

【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25年12月26日 (2013.12.26)

【公表番号】特表2013-514983(P2013-514983A)

【公表日】平成25年5月2日 (2013.5.2)

【年通号数】公開・登録公報2013-021

【出願番号】特願2012-544865(P2012-544865)

【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 39/395 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 21/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/08 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 1 8 Z

C 0 7 D 519/00 3 1 1

A 6 1 K 39/395 L

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 21/02

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 15/08

A 6 1 P 9/10 1 0 3

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 17/02

【手続補正書】

【提出日】平成25年11月5日 (2013.11.5)

【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

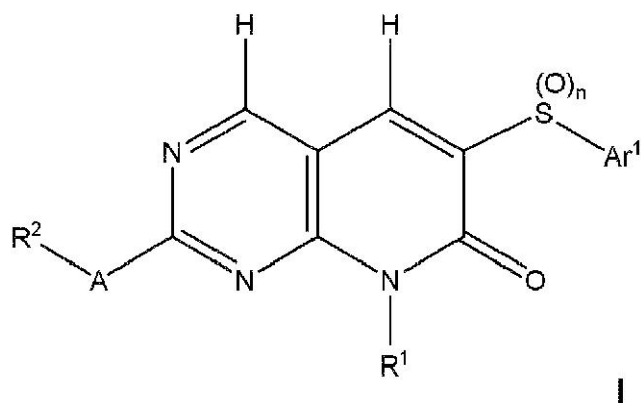
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物、又はこれらの塩：

【化 1】



{

ただし、

A は、 $S(O)_m$ 又は NR^A であり；

R^1 は、以下の群から選ばれ：水素、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル、及び $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル；

R^2 は、以下の群から選ばれ： $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、非置換 $-(CH_2)_r-$ $(C_2 \sim C_7)$ ヘテロ環、置換 $-(CH_2)_r-$ $(C_2 \sim C_7)$ ヘテロ環、非置換 $(C_6 \sim C_{10})$ アリール、置換 $(C_6 \sim C_{10})$ アリール、非置換 $(C_2 \sim C_9)$ ヘテロシクリル、及び置換 $(C_2 \sim C_9)$ ヘテロシクリル；

(ここで、前記置換 $(C_6 \sim C_{10})$ アリール、置換 $-(CH_2)_r-$ $(C_2 \sim C_7)$ ヘテロ環、及び置換 $(C_2 \sim C_9)$ ヘテロシクリル基は、以下の群から独立して選ばれる 1 以上の置換基で置換される： $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル； $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル；ハロゲン； $-C \equiv N$ ； $-NO_2$ ； $-C(=O)R^3$ ； $-C(=O)OR^3$ ； $-C(=O)NR^3_2$ ； $-C(=NR^3)NR^3_2$ ； $-OR^3$ ； $-OC(=O)(C_1 \sim C_6)$ アルキル； $-OC(=O)O(C_1 \sim C_6)$ アルキル； $-OC(=O)NR^3_2$ ； $-NR^3_2$ ； $-NR^3C(=O)R^3$ ； $-NR^3C(=O)O(C_1 \sim C_6)$ アルキル； $-NR^3C(=O)NR^3_2$ ； $-NR^3SO_2R^3$ ； $-SR^3$ ； $-S(O)R^3$ ； $-SO_2R^3$ ； $-OSO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル； $-SO_2NR^3_2$ ； $(C_2 \sim C_9)$ ヘテロシクリル； $(C_1 \sim C_3)$ ペルフルオロアルキル； $-(C_2 \sim C_6)$ アルキレン $-OR^3$ 、 $-O(C_2 \sim C_6)$ アルキレン $-N((C_1 \sim C_6)$ アルキル) $_2$ 、 $-P(=O)(OR^4)_2$ ； $-OP(=O)(OR^4)_2$ 、4 - メチルピペラジン - 1 - イル、4 - BOC - ピペラジン - 1 - イル、及び 4 - アセチルピペラジン - 1 - イル；)

m は、0、1、又は 2 であり；

n は、0、1、又は 2 であり；

r は、1、2、3、又は 4 であり；

 R^A は、以下の群から選ばれ：水素及び $(C_1 \sim C_6)$ アルキル

(ここで、 R^A 及び R^2 が同一の窒素原子に結合しているときには、 R^A 及び R^2 は、ヘテロ環又は置換ヘテロ環を形成するように結合してもよく、前記置換ヘテロ環は、以下の群から選ばれる 1 以上の置換基で置換される： $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル； $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル；ハロゲン； $-C \equiv N$ ； $-NO_2$ ； $-C(=O)R^3$ ； $-C(=O)OR^3$ ； $-C(=O)NR^3_2$ ； $-C(=NR^3)NR^3_2$ ； $-OR^3$ ； $-OC(=O)(C_1 \sim C_6)$ アルキル； $-OC(=O)O(C_1 \sim C_6)$ アルキル； $-OC(=O)NR^3_2$ ； $-NR^3_2$ ； $-NR^3C(=O)R^3$ ； $-NR^3C(=O)O(C_1 \sim C_6)$ アルキル； $-NR^3C(=O)NR^3_2$ ； $-NR^3SO_2R^3$ ； $-SR^3$ ； $-S(O)R^3$ ； $-SO_2R^3$ ； $-OSO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル； $-SO_2NR^3_2$ ； $(C_1 \sim C_3)$ ペルフルオロアルキル； $-(C_2 \sim C_6)$ アルキレン $-OR^3$ 、 $-O(C_2 \sim C_6)$ アルキレン $-N((C_1 \sim C_6)$ アルキル) $_2$ 、 $-P(=O)(OR^4)_2$ ； $-OP(=O)(OR^4)_2$ ；ピリジル；3 - トリフ

ルオロメチルピリジル；及び 4 - トリフルオロメチルピリジル；)

A^{r1}は、以下の群から選ばれる：非置換 (C₆ ~ C₁₀) アリール、置換 (C₆ ~ C₁₀) アリール、非置換 (C₂ ~ C₉) ヘテロアリール、及び置換 (C₂ ~ C₉) ヘテロアリール

(ここで、前記置換 (C₆ ~ C₁₀) アリール及び置換 (C₂ ~ C₉) ヘテロアリール基は、以下の群から選ばれる 1 ~ 5 つの置換基で独立して置換される：(C₁ ~ C₆) アルキル、(C₂ ~ C₆) アルケニル；(C₂ ~ C₆) アルキニル；ハロゲン；- C₁N；- NO₂；- C(=O)R³；- C(=O)OR³；- C(=O)NR³₂；- C(=NR³)NR³₂；- OR³；- OC(=O)(C₁ ~ C₆) アルキル；- OC(=O)O(C₁ ~ C₆) アルキル；- OC(=O)NR³₂；- NR³₂；- NR³C(=O)R³；- NR³C(=O)O(C₁ ~ C₆) アルキル；- NR³C(=O)NR³₂；- NR³SO₂R³；- SR³；- S(O)R³；- SO₂R³；- OSO₂(C₁ ~ C₆) アルキル；- SO₂NR³₂；(C₁ ~ C₃) ペルフルオロアルキル；- (C₂ ~ C₆) アルキレン - OR³，- O(C₂ ~ C₆) アルキレン - N((C₁ ~ C₆) アルキル)₂，- P(=O)(OR⁴)₂；及び - OP(=O)(OR⁴)₂；

(各 R³は、以下の群から独立して選ばれ：水素及び (C₁ ~ C₆) アルキル；並びに

各 R⁴は、以下の群から独立して選ばれる：水素及び (C₁ ~ C₆) アルキル))

}

【請求項 2】

A が S(O)_mである、請求項 1 に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項 3】

R²が (C₁ ~ C₆) アルキルである、請求項 2 に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項 4】

R¹が (C₁ ~ C₆) アルキル又は (C₃ ~ C₇) シクロアルキルである、請求項 3 に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項 5】

m が 0 又は 1 である、請求項 4 に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項 6】

以下の群から選ばれる請求項 5 に記載の化合物：

2 - (メチルスルファニル) - 6 - (フェニルスルホニル) - 8 - プロピルピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8H) - オン 8 - シクロペンチル - 2 - (メチルスルファニル) - 6 - (フェニルスルホニル) ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8H) - オン；

8 - シクロペンチル - 2 - (メチルスルフィニル) - 6 - (フェニルスルホニル) ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8H) - オン；

6 - (4 - クロロフェニルスルホニル) - 8 - シクロペンチル - 2 - (メチルスルファニル) ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8H) - オン；及び

6 - (4 - クロロフェニルスルホニル) - 8 - シクロペンチル - 2 - (メチルスルフィニル) ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8H) - オン；

【請求項 7】

以下の群から選ばれる請求項 5 に記載の化合物：

6 - (2, 4 - ジフルオロフェニルスルホニル) - 8 - メチル - 2 - (メチルスルファニル) ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8H) - オン

及び 6 - (2, 4 - ジフルオロフェニルスルホニル) - 8 - メチル - 2 - (メチルスルフィニル) ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8H) - オン。

【請求項 8】

R²が非置換 (C₆ ~ C₁₀) アリールである、請求項 2 に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項 9】

R¹が (C₁ ~ C₆) アルキル又は (C₃ ~ C₇) シクロアルキルである、請求項 8 に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項 10】

m が 0 又は 1 である、請求項 9 に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項 11】

6 - (フェニルスルホニル) - 2 - (フェニルスルファニル) - 8 - プロピルピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オンである、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

A が NR^A である、請求項 1 に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項 13】

R^1 が ($\text{C}_3 \sim \text{C}_7$) シクロアルキルである、請求項 12 に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項 14】

Ar^1 が非置換 ($\text{C}_6 \sim \text{C}_{10}$) アリール又は置換 ($\text{C}_6 \sim \text{C}_{10}$) アリールである、請求項 13 に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項 15】

以下の群から選ばれる、請求項 14 に記載の化合物：

2 - (5 - (4 - tert - ブトキシカルボニルピペラジン - 1 - イル)ピリジン - 2 - イルアミノ) - 8 - シクロペンチル - 6 - (フェニルスルホニル)ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン；

2 - (4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル)フェニルアミノ) - 8 - シクロペンチル - 6 - (フェニルスルホニル)ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン；

2 - (4 - モルホリノフェニルアミノ) - 8 - シクロペンチル - 6 - (フェニルスルホニル)ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン；

2 - (3, 4, 5 - トリメトキシフェニルアミノ) - 8 - シクロペンチル - 6 - (フェニルスルホニル)ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン；

2 - (4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル)フェニルアミノ) - 6 - (4 - クロロフェニルスルホニル) - 8 - シクロペンチルピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン；

8 - シクロペンチル - 2 - (4 - (5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)ピペラジン - 1 - イル) - 6 - (フェニルスルホニル)ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン；

2 - (4 - メトキシフェニルアミノ) - 8 - シクロペンチル - 6 - (フェニルスルホニル)ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン；

6 - (4 - クロロフェニルスルホニル) - 2 - (4 - モルホリノフェニルアミノ) - 8 - シクロヘキシルピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン；

2 - (4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル)フェニルアミノ) - 6 - (4 - クロロフェニルスルホニル) - 8 - シクロヘキシルピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン；及び

これらの塩。

【請求項 16】

R^1 が ($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$) アルキルである、請求項 12 に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項 17】

Ar^1 が非置換 ($\text{C}_6 \sim \text{C}_{10}$) アリール又は置換 ($\text{C}_6 \sim \text{C}_{10}$) アリールである、請求項 16 に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項 18】

以下の群から選ばれる、請求項 17 に記載の化合物：

2 - (4 - クロロフェニルアミノ) - 6 - (4 - クロロフェニルスルホニル) - 8 - メチルピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン；

6 - (4 - クロロフェニルスルホニル) - 2 - (4 - メトキシフェニルアミノ) - 8 - メチルピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン；

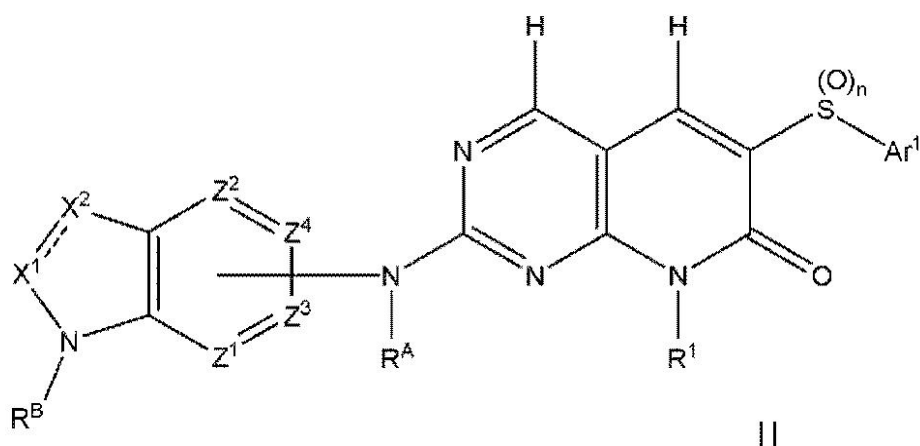
6 - (4 - クロロフェニルスルホニル) - 8 - メチル - 2 - (キノリン - 3 - イルアミ

ノ) ピリド[2, 3-d]ピリミジン-7(8H)-オン;
 2-(3-モルホリノプロピルアミノ)-6-(4-クロロフェニルスルホニル)-8-メチルピリド[2, 3-d]ピリミジン-7(8H)-オン;
 6-(4-クロロフェニルスルホニル)-2-(4-アセチルピペラジン-1-イル)-8-メチルピリド[2, 3-d]ピリミジン-7(8H)-オン;
 2-(2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エチルアミノ)-6-(4-クロロフェニルスルホニル)-8-メチルピリド[2, 3-d]ピリミジン-7(8H)-オン;
 8-メチル-2-(キノリン-8-イルアミノ)-6-トシルピリド[2, 3-d]ピリミジン-7(8H)-オン;
 8-メチル-2-(キノリン-5-イルアミノ)-6-トシルピリド[2, 3-d]ピリミジン-7(8H)-オン;
 2-(4-メトキシフェニルアミノ)-8-メチル-6-トシルピリド[2, 3-d]ピリミジン-7(8H)-オン;
 8-メチル-6-(フェニルスルホニル)-2-(キノリン-6-イルアミノ)ピリド[2, 3-d]ピリミジン-7(8H)-オン;
 6-(2, 4-ジフルオロフェニルスルホニル)-2-(2-モルホリノエチルアミノ)-8-メチルピリド[2, 3-d]ピリミジン-7(8H)-オン; 及び
 これらの塩。

【請求項 19】

以下式 II の構造を有する請求項 1 の化合物又はこれらの塩;

【化 2】



{ ここで、

X¹は、以下の群から選ばれ：窒素、C R⁵、及びC(=O)；

X²は、窒素又はC R⁵であり；

Z¹は、窒素又はC R⁵であり；

Z²は、窒素又はC R⁵であり；

Z³は、窒素又はC R⁵であり；

Z⁴は、窒素又はC R⁵であり；

R^Aは、水素及び(C₁~C₆)アルキルからなる群から選ばれ；

R^Bは、下記の群から選ばれ：水素、(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アシル、非置換-C(=O)-(C₆~C₁₀)アリール、置換-C(=O)-(C₆~C₁₀)アリール、非置換-(CH₂)_q-(C₆~C₁₀)アリール、置換-(CH₂)_q-(C₆~C₁₀)アリール、及び-C(=O)O-(C₁~C₆)アルキル；

(ここで、前記置換-C(=O)-(C₆~C₁₀)アリール及び置換-(CH₂)_q-(C₆~C₁₀)アリール基は、以下の群から独立して選ばれる1つ以上の置換基で置換される：(C₁~C₆)アルキル、(C₂~C₆)アルケニル；(C₂~C₆)アルキニル；ハロゲン；-C≡N；-NO₂；-C(=O)R⁶；-C(=O)OR⁶；-C(=O)NR⁶₂

; - C(=NR⁶)NR⁶₂; - OR⁶; - OC(=O)(C₁~C₆)アルキル; - OC(=O)O(C₁~C₆)アルキル; - OC(=O)NR⁶₂; - NR⁶₂; - NR⁶C(=O)R⁶; - NR⁶C(=O)O(C₁~C₆)アルキル; - NR⁶C(=O)NR⁶₂; - NR⁶SO₂R⁶; - SR⁶; - S(O)R⁶; - SO₂R⁶; - OSO₂(C₁~C₆)アルキル; - SO₂NR⁶₂; (C₂~C₉)ヘテロシクリル; (C₁~C₃)ペルフルオロアルキル; - (C₂~C₆)アルキレン-OR⁶, - O(C₂~C₆)アルキレン-N((C₁~C₆)アルキル)₂, - P(=O)(OR⁷)₂; 及び - OP(=O)(OR⁷)₂;

q は、1、2、3 又は 4 である;) ;

各 R⁵ は、独立して、下記の群から選ばれる: 水素, (C₁~C₆)アルキル, (C₂~C₆)アルケニル; (C₂~C₆)アルキニル; ハロゲン; - C₃N; - NO₂; - C(=O)R³; - C(=O)OR³; - C(=O)NR³₂; - C(=NR³)NR³₂; - OR³; - OC(=O)(C₁~C₆)アルキル; - OC(=O)O(C₁~C₆)アルキル; - OC(=O)NR³₂; - NR³₂; - NR³C(=O)R³; - NR³C(=O)O(C₁~C₆)アルキル; - NR³C(=O)NR³₂; - NR³SO₂R³; - SR³; - S(O)R³; - SO₂R³; - OSO₂(C₁~C₆)アルキル; - SO₂NR³₂; (C₁~C₃)ペルフルオロアルキル; - (C₂~C₆)アルキレン-OR³, - O(C₂~C₆)アルキレン-N((C₁~C₆)アルキル)₂, - P(=O)(OR⁴)₂; 及び - OP(=O)(OR⁴)₂;

各 R⁶ は、独立して、下記の群から選ばれる; 水素及び (C₁~C₆)アルキル; 並びに各 R⁷ は、独立して、下記の群から選ばれる; 水素及び (C₁~C₆)アルキル

}。

【請求項 20】

R¹が (C₁~C₆)アルキル又は (C₃~C₇)シクロアルキルである請求項 19 に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項 21】

R^Aが水素である請求項 20 に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項 22】

Ar¹が非置換 (C₆~C₁₀)アリール又は置換 (C₆~C₁₀)アリールである請求項 21 に記載の化合物又はこれらの塩。

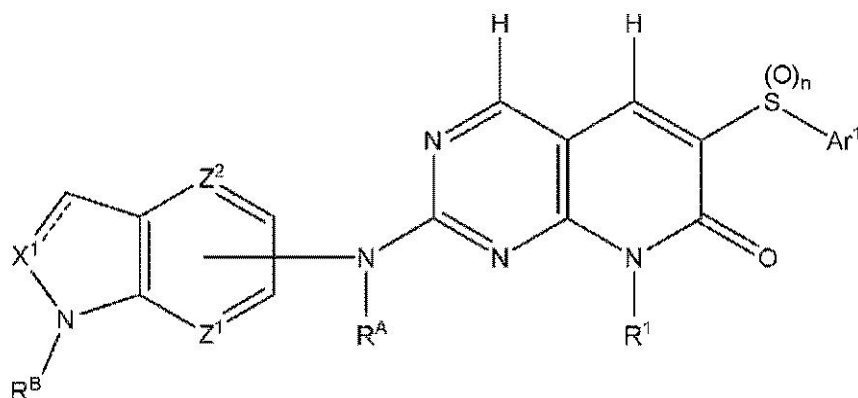
【請求項 23】

n が 2 である請求項 21 に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項 24】

下記式 III の構造である請求項 19 の化合物又はこれらの塩。

【化 3】



III

【請求項 25】

R¹が (C₃~C₇)シクロアルキルである請求項 24 に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項 26】

R^A が水素である請求項25に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項27】

A_{r1} が非置換($C_6 \sim C_{10}$)アリール又は置換($C_6 \sim C_{10}$)アリールである請求項26に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項28】

n が2である請求項27に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項29】

下記の群から選ばれる請求項28に記載の化合物：

2 - (1H - インドール - 5 - イルアミノ) - 8 - シクロペンチル - 6 - (フェニルスルホニル)ピリド[2, 3 - d]ピリミジン - 7(8H) - オン；及び

2 - (1H - インドール - 5 - イルアミノ) - 6 - (4 - クロロフェニルスルホニル) - 8 - シクロヘキシルピリド[2, 3 - d]ピリミジン - 7(8H) - オン。

【請求項30】

R^1 が($C_1 \sim C_6$)アルキルである請求項24に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項31】

R^A が水素である請求項30に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項32】

A_{r1} が非置換($C_6 \sim C_{10}$)アリール又は置換($C_6 \sim C_{10}$)アリールである請求項31に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項33】

n が2である請求項32に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項34】

X^1 が窒素及びC(=O)からなる群から選ばれる請求項33に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項35】

下記の群から選ばれる請求項34に記載の化合物：

2 - (1H - インダゾール - 5 - イルアミノ) - 6 - (4 - フルオロフェニルスルホニル) - 8 - メチルピリド[2, 3 - d]ピリミジン - 7(8H) - オン；

2 - (2 - オキシインドリン - 5 - イルアミノ) - 8 - メチル - 6 - トシルピリド[2, 3 - d]ピリミジン - 7(8H) - オン；

2 - (2 - オキシインドリン - 5 - イルアミノ) - 6 - (3 - クロロ - 4 - フルオロフェニルスルホニル) - 8 - メチルピリド[2, 3 - d]ピリミジン - 7(8H) - オン；

2 - (1H - インダゾール - 5 - イルアミノ) - 6 - (3 - クロロ - 4 - フルオロフェニルスルホニル) - 8 - メチルピリド[2, 3 - d]ピリミジン - 7(8H) - オン；

2 - (1H - インダゾール - 5 - イルアミノ) - 6 - (2, 4 - ジフルオロフェニルスルホニル) - 8 - メチルピリド[2, 3 - d]ピリミジン - 7(8H) - オン；及び

6 - (2, 4 - ジフルオロフェニルスルホニル) - 2 - (2 - オキシインドリン - 5 - イルアミノ) - 8 - メチルピリド[2, 3 - d]ピリミジン - 7(8H) - オン；並びに

これらの塩。

【請求項36】

X^1 がCHであり、 Z^2 がCHであり、及びハッシュ結合(---)が炭素 - 炭素の二重結合を表す請求項33に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項37】

下記の群から選ばれる請求項36に記載の化合物：

2 - (1H - インドール - 5 - イルアミノ) - 6 - (4 - クロロフェニルスルホニル) - 8 - メチルピリド[2, 3 - d]ピリミジン - 7(8H) - オン；

2 - (1H - インドール - 4 - イルアミノ) - 6 - (4 - フルオロフェニルスルホニル) - 8 - メチルピリド[2, 3 - d]ピリミジン - 7(8H) - オン；

2 - (1 H - ピロロ [2 , 3 - b] ピリジン - 5 - イルアミノ) - 6 - (4 - フルオロ
フェニルスルホニル) - 8 - メチルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン
:

2 - (1 H - インドール - 5 - イルアミノ) - 8 - メチル - 6 - トシルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン ;

2 - (1 H - ピロロ [2 , 3 - b] ピリジン - 5 - イルアミノ) - 8 - メチル - 6 - ト
シルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン ;

2 - (1 H - ピロロ [2 , 3 - b] ピリジン - 5 - イルアミノ) - 8 - メチル - 6 - (フェニルスルホニル) ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン ;

2 - (1 H - インドール - 6 - イルアミノ) - 8 - メチル - 6 - (フェニルスルホニル) ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン ;

メチル 4 - (2 - (1 H - インドール - 5 - イルアミノ) - 7 , 8 - ジヒドロ - 8 -
メチル - 7 - オキソピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 6 - イルスルホニル) ベンゾエー
ト :

2 - (1 H - インドール - 6 - イルアミノ) - 8 - メチル - 6 - トシルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン ;

2 - (1 H - インドール - 4 - イルアミノ) - 6 - (4 - メトキシフェニルスルホニル) - 8 - メチルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン ;

2 - (1 H - インドール - 4 - イルアミノ) - 6 - (4 - クロロフェニルスルホニル)
- 8 - メチルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン ;

2 - (1 H - インドール - 5 - イルアミノ) - 6 - (3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル
スルホニル) - 8 - メチルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン ;

2 - (1 H - インドール - 6 - イルアミノ) - 6 - (フェニルスルホニル) - 8 - プロピルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン ;

2 - (1 H - ピロロ [2 , 3 - b] ピリジン - 5 - イルアミノ) - 6 - (3 - クロロ - 4 - フルオロフェニルスルホニル) - 8 - メチルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 (

2 - (1 H - インドール - 5 - イルアミノ) - 6 - (4 - ヒドロキシフェニルスルホニ

ル) - 8 - メチルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン ;
4 - (2 - (1 H - インドール - 5 - イルアミノ) - 7 , 8 - ジヒドロ - 8 - メチル -
7 - オキソピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 6 - イルスルホニル) 安息香酸 ; 及び
これらの塩。

【請求項 3 8】

2 - (1 H - インドール - 5 - イルアミノ) - 6 - (2 , 4 - ジフルオロフェニルスル
ホニル) - 8 - メチルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン又はこれらの
塩である請求項 3 6 に記載の化合物。

【請求項 3 9】

R¹ が水素である請求項 2 4 に記載の化合物又はこれらの塩。

【請求項 4 0】

2 - (1 H - インドール - 5 - イルアミノ) - 6 - (3 - クロロ - 4 - フルオロフェニ
ルスルホニル) ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 (8 H) - オン又はこれらの塩であ
る請求項 3 9 に記載の化合物。

【請求項 4 1】

式 I - L - A b の抗体複合体又はこれらの塩であって、

I は請求項 1 に記載の化合物であり、

A b は抗体であり ; 及び

- L - は、単結合であるか、又は式 I の前記化合物を前記抗体へ共有結合的に結合さ
せる結合基である

該複合体又はこれらの塩。

【請求項 4 2】

前記抗体がモノクローナル抗体又は単一特異性ポリクローナル抗体である請求項 4 1 に
記載の抗体複合体又はこれらの塩。

【請求項 4 3】

前記抗体が腫瘍特異的抗体である請求項 4 2 に記載の抗体複合体又はこれらの塩。

【請求項 4 4】

医薬的に適用可能なキャリア及び請求項 1 に記載の化合物又はこれらの医薬的に適用可
能な塩を含む医薬組成物。

【請求項 4 5】

医薬的に適用可能なキャリア及び請求項 2 4 に記載の化合物又はこれらの医薬的に適用
可能な塩を含む医薬組成物。

【請求項 4 6】

医薬的に適用可能なキャリア及び請求項 4 1 に記載の抗体複合体又はこれらの医薬的に
適用可能な塩を含む医薬組成物。

【請求項 4 7】

細胞増殖性異常を治療するための組成物であって、少なくとも 1 種の請求項 1 に記載の
化合物又はこれらの医薬的に適用可能な塩を含む該組成物。

【請求項 4 8】

前記細胞増殖性異常が下記の群から選ばれる請求項 4 7 に記載の組成物 :

新生児の血管腫症、二次性進行型多発性硬化症、アテローム性硬化症、慢性進行性骨髄変
性疾患、神経線維腫症、節神経腫症、ケロイド生成、骨ページェット病、乳腺線維嚢胞症
、子宮筋腫、ペーロニー病、デュピュイトラン病、再狭窄、良性増殖性乳房疾患、良性前
立腺肥大症、X 連鎖性 (X l i n k e d) リンパ細胞 (l y m p h o c e l l u l a r) 増殖性疾患、移植後リンパ細胞 (l y m p h o c e l l u l a r) 増殖性疾患、黄斑改
質、網膜症、増殖性硝子体網膜症及び非癌性リンパ細胞 (l y m p h o c e l l u l a r) 増殖性疾患。

【請求項 4 9】

前記細胞増殖性異常が癌である請求項 4 7 に記載の組成物。

【請求項 5 0】

前記癌が下記の群から選ばれる請求項 4 9 に記載の組成物：卵巣癌；子宮頸癌；乳癌；前立腺癌；精巣癌；肺癌；腎臓癌；大腸癌；皮膚癌；脳癌；白血病（急性骨髄白血病、慢性骨髄白血病、急性リンパ球白血病、及び慢性リンパ球白血病を含む）。

【請求項 5 1】

癌細胞のアポトーシスを誘導させるための組成物であって、少なくとも 1 種の請求項 1 に記載の化合物又はこれらの医薬的に適用可能な塩を含む該組成物。

【請求項 5 2】

前記癌細胞が腫瘍細胞である請求項 5 1 に記載の組成物。

【請求項 5 3】

前記腫瘍細胞が下記の群から選ばれる請求項 5 2 に記載の組成物：卵巣、子宮頸部、子宮、膣性、乳房、前立腺、精巣、肺、腎臓、大腸、胃、副腎、口、食道、肝臓性、胆嚢、骨、リンパ、眼、皮膚及び脳の腫瘍細胞。

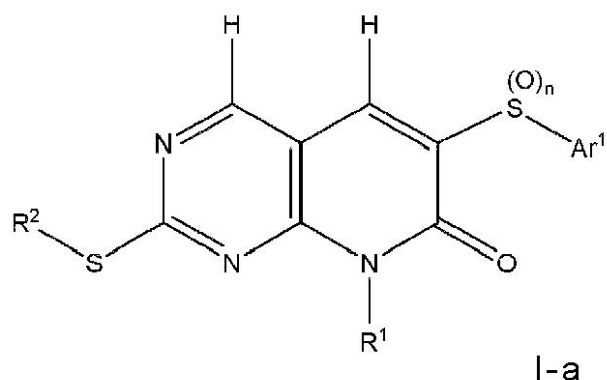
【請求項 5 4】

細胞増殖性異常を治療するための組成物であって、請求項 4 1 に記載の少なくとも 1 種の抗体複合体、又はこれらの医薬的に適用可能な塩を含む該組成物。

【請求項 5 5】

下記式 I - a の構造を有する請求項 1 に記載の化合物を製造するための方法であって：

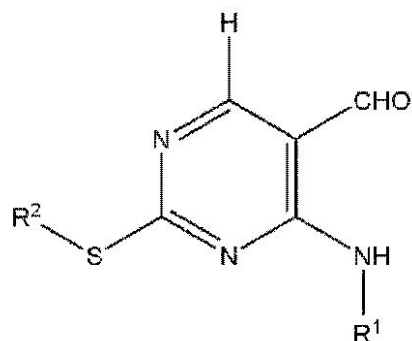
【化 4】



以下のステップを含む該方法：

- (1) アリールスルホン酸又は式 $\text{Ar}^1 - \text{SO}_2 - \text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}$ （ここで R は水素又は $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキルである）のエステルで、下記式のアルデヒドを処理するステップ：

【化 5】



；及び

- (2) 前記反応生成物から、式 I - a の化合物又はこれらの化合物の塩を単離するステップ。

【請求項 5 6】

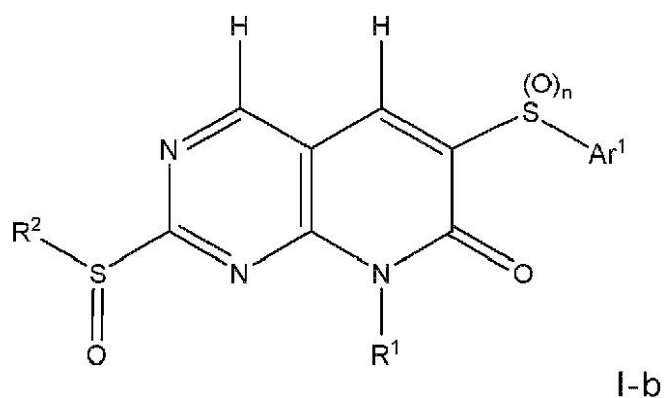
n が 2 であり、 R^1 がメチルであり、 R^2 がメチルであり、及び Ar^1 が 2, 4 - ジフル

オロフェニルである請求項 55 に記載の方法。

【請求項 57】

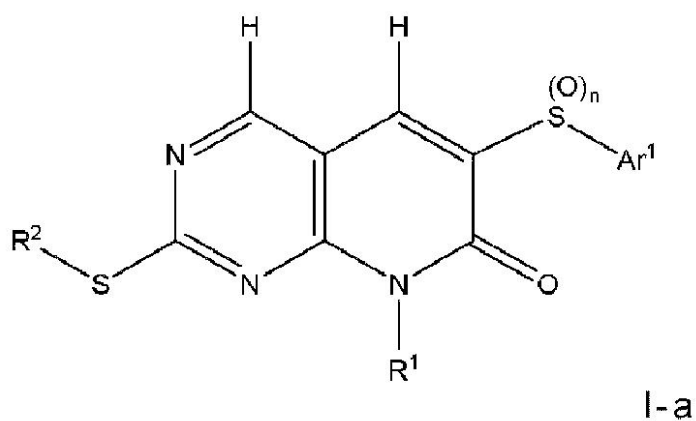
下記式 I - b の構造を有する請求項 1 に記載の化合物を製造するための方法であって以下のステップを含む方法：

【化 6】



(1) スルフィドをスルホオキシドに酸化することができる酸化剤で、式 I - a の化合物又はこれらの塩を処理するステップ

【化 7】



；及び

(2) 前記反応生成物から、式 I - b の化合物又はこれらの化合物の塩を単離するステップ。

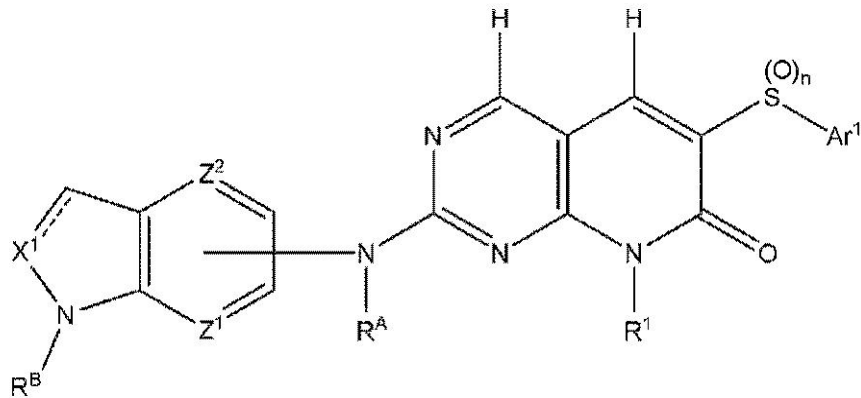
【請求項 58】

n が 2 であり、R¹ がメチルであり、R² がメチルであり、及び Ar¹ が 2, 4 - ジフルオロフェニルである請求項 57 に記載の方法。

【請求項 59】

以下式 I I I の構造を有する請求項 24 に記載の化合物を製造するための方法であって以下のステップを含む該方法：

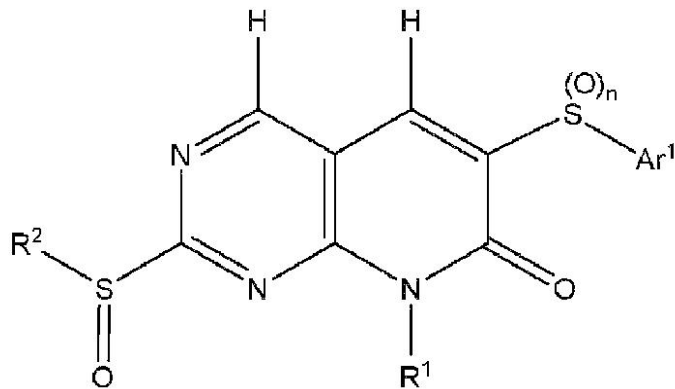
【化 8】



III

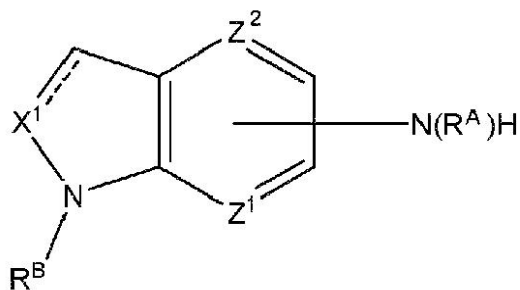
(1) 式 I - b の化合物又はこれらの塩を、式 A のアミンで処理するステップ

【化 9】



I-b

【化 10】



A

{ ここで

X^1 は、窒素、 CR^5 、及び $C(=O)$ からなる群から選ばれ；

Z^1 は、窒素又は CR^5 であり；

Z^2 は、窒素又は CR^5 であり；

R^B は、以下の群から選ばれ：水素， $(C_1 \sim C_6)$ アルキル， $(C_1 \sim C_6)$ アシル，非置換 - $C(=O) - (C_6 \sim C_{10})$ アリール，置換 - $C(=O) - (C_6 \sim C_{10})$ アリール，非置換 - $(CH_2)_q (C_6 \sim C_{10})$ アリール，置換 - $(CH_2)_q - (C_6 \sim C_{10})$ アリール，及び $C(=O)O - (C_1 \sim C_6)$ アルキル；

(ここで、前記置換 - $C(=O) - (C_6 \sim C_{10})$ アリール及び置換 - $(CH_2)_q -$

($C_6 \sim C_{10}$) アリール基は、以下の群から独立して選ばれる 1 つ以上の置換基で置換される： $(C_1 \sim C_6)$ アルキル， $(C_2 \sim C_6)$ アルケニル； $(C_2 \sim C_6)$ アルキニル；ハロゲン； $-C \equiv N$ ； $-NO_2$ ； $-C(=O)R^3$ ； $-C(=O)OR^3$ ； $-C(=O)NR^3_2$ ； $-C(=NR^3)NR^3_2$ ； $-OR^3$ ； $-OC(=O)(C_1 \sim C_6)$ アルキル； $-OC(=O)O(C_1 \sim C_6)$ アルキル； $-OC(=O)NR^3_2$ ； $-NR^3_2$ ； $-NR^3C(=O)R^3$ ； $-NR^3C(=O)O(C_1 \sim C_6)$ アルキル； $-NR^3C(=O)NR^3_2$ ； $-NR^3SO_2R^3$ ； $-SR^3$ ； $-S(O)R^3$ ； $-SO_2R^3$ ； $-OSO_2(C_1 \sim C_6)$ アルキル； $-SO_2NR^3_2$ ； $-(C_2 \sim C_9)$ ヘテロシクリル； $-(C_1 \sim C_3)$ ペルフルオロアルキル； $-(C_2 \sim C_6)$ アルキレン $-OR^3$ ， $-O(C_2 \sim C_6)$ アルキレン $-N((C_1 \sim C_6)$ アルキル) $_2$ ， $-P(=O)(OR^4)_2$ ；及び $-OP(=O)(OR^4)_2$ ；及び

q は、1、2、3、又は 4；

｝；並びに

(2) 前記反応生成物から、式 I I I の化合物又はこれらの化合物の塩を単離するステップ。

【請求項 60】

n が 2 であり、 R^1 がメチルであり、 R^2 がメチルであり、 Z^1 が炭素であり、 Z^2 が炭素であり、 R^A が水素であり、 R^B が水素であり、及び Ar^1 が 2, 4 - ジフルオロフェニルである請求項 59 に記載の方法。

【請求項 61】

前記式 A のアミンが 5 - アミノインドールである請求項 60 に記載の方法。