

【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】令和3年7月26日(2021.7.26)

【公表番号】特表2020-521775(P2020-521775A)
 【公表日】令和2年7月27日(2020.7.27)
 【年通号数】公開・登録公報2020-029
 【出願番号】特願2019-565535(P2019-565535)
 【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)
 C 0 7 D 519/00 (2006.01)
 A 6 1 K 31/444 (2006.01)
 A 6 1 K 31/437 (2006.01)
 A 6 1 K 31/497 (2006.01)
 A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
 A 6 1 K 31/541 (2006.01)
 A 6 1 K 31/496 (2006.01)
 A 6 1 K 31/5386 (2006.01)
 A 6 1 K 31/551 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4545 (2006.01)
 A 6 1 P 33/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 0 6 C
 C 0 7 D 471/04 C S P
 C 0 7 D 519/00 3 0 1
 C 0 7 D 519/00 3 1 1
 A 6 1 K 31/444
 A 6 1 K 31/437
 A 6 1 K 31/497
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 K 31/541
 A 6 1 K 31/496
 A 6 1 K 31/5386
 A 6 1 K 31/551
 A 6 1 K 31/4545
 A 6 1 P 33/02

【手続補正書】

【提出日】令和3年5月19日(2021.5.19)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

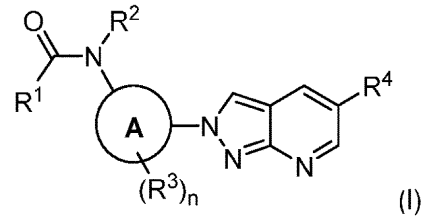
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



(式中、

環 A は、フェニル又はピリジニルであり；

R¹ は、以下のものから選択され；

(a) 非置換であるか、又はハロゲン及び C₃ - 6 シクロアルキルから独立して選択される 1 ~ 3 つの置換基で置換される C₁ - 6 アルキル；前記 C₃ - 6 シクロアルキルは、非置換であるか、又はハロゲン及び C₁ - 4 アルキルから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換され；

(b) 非置換であるか、又は C₁ - 4 ハロアルキルで置換される C₁ - 4 アルコキシ；

(c) -NR^{5a}R^{5b}、ここで、R^{5a} 及び R^{5b} は、独立して、水素、C₁ - 4 アルキル又は C₁ - 4 ハロアルキルであるか；又は R^{5a} 及び R^{5b} は、それらの両方が結合される窒素原子と一緒に、環原子として N、O 及び S から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含む 4 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルを形成し；

ここで、前記 4 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルは、非置換であるか、又はハロゲン、C₁ - 4 アルキル、及び C₁ - 4 アルコキシから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換され；又は前記 4 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルの同じ又は異なる環原子上の 2 つの置換基は、それらが結合される原子と一緒に、前記 4 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルに結合されたスピロ、架橋又は縮合環 B を形成し；

ここで、環 B は、C₃ - 6 シクロアルキル又は環原子として N、O 又は S から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含む 3 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルであり；

(d) 単環式 C₃ - 6 シクロアルキル、C₃ - 6 シクロアルケニル又はスピロペンチル；これはそれぞれ、非置換であるか、又はハロゲン、シアノ、C₁ - 4 アルキル、及び C₁ - 4 ハロアルキル、及び C₁ - 4 アルコキシから独立して選択される 1 ~ 3 つの置換基で置換され；

(e) フェニル又は環原子として N、O 及び S から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を含む 5 ~ 6 員ヘテロアリアル；これはそれぞれ、非置換であるか、又はハロゲン、シアノ、C₁ - 4 アルキル、C₁ - 4 ハロアルキル、ジ - C₁ - 4 アルキルアミノ - C₁ - 4 アルキル、C₁ - 4 アルコキシ C₁ - 4 アルキル、C₁ - 4 ヒドロキシアルキル、C₁ - 4 アルコキシ、及び C₃ - 6 シクロアルキルから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換され；

R² 及び R⁷ は、独立して、水素又は C₁ - 4 アルキルであり；

R³ は、水素又はハロゲンであり、n は、0 又は 1 であり；

R⁴ は、以下のものから選択され、

(a) 水素；

(b) ハロゲン；

(c) C₁ - 6 ハロアルキル又は非置換であるか、若しくは C₃ - 6 シクロアルキルで置換される C₁ - 6 アルキル；前記 C₃ - 6 シクロアルキルは、非置換であるか、又はハロゲン及び C₁ - 4 アルキルから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換され；

(d) -NR^{6a}R^{6b}、ここで、R^{6a} は、水素又は C₁ - 4 アルキルであり；R^{6b} は、水素、C₁ - 4 アルコキシカルボニル、C₁ - 4 ハロアルキル、C₃ - 6 シクロアルキル、又は非置換であるか、若しくは C₁ - 4 アルコキシで置換される C₁ - 4 アルキ

ルであり；又は

R^{6a} 及び R^{6b} は、それらの両方が結合される窒素原子と一緒に、環原子として N、O 及び S から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を含む 4 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルを形成し；

前記 4 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルは、非置換であるか、又はハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} アルコキシ C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、オキソ、1, 1 - ジオキソ、 $-C(O)-OR^7$ 又は N、O 及び S から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を含む 4 ~ 6 員ヘテロシクロアルキルから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換され；又は前記 4 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルの同じ又は異なる環原子上の 2 つの置換基は、それらが結合される原子と一緒に、前記 4 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルに結合されたスピロ、架橋又は縮合環 C を形成し；

ここで、環 C は、 C_{3-6} シクロアルキル、及び環原子として N、O 又は S から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含む 3 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルから選択され；非置換であるか、又はハロゲン、及びオキソから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換され；

(e) C_{3-6} シクロアルキル；

(f) 環原子として N、O 及び S から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を含み；非置換であるか、又は $-C(O)OR^8$ 、 $-C(O)R^8$ (ここで、 R^8 は、 C_{1-4} アルキル、及び非置換であるか、又は 1 ~ 2 つのハロ置換基で置換されるアリール C_{1-4} アルキルである) で置換される 4 員 ~ 6 員ヘテロシクロアルキル；及び

(g) 環原子として N、O 及び S から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を含み；非置換であるか、又はハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ヒドロキシアルキル、及び C_{3-6} シクロアルキルから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換される 5 員 ~ 6 員ヘテロアリール)

の化合物、又はその薬学的に許容可能な塩、若しくは立体異性体。

【請求項 2】

環 A がフェニルである、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

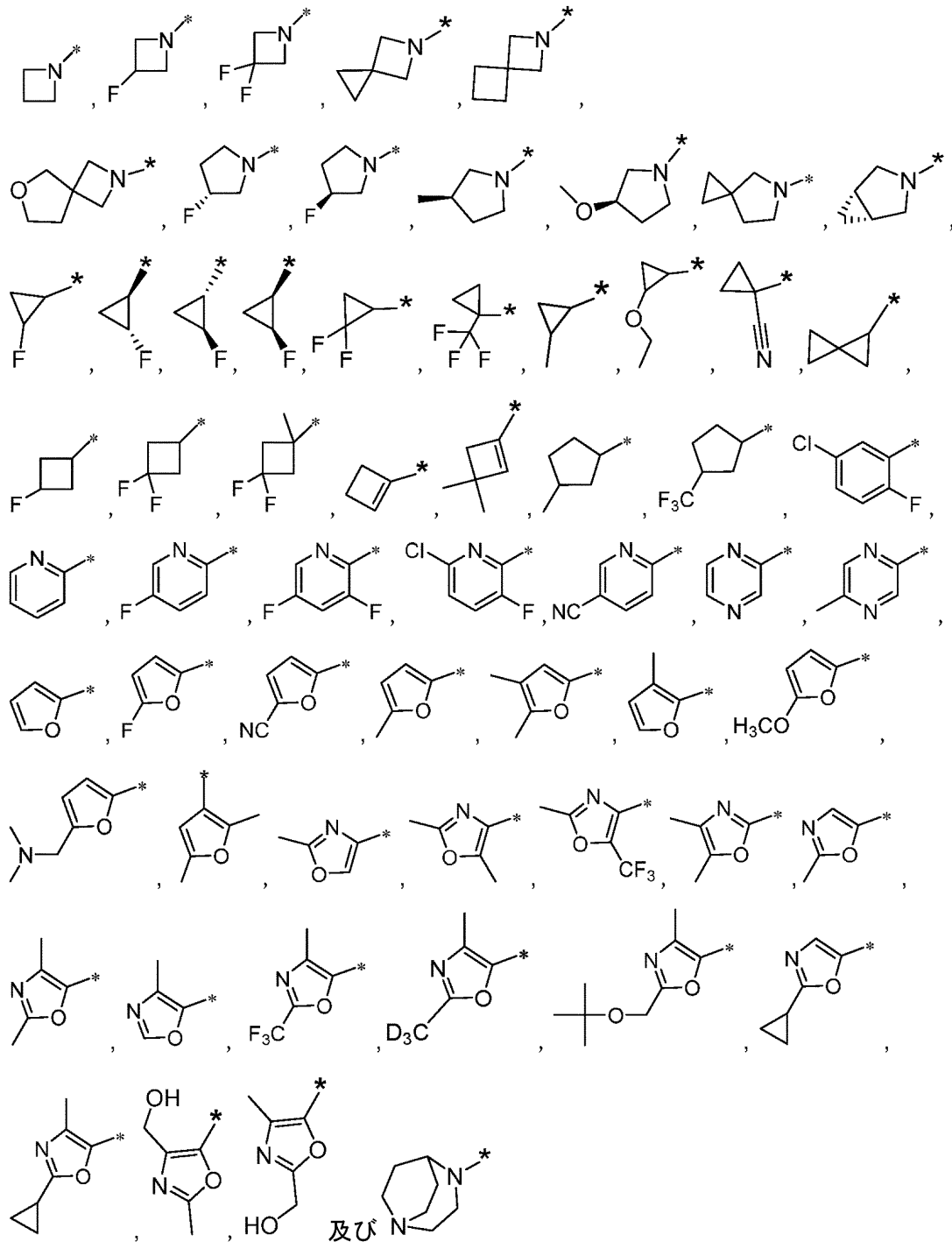
【請求項 3】

環 A がピリジニルである、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4】

R^1 は、 $-(CH_2)_{1-3}CF_3$ 、 $-(CH_2)-CH(CH_3)-CF_3$ 、 $-(CH_2)-C(CH_3)_3$ 、 $-O(CH_2)_2CF_3$ 、 $-(CH_2)_{0-2}$ -シクロプロピル、 $-(CH_2)_{0-2}$ -シクロブチル、 $-NHCH_3$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-N(CD_3)_2$ 、 $-N(CH_3)(CH_2CH_3)$ 、 $-N(CH_3)(CH_2CF_3)$ 、

【化 2】



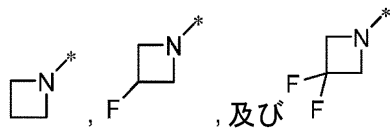
から選択される、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5】

R¹ は、非置換であるか、又はハロゲン及び C₁ ~ 4 アルキルから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換されるアゼチジニルであり；又は前記アゼチジニルの同じ環原子上の 2 つの置換基は、それらの両方が結合される環原子と一緒に、前記アゼチジニル環に結合されたスピロシクロプロピル又はスピロテトラヒドロフラニルを形成する、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6】

R¹ は、
【化 3】



から選択される、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 7】

R³ は八口であり、n は 1 である、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 8】

R³ はフルオロである、請求項 7 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 9】

R⁴ は、水素、クロロ、プロモ、メチル、イソ - プロピル、 $-(CH_2)_{1-2}CH(CH_3)_2$ 、 $-(CH_2)_{0-1}C(CH_3)_3$ 、 $-C(CH_3)_2CH_2CH_3$ 、 $-CH(CH_3)(CH_2)_{1-2}CH_3$ 、 $-CH_2$ -シクロブチル、 $-(CH_2)_{0-1}CF_3$ 、 $-NH-(CH_2)_{0-1}CH_3$ 、 $-N-(CD_3)_2$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-NH-CH-(CH_3)_2$ 、 $-NH-(CH_2)-CH-(CH_3)_2$ 、 $-NHC(O)OCH(CH_3)_2$ 、 $-NH(CH_2)_2OCH_3$ 、

から選択される、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 10】

R^4 は $-NR^{6a}R^{6b}$ であり；

R^{6a} は、水素又は C_{1-4} アルキルであり；

R^{6b} は、水素、 C_{1-4} アルコキシカルボニル又は非置換であるか、若しくは C_{1-4} アルコキシで置換される C_{1-4} アルキルであり；又は R^{6a} 及び R^{6b} は、それらの両方が結合される窒素原子と一緒に、環原子として N、O 及び S から独立して選択される 1 ~ 2 個のさらなるヘテロ原子を任意選択的に含む 4 員 ~ 6 員ヘテロシクロアルキルを形成し；

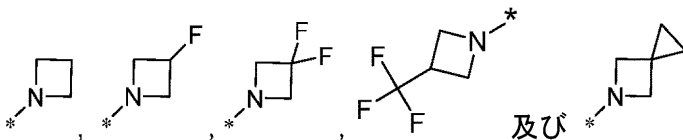
ここで、前記 4 員 ~ 6 員ヘテロシクロアルキルは、非置換であるか、又はハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} アルコキシ C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、及びオキソから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換され；又は前記 4 員 ~ 6 員ヘテロシクロアルキルの同じ又は異なる環原子上の 2 つの置換基は、それらが結合される原子と一緒に、前記 4 員 ~ 6 員ヘテロシクロアルキルに結合されたスピロ、架橋又は縮合環 C を形成し；

ここで、環 C は、 C_{3-6} シクロアルキル；及び環原子として N、O 又は S から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含む 3 員 ~ 5 員ヘテロシクロアルキルから選択され；環 C は、独立して、非置換であるか、又はハロゲン、及びオキソから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換される、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 11】

R^4 は、

【化 5】

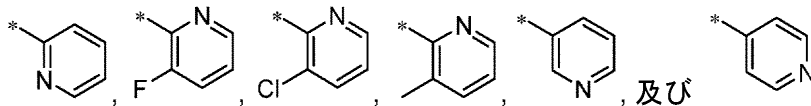


から選択される、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 12】

R^4 は、

【化 6】



から選択される、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 13】

下記 から選択される化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

1	N-{4-フルオロ-3-[5-(3-メチルピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
2	N-{4-フルオロ-3-[5-(3-メチルピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}フラン-2-カルボキサミド;
3	N-{4-フルオロ-3-[5-(3-メチルピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
4	(3R)-3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(3-メチルピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピロリジン-1-カルボキサミド;
5	3,3-ジフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(3-メチルピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
6	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(3-メチルピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
7	N-{4-フルオロ-3-[5-(2-メチルプロピル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
8	3,3-ジフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(2-メチルプロピル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
9	N-{3-[5-(ジメチルアミノ)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3,3-ジフルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
10	N-{3-[5-(アゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
11	5-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}フラン-2-カルボキサミド;
12	N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}シクロプロパンカルボキサミド;
13	2-シクロプロピル-N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アセトアミド;
14	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(2-メチルプロピル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
15	N-(3-[5-シクロプロピル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
16	N-{4-フルオロ-3-[5-(2-メチルプロピル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
17	N-(3-[5-シクロプロピル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
18	N-(3-[5-シクロペンチル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
19	N-(3-[5-シクロヘキシル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
20	N-(3-[5-シクロブチル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;

21	N-{3-[5-(2,2-ジメチルプロピル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
22	N-(3-{5-tert-ブチル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
23	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ペンタン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
24	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(2-メチルブタン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
25	N-{3-[5-(ブタン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
26	N-{3-[5-(シクロブチルメチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
27	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(3-メチルブチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
28	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
29	N-(3-{5-シクロプロピル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)-3,3-ジフルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
30	N-(3-{5-シクロペンチル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)-3,3-ジフルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
31	N-(3-{5-シクロブチル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)-3,3-ジフルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
32	N-{3-[5-(2,2-ジメチルプロピル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3,3-ジフルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
33	N-(3-{5-tert-ブチル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)-3,3-ジフルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
34	3,3-ジフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ペンタン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
35	3,3-ジフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(2-メチルブタン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
36	N-{3-[5-(ブタン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3,3-ジフルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
37	N-{3-[5-(シクロブチルメチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3,3-ジフルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
38	3,3-ジフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(3-メチルブチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
39	3,3-ジフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
40	N-{4-フルオロ-3-[5-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;

41	(3R)-3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(2-メチルプロピル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピロリジン-1-カルボキサミド;
42	(3R)-N-(3-{5-シクロプロピル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)-3-フルオロピロリジン-1-カルボキサミド;
43	(3R)-N-(3-{5-シクロペンチル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)-3-フルオロピロリジン-1-カルボキサミド;
44	(3R)-N-(3-{5-シクロヘキシル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)-3-フルオロピロリジン-1-カルボキサミド;
45	(3R)-N-(3-{5-シクロブチル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)-3-フルオロピロリジン-1-カルボキサミド;
46	(3R)-N-{3-[5-(2,2-ジメチルプロピル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロピロリジン-1-カルボキサミド;
47	(3R)-N-(3-{5-tert-ブチル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)-3-フルオロピロリジン-1-カルボキサミド;
48	(3R)-3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ペンタン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピロリジン-1-カルボキサミド;
49	(3R)-3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(2-メチルブタン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピロリジン-1-カルボキサミド;
50	(3R)-N-{3-[5-(ブタン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロピロリジン-1-カルボキサミド;
51	(3R)-N-{3-[5-(シクロブチルメチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロピロリジン-1-カルボキサミド;
52	(3R)-3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(3-メチルブチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピロリジン-1-カルボキサミド;
53	(3R)-3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピロリジン-1-カルボキサミド;
54	N-{4-フルオロ-3-[5-(2-メチルプロピル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}フラン-2-カルボキサミド;
55	N-(3-{5-シクロプロピル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)フラン-2-カルボキサミド;
56	N-(3-{5-シクロペンチル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)フラン-2-カルボキサミド;
57	N-(3-{5-シクロヘキシル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)フラン-2-カルボキサミド;
58	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
59	N-{3-[5-(2,2-ジメチルプロピル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}フラン-2-カルボキサミド;
60	N-{4-フルオロ-3-[5-(2-メチルブタン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}フラン-2-カルボキサミド;

61	N-{3-[5-(ブタン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}フラン-2-カルボキサミド;
62	N-{3-[5-(シクロブチルメチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}フラン-2-カルボキサミド;
63	N-{4-フルオロ-3-[5-(3-メチルブチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}フラン-2-カルボキサミド;
64	N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}フラン-2-カルボキサミド;
65	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-5-メチルピラジン-2-カルボキサミド;
66	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-3-メチルシクロペンタン-1-カルボキサミド;
67	5-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピリジン-2-カルボキサミド;
68	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-2-メチル-5-(トリフルオロメチル)-1,3-ジメチルオキサゾール-4-カルボキサミド;
69	2-シクロプロピル-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アセトアミド;
70	3,5-ジフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピリジン-2-カルボキサミド;
71	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-3-(トリフルオロメチル)シクロペンタン-1-カルボキサミド;
72	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-2,5-ジメチルフラン-3-カルボキサミド;
73	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-4-メチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
74	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-2,5-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-4-カルボキサミド;
75	2-シクロプロピル-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
76	2-シクロプロピル-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-4-メチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
78	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-4-メチル-2-(トリフルオロメチル)-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
79	2-[(tert-ブトキシ)メチル]-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-4-メチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
81	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-4,5-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-2-カルボキサミド;
82	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピリジン-2-カルボキサミド;

83	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-2-メチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
84	5-シアノ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピリジンe-2-カルボキサミド;
85	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-2-メチル-1,3-ジメチルオキサゾール-4-カルボキサミド;
86	6-クロロ-3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピリジンe-2-カルボキサミド;
87	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピラジン-2-カルボキサミド;
89	5-クロロ-2-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ベンズアミド;
90	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}シクロプロパンカルボキサミド;
91	N-(3-[5-シクロプロピル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
92	N-(3-[5-(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
93	N-(3-[5-シクロブチル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
94	N-(3-[5-(2,2-ジメチルプロピル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
95	N-{4-フルオロ-3-[5-(ペンタン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
96	N-(3-[5-(ブタン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
97	N-(3-[5-(シクロブチルメチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
98	N-{4-フルオロ-3-[5-(3-メチルブチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
99	N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
100	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
101	N-(3-[5-シクロブチル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
102	N-(3-[5-(2,2-ジメチルプロピル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
103	N-(3-[5-tert-ブチル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;

104	N-{4-フルオロ-3-[5-(2-メチルブタン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
105	N-{3-[5-(ブタン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
106	N-{3-[5-(シクロブチルメチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
107	N-{4-フルオロ-3-[5-(3-メチルブチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
108	N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
109	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-5-メチルフラン-2-カルボキサミド;
110	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-5-メトキシフラン-2-カルボキサミド;
111	5-[(ジメチルアミノ)メチル]-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}フラン-2-カルボキサミド;
112	5-シアノ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}フラン-2-カルボキサミド;
113	5-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}フラン-2-カルボキサミド;
114	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-4,5-ジメチルフラン-2-カルボキサミド;
115	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-3-メチルフラン-2-カルボキサミド;
117	3,3-ジフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-1-メチルシクロブタン-1-カルボキサミド;
118	3,3-ジフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}シクロブタン-1-カルボキサミド;
121	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}シクロブタン-1-カルボキサミド;
122	N-{4-フルオロ-3-[5-(モルホリン-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}フラン-2-カルボキサミド;
123	プロパン-2-イル N-{2-[2-フルオロ-5-(フラン-2-アミド)フェニル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル}カルバメート;
124	3,3-ジフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
125	N-(3-[5-プロモ-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)-3,3-ジフルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
126	N-(3-[5-プロモ-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;

127	(3R)-N-(3-{5-ブromo-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)-3-フルオロピロリジン-1-カルボキサミド;
128	N-(3-{5-ブromo-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
129	N-(3-{5-ブromo-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
130	N-(3-{5-ブromo-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)フラン-2-カルボキサミド;
131	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ピロリジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
132	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(モルホリン-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
133	(3R)-N-{3-[5-(ジメチルアミノ)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロピロリジン-1-カルボキサミド;
134	(3R)-3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ピロリジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピロリジン-1-カルボキサミド;
135	(3R)-3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(モルホリン-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピロリジン-1-カルボキサミド;
136	プロパン-2-イル N-[2-(2-フルオロ-5-[(3R)-3-フルオロピロリジン-1-カルボニル]アミノ)フェニル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル]カルバメート;
137	N-{4-フルオロ-3-[5-(モルホリン-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
138	プロパン-2-イル N-(2-{5-[(アゼチジン-1-カルボニル)アミノ]-2-フルオロフェニル}-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル)カルバメート;
139	N-{4-フルオロ-3-[5-(メチルアミノ)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}フラン-2-カルボキサミド;
140	N-{3-[5-(ジメチルアミノ)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}フラン-2-カルボキサミド;
141	N-{4-フルオロ-3-[5-(ピロリジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}フラン-2-カルボキサミド;
142	1-{4-フルオロ-3-[5-(メチルアミノ)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-3-メチル尿素;
143	1-{3-[5-(ジメチルアミノ)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3,3-ジメチル尿素;
144	N-{3-[5-(アゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3,3-ジフルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
145	3,3-ジフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(モルホリン-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
146	プロパン-2-イル N-(2-{5-[(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-カルボニル)アミノ]-2-フルオロフェニル}-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル)カルバメート;

147	N-{3-[5-(アゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
148	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(オキサン-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
149	(3R)-N-{3-[5-(アゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロピロリジン-1-カルボキサミド;
150	(3R)-3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(オキサン-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピロリジン-1-カルボキサミド;
151	N-{3-[5-(アゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}フラン-2-カルボキサミド;
152	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(2,2,2-トリフルオロエチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
153	N-{4-フルオロ-3-[5-(メチルアミノ)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
154	N-{3-[5-(ジメチルアミノ)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
155	N-{3-[5-(アゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
156	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
157	N-{4-フルオロ-3-[5-(ピロリジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
158	N-{4-フルオロ-3-[5-(モルホリン-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
159	プロパン-2-イル N-{2-[5-(ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-アミド)-2-フルオロフェニル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル}カルバメート;
160	N-{4-フルオロ-3-[5-(オキサン-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
161	3,3-ジフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ピロリジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
162	(3R)-3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(2,2,2-トリフルオロエチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピロリジン-1-カルボキサミド;
163	N-{4-フルオロ-3-[5-(ピロリジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
164	N-{4-フルオロ-3-[5-(2,2,2-トリフルオロエチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
165	3,3-ジフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(オキサン-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
166	3,3-ジフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(2,2,2-トリフルオロエチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;

167	N-{3-[5-(ジメチルアミノ)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
168	プロパン-2-イル N-(2-{2-フルオロ-5-[(3-フルオロアゼチジン-1-カルボニル)アミノ]フェニル}-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル)カルバメート;
169	N-{4-フルオロ-3-[5-(オキサン-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
170	N-{3-[5-(ジメチルアミノ)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
171	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-(5-{2-オキサ-6-アザスピロ[3.3]ヘプタン-6-イル}-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
172	3-フルオロ-N-(4-フルオロ-3-[5-[(1S,4S)-2-オキサ-5-アザビシクロ[2.2.1]ヘプタン-5-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
173	4,4,4-トリフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ブタンアミド;
174	3,3,3-トリフルオロプロピル N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}カルバメート;
175	N-{4-フルオロ-3-[5-(2,2,2-トリフルオロエチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
176	N-{4-フルオロ-3-[5-(2,2,2-トリフルオロエチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}フラン-2-カルボキサミド;
177	N-(3-[5-[(2S,6S)-2,6-ジメチルモルホリン-4-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
178	N-{3-[5-(1,1-ジオキソ-1,4-チオモルホリン-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
179	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-[5-(4-メチルピペラジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
180	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-(5-{5H,6H,7H,8H-イミダゾール[1,2-a]ピラジン-7-イル}-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
181	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
182	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
183	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-(5-{2-オキサ-6-アザスピロ[3.4]オクタン-6-イル}-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
184	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-(5-{8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル}-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
185	3-フルオロ-N-(4-フルオロ-3-[5-[(2-メトキシエチル)アミノ]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
186	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-(5-{5H,6H,7H,8H-[1,2,4]トリ azolo[4,3-a]ピラジン-7-イル}-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;

187	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(3-フルオロピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
188	N-{3-[5-(3-クロロピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
189	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-3-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
190	N-(3-[5-[(2R,6S)-2,6-ジメチルモルホリン-4-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
191	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-(5-[6-オキサ-1-アザスピロ[3.3]ヘプタン-1-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
192	3-フルオロ-N-(4-フルオロ-3-[5-[3-(メトキシメチル)アゼチジン-1-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
193	N-[3-(5-[5-アザスピロ[2.3]ヘキサン-5-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)-4-フルオロフェニル]-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
194	N-(3-[5-[(3R,4R)-3,4-ジフルオロピロリジン-1-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
195	(3R)-3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピロリジン-1-カルボキサミド;
196	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}フラン-2-カルボキサミド;
197	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-(5-[2-オキサ-5-アザビシクロ[2.2.2]オクタン-5-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
198	3-フルオロ-N-(4-フルオロ-3-[5-[(2-メチルプロピル)アミノ]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
199	N-{3-[5-(エチルアミノ)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
200	3-フルオロ-N-(4-フルオロ-3-[5-[(プロパン-2-イル)アミノ]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
201	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-(5-[1-オキサ-6-アザスピロ[3.3]ヘプタン-6-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
202	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-(5-[6-オキサ-2-アザスピロ[3.4]オクタン-2-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
203	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-(5-[7-オキサ-2-アザスピロ[3.5]ノナン-2-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
204	N-[3-(5-[6,6-ジフルオロ-3-アザビシクロ[3.1.0]ヘキサン-3-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)-4-フルオロフェニル]-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
205	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(3-メトキシアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
206	5-シアノ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}フラン-2-カルボキサミド;

207	2-エトキシ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}シクロプロパン-1-カルボキサミド;
208	2,2-ジフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}シクロプロパン-1-カルボキサミド;
209	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-1-(トリフルオロメチル)シクロプロパン-1-カルボキサミド;
210	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}シクロブタンカルボキサミド;
211	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-2-メチルシクロプロパン-1-カルボキサミド;
212	3,3,3-トリフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}プロパンアミド;
213	4,4,4-トリフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-3-メチルブタンアミド;
214	5,5,5-トリフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ペンタンアミド;
215	3-シクロプロピル-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}プロパンアミド;
216	2-シクロブチル-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アセトアミド;
217	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-3,3-ジメチルブタンアミド;
218	N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}シクロブタ-1-エン-1-カルボキサミド;
219	1-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-3,3-ビス(² H ₃)メチル尿素;
220	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-5-アザスピロ[2.4]ヘプタン e-5-カルボキサミド;
221	(3R)-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-3-メチルピロリジン-1-カルボキサミド;
222	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-5-アザスピロ[2.3]ヘキサン e-5-カルボキサミド;
223	(1R,5S)-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-3-アザビシクロ[3.1.0]ヘキサン e-3-カルボキサミド;
224	3-エチル-1-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-3-メチル尿素;
225	(3R)-N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-3-メトキシピロリジン-1-カルボキサミド;
226	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-2-アザスピロ[3.3]ヘプタン e-2-カルボキサミド;

227	1-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-3-メチル-3-(2,2,2-トリフルオロエチル)尿素;
228	1-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-3,3-ジメチル尿素;
229	N-{4-フルオロ-3-[5-(プロパン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-1,4-ジアザビシクロ[3.2.2]ノナン-4-カルボキサミド;
230	N-(3-[5-[(2R,6S)-2,6-ジメチルモルホリン-4-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
231	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-(5-[6-オキサ-1-アザスピロ[3.3]ヘプタン-1-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
232	3-フルオロ-N-(4-フルオロ-3-[5-[3-(メトキシメチル)アゼチジン-1-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
233	N-[3-(5-[5-アザスピロ[2.3]ヘキサン-5-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)-4-フルオロフェニル]-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
234	N-(3-[5-[(3R,4R)-3,4-ジフルオロピロリジン-1-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
235	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-(5-[3-オキサ-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
236	1-(2-[2-フルオロ-5-[(3-フルオロアゼチジン-1-カルボニル)アミノ]フェニル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル)ピペリジン-4-カルボン酸;
237	3-フルオロ-N-(4-フルオロ-3-[5-[4-(2,2,2-トリフルオロエチル)ピペラジン-1-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
238	3-フルオロ-N-(4-フルオロ-3-[5-[4-(オキセタン-3-イル)ピペリジン-1-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
239	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-(5-[2-チア-6-アザスピロ[3.3]ヘプタン-6-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
240	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-(5-[6-オキサ-3-アザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
241	N-[3-(5-[5-アザスピロ[2.4]ヘプタン-5-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)-4-フルオロフェニル]-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
242	N-[3-(5-[5-アザスピロ[2.4]ヘプタン-5-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)-4-フルオロフェニル]-5-アザスピロ[2.4]ヘプタン-5-カルボキサミド;
243	N-[3-(5-[2-アザスピロ[3.3]ヘプタン-2-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)-4-フルオロフェニル]-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
244	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-(5-[8-オキサ-2-アザスピロ[4.5]デカン-2-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
245	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-(5-[6-オキソ-2,5-ジアザスピロ[3.4]オクタン-2-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
246	N-[4-フルオロ-3-(5-[6-オキサ-2-アザスピロ[3.4]オクタン-2-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]-6-オキサ-2-アザスピロ[3.4]オクタン-2-カルボキサミド;

247	tert-ブチル 2-(2-{5-[(アゼチジン-1-カルボニル)アミノ]-2-フルオロフェニル}-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-5-イル)ピロリジン-1-カルボキシレート;
248	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-(5-{2-オキサ-7-アザスピロ[3.5]ノナン-7-イル}-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
249	N-{3-[5-(シクロプロピルアミノ)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
250	N-(4-フルオロ-3-{5-[4-(2,2,2-トリフルオロエチル)ピペラジン-1-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}フェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
251	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(3-ヒドロキシ-3-メチルアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
252	3,3-ジフルオロ-N-(4-フルオロ-3-[5-[4-(2,2,2-トリフルオロエチル)ピペラジン-1-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}フェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
253	(3R)-3-フルオロ-N-(4-フルオロ-3-[5-[4-(2,2,2-トリフルオロエチル)ピペラジン-1-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}フェニル)ピロリジン-1-カルボキサミド;
254	N-(3-[5-ブromo-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)-5-アザスピロ[2.3]ヘキサン e-5-カルボキサミド;
255	N-{3-[5-(3,3-ジメチルアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
256	(1S,2R)-2-フルオロ-N-(4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)シクロプロパン-1-カルボキサミド;
257	N-[3-(5-[5-アザスピロ[2.3]ヘキサン-5-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)-4-フルオロフェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
258	N-[3-(5-[5-アザスピロ[2.3]ヘキサン-5-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)-4-フルオロフェニル]-3,3-ジフルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
259	(3R)-N-[3-(5-[5-アザスピロ[2.3]ヘキサン-5-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)-4-フルオロフェニル]-3-フルオロピロリジン-1-カルボキサミド;
260	N-(3-[5-(ジメチルアミノ)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)-5-アザスピロ[2.3]ヘキサン e-5-カルボキサミド;
261	N-[3-(5-[1,1-ジフルオロ-5-アザスピロ[2.3]ヘキサン-5-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)-4-フルオロフェニル]-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
262	N-{3-[5-(3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
263	3-フルオロ-N-[4-フルオロ-3-(5-{3-オキサ-6-アザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-6-イル}-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
264	N-{3-[5-(アゼチジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
265	3-フルオロ-N-(4-フルオロ-3-[5-[3-(トリフルオロメチル)アゼチジン-1-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}フェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
266	N-{3-[5-(3-シアノアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;

267	N-{3-[5-(1-acet イルアゼチジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
268	(1S,2R)-N-{3-[5-(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-2-フルオロシクロプロパン-1-カルボキサミド;
269	(1R,2S)-2-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}シクロプロパン-1-カルボキサミド;
270	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ピペラジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
271	(1R,2S)-N-{3-[5-(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-2-フルオロシクロプロパン-1-カルボキサミド;
272	(1R,2S)-N-{3-[5-(5-アザスピロ[2.3]ヘキサン-5-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)-4-フルオロフェニル}-2-フルオロシクロプロパン-1-カルボキサミド;
273	(1S,2R)-2-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}シクロプロパン-1-カルボキサミド;
274	N-(4-フルオロ-3-[5-[3-(トリフルオロメチル)アゼチジン-1-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
275	(3R)-3-フルオロ-N-(4-フルオロ-3-[5-[3-(トリフルオロメチル)アゼチジン-1-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)ピロリジン-1-カルボキサミド;
276	N-(3-[5-クロロ-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
277	N-(4-フルオロ-3-[5-(3-メチルピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)-4-(ヒドロキシメチル)-2-メチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
278	N-(4-フルオロ-3-[5-(3-メチルピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)-2-(² H ₃)メチル-4-メチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
279	N-(4-フルオロ-3-[5-[3-(トリフルオロメチル)アゼチジン-1-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
280	N-{2-[5-(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]ピリジン-4-イル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
281	3,3-ジフルオロ-N-{2-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]ピリジン-4-イル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
282	N-[2-(5-[5-アザスピロ[2.3]ヘキサン-5-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)ピリジン-4-イル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
283	N-(4-クロロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
284	N-(4-クロロ-3-[5-(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
285	N-(4-クロロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
286	N-[3-(5-[5-アザスピロ[2.3]ヘキサン-5-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)-4-クロロフェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;

287	N-[3-(5-{5-アザスピロ[2.3]ヘキサン-5-イル}-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド;
288	N-{4-フルオロ-3-[5-(オキサン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
289	N-{3-[5-(1,4-ジオキサン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
290	N-{3-[5-(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
291	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
292	N-{4-フルオロ-3-[5-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
293	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ピペリジン-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
294	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ピラジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
295	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(1H-イミダゾール-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
296	N-{3-[5-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
297	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(1H-ピラゾール-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
298	N-{3-[5-(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
299	N-{3-[5-(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3,3-ジフルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
300	(3R)-N-{3-[5-(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロピロリジン-1-カルボキサミド;
301	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(1-メチル-1H-イミダゾール-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
302	(3R)-3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピロリジン-1-カルボキサミド;
303	3,3-ジフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
304	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
305	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-{1-[(4-フルオロフェニル)メチル]ピペリジン-4-イル}-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
306	N-(3-[5-{ビス(²H₃)メチルアミノ}-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;

307	N-(3-{5-[ビス(² H ₃)メチルアミノ]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)-3,3-ジフルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
308	(3R)-N-(3-{5-[ビス(² H ₃)メチルアミノ]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)-3-フルオロピロリジン-1-カルボキサミド;
309	3,3-ジフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(3-フルオロピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
310	N-{3-[5-(3-クロロピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3,3-ジフルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
311	3-フルオロ-N-(4-フルオロ-3-[2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
312	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(3-メチルピラジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
313	N-{4-フルオロ-3-[5-(3-フルオロピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
314	N-(3-{5-[ビス(² H ₃)メチルアミノ]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}-4-フルオロフェニル)-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
315	N-{3-[5-(3-クロロピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
316	(3R)-N-{3-[5-(3-クロロピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロピロリジン-1-カルボキサミド;
317	(3R)-3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(3-フルオロピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピロリジン-1-カルボキサミド;
318	3-フルオロ-N-(4-フルオロ-3-[5-メチル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド;
319	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(1H-ピラゾール-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
320	N-{4-フルオロ-3-[5-(トリフルオロメチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
321	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(トリフルオロメチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
322	(3R)-3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(トリフルオロメチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピロリジン-1-カルボキサミド;
323	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(1H-イミダゾール-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
324	3,3-ジフルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(トリフルオロメチル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
325	N-{3-[5-(1-シクロプロピル-1H-ピラゾール-4-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;
326	N-{3-[5-(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}シクロプロパンカルボキサミド;

327	N-{4-フルオロ-3-[5-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}シクロプロパンカルボキサミド;
328	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(4-メチル-1H-イミダゾール-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
329	3-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(5-フルオロピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
330	N-{4-フルオロ-3-[5-(5-フルオロピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
331	N-{3-[5-(ジメチルアミノ)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}シクロプロパンカルボキサミド;
332	N-{4-フルオロ-3-[5-(3-フルオロピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}シクロプロパンカルボキサミド;
333	N-{3-[5-(3-クロロピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}シクロプロパンカルボキサミド;
334	N-{4-フルオロ-3-[5-(3-メチルピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-2-(ヒドロキシメチル)-4-メチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
335	N-(4-フルオロ-3-[5-(3-(ヒドロキシメチル)ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル)-2,4-ジメチル-1,3-ジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド;
336	N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピロリジン-1-カルボキサミド;
337	N-{3-[5-(5-アザスピロ[2.3]ヘキサン-5-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}ピロリジン-1-カルボキサミド;
338	N-{3-[5-(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}ピロリジン-1-カルボキサミド;
339	(1R,2S)-N-{3-[5-(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]-4-フルオロフェニル}-2-フルオロシクロプロパン-1-カルボキサミド;
340	(3R)-N-(2-[5-プロモ-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]ピリジン-4-イル)-3-フルオロピロリジン-1-カルボキサミド;
341	N-{2-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]ピリジン-4-イル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
342	3-フルオロ-N-{2-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]ピリジン-4-イル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
343	N-{3-[5-(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
344	N-{3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}アゼチジン-1-カルボキサミド;
345	N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}ピラジン-2-カルボキサミド;

346	N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}スピロ[2.2]ペンタン-1-カルボキサミド;
347	N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-3,3-ジメチルシクロブタン-1-エン-1-カルボキサミド;
348	1-シアノ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}シクロプロパン-1-カルボキサミド;
349	(1S,2S)-2-フルオロ-N-{4-フルオロ-3-[5-(ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}シクロプロパン-1-カルボキサミド;
350	N-{4-フルオロ-3-[5-(3-メチルピリジン-2-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]フェニル}-3,3-ジメチルシクロブタン-1-エン-1-カルボキサミド;
351	N-(4-フルオロ-3-(5-イソプロピル-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)フェニル)-2,4-ジメチルジメチルオキサゾール-5-カルボキサミド.

【請求項 1 4】

前記化合物が、

N-(3-(5-プロモ-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)-4-フルオロフェニル)-3-フルオロアゼチジン-1-カルボキサミド;

N-(3-(5-プロモ-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)-4-フルオロフェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド; 及び

3-(2-(5-プロモ-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)ピリジン-4-イル)-1,1-ジメチル尿素

から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

前記化合物が、3-フルオロ-N-(4-フルオロ-3-{5-[3-(トリフルオロメチル)アゼチジン-1-イル]-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル}フェニル)アゼチジン-1-カルボキサミド又はその薬学的に許容可能な塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 6】

前記化合物が、N-[3-(5-{5-アザスピロ[2.3]ヘキサン-5-イル}-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル)-4-フルオロフェニル]アゼチジン-1-カルボキサミド又はその薬学的に許容可能な塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 7】

前記化合物が、N-{2-[5-(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-2H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン-2-イル]ピリジン-4-イル}アゼチジン-1-カルボキサミド又はその薬学的に許容可能な塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 8】

請求項 1 ~ 1 7 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩と、少なくとも 1 つの賦形剤とを含む医薬組成物。

【請求項 1 9】

請求項 1 ~ 1 7 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩と、1 つ又は複数の治療効果のある薬剤とを含む組み合わせ。

【請求項 2 0】

リーシュマニア症、シャーガス病及びヒトアフリカトリパノソーマ症から選択される障害又は疾患の治療のための薬剤の製造における、請求項 1 ~ 1 7 のいずれか一項に記載の化合物と、任意に第 2 の薬剤とを組み合わせた使用。

【請求項 2 1】

前記疾患は、内臓リーシュマニア症及び皮膚リーシュマニア症から選択されるリーシュマニア症であり、任意に第 2 の薬剤と組み合わせられ、前記第 2 の薬剤は、スチボグルコネート、アンチモン酸メグルミン、アムホテリシン、ミルテホシン、及びパロモマイシ

ンから選択される、請求項 20 に記載の使用。

【請求項 22】

前記疾患は、シャーガス病であり、

任意に第 2 の薬剤と組み合わせられ、前記第 2 の薬剤は、ベンズニダゾール、ニフルチモックス及びアムホテリシンから選択される、請求項 20 に記載の使用。

【請求項 23】

前記疾患は、ヒトアフリカトリパノソーマ症であり、

任意に第 2 の薬剤と組み合わせられ、前記第 2 の薬剤は、ペンタミジン、スラミン、メラルソプロール、エフロルニチン、及びニフルチモックスである、請求項 20 に記載の使用。

【請求項 24】

シャーガス病の治療に用いるための、請求項 15 に記載の化合物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0363

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0363】

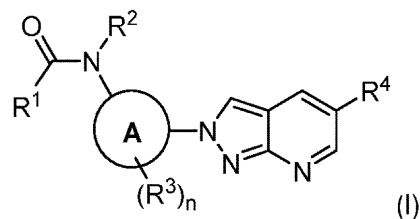
本明細書に記載される実施例及び実施形態が、例示のためのものに過ぎず、それを考慮して、様々な変更又は変形が、当業者に示唆され、本出願の趣旨及び範囲並びに添付の特許請求の範囲に含まれるべきであることが理解される。本明細書に引用される全ての刊行物、特許、及び特許出願は、あらゆる目的のために参照により本明細書に援用される。

本発明は、以下の態様を含む。

< 1 >

式 (I) :

【化 1】



(式中、

環 A は、フェニル又はピリジニルであり；

R¹ は、以下のものから選択され；

(a) 非置換であるか、又はハロゲン及び C₃ - 6 シクロアルキルから独立して選択される 1 ~ 3 つの置換基で置換される C₁ - 6 アルキル；前記 C₃ - 6 シクロアルキルは、非置換であるか、又はハロゲン及び C₁ - 4 アルキルから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換され；

(b) 非置換であるか、又は C₁ - 4 ハロアルキルで置換される C₁ - 4 アルコキシ；

(c) -NR^{5a}R^{5b}、ここで、R^{5a} 及び R^{5b} は、独立して、水素、C₁ - 4 アルキル又は C₁ - 4 ハロアルキルであるか；又は R^{5a} 及び R^{5b} は、それらの両方が結合される窒素原子と一緒に、環原子として N、O 及び S から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含む 4 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルを形成し；

ここで、前記 4 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルは、非置換であるか、又はハロゲン、C

1 ~ 4 アルキル、及び C₁ ~ 4 アルコキシから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換され；又は前記 4 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルの同じ又は異なる環原子上の 2 つの置換基は、それらが結合される原子と一緒に、前記 4 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルに結合されたスピロ、架橋又は縮合環 B を形成し；

ここで、環 B は、C₃ ~ 6 シクロアルキル又は環原子として N、O 又は S から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含む 3 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルであり；

(d) 単環式 C₃ ~ 6 シクロアルキル、C₃ ~ 6 シクロアルケニル又はスピロペンチル；これはそれぞれ、非置換であるか、又はハロゲン、シアノ、C₁ ~ 4 アルキル、及び C₁ ~ 4 ハロアルキル、及び C₁ ~ 4 アルコキシから独立して選択される 1 ~ 3 つの置換基で置換され；

(e) フェニル又は環原子として N、O 及び S から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を含む 5 ~ 6 員ヘテロアリール；これはそれぞれ、非置換であるか、又はハロゲン、シアノ、C₁ ~ 4 アルキル、C₁ ~ 4 ハロアルキル、ジ - C₁ ~ 4 アルキルアミノ - C₁ ~ 4 アルキル、C₁ ~ 4 アルコキシ C₁ ~ 4 アルキル、C₁ ~ 4 ヒドロキシアルキル、C₁ ~ 4 アルコキシ、及び C₃ ~ 6 シクロアルキルから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換され；

R² 及び R⁷ は、独立して、水素又は C₁ ~ 4 アルキルであり；

R³ は、水素又はハロゲンであり、n は、0 又は 1 であり；

R⁴ は、以下のものから選択され、

(a) 水素；

(b) ハロゲン；

(c) C₁ ~ 6 ハロアルキル又は非置換であるか、若しくは C₃ ~ 6 シクロアルキルで置換される C₁ ~ 6 アルキル；前記 C₃ ~ 6 シクロアルキルは、非置換であるか、又はハロゲン及び C₁ ~ 4 アルキルから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換され；

(d) - NR^{6a} R^{6b}、ここで、R^{6a} は、水素又は C₁ ~ 4 アルキルであり；R^{6b} は、水素、C₁ ~ 4 アルコキシカルボニル、C₁ ~ 4 ハロアルキル、C₃ ~ 6 シクロアルキル、又は非置換であるか、若しくは C₁ ~ 4 アルコキシで置換される C₁ ~ 4 アルキルであり；又は

R^{6a} 及び R^{6b} は、それらの両方が結合される窒素原子と一緒に、環原子として N、O 及び S から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を含む 4 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルを形成し；

前記 4 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルは、非置換であるか、又はハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C₁ ~ 4 アルキル、C₁ ~ 4 ハロアルキル、C₁ ~ 4 アルコキシ C₁ ~ 4 アルキル、C₁ ~ 4 アルコキシ、オキソ、1, 1 - ジオキソ、- C(O) - OR⁷ 又は N、O 及び S から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を含む 4 ~ 6 員ヘテロシクロアルキルから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換され；又は前記 4 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルの同じ又は異なる環原子上の 2 つの置換基は、それらが結合される原子と一緒に、前記 4 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルに結合されたスピロ、架橋又は縮合環 C を形成し；

ここで、環 C は、C₃ ~ 6 シクロアルキル、及び環原子として N、O 又は S から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含む 3 員 ~ 7 員ヘテロシクロアルキルから選択され；非置換であるか、又はハロゲン、及びオキソから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換され；

(e) C₃ ~ 6 シクロアルキル；

(f) 環原子として N、O 及び S から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を含み；非置換であるか、又は - C(O)OR⁸、- C(O)R⁸ (ここで、R⁸ は、C₁ ~ 4 アルキル、及び非置換であるか、又は 1 ~ 2 つのハロ置換基で置換されるアリール C₁ ~ 4 アルキルである) で置換される 4 員 ~ 6 員ヘテロシクロアルキル；及び

(g) 環原子として N、O 及び S から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を含み；非置換であるか、又はハロゲン、C₁ ~ 4 アルキル、C₁ ~ 4 ヒドロキシアルキル、及

び $C_3 \sim 6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換される 5 員 ~ 6 員ヘテロアリール) の化合物、又はその薬学的に許容可能な塩、若しくは立体異性体。

< 2 >

環 A がフェニルである、< 1 > に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

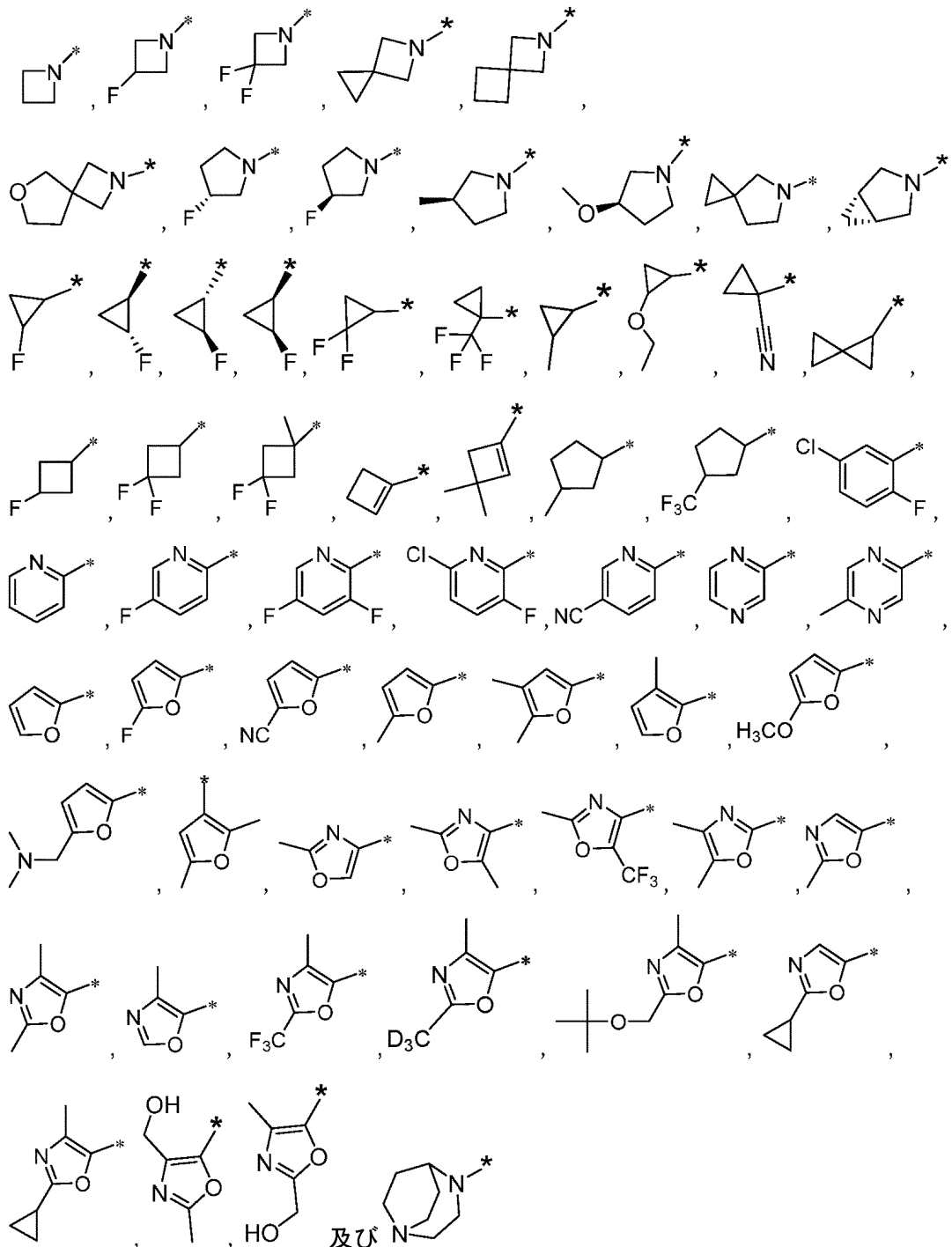
< 3 >

環 A がピリジニルである、< 1 > に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

< 4 >

R^1 は、 $-(CH_2)_{1 \sim 3}CF_3$ 、 $-(CH_2)-CH(CH_3)-CF_3$ 、 $-(CH_2)-C(CH_3)_3$ 、 $-O(CH_2)_2CF_3$ 、 $-(CH_2)_{0 \sim 2}$ -シクロプロピル、 $-(CH_2)_{0 \sim 2}$ -シクロブチル、 $-NHCH_3$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $-N(CD_3)_2$ 、 $-N(CH_3)(CH_2CH_3)$ 、 $-N(CH_3)(CH_2CF_3)$ 、

【化 2】



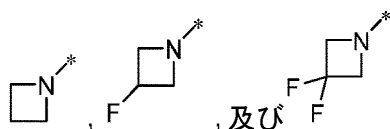
から選択される、< 1 > ~ < 3 > のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

< 5 >

R¹ は、非置換であるか、又はハロゲン及び C₁ ~ C₄ アルキルから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換されるアゼチジニルであり；又は前記アゼチジニルの同じ環原子上の 2 つの置換基は、それらの両方が結合される環原子と一緒に、前記アゼチジニル環に結合されたスピロシクロプロピル又はスピロテトラヒドロフランルを形成する、< 1 > ~ < 3 > のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

< 6 >

R¹ は、
【化 3】



から選択される、< 1 > ~ < 3 > のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

< 7 >

R³ は八員環であり、n は 1 である、< 1 > ~ < 6 > のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

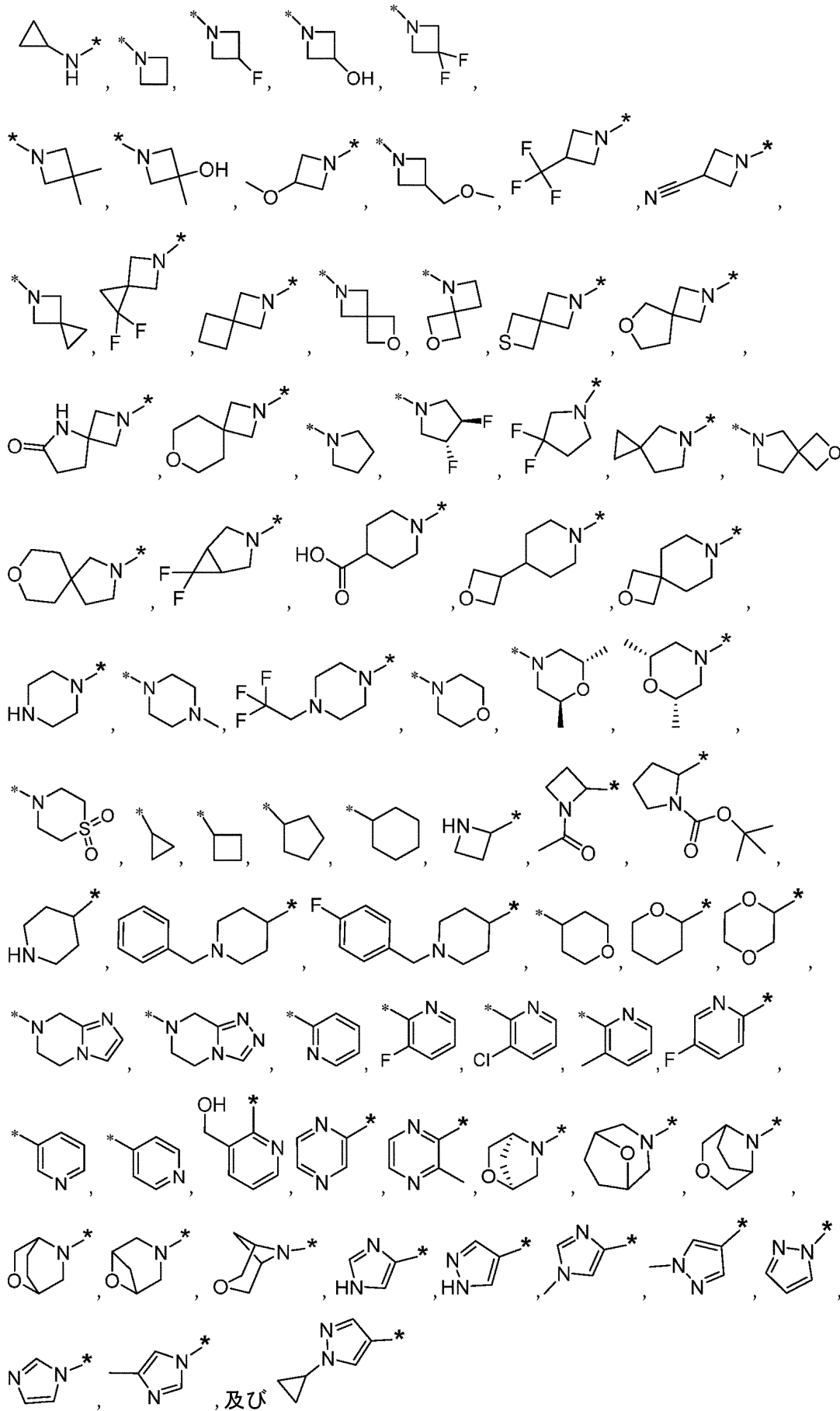
< 8 >

R³ はフルオロである、< 7 > に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

< 9 >

R⁴ は、水素、クロロ、ブロモ、メチル、イソ-プロピル、- (CH₂)₁₋₂ CH (CH₃)₂、- (CH₂)₀₋₁ C (CH₃)₃、- C (CH₃)₂ CH₂ CH₃、- CH (CH₃) (CH₂)₁₋₂ CH₃、- CH₂-シクロブチル、- (CH₂)₀₋₁ CF₃、- NH- (CH₂)₀₋₁ CH₃、- N- (CD₃)₂、- N (CH₃)₂、- NH-CH- (CH₃)₂、- NH- (CH₂) - CH- (CH₃)₂、- NHC (O) OCH (CH₃)₂、- NH (CH₂)₂ OCH₃、

【化 4】



から選択される、 $\langle 1 \rangle \sim \langle 8 \rangle$ のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

$\langle 10 \rangle$

R^4 は、 $-NR^{6a}R^{6b}$ であり；

R^{6a} は、水素又は C_{1-4} アルキルであり；

R^{6b} は、水素、 C_{1-4} アルコキシカルボニル又は非置換であるか、若しくは C_{1-4} アルコキシで置換される C_{1-4} アルキルであり；又は R^{6a} 及び R^{6b} は、それらの両方が結合される窒素原子と一緒に、環原子として N、O 及び S から独立して選択される 1 ~ 2 個のさらなるヘテロ原子を任意選択的に含む 4 員 ~ 6 員ヘテロシクロアルキルを形成し；

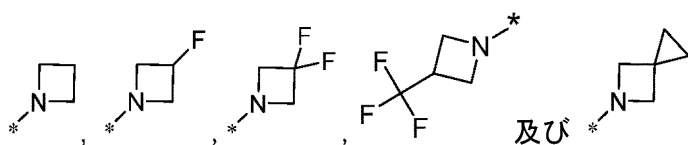
ここで、前記 4 員 ~ 6 員ヘテロシクロアルキルは、非置換であるか、又はハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} アルコキシ C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、及びオキソから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換され；又は前記 4 員 ~ 6 員ヘテロシクロアルキルの同じ又は異なる環原子上の 2 つの置換基は、それらが結合される原子と一緒に、前記 4 員 ~ 6 員ヘテロシクロアルキルに結合されたスピロ、架橋又は縮合環 C を形成し；

ここで、環 C は、 C_{3-6} シクロアルキル；及び環原子として N、O 又は S から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含む 3 員 ~ 5 員ヘテロシクロアルキルから選択され；環 C は、独立して、非置換であるか、又はハロゲン、及びオキソから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基で置換される、 $\langle 1 \rangle \sim \langle 8 \rangle$ のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

$\langle 11 \rangle$

R^4 は、

【化 5】

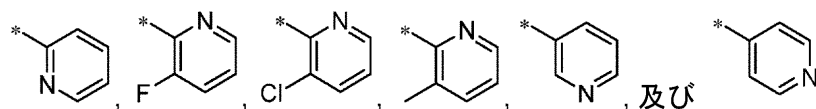


から選択される、 $\langle 1 \rangle \sim \langle 8 \rangle$ のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

$\langle 12 \rangle$

R^4 は、

【化 6】



から選択される、 $\langle 1 \rangle \sim \langle 8 \rangle$ のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

$\langle 13 \rangle$

表 1 に開示される化合物 1 ~ 3 5 3 から選択される化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

$\langle 14 \rangle$

$\langle 1 \rangle \sim \langle 13 \rangle$ のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩と、少なくとも 1 つの賦形剤とを含む医薬組成物。

$\langle 15 \rangle$

$\langle 1 \rangle \sim \langle 13 \rangle$ のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩と、1 つ又

は複数の治療効果のある薬剤とを含む組み合わせ。

< 1 6 >

リーシュマニア症、シャーガス病及びヒトアフリカトリパノソーマ症から選択される障害又は疾患の治療のための薬剤の製造における、< 1 > ~ < 1 3 >のいずれかに記載の化合物の使用。

< 1 7 >

前記疾患は、内臓リーシュマニア症及び皮膚リーシュマニア症から選択されるリーシュマニア症である、< 1 6 >に記載の方法。

< 1 8 >

前記第 2 の薬剤は、スチボグルコネート、アンチモン酸メグルミン、アムホテリシン、ミルテホシン、及びパロモマイシンから選択される、< 1 7 >に記載の方法。

< 1 9 >

前記疾患は、シャーガス病であり；前記第 2 の薬剤は、ベンズニダゾール、ニフルチモックス及びアムホテリシンから選択される、< 1 6 >に記載の方法。

< 2 0 >

前記疾患は、ヒトアフリカトリパノソーマ症であり；前記第 2 の薬剤は、ペンタミジン、スラミン、メラルソプロール、エフロルニチン、及びニフルチモックスである、< 1 6 >に記載の方法。