

【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 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 487/04 1 4 3

C 0 7 D 487/04 C S P

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 1/04

A 6 1 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

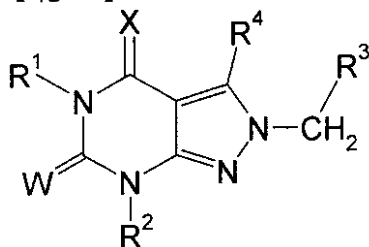
【補正の内容】

【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 NR^{20} であり、但し、WがOであるとき、XはO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 NR^{20} であり、但し、XがOであるとき、WはOではなく；

R^1 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

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；

R⁴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-OC₁₋₆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^a、-C(=O)R^bNR^aR^a、-C(=ONOR^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によって表されるか；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R⁴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^{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^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、 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、 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- OC 、 H_2CH_2O- 、ビニル- OC_{1-2} ハロアルキル $O-$ 、ビニル- OCH_2O- 、ビニル- 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；

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} 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る少なくとも1個の置換基を指す}。

【請求項2】

式中、 R^1 は、H、または C_{1-6} アルキル、または $-(CH_2)_n$ シクロアルキルまたは $-(CH_2)_{1-2}$ Hetであり、ここで C_{1-6} アルキルまたは $-(CH_2)_n$ シクロアルキルまたは $-(CH_2)_{1-2}$ Hetは、Het、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-OR^a$ 、 $-NR^aR^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-OC(=O)C_{1-4}$ アルキル、 $-S(=O)_nR^c$ 、 $-S(=O)_nNR^aR^a$ または $-NR^aC(=O)C_{1-4}$ 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。

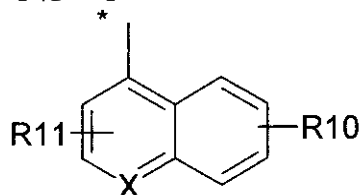
【請求項3】

式中、 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、 $S(=O)_nR^c$ 、 $-S(=O)_nNR^aR^a$ 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。

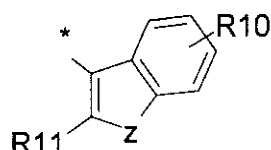
【請求項4】

式中、 R^3 は、以下に定義の式(i)、(ii)、(iii)または(iv)：

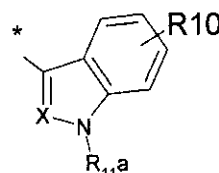
【化2】



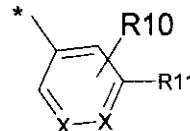
(i)



(ii)



(iii)



(iv)

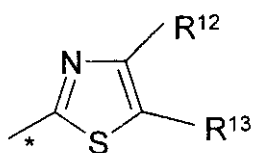
{ 式中、*は、(i)または(ii)または(iii)または(iv)が前記構造式(I)に結合している位置

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 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 、 CF_3 、 $-NR^aR^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-OC(=O)C_{1-4}$ 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。

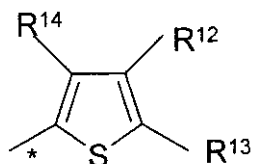
【請求項5】

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

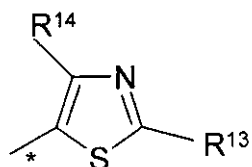
【化 3】



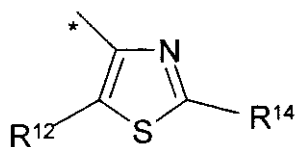
(a)



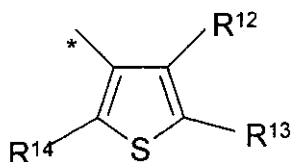
(b)



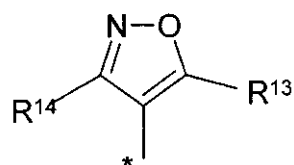
(c)



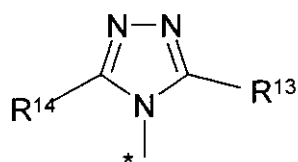
(d)



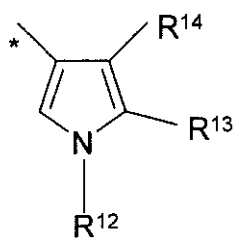
(e)



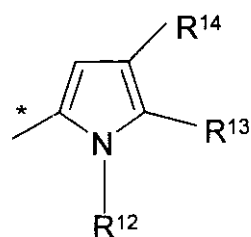
(f)



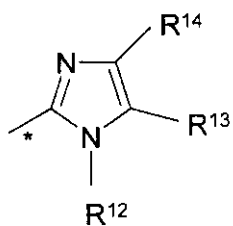
(g)



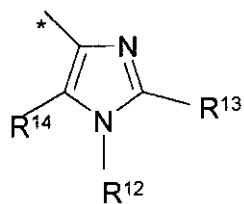
(h)



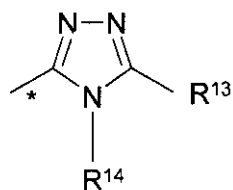
(i)



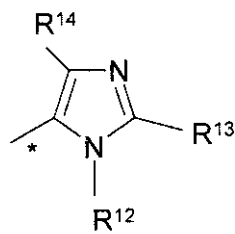
(j)



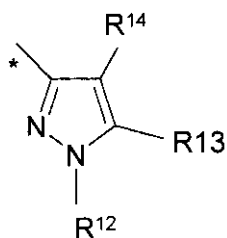
(k)



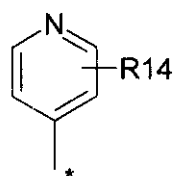
(l)



(m)

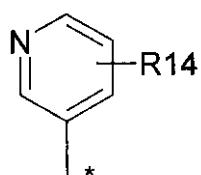


(n)

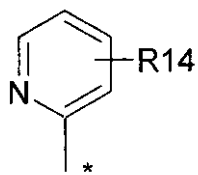


(o)

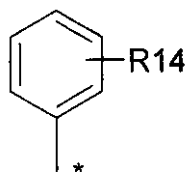
【化 4】



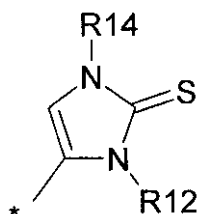
(p)



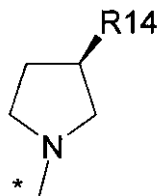
(q)



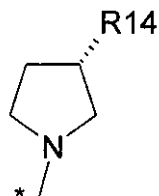
(r)



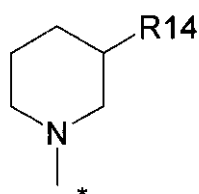
(s)



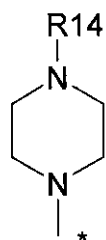
(t)



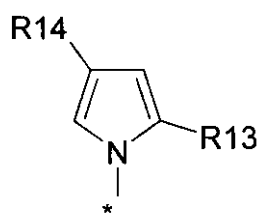
(u)



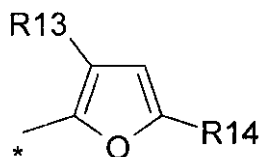
(v)



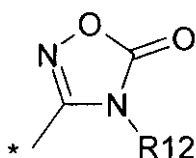
(w)



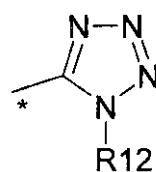
(x)



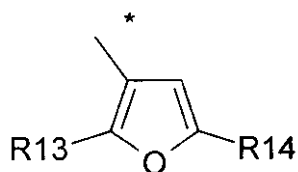
(y)



(z)



(aa)



(ab)

から選択され、式中、*は、 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、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{ニトロ}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{-Het}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{NR}^a\text{R}^a)$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{OR}^a)$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a)$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b\text{Het}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^b\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^a)\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{NCN})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^b\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a\text{-SR}^a$ 、 $=\text{S}$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^a)\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a(\text{R}^b\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a)$ 、または $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a(\text{R}^b\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a)$ 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 NR^{20} であり、但し、Wが0であるとき、XはO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 NR^{20} であり、但し、XがOであるとき、WはOではない；

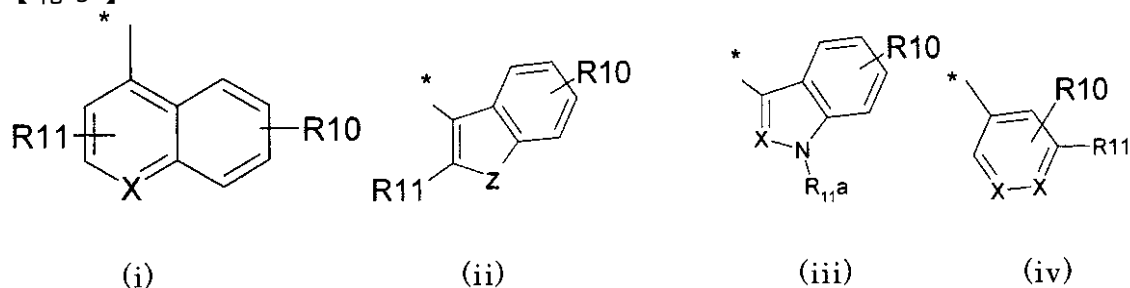
R^{20} はH、 $-\text{CN}$ 、 R^a 、 $-\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{Het}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^c$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、または $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^a$ であり；

R^1 は、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 CH_2CN 、 CF_3 、 $(\text{CH}_2)_2\text{OH}$ 、シクロプロピル、イソプロピル、 CH_2CCH 、 $(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{CH}_2)_2$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}=\text{NH})\text{NH}_2$ 、 $-\text{CH}_2-2\text{-ピリジル}$ 、 $-\text{CH}_2-3\text{-ピリジル}$ 、 $-\text{CH}_2-4\text{-ピリジル}$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-1\text{-イミダゾリル}$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-1\text{-ピラゾリル}$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-1\text{-ピペリジル}$ 、 $-(\text{CH}_2)_m-(1\text{-メチルピペリジン}-4\text{-イル})$ 、 $-\text{CH}_2-(1\text{-メチルピペリジン}-3\text{-イル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-(\text{モルフォリン}-4\text{-イル})$ であり；

R^2 は、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{-シクロプロピル}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CH}_2\text{-シクロブチル}$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{-メチルフェニル}$ 、 $-\text{CH}_2\text{-フェノール}$ 、 $-\text{CH}_2-(3,5\text{-ジメチルイソキサゾール}-4\text{-イル})$ 、 $-\text{CH}_2\text{-S-フェニル}$ 、 $-\text{CH}_2\text{-フェニルカルボキシル}$ 、または $-\text{CH}_2\text{SCF}_3$ であり；

R^3 は、以下に定義の式：(i)、(ii)、(iii)または(iv)：

【化5】

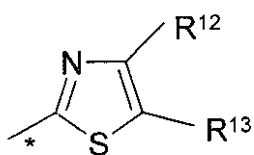


から選択され；

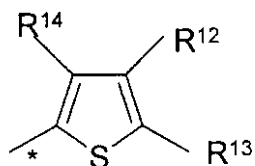
ここで、*は、(i)または(ii)または(iii)または(iv)が構造式(I)に結合している位置であり、XはCまたはNであり；及びZは、OまたはSであり、ここで R^{10} は、前記環の任意の位置にあり、 R^{10} 及び R^{11} はそれぞれの場合で独立して、H、 R^a 、ハロゲン、 $-\text{CN}$ 、ニトロ、 OR^a 、 CF_3 、 $-\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{C}_{1-4}\text{アルキル}$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}(=\text{O})\text{C}_{1-4}\text{アルキル}$ または $-\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^c$ であり；ここで R^{11a} は、 R^a 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^a$ または $-\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^c$ であり、 $n=1$ または2であり；

R^4 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；

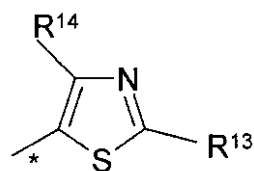
【化 6】



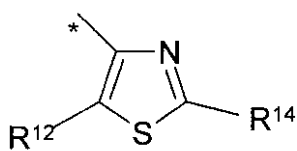
(a)



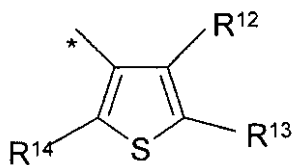
(b)



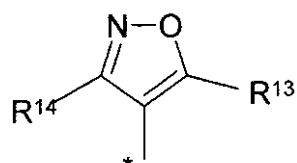
(c)



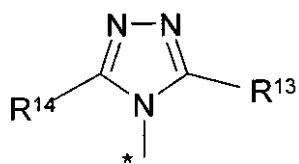
(d)



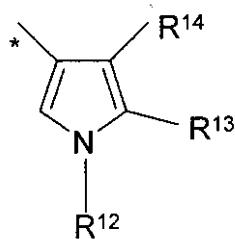
(e)



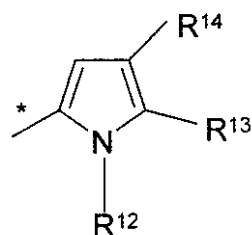
(f)



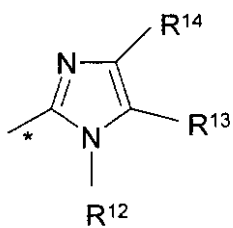
(g)



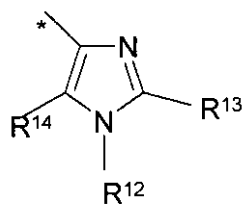
(h)



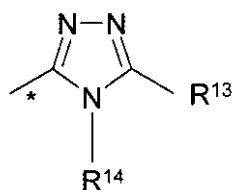
(i)



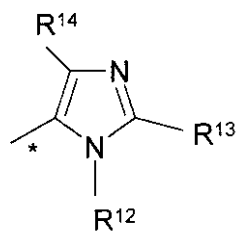
(j)



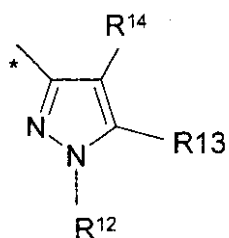
(k)



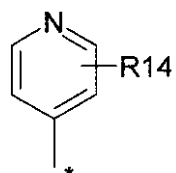
(l)



(m)

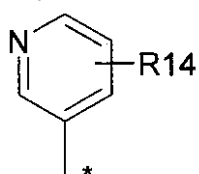


(n)

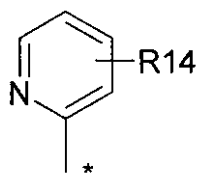


(o)

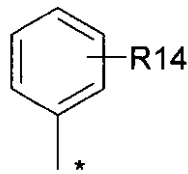
【化 7】



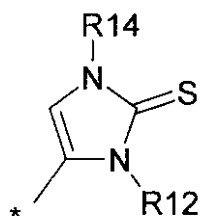
(p)



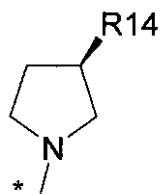
(q)



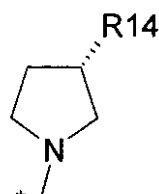
(r)



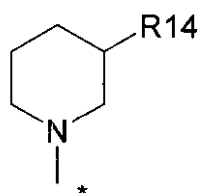
(s)



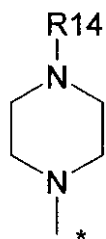
(t)



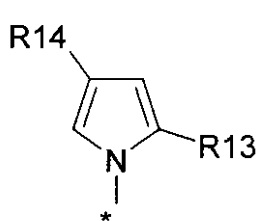
(u)



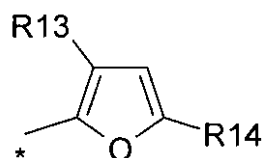
(v)



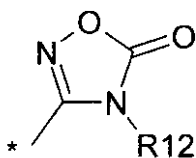
(w)



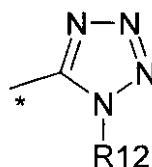
(x)



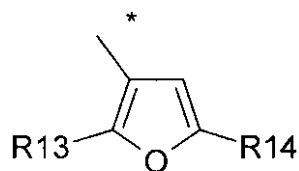
(y)



(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、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=O)NR^aS(=O)_2R^a$ 、 $-C(=O)NR^a-Het$ 、 $-C(=O)NR^aNR^aR^a$ 、 $-C(=O)NR^a(R^bNR^aR^a)$ 、 $-C(=O)NR^a(R^bOR^a)$ 、 $-C(=O)NR^a(R^bS(=O)_2R^a)$ 、 $-C(=O)NR^aR^bHet$ 、 $-C(=O)NR^aOR^a$ 、 $-C(=O)R^bNR^aR^a$ 、 $-C(=NOR^a)R^a$ 、 $-C(=NCN)R^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)OR^bNR^aR^a$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-OC(=O)R^a$ 、 $-C(=O)R^a-SR^a$ 、 $=S$ 、 $-NR^aC(=O)R^a$ 、 $-NR^aC(=O)OR^a$ 、 $-NR^aS(=O)_2R^b$ 、 $-C(=NOR^a)R^a$ 、 $-S(=O)_2R^a$ 、 $-S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-S(=O)_2NR^a(R^bC(=O)NR^aR^a)$ 、または $-S(=O)_2NR^a(R^bC(=O)OR^a)$ 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-[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]-N 2、N 2-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-[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-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-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；

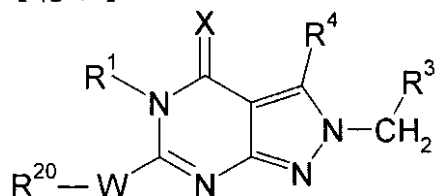
2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-5-メチル-3-(1-メチル-1H-イミダゾール-5-イル)-4-チオキソ-2,4,5,7-テトラヒドロ-6H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-オン；

(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 NR^{20} 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 NR^{21} であり；

R^1 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、 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、 $\text{NH}(\text{C}_{1-4}$ アルキル)、 $\text{N}(\text{C}_{1-4}$ アルキル) $_2$ 、 C_{1-4} アルカノイルアミノ、 $(\text{C}_{1-4}$ アルカノイル) $_2$ アミノ、 $\text{N}-(\text{C}_{1-4}$ アルキル)カルバモイル、 $\text{N},\text{N}-(\text{C}_{1-4}$ アルキル) $_2$ カルバモイル、 $(\text{C}_{1-4})\text{S}$ 、 $(\text{C}_{1-4}$ アルキル) $\text{S}(\text{O})$ 、 $(\text{C}_{1-4}$ アルキル) $\text{S}(\text{O})_2$ 、 (C_{1-4}) アルコキシカルボニル、 $\text{N}-(\text{C}_{1-4}$ アルキル)スルファモイル、 $\text{N},\text{N}-(\text{C}_{1-4}$ 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^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、 $=\text{O}$ 、ハロゲン、 $-\text{OR}^a$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 $-\text{CN}$ 、ニトロ、 $-\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^c$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{Het}$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{Het}$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{OR}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{Het}$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{Het}$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{NHC}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $\text{N}=\text{NR}^a$ 、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、 $-\text{Het}$ 、 $-\text{Het}-\text{Het}$ 、 R^5 、 $-\text{R}^5-\text{Het}$ 、 $-\text{Het}-\text{R}^5$ 、 $-\text{Het}-\text{O}-\text{R}^5$ 、 $-\text{R}^5-\text{R}^5$ 、 $-\text{R}^5-\text{OR}^5$ 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-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、 $\text{B}(\text{OH})_2$ 、ビシナル- $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、ビシナル- OC_{1-2} ハロアルキル $\text{O}-$ 、ビシナル- $\text{OCH}_2\text{O}-$ 、ビシナル- $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $=\text{O}$ 、ハロゲン、 $-\text{R}^b\text{OR}^a$ 、 $-\text{SR}^a$ 、 $-\text{OR}^a$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^c$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{Het}$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{Het}$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{OR}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{Het}$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{Het}$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{NHC}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{NHC}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $\text{N}=\text{NR}^a$ 、 NO_2 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{NR}^a\text{R}^a)$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{OR}^a)$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^a)$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{Het})$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^b\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^b\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a(\text{R}^b\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a)$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a(\text{R}^b\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a)$ 、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 R^4 は、 $-(\text{CH}_2)_n\text{R}^5-\text{Het}$ 、 $-(\text{CH}_2)_n\text{R}^d$ 、 $-\text{Het}$ 、 $-\text{Het}-\text{Het}$ 、 R^5 、 $-\text{R}^5-\text{Het}$ 、 $-\text{Het}-\text{R}^5$ 、 $-\text{Het}-\text{OR}^5$ 、 R^5-R^5 、若しくは $-\text{R}^5-\text{OR}^5$ により表されるか；または R^4 は、 C_{1-6} アルキル、 $-\text{NC}_{1-6}$ アルキル、若しくは $-\text{N}(\text{C}_{1-6}$ アルキル) $_2$ により表され、ここで前記 C_{1-6} アルキル、 $-\text{NC}_{1-6}$ アルキル、 $-\text{N}(\text{C}_{1-6}$ 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、 $-OR^a$ 、 $-S(=O)_nR^c$ 、 $-O(CH_2)_mHet$ 、 $-O(CH_2)_mC(=O)Het$ 、 $-O(CH_2)_mC(=O)NR^aR^a$ 、 $-O(CH_2)_mC(=O)OR^a$ 、 $-O(CH_2)_mNR^aR^a$ 、 $-O(CH_2)_mOR^a$ 、 $-S(CH_2)_mHet$ 、 $-S(CH_2)_mC(=O)Het$ 、 $-S(CH_2)_mC(=O)NR^aR^a$ 、 $-S(CH_2)_mC(=O)OR^a$ 、 $-S(CH_2)_mNR^aR^a$ 、 $-S(CH_2)_mOR^a$ 、 $-R^bOR^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=O)NR^aOR^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^bNR^aR^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^bOR^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^bS(=O)_nR^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^bHet$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-OC(=O)R^a$ 、 $-C(=O)OR^bNR^aR^a$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)R^bNR^aR^a$ 、 $-C(=NOR^a)R^a$ 、 $-C(=NCN)R^a$ 、 $-S(=O)_2NR^aR^a$ 、 $-NR^aS(=O)_2R^a$ 、 $-S(=O)_2NR^aR^bC(=O)NR^aR^a$ 、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^{20} 及び R^{21} と、これらが結合している N は組み合わせさせて、 N 、0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 、0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 、0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、 $-OH$ 、 $-OR^c$ 、 $-NR^a R^a$ 、 $-S(=O)_n R^c$ 、 $-C(=O)NR^a R^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-NR^a C(=O)R^a$ 、 $-OC(=O)R^a$ 、 $B(OH)_2$ 、ビニル- OC 、 H_2CH_2O- 、ビニル- OC_{1-2} ハロアルキル $O-$ 、ビニル- OCH_2O- 、ビニル- 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、 $-C(=O)C_{1-4}$ 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}。

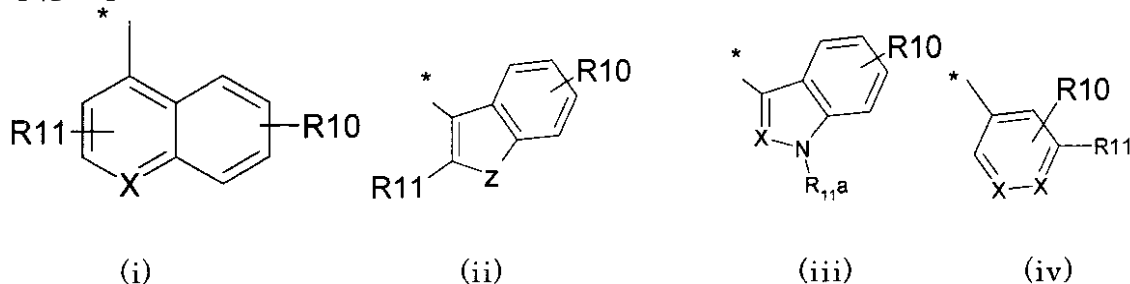
【請求項9】

式中、 R^1 は H 、または C_{1-6} アルキル、若しくは $-(CH_2)_n$ シクロアルキルであり、ここで C_{1-6} アルキルまたは $-(CH_2)_n$ シクロアルキルは、 Het 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-OR^a$ 、 $-NR^a R^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)NR^a R^a$ 、 $-OC(=O)C_{1-4}$ アルキルまたは $-NR^a C(=O)C_{1-4}$ 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】

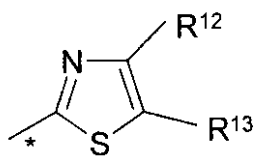


から選択され、式中、*は、(i)または(ii)または(iii)または(iv)が構造式(I)に結合している位置であり、 X は C または N であり；及び Z は O または S であり、ここで R^{10} は、前記環の任意の位置にあり、 R^{10} 及び R^{11} は、それぞれの場合で独立して、 H 、 R^a 、ハロゲン、 $-CN$ 、ニトロ、 OR^a 、 CF_3 、 $-NR^a R^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)NR^a R^a$ 、 $-OC(=O)C_{1-4}$ アルキル、 $-NR^a C(=O)C_{1-4}$ アルキルまたは $-S(=O)_n R^c$ であり；ここで R^{11a} は、 R^a 、 $-S(=O)_2 NR^a R^a$ または $-S(=O)_n R^c$ であり、 $n = 1$ または2である、請求項8に記載の化合物。

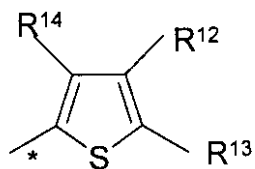
【請求項11】

式中、 R^4 は、以下の式(a)～(z)または(aa)若しくは(ab)：

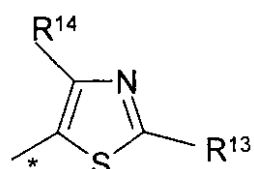
【化 1 0】



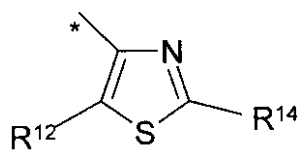
(a)



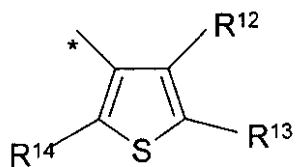
(b)



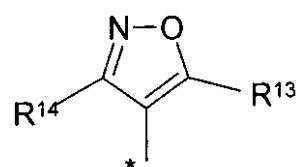
(c)



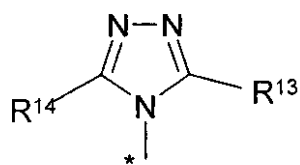
(d)



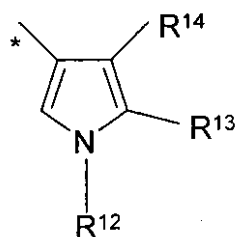
(e)



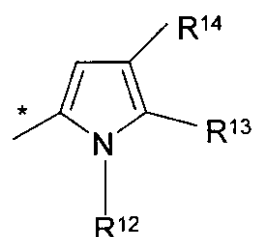
(f)



(g)

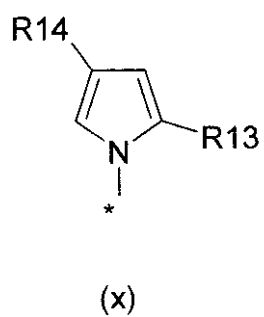
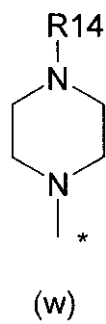
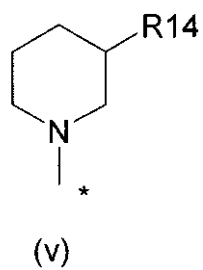
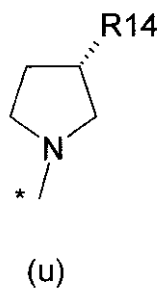
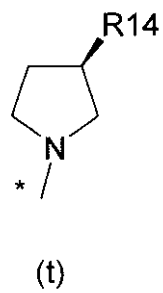
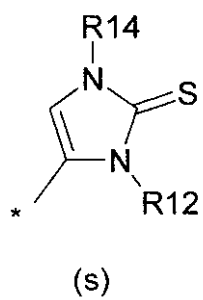
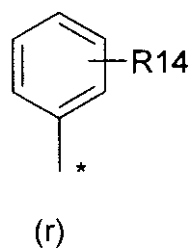
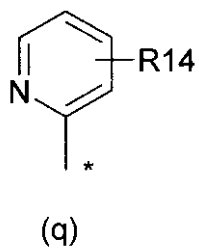
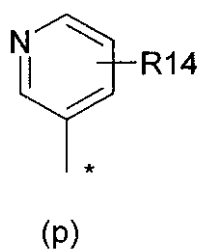
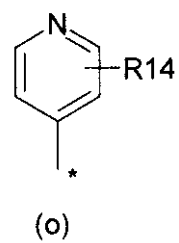
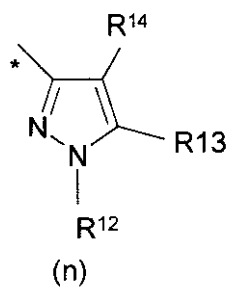
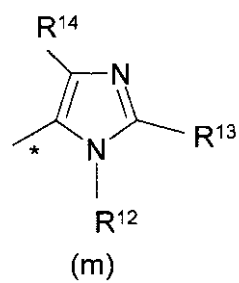
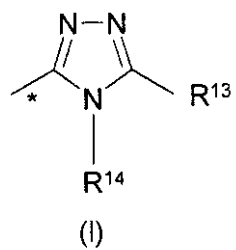
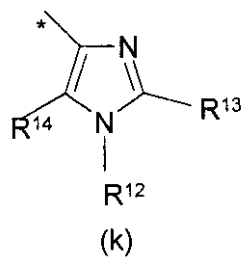
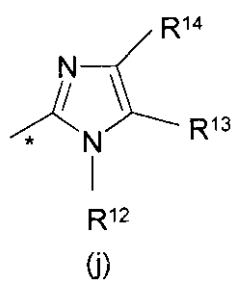


(h)

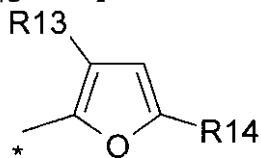


(i)

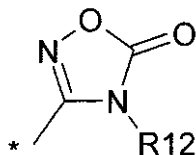
【化 1 1】



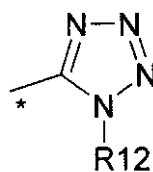
【化 1 2】



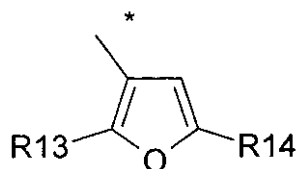
(y)



(z)



(aa)



(ab)

から選択され、式中、*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)NR^aR^b、-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(=O)NR^aR^b、-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 1 2】

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；

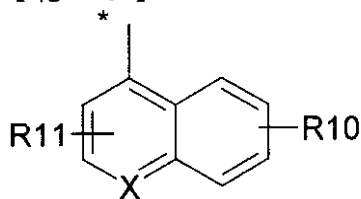
R²⁰は、H、-CN、R^a、-OR^a、-NR^aR^a、-Het、-S(=O)_nR^c、-C(=O)R^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=O)OR^a、-NR^aC(=O)R^a、または-OC(=O)R^aであり；

R²⁰及びR²¹と、これらが結合しているNは組み合わせさせて、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；

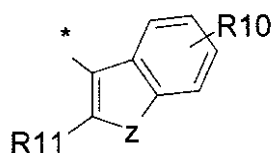
R¹は、CH₃、CH₂CH₃、CH₂CN、CF₃、(CH₂)₂OH、シクロプロピル、イソプロピル、CH₂CCH₃、(CH₂)₂N(CH₂)₂、(CH₂)₂N(C=NH)NH₂、-CH₂-2-ピリジル、-CH₂-3-ピリジル、-CH₂-4-ピリジル、-(CH₂)₂-1-イミダゾリル、-(CH₂)₂-1-ピラゾリル、-(CH₂)₂-1-ピペリジル、-(CH₂)_m-(1-メチルピペリジン-4-イル)、-CH₂-(1-メチルピペリジン-3-イル)、-(CH₂)₂-(モルフォリン-4-イル)であり；

R³は、以下の式(i)、(ii)、(iii)または(iv)：

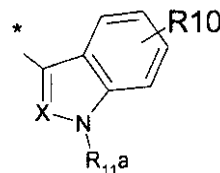
【化 1 3】



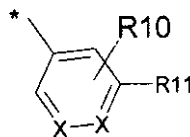
(i)



(ii)



(iii)

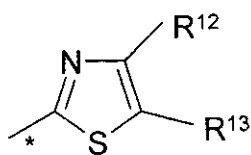


(iv)

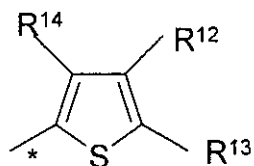
から選択され、ここで*は、(i)または(ii)または(iii)または(iv)が構造式(I)に結合している位置であり、Xは、CまたはNであり；及びZはOまたはSであり、ここで R^{10} は、前記環の任意の位置にあり、 R^{10} 及び R^{11} はそれぞれの場合で独立して、H、 R^a 、ハロゲン、-CN、ニトロ、 OR^a 、 CF_3 、 $-NR^aR^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-OC(=O)C_{1-4}$ アルキル、 $-NR^aC(=O)C_{1-4}$ アルキルまたは $-S(=O)_nR^c$ 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；

R^4 は、以下の式(a)~(z)または(aa)若しくは(ab)：

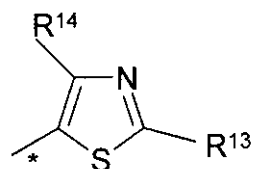
【化 1 4】



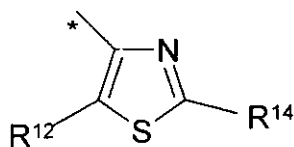
(a)



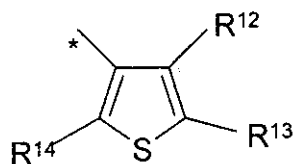
(b)



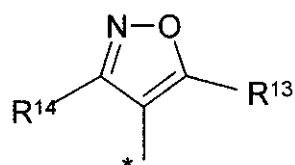
(c)



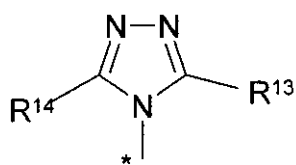
(d)



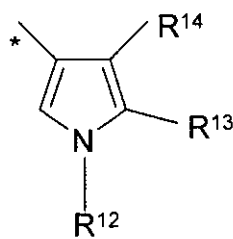
(e)



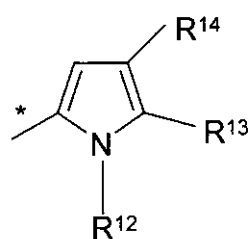
(f)



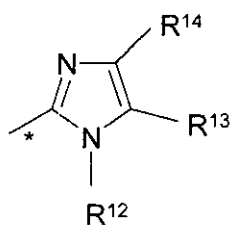
(g)



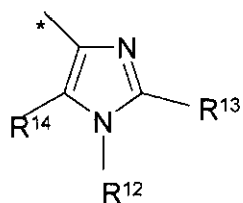
(h)



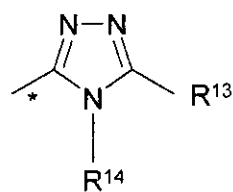
(i)



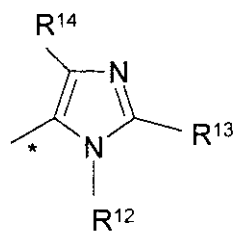
(j)



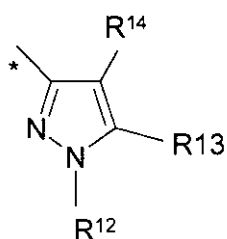
(k)



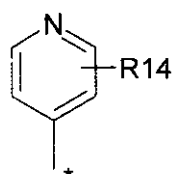
(l)



(m)

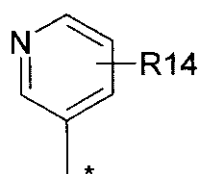


(n)

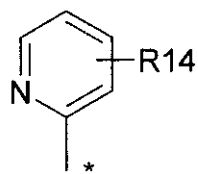


(o)

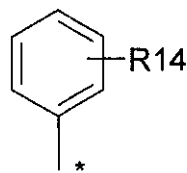
【化 1 5】



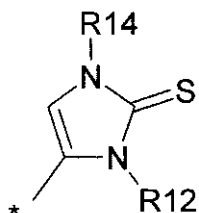
(p)



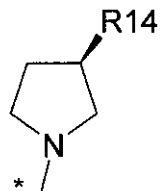
(q)



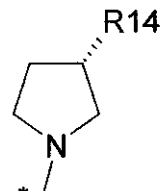
(r)



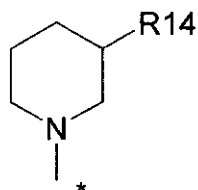
(s)



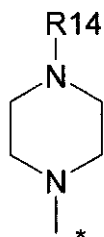
(t)



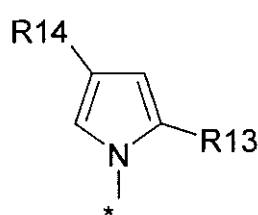
(u)



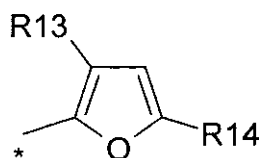
(v)



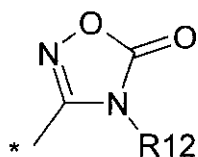
(w)



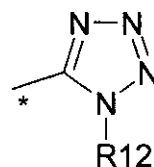
(x)



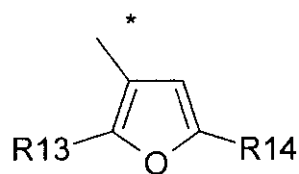
(y)



(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、 C_{1-6} アルキル、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{ニトロ}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{-Het}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{NR}^a\text{R}^a)$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{OR}^a)$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a)$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b\text{Het}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^b\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^a)\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{NCN})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^b\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a\text{-SR}^a$ 、 $=\text{S}$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^a)\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a(\text{R}^b\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a)$ 、または $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a(\text{R}^b\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a)$ により表される、請求項8に記載の化合物。

【請求項 1 3】

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；

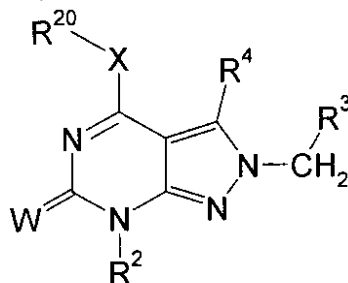
5-[(4Z)-2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-6-[(シクロプロピルメチル)アミノ]-5-メチル-4-(メチルイミノ)-4,5-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

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、 $-OR^a$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 $-CN$ 、ニトロ、 $-S(=O)_n R^c$ 、 $-O(CH_2)_m Het$ 、 $-O(CH_2)_m C(=O)Het$ 、 $-O(CH_2)_m C(=O)NR^a R^a$ 、 $-O(CH_2)_m C(=O)OR^a$ 、 $-O(CH_2)_m NR^a R^a$ 、 $-O(CH_2)_m OR^a$ 、 $-S(CH_2)_m Het$ 、 $-S(CH_2)_m C(=O)Het$ 、 $-S(CH_2)_m C(=O)NR^a R^a$ 、 $-S(CH_2)_m C(=O)OR^a$ 、 $-S(CH_2)_m NR^a R^a$ 、 $-S(CH_2)_m OR^a$ 、 $-NR^a R^a$ 、 $-NHC(=O)R^a$ 、 $N=NR^a$ 、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、 $-Het$ 、 $-Het-Het$ 、 R^5 、 $-R^5-Het$ 、 $-Het-R^5$ 、 $-Het-O-R^5$ 、 $-R^5-R^5$ 、 $-R^5-OR^5$ 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- OCH_2CH_2O- 、ビシナル- OC_{1-2} ハロアルキル $O-$ 、ビシナル- OCH_2O- 、ビシナル- CH_2OCH_2O- 、 $=O$ 、ハロゲン、 $-R^b OR^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-OR^a$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 $-CN$ 、 $-S(=O)_n R^c$ 、 $-O(CH_2)_m Het$ 、 $-O(CH_2)_m C(=O)Het$ 、 $-O(CH_2)_m C(=O)NR^a R^a$ 、 $-O(CH_2)_m C(=O)OR^a$ 、 $-O(CH_2)_m NR^a R^a$ 、 $-O(CH_2)_m OR^a$ 、 $-S(CH_2)_m Het$ 、 $-S(CH_2)_m C(=O)Het$ 、 $-S(CH_2)_m C(=O)NR^a R^a$ 、 $-S(CH_2)_m C(=O)OR^a$ 、 $-S(CH_2)_m NR^a R^a$ 、 $-S(CH_2)_m OR^a$ 、 $-NR^a R^a$ 、 $-NHC(=O)R^a$ 、 $-NHC(=O)OR^a$ 、 $N=NR^a$ 、 NO_2 、 $-C(=O)NR^a R^a$ 、 $-C(=O)NR^a OR^a$ 、 $-C(=O)NR^a (R^b NR^a R^a)$ 、 $-C(=O)NR^a (R^b OR^a)$ 、 $-C(=O)NR^a (R^b S(=O)_n R^a)$ 、 $-C(=O)NR^a (R^b Het)$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-OC(=O)R^a$ 、 $-C(=O)OR^b NR^a R^a$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)R^b NR^a R^a$ 、 $-C(=ONOR^a)R^a$ 、 $-C(=NCN)R^a$ 、 $-S(=O)_2 NR^a R^a$ 、 $-NR^a S(=O)_2 R^a$ 、 $-S(=O)_2 NR^a (R^b C(=O)NR^a R^a)$ 、 $-S(=O)_2 NR^a (R^b C(=O)OR^a)$ 、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、 $-(CH_2)_n R^5-Het$ 、 $-(CH_2)_n R^d$ 、 $-Het$ 、 $-Het-Het$ 、 R^5 、 $-R^5-Het$ 、 $-Het-R^5$ 、 $-Het-OR^5$ 、 R^5-R^5 、若しくは $-R^5-OR^5$ により表されるか；または R^4 は、 C_{1-6} アルキル、 $-NC_{1-6}$ アルキル、若しくは $-N(C_{1-6}アルキル)_2$ により表され、ここで前記 C_{1-6} アルキル、 $-NC_{1-6}$ アルキル、 $-N(C_{1-6}アルキル)_2$ 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、 $-(CH_2)_z CH_3$ 、 $-(CH_2)_z CH_2 OH$ 、 $-(CH_2)_z CO_2 H$ でも、 $-(CH_2)_z CO_2 C_{1-6}アルキル$ 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、 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、 $-OR^a$ 、 $-S(=O)_n R^c$ 、 $-O(CH_2)_m Het$ 、 $-O(CH_2)_m C(=O)Het$ 、 $-O(CH_2)_m C(=O)NR^a R^a$ 、 $-O(CH_2)_m C(=O)OR^a$ 、 $-O(CH_2)_m NR^a R^a$ 、 $-O(CH_2)_m OR^a$ 、 $-S(CH_2)_m Het$ 、 $-S(CH_2)_m C(=O)Het$ 、 $-S(CH_2)_m C(=O)NR^a R^a$ 、 $-S(CH_2)_m C(=O)OR^a$ 、 $-S(CH_2)_m NR^a R^a$ 、 $-S(CH_2)_m OR^a$ 、 $-R^b OR^a$ 、 $-SR^a$ 、 $-C(=O)NR^a R^a$ 、 $-C(=O)NR^a OR^a$ 、 $-C(=O)NR^a R^b NR^a R^a$ 、 $-C(=O)NR^a R^b OR^a$ 、 $-C(=O)NR^a R^b S(=O)_n R^a$ 、 $-C(=O)NR^a R^b Het$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-OC(=O)R^a$ 、 $-C(=O)OR^b NR^a R^a$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)R^b NR^a R^a$ 、 $-C(=ONOR^a)R^a$ 、 $-C(=NCN)R^a$ 、 $-S(=O)_2 NR^a R^a$ 、 $-NR^a S(=O)_2 R^a$ 、 $-S(=O)_2 NR^a R^b C(=O)NR^a R^a$ 、または $-S(=O)_2 NR^a R^b C(=O)OR^a$ 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、 $-S(=O)_n R^c$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)NR^a R^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-NR^a C(=O)R^a$ 、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^{2^0} 及び R^{2^1} と、これらが結合しているNは組み合わせあって、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_2H_4O -、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}。

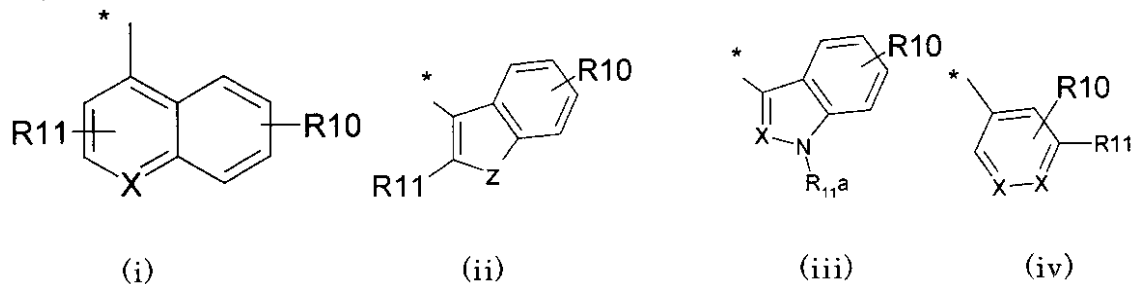
【請求項15】

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】

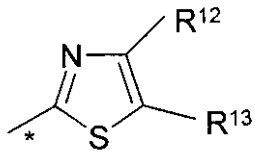


から選択され、ここで*は、(i)または(ii)または(iii)または(iv)が構造式(I)に結合している位置であり、Xは、CまたはNであり；及びZはOまたはSであり、ここで R^{10} は、前記環の任意の位置にあり、 R^{10} 及び R^{11} は、それぞれの場合で独立して、H、 R^a 、ハロゲン、 $-\text{CN}$ 、ニトロ、 OR^a 、 CF_3 、 $-\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{C}_{1-4}$ アルキル、 $-\text{NR}^a\text{C}(=\text{O})\text{C}_{1-4}$ アルキルまたは $-\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^c$ であり；ここで R^{11a} は R^a 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^a$ または $-\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^c$ であり、 $n = 1$ または2である、請求項14に記載の化合物。

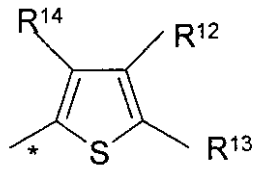
【請求項 1 7】

式中、 R^4 は、以下の式(a)~(z)または(aa)若しくは(ab)：

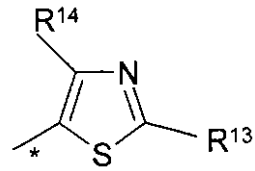
【化 1 8】



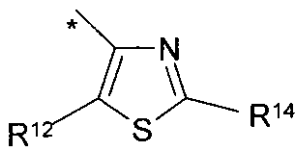
(a)



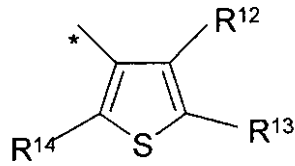
(b)



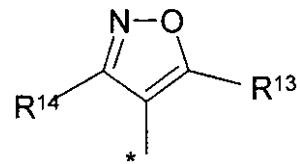
(c)



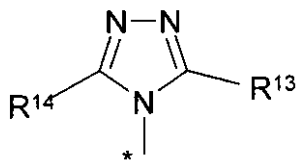
(d)



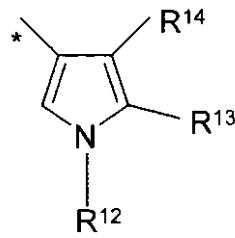
(e)



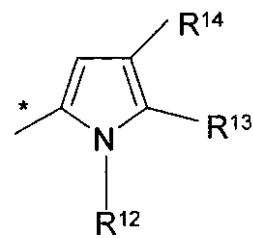
(f)



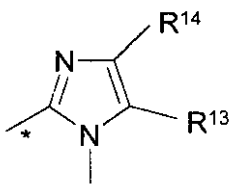
(g)



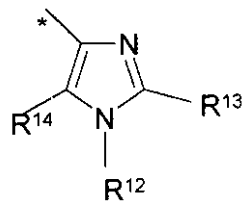
(h)



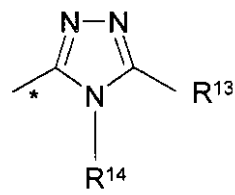
(i)



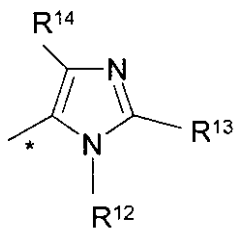
(j)



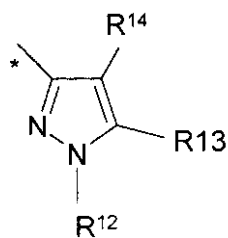
(k)



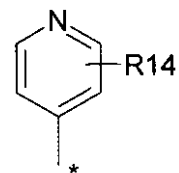
(l)



(m)

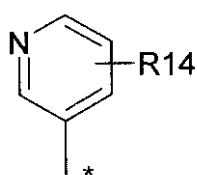


(n)

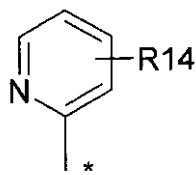


(o)

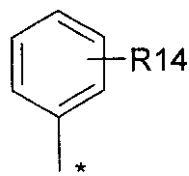
【化 19】



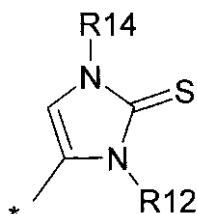
(p)



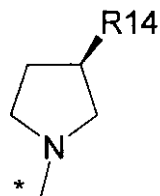
(q)



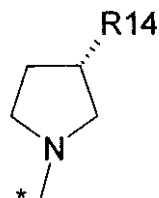
(r)



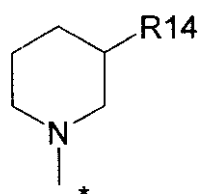
(s)



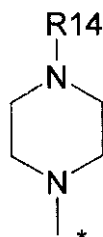
(t)



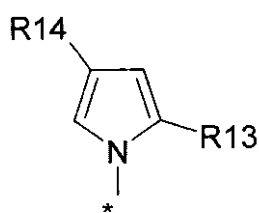
(u)



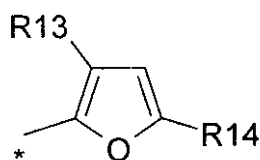
(v)



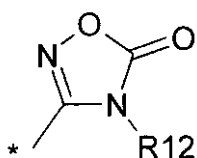
(w)



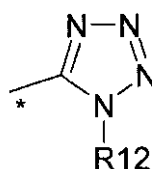
(x)



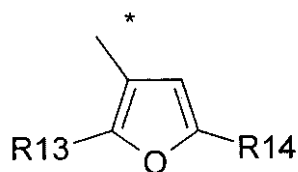
(y)



(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、 C_{1-6} アルキル、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{ニトロ}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{-Het}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{NR}^a\text{R}^a)$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{OR}^a)$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a)$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b\text{Het}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^b\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^a)\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{NCN})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^b\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a\text{-SR}^a$ 、 $=\text{S}$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^a)\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a(\text{R}^b\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a)$ 、または $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a(\text{R}^b\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a)$ 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 NR^{21} であるか；または XR^{20} は水素であり、

Wは、S、O、または NR^{20} であり；

R^{20} は、H、-CN、 R^a 、 $-\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{R}^a$ 、-Het、 $-\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^c$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、または $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^a$ であり；

R^{20} は、H、-CN、 R^a 、 $-\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{R}^a$ 、-Het、 $-\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^c$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、または $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^a$ であり；

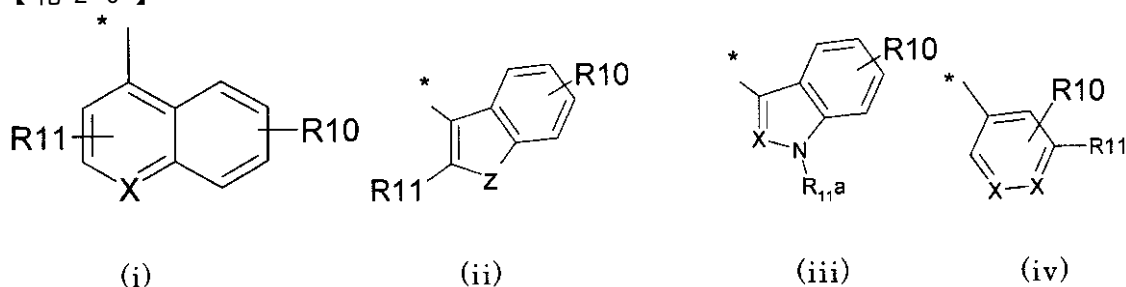
R^{20} 及び R^{21} と、これらが結合しているNは組み合わさって、N、OまたはSから独立して選択される1または2個のヘテロ原子を有する3～10員のN-結合飽和または不飽和の複素環を形成することもでき、ここで前記複素環は R^e で置換されており；

R^1 は、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 CH_2CN 、 CF_3 、 $(\text{CH}_2)_2\text{OH}$ 、シクロプロピル、イソプロピル、 CH_2CCH 、 $(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{CH}_2)_2$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}=\text{NH})\text{NH}_2$ 、 $-\text{CH}_2-2\text{-ピリジル}$ 、 $-\text{CH}_2-3\text{-ピリジル}$ 、 $-\text{CH}_2-4\text{-ピリジル}$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-1\text{-イミダゾリル}$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-1\text{-ピラゾリル}$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-1\text{-ピペリジル}$ 、 $-(\text{CH}_2)_m-(1\text{-メチルピペリジン-4-イル})$ 、 $-\text{CH}_2-(1\text{-メチルピペリジン-3-イル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-(\text{モルフォリン-4-イル})$ であり、

R^2 は、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{-シクロプロピル}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CH}_2\text{-シクロブチル}$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{-メチルフェニル}$ 、 $-\text{CH}_2\text{-フェノール}$ 、 $-\text{CH}_2-(3,5\text{-ジメチルイソキサゾール-4-イル})$ 、 $-\text{CH}_2\text{-S-フェニル}$ 、 $-\text{CH}_2\text{-フェニルカルボキシル}$ 、または $-\text{CH}_2\text{SCF}_3$ であり；

R^3 は、以下の式(i)、(ii)、(iii)または(iv)：

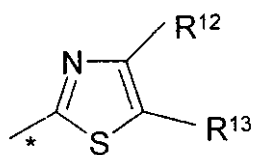
【化20】



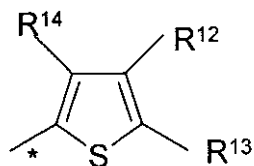
から選択され、ここで*は、(i)または(ii)または(iii)または(iv)が構造式(1)に結合している位置であり、Xは、CまたはNであり；及びZは、OまたはSであり、ここで R^{10} は、前記環の上の任意の位置にあり、 R^{10} 及び R^{11} はそれぞれの場合で独立して、H、 R^a 、ハロゲン、-CN、ニトロ、 OR^a 、 CF_3 、 $-\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{C}_{1-4}$ アルキル、 $-\text{NR}^a\text{C}(=\text{O})\text{C}_{1-4}$ アルキルまたは $-\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^c$ であり；ここで R^{11a} は、 R^a 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^a$ または $-\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^c$ であり、 $n = 1$ または2であり、

R^4 は、以下の式(a)～(z)または(aa)若しくは(ab)：

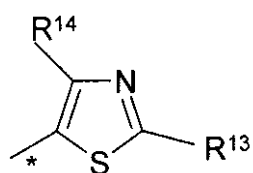
【化 2 1】



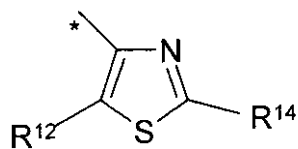
(a)



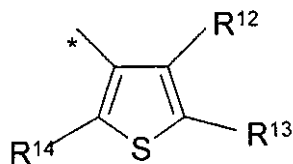
(b)



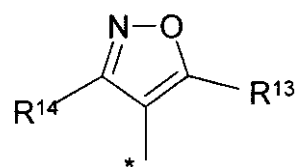
(c)



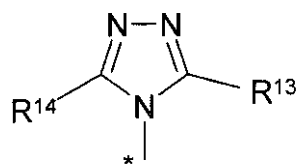
(d)



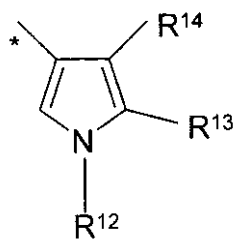
(e)



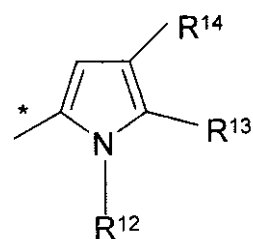
(f)



(g)

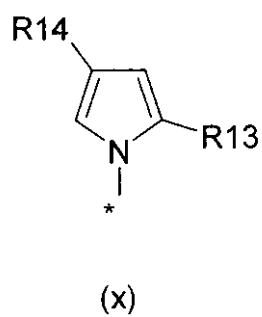
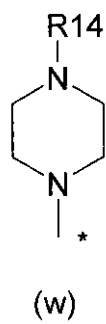
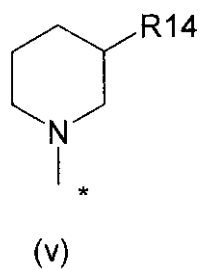
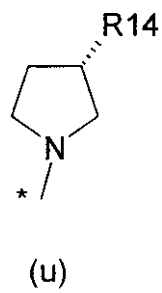
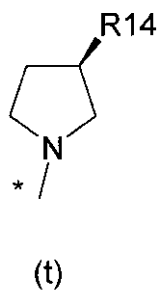
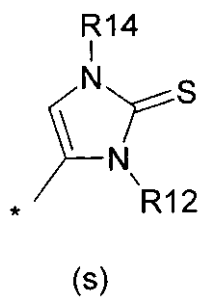
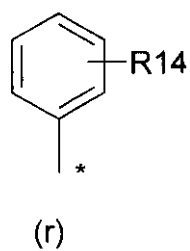
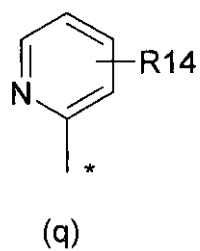
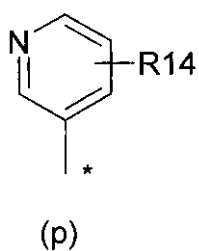
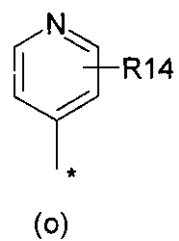
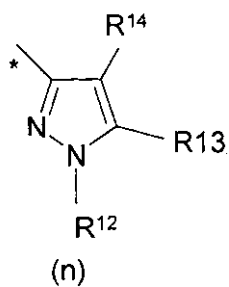
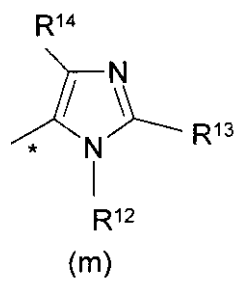
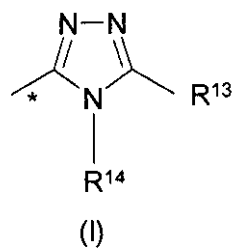
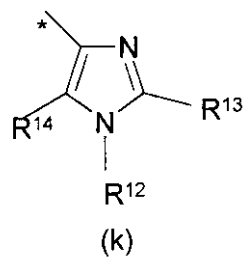
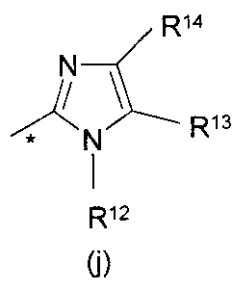


(h)

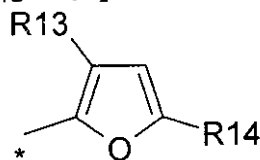


(i)

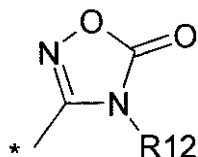
【化 2 2】



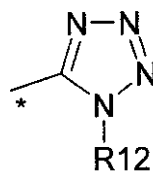
【化 2 3】



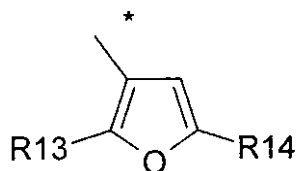
(y)



(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、 C_{1-6} アルキル、-CN、 $-NR^a R^a$ 、-ニトロ、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)NR^a R^a$ 、 $-C(=O)NR^a S(=O)_2 R^a$ 、 $-C(=O)NR^a$ -Het、 $-C(=O)NR^a NR^a R^a$ 、 $-C(=O)NR^a (R^b NR^a R^a)$ 、 $-C(=O)NR^a (R^b OR^a)$ 、 $-C(=O)NR^a (R^b S(=O)_2 R^a)$ 、 $-C(=O)NR^a R^b$ Het、 $-C(=O)NR^a OR^a$ 、 $-C(=O)R^b NR^a R^a$ 、 $-C(=NOR^a)R^a$ 、 $-C(=NCN)R^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)OR^b NR^a R^a$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-OC(=O)R^a$ 、 $-C(=O)R^a-SR^a$ 、=S、 $-NR^a C(=O)R^a$ 、 $-NR^a C(=O)OR^a$ 、 $-NR^a S(=O)_2 R^b$ 、 $-C(=NOR^a)R^a$ 、 $-S(=O)_2 R^a$ 、 $-S(=O)_2 NR^a R^a$ 、 $-S(=O)_2 NR^a (R^b C(=O)NR^a R^a)$ 、または $-S(=O)_2 NR^a (R^b C(=O)OR^a)$ 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-[(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；

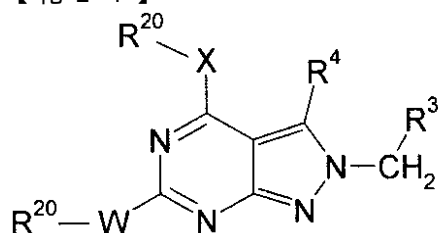
5-[(6Z)-2-[(6-クロロキノリン-4-イル)メチル]-7-(シクロプロピルメチル)-4-(メチルアミノ)-6-(メチルイミノ)-6,7-ジヒドロ-2H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-3-イル]-1-メチル-1H-ピロール-3-カルボニトリル；

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 2 4】



(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 NR^{21} 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、 $=\text{O}$ 、ハロゲン、 $-\text{OR}^a$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 $-\text{CN}$ 、ニトロ、 $-\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^c$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{Het}$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{Het}$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{OR}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{Het}$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{Het}$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{NHC}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $\text{N}=\text{NR}^a$ 、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 R^3 は、 $-\text{Het}$ 、 $-\text{Het}-\text{Het}$ 、 R^5 、 $-\text{R}^5-\text{Het}$ 、 $-\text{Het}-\text{R}^5$ 、 $-\text{Het}-\text{O}-\text{R}^5$ 、 $-\text{R}^5-\text{R}^5$ 、 $-\text{R}^5-\text{OR}^5$ により表される；

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、 $\text{B}(\text{OH})_2$ 、ビシナル- $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ -、ビシナル- OC_{1-2} ハロアルキルO-、ビシナル- OCH_2O -、ビシナル- $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}$ -、 $=\text{O}$ 、ハロゲン、 $-\text{R}^b\text{OR}^a$ 、 $-\text{SR}^a$ 、 $-\text{OR}^a$ 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^c$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{Het}$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{Het}$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{OR}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{Het}$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{Het}$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{NHC}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{NHC}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $\text{N}=\text{NR}^a$ 、 NO_2 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{NR}^a\text{R}^a)$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{OR}^a)$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^a)$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{Het})$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^b\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^b\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^a)\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{NCN})\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a(\text{R}^b\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a)$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a(\text{R}^b\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a)$ 、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 R^4 は、 $-(\text{CH}_2)_n\text{R}^5-\text{Het}$ 、 $-(\text{CH}_2)_n\text{R}^d$ 、 $-\text{Het}$ 、 $-\text{Het}-\text{Het}$ 、 R^5 、 $-\text{R}^5-\text{Het}$ 、 $-\text{Het}-\text{R}^5$ 、 $-\text{Het}-\text{OR}^5$ 、 R^5-R^5 、若しくは $-\text{R}^5-\text{OR}^5$ により表されるか；または R^4 は、 $\text{C}_{1-6}\text{alky}$ 、 $-\text{NC}_{1-6}$ アルキル、若しくは $-\text{N}(\text{C}_{1-6}\text{アルキル})_2$ により表され、ここで前記 C_{1-6} アルキル、 $-\text{NC}_{1-6}$ アルキル、 $-\text{N}(\text{C}_{1-6}\text{アルキル})_2$ 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 R^4 は、 $-(\text{CH}_2)_z\text{CH}_3$ 、 $-(\text{CH}_2)_z\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-(\text{CH}_2)_z\text{CO}_2\text{H}$ でも、 $-(\text{CH}_2)_z\text{CO}_2\text{C}_{1-6}\text{アルキル}$ でもなく、ここで z は、1、2、3、4、5、または6である；

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、 $-\text{OC}_{1-6}$ ハロアルキル、 C_{1-6} アルキル、 $-\text{CN}$ 、ニトロ、 $-\text{OR}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^c$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{Het}$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{Het}$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{OR}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{Het}$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{Het}$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(\text{CH}_2)_m\text{OR}^a$ 、 $-\text{R}^b\text{OR}^a$ 、 $-\text{SR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b\text{Het}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^b\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^b\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^a)\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{NCN})\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^b\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ または $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^b\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 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、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^c$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、または $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^a$ 、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} 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、 $\text{NH}(\text{C}_{1-4}\text{アルキル})$ 、 $\text{N}(\text{C}_{1-4}\text{アルキル})_2$ 、 C_{1-4} アルカノイルアミノ、 $(\text{C}_{1-4}\text{アルカノイル})_2$ アミノ、 $\text{N}-(\text{C}_{1-4}\text{アルキル})$ カルバモイル、 $\text{N},\text{N}-(\text{C}_{1-4}\text{アルキル})_2$ 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}) アルコキシカルボニル、 $N-(C_{1-4} \text{ アルキル})$ スルファモイル、 $N,N-(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 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 、 $-CN$ 、 $-S(=O)_n R^c$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)NR^a R^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-NR^a C(=O)R^a$ 、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} 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、 $NH(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $N(C_{1-4} \text{ アルキル})_2$ 、 C_{1-4} アルカノイルアミノ、 $(C_{1-4} \text{ アルカノイル})_2$ アミノ、 $N-(C_{1-4} \text{ アルキル})$ カルバモイル、 $N,N-(C_{1-4} \text{ アルキル})_2$ 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}) アルコキシカルボニル、 $N-(C_{1-4} \text{ アルキル})$ スルファモイル、 $N,N-(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 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^{20} 及び R^{21} と、これらが結合している N は組み合わせさせて、 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、 $-OH$ 、 $-OR^c$ 、 $-NR^a R^a$ 、 $-S(=O)_n R^c$ 、 $-C(=O)NR^a R^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-NR^a C(=O)R^a$ 、 $-OC(=O)R^a$ 、 $B(OH)_2$ 、ビシニル- OC_2H_4O- 、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} 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；

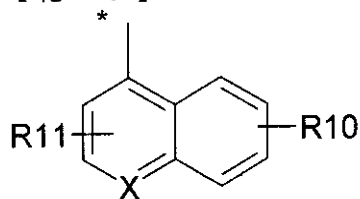
n は、0、1または2であり；

「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、 $NH(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 、 $N(C_{1-4} \text{ アルキル})_2$ 、 C_{1-4} アルカノイルアミノ、 $(C_{1-4} \text{ アルカノイル})_2$ アミノ、 $N-(C_{1-4} \text{ アルキル})$ カルバモイル、 $N,N-(C_{1-4} \text{ アルキル})_2$ 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}) アルコキシカルボニル、 $N-(C_{1-4} \text{ アルキル})$ スルファモイル、 $N,N-(C_{1-4} \text{ アルキル})$ 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る少なくとも1個の置換基を指す}。

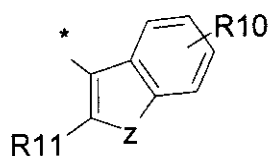
【請求項 2 1】

式中、 R^3 は、以下の式 (i)、(ii)、(iii) または (iv) :

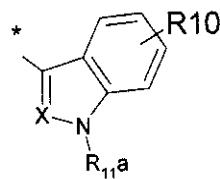
【化 2 5】



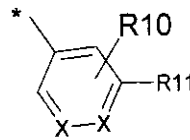
(i)



(ii)



(iii)



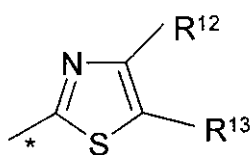
(iv)

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(1)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、前記環の上の任意の位置にあり、 R^{11} 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 、 CF_3 、 $-NR^aR^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-OC(=O)C_{1-4}$ 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である、請求項20に記載の化合物。

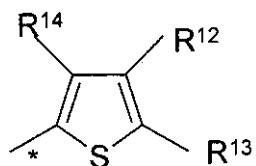
【請求項 2 2】

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

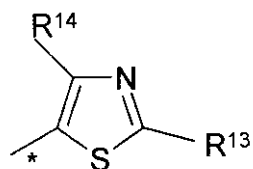
【化 2 6】



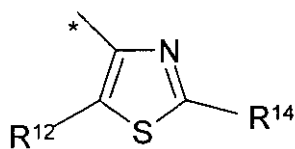
(a)



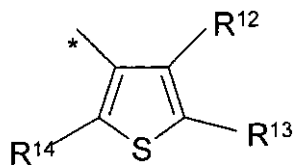
(b)



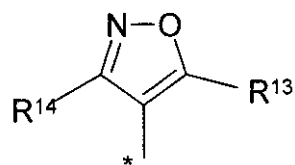
(c)



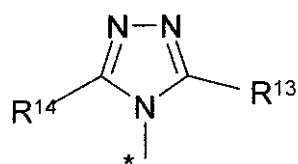
(d)



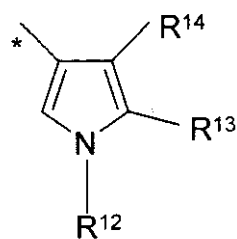
(e)



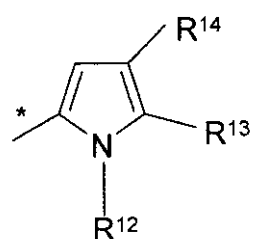
(f)



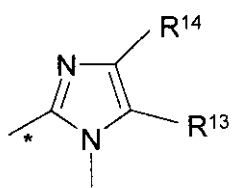
(g)



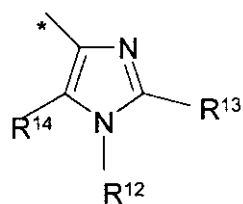
(h)



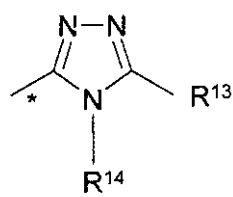
(i)



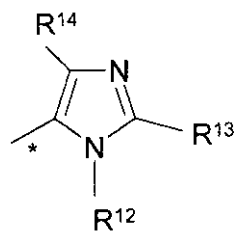
(j)



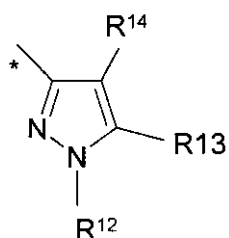
(k)



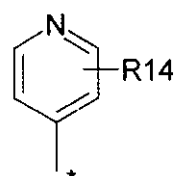
(l)



(m)

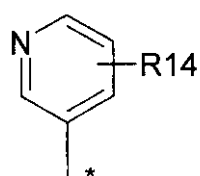


(n)

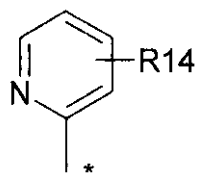


(o)

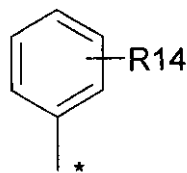
【化 2 7】



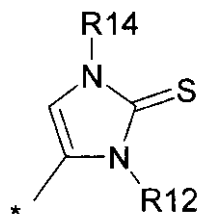
(p)



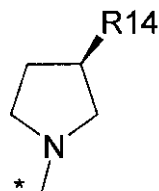
(q)



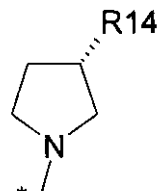
(r)



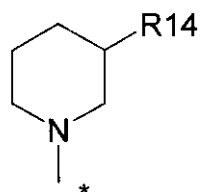
(s)



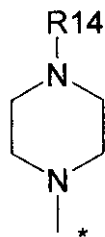
(t)



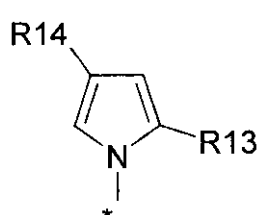
(u)



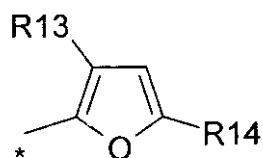
(v)



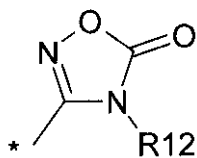
(w)



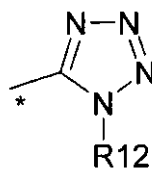
(x)



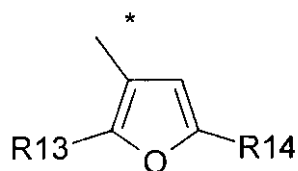
(y)



(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、 C_{1-6} アルキル、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{ニトロ}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{-Het}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{NR}^a\text{R}^a)$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{OR}^a)$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a(\text{R}^b\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a)$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b\text{Het}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^b\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^a)\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{NCN})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^b\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a\text{-SR}^a$ 、 $=\text{S}$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^b$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^a)\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a(\text{R}^b\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a)$ 、または $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a(\text{R}^b\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a)$ により表される、請求項20に記載の化合物。

【請求項 2 3】

式中、Xは、S、O、若しくは NR^{21} であるか；または X-R^{20} は水素であり；

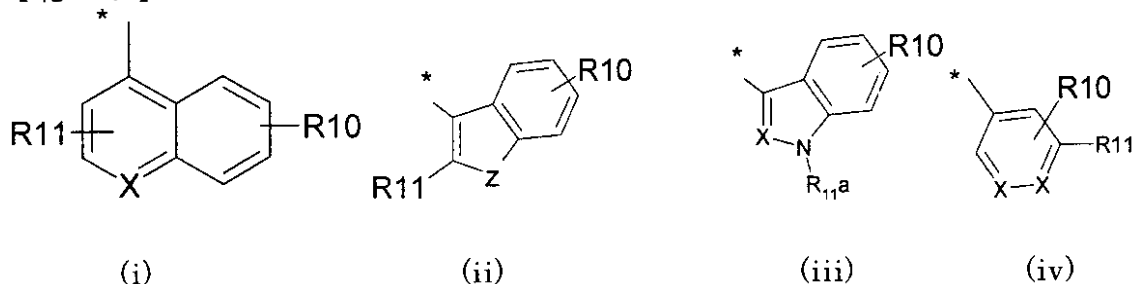
Wは、S、O、または NR^{21} であり；

R^1 は、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 CH_2CN 、 CF_3 、 $(\text{CH}_2)_2\text{OH}$ 、シクロプロピル、イソプロピル、 CH_2CCH 、 $(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{CH}_2)_2$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{C}=\text{NH})\text{NH}_2$ 、 $-\text{CH}_2-2\text{-ピリジル}$ 、 $-\text{CH}_2-3\text{-ピリジル}$ 、 $-\text{CH}_2-4\text{-ピリジル}$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-1\text{-イミダゾリル}$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-1\text{-ピラゾリル}$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-1\text{-ピペリジル}$ 、 $-(\text{CH}_2)_m-(1\text{-メチルピペリジン-4-イル})$ 、 $-\text{CH}_2-(1\text{-メチルピペリジン-3-イル})$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-(\text{モルフォリン-4-イル})$ であり、

R^2 は、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{-シクロプロピル}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CH}_2\text{-シクロブチル}$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{-メチルフェニル}$ 、 $-\text{CH}_2\text{-フェノール}$ 、 $-\text{CH}_2-(3,5\text{-ジメチルイソキサゾール-4-イル})$ 、 $-\text{CH}_2\text{-S-フェニル}$ 、 $-\text{CH}_2\text{-フェニルカルボキシル}$ 、または $-\text{CH}_2\text{SCF}_3$ であり；

R^3 は、以下の式(i)、(ii)、(iii)または(iv)：

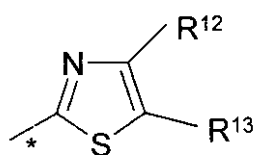
【化 28】



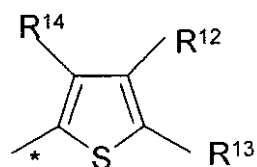
から選択され、ここで*は、(i)または(ii)または(iii)または(iv)が構造式(1)に結合している位置であり、及びXは、CまたはNであり；及びZは、OまたはSであり、ここで R^{10} は、前記環の上の任意の位置にあり、 R^{10} 及び R^{11} は、それぞれの場合で独立して、H、 R^a 、ハロゲン、 $-\text{CN}$ 、ニトロ、 OR^a 、 CF_3 、 $-\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{C}_{1-4}\text{アルキル}$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}(=\text{O})\text{C}_{1-4}\text{アルキル}$ または $-\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^c$ であり；ここで R^{11a} は、 R^a 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^a$ または $-\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^c$ であり、 $n = 1$ または 2 であり、

R^4 は、以下の式(a)～(z)または(aa)若しくは(ab)：

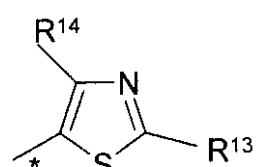
【化 29】



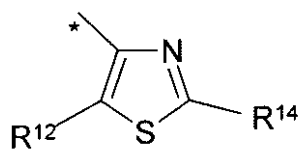
(a)



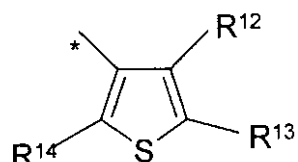
(b)



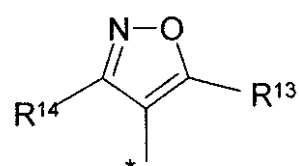
(c)



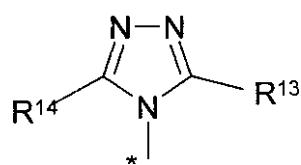
(d)



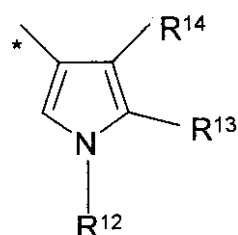
(e)



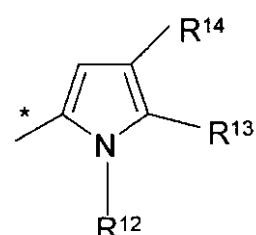
(f)



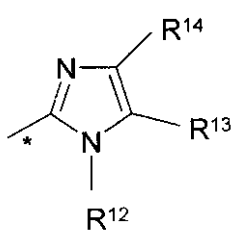
(g)



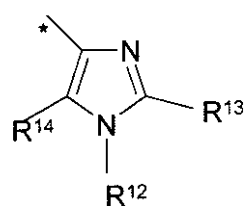
(h)



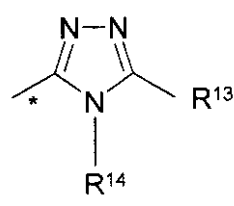
(i)



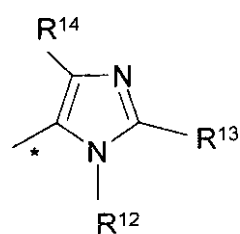
(j)



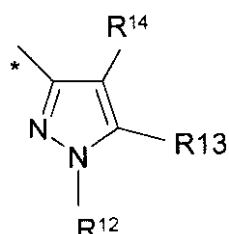
(k)



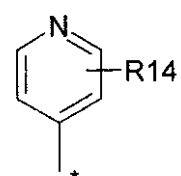
(l)



(m)

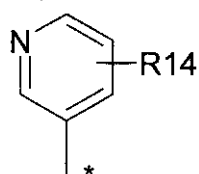


(n)

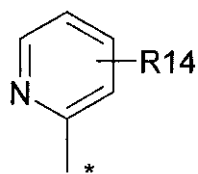


(o)

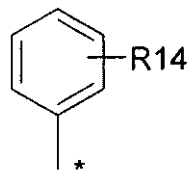
【化 30】



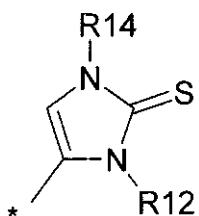
(p)



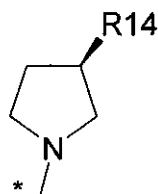
(q)



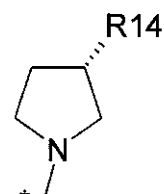
(r)



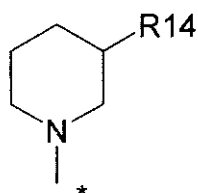
(s)



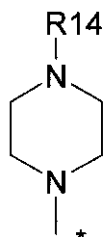
(t)



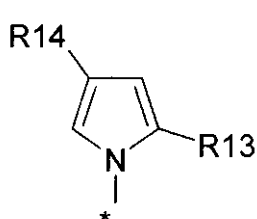
(u)



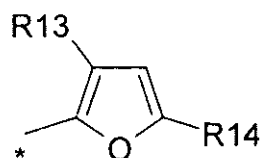
(v)



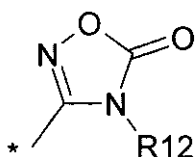
(w)



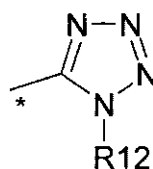
(x)



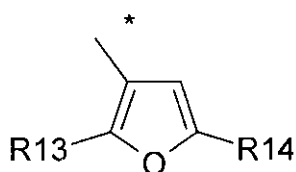
(y)



(z)



(aa)



(ab)

から選択され、ここで*は、 R^4 が前記環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、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)NR^aR^a$ 、 $-C(=O)NR^aS(=O)_2R^a$ 、 $-C(=O)NR^a-Het$ 、 $-C(=O)NR^aNR^aR^a$ 、 $-C(=O)NR^a(R^bNR^aR^a)$ 、 $-C(=O)NR^a(R^bOR^a)$ 、 $-C(=O)NR^a(R^bS(=O)_2R^a)$ 、 $-C(=O)NR^aR^bHet$ 、 $-C(=O)NR^aOR^a$ 、 $-C(=O)R^bNR^aR^a$ 、 $-C(=NOR^a)R^a$ 、 $-C(=NCN)R^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-C(=O)OR^bNR^aR^a$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-OC(=O)R^a$ 、 $-C(=O)R^a-SR^a$ 、=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、

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} 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は組み合わせさせて、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)感染症に関連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・ピロリに関連する感染症の処置に必要な宿主に、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・ピロリに関連する感染症の処置方法。

【請求項28】

ヘリコバクター・ピロリに関連する感染症の予防的処置に必要な宿主に、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・ピロリに付随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ア、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。