環式または二環式ヘテロアリールであるか、またはS、O、およびNから選択される1~4個のヘテロ原子を含み、各々が、1~3個のR²で任意に置換される3~8員のヘテロシクリルであり。

式 (I b) 中の B¹ が、フェニル、または S、O、および N から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含み、各々が、1 ~ 3 個の R² で任意に置換される 3 ~ 8 員のヘテロシクリルである、項目 8 に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目 10)

W または B¹ が、1～3個の R² で置換される、項目 1 または 8 に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

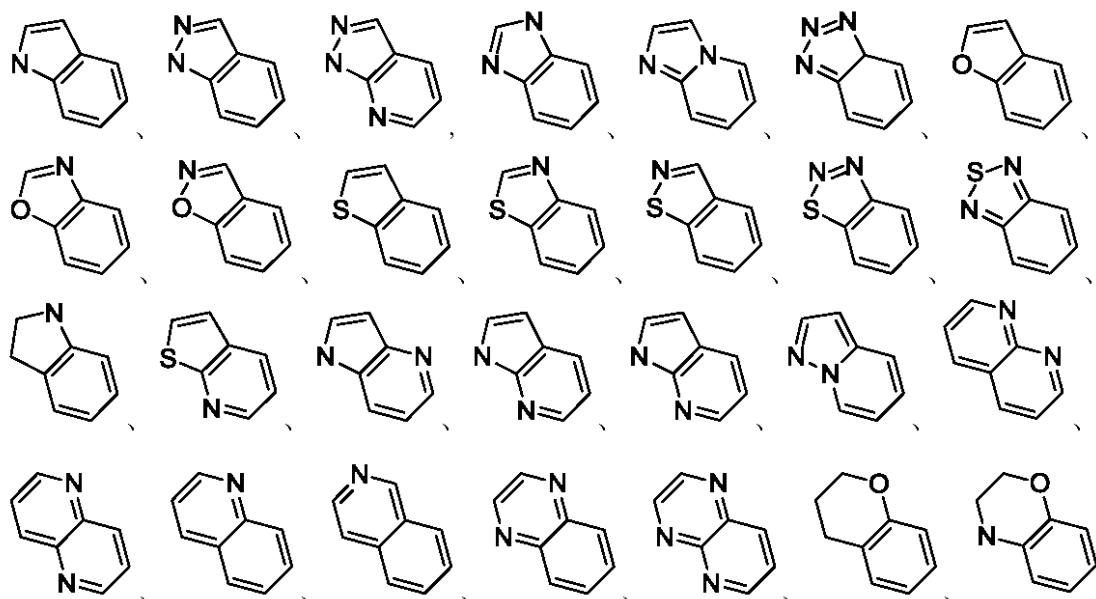
(項目 1 1)

R¹ および R² が独立して、ハロ、C₁₋₈アルキル、ハロC₁₋₈アルキル、シアノ、オキソ、OH、O(C₁₋₈アルキル)、およびO(ハロC₁₋₈アルキル)からなる群から選択される、項目8~10に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

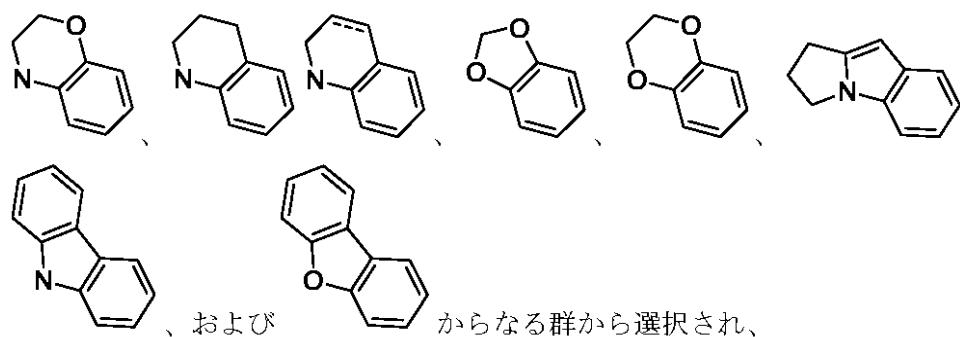
(項目 1 2)

X⁻¹またはHETが、

【化96-1】



【化96-2】

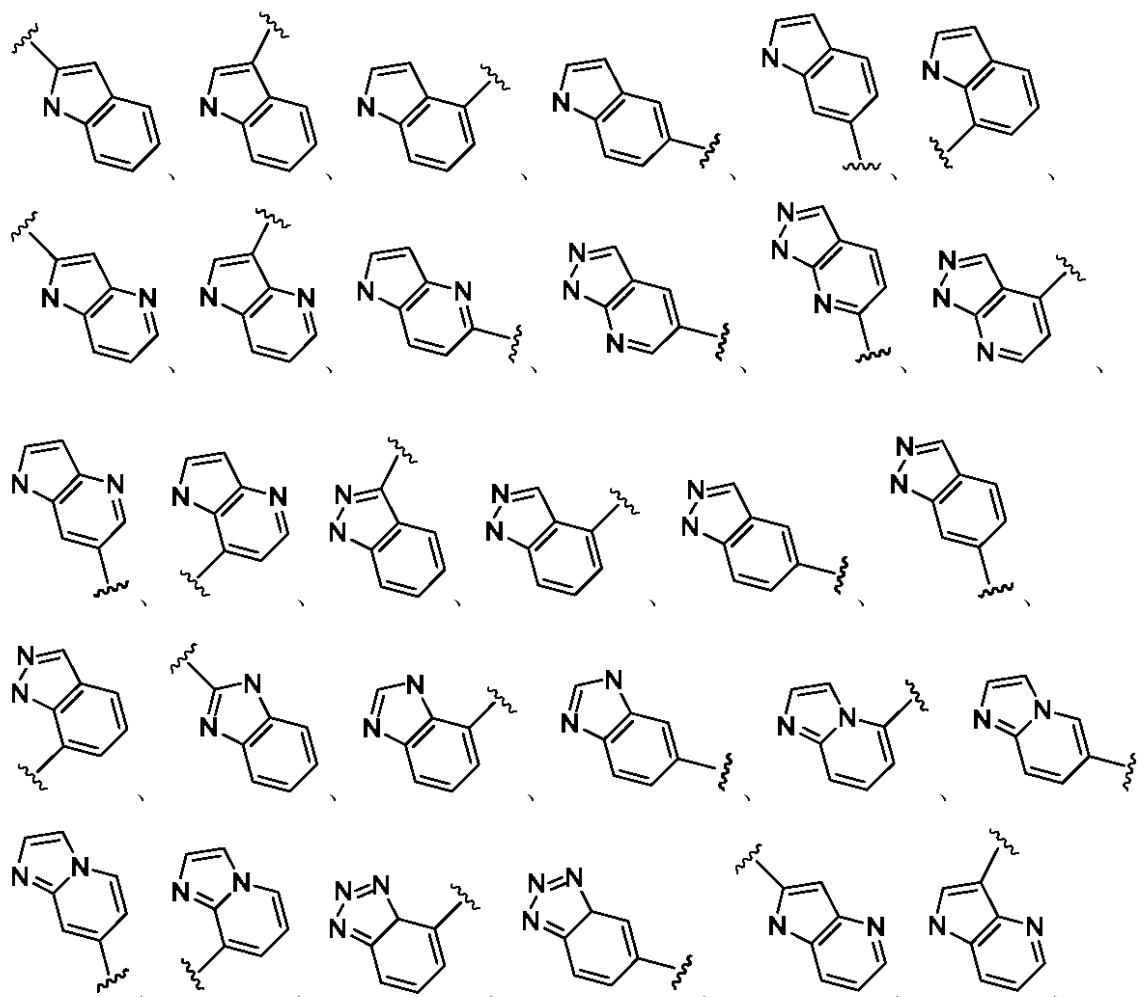


式中、前記分子の残りへの結合点が炭素環原子上にある、項目4～11に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

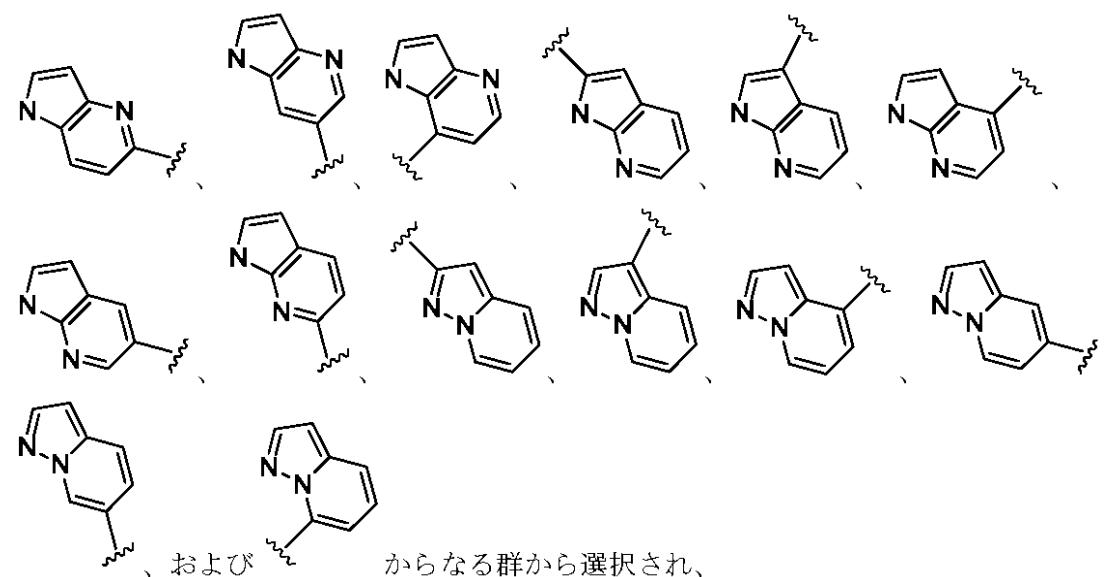
(項目13)

X¹またはHETが、

【化 9 7 - 1】



【化 9 7 - 2】

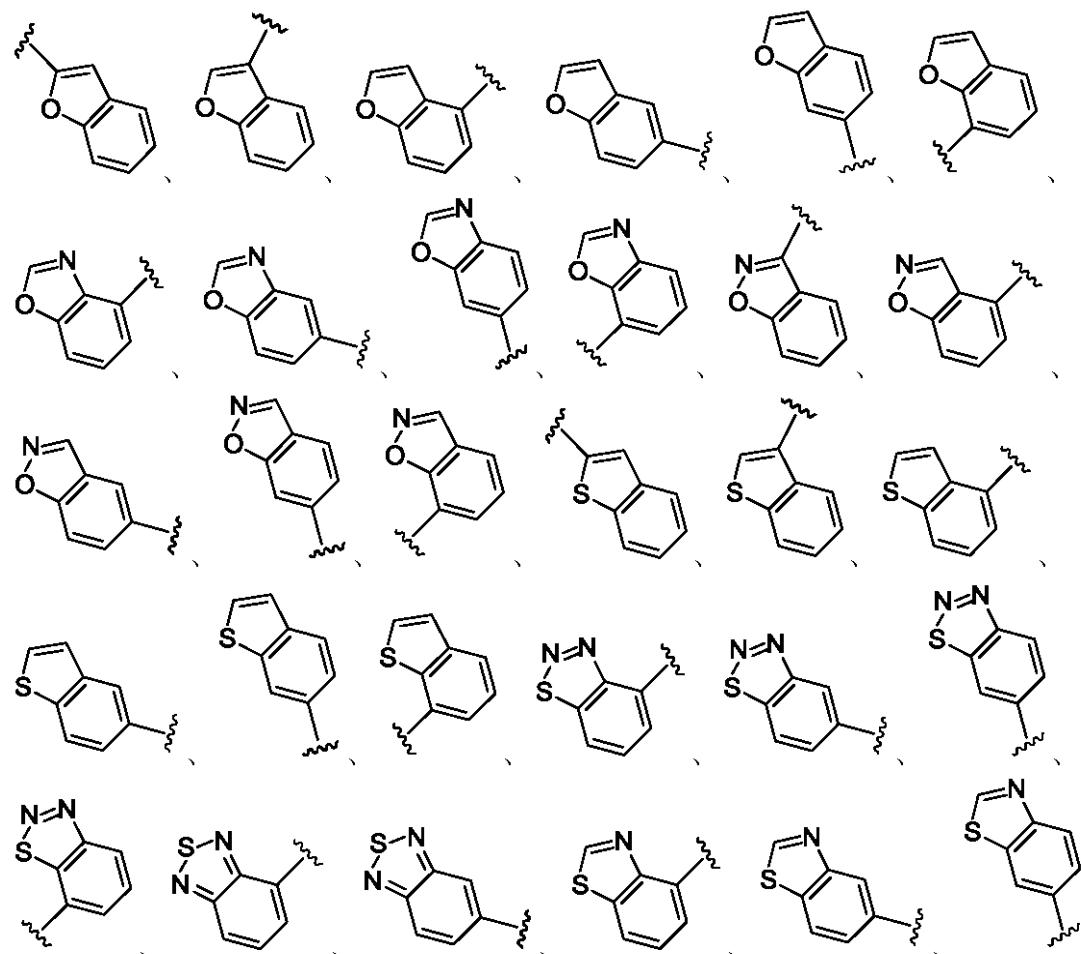


式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目 1 2 に記載の化合物。

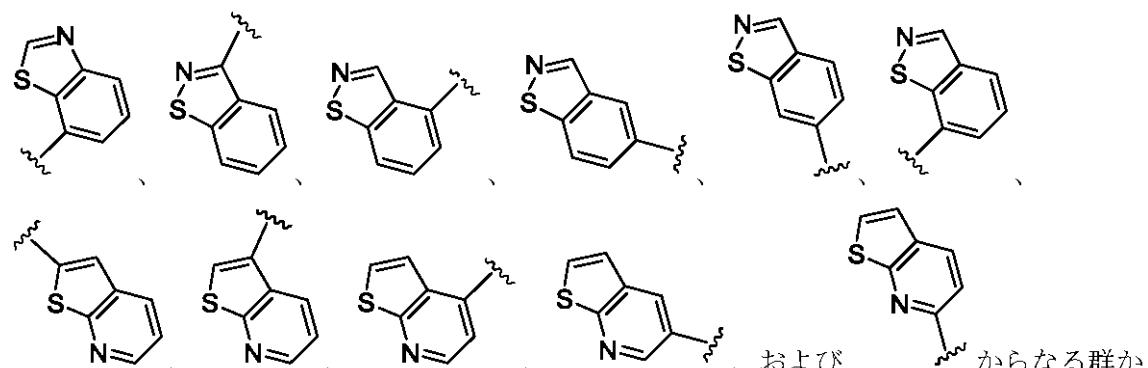
(項目 1 4)

X¹ または H E T が、

【化98-1】



【化98-2】



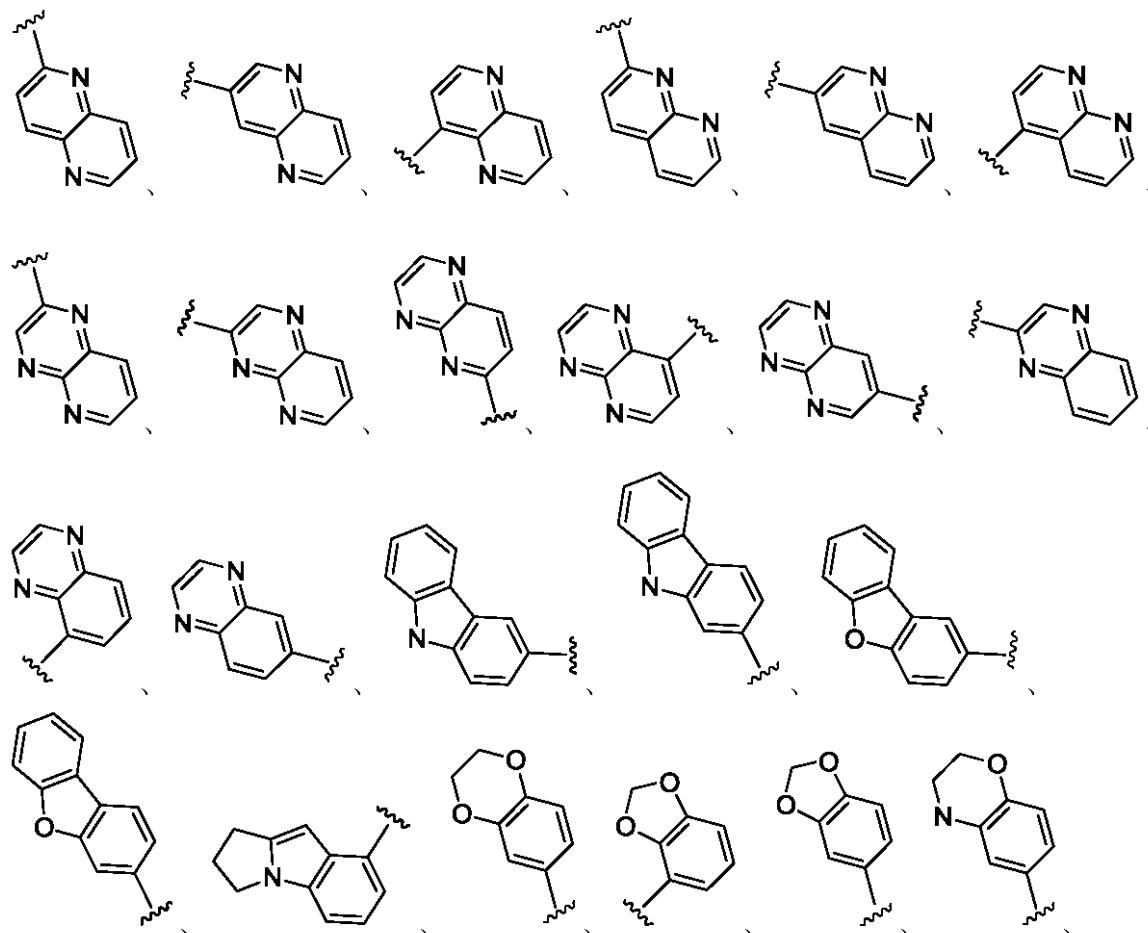
ら選択され、
からなる群か

式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目12に記載の化合物。

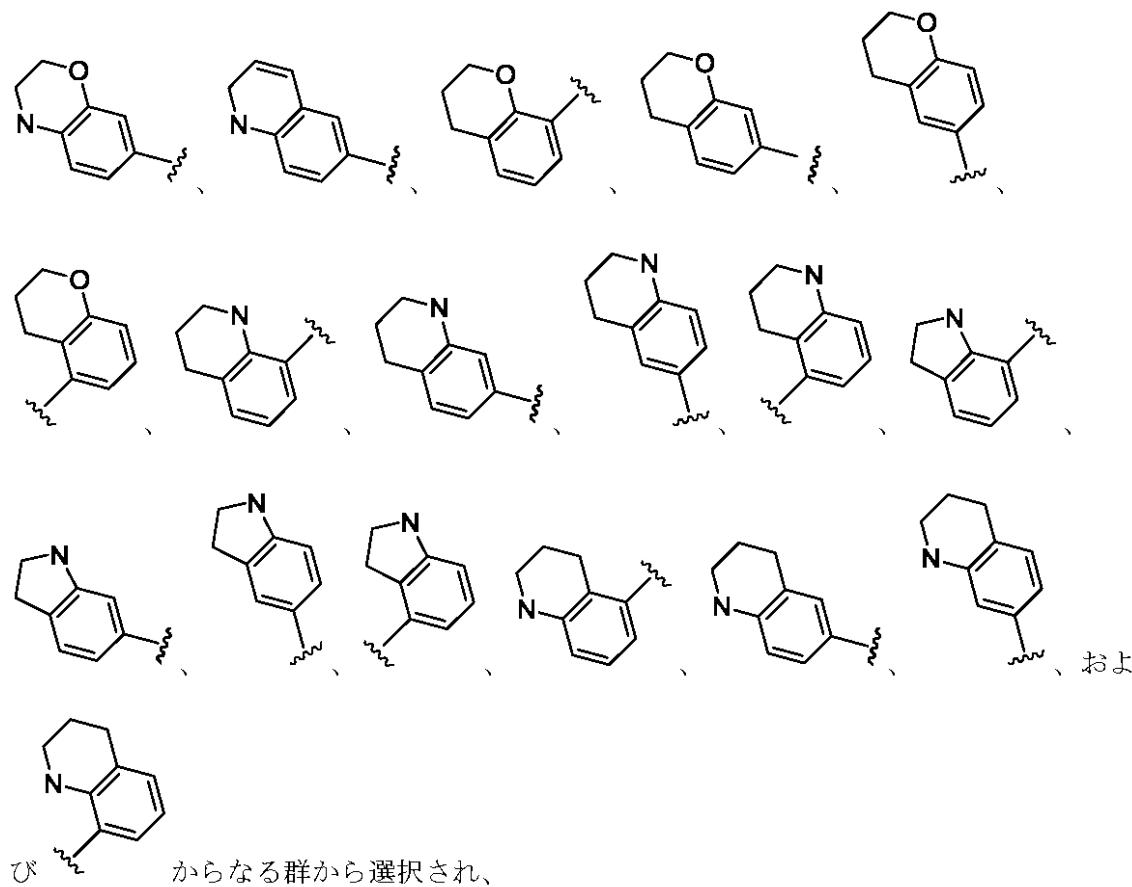
(項目15)

X¹またはHETが、

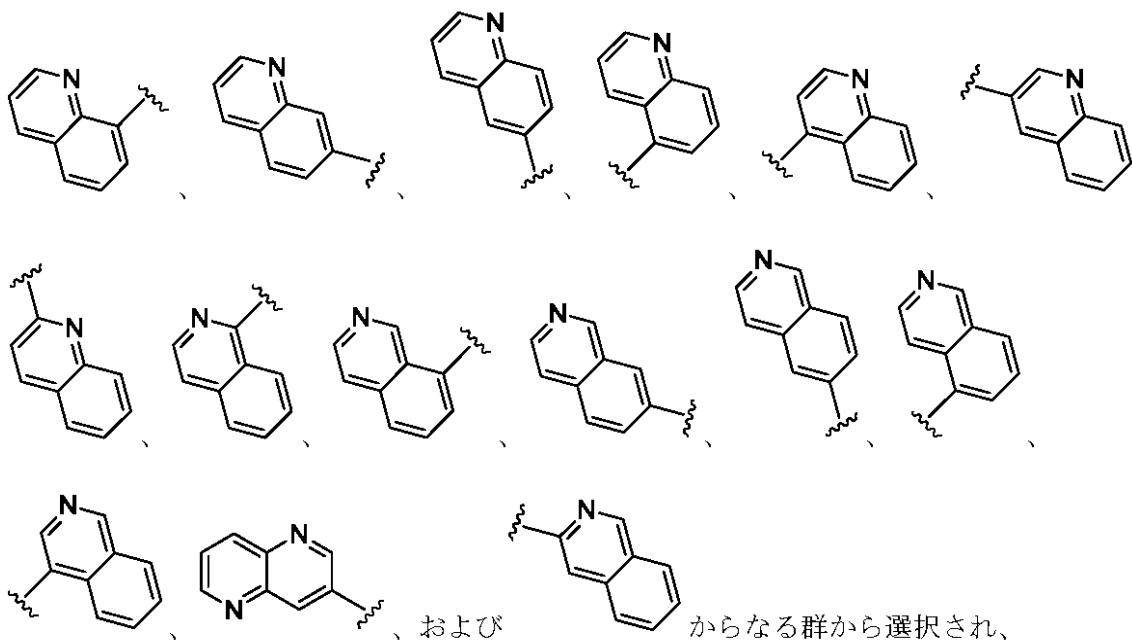
【化 9 9 - 1】



【化 9 9 - 2】

式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目 1 2 に記載の化合物。(項目 1 6) X^1 または H E T が、

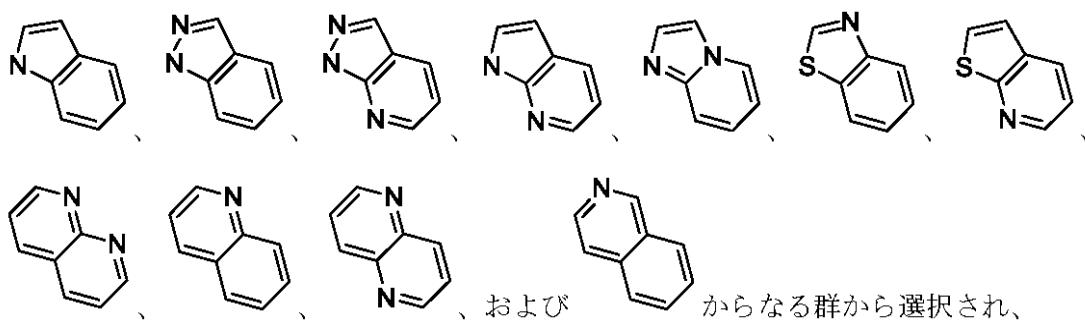
【化 1 0 0】

式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目 1 2 に記載の化合物。

(項目17)

X¹またはHETが、

【化101】



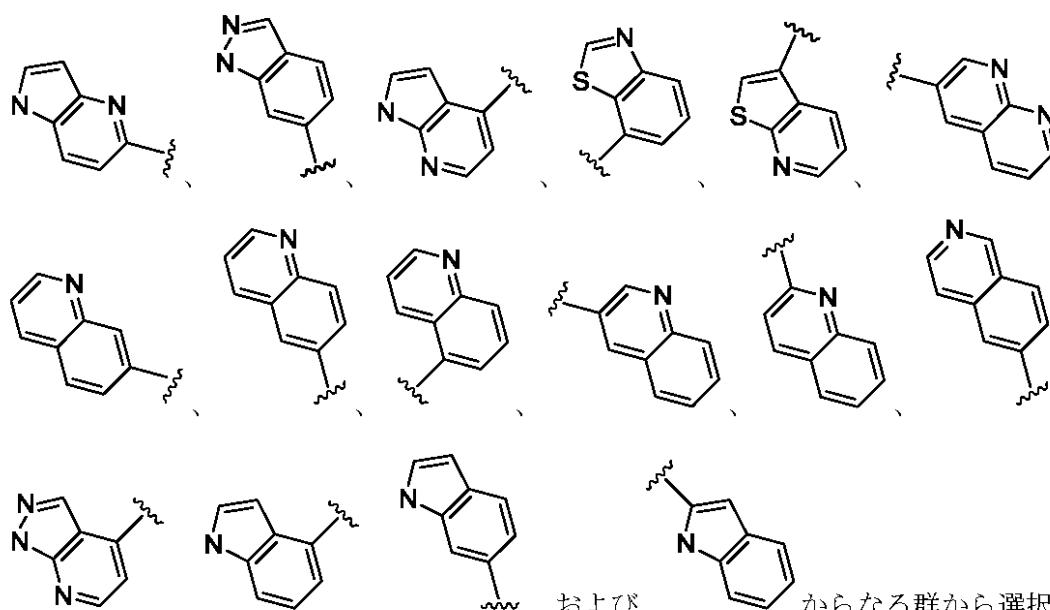
からなる群から選択され、

式中、前記分子の残りへの結合点が炭素環原子上である、項目12に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目18)

X¹またはHETが、

【化102】



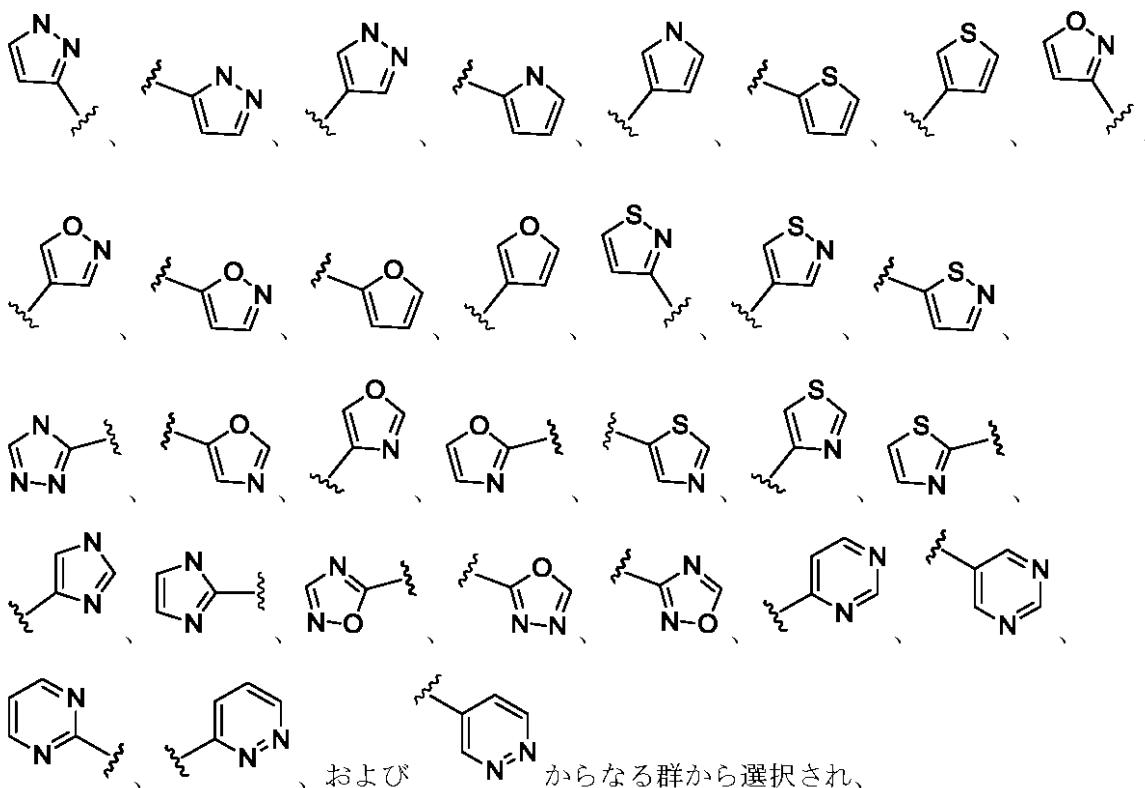
からなる群から選択され、

式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目17に記載の化合物。

(項目19)

X¹またはHETが、

【化 1 0 3】

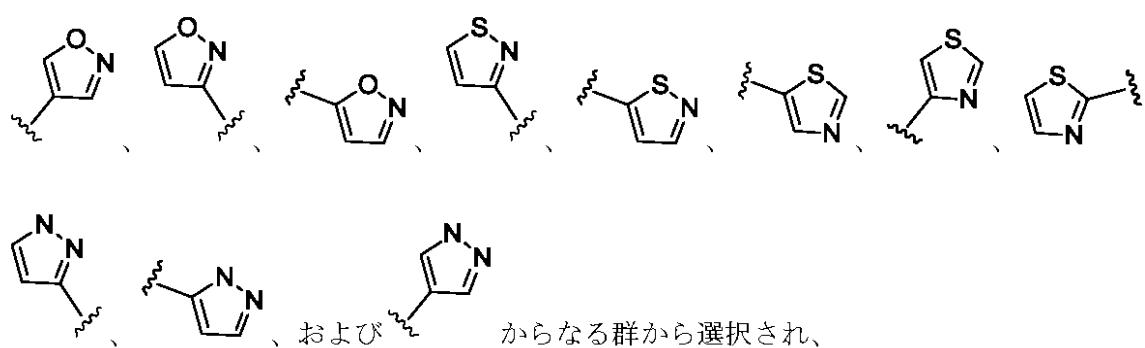


式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目4～11のいずれか一項に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目 20)

X⁻¹ または H E T が、

【化 1 0 4】

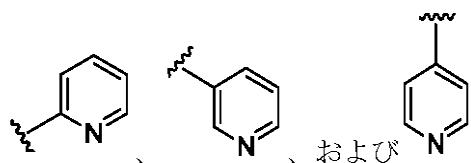


式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目19に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目 2 1)

X¹ または H E T が、

【化105】



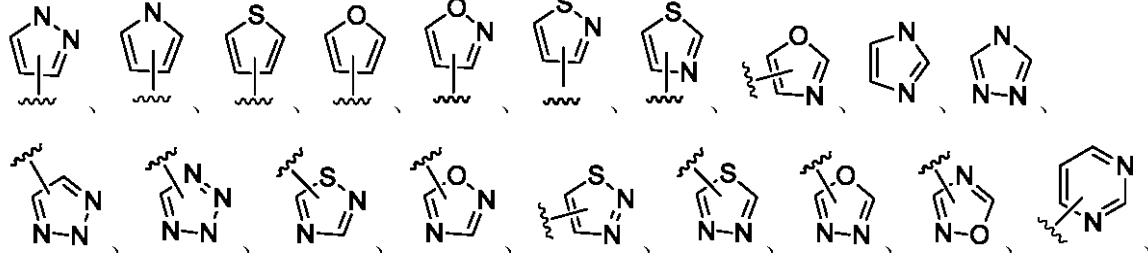
からなる群から選択され、

式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目4～11のいずれか一項に記載の化合物
、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

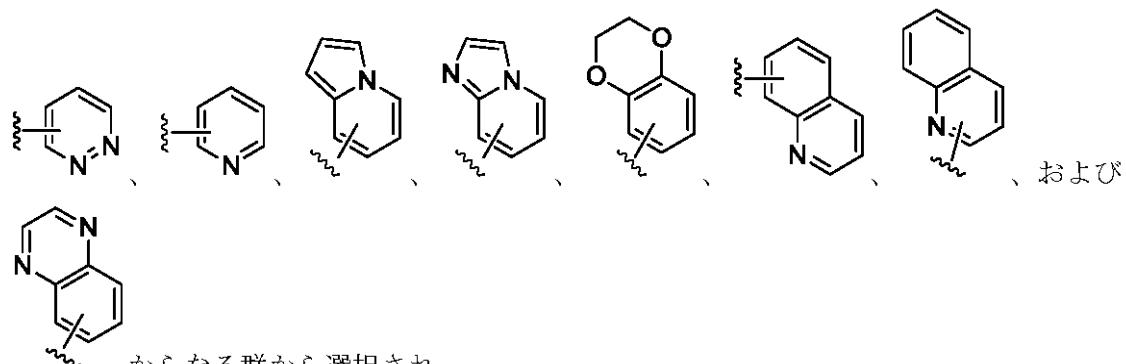
(項目22)

WまたはB¹が、

【化106-1】



【化106-2】



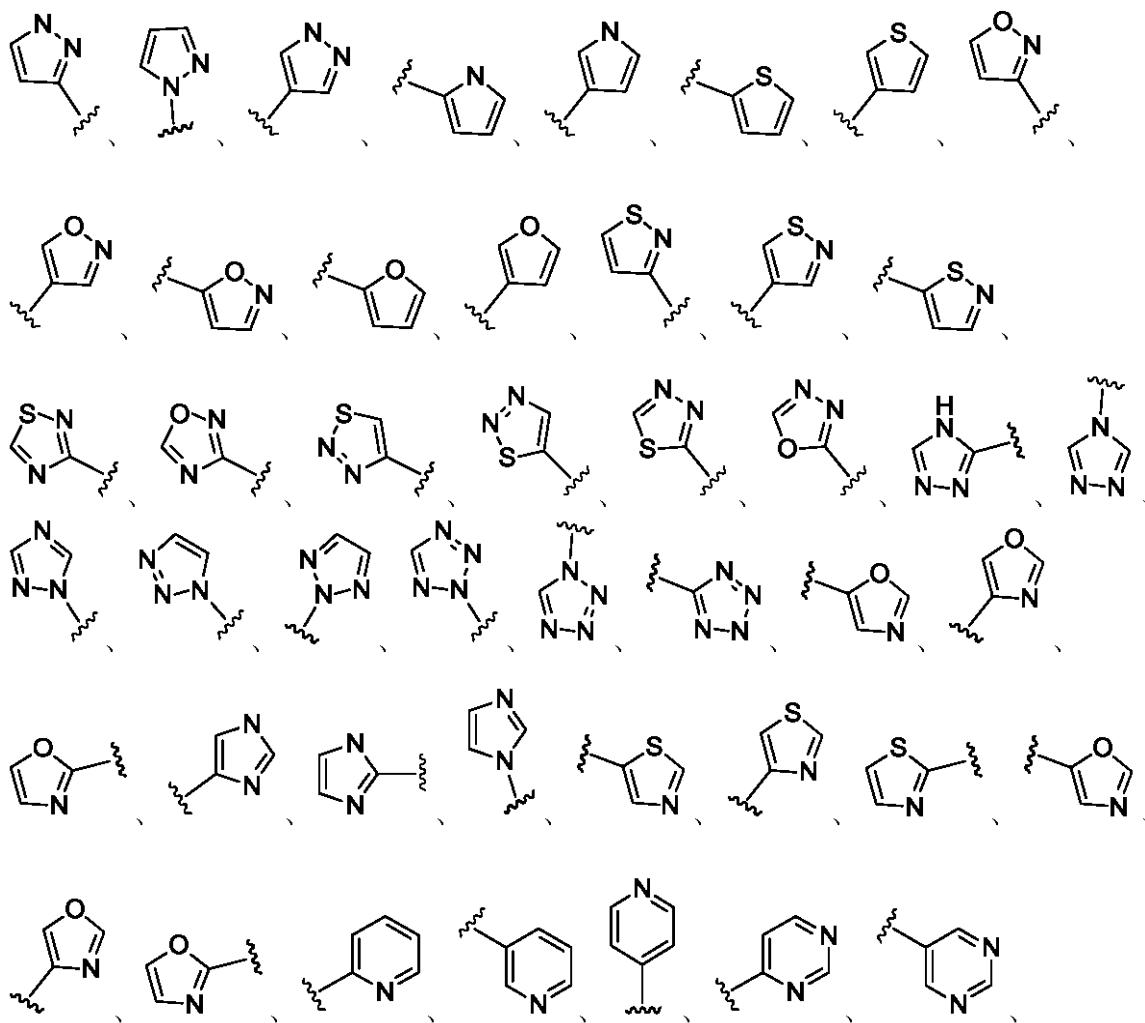
からなる群から選択され、

式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目1～21のいずれか一項に記載の化合物
、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

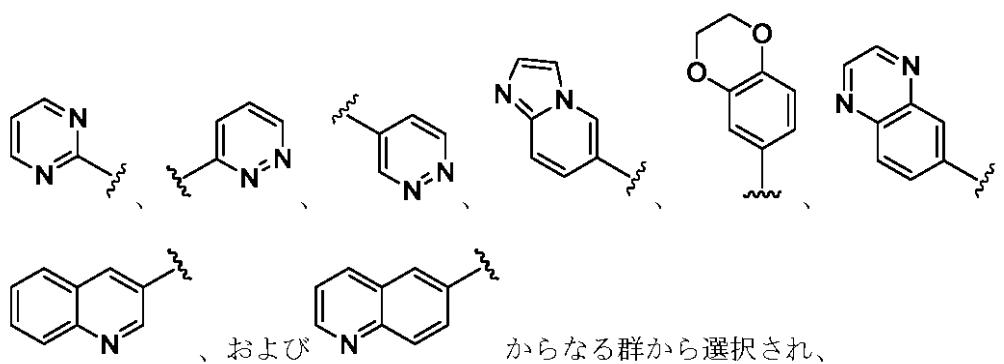
(項目23)

WまたはB¹が、

【化 107-1】



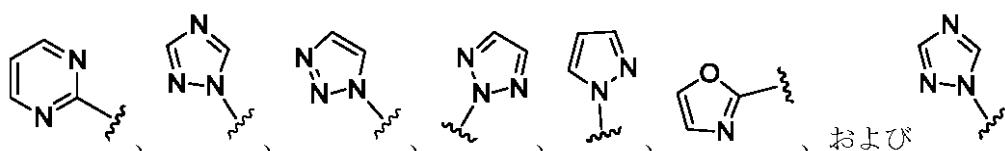
【化 107-2】



式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目22に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目24)
WまたはB¹が、

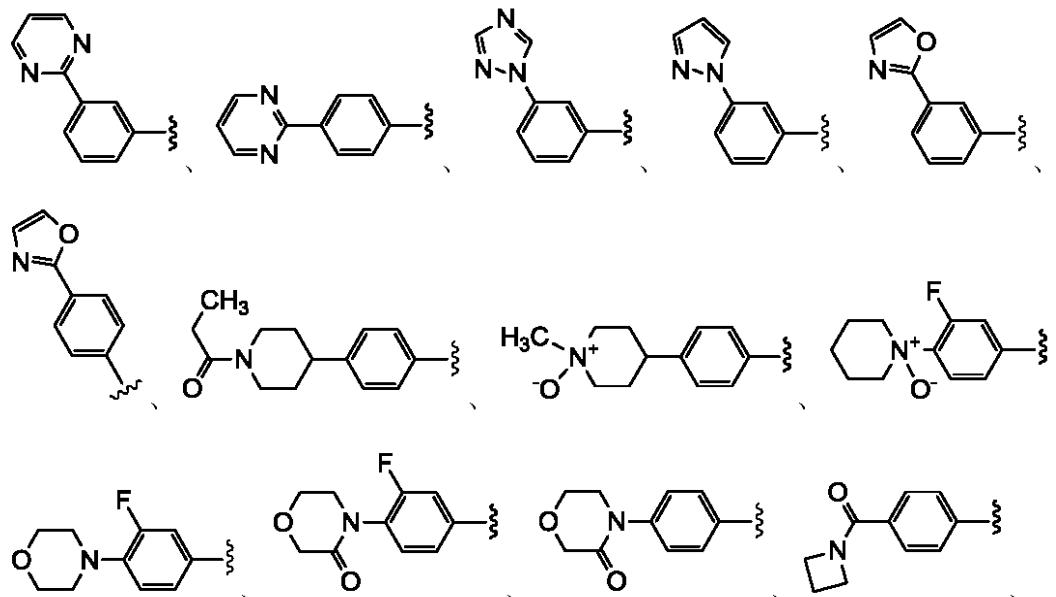
【化108】



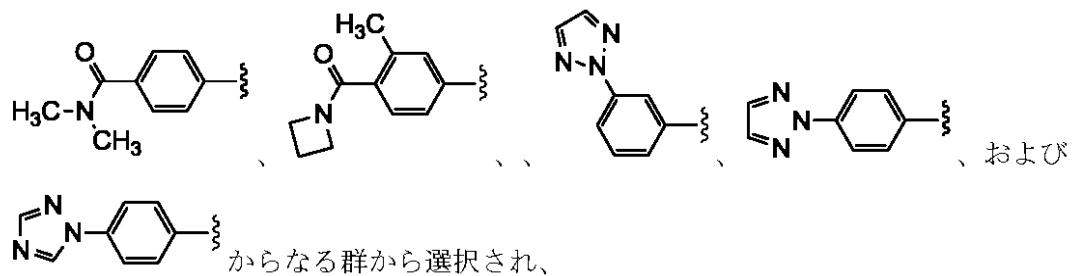
(項目25)

B¹-Ph-ga、

【化109-1】



【化109-2】

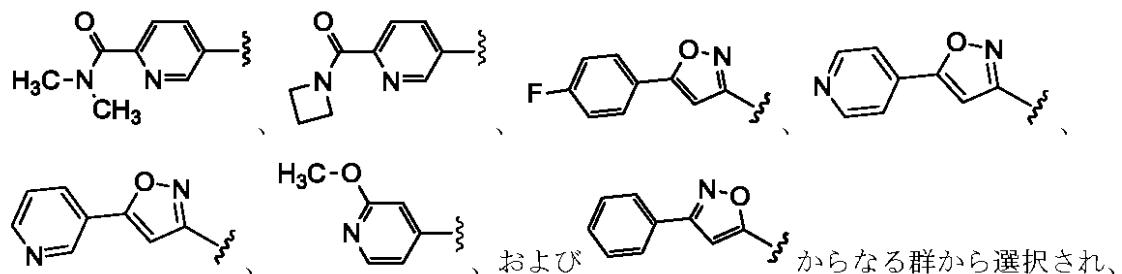


式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目1～24のいずれか一項に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目26)

B¹-HET-ga、

【化 1 1 0】

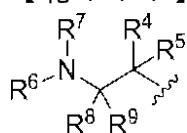


式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目1～25のいずれか一項に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目27)

Y が、

【化 1 1 1】



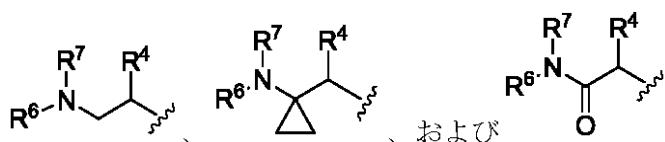
であり、

式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目1～26のいずれか一項に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目 2 8)

Y が、

【化 1 1 2】



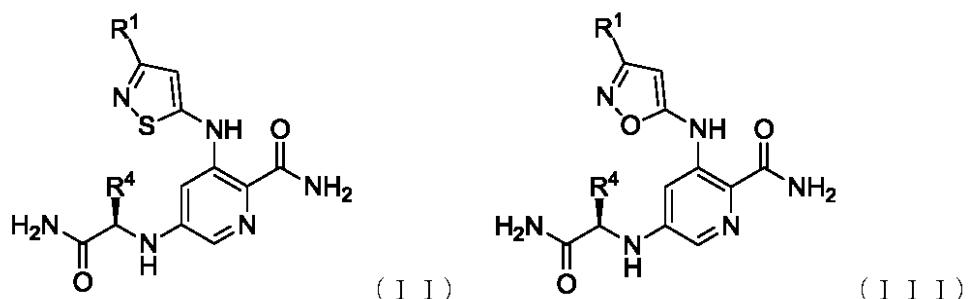
からなる群から選択され、

式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目1～27のいずれか一項に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目29)

式 (I I) または式 (I I I)

【化 1 1 3】



の項目 2.8 に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

（項目30）

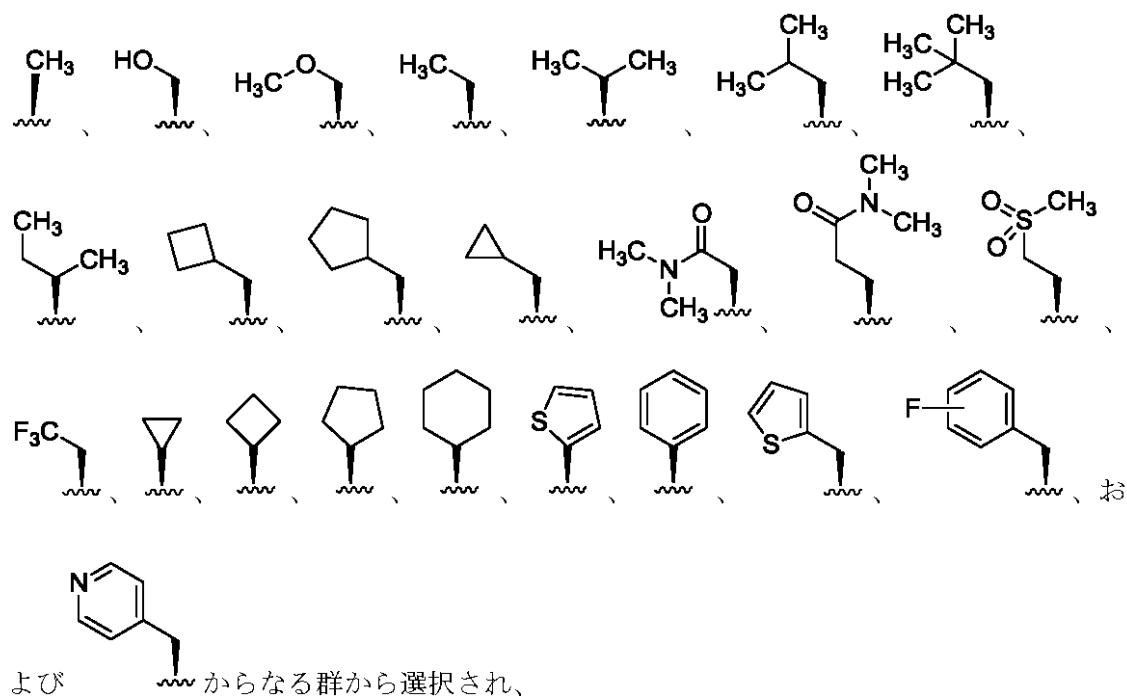
R⁶ および R⁷ が H であり、 R⁴ が、 H、 C₁ ~ 8 アルキル、 ハロ C₁ ~ 8 アルキル、 シクロアルキル、 (シクロアルキル) C₁ ~ 4 アルキル、 (ヒドロキシ) C₁ ~ 4 アルキル、 (C₁ ~ 4 アルコキシ) C₁ ~ 4 アルキル、 (ハロ C₁ ~ 4 アルコキシ) C₁ ~ 4 アルキル、 (C_H₂)_p NR⁴^b R⁴^c、 (C_H)_p SO₂ NR⁴^b R⁴^c、 (C_H₂)_p SOR⁴^a、 (C_H₂)_p SO₂ R⁴^a、 (C_H₂)_f CONR⁴^b R⁴^c、 (C_H₂)_p NR⁴^b COR⁴^d、 フェニル、 ヘテロアリール、 (フェニル) C₁ ~ 8 アルキル、 および (ヘテロアリール) C₁ ~ 8 アルキルからなる群から選択され、 前記フェニルおよびヘテロアリールが、 ハロ、 C₁ ~ 4 アルキル、 ハロ C₁ ~ 4 アルキル、 C₁ ~ 4 アルコキシ、 および ハロ C₁ ~ 4 アルコキシから独立して選択される 1 ~ 3 個の基で任意に置換される、 項目 28 または 29 に記載の化合物、 またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目 31)

R⁴ が、 H、 メチル、 エチル、 プロピル、 イソプロピル、 イソブチル、 ヒドロキシメチル、 ピリジル、 およびフェニルからなる群から選択され、 前記ピリジルおよびフェニルが、 ハロ、 C₁ ~ 4 アルキル、 ハロ C₁ ~ 4 アルキル、 C₁ ~ 4 アルコキシ、 および ハロ C₁ ~ 4 アルコキシから独立して選択される 1 ~ 3 個の基で任意に置換される、 項目 30 に記載の化合物、 またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目 32)

R⁴ が、
【化 114】



式中、 波線が分子の残りへの結合点を示す、 項目 28 または 29 に記載の化合物、 またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目 33)

R¹ が、 ハロ、 C₁ ~ 8 アルキル、 ハロ C₁ ~ 8 アルキル、 シアノ、 オキソ、 OH、 O (C₁ ~ 8 アルキル)、 O (ハロ C₁ ~ 8 アルキル)、 CO - NR^a R^b、 フェニル、 ヘテロアリール、 および ヘテロシクリルからなる群から選択され、 前記フェニル、 ヘテロアリール、 および ヘテロシクリルが各々、 1 ~ 3 個の R² で任意に置換され、 R^a および R^b が一緒になって、 ハロ、 C₁ ~ 8 アルキル、 および ハロ C₁ ~ 8 アルキルから独立して選択される 1 ~ 3 個の基で任意に置換される 4 ~ 6 員の複素環を形成する、 項目 29 ~ 3

2のいずれか一項に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

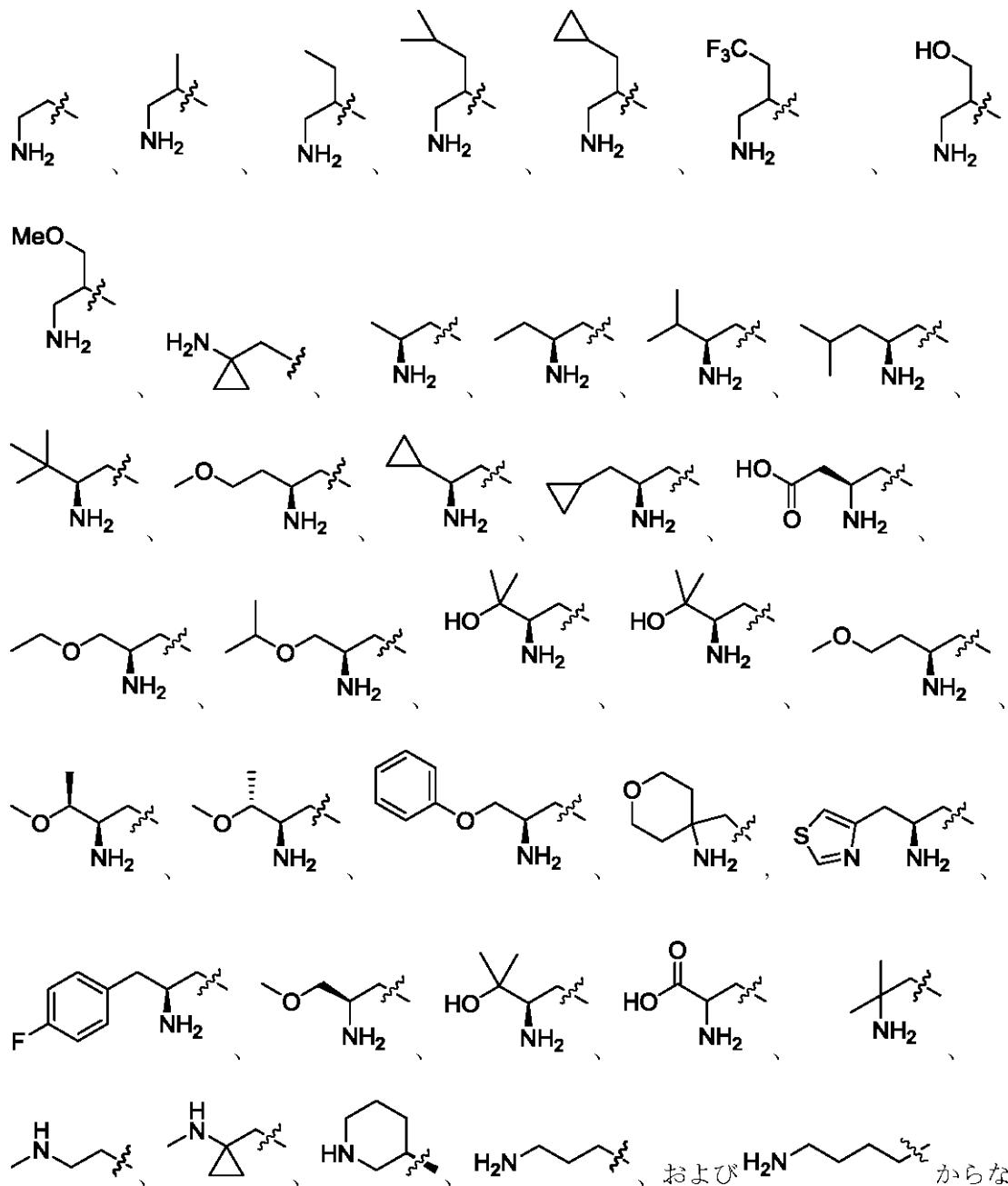
(項目 3 4)

R¹がメチルである、項目33に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目 3 5)

Y が、

【化 1 1 5】



群から選択され、

式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目 27 に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目 3 6)

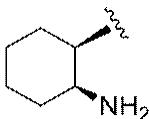
Yが(CH2)_v(X)であり、式中、vが0であり、Xがシクロアルキルまたはヘテロシクロアルキルであり、各々が、1~3個のR^{1~0}で任意に置換される、項目1~26

のいずれか一項に記載の化合物、またはその互変異性体もしくはその薬学的に許容される塩。

（項目37）

Y が、

【化 1 1 6】



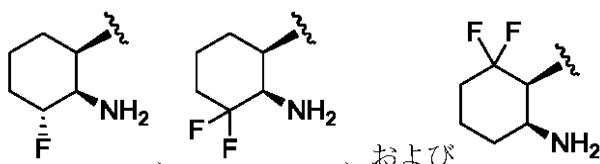
であり、

1～2個のハロで任意に置換され、式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目36に記載の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目 3 8)

Y が、

【化 1 1 7 】



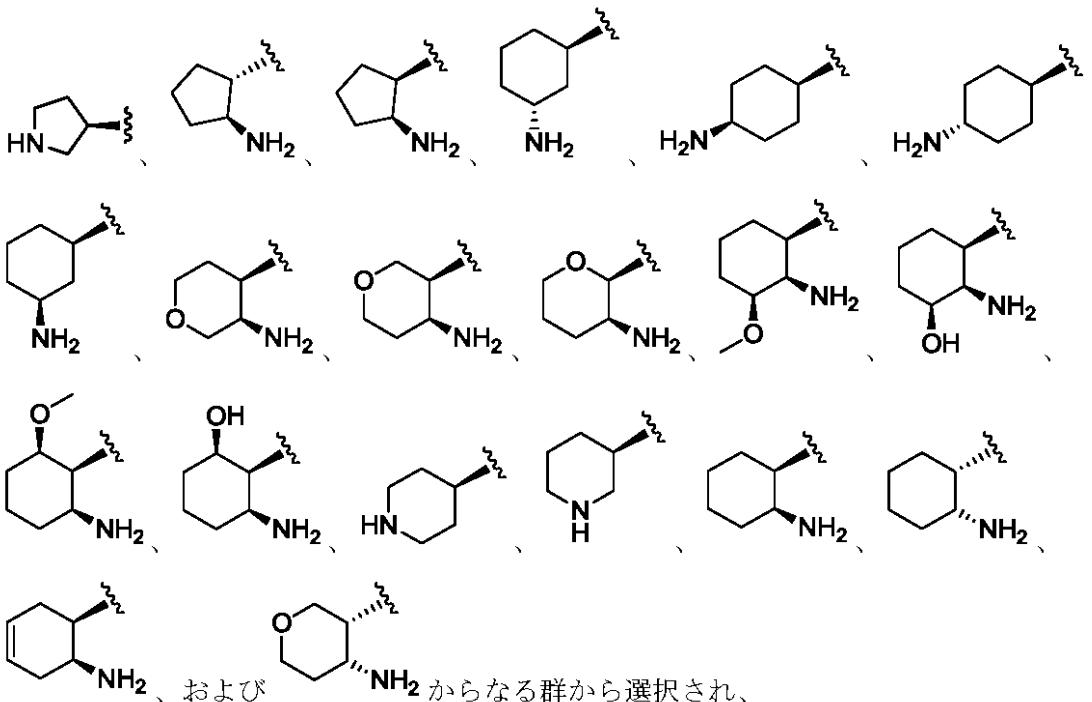
からなる群から選択され、

式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目 37 に記載の化合物。

(項目 3 9)

Y が、

【化 1 1 8 】

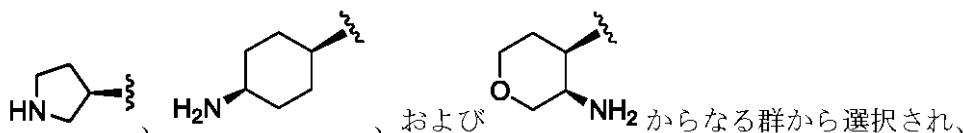


式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目 3.6 に記載の化合物。

(項目 40)

Y が、

【化119】



式中、波線が分子の残りへの結合点を示す、項目39に記載の化合物。

(項目41)

(R)-5-(1-アミノ-4-メチル-1-オキソペンタン-2-イルアミノ)-3-(3-メチルイソチアゾール-5-イルアミノ)ピコリンアミド、
5-((1R,2R)-2-アミノ-3,3-ジフルオロシクロヘキシリルアミノ)-3-(3-メチルイソチアゾール-5-イルアミノ)ピコリンアミド、
(R)-5-(1-アミノ-3-シクロプロピル-1-オキソプロパン-2-イルアミノ)-3-(3-メチルイソチアゾール-5-イルアミノ)ピコリンアミド、
5-((1R,2S)-2-アミノシクロヘキシリルアミノ)-3-(3-メチルイソチアゾール-5-イルアミノ)ピコリンアミド、
(R)-5-(1-アミノ-1-オキソブタン-2-イルアミノ)-3-(3-メチルイソチアゾール-5-イルアミノ)ピコリンアミド、
3-(3-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)フェニルアミノ)-5-((1R,2S)-2-アミノシクロヘキシリルアミノ)ピコリンアミド、
(R)-5-(1-アミノ-3-メチル-1-オキソブタン-2-イルアミノ)-3-(3-メチルイソチアゾール-5-イルアミノ)ピコリンアミド、
5-((1R,2S)-2-アミノシクロヘキシリルアミノ)-3-(3-フェニルイソオキサゾール-5-イルアミノ)ピコリンアミド、
5-((1R,2R)-2-アミノ-3,3-ジフルオロシクロヘキシリルアミノ)-3-(3-フェニルイソオキサゾール-5-イルアミノ)ピコリンアミド、
5-((1R,2S)-2-アミノシクロヘキシリルアミノ)-3-(3-メチルイソオキサゾール-5-イルアミノ)ピコリンアミド、
(R)-5-(1-アミノ-4-メチル-1-オキソペンタン-2-イルアミノ)-3-(3-フェニルイソオキサゾール-5-イルアミノ)ピコリンアミド、
5-((1R,2S)-2-アミノシクロヘキシリルアミノ)-3-(イソキノリン-6-イルアミノ)ピコリンアミド、
5-((1R,2S)-2-アミノシクロヘキシリルアミノ)-3-(キノリン-3-イルアミノ)ピコリンアミド、
5-((1R,2S)-2-アミノシクロヘキシリルアミノ)-3-(イソキノリン-7-イルアミノ)ピコリンアミド、
5-((1R,2S)-2-アミノシクロヘキシリルアミノ)-3-(キノリン-7-イルアミノ)ピコリンアミド、
(R)-5-(1-アミノ-4-メチル-1-オキソペンタン-2-イルアミノ)-3-(キノリン-6-イルアミノ)ピコリンアミド、
(R)-5-(1-アミノ-4-メチル-1-オキソペンタン-2-イルアミノ)-3-(イソキノリン-6-イルアミノ)ピコリンアミド、
(R)-5-(1-アミノ-3-シクロヘキシリル-1-オキソプロパン-2-イルアミノ)-3-(3-メチルイソチアゾール-5-イルアミノ)ピコリンアミド、
(R)-3-(3-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)フェニルアミノ)-5-(1-アミノ-4-メチル-1-オキソペンタン-2-イルアミノ)ピコリンアミド、
(R)-5-(1-アミノ-4-メチル-1-オキソペンタン-2-イルアミノ)-3-(キノリン-3-イルアミノ)ピコリンアミド、

(R) - 5 - (1 - アミノ - 4 - メチル - 1 - オキソペンタン - 2 - イルアミノ) - 3 -
 (イソキノリン - 7 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 4 - メチル - 1 - オキソベンタン - 2 - イルアミノ) - 3 -
 (キノリン - 7 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 5 - ((3 R , 4 R) - 3 - アミノテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イルアミノ) - 3 -
 - (3 - メチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 5 - ((1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシルアミノ) - 3 - (1 - メチル - 1 H -
 ピラゾール - 4 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 5 - ((1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシルアミノ) - 3 - (ピラゾロ [1 , 5 -
 a] ピリジン - 3 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 5 - ((1 S , 4 S) - 4 - アミノシクロヘキシルアミノ) - 3 - (3 - メチルイソチア
 ゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 5 - ((1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシルアミノ) - 3 - (イソチアゾール - 4
 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 5 - (1 - カルバモイルシクロプロピルアミノ) - 3 - (3 - メチルイソチアゾール - 5
 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 3 - メチル - 1 - オキソブタン - 2 - イルアミノ) - 3 - (3 -
 エチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 5 - ((1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシルアミノ) - 3 - (3 - シクロプロピル
 イソオキサゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 3 - メチル - 1 - オキソブタン - 2 - イルアミノ) - 3 - (3 -
 シクロプロピルイソオキサゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 5 - ((1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシルアミノ) - 3 - (3 - イソプロピルイ
 ソオキサゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 5 - ((1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシルアミノ) - 3 - (3 - エチルイソオキ
 サゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 1 - オキソブタン - 2 - イルアミノ) - 3 - (3 - シクロプ
 ロピルイソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 3 , 3 - ジメチル - 1 - オキソブタン - 2 - イルアミノ) -
 3 - (3 - シクロプロピルイソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 4 , 4 - ジメチル - 1 - オキソベンタン - 2 - イルアミノ)
 - 3 - (8 - フルオロキノリン - 6 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 4 , 4 - ジメチル - 1 - オキソベンタン - 2 - イルアミノ)
 - 3 - (キノリン - 7 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (2 - アミノ - 2 - オキソ - 1 - フェニルエチルアミノ) - 3 - (3 - メチ
 ルイソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 1 - オキソプロパン - 2 - イルアミノ) - 3 - (3 - メチル
 イソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 4 , 4 , 4 - トリフルオロ - 1 - オキソブタン - 2 - イルア
 ミノ) - 3 - (3 - メチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 4 - (メチルスルホニル) - 1 - オキソブタン - 2 - イルア
 ミノ) - 3 - (3 - メチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (2 - アミノ - 1 - シクロプロピル - 2 - オキソエチルアミノ) - 3 - (3
 - メチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 4 - メチル - 1 - オキソベンタン - 2 - イルアミノ) - 3 -
 (3 - (ピリジン - 4 - イル) イソオキサゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 3 - メトキシ - 1 - オキソプロパン - 2 - イルアミノ) - 3
 - (3 - メチルイソチアゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 5 - ((1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシルアミノ) - 3 - (3 - (ピリジン - 4
 - イル) イソオキサゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、

5 - ((1R, 2S) - 2 - アミノシクロヘキシリアミノ) - 3 - (3 - (ピリジン - 3 - イル) イソオキサゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 (R) - 5 - (1 - アミノ - 4, 4 - トリフルオロ - 1 - オキソブタン - 2 - イルアミノ) - 3 - (キノリン - 7 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 5 - ((3R, 4R) - 3 - アミノテトラヒドロ - 2H - ピラン - 4 - イルアミノ) - 3 - (3 - (ピリジン - 4 - イル) イソオキサゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 5 - ((3R, 4R) - 3 - アミノテトラヒドロ - 2H - ピラン - 4 - イルアミノ) - 3 - (3 - (ピリジン - 3 - イル) イソオキサゾール - 5 - イルアミノ) ピコリンアミド、
 (R) - 3 - (1, 5 - ナフチリジン - 3 - イルアミノ) - 5 - (1 - アミノ - 1 - オキソブタン - 2 - イルアミノ) ピコリンアミド、および
 5 - ((1R, 2S) - 2 - アミノシクロヘキシリル) アミノ) - 3 - (3 - (オキサゾール - 2 - イル) フェニル) アミノ) ピコリンアミド、から選択される構造を有する、化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目42)

項目41に見られる構造を有する、式(Ia)または式(Ib)の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目43)

項目41に見られる構造を有する、式(II)または式(III)の化合物、またはその互変異性体もしくは薬学的に許容される塩。

(項目44)

薬学的に許容される担体または希釈剤と組み合わせて、項目1~43のいずれかに記載の化合物、またはその互変異性体もしくはその薬学的に許容される塩を含む、組成物。

(項目45)

sykキナーゼ活性により少なくとも一部媒介されるsykもしくはJAKキナーゼ、またはシグナル変換経路を阻害するための方法であって、項目1~43のいずれか一項に記載の化合物と細胞を接触させることを含む、方法。

(項目46)

sykキナーゼ活性により少なくとも一部媒介される状態または障害を治療するための方法であって、そのような治療を必要とする対象に、治療有効量の項目42に記載の組成物を投与することを含む、方法。

(項目47)

前記状態または障害が、心臓血管疾患、炎症性疾患、自己免疫疾患、および細胞増殖性障害からなる群から選択される、項目46に記載の方法。

(項目48)

前記心臓血管疾患が、再狭窄、血栓形成、免疫性血小板減少性紫斑病、ヘパリン起因性血小板減少症、拡張型心筋症、鎌状赤血球病、アテローム性動脈硬化症、心筋梗塞症、血管炎症、不安定狭心症、および急性冠症候群からなる群から選択され、

前記炎症性疾患が、アレルギー、喘息、リウマチ性関節炎、B細胞媒介性疾患、非ホジキンリンパ腫、抗リン脂質症候群、狼瘡、乾癬、多発性硬化症、および末期の腎疾患からなる群から選択され、

前記自己免疫疾患が、溶血性貧血、免疫性血小板減少性紫斑病、多発性硬化症、シェーレン症候群、糖尿病、リウマチ性関節炎、狼瘡、および乾癬からなる群から選択され、

前記細胞増殖障害が、白血病、リンパ腫、骨髄増殖性障害、血液悪性腫瘍、および慢性特発性骨髄線維症である、項目47に記載の方法。