

【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 2 年 7 月 27 日 (2020.7.27)

【公表番号】特表 2019-522018 (P2019-522018A)

【公表日】令和 1 年 8 月 8 日 (2019.8.8)

【年通号数】公開・登録公報 2019-032

【出願番号】特願 2019-503678 (P2019-503678)

【国際特許分類】

C 07 D 473/34 (2006.01)

A 61 K 31/52 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 35/02 (2006.01)

A 61 K 45/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 473/34 3 6 1

C 07 D 473/34 C S P

A 61 K 31/52

A 61 P 35/00

A 61 P 35/02

A 61 K 45/00

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 6 月 11 日 (2020.6.11)

【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

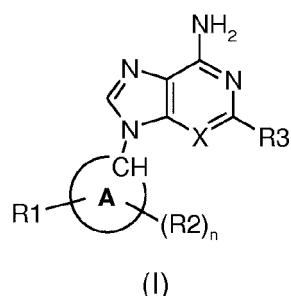
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



[ 式中、

X は、C H 又は窒素であり；

A は、6 若しくは 7 員のシクロアルキル又は 6 若しくは 7 員の窒素含有ヘテロシクリルであるか、又は、A は、7 ~ 9 員の炭素二環系であり、ここで 1 個の環炭素は任意に窒素により置き換えられていてもよく；

R 1 は：

1 ) いずれかの A 環炭素 ( この場合、R 1 は、フッ素、任意に置換されていてもよい (

$C_1 - C_6$ ) アルキル若しくは ( $C_3 - C_7$ ) シクロアルキル、 $-COR_6$ 、 $-COOR_4$ 、 $-CONR_4R_5$ 、 $-NR_4COOR_6$ 、 $-NR_4COR_5$ 、 $-NR_4R_5$ 、 $-NR_4CONR_4R_5$ 、 $-NR_4CSNR_4R_5$ 、又は  $-NR_4SO_2R_6$  である) ;

又は

2) 存在すれば、A 環窒素 (この場合、 $R_1$  は、任意に置換されていてもよい ( $C_1 - C_6$ ) アルキル若しくは ( $C_3 - C_7$ ) シクロアルキル、 $-COR_5$ 、 $-COOR_6$ 、 $-CONR_4R_5$ 、 $-CSNR_4R_5$ 、又は  $-SO_2R_6$  である)

{ ここで、

$R_4$  及び  $R_5$  は独立して、水素であるか、又は、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_3 - C_7$ ) シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリール ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリール ( $C_1 - C_6$ ) アルキルから選択される任意に置換されていてもよい基であり ; 又は

$R_4$  及び  $R_5$  は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、任意に N、O 及び S から選択される追加のヘテロ原子を含有していてもよい、任意に置換されていてもよい 5 若しくは 6 員のヘテロシクリル基を形成していてもよく ;

$R_6$  は、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_3 - C_7$ ) シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリール ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリール ( $C_1 - C_6$ ) アルキルから選択される任意に置換されていてもよい基である }

のいずれかに結合しており ;

$n$  は、0、1 又は 2 であり ;

$R_2$  は、いずれかの A 環原子に結合しており、フッ素、任意に置換されていてもよい ( $C_1 - C_6$ ) アルキル又は ( $C_3 - C_7$ ) シクロアルキル、及び  $NR_4R_5$  からなる群から選択され ;

但し、

$R_2$  がフッ素又は  $NR_4R_5$  であるとき、 $R_2$  は環炭素に結合しており ;

$n$  が 2 であるとき、 $R_2$  基は必ずしも同一ではない

ことを条件とし ;

$R_1$  及び  $R_2$  基は、同一の環炭素に結合することができ ;

$R_3$  は、水素、ハロゲン、シアノであるか、又は、( $C_1 - C_6$ ) アルキル、ポリフッ素化された ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、( $C_2 - C_6$ ) アルケニル、( $C_2 - C_6$ ) アルキニル、( $C_3 - C_7$ ) 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、 $-OR_6$ 、 $-SR_6$ 、 $-SO_2R_6$ 、 $-NR_4R_5$  若しくは  $-CONR_4R_5$  から選択される任意に置換されていてもよい基であり (ここで、 $R_4$ 、 $R_5$  及び  $R_6$  は上に定義した通りである) ;

但し、

X が窒素であるとき、 $R_3$  は水素又は  $NR_4R_5$  と異なり (ここで、 $R_4$  は任意に置換されていてもよいアリールであり、 $R_5$  は水素である) ; 及び

$R_1$  及び  $R_2$  は、ヒドロキシ及びヒドロキシ ( $C_1 - C_6$ ) アルキル基と異なる 1 個以上の基により置換されている

ことを条件とする]

の化合物又はその薬学的に許容される塩。

#### 【請求項 2】

X が、CH 又は窒素であり ;

A が、6 若しくは 7 員のシクロアルキル又は 6 若しくは 7 員の窒素含有ヘテロシクリルであるか、又は、A が、7 ~ 9 員の炭素二環系であり、ここで 1 個の環炭素は任意に窒素により置き換えられていてもよく ;

$R_1$  が :

1) いずれかの A 環炭素 (この場合、 $R_1$  は、フッ素、 $-COOR_4$ 、 $-CONR_4R_5$ 、 $-NR_4COOR_6$ 、 $-NR_4COR_5$ 、 $-NR_4R_5$ 、 $-NR_4CONR_4R_5$ 、 $-NR_4CSNR_4R_5$ 、又は  $-NR_4SO_2R_6$  である) ;

又は

2) 存在すれば A 環窒素 (この場合、R 1 は、- COR 5、- COOR 6、- CONR 4 R 5、- CSNR 4 R 5、又は - SO<sub>2</sub> R 6 である)

{ ここで、

R 4 及び R 5 は独立して、水素であるか、又は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリール (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリール (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルから選択される任意に置換されていてもよい基であるか；又は

R 4 及び R 5 は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、任意に N、O 及び S から選択される 1 個の追加のヘテロ原子を含有していてもよい、任意に置換されていてもよい 5 又は 6 員のヘテロシクリル基であってもよく；

R 6 は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、アリール (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリール (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルから選択される任意に置換されていてもよい基である }

のいずれかに結合しており；

n が、0、1 又は 2 であり；

R 2 が、いずれかの A 環原子に結合しており、フッ素、任意に置換されていてもよい (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル及び NR 4 R 5 からなる群から選択され；

但し、

R 2 がフッ素又は NR 4 R 5 であるとき、R 2 は環炭素に結合しており；

n が 2 であるとき、R 2 基は必ずしも同一ではない

ことを条件とし；

R 1 及び R 2 基は同一の環炭素に結合することができ；

R 3 が、水素、ハロゲン、シアノであるか、又は、ポリフッ素化された (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、ヘテロシクリル、アリール、ヘテロアリール、- OR 6 又は - CONR 4 R 5 (ここで、R 4、R 5 及び R 6 は上に定義した通りである) から選択される任意に置換されていてもよい基であり；

但し、X が窒素であるとき、R 3 は水素とは異なることを条件とする

ことを特徴とする、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物又はその薬学的に許容される塩。

#### 【請求項 3】

X が、CH 又は窒素であり；

A が、6 員のシクロアルキル又は 6 員の窒素含有ヘテロシクリルであり；

R 1 が：

1) いずれかの A 環炭素 (この場合、R 1 は、- CONR 4 R 5、- NR 4 COR 5、- NR 4 CONR 4 R 5、- NR 4 CSNR 4 R 5、又は - NR 4 SO<sub>2</sub> R 6 である)、  
又は

2) A 環窒素 (この場合、R 1 は - COR 5、- CONR 4 R 5、- CSNR 4 R 5 又は - SO<sub>2</sub> R 6 である)

{ ここで、

R 4 及び R 5 は、独立して水素であるか、又は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アリール及びヘテロアリールから選択される任意に置換されていてもよい基であり；

R 6 は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アリール及びヘテロアリールから選択される任意に置換されていてもよい基である }

のいずれかに結合しており；

n が、0、1 又は 2 であり；

R 2 が、任意に置換されていてもよい (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；

但し、

n が 2 であるとき、R 2 基は必ずしも同一ではない

ことを条件とし；

R 1 及び R 2 基は、同一の環炭素に結合することができ；

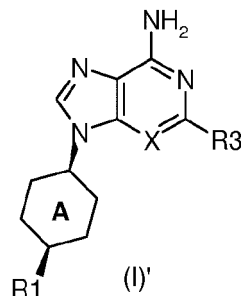
R<sub>3</sub> が、ハロゲン、シアノであるか、又は、ポリフッ素化された (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、アリール、ヘテロアリール、-OR<sub>6</sub> 及び -CONR<sub>4</sub>R<sub>5</sub> (ここで、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub> 及び R<sub>6</sub> は上に定義した通りである) から選択される任意に置換されていてもよい基である

ことを特徴とする、請求項 2 に記載の式 (I) の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 4】

下記式 (I)' :

【化 2】



[ 式中、

X は窒素であり；

A は 6 員のシクロアルキルであり、ここで、A はシス - 1, 4 - 二置換された立体配置を有し；

R<sub>1</sub> は、-CONR<sub>4</sub>R<sub>5</sub>、-NR<sub>4</sub>COR<sub>5</sub>、-NR<sub>4</sub>CONR<sub>4</sub>R<sub>5</sub> であり；

ここで、R<sub>4</sub> 及び R<sub>5</sub> は独立して、水素であるか、又は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、アリール及びヘテロアリールから選択される任意に置換されていてもよい基であり；

n は 0 であり；

R<sub>3</sub> は、ハロゲン、シアノであるか、又は、(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) アルキニル、アリール、ヘテロアリール及び -OR<sub>6</sub> から選択される任意に置換されていてもよい基であり、ここで、R<sub>6</sub> は任意に置換されていてもよい (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルである

ことを特徴とする。]

で表される、請求項 3 に記載の式 (I) の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 5】

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 3 - メトキシフェニル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 3 )、

シス - 4 - [ 6 - アミノ - 2 - ( ピリジン - 3 - イル ) - 9 H - プリン - 9 - イル ] - N - ( 3 - メトキシフェニル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 4 )、

シス - 4 - [ 6 - アミノ - 2 - ( ピリジン - 4 - イル ) - 9 H - プリン - 9 - イル ] - N - ( 3 - メトキシフェニル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 9 )、

シス - 4 - [ 6 - アミノ - 2 - ( 2 - フルオロピリジン - 4 - イル ) - 9 H - プリン - 9 - イル ] - N - ( 3 - メトキシフェニル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 15 )

、

シス - 4 - [ 6 - アミノ - 2 - ( 4 - ヒドロキシフェニル ) - 9 H - プリン - 9 - イル ] - N - ( 3 - メトキシフェニル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 17 )、

シス - 4 - [ 6 - アミノ - 2 - ( 3 - ヒドロキシフェニル ) - 9 H - プリン - 9 - イル ] - N - ( 3 - メトキシフェニル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 18 )、

シス - 4 - [ 6 - アミノ - 2 - ( 6 - フルオロピリジン - 3 - イル ) - 9 H - プリン - 9 - イル ] - N - ( 3 - メトキシフェニル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 19 )

、

シス - 4 - [ 6 - アミノ - 2 - ( 2 - メトキシピリジン - 4 - イル ) - 9 H - プリン - 9 - イル ] - N - ( 3 - メトキシフェニル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 21 )

、

3 - ( 6 - アミノ - 9 - { シス - 4 - [ ( 3 - メトキシフェニル ) カルバモイル ] シクロ  
 ヘキシル } - 9 H - プリン - 2 - イル ) ベンズアミド ( c p d 2 6 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - { 4 - [ ( トリ  
 フルオロメチル ) スルホニル ] フェニル } シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 2 7 )  
 、  
 4 - ( 6 - アミノ - 9 - { シス - 4 - [ ( 3 - メトキシフェニル ) カルバモイル ] シクロ  
 ヘキシル } - 9 H - プリン - 2 - イル ) - N - { 4 - [ ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イ  
 ル ) メチル ] フェニル } ベンズアミド ( c p d 2 9 ) 、  
 3 - ( 6 - アミノ - 9 - { シス - 4 - [ ( 3 - メトキシフェニル ) カルバモイル ] シクロ  
 ヘキシル } - 9 H - プリン - 2 - イル ) - N - { 4 - [ ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イ  
 ル ) メチル ] フェニル } ベンズアミド ( c p d 3 0 ) 、  
 3 - ( 6 - アミノ - 9 - { シス - 4 - [ ( 3 - メトキシフェニル ) カルバモイル ] シクロ  
 ヘキシル } - 9 H - プリン - 2 - イル ) - N - ( 4 - { [ 4 - ( ジメチルアミノ ) ピペリ  
 ジン - 1 - イル ] メチル } フェニル ) ベンズアミド ( c p d 3 1 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 3 , 4 - ジメ  
 トキシフェニル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 3 2 ) 、  
 4 - ( 6 - アミノ - 9 - { シス - 4 - [ ( 3 - メトキシフェニル ) カルバモイル ] シクロ  
 ヘキシル } - 9 H - プリン - 2 - イル ) - N - ( 4 - { [ 4 - ( ジメチルアミノ ) ピペリ  
 ジン - 1 - イル ] メチル } フェニル ) ベンズアミド ( c p d 3 3 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - { 4 - [ 2 - ( {  
 4 - [ ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) メチル ] - 3 - ( トリフルオロメチル ) フ  
 エニル } アミノ ) - 2 - オキソエチル ] フェニル } シクロヘキサカルボキサミド ( c p  
 d 3 5 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - { 4 - [ 2 - ( {  
 4 - [ ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) メチル ] フェニル } アミノ ) - 2 - オキソ  
 エチル ] フェニル } シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 3 6 ) 、  
 シス - 4 - [ 6 - アミノ - 2 - ( ピリジン - 4 - イル ) - 9 H - プリン - 9 - イル ] - N  
 - ( 3 , 4 - ジメトキシフェニル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 3 7 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - ヨード - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 3 - メトキシ  
 フェニル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 4 1 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - エチニル - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 3 - メトキ  
 シフェニル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 4 5 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 3 - メチルフ  
 エニル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 4 8 ) 、  
 シス - 4 - [ 6 - アミノ - 2 - ( ピリジン - 4 - イル ) - 9 H - プリン - 9 - イル ] - N  
 - ( 3 - メチルフエニル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 5 0 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) シクロヘキサカルボ  
 キサミド ( c p d 5 3 ) 、  
 シス - 4 - [ 6 - アミノ - 2 - ( 3 - ヒドロキシプロパ - 1 - イン - 1 - イル ) - 9 H -  
 プリン - 9 - イル ] - N - ( 3 - メトキシフェニル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c  
 p d 6 0 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - [ 5 - ( トリフ  
 ルオロメチル ) - 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - イル ] シクロヘキサカルボキサミ  
 ド ( c p d 6 4 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4 - メチル -  
 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 6 5 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 1 , 3 - ベン  
 ゴチアゾール - 6 - イル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 6 9 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - ヨード - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4 - メチル -  
 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 7 0 ) 、

4 - ( { [ シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) シクロヘキシル ] カルボニル } アミノ ) - N - シクロヘキシルベンズアミド ( c p d 7 1 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 7 2 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 5 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 7 3 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4 - フェニル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 7 4 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 7 5 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( ピリジン - 2 - イル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 7 6 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - エチニル - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 7 7 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 1 H - イミダゾール - 2 - イル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 7 9 ) 、  
 シス - 4 - [ 6 - アミノ - 2 - ( ピリジン - 4 - イル ) - 9 H - プリン - 9 - イル ] - N - ( 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 8 1 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - メトキシ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 3 - メトキシフェニル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 8 3 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - メトキシ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 8 4 ) 、  
 3 - ( 6 - アミノ - 9 - { シス - 4 - [ ( 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) カルバモイル ] シクロヘキシル } - 9 H - プリン - 2 - イル ) - N - ( 4 - { [ 4 - ( ジメチルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ] メチル } フェニル ) ベンズアミドビス - トリフルオロアセテート ( c p d 8 5 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - { 4 - [ 2 - ( 1 , 4 ' - ビピペラジン - 1 ' - イル ) - 2 - オキシエチル ] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 8 6 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - シクロプロピル - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 3 - メトキシフェニル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 8 7 ) 、  
 メチルシス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) シクロヘキサカルボキシレート ( c p d 8 8 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - [ 6 - ( メチルスルホニル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ] シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 8 9 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 6 - クロロ - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 9 0 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4 - メトキシ - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 9 1 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 6 - メトキシ - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 9 2 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 5 , 6 - ジメチル - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 9 3 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 5 - クロロ - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ) シクロヘキサカルボキサミド ( c p d 9 4 )

、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 1 - メチル - 1 H - ベンズイミダゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 9 5 ) 、  
 3 - ( 6 - アミノ - 9 - { シス - 4 - [ ( 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) カルバモイル ] シクロヘキシル } - 9 H - プリン - 2 - イル ) ベンズアミド ( c p d 9 6 ) 、  
 3 - ( 6 - アミノ - 9 - { トランス - 4 - [ ( 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) カルバモイル ] シクロヘキシル } - 9 H - プリン - 2 - イル ) ベンズアミド ( c p d 9 7 ) 、  
 シス - 4 - { 6 - アミノ - 2 - [ ( トリメチルシリル ) エチニル ] - 9 H - プリン - 9 - イル } - N - ( 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 9 8 ) 、  
 シス - 4 - { 6 - アミノ - 2 - [ 3 - ( ベンジルオキシ ) フェニル ] - 9 H - プリン - 9 - イル } - N - ( 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 0 0 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - シアノ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 0 2 ) 、  
 シス - 4 - [ 6 - アミノ - 2 - ( 3 - ヒドロキシフェニル ) - 9 H - プリン - 9 - イル ] - N - ( 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 0 3 ) 、  
 シス - 4 - [ 6 - アミノ - 2 - ( 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) - 9 H - プリン - 9 - イル ] - N - ( 3 - メトキシフェニル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 0 7 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 5 - メチル - 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 0 8 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 1 , 5 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 0 9 ) 、  
 シス - 4 - [ 6 - アミノ - 2 - ( 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) - 9 H - プリン - 9 - イル ] - N - ( 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 1 2 ) 、  
 トランス - 4 - [ 6 - アミノ - 2 - ( 1 H - ピラゾール - 3 - イル ) - 9 H - プリン - 9 - イル ] - N - ( 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 1 3 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 5 - クロロ - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 1 4 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - [ 4 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ] シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 1 5 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - ヨード - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4 - メトキシ - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 1 6 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - エチニル - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4 - メトキシ - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 1 9 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - { 4 - [ ( 4 - アミノピペリジン - 1 - イル ) メチル ] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 2 0 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4 - ヒドロキシ - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 2 2 ) 、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - フルオロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 2 4 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - フルオロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4 - メトキシ - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 2 6 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - フルオロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4 - ヒドロキシ - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 2 7 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - フルオロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 6 - フルオロ - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 2 8 ) 、  
 シス - 4 - [ 6 - アミノ - 2 - ( トリフルオロメチル ) - 9 H - プリン - 9 - イル ] - N - ( 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 2 9 ) 、  
 シス - 4 - [ 6 - アミノ - 2 - ( トリフルオロメチル ) - 9 H - プリン - 9 - イル ] - N - ( 6 - フルオロ - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 3 2 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 6 - フルオロ - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 3 4 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - [ 4 - ( 2 - アミノ - 2 - オキソエチル ) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ] シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 3 5 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 6 - ヒドロキシ - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 3 7 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( [ 1 , 3 ] チアゾロ [ 5 , 4 - c ] ピリジン - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 3 8 ) 、  
 N - [ シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) シクロヘキシル ] - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - カルボキサミド ( c p d 1 3 9 ) 、  
 N - [ シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) シクロヘキシル ] - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ( c p d 1 4 0 ) 、  
 N - [ シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) シクロヘキシル ] - 3 - メトキシベンゼンスルホンアミド ( c p d 1 4 1 ) 、  
 N - [ シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) シクロヘキシル ] - 3 - メトキシベンズアミド ( c p d 1 4 4 ) 、  
 6 - アミノ - 9 - { シス - 4 - [ ( 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) カルバモイル ] シクロヘキシル } - 9 H - プリン - 2 - カルボキサミド ( c p d 1 4 6 ) 、  
 2 - アミノ - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 6 - イルシス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) シクロヘキサンカルボキシレート ( c p d 1 5 9 ) 、  
 2 - アミノ - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 4 - イルシス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - フルオロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) シクロヘキサンカルボキシレート ( c p d 1 6 0 ) 、  
 2 - ( { [ シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) シクロヘキシル ] カルボニル } アミノ ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 6 - カルボキサミド ( c p d 1 6 3 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - [ 4 - ( 2 - アミノ - 2 - オキソエチル ) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ] - N - メチルシクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 6 4 ) 、  
 シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - [ 6 - ( ジメチ



ルアミノ) - 1, 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル] シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 6 5 )、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - [ 5 - ( 2 - アミノ - 2 - オキシエチル ) - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル ] シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 6 6 )、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4, 6 - ジフルオロ - 1, 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 6 7 )、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 5, 6 - ジフルオロ - 1, 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 6 8 )、

t e r t - ブチル 2 - ( { [ シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) シクロヘキシル ] カルボニル } アミノ ) - 6, 7 - ジヒドロ [ 1, 3 ] チアゾロ [ 5, 4 - c ] ピリジン - 5 ( 4 H ) - カルボキシレート ( c p d 1 6 9 )、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - メトキシ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 6 - フルオロ - 1, 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 7 0 )、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 5, 6, 7 - トリフルオロ - 1, 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 7 1 )、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4, 5, 6, 7 - テトラヒドロ [ 1, 3 ] チアゾロ [ 5, 4 - c ] ピリジン - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド塩酸塩 ( c p d 1 7 2 )、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 5 - メチル - 4, 5, 6, 7 - テトラヒドロ [ 1, 3 ] チアゾロ [ 5, 4 - c ] ピリジン - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 7 3 )、

メチル [ 2 - ( { [ シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) シクロヘキシル ] カルボニル } アミノ ) - 1, 3 - ベンゾチアゾール - 6 - イル ] アセテート ( c p d 1 7 4 )、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 6 - プロモ - 1, 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 7 5 )、

[ 2 - ( { [ シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) シクロヘキシル ] カルボニル } アミノ ) - 1, 3 - ベンゾチアゾール - 6 - イル ] 酢酸 ( c p d 1 7 6 )、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - [ 6 - ( 2 - アミノ - 2 - オキシエチル ) - 1, 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ] シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 7 7 )、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4, 4, 6, 6 - テトラメチル - 4, 5, 6, 7 - テトラヒドロ [ 1, 3 ] チアゾロ [ 5, 4 - c ] ピリジン - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 7 8 )、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - フルオロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 5 - メチル - 4, 5, 6, 7 - テトラヒドロ [ 1, 3 ] チアゾロ [ 5, 4 - c ] ピリジン - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 7 9 )、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - [ 6 - ( ジフルオロメトキシ ) - 1, 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ] シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 8 0 )、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - [ 6 - ( トリフルオロメトキシ ) - 1, 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ] シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 8 1 )、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - [ 5 - ( プロパン - 2 - イル ) - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ [ 1 , 3 ] チアゾロ [ 5 , 4 - c ] ピリジン - 2 - イル ] シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 8 2 ) 、

シス - N - [ 6 - ( アセチルアミノ ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ] - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 8 3 ) 、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 5 - シクロプロピル - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ [ 1 , 3 ] チアゾロ [ 5 , 4 - c ] ピリジン - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 8 4 ) 、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 6 , 7 - ジヒドロ - 4 H - ピラノ [ 4 , 3 - d ] [ 1 , 3 ] チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 8 5 ) 、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( [ 1 , 3 ] ジオキソロ [ 4 , 5 - f ] [ 1 , 3 ] ベンゾチアゾール - 6 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 8 6 ) 、

t e r t - ブチル ( 5 S , 8 R ) - 2 - ( { [ シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) シクロヘキシル ] カルボニル } アミノ ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 4 H - 5 , 8 - エピミノシクロヘプタ [ d ] [ 1 , 3 ] チアゾール - 9 - カルボキシレート ( c p d 1 8 7 ) 、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 6 , 6 - ジフルオロ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 8 8 ) 、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - [ ( 5 S , 8 R ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 4 H - 5 , 8 - エピミノシクロヘプタ [ d ] [ 1 , 3 ] チアゾール - 2 - イル ] シクロヘキサンカルボキサミド塩酸塩 ( c p d 1 8 9 ) 、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - フルオロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4 , 4 , 6 , 6 - テトラメチル - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ [ 1 , 3 ] チアゾロ [ 5 , 4 - c ] ピリジン - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 9 0 ) 、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - フルオロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 6 , 6 - ジフルオロ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 9 1 ) 、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 5 , 5 - ジオキシド - 6 , 7 - ジヒドロ - 4 H - チオピラノ [ 4 , 3 - d ] [ 1 , 3 ] チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 9 4 ) 、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 6 , 6 - ジメチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 4 H - ピラノ [ 4 , 3 - d ] [ 1 , 3 ] チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 9 5 ) 、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - [ 5 - ( 2 - アミノ - 2 - オキソエチル ) - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ [ 1 , 3 ] チアゾロ [ 5 , 4 - c ] ピリジン - 2 - イル ] シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 9 6 ) 、

1 - [ シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) シクロヘキシル ] - 3 - ( 3 - メトキシフェニル ) 尿素 ( c p d 1 1 9 7 ) 、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - ヨード - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 5 - メチル - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ [ 1 , 3 ] チアゾロ [ 5 , 4 - c ] ピリジン - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 9 8 ) 、

シス - 4 - { 6 - アミノ - 2 - [ ( トリメチルシリル ) エチニル ] - 9 H - プリン - 9 - イル } - N - ( 5 - メチル - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ [ 1 , 3 ] チアゾロ [ 5 , 4 - c ] ピリジン - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 1 9 9 ) 、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - フルオロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 6 , 7 - ジヒドロ - 4 H - ピラノ [ 4 , 3 - d ] [ 1 , 3 ] チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサン

カルボキサミド (c p d 2 0 0)、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - エチニル - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 5 - メチル - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ [ 1 , 3 ] チアゾロ [ 5 , 4 - c ] ピリジン - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 2 0 1 )、

シス - 4 - ( 4 - アミノ - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 1 - イル ) - N - ( 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 2 0 4 )、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 2 0 5 )、

シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - フルオロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) - N - ( 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 2 0 6 )

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の式 ( I ) の化合物 ( c p d ) 又はその薬学的に許容される塩。

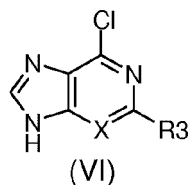
【請求項 6】

以下の一連のステップのいずれか 1 つを含む、請求項 1 に記載の式 ( I ) の化合物又はその薬学的に許容される塩の製造方法であって：

シーケンス A：

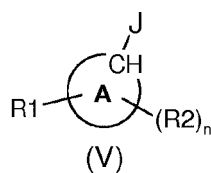
ステップ a ) 式 ( V I )：

【化 3】



( 式中、X 及び R 3 は請求項 1 に定義されている通りである ) の中間体化合物を、式 ( V )：

【化 4】

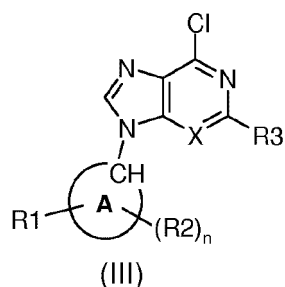


( 式中、A、R 1、R 2 及び n は請求項 1 に定義されている通りであり、J は、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、メタンスルホニル ( - O M s ) 及び p - トルエンスルホニル ( - O T s ) からなる群から選択される )

の中間体化合物によりアルキル化するステップ；

ステップ b ) 得られた式 ( I I I )

## 【化 5】



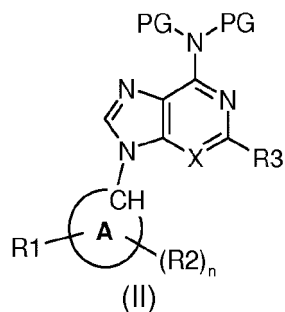
(式中、X、A、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>及びnは、請求項1に定義されている通りである)  
 の中間体化合物の塩素を、保護された窒素源化合物：NH(PG)<sub>2</sub> (I V)

(ここで、PGは独立して、水素又は保護基-COOR<sub>7</sub>(ここで、R<sub>7</sub>は、例えばメチル、エチル若しくはtert-ブチルのような(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、又は例えばベンジルのようなアリール(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルである)であり、但し、かかるPGは同時に水素ではないことを条件とする)

により置換するステップ；及び

ステップc) 得られた式(I I)

## 【化 6】



(式中、X、A、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、PG及びnは、上に定義されている通りである)  
 の中間体化合物の保護基PGを除去して、請求項1に記載の一般式(I)の化合物を得る  
 ステップ；

又は

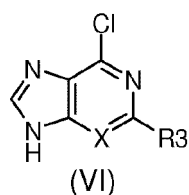
ステップd) ステップa)で得られた式(I I I)の中間体化合物の塩素を、アンモニア溶液のような窒素源により置換して、請求項1に記載の一般式(I)の化合物を得る  
 ステップ；

或いは、

シーケンスB

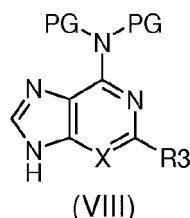
ステップb') ステップa)に定義されている式(V I)：

## 【化 7】



の中間体化合物の塩素を、ステップb)に記載されている保護された窒素源化合物：NH(PG)<sub>2</sub> (I V) により置換して、式(V I I I)：

## 【化 8】

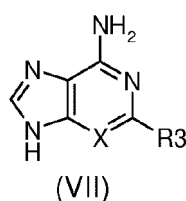


(式中、X、R<sub>3</sub>及びPGは、上に定義されている通りである)  
の中間体化合物を得るステップ；

又は

ステップd') 上に定義されている式(VI)の中間体化合物の塩素を、ステップd)に記載されているアンモニア溶液のような窒素源により置換するステップ；及び  
ステップe) 得られた式(VII)

## 【化 9】



(式中、X及びR<sub>3</sub>は、請求項1に定義されている通りである)  
の中間体化合物のNH<sub>2</sub>基を、式(PG)<sub>2</sub>O又はPGClの試薬により保護して、ステップb')に定義されている式(VIII)の中間体化合物を得るステップ；

次いで

ステップa') ステップb')又はステップe)のいずれかで得られた式(VIII)の保護された中間体化合物を、ステップa)に定義されている式(V)の中間体化合物により、そこに記載されている条件でアルキル化するステップ；

ステップc) 得られた、シーケンスAのステップc)に定義されている式(II)の中間体化合物の保護基PGを除去して、請求項1に記載の一般式(I)の化合物を得るステップ；

或いは

シーケンスC

ステップd') シーケンスBに記載の式(VI)の中間体化合物の塩素を置換するステップ；

ステップa'') 得られたシーケンスBに定義されている式(VII)の中間体化合物を、ステップa)に定義されている式(V)の中間体により、そこに記載されている条件にしたがってアルキル化するステップ；

任意に、式(I)の第1の化合物を式(I)の第2の化合物に変換し、所望であれば、式(I)の化合物をその薬学的に許容される塩に変換するか又は塩を遊離の化合物(I)に変換するステップ

を含む、前記製造方法。

## 【請求項 7】

治療上有効量の、請求項1に記載の式(I)の化合物又はその薬学的に許容される塩、及び少なくとも1種の薬学的に許容される賦形剤、担体又は希釈剤を含む医薬組成物。

## 【請求項 8】

さらに１種以上の化学療法剤を含む、請求項７に記載の医薬組成物。

【請求項９】

抗がん治療において、同時に、別個に、又は逐次使用するための組合せ製剤としての、請求項８に記載の医薬組成物。

【請求項１０】

医薬として使用するための、請求項１に記載の式（Ⅰ）の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項１１】

変化したコリン代謝により引き起こされる、及び／又は、変化したコリン代謝に関連する病気を患っている哺乳動物を治療するための、請求項１に記載の式（Ⅰ）の化合物又はその薬学的に許容される塩を含む、医薬組成物。

【請求項１２】

哺乳動物がヒトである、請求項１１に記載の医薬組成物。

【請求項１３】

病気が、がん、細胞増殖性疾患、感染症、免疫関連疾患及び神経変性疾患からなる群から選択される、請求項１２に記載の医薬組成物。

【請求項１４】

病気ががんである、請求項１３に記載の医薬組成物。

【請求項１５】

がんが、

膀胱、乳房、結腸、腎臓、肝臓、小細胞肺癌を含む肺、食道、胆嚢、卵巣、膵臓、胃、頸部、甲状腺、前立腺、及び扁平上皮癌を含む皮膚のような癌腫；

白血病、急性リンパ性白血病、急性リンパ芽球性白血病、Ｂ－細胞リンパ腫、Ｔ－細胞リンパ腫、ホジキンリンパ腫、非ホジキンリンパ腫、毛様細胞リンパ腫及びバーキットリンパ腫を含むリンパ系の造血器腫瘍；

急性及び慢性の骨髄性白血病、骨髄異形成症候群並びに前骨髄球性白血病を含む骨髄細胞系列の造血器腫瘍；

繊維肉腫及び横紋筋肉腫を含む間葉起源の腫瘍；

星状細胞腫、神経芽細胞腫、神経膠腫及び神経鞘腫を含む中枢及び末梢神経系の腫瘍；並びに

黒色腫、精上皮腫、奇形癌腫、骨肉腫、色素性乾皮症、ケラトキサントーマ、甲状腺乳頭癌及び甲状腺髄様癌のような甲状腺がん、及びカボジ肉腫を含む他の腫瘍からなる群から選択される、請求項１４に記載の医薬組成物。