

【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18年9月28日(2006.9.28)

【公表番号】特表2006-512366(P2006-512366A)

【公表日】平成18年4月13日(2006.4.13)

【年通号数】公開・登録公報2006-015

【出願番号】特願2004-562221(P2004-562221)

【国際特許分類】

C 07 D 487/04 (2006.01)

A 61 K 31/519 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 487/04 1 4 3

C 07 D 487/04 C S P

A 61 K 31/519

A 61 P 31/04

A 61 P 1/04

A 61 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成18年8月8日(2006.8.8)

【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

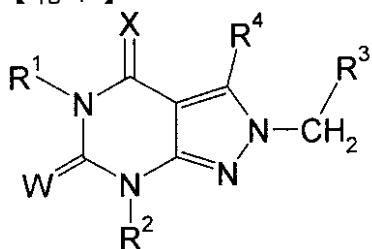
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

構造式(I)：

【化1】



(I)

を有する化合物またはその医薬的に許容可能な塩 { 式中、XはS、OまたはNR²⁰であり、但し、Wが0であるとき、Xは0ではなく、

X及びこれが結合している二重結合は、2個の水素原子で置換することができ、

WはS、OまたはNR²⁰であり、但し、Xが0であるとき、Wは0でなはく；

R¹はH、場合により置換されたアルキル、場合により置換されたアルケニル、場合により置換されたアルキニル、場合により置換されたシクロアルキル、場合により置換されたシクロアルケニル、場合により置換されたアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、または場合により置換さ

れた複素環であり；

R^2 は、H、場合により置換されたアルキル、場合により置換されたアルキルシクロアルキル、場合により置換されたアルケニル、場合により置換されたアルキニル、場合により置換されたシクロアルキル、場合により置換されたシクロアルケニル、場合により置換されたシクロアルキニル、場合により置換されたアリール、場合により置換されたアルコキシ、場合により置換されたアミノ、または場合により置換された複素環であり；

R^3 は、N、O、またはSから独立して選択される0、1、2または3個のヘテロ原子を含む、単環式または二環式の、飽和または不飽和の環系であり、前記環は、=O、ハロゲン、-OR^a、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、-CN、ニトロ、-S(=O)_nR^c、-O(CH₂)_mHet、-O(CH₂)_mC(=O)Het、-O(CH₂)_mC(=O)NR^aR^a、-O(CH₂)_mC(=O)OR^a、-O(CH₂)_mNR^aR^a、-O(CH₂)_mOR^a、-S(CH₂)_mHet、-S(CH₂)_mC(=O)Het、-S(CH₂)_mC(=O)NR^aR^a、-S(CH₂)_mC(=O)OR^a、-S(CH₂)_mNR^aR^a、-S(CH₂)_mOR^a、-NR^aR^a、-NHC(=O)R^a、N=NR^a、アミノカルボニル、フェニル、ベンジルから選択される0、1、2または3個の置換基により置換されており；あるいは R^3 は、-H et、-Het-Het、R⁵、-R⁵-Het、-Het-R⁵、-Het-O-R⁵、-R⁵-R⁵、-R⁵-OR⁵によって表され；

R^4 は、単環式または二環式の、飽和または不飽和の環系またはそのビシナル-縮合誘導体(vicinal-fused derivative)であり、これは5~12、好ましくは5~10個の環原子を含んでいてもよく、そのうちの0、1、2、3または4個はN、OまたはSから独立して選択されるヘテロ原子であり、前記環系は、B(OH)₂、ビシナル-OCH₂CH₂O-、ビシナル-OC₁₋₂ハロアルキルO-、ビシナル-OCH₂O-、ビシナル-CH₂OCH₂O-、=O、ハロゲン、-R^bOR^a、-SR^a、-OR^a、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、-CN、-S(=O)_nR^c、-O(CH₂)_mHet、-O(CH₂)_mC(=O)Het、-O(CH₂)_mNR^aR^a、-O(CH₂)_mOR^a、-S(CH₂)_mHet、-S(CH₂)_mC(=O)Het、-S(CH₂)_mNR^aR^a、-S(CH₂)_mOR^a、-NR^aR^a、-NHC(=O)R^a、-NHC(=O)OR^a、N=NR^a、NO₂、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)NR^aOR^a、-C(=O)NR^a(R^bNR^aR^a)、-C(=O)NR^a(R^bOR^a)、-C(=O)NR^a(R^bS(=O)_nR^a)、-C(=O)NR^a(R^bHet)、-C(=O)OR^a、-OC(=O)R^a、-C(=O)OR^bNR^aR^a、-C(=O)R^a、-C(=O)R^bNR^aR^a、-C(=NOR^a)R^a、-C(=NCN)R^a、-S(=O)₂NR^aR^a、-NR^aS(=O)₂R^a、-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)NR^aR^a)、-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)OR^a)、アミノカルボニル、フェニル、ベンジルから選択される0、1、2若しくは3個の置換基で置換されているか；または R^4 は、-(CH₂)_nR⁵-Het、-(CH₂)_nR^d、-Het、-Het-Het、R⁵、-R⁵-Het、-Het-R⁵、-Het-OR⁵、R⁵-R⁵、若しくは-R⁵-OR⁵によって表されるか；または R^4 は、C₁₋₆アルキル、-NC₁₋₆アルキル、若しくは-N(C₁₋₆アルキル)₂によって表され、ここで前記C₁₋₆アルキル、-NC₁₋₆アルキル、-N(C₁₋₆アルキル)₂は、R^a、OR^a、ハロゲン若しくはフェニルから選択される0、1または2個の置換基により置換されており、ここで R^4 は、-(CH₂)_zCH₃、-(CH₂)_zCH₂OH、-(CH₂)_zCO₂Hでも-(CH₂)_zCO₂C₁₋₆アルキル(ここでzは、1、2、3、4、5、または6である)でもない；

R^5 は、それぞれの場合で独立して、ハロゲン、C₁₋₆ハロアルキル、-OC₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆アルキル、-CN、ニトロ、-OR^a、-S(=O)_nR^c、-O(CH₂)_mHet、-O(CH₂)_mC(=O)Het、-O(CH₂)_mNR^aR^a、-O(CH₂)_mOR^a、-O(CH₂)_mNR^aR^a、-O(CH₂)_mOR^a、-S(CH₂)_mHet、-S(CH₂)_mC(=O)Het、-S(CH₂)_mNR^aR^a、-S(CH₂)_mOR^a、-SR^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)NR^aOR^a、-C(=O)NR^aR^bNR^aR^a、-C(=O)NR^aR^bOR^a、-C(=O)NR^aR^bS(=O)_nR^a、-C(=O)NR^aR^bHet、-C(=O)OR^a、-OC(=O)R^a、-C(=O)OR^bNR^aR^a、-C(=O)R^a、-C(=O)R^bNR^aR^a、-C(=NOR^a)R^a、-C(=NCN)R^a、-S(=O)₂NR^aR^a、-NR^aS(=O)₂R^a、-S(=O)₂NR^aR^bC(=O)NR^aR^a、または-S(=O)₂NR^aR^bC(=O)OR^aから選択される0、1、2または3個の基で置換されたフェニルであり；

R^6 は、それぞれの場合で独立して、H、-CN、場合により置換されたアルキル、場合により置換されたアルケニル、場合により置換されたアルキニル、場合により置換されたシクロアルキル、場合により置換されたシクロアルケニル、場合により置換されたシクロアルキニル、場合により置換されたアリール、場合により置換されたアルコキシ、場合により置換されたアミノ、場合により置換された複素環、-S(=O)_nR^c、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-NR^aC(=O)R^a、または-OC(=O)R^aであり；

R^a は、それぞれの場合で独立して、H、C₁₋₆アルキル、-C(=O)C₁₋₄アルキル、C₁₋₄ハロ

アルキル、フェニル、ベンジル、またはN、O若しくはSから独立して選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有する、5若しくは6員環の飽和若しくは不飽和の複素環であり；

R^bは、それぞれの場合で独立して、C₁₋₆アルキル、-C(=O)C₁₋₄アルキル、C₁₋₄ハロアルキル、フェニル、ベンジル、またはN、O若しくはSから独立して選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有する、5若しくは6員環の飽和若しくは不飽和の複素環であり；

R^cは、C₁₋₆アルキル、C₁₋₄ハロアルキル、フェニルまたはベンジルであり；

R^dは、-CN、ハロゲン、ニトロ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₄ハロアルキル、-OH、-OR^c、-NR^aR^a、-S(=O)_nR^c、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-NR^aC(=O)R^a、-OC(=O)R^a、B(OH)₂、ビニル-OC₂CH₂O-、ビニル-OC₁₋₂ハロアルキルO-、ビニル-OCH₂O-、ビニル-CH₂OCH₂O-、フェニル、ベンジル及び、N、O若しくはSから独立して選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有する、5-若しくは6員環の飽和若しくは不飽和複素環により置換されたフェニルであり；

mは、1、2または3であり；

nは、0、1または2であり；

「場合により置換された」なる用語を使用するとき、これは、シクロプロピル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、アミノ、カルボキシ、カルボキサミド、アミジノ、カルバモイル、メルカブト、スルファモイル、C₁₋₄アルキル、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルカノイル、C₁₋₄アルカノイルオキシ、NH(C₁₋₄アルキル)、N(C₁₋₄アルキル)₂、C₁₋₄アルカノイルアミノ、(C₁₋₄アルカノイル)₂アミノ、N-(C₁₋₄アルキル)カルバモイル、N,N-(C₁₋₄アルキル)₂カルバモイル、(C₁₋₄)S、(C₁₋₄アルキル)S(0)、(C₁₋₄アルキル)S(0)₂、(C₁₋₄)アルコキシカルボニル、N-(C₁₋₄アルキル)スルファモイル、N,N-(C₁₋₄アルキル)スルファモイル、C₁₋₄アルキルスルホニアミノ、及び複素環から選択される少なくとも1個の置換基を指す}。

【請求項2】

式中、R¹は、H、またはC₁₋₆アルキル、または-(CH₂)_nシクロアルキルまたは-(CH₂)₁₋₂Hetであり、ここでC₁₋₆アルキルまたは-(CH₂)_nシクロアルキルまたは-(CH₂)₁₋₂Hetは、Het、ハロゲン、-CN、-OR^a、-NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)NR^aR^a、-OC(=O)C₁₋₄アルキル、-S(=O)_nR^c、-S(=O)_nNR^aR^aまたは-NR^aC(=O)C₁₋₄アルキルから選択される1、2または3個の置換基により場合により置換され、及びnは0、1または2である、請求項1に記載の化合物。

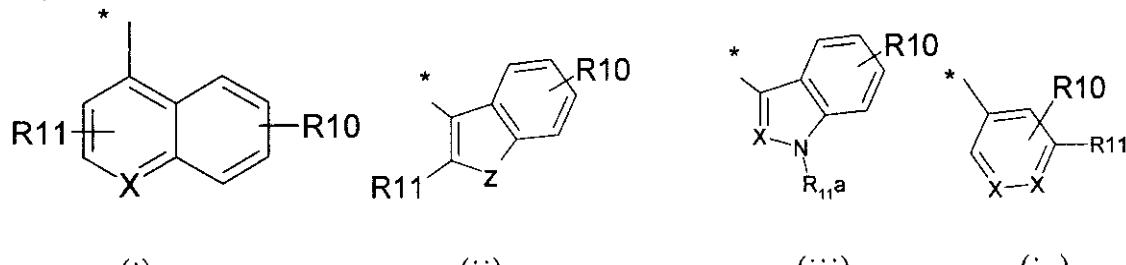
【請求項3】

式中、R²は、-(CH₂)₁₋₃シクロアルキルまたは-C₁₋₁₂アルキルであり、ここで-(CH₂)₁₋₃シクロアルキルまたは-C₁₋₁₂アルキルは、Het、S(=O)_nR^c、-S(=O)_nNR^aR^aハロゲン、-CN、-OR^a、-NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)NR^aR^a、-OC(=O)C₁₋₄アルキルまたは-NR^aC(=O)C₁₋₄アルキルから選択される0、1、2または3個の置換基により場合により置換され、及びnは、0、1または2である、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

式中、R³は、以下に定義の式(i)、(ii)、(iii)または(iv)：

【化2】



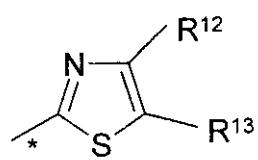
{式中、*は、(i)または(ii)または(iii)または(iv)が前記構造式(I)に結合している位置

であり、Xは、CまたはNであり；及びZはOまたはSであり、ここでR¹⁰は、前記環の任意の位置にあり、R¹⁰及びR¹¹はそれぞれの場合で独立して、H、R^a、ハロゲン、-CN、ニトロ、OR^a、CF₃、-NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)NR^aR^a、-OC(=O)C₁₋₄アルキル、-NR^aC(=O)C₁₋₄アルキルまたは-S(=O)_nR^cであり；ここでR^{11a}は、R^a、-S(=O)₂NR^aR^aまたは-S(=O)_nR^cであり、n=1または2である}から選択される、請求項1に記載の化合物。

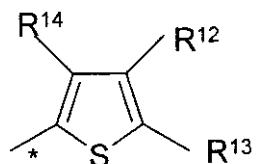
【請求項5】

式中、R⁴は、以下に定義の式(a)~(z)または(aa)若しくは(ab)：

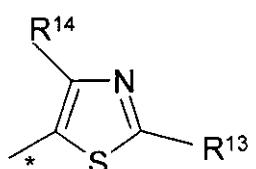
【化 3】



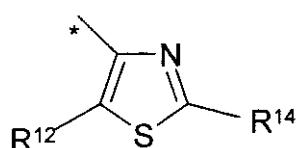
(a)



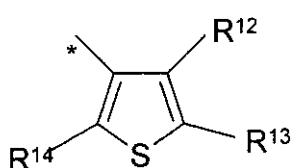
(b)



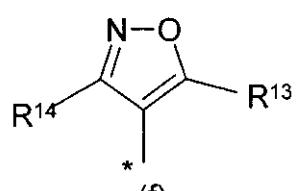
(c)



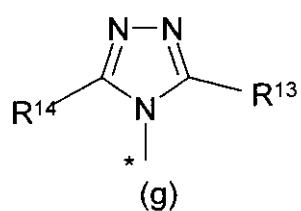
(d)



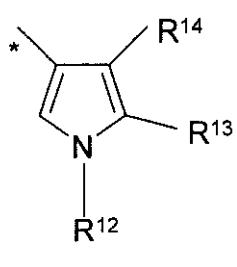
(e)



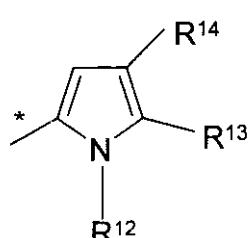
(f)



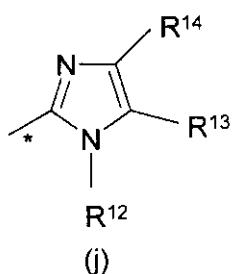
(g)



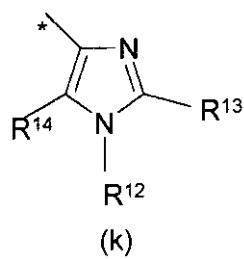
(h)



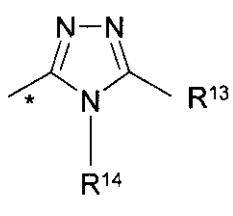
(i)



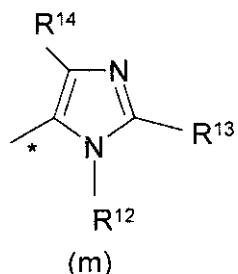
(j)



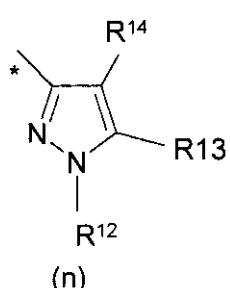
(k)



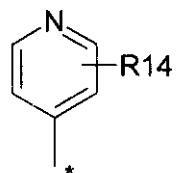
(l)



(m)

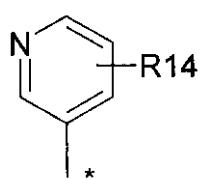


(n)

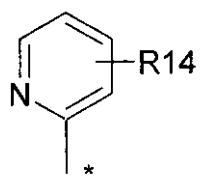


(o)

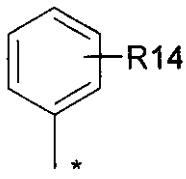
【化4】



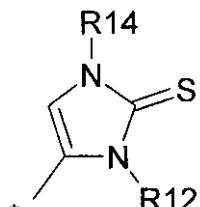
(p)



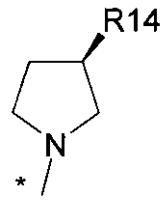
(q)



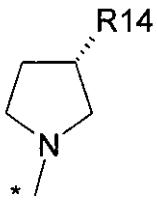
(r)



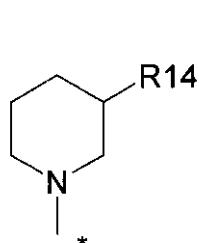
(s)



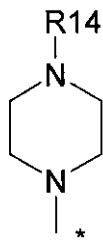
(t)



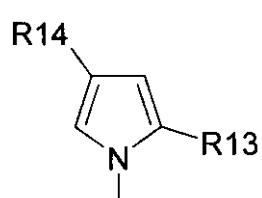
(u)



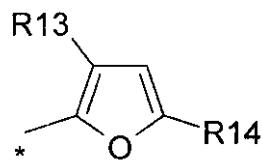
(v)



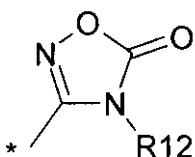
(w)



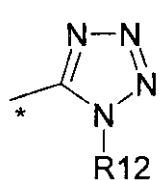
(x)



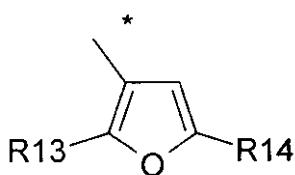
(y)



(z)



(aa)



(ab)

から選択され、式中、*は、R⁴が前記環系に結合している位置であり、ここでR¹²、R¹³及びR¹⁴は、それぞれ独立して、H、Het、C₁₋₆アルキル、-CN、-NR^aR^a、-ニトロ、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)NR^aS(=O)₂R^a、-C(=O)NR^a-Het、-C(=O)NR^aNR^aR^a、-C(=O)NR^a(R^bNR^aR^a)、-C(=O)NR^a(R^bOR^a)、-C(=O)NR^a(R^bS(=O)₂R^a)、-C(=O)NR^aR^bHet、-C(=O)NR^aOR^a、-C(=O)R^bNR^aR^a、-C(=NOR^a)R^a、-C(=NCN)R^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)OR^bNR^aR^a、-C(=O)R^a、-OC(=O)R^a、-C(=O)R^a-SR^a、=S、-NR^aC(=O)R^a、-NR^aC(=O)OR^a、-NR^aS(=O)₂R^b、-C(=NOR^a)R^a、-S(=O)₂R^a、-S(=O)₂NR^aR^a、-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)NR^aR^a)、または-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)OR^a)により表される、請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

式中、XはS、O、またはNR²⁻⁰であり、但し、Wが0であるとき、Xは0ではなく；またはX及び

これが結合している二重結合は2個の水素原子であってもよい；

Wは、S、O、またはNR²⁰であり、但し、Xが0であるとき、Wは0ではない；

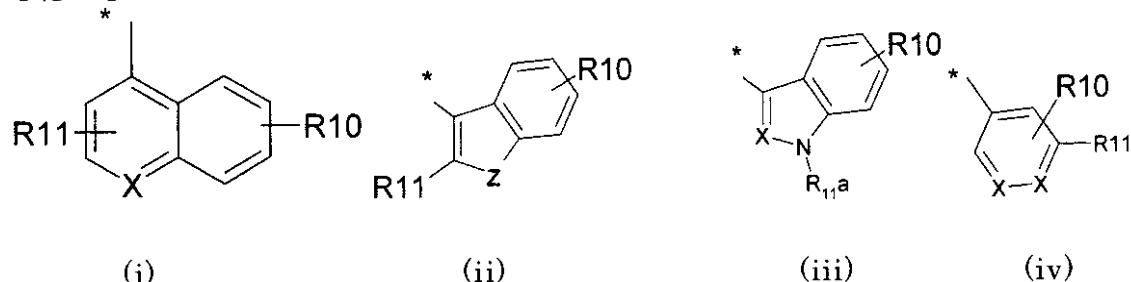
R²⁰はH、-CN、R^a、-OR^a、-NR^aR^a、-Het、-S(=O)_nR^c、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)O R^a、-NR^aC(=O)R^a、または-OC(=O)R^aであり；

R¹は、CH₃、CH₂CH₃、CH₂CN、CF₃、(CH₂)₂OH、シクロプロピル、イソプロピル、CH₂CCH、(CH₂)₂N(CH₂)₂、(CH₂)₂N(C=NH)NH₂、-CH₂-2-ピリジル、-CH₂-3-ピリジル、-CH₂-4-ピリジル、-(CH₂)₂-1-イミダゾリル、-(CH₂)₂-1-ピラゾリル、-(CH₂)₂-1-ピペリジル、-(CH₂)_m-(1-メチルピペリジン-4-イル)、-CH₂-(1-メチルピペリジン-3-イル)、-(CH₂)₂-(モルフォリン-4-イル)であり；

R²は、-CH₂CH₂CH₃、-CH₂-シクロプロピル、-CH₂CH(CH₃)₂、-CH₂CH₂CH₂F、-CH₂-シクロブチル、-CH₂C(CH₃)₃、-CH₂CH₂CH(CH₃)₂、-CH₂CF₃、-CH₂-メチルフェニル、-CH₂-フェノール、-CH₂-(3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル)、-CH₂-S-フェニル、-CH₂-フェニルカルボキシル、または-CH₂SCF₃であり；

R³は、以下に定義の式：(i)、(ii)、(iii)または(iv)：

【化5】

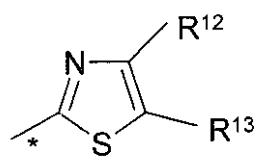


から選択され；

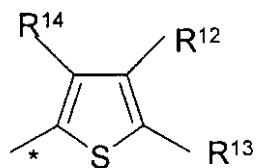
ここで、*は、(i)または(ii)または(iii)または(iv)が構造式(I)に結合している位置であり、XはCまたはNであり；及びZは、OまたはSであり、ここでR¹⁰は、前記環の任意の位置にあり、R¹⁰及びR¹¹はそれぞれの場合で独立して、H、R^a、ハロゲン、-CN、ニトロ、OR^a、CF₃、-NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-OC(=O)C_{1~4}アルキル、-NR^aC(=O)C_{1~4}アルキルまたは-S(=O)_nR^cであり；ここでR^{11a}は、R^a、-S(=O)₂NR^aR^aまたは-S(=O)_nR^cであり、n=1または2であり；

R⁴は、以下に定義の式(a)～(z)または(aa)若しくは(ab)から選択され：

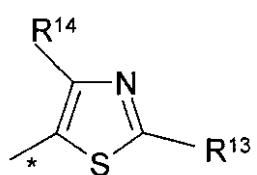
【化 6】



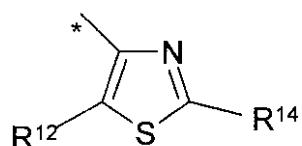
(a)



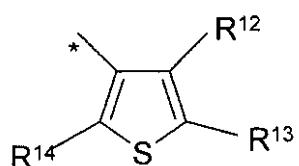
(b)



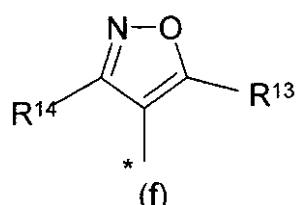
(c)



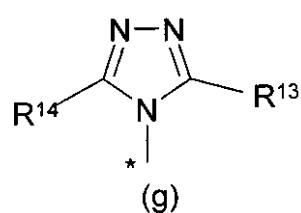
(d)



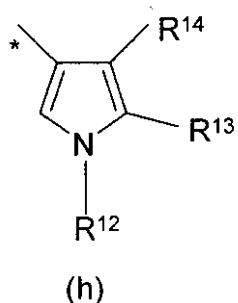
(e)



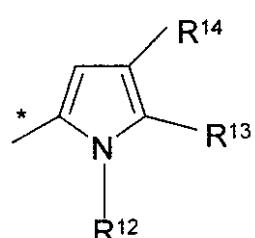
(f)



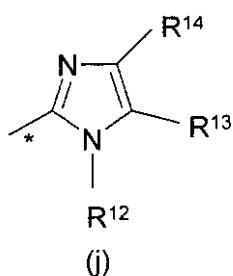
(g)



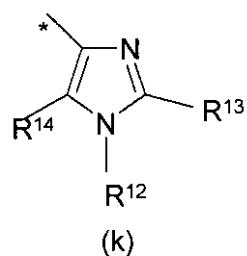
(h)



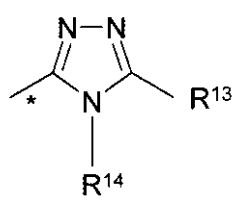
(i)



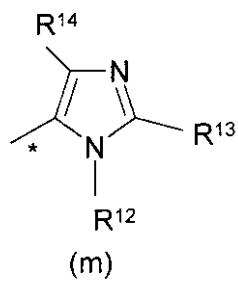
(j)



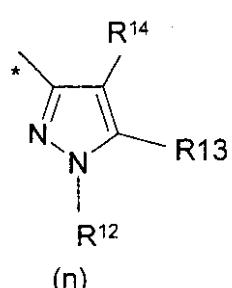
(k)



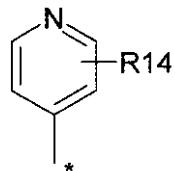
(l)



(m)

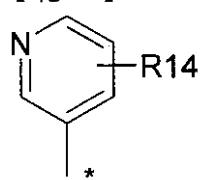


(n)

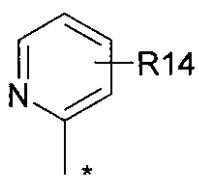


(o)

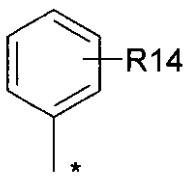
【化7】



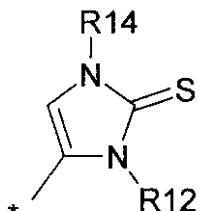
(p)



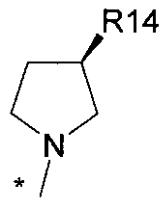
(q)



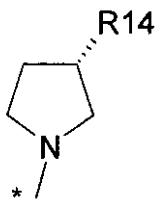
(r)



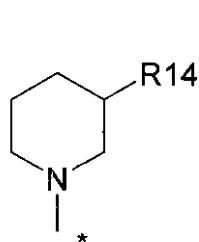
(s)



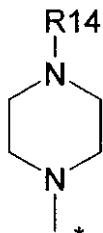
(t)



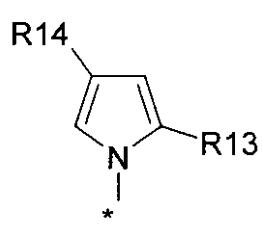
(u)



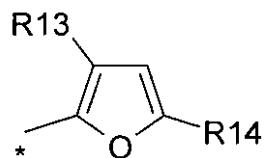
(v)



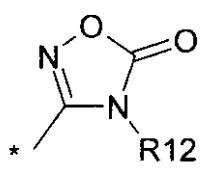
(w)



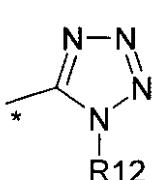
(x)



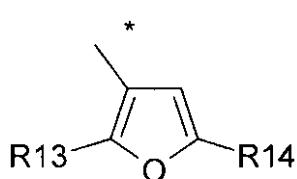
(y)



(z)



(aa)



(ab)

ここで、*は、 R^4 が前記環系に結合している位置であり、ここで R^{12} 、 R^{13} 及び R^{14} はそれぞれ独立して、H、Het、 C_{1-6} アルキル、-CN、-NR^aR^a、-ニトロ、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)NR^aS(=O)₂R^a、-C(=O)NR^a-Het、-C(=O)NR^aNR^aR^a、-C(=O)NR^a(R^bNR^aR^a)、-C(=O)NR^a(R^bOR^a)、-C(=O)NR^a(R^bS(=O)₂R^a)、-C(=O)NR^aR^bHet、-C(=O)NR^aOR^a、-C(=O)R^bNR^aR^a、-C(=O)OR^a、-C(=NCN)R^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)OR^bNR^aR^a、-C(=O)R^a、-OC(=O)R^a、-C(=O)R^a-SR^a、=S、-NR^aC(=O)R^a、-NR^aC(=O)OR^a、-NR^aS(=O)₂R^b、-C(=NOR^a)R^a、-S(=O)₂R^a、-S(=O)₂NR^a、-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)NR^aR^a)、または-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)OR^a)である、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

5-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-6-オキソ-4-チオ

キソ-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-4-イミノ-5-メチル-6-オキソ-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-[(4Z)-2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-5-メチル-4-(メチルイミノ)-6-オキソ-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-6-イミノ-5-メチル-4-オキソ-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-[(4Z)-2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-5-メチル-4-オキソ-6-チオキソ-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-[(6Z)-2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-5-メチル-6-(メチルイミノ)-4-オキソ-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

N-[(6Z)-2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-3-(4-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-7-(シクロプロピルメチル)-5-メチル-4-オキソ-2,4,5,7-テトラヒドロ-6H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イリデン]アセトアミド；

N-[(6Z)-2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-3-(4-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-7-(シクロプロピルメチル)-5-メチル-4-オキソ-2,4,5,7-テトラヒドロ-6H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イリデン]メタンスルホンアミド；

5-((6Z)-2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-6-{[2-(ジメチルアミノ)エチル]イミノ}-5-メチル-4-オキソ-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

N-1-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-3-(4-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-7-(シクロプロピルメチル)-5-メチル-4-オキソ-2,4,5,7-テトラヒドロ-6H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イリデン]-N₂、N₂-ジメチルグリシンアミド；

5-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-6-オキソ-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-5-メチル-6-オキソ-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-6-オキソ-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

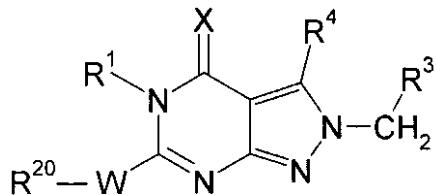
2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-5-メチル-3-(1-メチル-1H-イミダゾール-5-イル)-4-チオキソ-2,4,5,7-テトラヒドロ-6H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-オン；

(4Z)-2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-5-メチル-3-(1-メチル-1H-イミダゾール-5-イル)-4-(メチルイミノ)-2,4,5,7-テトラヒドロ-6H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-オンから選択される、式(I)の化合物。

【請求項 8】

構造式(II)：

【化8】



(II)

を有する化合物またはその医薬的に許容可能な塩 { 式中、XはS、O、またはNR²⁰であり、X及びこれに結合している二重結合は、2個の水素原子で置き換えることができ、WはS、O、またはNR²¹であり；

R¹はH、場合により置換されたアルキル、場合により置換されたアルケニル、場合により置換されたアルキニル、場合により置換されたシクロアルキル、場合により置換されたシクロアルケニル、場合により置換されたシクロアルキニル、場合により置換されたアリール、場合により置換されたアルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、または場合により置換された複素環であり、ここで前記置換基は、シクロプロピル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、アミノ、カルボキシ、カルボキサミド、アミジノ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、C₁₋₄アルキル、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルカノイル、C₁₋₄アルカノイルオキシ、NH(C₁₋₄アルキル)、N(C₁₋₄アルキル)₂、C₁₋₄アルカノイルアミノ、(C₁₋₄アルカノイル)₂アミノ、N-(C₁₋₄アルキル)カルバモイル、N,N-(C₁₋₄アルキル)₂カルバモイル、(C₁₋₄)S、(C₁₋₄アルキル)S(O)、(C₁₋₄アルキル)S(O)₂、(C₁₋₄)アルコキシカルボニル、N-(C₁₋₄アルキル)スルファモイル、N,N-(C₁₋₄アルキル)スルファモイル、C₁₋₄アルキルスルホニルアミノ、及び複素環から選択され；

R³は、N、OまたはSから独立して選択される0、1、2または3個のヘテロ原子を含む単環式または二環式の、飽和または不飽和の環系であり、前記環は、=O、ハロゲン、-OR^a、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、-CN、ニトロ、-S(=O)_nR^c、-O(CH₂)_mHet、-O(CH₂)_mC(=O)Het、-O(CH₂)_mC(=O)NR^aR^a、-O(CH₂)_mC(=O)OR^a、-O(CH₂)_mNR^aR^a、-O(CH₂)_mOR^a、-S(CH₂)_mHet、-S(CH₂)_mC(=O)Het、-S(CH₂)_mC(=O)NR^aR^a、-S(CH₂)_mOR^a、-NR^aR^a、-NHC(=O)R^a、N=NR^a、アミノカルボニル、フェニル、ベンジルから選択される0、1、2若しくは3個の置換基で置換されているか；またはR³は、-Het、-H^b-Het、R⁵、-R⁵-Het、-Het-R⁵、-Het-O-R⁵、-R⁵-R⁵、-R⁵-OR⁵によって表され；

R⁴は、単環式若しくは二環式の、飽和若しくは不飽和の環系、またはそのビシナル-融合誘導体であり、これは5~12、好ましくは5~10個の環原子を含んでもよく、そのうちの0、1、2、3または4個は、N、OまたはSから独立して選択されるヘテロ原子であり、前記環系は、B(OH)₂、ビシナル-OCH₂CH₂O-、ビシナル-OC₁₋₂ハロアルキルO-、ビシナル-OCH₂O-、ビシナル-CH₂OCH₂O-、=O、ハロゲン、-R^bOR^a、-SR^a、-OR^a、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、-CN、-S(=O)_nR^c、-O(CH₂)_mHet、-O(CH₂)_mC(=O)Het、-O(CH₂)_mC(=O)NR^aR^a、-O(CH₂)_mC(=O)OR^a、-O(CH₂)_mNR^aR^a、-O(CH₂)_mOR^a、-S(CH₂)_mHet、-S(CH₂)_mC(=O)Het、-S(CH₂)_mC(=O)NR^aR^a、-S(CH₂)_mC(=O)OR^a、-S(CH₂)_mNR^aR^a、-S(CH₂)_mOR^a、-NR^aR^a、-NHC(=O)R^a、-NHC(=O)OR^a、N=NR^a、NO₂、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)NR^aOR^a、-C(=O)NR^a(R^bNR^aR^a)、-C(=O)NR^a(R^bOR^a)、-C(=O)NR^a(R^bS(=O)_nR^a)、-C(=O)NR^a(R^bHet)、-C(=O)OR^a、-OC(=O)R^a、-C(=O)OR^bNR^aR^a、-C(=O)R^bNR^aR^a、-C(=NOR^a)R^a、-C(=NCN)R^a、-S(=O)₂NR^aR^a、-NR^aS(=O)₂R^a、-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)NR^aR^a)、-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)OR^a)、アミノカルボニル、フェニル、ベンジルから選択される0、1、2または3個の置換基により置換されているか；またはR⁴は、-(CH₂)_nR⁵-Het、-(CH₂)_nR^d、-Het、-Het-Het、R⁵、-R⁵-Het、-Het-R⁵、-Het-OR⁵、R⁵-R⁵、若しくは-R⁵-OR⁵により表されるか；またはR⁴は、C₁₋₆アルキル、-NC₁₋₆アルキル、若しくは-N(C₁₋₆アルキル)₂により表され、ここで前記C₁₋₆アルキル、-NC₁₋₆アルキル、-N(C₁₋₆アルキル)₂は、R^a、OR^a、ハロゲン若しくはフェニルから選択される

0、1または2個の置換基により置換されており、ここで R^4 は、 $-(CH_2)_zCH_3$ 、 $-(CH_2)_zCH_2OH$ 、 $-(CH_2)_zCO_2H$ 、でも $-(CH_2)_zCO_2C_{1-6}$ アルキルでもなく、ここで z は、1、2、3、4、5、若しくは6であり；

R^5 は、それぞれの場合で独立して、ハロゲン、 C_{1-6} ハロアルキル、 $-OC_{1-6}$ ハロアルキル、 C_{1-6} アルキル、 $-CN$ 、ニトロ、 $-OR^a$ 、 $-S(=O)_nR^c$ 、 $-O(CH_2)_mHet$ 、 $-O(CH_2)_mC(=O)Het$ 、 $-O(CH_2)_mC(=O)NR^aR^a$ 、 $-O(CH_2)_mC(=O)OR^a$ 、 $-O(CH_2)_mOR^a$ 、 $-S(CH_2)_mHet$ 、 $-S(CH_2)_mC(=O)NR^aR^a$ 、 $-S(CH_2)_mC(=O)OR^a$ 、 $-S(CH_2)_mNR^aR^a$ 、 $-S(CH_2)_mOR^a$ 、 $-R^bOR^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=O)NR^aOR^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^bNR^aR^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^bOR^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^bS(=O)_nR^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^bHet$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-OC(=O)R^a$ 、 $-C(=O)OR^bNR^aR^a$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)R^bNR^aR^a$ 、 $-C(=NOR^a)R^a$ 、 $-C(=NCN)R^a$ 、 $-S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-NR^aS(=O)_2R^a$ 、 $-S(=O)_2NR^aR^bC(=O)NR^aR^a$ 、または $-S(=O)_2NR^aR^bC(=O)OR^a$ から選択される0、1、2または3個の基により置換されたフェニルであり；

R^{20} は、それぞれの場合で独立して、 H 、 $-CN$ 、 $-S(=O)_nR^c$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-NR^aC(=O)R^a$ 、または $-OC(=O)R^a$ 、場合により置換されたアルキル、場合により置換されたアルケニル、場合により置換されたアルキニル、場合により置換されたシクロアルキル、場合により置換されたシクロアルケニル、場合により置換されたシクロアルキニル、場合により置換されたアリール、場合により置換されたアルコキシ、場合により置換されたアミノ、場合により置換された複素環であり、ここで前記置換基は、シクロプロピル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、アミノ、カルボキシ、カルボキサミド、アミジノ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、 C_{1-4} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルカノイル、 C_{1-4} アルカノイルオキシ、 $NH(C_{1-4}$ アルキル)、 $N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 C_{1-4} アルカノイルアミノ、 $(C_{1-4}$ アルカノイル) $_2$ アミノ、 $N-(C_{1-4}$ アルキル)カルバモイル、 $N,N-(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ カルバモイル、 $(C_{1-4})S$ 、 $(C_{1-4}$ アルキル) $S(O)$ 、 $(C_{1-4}$ アルキル) $S(O)_2$ 、 (C_{1-4}) アルコキシカルボニル、 $N-(C_{1-4}$ アルキル)スルファモイル、 $N,N-(C_{1-4}$ アルキル)スルファモイル、 C_{1-4} アルキルスルホニルアミノ、及び複素環から選択され；

R^{21} は、それぞれの場合で独立して、 H 、 $-CN$ 、 $-S(=O)_nR^c$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-NR^aC(=O)R^a$ 、または $-OC(=O)R^a$ ；場合により置換されたアルキル、場合により置換されたアルケニル、場合により置換されたアルキニル、場合により置換されたシクロアルキル、場合により置換されたシクロアルケニル、場合により置換されたシクロアルキニル、場合により置換されたアリール、場合により置換されたアルコキシ、場合により置換されたアミノ、場合により置換された複素環であり、ここで前記置換基は、シクロプロピル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、アミノ、カルボキシ、カルボキサミド、アミジノ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、 C_{1-4} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルカノイル、 C_{1-4} アルカノイルオキシ、 $NH(C_{1-4}$ アルキル)、 $N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 C_{1-4} アルカノイルアミノ、 $(C_{1-4}$ アルカノイル) $_2$ アミノ、 $N-(C_{1-4}$ アルキル)カルバモイル、 $N,N-(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ カルバモイル、 $(C_{1-4})S$ 、 $(C_{1-4}$ アルキル) $S(O)$ 、 $(C_{1-4}$ アルキル) $S(O)_2$ 、 (C_{1-4}) アルコキシカルボニル、 $N-(C_{1-4}$ アルキル)スルファモイル、 $N,N-(C_{1-4}$ アルキル)スルファモイル、 C_{1-4} アルキルスルホニルアミノ、及び複素環から選択され；

R^0 及び R^{21} と、これらが結合しているNは組み合わさって、N、OまたはSから独立して選択される1または2個のヘテロ原子を有する3～10員のN-結合飽和または不飽和の複素環を形成することもでき、ここで前記複素環は R^e で置換されており；

R^a は、それぞれの場合で独立して、 H 、 C_{1-6} アルキル、 $-C(=O)C_{1-4}$ アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、フェニル、ベンジル、またはN、O若しくはSから独立して選択される1、2、3、若しくは4個のヘテロ原子を含有する、5若しくは6員環の飽和若しくは不飽和の複素環であり；

R^b は、それぞれの場合で独立して、 C_{1-6} アルキル、 $-C(=O)C_{1-4}$ アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、フェニル、ベンジル、またはN、O若しくはSから独立して選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子を含有する、5若しくは6員環の飽和若しくは不飽和の複素環で

あり；

R^c は、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、フェニルまたはベンジルであり；

R^d は、-CN、ハロゲン、ニトロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、-OH、-OR^c、-NR^aR^a、-S(=O)_nR^c、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-NR^aC(=O)R^a、-OC(=O)R^a、B(OH)₂、ビニル-OC₂CH₂O-、ビニル-OC₁₋₂ハロアルキルO-、ビニル-OCH₂O-、ビニル-CH₂OCH₂O-、フェニル、ベンジル及び、N、O若しくはSから独立して選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子を含有する、5若しくは6員環の飽和若しくは不飽和の複素環から選択される0、1若しくは2個の基により置換されたフェニルであり；

R^e は、それぞれの場合で独立して、H、 C_{1-6} アルキル、-C(=O)C₁₋₄アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、フェニル、ベンジル、またはN、O若しくはSから独立して選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子を含有する、5若しくは6員環の飽和若しくは不飽和の複素環であり；

mは1、2または3であり；

nは、0、1または2である}。

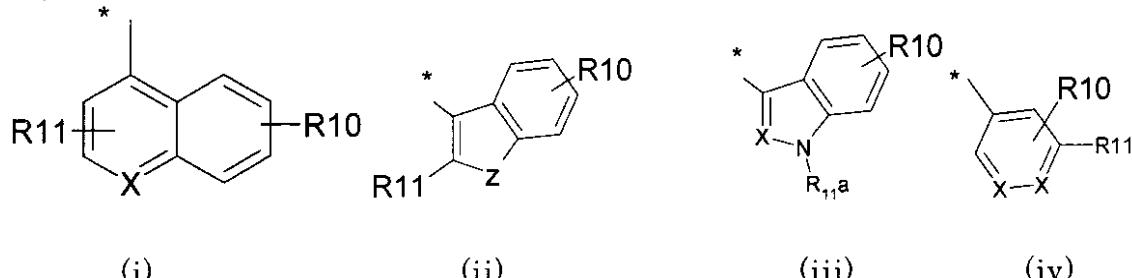
【請求項9】

式中、 R^1 はH、または C_{1-6} アルキル、若しくは-(CH₂)_nシクロアルキルであり、ここで C_{1-6} アルキルまたは-(CH₂)_nシクロアルキルは、Het、ハロゲン、-CN、-OR^a、-NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)NR^aR^a、-OC(=O)C₁₋₄アルキルまたは-NR^aC(=O)C₁₋₄アルキルから選択された1、2または3個の置換基により場合により置換され、及びnは0、1または2である、請求項8に記載の化合物。

【請求項10】

式中、 R^3 は以下の式(i)、(ii)、(iii)または(iv)：

【化9】

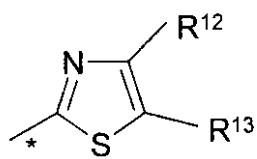


から選択され、式中、*は、(i)または(ii)または(iii)または(iv)が構造式(I)に結合している位置であり、XはCまたはNであり；及びZはOまたはSであり、ここで R^{10} は、前記環の任意の位置にあり、 R^{10} 及び R^{11} は、それぞれの場合で独立して、H、R^a、ハロゲン、-CN、ニトロ、OR^a、CF₃、-NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-OC(=O)C₁₋₄アルキル、-NR^aC(=O)C₁₋₄アルキルまたは-S(=O)_nR^cであり；ここで R^{11a} は、R^a、-S(=O)₂NR^aR^aまたは-S(=O)_nR^cであり、n=1または2である、請求項8に記載の化合物。

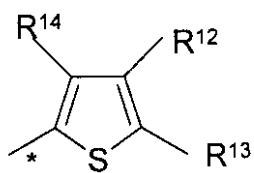
【請求項11】

式中、 R^4 は、以下の式(a)～(z)または(aa)若しくは(ab)：

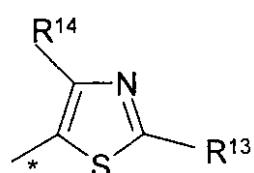
【化10】



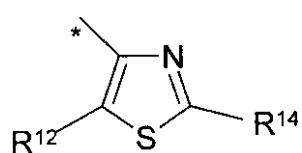
(a)



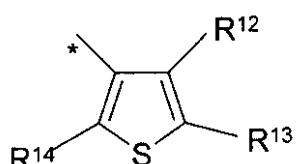
(b)



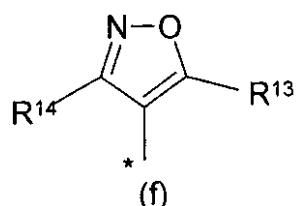
(c)



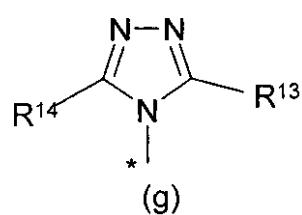
(d)



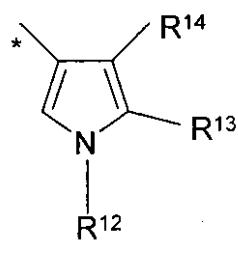
(e)



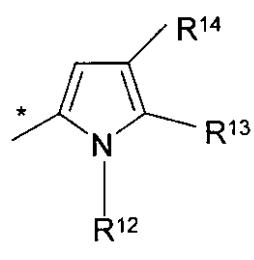
(f)



(g)

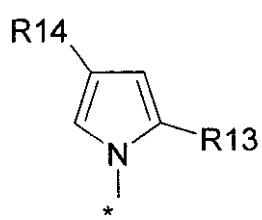
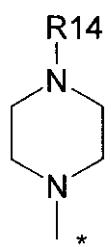
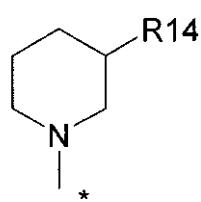
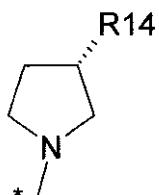
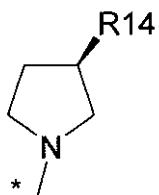
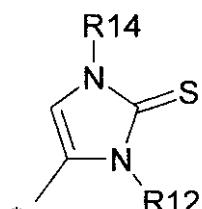
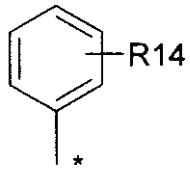
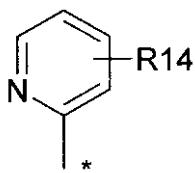
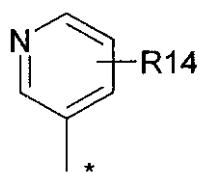
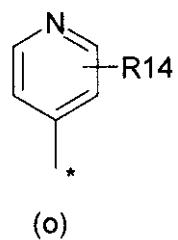
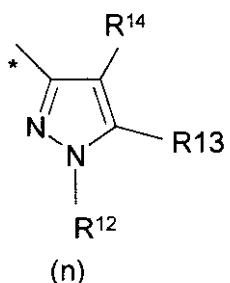
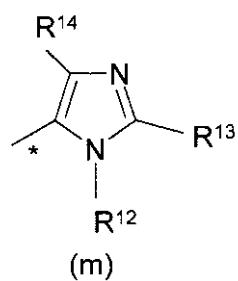
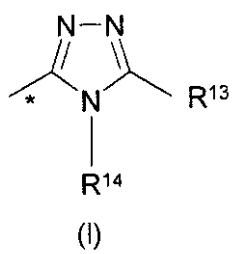
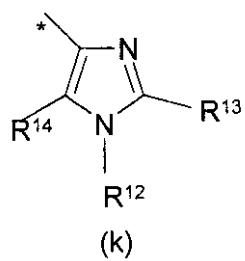
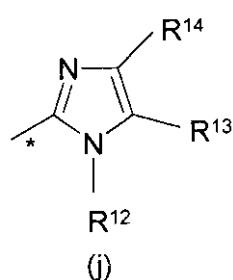


(h)

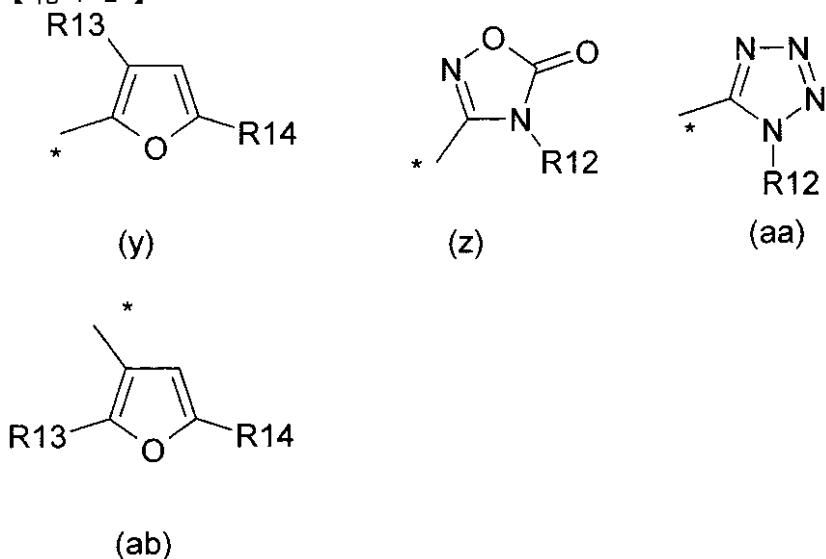


(i)

【化 1 1】



【化12】



から選択され、式中、*は、R⁴が前記環系に結合している位置であり、ここでR¹²、R¹³及びR¹⁴は、それぞれ独立して、H、Het、C₁₋₆アルキル、-CN、-NR^aR^a、-ニトロ、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)NR^aS(=O)₂R^a、-C(=O)NR^a-Het、-C(=O)NR^aNR^aR^a、-C(=O)NR^a(R^bNR^aR^a)、-C(=O)NR^a(R^bOR^a)、-C(=O)NR^a(R^bS(=O)₂R^a)、-C(=O)NR^aR^bHet、-C(=O)NR^aOR^a、-C(=O)R^bNR^aR^a、-C(=NOR^a)R^a、-C(=NCN)R^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)OR^bNR^aR^a、-C(=O)R^a、-OC(=O)R^a、-C(=O)R^a-SR^a、=S、-NR^aC(=O)R^a、-NR^aC(=O)OR^a、-NR^aS(=O)₂R^b、-C(=NOR^a)R^a、-S(=O)₂R^a、-S(=O)₂NR^aR^a、-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)NR^aR^a)、または-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)OR^a)によって表される、請求項8に記載の化合物。

【請求項12】

式中、Xは、S、O、若しくはNR²⁰であるか；またはXとこれが結合している二重結合は、2個の水素原子であってもよく；

WはS、O、またはNR²¹であり；

R²⁰は、H、-CN、R^a、-OR^a、-NR^aR^a、-Het、-S(=O)_nR^c、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-NR^aC(=O)R^a、または-OC(=O)R^aであり；

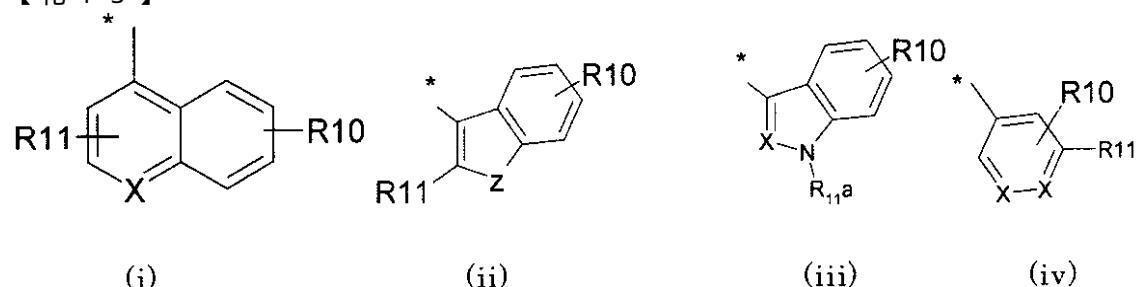
R²⁰は、H、-CN、R^a、-OR^a、-NR^aR^a、-Het、-S(=O)_nR^c、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-NR^aC(=O)R^a、または-OC(=O)R^aであり；

R²⁰及びR²¹と、これらが結合しているNは組み合わさって、N、OまたはSから独立して選択される1または2個のヘテロ原子を有する3～10員のN-結合飽和または不飽和の複素環を形成することもでき、ここで前記複素環はR^eで置換されており；

R¹は、CH₃、CH₂CH₃、CH₂CN、CF₃、(CH₂)₂OH、シクロプロピル、イソプロピル、CH₂CCH、(CH₂)₂N(CH₂)₂、(CH₂)₂N(C=NH)NH₂、-CH₂-2-ピリジル、-CH₂-3-ピリジル、-CH₂-4-ピリジル、-(CH₂)₂-1-イミダゾリル、-(CH₂)₂-1-ピラゾリル、-(CH₂)₂-1-ピペリジル、-(CH₂)_m-1-メチルピペリジン-4-イル、-CH₂-1-メチルピペリジン-3-イル、-(CH₂)₂-モルフォリン-4-イル)であり；

R³は、以下の式(i)、(ii)、(iii)または(iv)：

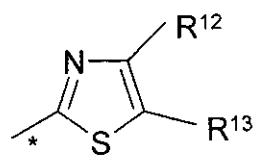
【化13】



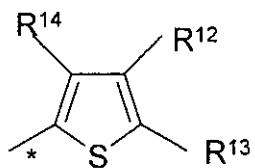
から選択され、ここで^{*}は、(i)または(ii)または(iii)または(iv)が構造式(I)に結合している位置であり、Xは、CまたはNであり；及びZはOまたはSであり、ここでR¹⁰は、前記環の任意の位置にあり、R¹⁰及びR¹¹はそれぞれの場合で独立して、H、R^a、ハロゲン、-CN、ニトロ、OR^a、CF₃、-NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-OC(=O)C₁₋₄アルキル、-NR^aC(=O)C₁₋₄アルキルまたは-S(=O)_nR^cであり、ここでR^{11a}は、R^a、-S(=O)₂NR^aR^aまたは-S(=O)_nR^cであり、n=1または2であり；

R⁴は、以下の式(a)～(z)または(aa)若しくは(ab)：

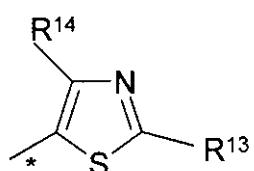
【化14】



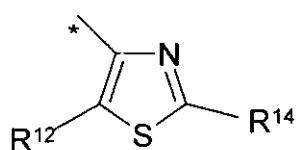
(a)



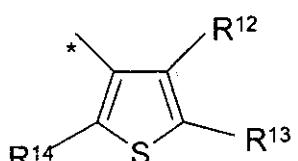
(b)



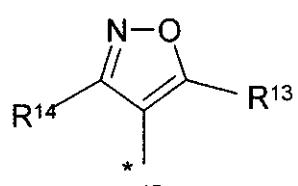
(c)



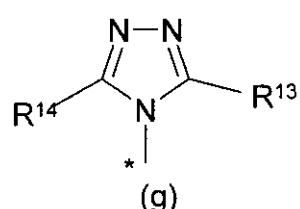
(d)



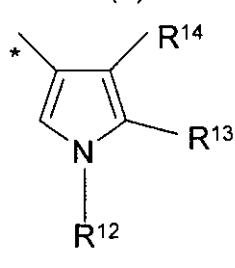
(e)



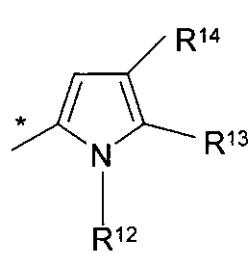
(f)



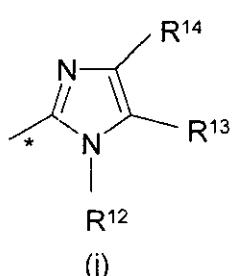
(g)



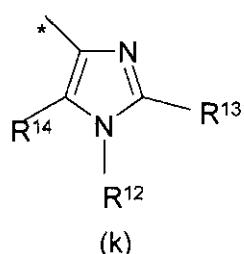
(h)



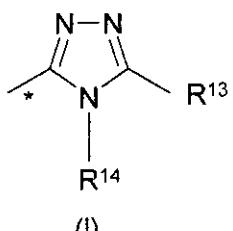
(i)



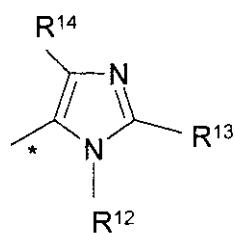
(j)



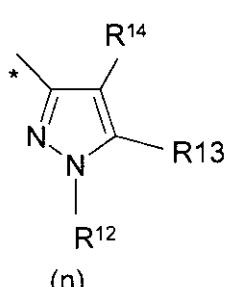
(k)



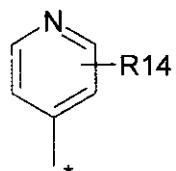
(l)



(m)

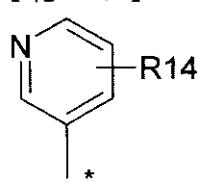


(n)

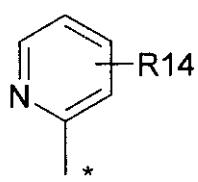


(o)

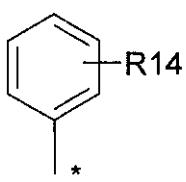
【化15】



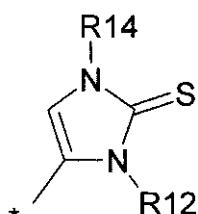
(p)



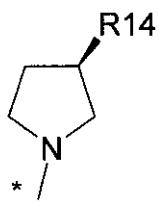
(q)



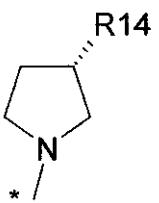
(r)



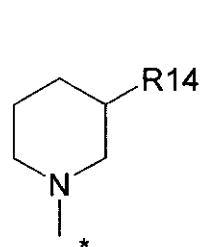
(s)



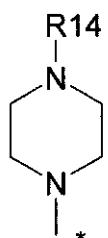
(t)



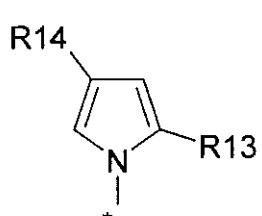
(u)



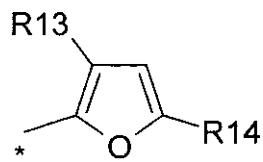
(v)



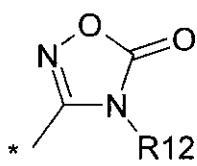
(w)



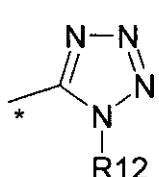
(x)



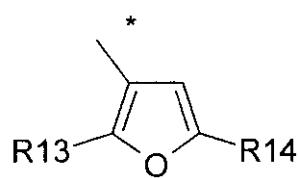
(y)



(z)



(aa)



(ab)

から選択され、ここで*は、R⁴が前記環系に結合している位置であり、ここでR^{1,2}、R^{1,3}及びR^{1,4}は、それぞれ独立して、H、Het、C₁₋₆アルキル、-CN、-NR^aR^a、-ニトロ、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)NR^aS(=O)₂R^a、-C(=O)NR^a-Het、-C(=O)NR^aNR^aR^a、-C(=O)NR^a(R^bNR^aR^a)、-C(=O)NR^a(R^bOR^a)、-C(=O)NR^a(R^bS(=O)₂R^a)、-C(=O)NR^aR^bHet、-C(=O)NR^aOR^a、-C(=O)R^bNR^aR^a、-C(=NOR^a)R^a、-C(=NCN)R^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)OR^bNR^aR^a、-C(=O)R^a、-OC(=O)R^a、-C(=O)R^a-SR^a、=S、-NR^aC(=O)R^a、-NR^aC(=O)OR^a、-NR^aS(=O)₂R^b、-C(=NOR^a)R^a、-S(=O)₂R^a、-S(=O)₂NR^aR^a、-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)NR^aR^a)、または-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)OR^a)により表される、請求項8に記載の化合物。

【請求項13】

5-{6-アミノ-2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-5-メチル-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-2

H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

N-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-3-(4-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-5-メチル-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イル]-3-メチルブタンアミド；

N,N-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-3-(4-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-5-メチル-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イル]-3-メチルブタンアミド；

N'-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-3-(4-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-5-メチル-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イル]-N,N-ジメチルイミドホルムアミド；

5-{2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-6-[(シクロプロピルメチル)(メチル)アミノ]-5-メチル-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-{2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-6-[(シクロプロピルメチル)アミノ]-5-メチル-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

N-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-3-(4-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-5-メチル-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イル]プロパン-1-スルホンアミド；

エチル2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-3-(4-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-5-メチル-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルカルバメート；

N-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-3-(4-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-5-メチル-4-オキソ-4,5-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イル]-N'-エチルウレア；

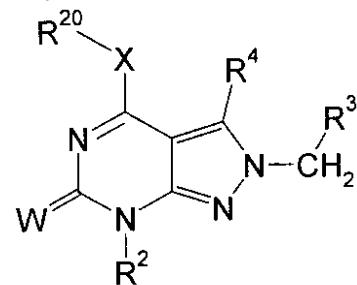
5-[(4Z)-2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-6-[(シクロプロピルメチル)アミノ]-5-メチル-4-(メチルイミノ)-4,5-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-[(4Z,6Z)-2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-5-メチル-4,6-ビス(メチルイミノ)-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリルから選択される式(II)の化合物。

【請求項 14】

構造式(III)：

【化16】



(III)

を有する化合物またはその医薬的に許容可能な塩 { 式中、Xは、S、O、NR²¹であるか；またはXR²⁰は水素であり；

WはS、O、またはNR²⁰であり；

R²は、H、場合により置換されたアルキル、場合により置換されたアルキルシクロアルキル、場合により置換されたアルキルシクロアルキル、場合により置換されたアルケニル、場合により置換されたアルキニル、場合により置換されたシクロアルキル、場合により

置換されたシクロアルケニル、場合により置換されたシクロアルキニル、場合により置換されたアリール、場合により置換されたアルコキシ、場合により置換されたアミノ、または場合により置換された複素環であり；

R^3 は、N、O、Sから独立して選択される0、1、2または3個のヘテロ原子を含む、単環式または二環式の、飽和または不飽和の環系であり、前記環は、=O、ハロゲン、-OR^a、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、-CN、ニトロ、-S(=O)_nR^c、-O(CH₂)_mHet、-O(CH₂)_mC(=O)Het、-O(CH₂)_mC(=O)NR^aR^a、-O(CH₂)_mC(=O)OR^a、-O(CH₂)_mNR^aR^a、-O(CH₂)_mOR^a、-S(CH₂)_mHet、-S(CH₂)_mC(=O)Het、-S(CH₂)_mC(=O)NR^aR^a、-S(CH₂)_mC(=O)OR^a、-S(CH₂)_mNR^aR^a、-S(CH₂)_mOR^a、-NR^aR^a、-NHC(=O)R^a、N=NR^a、アミノカルボニル、フェニル、ベンジルから選択される0、1、2若しくは3個の置換基で置換されているか；または R^3 は、-Het、-Het-Het、R⁵、-R⁵-Het、-Het-R⁵、-Het-0-R⁵、-R⁵-R⁵、-R⁵-OR⁵によって表され；

R^4 は、単環式若しくは二環式の、飽和若しくは不飽和の環系、またはそのビシナル-縮合誘導体であり、これは5～12、好ましくは5～10個の環原子を含んでもよく、そのうちの0、1、2、3または4個は、N、OまたはSから独立して選択されるヘテロ原子であり、前記環系は、B(OH)₂、ビシナル-OCH₂CH₂O-、ビシナル-OC₁₋₂ハロアルキルO-、ビシナル-OCH₂O-、ビシナル-CH₂OCH₂O-、=O、ハロゲン、-R^bOR^a、-SR^a、-OR^a、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、-CN、-S(=O)_nR^c、-O(CH₂)_mHet、-O(CH₂)_mC(=O)Het、-O(CH₂)_mC(=O)NR^aR^a、-O(CH₂)_mOR^a、-S(CH₂)_mHet、-S(CH₂)_mC(=O)Het、-S(CH₂)_mNR^aR^a、-S(CH₂)_mC(=O)OR^a、-S(CH₂)_mNR^aR^a、-O(CH₂)_mOR^a、-S(CH₂)_mNR^aR^a、-S(CH₂)_mOR^a、-NR^aR^a、-NHC(=O)R^a、-NHC(=O)OR^a、N=NR^a、NO₂、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)NR^aOR^a、-C(=O)NR^a(R^bNR^aR^a)、-C(=O)NR^a(R^bOR^a)、-C(=O)NR^a(R^bS(=O)_nR^a)、-C(=O)NR^a(R^bHet)、-C(=O)OR^a、-OC(=O)R^a、-C(=O)OR^bNR^aR^a、-C(=O)R^a、-C(=O)R^bNR^aR^a、-C(=NOR^a)R^a、-C(=NCN)R^a、-S(=O)₂NR^aR^a、-NR^aS(=O)₂R^a、-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)NR^aR^a)、-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)OR^a)、アミノカルボニル、フェニル、ベンジルから選択される0、1、2若しくは3個の置換基で置換されているか；または R^4 は、-(CH₂)_nR⁵-Het、-(CH₂)_nR^d、-Het、-Het-Het、R⁵、-R⁵-Het、-Het-R⁵、-Het-0R⁵、R⁵-R⁵、若しくは-R⁵-OR⁵により表されるか；または R^4 は、C₁₋₆アルキル、-NC₁₋₆アルキル、若しくは-N(C₁₋₆アルキル)₂により表され、ここで前記C₁₋₆アルキル、-NC₁₋₆アルキル、-N(C₁₋₆アルキル)₂は、R^a、OR^a、ハロゲンまたはフェニルから選択される0、1若しくは2個の置換基で置換されており、ここで R^4 は、-(CH₂)_zCH₃、-(CH₂)_zCH₂OH、-(CH₂)_zCO₂Hでも、-(CH₂)_zCO₂C₁₋₆アルキルでもなく、ここでzは、1、2、3、4、5、または6であり；

R^5 は、それぞれの場合で独立して、ハロゲン、C₁₋₆ハロアルキル、-OC₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆アルキル、-CN、ニトロ、-OR^a、-S(=O)_nR^c、-O(CH₂)_mHet、-O(CH₂)_mC(=O)Het、-O(CH₂)_mNR^aR^a、-O(CH₂)_mOR^a、-S(CH₂)_mHet、-S(CH₂)_mC(=O)Het、-S(CH₂)_mNR^aR^a、-S(CH₂)_mOR^a、-R^bOR^a、-SR^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)NR^aOR^a、-C(=O)NR^aR^bNR^aR^a、-C(=O)NR^aR^bOR^a、-C(=O)NR^aR^bS(=O)_nR^a、-C(=O)NR^aR^bHet、-C(=O)OR^a、-OC(=O)R^a、-C(=O)OR^bNR^aR^a、-C(=O)R^a、-C(=O)R^bNR^aR^a、-C(=NOR^a)R^a、-C(=NCN)R^a、-S(=O)₂NR^aR^a、-NR^aS(=O)₂R^a、-S(=O)₂NR^aR^bC(=O)OR^aから選択される0、1、2または3個の基で置換されたフェニルであり；

R^{20} は、それぞれの場合で独立して、H、-CN、場合により置換されたアルキル、場合により置換されたアルケニル、場合により置換されたアルキニル、場合により置換されたシクロアルキル、場合により置換されたシクロアルケニル、場合により置換されたシクロアルキニル、場合により置換されたアリール、場合により置換されたアルコキシ、場合により置換されたアミノ、場合により置換された複素環、-S(=O)_nR^c、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-NR^aC(=O)R^a、または-OC(=O)R^aであり；

R^{21} は、それぞれの場合で独立して、H、-CN、場合により置換されたアルキル、場合により置換されたアルケニル、場合により置換されたアルキニル、場合により置換されたシクロアルキル、場合により置換されたシクロアルケニル、場合により置換されたシクロアルキニル、場合により置換されたアリール、場合により置換されたアルコキシ、場合によ

り置換されたアミノ、場合により置換された複素環、 $-S(=O)_nR^c$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-NR^aC(=O)R^a$ 、または $-OC(=O)R^a$ であるか；あるいは

R^{20} 及び R^{21} と、これらが結合しているNは組み合わさって、N、OまたはSから独立して選択される1または2個のヘテロ原子を有する3～10員のN-結合飽和または不飽和の複素環を形成することもでき、ここで前記複素環は R^e で置換されており；

R^a は、それぞれの場合で独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 $-C(=O)C_{1-4}$ アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、フェニル、ベンジル、またはN、O若しくはSから独立して選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子を含有する、5若しくは6員環の飽和若しくは不飽和の複素環であり；

R^b は、それぞれの場合で独立して、 C_{1-6} アルキル、 $-C(=O)C_{1-4}$ アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、フェニル、ベンジル、またはN、O若しくはSから独立して選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子を含有する、5若しくは6員環の飽和若しくは不飽和の複素環であり；

R^c は、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、フェニルまたはベンジルであり；

R^d は、 $-CN$ 、ハロゲン、ニトロ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 $-OH$ 、 $-OR^c$ 、 $-NR^aR^a$ 、 $-S(=O)_nR^c$ 、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-NR^aC(=O)R^a$ 、 $-OC(=O)R^a$ 、 $B(OH)_2$ 、ビシニル- OC_2CH_2O- 、ビシニル- OC_{1-2} ハロアルキルO-、ビシニル- OCH_2O- 、ビシニル- CH_2OCH_2O- 、フェニル、ベンジル及び、N、O若しくはSから独立して選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有する5-若しくは6-員環の飽和若しくは不飽和複素環により置換されたフェニルであり；

R^e は、それぞれの場合で独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 $-C(=O)C_{1-4}$ アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、フェニル、ベンジル、またはN、O若しくはSから独立して選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子を含有する5若しくは6員環の飽和若しくは不飽和の複素環であり；

mは、1、2または3であり；

nは、0、1または2であり；

「場合により置換された」なる用語を使用するとき、これは、シクロプロピル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、アミノ、カルボキシ、カルボキサミド、アミジノ、カルバモイル、メルカブト、スルファモイル、 C_{1-4} アルキル、 C_{2-4} アルケニル、 C_{2-4} アルキニル、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルカノイル、 C_{1-4} アルカノイルオキシ、 $NH(C_{1-4}$ アルキル)、 $N(C_{1-4}$ アルキル)₂、 C_{1-4} アルカノイルアミノ、(C_{1-4} アルカノイル)₂アミノ、 $N-(C_{1-4}$ アルキル)カルバモイル、 $N,N-(C_{1-4}$ アルキル)₂カルバモイル、(C_{1-4})S、(C_{1-4} アルキル)S(O)、(C_{1-4} アルキル)S(O)₂、(C_{1-4})アルコキシカルボニル、 $N-(C_{1-4}$ アルキル)スルファモイル、 $N,N-(C_{1-4}$ アルキル)スルファモイル、 C_{1-4} アルキルスルホニアミノ、及び複素環から選択される少なくとも一個の置換基を指す}。

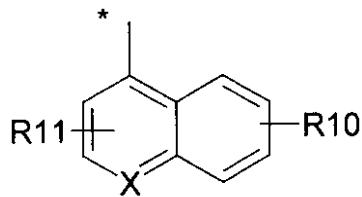
【請求項15】

式中、 R^2 は $-(CH_2)_{1-3}$ シクロアルキルまたは $-C_{1-12}$ アルキルであり、ここで $-(CH_2)_{1-3}$ シクロアルキルまたは $-C_{1-12}$ アルキルは、Het、 $S(=O)_nR^c$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-OR^a$ 、 $-NR^aR^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-OC(=O)C_{1-4}$ アルキルまたは $-NR^aC(=O)C_{1-4}$ アルキルから選択された0、1、2または3個の置換基で場合により置換され、nは0、1または2である、請求項14に記載の化合物。

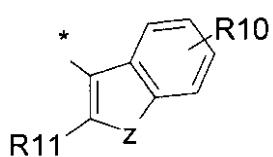
【請求項16】

式中、 R^3 は、以下の式(i)、(ii)、(iii)または(iv)：

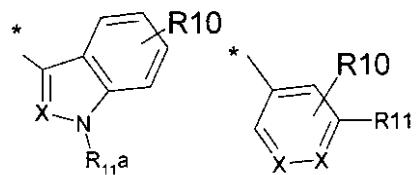
【化 1 7】



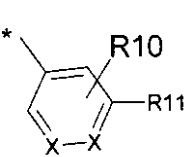
(i)



(ii)



(iii)



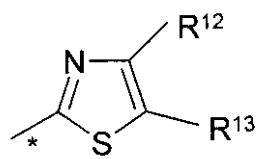
(iv)

から選択され、ここで*は、(i)または(ii)または(iii)または(iv)が構造式(I)に結合している位置であり、Xは、CまたはNであり；及びZはOまたはSであり、ここでR¹⁰は、前記環の任意の位置にあり、R¹⁰及びR¹¹は、それぞれの場合で独立して、H、R^a、ハロゲン、-CN、ニトロ、OR^a、CF₃、-NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)NR^aR^a、-OC(=O)C₁₋₄アルキル、-NR^aC(=O)C₁₋₄アルキルまたは-S(=O)_nR^cであり；ここでR^{11a}はR^a、-S(=O)₂NR^aR^aまたは-S(=O)_nR^cであり、n=1または2である、請求項1-4に記載の化合物。.

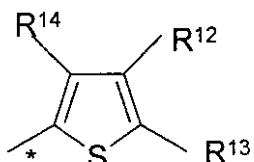
【請求項 17】

式中、 R^4 は、以下の式 (a) ~ (z) または (aa) 若しくは (ab) :

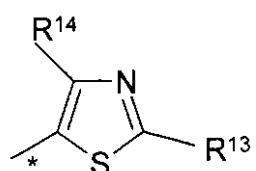
【化 18】



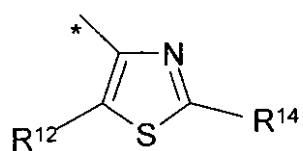
(a)



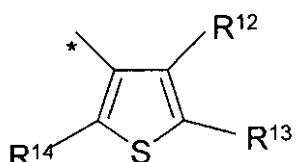
(b)



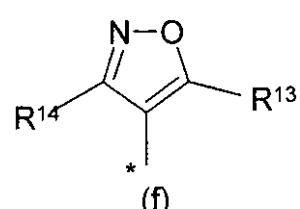
(c)



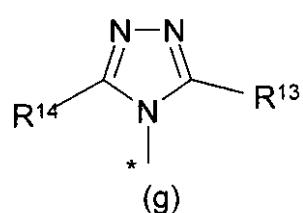
(d)



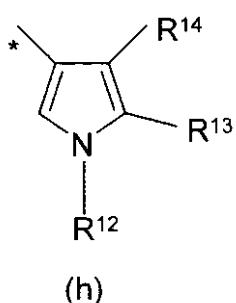
(e)



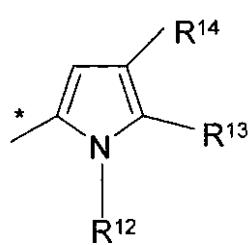
(f)



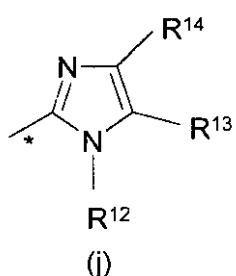
(g)



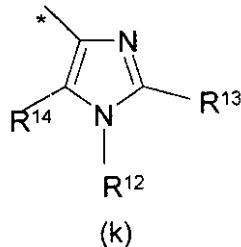
(h)



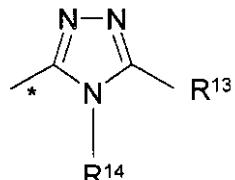
(i)



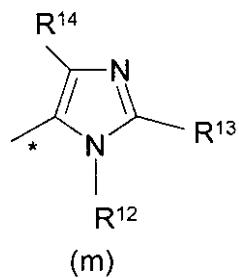
(j)



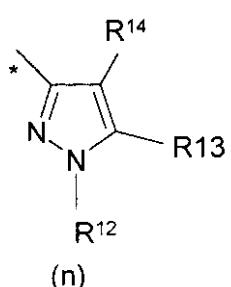
(k)



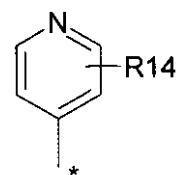
(l)



(m)

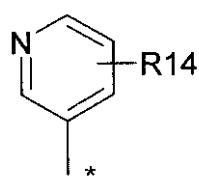


(n)

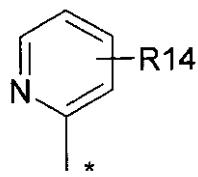


(o)

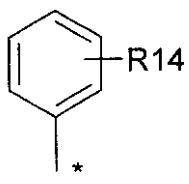
【化19】



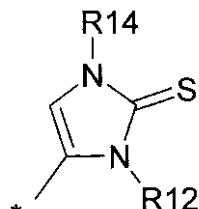
(p)



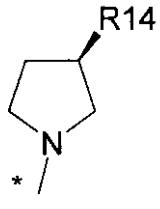
(q)



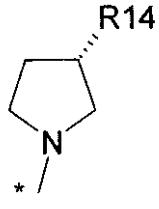
(r)



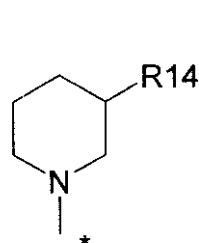
(s)



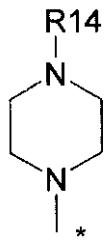
(t)



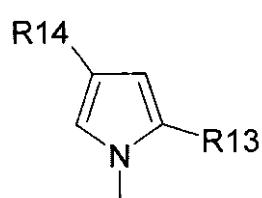
(u)



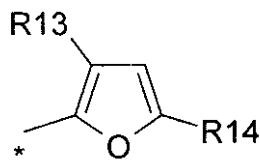
(v)



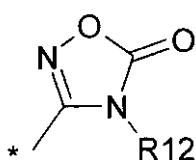
(w)



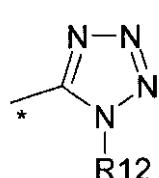
(x)



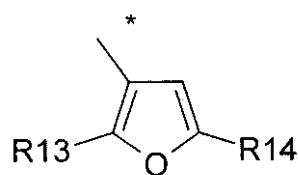
(y)



(z)



(aa)



(ab)

から選択され、ここで*は、 R^4 が前記環系に結合している位置であり、ここで R^{12} 、 R^{13} 及び R^{14} は、それぞれ独立して、H、Het、C₁₋₆アルキル、-CN、-NR^aR^a、-ニトロ、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)NR^aS(=O)₂R^a、-C(=O)NR^a-Het、-C(=O)NR^aNR^aR^a、-C(=O)NR^a(R^bNR^aR^a)、-C(=O)NR^a(R^bOR^a)、-C(=O)NR^a(R^bS(=O)₂R^a)、-C(=O)NR^aR^bHet、-C(=O)NR^aOR^a、-C(=O)R^bNR^aR^a、-C(=NOR^a)R^a、-C(=NCN)R^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)OR^bNR^aR^a、-C(=O)R^a、-OC(=O)R^a、-C(=O)R^a-SR^a、=S、-NR^aC(=O)R^a、-NR^aC(=O)OR^a、-NR^aS(=O)₂R^b、-C(=NOR^a)R^a、-S(=O)₂R^a、-S(=O)₂NR^aR^a、-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)NR^aR^a)、または-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)OR^a)により表される、請求項14に記載の化合物。

【請求項18】

式中、Xは、S、O、若しくはNR²¹であるか；またはXR²⁰は水素であり、

Wは、S、O、またはNR²⁰であり；

R²⁰は、H、-CN、R^a、-OR^a、-NR^aR^a、-Het、-S(=O)_nR^c、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-NR^aC(=O)R^a、または-OC(=O)R^aであり；

R²⁰は、H、-CN、R^a、-OR^a、-NR^aR^a、-Het、-S(=O)_nR^c、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-NR^aC(=O)R^a、または-OC(=O)R^aであり；

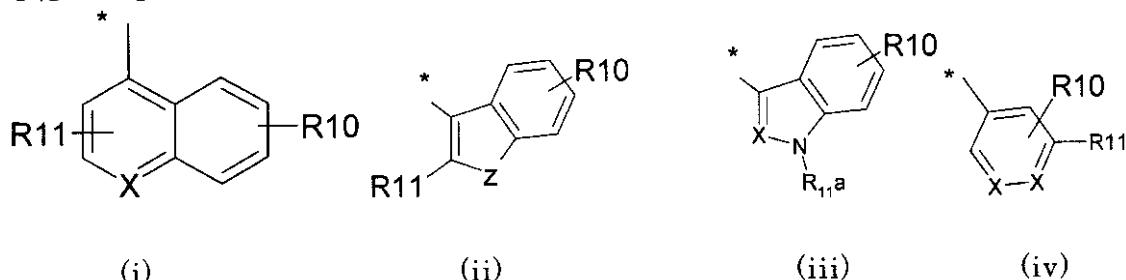
R²⁰及びR²¹と、これらが結合しているNは組み合わさって、N、OまたはSから独立して選択される1または2個のヘテロ原子を有する3～10員のN-結合飽和または不飽和の複素環を形成することもでき、ここで前記複素環はR^eで置換されており；

R¹は、CH₃、CH₂CH₃、CH₂CN、CF₃、(CH₂)₂OH、シクロプロピル、イソプロピル、CH₂CCH、(CH₂)₂N(CH₂)₂、(CH₂)₂N(C=NH)NH₂、-CH₂-2-ピリジル、-CH₂-3-ピリジル、-CH₂-4-ピリジル、-(CH₂)₂-1-イミダゾリル、-(CH₂)₂-1-ピラゾリル、-(CH₂)₂-1-ピペリジル、-(CH₂)_m-(1-メチルピペリジン-4-イル)、-CH₂-(1-メチルピペリジン-3-イル)、-(CH₂)₂-(モルフォリン-4-イル)であり、

R²は、-CH₂CH₂CH₃、-CH₂-シクロプロピル、-CH₂CH(CH₃)₂、-CH₂CH₂CH₂F、-CH₂-シクロブチル、-CH₂C(CH₃)₃、-CH₂CH₂CH(CH₃)₂、-CH₂CF₃、-CH₂-メチルフェニル、-CH₂-フェノール、-CH₂-(3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル)、-CH₂-S-フェニル、-CH₂-フェニルカルボキシル、または-CH₂SCF₃であり；

R³は、以下の式(i)、(ii)、(iii)または(iv)：

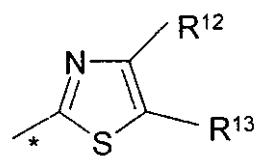
【化20】



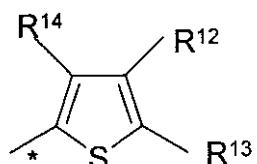
から選択され、ここで*は、(i)または(ii)または(iii)または(iv)が構造式(I)に結合している位置であり、Xは、CまたはNであり；及びZは、OまたはSであり、ここでR¹⁰は、前記環の上の任意の位置にあり、R¹⁰及びR¹¹はそれぞれの場合で独立して、H、R^a、ハロゲン、-CN、二トロ、OR^a、CF₃、-NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-OC(=O)C₁₋₄アルキル、-NR^aC(=O)C₁₋₄アルキルまたは-S(=O)_nR^cであり；ここでR^{11a}は、R^a、-S(=O)₂NR^aR^aまたは-S(=O)_nR^cであり、n=1または2であり、

R⁴は、以下の式(a)～(z)または(aa)若しくは(ab)：

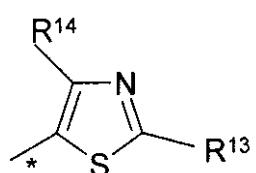
【化 2 1】



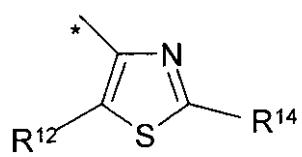
(a)



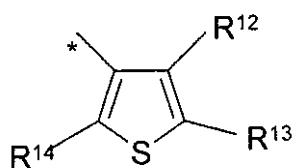
(b)



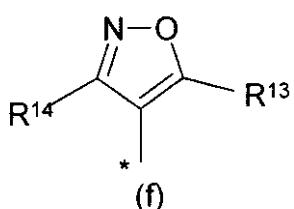
(c)



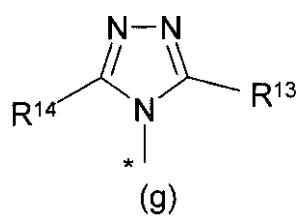
(d)



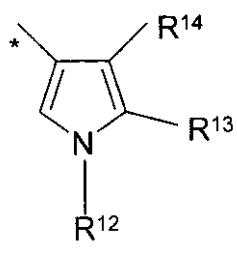
(e)



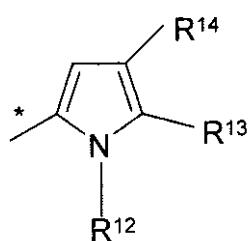
(f)



(g)

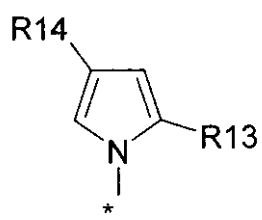
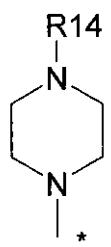
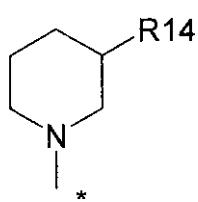
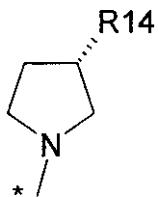
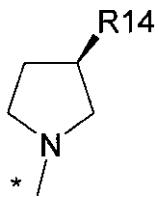
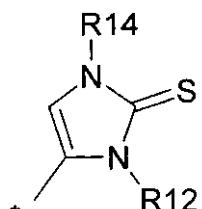
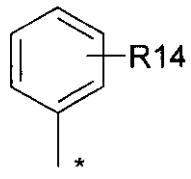
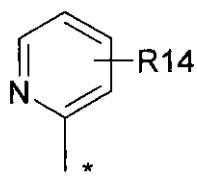
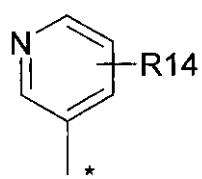
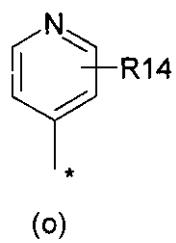
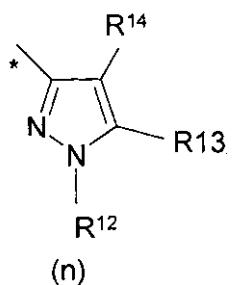
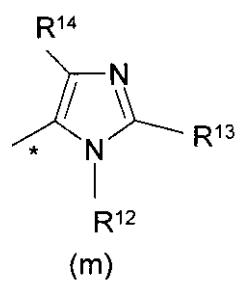
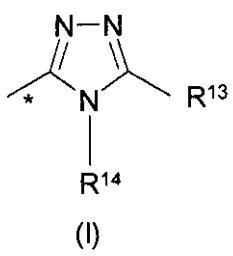
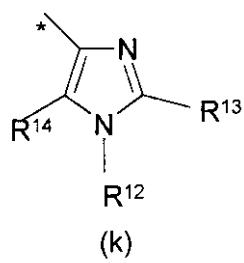
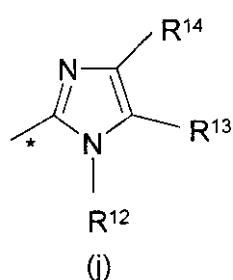


(h)

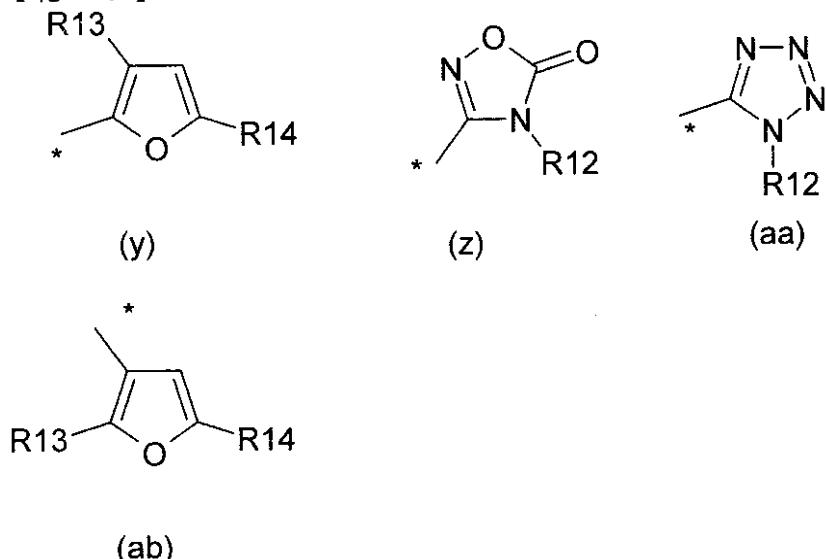


(i)

【化22】



【化23】



から選択され、ここで*は、R⁴が前記環系に結合している位置であり、ここでR¹²、R¹³及びR¹⁴は、それぞれ独立して、H、Het、C₁₋₆アルキル、-CN、-NR^aR^a、-ニトロ、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)NR^aS(=O)₂R^a、-C(=O)NR^a-Het、-C(=O)NR^aNR^aR^a、-C(=O)NR^a(R^bNR^a)、-C(=O)NR^a(R^bOR^a)、-C(=O)NR^a(R^bS(=O)₂R^a)、-C(=O)NR^aR^bHet、-C(=O)NR^aOR^a、-C(=O)R^bNR^aR^a、-C(=NOR^a)R^a、-C(=NCN)R^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)OR^bNR^aR^a、-C(=O)R^a、-OC(=O)R^a、-C(=O)R^a-SR^a、=S、-NR^aC(=O)R^a、-NR^aC(=O)OR^a、-NR^aS(=O)₂R^b、-C(=NOR^a)R^a、-S(=O)₂R^a、-S(=O)₂NR^aR^a、-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)NR^aR^a)、または-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)OR^a)により表される、請求項14に記載の化合物。

【請求項19】

4-アミノ-7-イソブチル-2-(1-ナフチルメチル)-3-ピリジン-4-イル-2,7-ジヒドロ-6H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-オン；

7-イソブチル-4-(メチルアミノ)-2-(1-ナフチルメチル)-3-ピリジン-4-イル-2,7-ジヒドロ-6H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-オン；

4-(ジメチルアミノ)-7-イソブチル-2-(1-ナフチルメチル)-3-ピリジン-4-イル-2,7-ジヒドロ-6H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-オン；

7-イソブチル-4-(4-メチルピペラジン-1-イル)-2-(1-ナフチルメチル)-3-ピリジン-4-イル-2,7-ジヒドロ-6H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-オン；

4-アミノ-2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-イソブチル-3-(1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-2,7-ジヒドロ-6H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-オン；

5-{4-アミノ-2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-イソブチル-6-オキソ-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-イソブチル-4-(メチルアミノ)-6-オキソ-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-4-(ジメチルアミノ)-7-イソブチル-6-オキソ-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-イソブチル-6-オキソ-4-(プロピルアミノ)-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-{2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-4-[(2-ヒドロキシエチル)アミノ]-7-イソブチル-6-オキソ-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-4-(ヒドロキシアミノ)-7-イソブチル-6-オキソ-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-4-(シクロプロピルアミノ)-7-イソブチル-6-オキソ-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-{2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-4-ヒドラジノ-7-イソブチル-6-オキソ-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-4-(2,2-ジメチルヒドラジノ)-7-イソブチル-6-オキソ-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

N-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-3-(4-シアノ-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-7-イソブチル-6-オキソ-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-4-イル]アセトアミド；

5-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-4-(メチルチオ)-6-オキソ-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-{2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-4-[(2-ヒドロキシブチル)アミノ]-6-オキソ-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル}-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-(2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-4-[(2R)-2-ヒドロキシプロピル]アミノ}-6-オキソ-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル)-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-4-メトキシ-6-オキソ-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-6-オキソ-4-(1H-ピロール-1-イル)-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

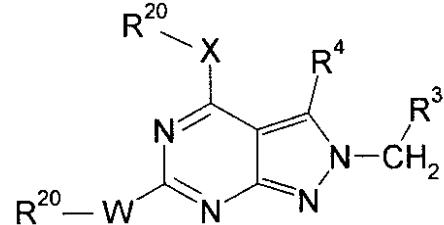
5-[(6Z)-2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-4-(メチルアミノ)-6-(メチルイミノ)-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

5-[4-アミノ-2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-6-オキソ-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリルから選択される構造式(III)の化合物。

【請求項 20】

構造式(IV)の化合物：

【化 24】



(IV)

またはその医薬的に許容可能な塩 { Xは、S、O、NR²¹であるか；またはXR²⁰は、水素であり；

Wは、S、O、またはNR²⁻¹であり；

R³は、N、OまたはSから独立して選択される0、1、2または3個のヘテロ原子を含有する、単環式または二環式の、飽和または不飽和の環系であり、前記環は、=O、ハロゲン、-OR^a、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、-CN、ニトロ、-S(=O)_nR^c、-O(CH₂)_mHet、-O(CH₂)_mC(=O)Het、-O(CH₂)_mC(=O)NR^aR^a、-O(CH₂)_mC(=O)OR^a、-O(CH₂)_mNR^aR^a、-O(CH₂)_mOR^a、-S(CH₂)_mHet、-S(CH₂)_mC(=O)Het、-S(CH₂)_mC(=O)NR^aR^a、-S(CH₂)_mC(=O)OR^a、-S(CH₂)_mNR^aR^a、-S(CH₂)_mOR^a、-NR^aR^a、-NHC(=O)R^a、N=NR^a、アミノカルボニル、フェニル、ベンジルから選択される0、1、2若しくは3個の置換基により置換されているか；またはR³は、-Het、-Het-Het、R⁵、-R⁵-Het、-Het-R⁵、-Het-O-R⁵、-R⁵-R⁵、-R⁵-OR⁵により表される；

R⁴は、単環式若しくは二環式の、飽和若しくは不飽和の環系またはそのビシナル-縮合誘導体であり、これは5～12、好ましくは5～10個の環原子を含んでいてもよく、そのうちの0、1、2、3または4個はN、OまたはSから独立して選択されるヘテロ原子であり、前記環系は、B(OH)₂、ビシナル-OCH₂CH₂O-、ビシナル-OC₁₋₂ハロアルキルO-、ビシナル-OCH₂O-、ビシナル-CH₂OCH₂O-、=O、ハロゲン、-R^bOR^a、-SR^a、-OR^a、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、-CN、-S(=O)_nR^c、-O(CH₂)_mHet、-O(CH₂)_mC(=O)Het、-O(CH₂)_mNR^aR^a、-O(CH₂)_mOR^a、-O(CH₂)_mNR^aR^a、-S(CH₂)_mHet、-S(CH₂)_mC(=O)Het、-S(CH₂)_mNR^aR^a、-S(CH₂)_mOR^a、-S(CH₂)_mNR^aR^a、-S(CH₂)_mC(=O)OR^a、-S(CH₂)_mNR^aR^a、-O(CH₂)_mOR^a、-S(CH₂)_mNR^aR^a、-S(CH₂)_mOR^a、-NR^aR^a、-NHC(=O)R^a、-NHC(=O)OR^a、N=NR^a、NO₂、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)NR^aOR^a、-C(=O)NR^a(R^bNR^aR^a)、-C(=O)NR^a(R^bOR^a)、-C(=O)NR^a(R^bS(=O)_nR^a)、-C(=O)NR^a(R^bHet)、-C(=O)OR^a、-OC(=O)R^a、-C(=O)OR^bNR^aR^a、-C(=O)R^a、-C(=O)R^bNR^aR^a、-C(=NOR^a)R^a、-C(=NCN)R^a、-S(=O)₂NR^aR^a、-NR^aS(=O)₂R^a、-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)NR^aR^a)、-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)OR^a)、アミノカルボニル、フェニル、ベンジルから選択される0、1、2若しくは3個の置換基により置換されているか；またはR⁴は、-(CH₂)_nR⁵-Het、-(CH₂)_nR^d、-Het、-Het-Het、R⁵、-R⁵-Het、-Het-R⁵、-Het-OR⁵、R⁵-R⁵、若しくは-R⁵-OR⁵により表されるか；またはR⁴は、C₁₋₆alky、-NC₁₋₆アルキル、若しくは-N(C₁₋₆アルキル)₂により表され、ここで前記C₁₋₆アルキル、-NC₁₋₆アルキル、-N(C₁₋₆アルキル)₂は、R^a、OR^a、ハロゲン若しくはフェニルから選択される0、1または2個の置換基により置換され、ここでR⁴は、-(CH₂)_zCH₃、-(CH₂)_zCH₂OH、-(CH₂)_zCO₂Hでも、-(CH₂)_zCO₂C₁₋₆アルキルでもなく、ここでzは、1、2、3、4、5、または6である；

R⁵は、それぞれの場合で独立してハロゲン、C₁₋₆ハロアルキル、-OC₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆アルキル、-CN、ニトロ、-OR^a、-S(=O)_nR^c、-O(CH₂)_mHet、-O(CH₂)_mC(=O)Het、-O(CH₂)_mNR^aR^a、-O(CH₂)_mOR^a、-O(CH₂)_mNR^aR^a、-S(CH₂)_mHet、-S(CH₂)_mC(=O)Het、-S(CH₂)_mNR^aR^a、-S(CH₂)_mOR^a、-R^bOR^a、-SR^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)NR^aOR^a、-C(=O)NR^aR^bNR^aR^a、-C(=O)NR^aR^bOR^a、-C(=O)NR^aR^aR^bS(=O)_nR^a、-C(=O)NR^aR^bHet、-C(=O)OR^a、-OC(=O)R^a、-C(=O)OR^bNR^aR^a、-C(=O)R^a、-C(=O)R^bNR^aR^a、-C(=NOR^a)R^a、-C(=NCN)R^a、-S(=O)₂NR^aR^a、-NR^aS(=O)₂R^a、-S(=O)₂NR^aR^bC(=O)NR^aR^aまたは-S(=O)₂NR^aR^bC(=O)OR^aから選択される0、1、2または3個の基で置換されたフェニルであり；

R²⁰は、それぞれの場合で独立して、H、-CN、-S(=O)_nR^c、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-NR^aC(=O)R^a、または-OC(=O)R^a、場合により置換されたアルキル、場合により置換されたアルケニル、場合により置換されたアルキニル、場合により置換されたシクロアルキル、場合により置換されたシクロアルケニル、場合により置換されたシクロアルキニル、場合により置換されたアリール、場合により置換されたアルコキシ、場合により置換されたアミノ、場合により置換された複素環であり、ここでそのような置換基は、シクロプロピル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、アミノ、カルボキシ、カルボキサミド、アミジノ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、C₁₋₄アルキル、C₂₋₄アルケニル、C₂₋₄アルキニル、C₁₋₄アルコキシ、C₁₋₄アルカノイル、C₁₋₄アルカノイルオキシ、NH(C₁₋₄アルキル)、N(C₁₋₄アルキル)₂、C₁₋₄アルカノイルアミノ、(C₁₋₄アルカノイル)₂アミノ、N-(C₁₋₄アルキル)カルバモイル、N,N-(C₁₋₄アルキル)₂カル

バモイル、 $(C_{1-4})S$ 、 $(C_{1-4}\text{アルキル})S(O)$ 、 $(C_{1-4}\text{アルキル})S(O)_2$ 、 $(C_{1-4})\text{アルコキシカルボニル}$ 、 $N-(C_{1-4}\text{アルキル})\text{スルファモイル}$ 、 $N,N-(C_{1-4}\text{アルキル})\text{スルファモイル}$ 、 $C_{1-4}\text{アルキルスルホニルアミノ}$ 、及び複素環から選択され；

R^{21} は、それぞれの場合で独立して、H、-CN、 $-S(=O)_nR^c$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-NR^aC(=O)R^a$ 、または $-OC(=O)R^a$ ；場合により置換されたアルキル、場合により置換されたアルケニル、場合により置換されたアルキニル、場合により置換されたシクロアルキル、場合により置換されたシクロアルケニル、場合により置換されたシクロアルキニル、場合により置換されたアリール、場合により置換されたアルコキシ、場合により置換されたアミノ、場合により置換された複素環であり、ここでそのような置換基は、シクロプロピル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、アミノ、カルボキシ、カルボキサミド、アミジノ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、 $C_{1-4}\text{アルキル}$ 、 $C_{2-4}\text{アルケニル}$ 、 $C_{2-4}\text{アルキニル}$ 、 $C_{1-4}\text{アルコキシ}$ 、 $C_{1-4}\text{アルカノイル}$ 、 $C_{1-4}\text{アルカノイルオキシ}$ 、 $NH(C_{1-4}\text{アルキル})$ 、 $N(C_{1-4}\text{アルキル})_2$ 、 $C_{1-4}\text{アルカノイルアミノ}$ 、 $(C_{1-4}\text{アルカノイル})_2\text{アミノ}$ 、 $N-(C_{1-4}\text{アルキル})\text{カルバモイル}$ 、 $N,N-(C_{1-4}\text{アルキル})_2\text{カルバモイル}$ 、 $(C_{1-4})S$ 、 $(C_{1-4}\text{アルキル})S(O)$ 、 $(C_{1-4}\text{アルキル})S(O)_2$ 、 $(C_{1-4})\text{アルコキシカルボニル}$ 、 $N-(C_{1-4}\text{アルキル})\text{スルファモイル}$ 、 $N,N-(C_{1-4}\text{アルキル})\text{スルファモイル}$ 、 $C_{1-4}\text{アルキルスルホニルアミノ}$ 、及び複素環から選択され；

R^{20} 及び R^{21} と、これらが結合しているNは組み合わさって、N、OまたはSから独立して選択される1または2個のヘテロ原子を有する3~10員のN-結合飽和または不飽和の複素環を形成することもでき、ここで前記複素環は、 R^e で置換されており；

R^a は、それぞれの場合で独立して、H、 $C_{1-6}\text{アルキル}$ 、 $-C(=O)C_{1-4}\text{アルキル}$ 、 $C_{1-4}\text{ハロアルキル}$ 、フェニル、ベンジル、またはN、O若しくはSから独立して選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子を含有する、5若しくは6員環の飽和若しくは不飽和の複素環であり；

R^b は、それぞれの場合で独立して、 $C_{1-6}\text{アルキル}$ 、 $-C(=O)C_{1-4}\text{アルキル}$ 、 $C_{1-4}\text{ハロアルキル}$ 、フェニル、ベンジル、またはN、O若しくはSから独立して選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子を含有する、5若しくは6員環の飽和若しくは不飽和の複素環であり；

R^c は、 $C_{1-6}\text{アルキル}$ 、 $C_{1-4}\text{ハロアルキル}$ 、フェニルまたはベンジルであり；

R^d は、-CN、ハロゲン、ニトロ、 $C_{1-6}\text{アルキル}$ 、 $C_{1-4}\text{ハロアルキル}$ 、-OH、 $-OR^c$ 、 $-NR^aR^a$ 、 $-S(=O)_nR^c$ 、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-NR^aC(=O)R^a$ 、 $-OC(=O)R^a$ 、 $B(OH)_2$ 、ビシニル- OC_2CH_2O- 、ビシニル- $OC_{1-2}H_2O-$ 、ビシニル-OCH₂O-、ビシニル-CH₂OCH₂O-、フェニル、ベンジル及び、N、O若しくはSから独立して選択される1、2、3または4個のヘテロ原子を含有する、5若しくは6員環の飽和若しくは不飽和の複素環により置換されたフェニルであり；

R^e は、それぞれの場合で独立して、H、 $C_{1-6}\text{アルキル}$ 、 $-C(=O)C_{1-4}\text{アルキル}$ 、 $C_{1-4}\text{ハロアルキル}$ 、フェニル、ベンジル、またはN、O若しくはSから独立して選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子を含有する、5若しくは6員環の飽和若しくは不飽和の複素環であり；

mは、1、2または3であり；

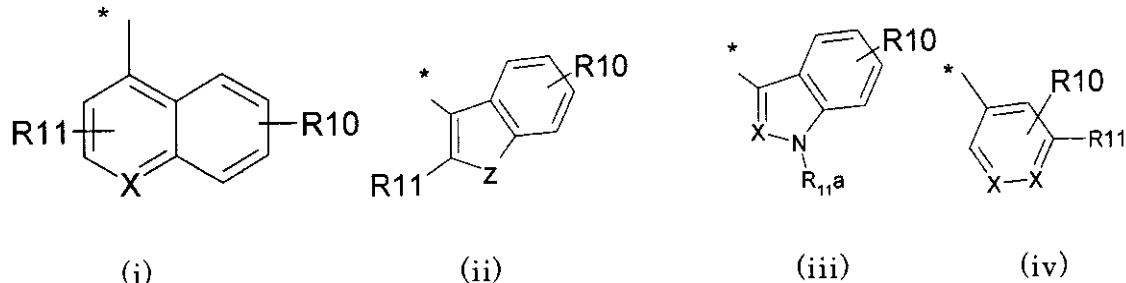
nは、0、1または2であり；

「場合により置換された」なる用語を使用するとき、これは、シクロプロピル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、アミノ、カルボキシ、カルボキサミド、アミジノ、カルバモイル、メルカプト、スルファモイル、 $C_{1-4}\text{アルキル}$ 、 $C_{2-4}\text{アルケニル}$ 、 $C_{2-4}\text{アルキニル}$ 、 $C_{1-4}\text{アルコキシ}$ 、 $C_{1-4}\text{アルカノイル}$ 、 $C_{1-4}\text{アルカノイルオキシ}$ 、 $NH(C_{1-4}\text{アルキル})$ 、 $N(C_{1-4}\text{アルキル})_2$ 、 $C_{1-4}\text{アルカノイルアミノ}$ 、 $(C_{1-4}\text{アルカノイル})_2\text{アミノ}$ 、 $N-(C_{1-4}\text{アルキル})\text{カルバモイル}$ 、 $N,N-(C_{1-4}\text{アルキル})_2\text{カルバモイル}$ 、 $(C_{1-4})S$ 、 $(C_{1-4}\text{アルキル})S(O)$ 、 $(C_{1-4}\text{アルキル})S(O)_2$ 、 $(C_{1-4})\text{アルコキシカルボニル}$ 、 $N-(C_{1-4}\text{アルキル})\text{スルファモイル}$ 、 $N,N-(C_{1-4}\text{アルキル})\text{スルファモイル}$ 、 $C_{1-4}\text{アルキルスルホニアミノ}$ 、及び複素環から選択される少なくとも1個の置換基を指す}。

【請求項 21】

式中、R³は、以下の式(i)、(ii)、(iii)または(iv)：

【化25】

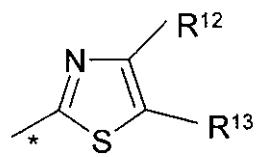


から選択され、ここで*は、(i)または(ii)または(iii)または(iv)が構造式(I)に結合している位置であり、Xは、CまたはNであり；及びZは、OまたはSであり、ここでR¹⁰は、前記環の上の任意の位置にあり、R¹¹は、それぞれの場合で独立して、H、R^a、ハロゲン、-C^N、ニトロ、OR^a、CF₃、-NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-OC(=O)C₁₋₄アルキル、-NR^aC(=O)C₁₋₄アルキルまたは-S(=O)_nR^cであり；ここでR^{11a}は、R^a、-S(=O)₂NR^aR^aまたは-S(=O)_nR^cであり、n=1または2である、請求項20に記載の化合物。

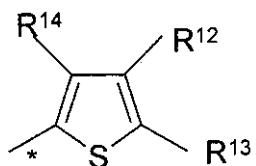
【請求項 22】

式中、R⁴は、以下の式(a)～(z)または(aa)若しくは(ab)：

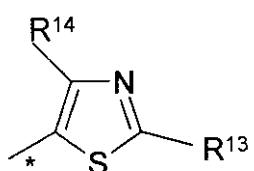
【化26】



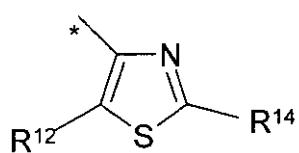
(a)



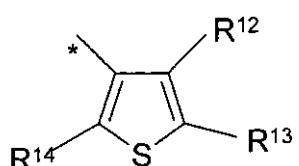
(b)



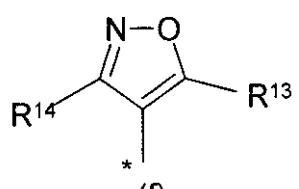
(c)



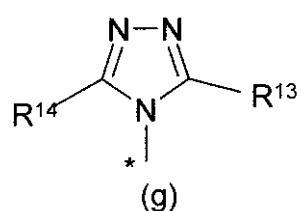
(d)



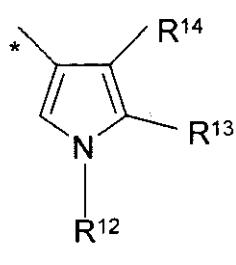
(e)



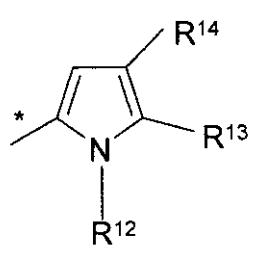
(f)



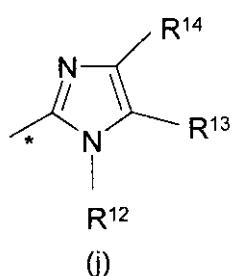
(g)



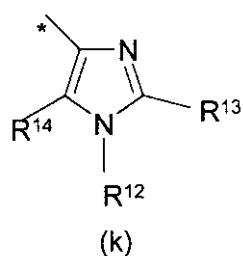
(h)



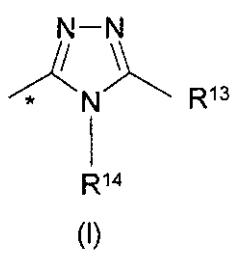
(i)



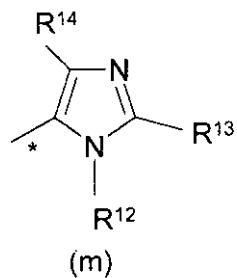
(j)



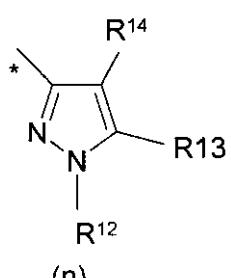
(k)



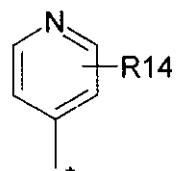
(l)



(m)

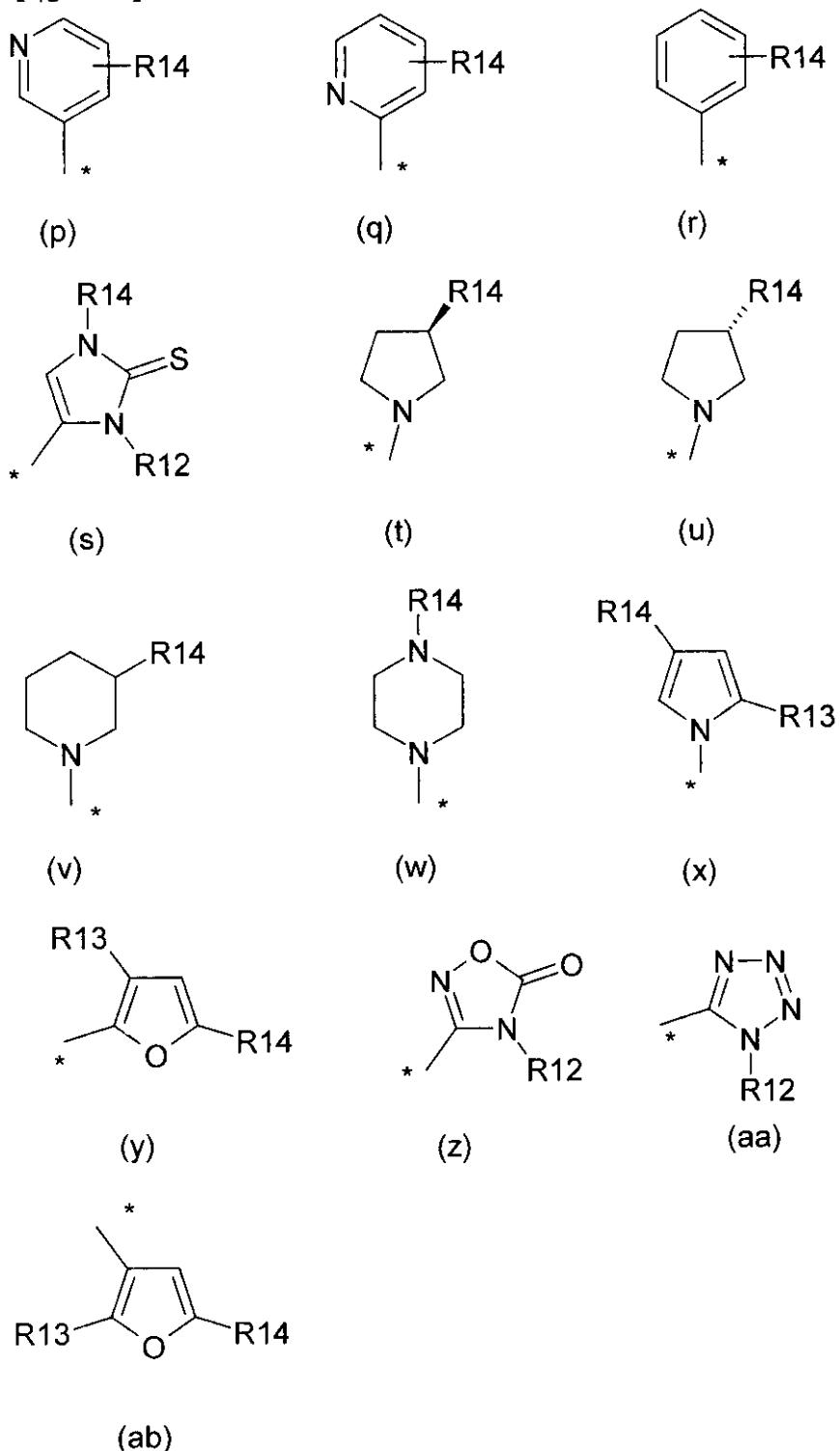


(n)



(o)

【化27】



から選択され、ここで*は、R⁴が前記環系に結合している位置であり、ここでR¹²、R¹³及びR¹⁴は、それぞれ独立して、H、Het、C₁₋₆アルキル、-CN、-NR^aR^a、-ニトロ、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)NR^aS(=O)₂R^a、-C(=O)NR^a-Het、-C(=O)NR^aNR^aR^a、-C(=O)NR^a(R^bNR^aR^a)、-C(=O)NR^a(R^bOR^a)、-C(=O)NR^a(R^bS(=O)₂R^a)、-C(=O)NR^aR^bHet、-C(=O)NR^aOR^a、-C(=O)R^bNR^aR^a、-C(=NOR^a)R^a、-C(=NCN)R^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)OR^bNR^aR^a、-C(=O)R^a、-OC(=O)R^a、-C(=O)R^a-SR^a、=S、-NR^aC(=O)R^a、-NR^aC(=O)OR^a、-NR^aS(=O)₂R^b、-C(=NOR^a)R^a、-S(=O)₂R^a、-S(=O)₂NR^aR^a、-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)NR^aR^a)、または-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)OR^a)により表される、請求項20に記載の化合物。

【請求項23】

式中、Xは、S、O、若しくはNR²¹であるか；またはX-R²⁰は水素であり；

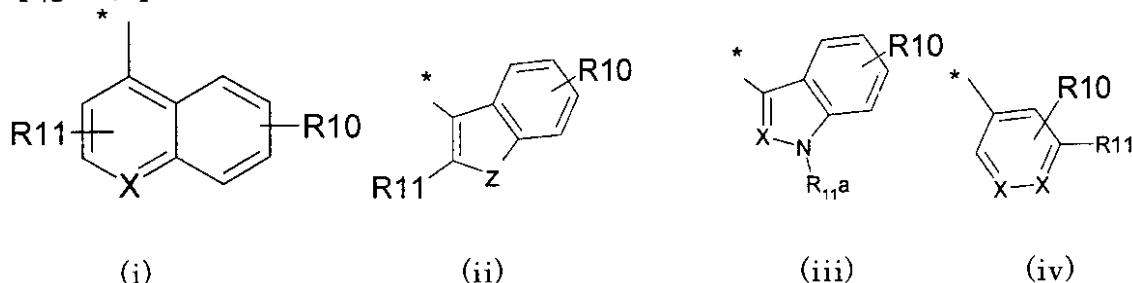
Wは、S、O、またはNR²¹であり；

R¹は、CH₃、CH₂CH₃、CH₂CN、CF₃、(CH₂)₂OH、シクロプロピル、イソプロピル、CH₂CCH、(CH₂)₂N(CH₂)₂、(CH₂)₂N(C=NH)NH₂、-CH₂-2-ピリジル、-CH₂-3-ピリジル、-CH₂-4-ピリジル、-(CH₂)₂-1-イミダゾリル、-(CH₂)₂-1-ピラゾリル、-(CH₂)₂-1-ピペリジル、-(CH₂)_m-(1-メチルピペリジン-4-イル)、-CH₂-(1-メチルピペリジン-3-イル)、-(CH₂)₂-(モルフォリン-4-イル)であり、

R²は、-CH₂CH₂CH₃、-CH₂-シクロプロピル、-CH₂CH(CH₃)₂、-CH₂CH₂CH₂F、-CH₂-シクロブチル、-CH₂C(CH₃)₃、-CH₂CH₂CH(CH₃)₂、-CH₂CF₃、-CH₂-メチルフェニル、-CH₂-フェノール、-CH₂-(3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル)、-CH₂-S-フェニル、-CH₂-フェニルカルボキシル、または-CH₂SCF₃であり；

R³は、以下の式(i)、(ii)、(iii)または(iv)：

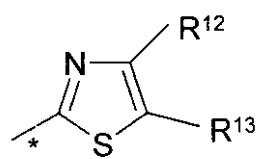
【化28】



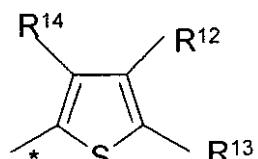
から選択され、ここで*は、(i)または(ii)または(iii)または(iv)が構造式(I)に結合している位置であり、及びXは、CまたはNであり；及びZは、OまたはSであり、ここでR¹⁰は、前記環の上の任意の位置にあり、R¹⁰及びR¹¹は、それぞれの場合で独立して、H、R^a、ハロゲン、-CN、ニトロ、OR^a、CF₃、-NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-OC(=O)C₁₋₄アルキル、-NR^aC(=O)C₁₋₄アルキルまたは-S(=O)_nR^cであり；ここでR^{11a}は、R^a、-S(=O)₂NR^aR^aまたは-S(=O)_nR^cであり、n=1または2であり、

R⁴は、以下の式(a)～(z)または(aa)若しくは(ab)：

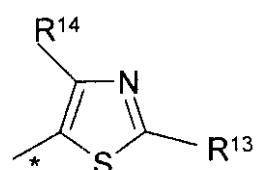
【化29】



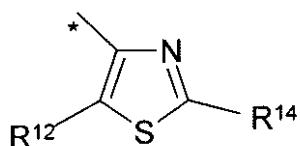
(a)



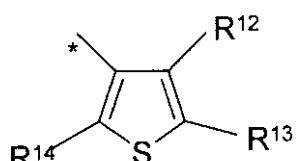
(b)



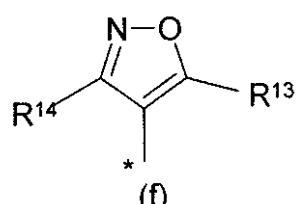
(c)



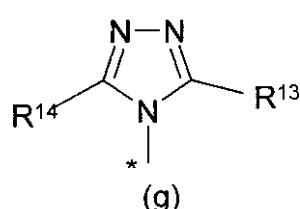
(d)



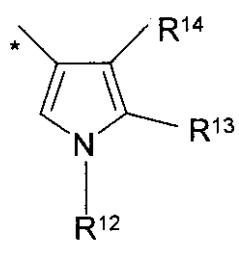
(e)



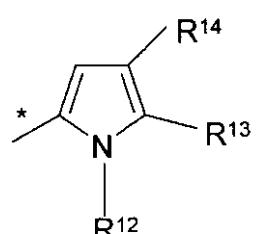
(f)



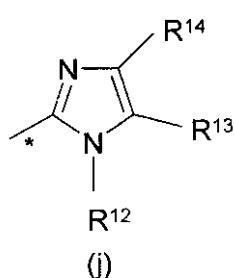
(g)



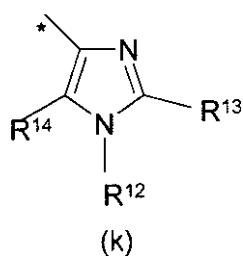
(h)



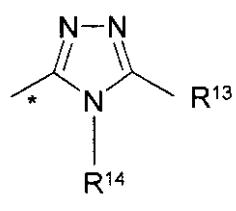
(i)



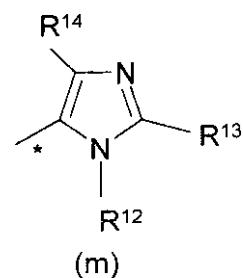
(j)



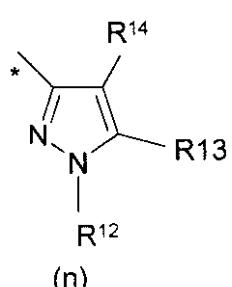
(k)



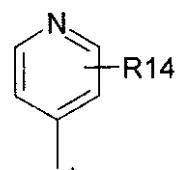
(l)



(m)

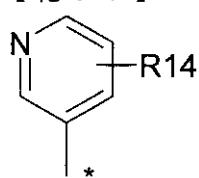


(n)

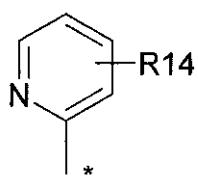


(o)

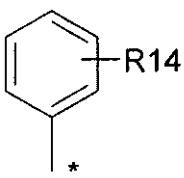
【化30】



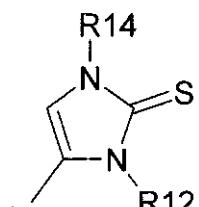
(p)



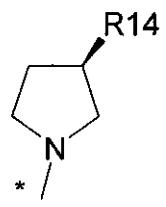
(q)



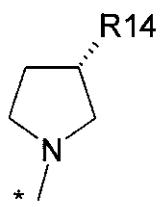
(r)



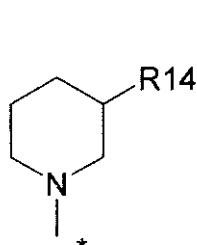
(s)



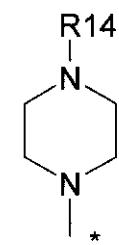
(t)



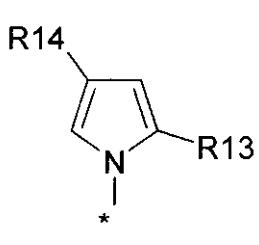
(u)



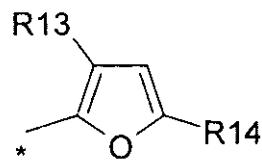
(v)



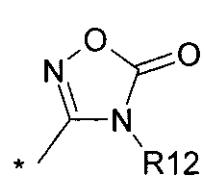
(w)



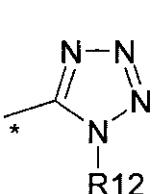
(x)



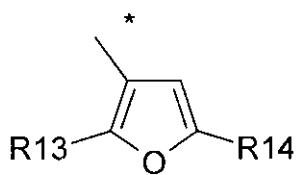
(y)



(z)



(aa)



(ab)

から選択され、ここで*は、R⁴が前記環に結合している位置であり、ここでR¹²、R¹³及びR¹⁴は、それぞれ独立して、H、Het、C₁₋₆アルキル、-CN、-NR^aR^a、-ニトロ、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)NR^aS(=O)₂R^a、-C(=O)NR^a-Het、-C(=O)NR^aNR^aR^a、-C(=O)NR^a(R^bNR^aR^a)、-C(=O)NR^a(R^bOR^a)、-C(=O)NR^a(R^bS(=O)₂R^a)、-C(=O)NR^aR^bHet、-C(=O)NR^aOR^a、-C(=O)R^bNR^aR^a、-C(=NOR^a)R^a、-C(=NCN)R^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)OR^bNR^aR^a、-C(=O)R^a、-OC(=O)R^a、-C(=O)R^a-SR^a、=S、-NR^aC(=O)R^a、-NR^aC(=O)OR^a、-NR^aS(=O)₂R^b、-C(=NOR^a)R^a、-S(=O)₂R^a、-S(=O)₂NR^aR^a、-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)NR^aR^a)、または-S(=O)₂NR^a(R^bC(=O)OR^a)。により表され、

R²⁰は、H、-CN、R^a、-OR^a、-NR^aR^a、-Het、-S(=O)_nR^c、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-NR^aC(=O)R^a、または-OC(=O)R^aであり；

R^{20} は、H、-CN、 R^a 、-OR^a、-NR^aR^a、-Het、-S(=O)_nR^c、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-NR^aC(=O)R^a または -OC(=O)R^a であり；

R^{20} 及び R^{21} と、これらが結合しているNは組み合わさって、N、O若しくはSから独立して選択される1または2個のヘテロ原子を有する3～10員のN-結合飽和または不飽和の複素環を形成することもでき、ここで前記複素環は R^e で置換されており；

R^e は、それぞれの場合で独立して、H、C_{1.6}アルキル、-C(=O)C_{1.4}アルキル、C_{1.4}ハロアルキル、フェニル、ベンジル、またはN、O若しくはSから独立して選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子を含有する、5若しくは6員環の飽和若しくは不飽和の複素環である、請求項20に記載の化合物。

【請求項24】

5-[2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-6-[(シクロプロピルメチル)アミノ]-4-(メチルアミノ)-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

N-{3-(4-アセチル-1-メチル-1H-ピロール-2-イル)-2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-4-メトキシ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イル}-2-シクロプロピルアセトアミドから選択される、式(IV)の化合物。

【請求項25】

薬剤として使用するための、請求項1～24のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項26】

ヘリコバクター・ピロリ(H.pylori)感染症に関する疾患の処置または予防の処置のための薬剤の製造における、請求項1～24のいずれか1項に記載の化合物の使用。

【請求項27】

ヘリコバクター・ピロリに関する感染症の処置の必要な宿主に、請求項1～24のいずれか1項に記載の化合物の治療的有効量を投与することを含む、ヘリコバクター・ピロリに関する感染症の処置方法。

【請求項28】

ヘリコバクター・ピロリに関する感染症の予防的処置の必要な宿主に、請求項1～24のいずれか1項に記載の化合物の治療的有効量を投与することを含む、ヘリコバクター・ピロリに関する感染症の予防的処置方法。

【請求項29】

請求項1～24のいずれか1項に記載の化合物または請求項1～24のいずれか1項に記載の医薬的に許容可能な塩の治療的有効量を投与することを含む、ヘリコバクター・ピロリ感染症の処置または予防法。

【請求項30】

少なくとも一種の医薬的に許容可能なキャリヤ、希釈剤または賦形剤と一緒に、請求項1～24のいずれか1項に記載の化合物を含む医薬組成物。