

【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11月1日(2018.11.1)

【公表番号】特表2017-533215(P2017-533215A)

【公表日】平成29年11月9日(2017.11.9)

【年通号数】公開・登録公報2017-043

【出願番号】特願2017-523293(P2017-523293)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 1 7 N

C 0 7 D 471/04 C S P

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 519/00 3 1 1

【誤訳訂正書】

【提出日】平成30年9月20日(2018.9.20)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

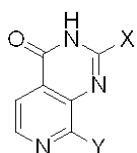
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記の化学式 ( I ) で表される化合物、その立体異性体、またはその薬学的に許容される塩：



化学式 ( I )

上記化学式において、

X は、水素、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、 $-CH(R^1)$ 、 $NH-R^2$  および  $-CH(R^1)O-R^2$  からなる群より選択され、前記シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリールおよびヘテロアリールは一つ以上の  $R^3$  で選択的に置換されてもよく；

Y は、水素 (但し、前記 X が、 $-CH(R^1)NH-R^2$ 、または  $-CH_2O-C_6H_5$  を除いた  $-CH(R^1)O-R^2$  の場合に限る。) か、 $-CH_2NH-A-Z$  であり；

A は、単一結合、 $C_{1-8}$  アルキレン、 $C_{2-8}$  アルケニレン、 $C_{2-8}$  アルキニレン

、 $C_{3-10}$  シクロアルキレン、ヘテロシクリレン、 $-C(=O)-$  および  $-CH(R^3)$   $C(=O)-$  からなる群より選択され、前記アルキレン、アルケニレン、アルキニレン、シクロアルキレンおよびヘテロシクリレンは、一つ以上の  $R^4$  で選択的に置換されてもよく；

$Z$  は、水素、 $-N(R^4)(R^5)$ 、 $C_{1-8}$  アルキル、 $C_{2-8}$  アルケニル、 $C_{2-8}$  アルキニル、 $C_{3-10}$  シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールからなる群より選択され、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールは、一つ以上の  $R^3$  で選択的に置換されてもよく；

$R^1$  は、水素、 $C_{1-8}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アミノアルキル、 $C_{1-4}$  フルオロアルキル、 $C_{1-4}$  ヒドロキシアルキル、 $C_{2-8}$  アルケニル、 $C_{2-8}$  アルキニル、 $C_{3-10}$  シクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールアルキルからなる群より選択され、前記ヘテロシクリルは、ハロゲンおよび  $C_{1-8}$  アルキルからなる群より選択される一つ以上によって選択的に置換されてもよく、

$R^2$  は、アリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールからなる群より選択され、前記アリールは、水素、ハロゲン(前記  $Y$  が、 $-CH_2NH-A-Z$  の場合に限る。)、 $C_{1-8}$  アルキル、 $C_{2-8}$  アルケニル、 $C_{2-8}$  アルキニル、 $C_{3-10}$  シクロアルキル、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)-O(R^4)$ 、 $-C(=O)-N(R^4)(R^5)$ 、 $-O(R^4)$ 、 $-OCF_3$ 、 $-S(R^4)$ 、 $-SO_3$ 、 $-SO_2(R^4)$ 、 $-N(R^4)(R^5)$ 、 $C_{1-8}$  アルコキシ  $C_{1-8}$  アルキル、 $-C_{1-8}$  アルキル  $-C(=O)R^4$ 、 $-C(=O)R^4$ 、 $-C_{1-8}$  アルキル  $-R^4$ 、 $-NH-C(=O)R^4$  および  $-C_{1-8}$  アルキル  $-NR^4R^5$  からなる群より選択された一つ以上で選択的に置換されてもよく、

前記アリールアルキルおよびヘテロアリールは、水素、ハロゲン、 $C_{1-8}$  アルキル、 $C_{2-8}$  アルケニル、 $C_{2-8}$  アルキニル、 $C_{3-10}$  シクロアルキル、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)-O(R^4)$ 、 $-C(=O)-N(R^4)(R^5)$ 、 $-O(R^4)$ 、 $-OCF_3$ 、 $-S(R^4)$ 、 $-SO_3$ 、 $-SO_2(R^4)$ 、 $-N(R^4)(R^5)$ 、 $C_{1-8}$  アルコキシ  $C_{1-8}$  アルキル、 $-C_{1-8}$  アルキル  $-C(=O)R^4$ 、 $-C(=O)R^4$ 、 $-C_{1-8}$  アルキル  $-R^4$ 、 $-NH-C(=O)R^4$  および  $-C_{1-8}$  アルキル  $-NR^4R^5$  からなる群より選択された一つ以上で選択的に置換されてもよく、

$R^3$  は、水素、 $C_{1-8}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アミノアルキル、 $C_{1-4}$  ヒドロキシアルキル、 $C_{2-8}$  アルケニル、 $C_{2-8}$  アルキニル、 $C_{3-10}$  シクロアルキル、オキソ、 $C(=O)-O(R^4)$ 、 $-C(=O)-N(R^4)(R^5)$ 、 $-O(R^4)$ 、 $-S(R^4)$ 、 $-SO_2(R^4)$  および  $-N(R^4)(R^5)$  からなる群より選択されるか；または、隣接した二つの置換基  $R^3$  が一つ以上の  $R^4$  で置換可能なアリールまたはヘテロアリール環を形成し、

$R^4$  または  $R^5$  は、独立して、水素、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アミノアルキル、 $C_{1-4}$  フルオロアルキル、 $C_{1-4}$  ヒドロキシアルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{3-10}$  シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリールアルキルおよびアリールアルキルからなる群より選択され、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリールアルキルおよびアリールアルキルは、それぞれ独立して一つ以上の  $R^1$  によって選択的に置換されてもよく；または置換基  $R^4$  および  $R^5$  が、それらが結合する窒素原子と一緒にあって、窒素含有ヘテロシクリルを形成することができ、前記ヘテロシクリルは、一つ以上の  $R^1$  によって置換されてもよい。

#### 【請求項 2】

請求項 1 に記載の化合物、その立体異性体、またはその薬学的に許容される塩；

$X$  は、水素、 $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $N$ 、 $O$  および  $S$  からなる群より選択された 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 4 - 10 員ヘテロシクリル、フェニル、 $N$ 、 $O$  および  $S$  からな

る群より選択された 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 4 - 10 員ヘテロアリール、 $-CH(R^1)NH-R^2$  および  $CH(R^1)O-R^2$ 、からなる群より選択され、前記ヘテロシクリルは、 $R^3$  によって選択的に置換されてもよく、

A は、単一結合、 $C_{1-8}$  アルキレン、 $C_{2-8}$  アルケニレン、 $C_{2-8}$  アルキニレン、 $C_{3-10}$  シクロアルキレン、ヘテロシクリレン、 $-C(=O)-$  および  $-CH(R^3)C(=O)-$  からなる群より選択され、前記アルキレン、アルケニレン、アルキニレン、シクロアルキレンおよびヘテロシクリレンは、一つ以上の  $R^4$  によって選択的に置換されてもよく、

Z は、水素、 $-N(R^4)(R^5)$ 、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{3-8}$  シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、N、O および S からなる群より選択された 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 4 - 10 員ヘテロシクリルおよび N、O および S からなる群より選択された 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 4 - 10 員ヘテロアリールからなる群より選択され、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリールおよびアリールは、一つ以上の  $R^3$  によって選択的に置換されてもよく、

$R^1$  は、水素、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-3}$  アミノアルキル、 $C_{1-3}$  フルオロアルキル、 $C_{1-3}$  ヒドロキシアルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{3-8}$  シクロアルキル、ベンジル、N、O および S からなる群より選択された 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 4 - 10 員ヘテロアリールアルキルおよび N、O および S からなる群より選択された 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 4 - 10 員ヘテロシクリルからなる群より選択され、前記ヘテロアリールアルキル、およびヘテロシクリルは、ハロゲンおよび  $C_{1-6}$  アルキルからなる群より選択された一つ以上の置換基によって選択的に置換されてもよく、

$R^2$  は、フェニル、ベンジル、および N、O および S からなる群より選択された 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 4 - 10 員ヘテロアリールからなる群より選択され、前記フェニルは水素、ハロゲン(前記 Y が、 $-CH_2NH-A-Z$  の場合に限る。)、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)-O(R^4)$ 、 $-C(=O)-N(R^4)(R^5)$ 、 $-O(R^4)$ 、 $-OCF_3$ 、 $-S(R^4)$ 、 $-SO_3$ 、 $-SO_2(R^4)$ 、 $-N(R^4)(R^5)$ 、 $C_{1-6}$  アルコキシ  $C_{1-6}$  アルキル、 $-C_{1-6}$  アルキル  $-C(=O)R^4$ 、 $-C(=O)R^4$ 、 $-C_{1-6}$  アルキル  $-R^4$ 、 $-NH-C(=O)R^4$  および  $-C_{1-6}$  アルキル  $-NR^4R^5$  からなる群より選択された一つ以上の置換基で選択的に置換されてもよく、前記ベンジルおよびヘテロアリールは水素、ハロゲン、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(=O)-O(R^4)$ 、 $-C(=O)-N(R^4)(R^5)$ 、 $-O(R^4)$ 、 $-OCF_3$ 、 $-S(R^4)$ 、 $-SO_3$ 、 $-SO_2(R^4)$ 、 $-N(R^4)(R^5)$ 、 $C_{1-6}$  アルコキシ  $C_{1-6}$  アルキル、 $-C_{1-6}$  アルキル  $-C(=O)R^4$ 、 $-C(=O)R^4$ 、 $-C_{1-6}$  アルキル  $-R^4$ 、 $-NH-C(=O)R^4$  および  $-C_{1-6}$  アルキル  $-NR^4R^5$  からなる群より選択された一つ以上の置換基で選択的に置換されてもよく、

$R^3$  は、水素、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アミノアルキル、 $C_{1-4}$  ヒドロキシアルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{3-8}$  シクロアルキル、オキソ、 $C(=O)-O(R^4)$ 、 $-C(=O)-N(R^4)(R^5)-O(R^4)$ 、 $-S(R^4)$ 、 $-SO_2(R^4)$  および  $-N(R^4)(R^5)$  からなる群より選択されるか；または、隣接した二つの置換基がフェニルまたは 4 - 10 員ヘテロアリール環を形成してもよく、前記フェニルまたは前記 4 - 10 員ヘテロアリール環は、一つ以上の  $R^4$  によって選択的に置換されてもよく、

$R^4$  または  $R^5$  は、それぞれ独立して、水素、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アミノアルキル、 $C_{1-4}$  フルオロアルキル、 $C_{1-4}$  ヒドロキシアルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $C_{3-8}$  シクロアルキル  $C_{1-4}$  アルキル、N、O および S からなる群より選択された 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 4 - 10 員ヘテロシクリル、N、O および S からなる群より選択された 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有す

る 4 - 10 員ヘテロシクリル  $C_{1-4}$  アルキル、N、O および S からなる群より選択された 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 4 - 10 員ヘテロアリール  $C_{1-4}$  アルキル、およびベンジルからなる群より選択され、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリールアルキルおよびアリールアルキルは、それぞれ独立して一つ以上の  $R^1$  によって選択的に置換されてもよく；または置換基  $R^4$  および  $R^5$  が、それらが結合する窒素原子と一緒になって、一つ以上の  $R^1$  によって置換可能な、4 - 10 員窒素含有ヘテロシクリルを形成してもよい。

### 【請求項 3】

請求項 1 に記載の化合物、その立体異性体、またはその薬学的に許容される塩：

X は、水素、シクロペンチル、テトラヒドロフラン、ベンゾフラン、ジヒドロベンゾフラン、クロマン、ジヒドロインデン、テトラヒドロナフタレン、 $-CH(R^1)NH-R^2$  または  $CH(R^1)O-R^2$  であり、前記ベンゾフランは、ピペリジノエチルアミノカルボニルまたはメトキシカルボニルによって選択的に置換されてもよく；

A は、単一結合、メチレン、エチレン、プロピレン、ブチレン、 $-C(=O)-$  または  $-CH_2C(=O)-$  であり、前記メチレン、エチレン、プロピレンおよびブチレンは、 $CH_3$  によって選択的に置換されてもよく；

Z は、水素、アミノ、ベンジル、ピリジン、シクロヘキシル、ジエチルアミノ、アゼチジン、ピロリジン、フラン、チオフェン、オキサゾール、イソオキサゾール、ピラゾール、イミダゾール、ピペリジン、ピペラジン、ピリミジン、ピラジン、モルホリン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、ジヒドロピロピリジンまたはピペリジニルメチルであり、前記 Z は、水素の場合を除き、独立してオキソ、クロロ、 $CH_3$ 、エチル、イソプロピル、ブチル、ヒドロキシエチル、メトキシエチル、シクロプロピル、ベンジル、メチルピペリジン、 $-C(=O)-N(CH_3)_2$ 、ジエチルアミノ、ジメチルアミノ、メチルアミノ、メチルピロリジニルメチル、ピペリジン、ベンジルピロリジンおよびピロリジニルテトラヒドロフランまたはジメチルアミノエチルの一つ以上によって置換され；

$R^1$  は、水素またはメチルであり；

$R^2$  は、フルオロ(前記 Y が、 $-CH_2NH-A-Z$  の場合に限る。)、クロロ(前記 Y が、 $-CH_2NH-A-Z$  の場合に限る。)、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シクロペンチル、シクロヘキシル、メトキシエチル、 $-C(=O)-CH_3$ 、 $-(CH_2)_2-C(=O)-CH_3$ 、 $-NH-C(=O)-CH_3$ 、ピリジン、フェノキシ、ベンゾイル、フェニル、プロボキシピペリジニルメチル、メトキシカルボニル、

「メチルで選択的に置換可能な」ベンジル、

プロボキシピペリジノメチル、

「テトラヒドロピラニル、ベンジル、テトラヒドロピランメチルまたはモルホリノエチルで選択的に置換可能な」アミノメチル、

「ピペリジノエチル、ヒドロキシエチルピペリジノメチル、メトキシエチルピペリジノメチル、メチルピペリジノメチル、ベンジルピペリジノメチル、モルホリノエチル、ベンジル、シクロヘキシルメチル、ピリジノメチル、ジメチルアミノプロピル、シクロペンチル、アセチルピペリジノメチル、ピペリジノメチル、アミノシクロヘキシル、テトラヒドロピラノメチルまたはピペリジノエチルで選択的に置換可能な」アミノカルボニル、ピロリジノカルボニル、

「ベンジルまたはプロボキシで選択的に置換可能な」ピペリジノカルボニル、

ピペラジノカルボニル、モルホリノカルボニル、モルホリノエチルアミノカルボニル、フェノキシ、ベンジルオキシ

からなる群より独立して選択された一つ以上の置換基で選択的に置換されてもよいフェニル；

メチルまたはベンジルで選択的に置換可能なピペリジン；

フルオロ、プロモまたはメチルで選択的に置換可能なピリジン；

ブロモで選択的に置換可能なピラジン；  
 インデン；  
 またはクロロで選択的に置換可能なベンジルである。

【請求項 4】

下記化合物からなる群より選択される、請求項 1 に記載の化合物、その立体異性体、またはその薬学的に許容される塩；

2 - ( ( p - トリルオキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 4 - ブチルフェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 4 - ( t e r t - ブチル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 4 - ( s e c - ブチル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 4 - シクロペンチルフェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 4 - シクロヘキシルフェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 4 - ( 2 - メトキシエチル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 4 - アセチルフェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 4 - ( 3 - オキソブチル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

N - ( 4 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) フェニル ) アセトアミド、

2 - ( ( 4 - ( モルホリン - 4 - カルボニル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 3 - ( ピペリジン - 1 - カルボニル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 4 - ベンジルフェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 4 - ( 1 - フェニルエチル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 4 - ( 2 - フェニルプロパン - 2 - イル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 4 - フェノキシフェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 4 - ( ベンジルオキシ ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 3 - ( ベンジルオキシ ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 4 - ベンゾイルフェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( [ 1 , 1 ' - ビフェニル ] - 3 - イルオキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

4 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) ベンゾニトリル、

3 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) ベンゾニトリル、

- 2 - ( ( 4 - ニトロフェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 4 - メトキシフェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( ピリジン - 4 - イルオキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( ピリジン - 3 - イルオキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( ( 6 - フルオロピリジン - 3 - イル ) オキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( ( 6 - プロモピリジン - 3 - イル ) オキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( ( 6 - メチルピリジン - 3 - イル ) オキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 , 4 , 5 - トリメトキシフェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- N - ( 2 - モルホリノエチル ) - 3 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) ベンズアミド、
- 2 - ( ( 3 - ( ( ( テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - ( ( ベンジルアミノ ) メチル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - ( ( 4 - プロボキシペリジン - 1 - イル ) メチル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - ( ( ( テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イル ) アミノ ) メチル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - ( ( ( 2 - モルホリノエチル ) アミノ ) メチル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - メチル - 5 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) - N - ( 2 - ( ピペリジン - 4 - イル ) エチル ) ベンズアミド、
- 2 - ( ( 2 - ( ピリジン - 4 - イル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( ( 4 - ( s e c - ブチル ) フェニル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( ( 4 - シクロヘキシルフェニル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( ( 4 - フェノキシフェニル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( ( 4 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( ( 3 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( [ 1 , 1 ' - ビフェニル ] - 3 - イルアミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( ( 1 - ベンジルピペリジン - 4 - イル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 8 - ( ( ベンジルアミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ( 2 , 6 - ジクロロピリジン - 4 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド  
 [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( シクロヘキシルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン  
 - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( 4 - ( ジエチルアミノ ) ブチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピ  
 リミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( 5 - ( ジエチルアミノ ) ペンタン - 2 - イル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3  
 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( 3 - ( 2 - オキソピロリジン - 1 - イル ) プロピル ) アミノ ) メチル ) ピリ  
 ド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( アゼチジン - 3 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリ  
 ミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ピロリジン - 3 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリ  
 ミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

( S ) - 8 - ( ( ( ピロリジン - 2 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 -  
 d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ( 1 - メチルピロリジン - 3 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3  
 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリ  
 ミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ( 1 - ( ピペリジン - 4 - イル ) エチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 -  
 d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ( ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3  
 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ( ( 1 - ベンジルピペリジン - 4 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3  
 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ( ( 1 ' - メチル - [ 1 , 4 ' - ビペリジン ] - 4 - イル ) メチル ) アミノ  
 ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

( R ) - 8 - ( ( ( ( ピペリジン - 3 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 -  
 d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

( S ) - 8 - ( ( ( ( ピペリジン - 3 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 -  
 d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ( ( 1 - メチルピペリジン - 3 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3  
 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ( ( 1 - ベンジルピペリジン - 3 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3  
 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ( ( 1 - ベンジルピペリジン - 2 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3  
 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ( 1 - ベンジルピペリジン - 4 - イル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d  
 ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ( ( 1 s , 4 s ) - 4 - アミノシクロヘキシル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3  
 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ( ( 1 - ベンジルピペリジン - 4 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) - 2 - ( ( 2 - クロロフェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン  
 、

8 - ( ( ( ( ( 1 - ベンジルピペリジン - 4 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) - 2 - ( ( 3 - クロロフェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン  
 、

8 - ( ( ( ( ( 1 - ベンジルピペリジン - 4 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) - 2 - ( ( 4 - クロロフェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン

[illegible]



- , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) ベンゾニトリル  
、
- 2 - ( ( 2 - クロロ - 5 - メチルフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( ( 5 - プロモピラジン - 2 - イル ) オキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - クロロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 8 - ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) - 2 - ( ( ( ピリジン - 2 - イルオキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 4 - クロロ - 3 - メチルフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 4 - エチルフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 , 4 - ジメチルフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 4 - クロロ - 2 - メチルフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 3 - ( ( 4 - オキソ - 8 - ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) ベンゾニトリル  
、
- 2 - ( ( ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 5 - イル ) オキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 4 - シクロペンチルフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 4 - ( 1 - フェニルエチル ) フェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン  
、
- 2 - ( ( 4 - ベンジルフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ( 1 - エチルピロリジン - 3 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン  
、
- 2 - ( ( 4 - ベンジルフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( 4 - ( ピロリジン - 1 - イル ) プチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 4 - ベンジルフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ( 1 - メチルピロリジン - 3 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン  
、
- ( R ) - 2 - ( ( 4 - ベンジルフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ( 1 - エチルピロリジン - 2 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- ( S ) - 2 - ( ( 4 - ベンジルフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ( 1 - エチルピロリジン - 2 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 8 - ( ( ( アゼチジン - 3 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) - 2 - ( ( 4 - ベンジルフェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- ( R ) - 2 - ( ( 4 - ベンジルフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ( テトラヒドロフラン - 2 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 4 - ベンジルフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ( テトラヒドロ - 2 H - ピラ

ン - 4 - イル)メチル)アミノ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H )  
- オン、

( S ) - 2 - ( ( 4 - ベンジルフェノキシ)メチル) - 8 - ( ( ( ピロリジン - 3 - イ  
ルメチル)アミノ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

( R ) - 2 - ( ( 4 - ベンジルフェノキシ)メチル) - 8 - ( ( ( ピロリジン - 3 - イ  
ルメチル)アミノ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 4 - ベンジルフェノキシ)メチル) - 8 - ( ( ( ( 1 - メチルピペリジン - 4  
- イル)メチル)アミノ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン  
、

( S ) - 2 - ( ( 4 - ベンジルフェノキシ)メチル) - 8 - ( ( ( ピペリジン - 3 - イ  
ルメチル)アミノ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

( R ) - 2 - ( ( 4 - ベンジルフェノキシ)メチル) - 8 - ( ( ( ピペリジン - 3 - イ  
ルメチル)アミノ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ( 1 r、4 r ) - 4 - アミノシクロヘキシル)アミノ)メチル) - 2 - ( ( 4  
- ベンジルフェノキシ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン  
、

2 - ( ( 4 - ベンジルフェノキシ)メチル) - 8 - ( ( ( ピリジン - 3 - イルメチル)  
アミノ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 4 - ベンジルフェノキシ)メチル) - 8 - ( ( ( 2 - モルホリノエチル)アミ  
ノ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

( S ) - 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ)メチル) - 8 - ( ( ( ピロリ  
ジン - 3 - イルメチル)アミノ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H )  
- オン、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ)メチル) - 8 - ( ( ( ( 1 - メチルピ  
ロリジン - 3 - イル)メチル)アミノ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3  
H ) - オン、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ)メチル) - 8 - ( ( ( ( 1 - メチルピ  
ペリジン - 4 - イル)メチル)アミノ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3  
H ) - オン、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ)メチル) - 8 - ( ( ( ( テトラヒドロ  
- 2 H - ピラン - 4 - イル)メチル)アミノ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン  
- 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ)メチル) - 8 - ( ( ( ( テトラヒドロ  
- 2 H - ピラン - 3 - イル)メチル)アミノ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン  
- 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ)メチル) - 8 - ( ( ( ( テトラヒドロ  
フラン - 3 - イル)メチル)アミノ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3  
H ) - オン、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ)メチル) - 8 - ( ( ( 2 - モルホリノ  
エチル)アミノ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( 3 - ( 1 H - イミダゾール - 1 - イル)プロピル)アミノ)メチル) - 2 -  
( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン -  
4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ)メチル) - 8 - ( ( ( ( 5 - メチルピ  
ラジン - 2 - イル)メチル)アミノ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3  
H ) - オン、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ)メチル) - 8 - ( ( ( モルホリン - 2  
- イルメチル)アミノ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ)メチル) - 8 - ( ( ( ( 1 - イソプロ  
ピルピペリジン - 4 - イル)メチル)アミノ)メチル)ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン

- 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( 1 - シクロペンチルピペリジン - 4 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ピリジン - 2 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( フラン - 2 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ピリジン - 3 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ピリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 5 - ( ( ( 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 8 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) - N , N - ジメチルフラン - 2 - カルボキサミド、
- 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( 2 - ( 2 - メチル - 1 H - イミダゾール - 1 - イル ) エチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( 2 - ( チオフェン - 2 - イル ) エチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ( 3 - メチルイソオキサゾール - 5 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ( 4 - メチルホルリン - 2 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( オキサゾール - 2 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ( ピリミジン - 2 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ( チオフェン - 2 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ( 2 - クロロピリジン - 4 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( 2 - ( 3 , 5 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ) エチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( 2 - ( 6 - メチルピリジン - 2 - イル ) エチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( 3 - ( 5 - オキソ - 5 , 7 - ジヒドロ - 6 H - ピロロ [ 3 , 4 - b ] ピリジン - 6 - イル ) プロピル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( 2 - ( ピリジン - 2 - イル ) エチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、
- ( R ) - 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( モルホ

リン - 2 - イルメチル) アミノ) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H )  
- オン、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ) メチル) - 8 - ( ( ( ( 1 - ( 2 - ヒ  
ドロキシエチル) ピペリジン - 4 - イル) メチル) アミノ) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d  
] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ) メチル) - 8 - ( ( ( ( 1 - ( 2 - メ  
トキシエチル) ピペリジン - 4 - イル) メチル) アミノ) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ]  
ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

( S ) - 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ) メチル) - 8 - ( ( ( モルホ  
リン - 2 - イルメチル) アミノ) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H )  
- オン、

2 - シクロペンチル - 8 - ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル) アミノ) メチル) ピリ  
ド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - シクロペンチル - 8 - ( ( ( ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル) メチル) アミノ  
) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル) アミノ) メチル) - 2 - ( テトラヒドロフラン  
- 2 - イル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル) メチル) アミノ) メチル) - 2 - ( テ  
トラヒドロフラン - 2 - イル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル) アミノ) メチル) - 2 - ( テトラヒドロフラン  
- 3 - イル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

8 - ( ( ( ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル) メチル) アミノ) メチル) - 2 - ( テ  
トラヒドロフラン - 3 - イル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 2 - イル) - 8 - ( ( ( ( ピペリジン - 4 - イル  
メチル) アミノ) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( 2 , 3 - ジヒドロベンゾフラン - 2 - イル) - 8 - ( ( ( ( 1 - メチルピペリジ  
ン - 4 - イル) メチル) アミノ) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H )  
- オン、

2 - ( クロマン - 2 - イル) - 8 - ( ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル) アミノ) メチ  
ル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( クロマン - 2 - イル) - 8 - ( ( ( ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル) メチル  
) アミノ) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 2 - イル) - 8 - ( ( ( ( 1 - メチルピペ  
リジン - 4 - イル) メチル) アミノ) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3  
H ) - オン、

2 - ( ( ベンジルオキシ) メチル) - 8 - ( ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル) アミノ  
) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( ベンジルオキシ) メチル) - 8 - ( ( ( ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル)  
メチル) アミノ) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

( S ) - 2 - ( ( ベンジルオキシ) メチル) - 8 - ( ( ( ( ピロリジン - 3 - イルメチル  
) アミノ) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( ベンジルオキシ) メチル) - 8 - ( ( ( ( 1 - メチルピロリジン - 3 - イル)  
メチル) アミノ) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( ( 3 - クロロベンジル) オキシ) メチル) - 8 - ( ( ( ( ピペリジン - 4 - イル  
メチル) アミノ) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( ( 3 - クロロベンジル) オキシ) メチル) - 8 - ( ( ( ( 1 - メチルピペリジ  
ン - 4 - イル) メチル) アミノ) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H )  
- オン、

( S ) - 2 - ( ( ( 3 - クロロベンジル) オキシ) メチル) - 8 - ( ( ( ( ピロリジン -  
3 - イルメチル) アミノ) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン

、

2 - ( ( ( 2 - クロロベンジル ) オキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( ( 2 - クロロベンジル ) オキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( 1 - ( 4 - ベンジルフェノキシ ) エチル ) - 8 - ( ( ( ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( 1 - ( 4 - ベンジルフェノキシ ) エチル ) - 8 - ( ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( 1 - ( 4 - ベンジルフェノキシ ) エチル ) - 8 - ( ( ( ( ( S ) - ピロリジン - 3 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( 1 - ( 4 - ベンジルフェノキシ ) エチル ) - 8 - ( ( ( ( ( 1 - メチルピロリジン - 3 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

( R ) - 2 - ( 1 - ( 4 - ベンジルフェノキシ ) エチル ) - 8 - ( ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

( R ) - 2 - ( 1 - ( 4 - ベンジルフェノキシ ) エチル ) - 8 - ( ( ( ( ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

( R ) - 2 - ( 1 - ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) エチル ) - 8 - ( ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

( R ) - 2 - ( 1 - ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) エチル ) - 8 - ( ( ( ( ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

( S ) - 2 - ( 1 - ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) エチル ) - 8 - ( ( ( ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

( S ) - 2 - ( 1 - ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) エチル ) - 8 - ( ( ( ( ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル ) メチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( ( 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 8 - イル ) メチル ) アミノ ) - N - ( 2 - ( ジメチルアミノ ) エチル ) - N - エチルアセトアミド、

N - ブチル - 2 - ( ( ( 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 8 - イル ) メチル ) アミノ ) - N - エチルアセトアミド、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( 2 - オキソ - 2 - ( ピロリジン - 1 - イル ) エチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( 2 - オキソ - 2 - ( ピペリジン - 1 - イル ) エチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( 2 - モルホリノ - 2 - オキソエチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( 2 - ( 4 - メチ

ルピペラジン - 1 - イル) - 2 - オキシエチル) アミノ) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ]  
 ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( ( 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ) メチル) - 4 - オキシ - 3  
 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 8 - イル) メチル) アミノ) - N - ( ( 1 -  
 メチルピロリジン - 3 - イル) メチル) アセトアミド、

( R ) - 8 - ( ( ( 2 - ( 3 - アミノピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキシエチル) ア  
 ミノ) メチル) - 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ) メチル) ピリド [ 3 ,  
 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

( S ) - 8 - ( ( ( 2 - ( 3 - アミノピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキシエチル) ア  
 ミノ) メチル) - 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ) メチル) ピリド [ 3 ,  
 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

( R ) - 2 - ( ( ( 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ) メチル) - 4 - オ  
 キソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 8 - イル) メチル) アミノ)  
 - N - ( ピペリジン - 3 - イル) アセトアミド、

( S ) - 2 - ( ( ( 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ) メチル) - 4 - オ  
 キソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 8 - イル) メチル) アミノ)  
 - N - ( ピペリジン - 3 - イル) アセトアミド、

N - ( 1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2 - ( ( ( 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フ  
 ルオロフェノキシ) メチル) - 4 - オキシ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリ  
 ミジン - 8 - イル) メチル) アミノ) アセトアミド、

2 - ( ( ( 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ) メチル) - 4 - オキシ - 3  
 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 8 - イル) メチル) アミノ) - N - ( ト  
 ランス - 5 - ( ピロリジン - 1 - イル) テトラヒドロフラン - 2 - イル) アセトアミド

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ) メチル) - 8 - ( ( ( 2 - ( 3 - ( ジ  
 エチルアミノ) ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキシエチル) アミノ) メチル) ピリド [ 3 ,  
 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ) メチル) - 8 - ( ( ( 2 - ( 3 - ( ジ  
 メチルアミノ) ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキシエチル) アミノ) メチル) ピリド [ 3 ,  
 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ) メチル) - 8 - ( ( ( 2 - ( 3 - ( メ  
 チルアミノ) ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキシエチル) アミノ) メチル) ピリド [ 3 ,  
 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

( R ) - 2 - ( ( ( 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ) メチル) - 4 - オ  
 キソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 8 - イル) メチル) アミノ)  
 - N - ( ピロリジン - 3 - イル) アセトアミド、および

N - ( ( 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ) メチル) - 4 - オキシ - 3 ,  
 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 8 - イル) メチル) ピペリジン - 3 - カ  
 ルボキサミド。

#### 【請求項 5】

下記化合物、その立体異性体、またはその薬学的に許容される塩：

2 - ( ( ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 5 - イル) オキシ) メチル) ピリド [ 3 ,  
 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( ( 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 2 - イル) オキシ) メチル) ピ  
 リド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 3 , 4 - ジフルオロフェノキシ) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン -  
 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 3 - クロロフェノキシ) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H )  
 ) - オン、

2 - ( ( 2 - クロロフェノキシ) メチル) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H

) - オン、

2 - ( ( 3 , 4 - ジクロロフェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 3 , 5 - ジクロロフェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - クロロ - 5 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) - N - ( 2 - ( ピペリジン - 4 - イル ) エチル ) ベンズアミド、

2 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 2 - ヒドロキシエチル ) ピペリジン - 4 - イル ) メチル ) - 5 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) ベンズアミド、

2 - クロロ - N - ( ( 1 - ( 2 - メトキシエチル ) ピペリジン - 4 - イル ) メチル ) - 5 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) ベンズアミド、  
2 - クロロ - N - ( ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル ) メチル ) - 5 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) ベンズアミド、

N - ( ( 1 - ベンジルピペリジン - 4 - イル ) メチル ) - 2 - クロロ - 5 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) ベンズアミド、

2 - クロロ - N - ( 2 - モルホリノエチル ) - 5 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) ベンズアミド、

N - ベンジル - 2 - クロロ - 5 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) ベンズアミド、

2 - ( ( 3 - ( 4 - ベンジルピペリジン - 1 - カルボニル ) - 4 - クロロフェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 4 - クロロ - 3 - ( 4 - プロボキシピペリジン - 1 - カルボニル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - クロロ - N - ( シクロヘキシルメチル ) - 5 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) ベンズアミド、

2 - クロロ - 5 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) - N - ( ピリジン - 4 - イルメチル ) ベンズアミド、

2 - クロロ - N - ( 3 - ( ジメチルアミノ ) プロピル ) - 5 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) ベンズアミド、

2 - クロロ - N - シクロペンチル - 5 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) ベンズアミド、

2 - ( ( 4 - クロロ - 3 - ( ピロリジン - 1 - カルボニル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 4 - クロロ - 3 - ( ピペリジン - 1 - カルボニル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

N - ( ( 1 - アセチルピペリジン - 4 - イル ) メチル ) - 2 - クロロ - 5 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) ベンズアミド、

2 - ( ( 4 - クロロ - 3 - ( ピペラジン - 1 - カルボニル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

N - ( トランス - 1 , 4 - アミノシクロヘキシル ) - 2 - クロロ - 5 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) ベンズアミド、

2 - クロロ - 5 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) - N - ( ピペリジン - 4 - イルメチル ) ベンズアミド、

2 - ( ( 4 - クロロ - 3 - ( モルホリン - 4 - カルボニル ) フェノキシ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - クロロ - 5 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) - N - ( ( テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イル ) メチル ) ベンズアミド、

2 - プロモ - 5 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) - N - ( 2 - ( ピペリジン - 4 - イル ) エチル ) ベンズアミド、

メチル 2 - クロロ - 5 - ( ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) メトキシ ) ベンゾエート、

2 - ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) - N - ( 2 - ( ピペリジン - 4 - イル ) エチル ) ベンゾフラン - 7 - カルボキサミド、

メチル 2 - ( 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 2 - イル ) ベンゾフラン - 7 - カルボキシレート、

2 - ( ( ( 4 - ( ( 4 - メトキシベンジル ) オキシ ) フェニル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( ( 3 , 4 - ジフルオロフェニル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( 2 - オキソ - 2 - ( 4 - ( ピロリジン - 1 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ) エチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、

2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 8 - ( ( ( 2 - ( 3 - モルホリノピロリジン - 1 - イル ) - 2 - オキソエチル ) アミノ ) メチル ) ピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 4 ( 3 H ) - オン、および

N - ( ( 2 - ( ( 3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ ) メチル ) - 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリド [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 8 - イル ) メチル ) - 2 - ( ピペリジン - 4 - イル ) アセトアミド。

#### 【請求項 6】

請求項 1 ~ 5 のいずれか一項による化合物、その立体異性体、またはその薬学的に許容される塩を有効成分として含む薬学組成物。

#### 【請求項 7】

癌またはヒストンリジン脱メチル化酵素 ( KDM ) の調節障害に関連した、過増殖性疾患、脳卒中、糖尿病、肝腫大 ( hepatomegaly )、心血管疾患、多発性硬化症、アルツハイマー疾患、嚢胞性線維症、ウイルス疾患、自己免疫疾患、粥状動脈硬化症、再狭窄 ( restenosis )、乾癬、リウマチ性関節炎、炎症性腸疾患、ぜんそく、アレルギー性疾患、炎症、神経障害、ホルモン関連疾病、臓器移植に関連した症状、免疫欠乏障害、破壊性骨疾患、感染性疾患、T細胞活性化を含む病理学的免疫状態、CNS 障害または骨髄増殖性障害を含む、疾患の治療用である請求項 6 に記載の薬学組成物。

#### 【請求項 8】

前記癌が、前立腺癌、肺ガン、乳癌、胃ガン、子宮頸ガン、黒色腫、腎細胞癌 ( renal cell carcinoma ) および白血病からなる群より選択されることを特徴とする請求項 7 に記載の薬学組成物。

#### 【請求項 9】

請求項 1 ~ 5 のいずれか一項による化合物を含む、癌またはヒストンリジン脱メチル化酵素 ( KDM ) の調節障害に関連した、過増殖性疾患、脳卒中、糖尿病、肝腫大 ( hepatomegaly )、心血管疾患、多発性硬化症、アルツハイマー疾患、嚢胞性線維症、ウイルス疾患、自己免疫疾患、粥状動脈硬化症、再狭窄 ( restenosis )、乾癬、リウマチ性関節炎、炎症性腸疾患、ぜんそく、アレルギー性疾患、炎症、神経障害、ホルモン関連疾病、臓器移植に関連した症状、免疫欠乏障害、破壊性骨疾患、感染性疾患、T細胞活性化を含む病理学的免疫状態、CNS 障害または骨髄増殖性障害を含む、疾患の治療用組成物。

#### 【請求項 10】

前記癌が、前立腺癌、肺ガン、乳癌、胃ガン、子宮頸ガン、黒色腫、腎細胞癌および白



血病からなる群より選択されることを特徴とする請求項 9 に記載の治療用組成物。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0039

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0039】

本発明のより好ましい実施形態では、 $R^2$  は、フルオロ、クロロ、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ブチル、トリフルオロメチル、メトキシ、シクロペンチル、シクロヘキシル、メトキシエチル、 $-C(=O)-CH_3$ 、 $-(CH_2)_2-C(=O)-CH_3$ 、 $-NH-C(=O)-CH_3$ 、ピリジン、フェノキシ、ベンゾイル、フェニル、プロポキシピペリジニルメチル、メトキシカルボニル、「メチルで選択的に置換可能な」ベンジル、プロポキシピペリジノメチル、「テトラヒドロピラニル、ベンジル、テトラヒドロピランメチルまたはモルホリノエチルで選択的に置換可能な」アミノメチル、「ピペリジノエチル、ヒドロキシエチルピペリジノメチル、メトキシエチルピペリジノメチル、メチルピペリジノメチル、ベンジルピペリジノメチル、モルホリノエチル、ベンジル、シクロヘキシルメチル、ピリジノメチル、ジメチルアミノプロピル、シクロペンチル、アセチルピペリジノメチル、ピペリジノメチル、アミノシクロヘキシル、テトラヒドロピラノメチルまたはピペリジノエチルで選択的に置換可能な」アミノカルボニル、ピロリジノカルボニル、「ベンジルまたはプロポキシで選択的に置換可能な」ピペリジノカルボニル、ピペラジノカルボニル、モルホリノカルボニル、モルホリノエチルアミノカルボニル、フェノキシ、「メトキシ、ベンゾイルまたはフェニルで選択的に置換可能な」ベンジロキシからなる群より独立して選択された一つ以上の置換基で選択的に置換されてもよいフェニル；メチルまたはベンジルで選択的に置換可能なピペリジン；フルオロ、プロモまたはメチルで選択的に置換可能なピリジン；プロモで選択的に置換可能なピラジン；インデン；またはクロロで選択的に置換されるベンジルである。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0753

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0753】

化合物を処理してから 24 時間後に、細胞をダルベッコリン酸緩衝生理食塩水 (Dulbecco's Phosphate-Buffered Saline) で 2 回洗浄し、蛋白質分解酵素抑制剤 (コンプリートプロテアーゼインヒビターカクテルタブレット；ロシュアプライドサイエンス、スイス) を含む RIPA 緩衝液 (Sigma、USA) を用いて全体細胞蛋白質を抽出した。前記抽出物は  $14,000 \times g$  で 10 分間遠心分離して、上澄み液を回収した。蛋白質濃度は BCA タンパク質アッセイ (Pierce、USA) および SoftMax pro ソフトウェアバージョン 5.2 (モレキュラーデバイス、USA) を用いて定量した。95 で 10 分間変性させた後、総蛋白質 ( $20 \mu g$  のタンパク質 / lane) を SDS-PAGE 4 ~ 12 % 濃度勾配ゲル (インビトロジェン、USA) によって分離した。分離された蛋白質を  $0.45 \mu m$  ニトロセルロース膜上に湿式電気ブロッティング (wet electroblotting) によって 1 時間の間移した後、5 % 脱脂粉乳および 0.05 % の Tween-20 (TBS-T) を含有する TRIS-緩衝食塩水に室温で 1 時間浸した。前記膜を 4 で一晩 1:2000 の H3K4me3 抗体 (ab8580; Abcam) および 1:10000 の H3 抗体 (ab1791; Abcam) と共に培養した。前記膜を TBS-T で 30 分間 3 回洗浄した後、室温で 1 時間 1:5000 または 1:20000 の抗ウサギ二次抗体と共に培養した。目的蛋白質バンドを化学発光法 (Amersham ECL Prime ウェスタンブロッティング検出試薬、GEヘルスケアライフサイエンス、USA) によって視覚化した。

。目的蛋白質バンドイメージはM o l e c u l a r I m a g e r C h e m i D o c X R Sシステム（B i o - R a d、U S A）によって収集され、Q u a n t i t y O n eソフトウェア（v e r 4 . 6 . 7）を用いて定量化した。正規化されたトリメチル化水準はH 3バンド強度に相当するH 3 K 4 m e 3バンド強度とS i g m a P l o tを用いて計算された阻害濃度の半分値（I C <sub>50</sub>）を決定した。

結果は表 3 に示す。なお、表 3 における阻害濃度の半分値（I C <sub>50</sub>）の単位は、 $\mu$  Mである。