

【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

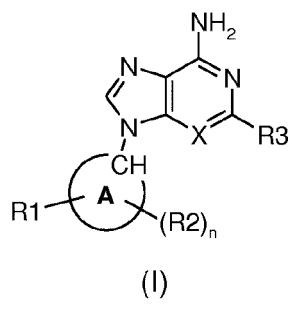
【補正の内容】

【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；

R1は：

1) いずれかのA環炭素(この場合、R1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<sub>6</sub>、-COOR<sub>4</sub>、-CONR<sub>4</sub>R<sub>5</sub>、-NR<sub>4</sub>COOR<sub>6</sub>、-NR<sub>4</sub>COR<sub>5</sub>、-NR<sub>4</sub>R<sub>5</sub>、-NR<sub>4</sub>CONR<sub>4</sub>R<sub>5</sub>、-NR<sub>4</sub>C<sub>n</sub>NR<sub>4</sub>R<sub>5</sub>、又は-NR<sub>4</sub>SO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>である) ;

又は

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

{ 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、( $C_1 - C_6$ ) 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<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって、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<sub>6</sub>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<sub>2</sub>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<sub>4</sub>R<sub>5</sub>からなる群から選択され;

但し、

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

nが2であるとき、R<sub>2</sub>基は必ずしも同一ではない

ことを条件とし;

R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>基は、同一の環炭素に結合することができ;

R<sub>3</sub>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<sub>6</sub>、-SR<sub>6</sub>、-SO<sub>2</sub>R<sub>6</sub>、-NR<sub>4</sub>R<sub>5</sub>若しくは-CONR<sub>4</sub>R<sub>5</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>4</sub>、R<sub>5</sub>及びR<sub>6</sub>は上に定義した通りである);

但し、

Xが窒素であるとき、R<sub>3</sub>は水素又はNR<sub>4</sub>R<sub>5</sub>と異なり(ここで、R<sub>4</sub>は任意に置換されていてもよいアリールであり、R<sub>5</sub>は水素である); 及び

R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>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<sub>1</sub>が:

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

又は

2) 存在すれば A 環窒素(この場合、R 1 は、-COR5、-COOR6、-CONR4R5、-CSNR4R5、又は-SO<sub>2</sub>R6 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になって、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、任意に置換されてもよい(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル及び NR4R5 からなる群から選択され；

但し、

R 2 がフッ素又は NR4R5 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、-OR6 又は -CONR4R5 (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、-CONR4R5、-NR4COR5、-NR4CONR4R5、-NR4CSNR4R5、又は-NR4SO<sub>2</sub>R6 である)、又は

2) A 環窒素(この場合、R 1 は -COR5、-CONR4R5、-CSNR4R5 又は -SO<sub>2</sub>R6 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；

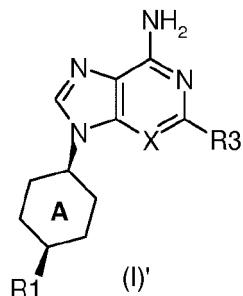
R<sub>3</sub>が、ハロゲン、シアノであるか、又は、ポリフッ素化された(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)アルキニル、アリール、ヘテロアリール、-OR<sub>6</sub>及び-CO-NR<sub>4</sub>R<sub>5</sub>(ここで、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>及びR<sub>6</sub>は上に定義した通りである)から選択される任意に置換されていてもよい基である

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-9H-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(cpd3)、

シス-4-[6-アミノ-2-(ピリジン-3-イル)-9H-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(cpd4)、

シス-4-[6-アミノ-2-(ピリジン-4-イル)-9H-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(cpd9)、

シス-4-[6-アミノ-2-(2-フルオロピリジン-4-イル)-9H-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(cpd15)、

、

シス-4-[6-アミノ-2-(4-ヒドロキシフェニル)-9H-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(cpd17)、

シス-4-[6-アミノ-2-(3-ヒドロキシフェニル)-9H-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(cpd18)、

シス-4-[6-アミノ-2-(6-フルオロピリジン-3-イル)-9H-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(cpd19)、

、

シス-4-[6-アミノ-2-(2-メトキシピリジン-4-イル)-9H-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(cpd21)、

、

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 } シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) フェニル } アミノ ) - 2 - オキソエチル ] フェニル } シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 } シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 - メチルフェニル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 - メチルフェニル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( c p d 5 0 ) 、  
シス - 4 - ( 6 - アミノ - 2 - クロロ - 9 H - プリン - 9 - イル ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ] シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキシレート ( 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 ] シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ) シクロヘキサンカルボキサミド ( 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 ] シクロヘキシリル } - 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 ] シクロヘキシリル } - 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 ) シクロヘキシリル ] - 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 ) シクロヘキシリル ] - 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 ) シクロヘキシリル ] - 3 - メトキシベンゼンスルホニアミド ( 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 ) シクロヘキシリル ] - 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 ] シクロヘキシリル } - 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 ) シクロヘキシリル ] 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 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 ) 、  
 tert - 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 - オキソエチル ) - 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 ) 、  
tert - 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 ) シクロヘキシリル ] 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 ) シクロヘキシリル ] - 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。

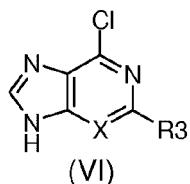
#### 【請求項 6】

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 ) :

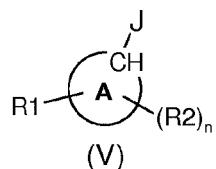
#### 【化 3】



( 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】

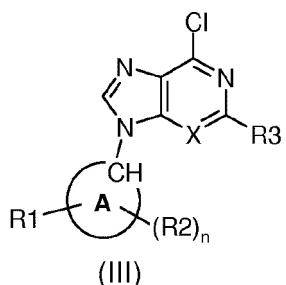


( 式中、 A 、 R 1 、 R 2 及び n は請求項 1 に定義されている通りであり、 J は、臭素、ヨウ素、ヒドロキシ、メタンスルホニル ( - O M s ) 及び p - トルエンスルホニル ( - O T s ) からなる群から選択される )

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】

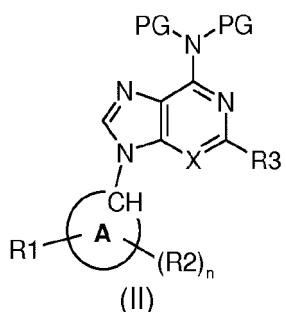


(式中、X、A、R1、R2、R3及びnは、請求項1に定義されている通りである)  
の中間体化合物の塩素を、保護された窒素源化合物：NH(PG)<sub>2</sub> (IV)  
(ここで、PGは独立して、水素又は保護基-COOR7(ここで、R7は、例えばメチル、エチル若しくはtert-ブチルのような(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、又は例えばベンジルのようなアリール(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルである)であり、但し、かかるPGは同時に水素ではないことを条件とする)

により置換するステップ；及び

ステップc) 得られた式(II)

## 【化6】



(式中、X、A、R1、R2、R3、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

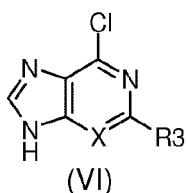
ステップd) ステップa)で得られた式(III)の中間体化合物の塩素を、アンモニア溶液のような窒素源により置換して、請求項1に記載の一般式(I)の化合物を得る  
ステップ；

或いは、

シーケンスB

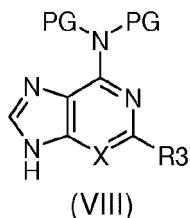
ステップb') ステップa)に定義されている式(VI)：

## 【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> (IV)により置換して、式(VII)：

## 【化8】



(式中、X、R3及びPGは、上に定義されている通りである)

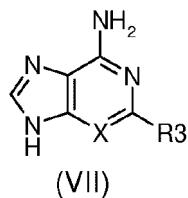
の中間体化合物を得るステップ；

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R3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(VII)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(VII)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、小細胞肺がんを含む肺、食道、胆嚢、卵巣、脾臓、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髓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。