

【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30年5月31日(2018.5.31)

【公表番号】特表2017-515836(P2017-515836A)

【公表日】平成29年6月15日(2017.6.15)

【年通号数】公開・登録公報2017-022

【出願番号】特願2016-567364(P2016-567364)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 21/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/02 (2006.01)

A 6 1 P 7/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 0 6

C 0 7 D 471/04 C S P

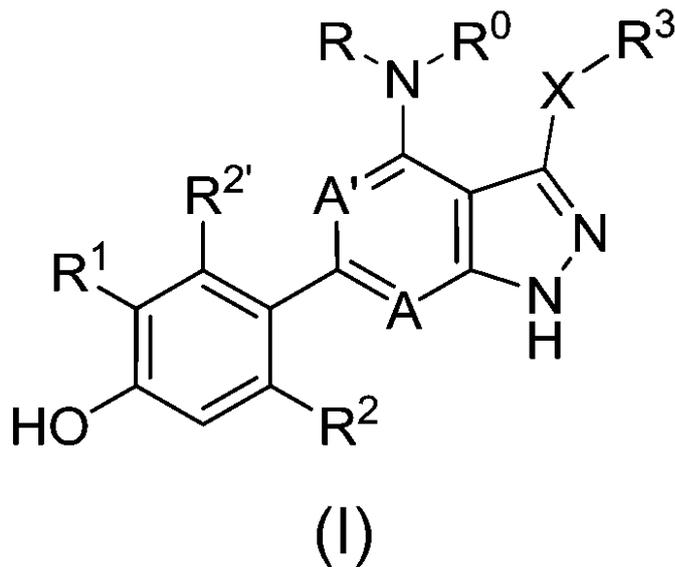
A 6 1 K 31/437

C 0 7 D	487/04	1 4 3
A 6 1 K	31/519	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	11/02	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	19/06	
A 6 1 P	25/04	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	7/02	
A 6 1 P	9/04	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	15/00	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	21/02	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	15/02	
A 6 1 P	7/10	
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	31/12	
A 6 1 K	31/444	

**【手続補正書】****【提出日】**平成30年4月16日(2018.4.16)**【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

## 【化1】



を有する化合物もしくは薬学的に許容できるその塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容できる塩の薬学的に許容できる溶媒和物〔式中、

AおよびA'は、独立に、CまたはNであり、ここで、Cは、非置換であってよく、または八口もしくはC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルによって置換されていてもよく、

RおよびR<sup>0</sup>は、独立に、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、フェニル(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、および-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-Wからなる群から選択され、ここで、Wは、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、フェニル、ナフチル、1~3個のN、Sおよび/またはO原子を含有する5員または6員のヘテロアリールまたは複素環、-SO<sub>2</sub>-R'、-NH-SO<sub>2</sub>-R'、-NR''-SO<sub>2</sub>-R'およびSR'であり、ここで、R'およびR''は、独立に、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルもしくはC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)アミノ、フェニル、ヘテロアリール、または複素環であり、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、複素環、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリールのそれぞれは、非置換であってよく、またはフェニル、ヘテロアリール、複素環、八口、シアノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、アリールオキシ、-SO<sub>2</sub>-R'、-CONR'R''、NR'COR''、-NR'CONR'R''、-NR'CO<sub>2</sub>R''、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-SO<sub>2</sub>-R'、-NH-SO<sub>2</sub>-R'、-NR''-SO<sub>2</sub>-R'もしくはSR'によって置換されていてもよく、ここで、R'およびR''は、独立に、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、フェニル、アミノ、ヒドロキシアルキルアミノ、複素環もしくは-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-W'であり、ここで、W'は、ヒドロキシ、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、フェニル、ナフチル、複素環、または1~3個のN、Sおよび/もしくはO原子を含有する5員もしくは6員のヘテロアリールであり、

またはRおよびR<sup>0</sup>ならびにそれらに結合しているN原子は、一緒になって、単環式または二環式の複素環を形成し、その複素環は、非置換であってよく、または(a)八口、ヒドロキシ、ヘテロアリール、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ)C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、アリール(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ)、アリールオキシ、アミノ、アミノアシル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルアミノアシル、アリールアルキルアミノアシル、ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)アミノアシル、-SO<sub>2</sub>-R'、-SO<sub>2</sub>-NR''、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-W、-NH-SO<sub>2</sub>-R'、-NR''-SO<sub>2</sub>-R'もしくはSR'(ここで、R'およびR''は、独立に、アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキルである)、または(b)-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-W(ここで、Wは、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、フェニル、

ナフチル、複素環、1～3個のN原子を含有する5員または6員のヘテロアリール、 $-SO_2-R'$ 、 $-NH SO_2-R'$ 、 $-NR''SO_2-R'$ または $SR'$ であり、 $R'$ および $R''$ は、独立に、アルキルまたはシクロアルキルである)によって置換されていてもよく、ここで、前記フェニル、アリールもしくはヘテロアリールのそれぞれは、非置換であってよく、またはハロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、シアノもしくはヒドロキシによって置換されていてもよく、

$R^1$ は、H、ハロまたはシアノであり、

$R^2$ および $R^{2'}$ は、独立に、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、または $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルであり、ここで、アルキル、アルコキシ、またはシクロアルキルは、1つまたは複数のフッ素原子によって置換されていてもよく、

Xは、結合、 $-CO-$ 、 $-CONH-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-SONH-$ 、または $-(CH_2)_m-$ であり、

$R^3$ は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、フェニル、ナフチル、1～3個のN原子を含有する6員のヘテロアリールまたは複素環、(a) 1～4個のN原子、または(b) 1個のOもしくはS原子および0～3個のN原子のいずれかを含有する5員のヘテロアリールまたは複素環、1～4個のN原子を含有する10員の二環式ヘテロアリールまたは複素環、(a) 1～4個のN原子、または(b) 1個のOもしくはS原子および0～3個のN原子のいずれかを含有する9員の二環式ヘテロアリールまたは複素環、または(a) 1～4個のN原子、または(b) 1個のOもしくはS原子および1～3個のN原子、または(c) 2個のOもしくはS原子および0～2個のN原子を含有する8員の二環式ヘテロアリールまたは複素環であり、ここで、前記フェニル、ナフチル、ヘテロアリールまたは複素環のそれぞれは、アルキル、1個の置換基 $-Y-R^4$ および/または $R^5$ からそれぞれ独立に選択される1～4個の置換基によって置換されていてもよく、ただし、Xが、 $-CO-$ または $-SO_2-$ である場合、 $R^3$ は、Hではなく、

Yは、結合、 $-(CH_2)_m-$ または $-O-$ であり、

$R^4$ は、(a) H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、ハロ、オキソ、 $-OR^6$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-SR^6$ 、 $-SOR^9$ 、 $-SO_2R^9$ 、 $-COR^6$ 、 $-OCOR^6$ 、 $-COOR^6$ 、 $-NR^6COR^6$ 、 $-CONR^7R^8$ 、 $-NR^6SO_2R^9$ 、 $-SO_2NR^7R^8$ 、 $-NR^6CONR^7R^8$ 、 $-NR^6COOR^9$ および $-NR^6SO_2NR^7R^8$ 、(b) フェニルもしくはナフチル(前記フェニルおよびナフチルは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、ハロ、シアノ、 $-OR^6$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-SR^6$ 、 $-SOR^9$ 、 $-SO_2R^9$ 、 $-COR^6$ 、 $-OCOR^6$ 、 $-COOR^6$ 、 $-NR^6COR^6$ 、 $-CONR^7R^8$ 、 $-NR^6SO_2R^9$ 、 $-SO_2NR^7R^8$ 、 $-NR^6CONR^7R^8$ 、 $-NR^6COOR^9$ および $-NR^6SO_2NR^7R^8$ から選択される1～5個の置換基で置換されていてもよい)、または(c) OおよびNから選択される1個もしくは2個のヘテロ原子を含有する3～8員の飽和もしくは部分的に不飽和の単環式ヘテロアリール(前記ヘテロアリールは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、ハロ、シアノ、オキソ、 $-OR^6$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-SR^6$ 、 $-SOR^9$ 、 $-SO_2R^9$ 、 $-COR^6$ 、 $-OCOR^6$ 、 $-COOR^6$ 、 $-NR^6COR^6$ 、 $-CONR^7R^8$ 、 $-NR^6SO_2R^9$ 、 $-SO_2NR^7R^8$ 、 $-NR^6CONR^7R^8$ 、 $-NR^6COOR^9$ および $-NR^6SO_2NR^7R^8$ から選択される1～5個の置換基によって置換されていてもよい)であり、

$R^5$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、ハロ、シアノ、 $-OR^6$ 、 $-NR^7R^8$ 、 $-SR^6$ 、 $-SOR^9$ 、 $-SO_2R^9$ 、 $-COR^6$ 、 $-OCOR^6$ 、 $-COOR^6$ 、 $-NR^6COR^6$ 、 $-CONR^7R^8$ 、 $-NR^6SO_2R^9$ 、 $-SO_2NR^7R^8$ 、 $-NR^6CONR^7R^8$ 、 $-NR^6COOR^9$ または $-NR^6SO_2NR^7R^8$ であり、

$R^6$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルであり、前記 $C_1 \sim C_6$ アルキルは、 $-NR^7R^8$ によって、またはOおよびNから選択される1個もしくは2

個のヘテロ原子を含有する 3 ~ 8 員の飽和もしくは部分的に不飽和の単環式ヘテロアリアルによって置換されていてもよく、前記ヘテロアリアルは、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、ハロ、ヒドロキシおよびシアノから選択される 1 ~ 5 個の置換基によって置換されていてもよく、

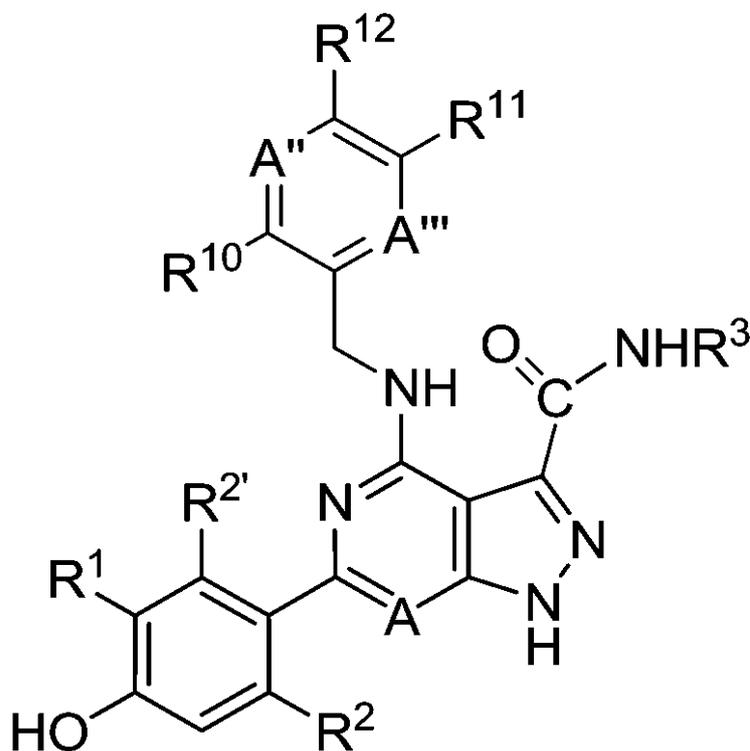
$R^7$  および  $R^8$  は、それぞれ独立に、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキルもしくは  $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルであり、またはそれらが結合している窒素原子と一緒に、1 ~ 2 個の窒素原子もしくは 1 個の窒素および 1 個の酸素原子を含有する 4 員、5 員もしくは 6 員の飽和複素環を形成し、前記  $C_1 \sim C_6$  アルキルは、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、ハロ、ヒドロキシ、アミノ、( $C_1 \sim C_6$  アルキル)アミノまたはジ( $C_1 \sim C_6$  アルキル)アミノによって置換されていてもよく、前記複素環は、1 つまたは複数の  $C_1 \sim C_6$  アルキルまたは  $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル基によって置換されていてもよく、

$R^9$  は、 $C_1 \sim C_6$  アルキルまたは  $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルであり、 $m$  および  $n$  は、独立に、0、1、2 または 3 である ]。

【請求項 2】

構造

【化 2】



(Ia)

を有する請求項 1 に記載の化合物もしくは薬学的に許容できるその塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容できる塩の薬学的に許容できる溶媒和物 [ 式中、

$A$ 、 $A''$  および  $A'''$  は、独立に、 $C$  または  $N$  であり、ここで、 $C$  は、非置換であってよく、またはハロもしくは  $C_1 \sim C_6$  アルキルによって置換されていてもよく、

$R^1$  は、 $H$ 、シアノまたはハロであり、

$R^2$  および  $R^2'$  は、独立に、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルチオ、または  $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルであり、ここで、アルキル、アルコキシ、またはシクロアルキルは、1 つまたは複数のフッ素原子によって置換されていてもよく、

$R^3$  は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、フェニル、ナフチル、1 ~ 3 個の  $N$  原子を含有する 6

員のヘテロアリアルまたは複素環、(a) 1~4個のN原子、または(b) 1個のOもしくはS原子および0~3個のN原子のいずれかを含有する5員のヘテロアリアルまたは複素環、1~4個のN原子を含有する10員の二環式ヘテロアリアルまたは複素環、(a) 1~4個のN原子、または(b) 1個のOもしくはS原子および0~3個のN原子のいずれかを含有する9員の二環式ヘテロアリアルまたは複素環、または(a) 1~4個のN原子、または(b) 1個のOもしくはS原子および1~3個のN原子、または(c) 2個のOもしくはS原子および0~2個のN原子を含有する8員の二環式ヘテロアリアルまたは複素環であり、ここで、前記フェニル、ナフチル、ヘテロアリアルまたは複素環のそれぞれは、アルキル、1個の置換基-Y-R<sup>4</sup>および/またはR<sup>5</sup>からそれぞれ独立に選択される1~4個の置換基によって置換されていてもよく、

Yは、結合、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-または-O-であり、

R<sup>4</sup>は、(a) H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、ハロ、オキソ、-OR<sup>6</sup>、-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-SR<sup>6</sup>、-SOR<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-COR<sup>6</sup>、-OCOR<sup>6</sup>、-COOR<sup>6</sup>、-NR<sup>6</sup>COR<sup>6</sup>、-CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>COOR<sup>9</sup>および-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、(b) フェニルもしくはナフチル(前記フェニルおよびナフチルは、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、ハロ、-CN、-OR<sup>6</sup>、-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-SR<sup>6</sup>、-SOR<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-COR<sup>6</sup>、-OCOR<sup>6</sup>、-COOR<sup>6</sup>、-NR<sup>6</sup>COR<sup>6</sup>、-CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>COOR<sup>9</sup>および-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>から選択される1~5個の置換基で置換されていてもよい)、または(c) OおよびNから選択される1個もしくは2個のヘテロ原子を含有する3~8員の飽和もしくは部分的に不飽和の単環式ヘテロアリアル(前記ヘテロアリアルは、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、ハロ、オキソ、-OR<sup>6</sup>、-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-SR<sup>6</sup>、-SOR<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-COR<sup>6</sup>、-OCOR<sup>6</sup>、-COOR<sup>6</sup>、-NR<sup>6</sup>COR<sup>6</sup>、-CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>COOR<sup>9</sup>および-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>から選択される1~5個の置換基によって置換されていてもよい)であり、

R<sup>5</sup>は、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、ハロ、-CN、-OR<sup>6</sup>、-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-SR<sup>6</sup>、-SOR<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-COR<sup>6</sup>、-OCOR<sup>6</sup>、-COOR<sup>6</sup>、-NR<sup>6</sup>COR<sup>6</sup>、-CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>COOR<sup>9</sup>または-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>であり、

R<sup>6</sup>は、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキルであり、前記C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルは、-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>によって、またはOおよびNから選択される1個もしくは2個のヘテロ原子を含有する3~8員の飽和もしくは部分的に不飽和の単環式ヘテロアリアルによって置換されていてもよく、前記ヘテロアリアルは、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、ハロ、ヒドロキシおよびシアノから選択される1~5個の置換基によって置換されていてもよく、

R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>は、それぞれ独立に、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルもしくはC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキルであり、またはそれらが結合している窒素原子と一緒に、1~2個の窒素原子もしくは1個の窒素および1個の酸素原子を含有する4員、5員もしくは6員の飽和複素環を形成し、前記C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルは、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、ハロ、ヒドロキシ、アミノ、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)アミノまたはジ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)アミノによって置換されていてもよく、前記複素環は、1つまたは複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル基によって置換されていてもよく、

R<sup>9</sup>は、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキルであり、

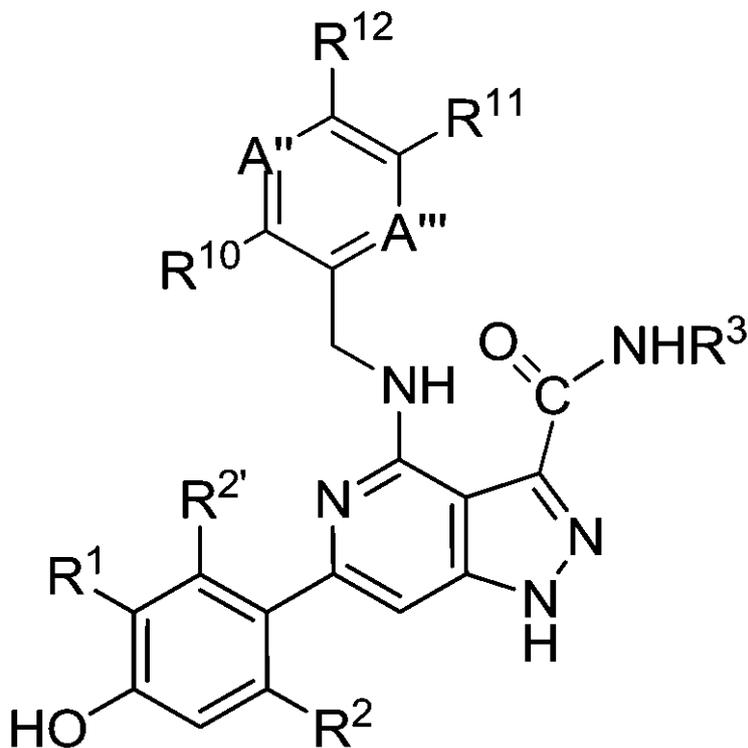
R<sup>10</sup>は、-NH<sub>2</sub>-R'、-NR''SO<sub>2</sub>-R'またはSR'であり、ここで、R'およびR''は、独立に、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、フェニル、アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)アミノ、複素

環、 $-(CH_2)_n-W'$ であり、ここで、 $W'$ は、ヒドロキシ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、フェニル、ナフチル、複素環、1～3個のNおよび/またはO原子を含有する5員または6員のヘテロアリアルであり、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、複素環、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリアルそれぞれの非置換であってよく、またはフェニル、ヘテロアリアル、複素環、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、アリアルオキシ、 $-SO_2-R'$ 、 $-NH-SO_2-R'$ 、 $-NR'SO_2-R'$ もしくは $SR'$ によって置換されていてもよく、ここで、 $R'$ および $R''$ は、独立に、フェニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルもしくは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルであり、 $R^{11}$ および $R^{12}$ は、それぞれ独立に、H、ヒドロキシ、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルであり、 $m$ および $n$ は、独立に、0、1、2、または3である]。

【請求項3】

構造

【化3】



(Ib)

を有する請求項1に記載の化合物もしくは薬学的に許容できるその塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容できる塩の薬学的に許容できる溶媒和物[式中、

$A''$ および $A'''$ は、独立に、CまたはNであり、ここで、Cは、非置換であってよく、またはハロもしくは $C_1 \sim C_6$ アルキルによって置換されていてもよく、

$R^1$ は、H、シアノまたはハロであり、

$R^2$ および $R^{2'}$ は、独立に、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、または $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルであり、ここで、アルキル、アルコキシ、またはシクロアルキルは、1つまたは複数のフッ素原子によって置換されていてもよく、

$R^3$ は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、フェニル、ナフチル、1～3個のN原子を含有する6

員のヘテロアリアルまたは複素環、(a) 1~4個のN原子、または(b) 1個のOもしくはS原子および0~3個のN原子のいずれかを含有する5員のヘテロアリアルまたは複素環、1~4個のN原子を含有する10員の二環式ヘテロアリアルまたは複素環、(a) 1~4個のN原子、または(b) 1個のOもしくはS原子および0~3個のN原子のいずれかを含有する9員の二環式ヘテロアリアルまたは複素環、または(a) 1~4個のN原子、または(b) 1個のOもしくはS原子および1~3個のN原子、または(c) 2個のOもしくはS原子および0~2個のN原子を含有する8員の二環式ヘテロアリアルまたは複素環であり、ここで、前記フェニル、ナフチル、ヘテロアリアルまたは複素環のそれぞれは、アルキル、1個の置換基-Y-R<sup>4</sup>および/またはR<sup>5</sup>からそれぞれ独立に選択される1~4個の置換基によって置換されていてもよく、

Yは、結合、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-または-O-であり、

R<sup>4</sup>は、(a) H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、ハロ、オキソ、-OR<sup>6</sup>、-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-SR<sup>6</sup>、-SOR<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-COR<sup>6</sup>、-OCOR<sup>6</sup>、-COOR<sup>6</sup>、-NR<sup>6</sup>COR<sup>6</sup>、-CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>COOR<sup>9</sup>および-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、(b) フェニルもしくはナフチル(前記フェニルおよびナフチルは、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、ハロ、-CN、-OR<sup>6</sup>、-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-SR<sup>6</sup>、-SOR<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-COR<sup>6</sup>、-OCOR<sup>6</sup>、-COOR<sup>6</sup>、-NR<sup>6</sup>COR<sup>6</sup>、-CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>COOR<sup>9</sup>および-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>から選択される1~5個の置換基で置換されていてもよい)、または(c) OおよびNから選択される1個もしくは2個のヘテロ原子を含有する3~8員の飽和もしくは部分的に不飽和の単環式ヘテロアリアル(前記ヘテロアリアルは、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、ハロ、オキソ、-OR<sup>6</sup>、-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-SR<sup>6</sup>、-SOR<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-COR<sup>6</sup>、-OCOR<sup>6</sup>、-COOR<sup>6</sup>、-NR<sup>6</sup>COR<sup>6</sup>、-CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>COOR<sup>9</sup>および-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>から選択される1~5個の置換基によって置換されていてもよい)であり、

R<sup>5</sup>は、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、ハロ、-CN、-OR<sup>6</sup>、-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-SR<sup>6</sup>、-SOR<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-COR<sup>6</sup>、-OCOR<sup>6</sup>、-COOR<sup>6</sup>、-NR<sup>6</sup>COR<sup>6</sup>、-CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>COOR<sup>9</sup>または-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>であり、

R<sup>6</sup>は、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキルであり、前記C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルは、-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>によって、またはOおよびNから選択される1個もしくは2個のヘテロ原子を含有する3~8員の飽和もしくは部分的に不飽和の単環式ヘテロアリアルによって置換されていてもよく、前記ヘテロアリアルは、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、ハロ、ヒドロキシおよびシアノから選択される1~5個の置換基によって置換されていてもよく、

R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>は、それぞれ独立に、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルもしくはC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキルであり、またはそれらが結合している窒素原子と一緒に、1~2個の窒素原子もしくは1個の窒素および1個の酸素原子を含有する4員、5員もしくは6員の飽和複素環を形成し、前記C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルは、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、ハロ、ヒドロキシ、アミノ、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)アミノまたはジ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)アミノによって置換されていてもよく、前記複素環は、1つまたは複数のC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル基によって置換されていてもよく、

R<sup>9</sup>は、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキルであり、

R<sup>10</sup>は、-NH<sub>2</sub>-R'、-NR''SO<sub>2</sub>-R'またはSR'であり、ここで、R'およびR''は、独立に、水素、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、フェニル、アミノ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)アミノ、複素

環、 $-(CH_2)_n-W'$ であり、ここで、 $W'$ は、ヒドロキシ、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、フェニル、ナフチル、複素環、1～3個のNおよび/またはO原子を含有する5員または6員のヘテロアリアルであり、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、複素環、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリアルそれぞれの非置換であってよく、またはフェニル、ヘテロアリアル、複素環、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、アリアルオキシ、 $-SO_2-R'$ 、 $-NH-SO_2-R'$ 、 $-NR''SO_2-R'$ もしくは $SR'$ によって置換されていてもよく、ここで、 $R'$ および $R''$ は、独立に、フェニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルもしくは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルであり、 $R^{11}$ および $R^{12}$ は、それぞれ独立に、H、ヒドロキシ、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルであり、 $m$ および $n$ は、独立に、0、1、2または3である]。

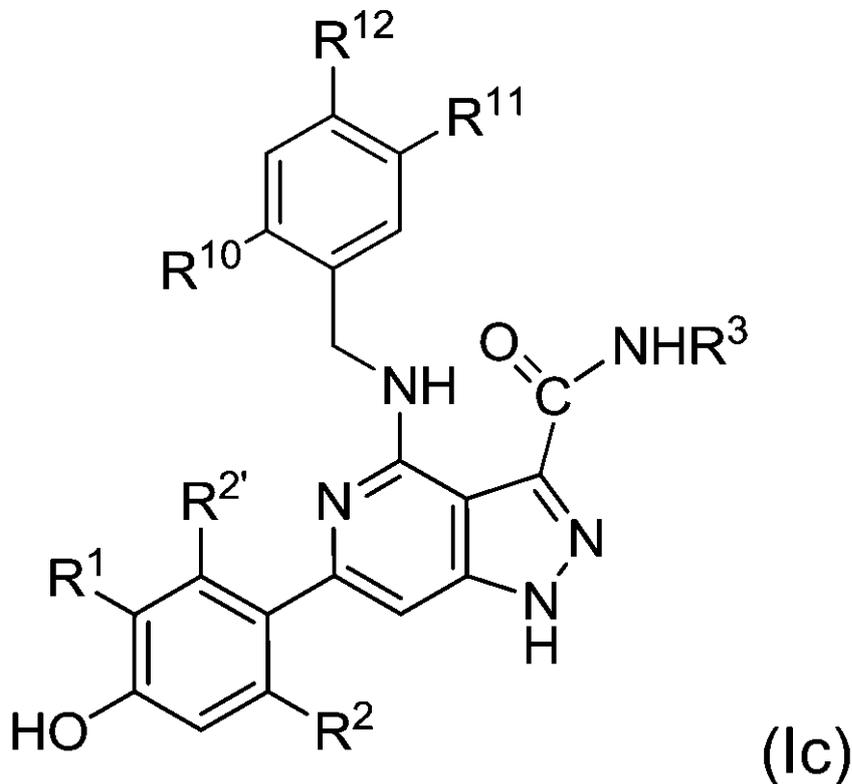
【請求項4】

$R^{10}$ が、 $-NR''SO_2-R'$ であり、 $R'$ および $R''$ が、共に $C_1 \sim C_6$ アルキルである、請求項3に記載の化合物もしくは薬学的に許容できるその塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容できる塩の薬学的に許容できる溶媒和物。

【請求項5】

構造

【化4】



を有する請求項1に記載の化合物もしくは薬学的に許容できるその塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容できる塩の薬学的に許容できる溶媒和物[式中、

$R^1$ は、H、シアノまたはハロであり、

$R^2$ および $R^{2'}$ は、独立に、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、または $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルであり、ここで、アルキル、アルコキシ、またはシクロアルキルは、1つまたは複数のフッ素原子によって置換されていてもよく、

$R^3$ は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、フェニル、ナフチル、1～3個のN原子を含有する6員のヘテロアリアルまたは複素環、(a) 1～4個のN原子、または(b) 1個のOもしくはS原子および0～3個のN原子のいずれかを含有する5員のヘテロアリアルまたは複

素環、1～4個のN原子を含有する10員の二環式ヘテロアリアルまたは複素環、(a) 1～4個のN原子、または(b) 1個のOもしくはS原子および0～3個のN原子のいずれかを含有する9員の二環式ヘテロアリアルまたは複素環、または(a) 1～4個のN原子、または(b) 1個のOもしくはS原子および1～3個のN原子、または(c) 2個のOもしくはS原子および0～2個のN原子を含有する8員の二環式ヘテロアリアルまたは複素環であり、ここで、前記フェニル、ナフチル、ヘテロアリアルまたは複素環のそれぞれは、アルキル、1個の置換基-Y-R<sup>4</sup>および/またはR<sup>5</sup>からそれぞれ独立に選択される1～4個の置換基によって置換されていてもよく、

Yは、結合、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-または-O-であり、

R<sup>4</sup>は、(a) H、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル、八口、オキソ、-OR<sup>6</sup>、-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-SR<sup>6</sup>、-SOR<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-COR<sup>6</sup>、-OCOR<sup>6</sup>、-COOR<sup>6</sup>、-NR<sup>6</sup>COR<sup>6</sup>、-CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>COOR<sup>9</sup>および-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、(b) フェニルもしくはナフチル(前記フェニルおよびナフチルは、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル、八口、-CN、-OR<sup>6</sup>、-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-SR<sup>6</sup>、-SOR<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-COR<sup>6</sup>、-OCOR<sup>6</sup>、-COOR<sup>6</sup>、-NR<sup>6</sup>COR<sup>6</sup>、-CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>COOR<sup>9</sup>および-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>から選択される1～5個の置換基で置換されていてもよい)、または(c) OおよびNから選択される1個もしくは2個のヘテロ原子を含有する3～8員の飽和もしくは部分的に不飽和の単環式ヘテロアリアル(前記ヘテロアリアルは、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル、八口、オキソ、-OR<sup>6</sup>、-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-SR<sup>6</sup>、-SOR<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-COR<sup>6</sup>、-OCOR<sup>6</sup>、-COOR<sup>6</sup>、-NR<sup>6</sup>COR<sup>6</sup>、-CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>COOR<sup>9</sup>および-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>から選択される1～5個の置換基によって置換されていてもよい)であり、

R<sup>5</sup>は、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル、八口、-CN、-OR<sup>6</sup>、-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-SR<sup>6</sup>、-SOR<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-COR<sup>6</sup>、-OCOR<sup>6</sup>、-COOR<sup>6</sup>、-NR<sup>6</sup>COR<sup>6</sup>、-CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>CONR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、-NR<sup>6</sup>COOR<sup>9</sup>または-NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>であり、

R<sup>6</sup>は、H、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキルであり、前記C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルは、-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>によって、またはOおよびNから選択される1個もしくは2個のヘテロ原子を含有する3～8員の飽和もしくは部分的に不飽和の単環式ヘテロアリアルによって置換されていてもよく、前記ヘテロアリアルは、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル、八口、ヒドロキシおよびシアノから選択される1～5個の置換基によって置換されていてもよく、

R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>は、それぞれ独立に、H、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルもしくはC<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキルであり、またはそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、1～2個の窒素原子もしくは1個の窒素および1個の酸素原子を含有する4員、5員もしくは6員の飽和複素環を形成し、前記C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルは、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル、八口、ヒドロキシ、アミノ、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノまたはジ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノによって置換されていてもよく、前記複素環は、1つまたは複数のC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル基によって置換されていてもよく、

R<sup>9</sup>は、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキルであり、

R<sup>10</sup>は、-NH<sub>2</sub>-R'、-NR''SO<sub>2</sub>-R'またはSR'であり、ここで、R'およびR''は、独立に、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル、フェニル、アミノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルアミノ、ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)アミノ、複素環、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-W'であり、ここで、W'は、ヒドロキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>8</sub>シクロアルキル、フェニル、ナフチル、複素環、1～3個のNおよび/またはO原子を含有する5員

または6員のヘテロアリアルであり、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、複素環、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリアルそれぞれの非置換であってよく、またはフェニル、ヘテロアリアル、複素環、八口、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、アリアルオキシ、 $-SO_2-R'$ 、 $-NH SO_2-R'$ 、 $-NR''SO_2-R'$ もしくは $SR'$ によって置換されていてもよく、ここで、 $R'$ および $R''$ は、独立に、フェニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルもしくは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルであり、

$R^{11}$ および $R^{12}$ は、それぞれ独立に、H、ヒドロキシ、八口、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルであり、 $m$ および $n$ は、独立に、0、1、2または3である]。

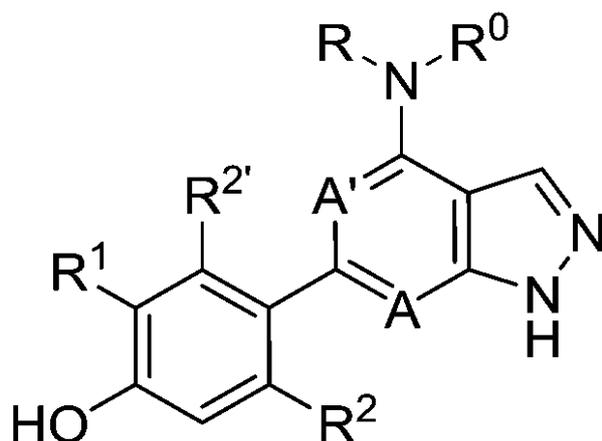
【請求項6】

$R^{10}$ が、 $-NR''SO_2-R'$ であり、 $R'$ および $R''$ が、共に $C_1 \sim C_6$ アルキルである、請求項5に記載の化合物もしくは薬学的に許容できるその塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容できる塩の薬学的に許容できる溶媒和物。

【請求項7】

構造

【化5】



(Id)

を有する請求項1に記載の化合物もしくは薬学的に許容できるその塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容できる塩の薬学的に許容できる溶媒和物[式中、

$A$ および $A'$ は、独立に、 $C$ または $N$ であり、ここで、 $C$ は、非置換であってよく、または $C_1 \sim C_6$ アルキルによって置換されていてもよく、

$R$ および $R^0$ は、独立に、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ヒドロキシ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)、フェニル( $C_1 \sim C_6$ アルキル)、および $-(CH_2)_n-W$ からなる群から選択され、ここで、 $W$ は、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、フェニル、ナフチル、1~3個のN、Sおよび/またはO原子を含有する5員または6員のヘテロアリアルまたは複素環、 $-SO_2-R'$ 、 $-NH SO_2-R'$ 、 $-NR''SO_2-R'$ および $SR'$ であり、ここで、 $R'$ および $R''$ は、独立に、 $C_1 \sim C_6$ アルキルもしくは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、アミノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルアミノ、ジ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)アミノ、フェニル、ヘテロアリアル、または複素環であり、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、複素環、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリアルそれぞれの非置換であってよく、またはフェニル、ヘテロアリアル、複素環、八口、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、アリアルオキシ、 $-SO_2-R'$ 、 $-CONR'R''$ 、 $NR'COR''$ 、 $-NR'CONR'R''$ 、 $-NR'CO_2R''$ 、 $-(CH_2)_n-SO_2-R'$ 、 $-NH SO_2-R'$ 、 $-NR''SO_2-R'$ もしくは $SR'$ によって置換されてい

てもよく、ここで、 $R'$  および  $R''$  は、独立に、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、フェニル、アミノ、ヒドロキシアルキルアミノ、複素環もしくは  $-(CH_2)_n - W'$  であり、ここで、 $W'$  は、ヒドロキシ、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、フェニル、ナフチル、複素環、または 1 ~ 3 個の N、S および / もしくは O 原子を含有する 5 員もしくは 6 員のヘテロアリアルであり、

または  $R$  および  $R^0$  ならびにそれらに結合している N 原子は、一緒になって、単環式または二環式の複素環を形成し、その複素環は、非置換であってよく、または (a) 八口、ヒドロキシ、ヘテロアリアル、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $(C_1 \sim C_6$  アルコキシ)  $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、アリアル ( $C_1 \sim C_6$  アルコキシ)、アリアルオキシ、アミノ、アミノアシル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノアシル、アリアルアルキルアミノアシル、ジ ( $C_1 \sim C_6$  アルキル) アミノアシル、 $-SO_2 - R'$ 、 $-SO_2 - NR''$ 、 $-(CH_2)_n - W$ 、 $-NH SO_2 - R'$ 、 $-NR'' SO_2 - R'$  もしくは  $SR'$  (ここで、 $R'$  および  $R''$  は、独立に、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノ、ジ ( $C_1 \sim C_6$  アルキル) アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルまたは  $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルである)、または (b)  $-(CH_2)_n - W$  (ここで、 $W$  は、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、フェニル、ナフチル、複素環、1 ~ 3 個の N 原子を含有する 5 員または 6 員のヘテロアリアル、 $-SO_2 - R'$ 、 $-NH SO_2 - R'$ 、 $-NR'' SO_2 - R'$  または  $SR'$  であり、ここで、 $R'$  および  $R''$  は、独立に、アルキルまたはシクロアルキルである) によって置換されていてもよく、ここで、前記フェニル、アリアル、またはヘテロアリアルのそれぞれは、非置換であってよく、または八口、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、シアノもしくはヒドロキシによって置換されていてもよく、

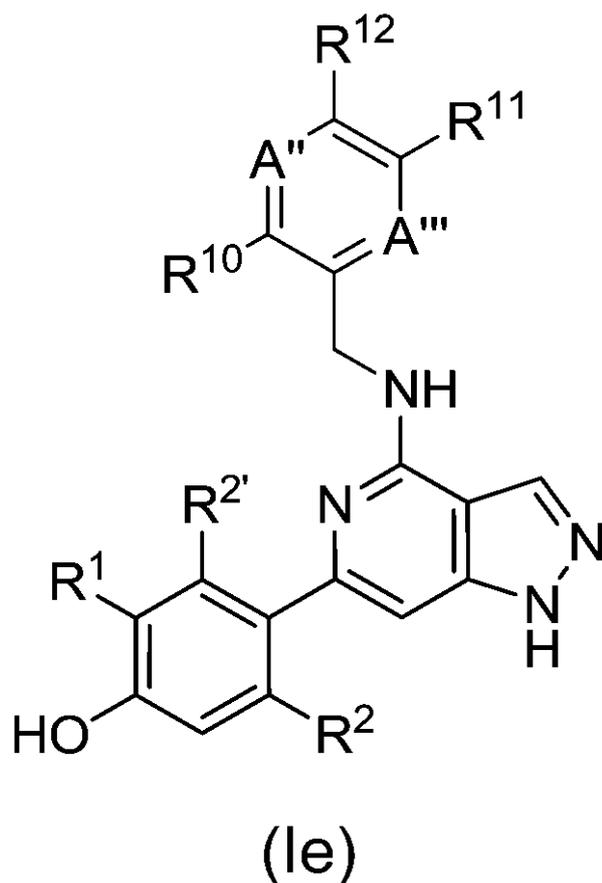
$R^1$  は、H、シアノまたは八口であり、

$R^2$  および  $R^{2'}$  は、独立に、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルチオ、または  $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルであり、ここで、アルキル、アルコキシ、またはシクロアルキルは、1 つまたは複数のフッ素原子によって置換されていてもよく、 $n$  は、0、1、2 または 3 である ]。

【請求項 8】

構造

【化6】



を有する請求項6に記載の化合物もしくは薬学的に許容できるその塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容できる塩の薬学的に許容できる溶媒和物〔式中、

A、A'、A''およびA'''は、独立に、CまたはNであり、ここで、Cは、非置換であってよく、またはハロもしくはC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルによって置換されていてもよく、R<sup>1</sup>は、H、シアノまたはハロであり、

R<sup>2</sup>およびR<sup>2'</sup>は、独立に、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、シアノ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルチオ、またはC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキルであり、ここで、アルキル、アルコキシ、またはシクロアルキルは、1つまたは複数のフッ素原子によって置換されていてもよく、

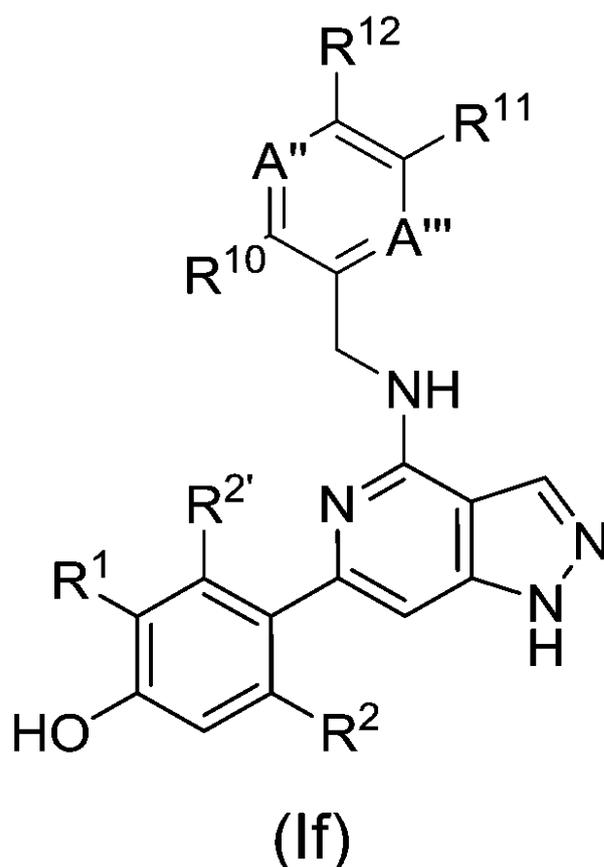
R<sup>10</sup>は、-NHSO<sub>2</sub>-R'、-NR''SO<sub>2</sub>-R'またはSR'であり、ここで、R'およびR''は、独立に、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキルであり、

R<sup>11</sup>およびR<sup>12</sup>は、それぞれ独立に、H、ヒドロキシ、ハロ、シアノ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキルである〕。

【請求項9】

構造

【化 7】



を有する請求項 6 に記載の化合物もしくは薬学的に許容できるその塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容できる塩の薬学的に許容できる溶媒和物 [ 式中、

A' および A''' は、独立に、C または N であり、ここで、C は、非置換であってよく、または八口もしくは C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルによって置換されていてもよく、

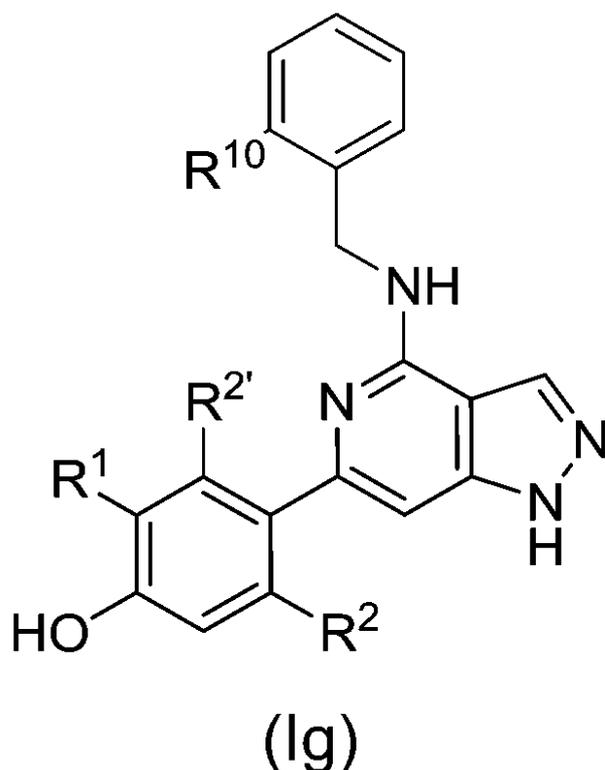
R<sup>1</sup> は、H、シアノまたは八口であり、

R<sup>2</sup> および R<sup>2'</sup> は、独立に、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、シアノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルチオ、または C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキルであり、ここで、アルキル、アルコキシ、またはシクロアルキルは、1 つまたは複数のフッ素原子によって置換されていてもよく、

R<sup>10</sup> は、-NH SO<sub>2</sub> - R'、-NR'' SO<sub>2</sub> - R' または SR' であり、ここで、R' および R'' は、独立に、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキル、フェニル、アミノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルアミノ、ジ (C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル) アミノ、複素環、- (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - W' であり、ここで、W' は、ヒドロキシ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキル、フェニル、ナフチル、複素環、1 ~ 3 個の N および / または O 原子を含有する 5 員または 6 員のヘテロアリアルであり、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、複素環、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリアルは、非置換であってよく、またはフェニル、ヘテロアリアル、複素環、八口、シアノヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシ、アリアルオキシ、-SO<sub>2</sub> - R'、-NH SO<sub>2</sub> - R'、-NR'' SO<sub>2</sub> - R' もしくは SR' によって置換されていてもよく、ここで、R' および R'' は、独立に、フェニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルもしくは C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキルであり、R<sup>11</sup> および R<sup>12</sup> は、それぞれ独立に、H、ヒドロキシ、八口、シアノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルまたは C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> シクロアルキルであり、m および n は、独立に、0、1、2 または 3 である ]。

【請求項 10】

構造  
【化 8】



を有する請求項 6 に記載の化合物もしくは薬学的に許容できるその塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容できる塩の薬学的に許容できる溶媒和物 [ 式中、

$R^1$  は、H、シアノまたはハロであり、

$R^2$  および  $R^{2'}$  は、独立に、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルチオ、または  $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルであり、ここで、アルキル、アルコキシ、またはシクロアルキルは、1 つまたは複数のフッ素原子によって置換されていてもよく、

$R^{10}$  は、 $-NH SO_2 - R'$ 、 $-NR'' SO_2 - R'$  または  $SR'$  であり、ここで、 $R'$  および  $R''$  は、独立に、水素、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、フェニル、アミノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキルアミノ、ジ ( $C_1 \sim C_6$  アルキル) アミノ、複素環、 $-(CH_2)_n - W'$  であり、ここで、 $W'$  は、ヒドロキシ、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、フェニル、ナフチル、複素環、1 ~ 3 個の N および / または O 原子を含有する 5 員または 6 員のヘテロアリアルであり、ここで、前記アルキル、シクロアルキル、複素環、フェニル、ナフチルまたはヘテロアリアルそれぞれの非置換であってよく、またはフェニル、ヘテロアリアル、複素環、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、アリアルオキシ、 $-SO_2 - R'$ 、 $-NH SO_2 - R'$ 、 $-NR'' SO_2 - R'$  もしくは  $SR'$  によって置換されていてもよく、ここで、 $R'$  および  $R''$  は、独立に、フェニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキルもしくは  $C_3 \sim C_8$  シクロアルキルであり、 $n$  は、0、1、2 または 3 である ]。

【請求項 11】

$R^{10}$  が、 $-NR'' SO_2 - R'$  であり、 $R'$  および  $R''$  が、共に  $C_1 \sim C_6$  アルキルである、請求項 10 に記載の化合物 もしくは薬学的に許容できるその塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容できる塩の薬学的に許容できる溶媒和物。

【請求項 12】

4 - ( { 2 - [ エチル ( エチルスルホニル ) アミノ ] ベンジル } アミノ ) - 6 - [ 5 -





6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - 4 - ( { 5 - ヒドロキシ - 2 - [ メチル ( フェニルスルホニル ) - アミノ ] ベンジル } アミノ ) - N - メチル - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 3 - カルボキサミド ;

4 - ( { 2 - [ エチル ( フェニルスルホニル ) アミノ ] - 5 - ヒドロキシベンジル } アミノ ) - 6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - N - メチル - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 3 - カルボキサミド ;

6 - ( 2 - シクロプロピル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - N - メチル - 4 - ( { 2 - [ メチル ( メチルスルホニル ) アミノ ] - ベンジル } アミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 3 - カルボキサミド ;

6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - N - メチル - 4 - { [ ( 1 R ) - 1 - { 2 - [ メチル ( メチルスルホニル ) アミノ ] - フェニル } エチル ] アミノ } - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 3 - カルボキサミド ;

6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - N - メチル - 4 - { [ ( 1 S ) - 1 - { 2 - [ メチル ( メチルスルホニル ) - アミノ ] フェニル } エチル ] アミノ } - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 3 - カルボキサミド ;

6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 4 - ( { 2 - [ メチル ( フェニルスルホニル ) アミノ ] ベンジル } アミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 3 - カルボキサミド ;

6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - 4 - ( { 4 - ヒドロキシ - 2 - [ メチル ( メチルスルホニル ) - アミノ ] ベンジル } アミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 3 - カルボキサミド ;

6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - 4 - ( { 5 - ヒドロキシ - 2 - [ メチル ( フェニルスルホニル ) - アミノ ] ベンジル } アミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 3 - カルボキサミド ;

4 - ( { 2 - [ エチル ( フェニルスルホニル ) アミノ ] - 5 - ヒドロキシベンジル } アミノ ) - 6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 3 - カルボキサミド ;

6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - N - メチル - 4 - [ ( { 3 - [ メチル ( フェニルスルホニル ) - アミノ ] ピラジン - 2 - イル } メチル ) アミノ ] - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 3 - カルボキサミド ;

4 - [ ( { 3 - [ エチル ( メチルスルホニル ) アミノ ] ピラジン - 2 - イル } メチル ) アミノ ] - 6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - N - メチル - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 3 - カルボキサミド ;

N - エチル - 4 - [ ( { 3 - [ エチル ( メチルスルホニル ) アミノ ] ピラジン - 2 - イル } メチル ) アミノ ] - 6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 3 - カルボキサミド ;

6 - ( 2 - シクロプロピル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 4 - ( { 2 - [ メチル ( メチルスルホニル ) アミノ ] ベンジル } アミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 3 - カルボキサミド ;

6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - N - メチル - 4 - [ ( { 4 - [ メチル ( メチルスルホニル ) - アミノ ] ピリジン - 3 - イル } メチル ) アミノ ] - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 3 - カルボキサミド ;

6 - ( 2 - シクロプロピル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - N - メチル - 4 - [ ( { 2 - [ メチル ( メチルスルホニル ) アミノ ] - ピリジン - 3 - イル } メチル )

アミノ] - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 6 - [5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)フェニル] - 4 - ( { 5 - メトキシ - 2 - [メチル(メチルスルホニル) - アミノ]ベンジル } アミノ ) - N - メチル - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 6 - [5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)フェニル] - N - メチル - 4 - [ ( { 3 - [メチル(メチルスルホニル)アミノ]ピラジン - 2 - イル } メチル ) アミノ ] - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 4 - [ ( { 2 - [エチル(メチルスルホニル)アミノ]ピリジン - 3 - イル } メチル ) アミノ ] - 6 - [5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)フェニル] - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 6 - [5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)フェニル] - N - メチル - 4 - [ ( { 2 - [メチル(メチルスルホニル) - アミノ]ピリジン - 3 - イル } メチル ) アミノ ] - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 6 - [5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)フェニル] - 4 - ( { 5 - ヒドロキシ - 2 - [メチル(ピリジン - 3 - イルスルホニル)アミノ]ベンジル } アミノ ) - N - メチル - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 6 - [5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)フェニル] - N - メチル - 4 - [ ( { 3 - [メチル(メチルスルホニル) - アミノ]ピリジン - 2 - イル } メチル ) アミノ ] - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 6 - (2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル) - 4 - ( { 2 - [メチル(メチルスルホニル)アミノ]ベンジル } アミノ ) - N - (6 - メチルピリジン - 3 - イル) - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 6 - (5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)フェニル) - N - メチル - 4 - ( (1, 3, 3 - トリメチルウレイド)ベンジル) - アミノ ) - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 6 - (5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)フェニル) - N - メチル - 4 - ( (2 - (N - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - スルホンアミド)ベンジル)アミノ ) - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 4 - ( (2 - N, 1 - ジメチル - 1H - イミダゾール - 4 - スルホンアミド)ベンジル)アミド ) - 6 - (5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)フェニル) - N - メチル - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 6 - [5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)フェニル] - 4 - [ (2 - { [ (2 - メトキシエチル)スルホニル] - (メチル)アミノ } ベンジル)アミノ ] - N - メチル - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 6 - [5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)フェニル] - 4 - ( { 2 - [メチル(ピリジン - 3 - イルスルホニル)アミノ]ベンジル } アミノ ) - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 6 - [5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)フェニル] - 4 - [ ( { 2 - [メチル(メチルスルホニル)アミノ]ピリジン - 3 - イル } メチル ) アミノ ] - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン - 3 - カルボキサミド ;  
 4 - [ ( { 2 - [エチル(メチルスルホニル)アミノ]ピリジン - 3 - イル } メチル ) アミノ ] - 6 - [5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル)フェニル] - 1H - ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン - 3 - カルボキサミド ;

ル)フェニル]-N-メチル-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-カルボキサミド;

6-[5-フルオロ-4-ヒドロキシ-2-(2,2,2-トリフルオロエチル)フェニル]-N-メチル-4-{[2-(スルファモイルメチル)ベンジル]-アミノ}-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-カルボキサミド;

6-[5-フルオロ-4-ヒドロキシ-2-(2,2,2-トリフルオロエチル)フェニル]-4-{[2-(メチル{[6-(モルホリン-4-イル)ピリジン-3-イル]スルホニル}アミノ)ベンジル]アミノ}-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-カルボキサミド;

6-[5-フルオロ-4-ヒドロキシ-2-(2,2,2-トリフルオロエチル)フェニル]-4-{[2-(メチル{[3-(モルホリン-4-イル)プロピル]スルホニル}アミノ)ベンジル]アミノ}-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-カルボキサミド;

6-[5-フルオロ-4-ヒドロキシ-2-(2,2,2-トリフルオロエチル)フェニル]-N-メチル-4-[(5-メチル-2-[メチル(メチルスルホニル)アミノ]ピリジン-3-イル)メチル]アミノ]-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-カルボキサミド;

6-[5-フルオロ-4-ヒドロキシ-2-(2,2,2-トリフルオロエチル)フェニル]-N-メチル-4-({2-[メチル(ピリジン-3-イルスルホニル)アミノ]ベンジル}アミノ)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-カルボキサミド;

6-[5-フルオロ-4-ヒドロキシ-2-(2,2,2-トリフルオロエチル)フェニル]-N-メチル-4-[(2-{メチル[(6-メチルピリジン-3-イル)スルホニル]アミノ}ベンジル)アミノ]-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-カルボキサミド;

6-[5-フルオロ-4-ヒドロキシ-2-(2,2,2-トリフルオロエチル)フェニル]-4-[(2-{メチル[(6-メチルピリジン-3-イル)スルホニル]アミノ}ベンジル)アミノ]-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-カルボキサミド;

4-[(5-クロロ-2-[エチル(メチルスルホニル)アミノ]ピリジン-3-イル)メチル]アミノ]-6-[5-フルオロ-4-ヒドロキシ-2-(2,2,2-トリフルオロエチル)フェニル]-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-カルボキサミド;

4-[(5-クロロ-2-[メチル(メチルスルホニル)アミノ]ピリジン-3-イル)メチル]アミノ]-6-[5-フルオロ-4-ヒドロキシ-2-(2,2,2-トリフルオロエチル)フェニル]-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-カルボキサミド;

6-(2-エチル-5-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル)-N-メチル-4-({2-[メチル(スルファモイル)アミノ]ベンジル}アミノ)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-カルボキサミド;

6-(5-フルオロ-4-ヒドロキシ-2-(2,2,2-トリフルオロエチル)フェニル)-4-(N-(2-ヒドロキシエチル)スルファモイル)(メチル)-アミノベンジル)アミノ)-N-メチル-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-カルボキサミド;

6-[5-フルオロ-4-ヒドロキシ-2-(2,2,2-トリフルオロエチル)フェニル]-N-{6-[(2-ヒドロキシエチル)アミノ]ピリジン-3-イル}-4-({5-ヒドロキシ-2-[メチル(メチルスルホニル)アミノ]ベンジル}アミノ)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-カルボキサミド;

6-[5-フルオロ-4-ヒドロキシ-2-(2,2,2-トリフルオロエチル)フェニル]-4-({2-[メチル(メチルスルホニル)アミノ]ベンジル}アミノ)-N-(6-メチルピリジン-3-イル)-1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン-3-カルボキサミド;





ノ) - 6 - ( 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル )  
 フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;  
 4 - ( ( 2 - ( N - メチルフェニルスルホンアミド ) - 5 - ヒドロキシベンジル ) アミ  
 ノ ) - 6 - ( 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル )  
 フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;  
 6 - ( 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェ  
 ニル ) - N - メチル - 4 - ( ( 2 - ( メチル ( スルファモイル ) アミノ ) - ベンジル ) ア  
 ミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;  
 6 - ( 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェ  
 ニル ) - N - メチル - 4 - ( ( 2 - ( メチル ( N - メチルスルファモイル ) アミノ ) ベン  
 ジル ) アミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 3 - カルボキサミド ;  
 4 - [ 4 - ( 7 , 8 - ジメトキシ - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 2 ( 1 H ) - イル  
 ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 6 - イル ] - 3 - エチルフェノールホルメ  
 ート ;  
 3 - エチル - 4 - [ 4 - ( 3 - フェノキシアゼチジン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4  
 , 3 - c ] ピリジン - 6 - イル ] フェノールホルメート ;  
 3 - エチル - 4 - { 4 - [ 6 - ( 4 - メチル - 1 H - イミダゾール - 1 - イル ) - 3 ,  
 4 - ジヒドロイソキノリン - 2 ( 1 H ) - イル ] - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジ  
 ン - 6 - イル } フェノールホルメート ;  
 3 - エチル - 4 - { 4 - [ 6 - ( 2 - メトキシエトキシ ) - 3 , 4 - ジヒドロイソキノ  
 リン - 2 ( 1 H ) - イル ] - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 6 - イル } フェノ  
 ールホルメート ;  
 1 - [ 6 - ( 2 - エチル - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ]  
 ピリジン - 4 - イル ] - 3 - メチルアゼチジン - 3 - オールホルメート ;  
 2 - [ 6 - ( 2 - エチル - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ]  
 ピリジン - 4 - イル ] - N - [ 2 - ( ピロリジン - 1 - イル ) エチル ] - 1 , 2 , 3 , 4  
 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - スルホンアミドホルメート ;  
 N - ベンジル - 2 - [ 6 - ( 2 - エチル - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H - ピラゾロ  
 [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 5  
 - カルボキサミドホルメート ;  
 4 - { 4 - [ 7 - ( ベンジルオキシ ) - 6 - メトキシ - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン  
 - 2 ( 1 H ) - イル ] - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 6 - イル } - 3 - エチ  
 ルフェノールホルメート ;  
 4 - [ 4 - ( 5 - クロロ - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 2 ( 1 H ) - イル ) - 1 H  
 - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 6 - イル ] - 3 - エチルフェノールホルメート ;  
 4 - クロロ - 3 - ( { 1 - [ 6 - ( 2 - エチル - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H - ピ  
 ラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] アゼチジン - 3 - イル } オキシ ) ベンゾニ  
 リルホルメート ;  
 3 - エチル - 4 - [ 4 - ( 6 - フルオロ - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 2 ( 1 H )  
 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 6 - イル ] フェノールホルメート ;  
 3 - エチル - 4 - [ 4 - ( 8 - メトキシ - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 2 ( 1 H )  
 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 6 - イル ] フェノールホルメート ;  
 N - { 2 - [ 6 - ( 2 - エチル - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3  
 - c ] ピリジン - 4 - イル ] - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 5 - イル }  
 メタンスルホンアミドホルメート ;  
 4 - ( 4 - { [ 2 - ( ビフェニル - 4 - イル ) エチル ] アミノ } - 1 H - ピラゾロ [ 4  
 , 3 - c ] ピリジン - 6 - イル ) - 3 - エチルフェノールホルメート ;  
 N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4  
 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] アミノ } メチル ) フェニル ] - N - メチルメタンスルホ  
 ンアミド塩酸塩

1 - [ 6 - ( 2 - エチル - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ]  
ピリジン - 4 - イル ] - N , N - ジメチルピロリジン - 3 - スルホンアミド ( ラセミ体 )  
;

N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4  
, 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] アミノ } メチル ) - 3 - メチルフェニル ] - N - メチル  
メタンスルホンアミドジエチルアミン塩 ;

3 - エチル - 4 - [ 4 - ( 4 - メトキシピペリジン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4  
, 3 - c ] ピリジン - 6 - イル ] フェノールジエチルアミン塩 ;

N - [ 2 - ( { [ 2 - ( 3 , 4 - ジメトキシフェニル ) エチル ] [ 6 - ( 2 - エチル -  
5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4  
- イル ] アミノ } メチル ) フェニル ] - N - メチルメタンスルホンアミド塩酸塩

N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H  
- ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] ( 2 - { 4 - [ ( メチルスルホニル ) ア  
ミノ ] フェニル } エチル ) アミノ } メチル ) フェニル ] - N - メチルメタンスルホンアミ  
ド塩酸塩

N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H  
- ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] アミノ } メチル ) - フェニル ] - N - メ  
チルメタンスルホンアミド ;

N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H  
- ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] アミノ } メチル ) - 4 - メチルフェニル  
] - N - メチルメタンスルホンアミド塩酸塩

N - [ 4 - クロロ - 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェ  
ニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] アミノ } メチル ) フェニル  
] - N - メチルメタンスルホンアミド塩酸塩

N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H  
- ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] アミノ } メチル ) - 3 - フルオロフェニ  
ル ] - N - メチルメタンスルホンアミド塩酸塩

N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H  
- ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] アミノ } メチル ) - フェニル ] - N - メ  
チルメタンスルホンアミド塩酸塩

N - エチル - N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェ  
ニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] アミノ } - メチル ) フェニ  
ル ] エタンスルホンアミド塩酸塩

N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H  
- ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] アミノ } メチル ) フェニル ] - N - プロ  
ピルメタンスルホンアミド ;

N - エチル - N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェ  
ニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] アミノ } - メチル ) フェニ  
ル ] メタンスルホンアミド ;

N - ブチル - N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェ  
ニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] アミノ } - メチル ) フェニ  
ル ] メタンスルホンアミド ;

N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H  
- ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] [ 2 - ( モルホリン - 4 - イル ) エチル  
] アミノ } メチル ) フェニル ] - N - メチルメタンスルホンアミド ;

N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H  
- ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] [ 2 - ( モルホリン - 4 - イル ) エチル  
] アミノ } メチル ) フェニル ] - N - メチルメタンスルホンアミド ;

N - エチル - N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェ  
ニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] ( メチル ) - アミノ } メチ

ル) - 4 - メチルフェニル]メタンスルホンアミド;

N - [ 2 - ( { エチル [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] アミノ } メチル ) - 4 - メチルフェニル ] - N - メチルメタンスルホンアミド;

N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] ( プロピル ) アミノ } - メチル ) - 4 - メチルフェニル ] - N - メチルメタンスルホンアミド;

N - エチル - N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] ( メチル ) アミノ } メチル ) フェニル ] メタンスルホンアミド 塩酸塩

N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] ( メチル ) アミノ } - メチル ) フェニル ] - N - メチルメタンスルホンアミド 塩酸塩

N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] アミノ } メチル ) フェニル ] - N - ( 2 - ヒドロキシエチル ) メタンスルホンアミド;

N - { 2 - [ ( { 6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル } アミノ ) メチル ] フェニル } - N - メチルメタンスルホンアミド;

N - ( 2 - { [ { 6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル } ( メチル ) アミノ ] メチル } フェニル ) - N - メチルメタンスルホンアミド;

N - { 2 - [ ( { 6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル } アミノ ) メチル ] - 4 - メチルフェニル } - N - メチルメタンスルホンアミド;

4 - { 4 - [ ( シクロプロピルメチル ) アミノ ] - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イル } - 2 - フルオロ - 5 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェノール;

4 - { 4 - [ ( 2 - シクロプロピルエチル ) アミノ ] - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イル } - 2 - フルオロ - 5 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェノール;

2 - フルオロ - 4 - { 4 - [ ( 2 - メチルプロピル ) アミノ ] - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イル } - 5 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェノール;

4 - [ 4 - ( ブチルアミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イル ] - 2 - フルオロ - 5 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェノール;

N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 - イル ] アミノ } メチル ) - フェニル ] - N - メチルメタンスルホンアミド 塩酸塩

N - ( 2 - ( ( 6 - ( 2 - エチル - 4 - ヒドロキシ - 6 - メチルフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ) アミノ ) メチル ) - フェニル ) - N - メチルメタンスルホンアミド;

N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 3 - ( 1 H - イミダゾール - 2 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] アミノ } メチル ) フェニル ] - N - メチルメタンスルホンアミド;

N - [ 2 - ( { [ 3 - ( 4 , 5 - ジメチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル ) - 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] アミノ } メチル ) フェニル ] - N - メチルメタンスルホンアミド;

N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 3 - ( 4 - メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジ

ン - 4 - イル] アミノ) メチル) フェニル] - N - メチルメタンスルホンアミド ;

4 - [ 3 - ( 5 - ベンジル - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ) - 4 - { [ 2 - ( メチルスルファニル ) エチル ] - アミノ } - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 6 - イル ] - 2 - フルオロ - 5 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェノール ;

N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 3 - ( 1 H - ピラゾール - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] アミノ } メチル ) フェニル ] - N - メチルメタンスルホンアミド ;

N - { 2 - [ ( { 6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - 3 - ( 1 H - ピラゾール - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル } アミノ ) メチル ] フェニル } - N - メチルメタンスルホンアミド ;

N - { 2 - [ ( { 6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - 3 - ( 5 - メチル - 4 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル } アミノ ) メチル ] フェニル } - N - メチルメタンスルホンアミド ;

N - [ 2 - ( { [ 6 - ( 2 - エチル - 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル ) - 3 - ( 5 - メチル - 4 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル ] アミノ } メチル ) フェニル ] - N - メチルメタンスルホンアミド ;

N - { 2 - [ ( { 6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - 3 - [ 5 - ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) - 4 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - イル ] - 1 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 4 - イル } アミノ ) メチル ] フェニル } - N - メチルメタンスルホンアミド ;

4 - ( 5 - { 6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - 4 - ( { 5 - ヒドロキシ - 2 - [ メチル ( メチルスルホニル ) アミノ ] ベンジル } アミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 3 - イル } - 4 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - イル ) ピペリジン - 1 - カルボキサミド ;

N - ( 2 - { [ ( 6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - 3 - { 5 - [ 1 - ( ピロリジン - 1 - イルアセチル ) ピペリジン - 4 - イル ] - 4 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - イル } - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 - イル ) アミノ ] メチル } フェニル ) - N - メチルメタンスルホンアミド ;

N - { 2 - [ ( { 6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - 3 - ( 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 - イル } アミノ ) メチル ] - 4 - ヒドロキシフェニル } - N - メチルメタンスルホンアミド ;

N - { 2 - [ ( { 3 - ( 5 - アセチル - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ) - 6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 - イル } アミノ ) メチル ] - 4 - ヒドロキシフェニル } - N - メチルメタンスルホンアミド ;

N - [ 2 - ( ジメチルアミノ ) エチル ] - 2 - { 6 - [ 5 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - 2 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) フェニル ] - 4 - ( { 5 - ヒドロキシ - 2 - [ メチル ( メチルスルホニル ) アミノ ] ベンジル } アミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 3 - イル } - 1 , 4 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 5 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 5 - カルボキサミド ; および

4 - ( 3 - ( 5 - ベンジル - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ) - 4 - ( ( 3 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル ) - アミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) - 2 - フルオロ - 5 - ( 2 ,

2,2-トリフルオロエチル)フェノール

からなる群から選択される、化合物もしくは薬学的に許容できるその塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容できる塩の薬学的に許容できる溶媒和物。

【請求項13】

請求項1に記載の化合物もしくは薬学的に許容できるその塩、または前記化合物もしくは塩の薬学的に許容できる溶媒和物、および薬学的に許容できる添加剤を含む、医薬組成物。

【請求項14】

アレルギー性鼻炎、鼻閉、鼻漏、通年性鼻炎、鼻炎、あらゆるタイプの喘息、慢性閉塞性肺疾患、慢性もしくは急性気管支収縮、慢性気管支炎、末梢気道閉塞症、肺気腫、慢性好酸球性肺炎、成人呼吸窮迫症候群、他の薬物療法に続発する気道過敏性の増悪、肺血管疾患、肺動脈高血圧、急性肺傷害、気管支拡張症、副鼻腔炎、アレルギー性結膜炎、特発性肺線維症またはアトピー性皮膚炎から選択される疾患または状態を治療するための、請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項15】

炎症、神経炎症、関節炎、関節リウマチ、脊椎関節症、全身性エリテマトーデス、関節炎、変形性関節症、痛風性関節炎、疼痛、発熱、肺サルコイドーシス、珪肺症、心血管疾患、アテローム性動脈硬化症、心筋梗塞、血栓症、うっ血性心不全および心臓再かん流傷害、心筋症、脳卒中、虚血、再かん流傷害、脳浮腫、脳外傷、神経変性、肝疾患、炎症性腸疾患、クローン病、潰瘍性大腸炎、腎炎、網膜炎、網膜症、黄斑変性症、緑内障、糖尿病（1型および2型）、糖尿病性ニューロパチー、ウイルスおよび細菌感染症、筋肉痛、内毒素ショック、毒素ショック症候群、自己免疫疾患、骨粗鬆症、多発性硬化症、子宮内膜症、月経痛、膣炎、カンジダ症、がん、線維症、肥満、筋ジストロフィー、多発性筋炎、アルツハイマー病、皮膚潮紅、湿疹、乾癬、アトピー性皮膚炎および日焼けから選択される疾患または状態を治療するための、請求項13に記載の医薬組成物。