

【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27年11月19日 (2015.11.19)

【公表番号】特表2014-528436(P2014-528436A)

【公表日】平成26年10月27日 (2014.10.27)

【年通号数】公開・登録公報2014-059

【出願番号】特願2014-533911(P2014-533911)

【国際特許分類】

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/5386 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 495/04 1 0 5 Z

C 0 7 D 495/04 1 1 1

C 0 7 D 519/00 C S P

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/5386

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成27年9月29日 (2015.9.29)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 3 0 5

## 【補正方法】変更

## 【補正の内容】

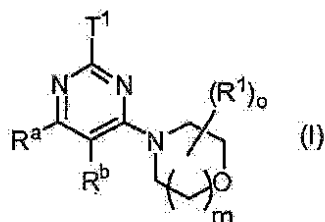
## 【0305】

ラットでの薬物動態学、例えば化合物2、6および30は、それぞれ0.16uM、0.27uMおよび0.32uMの血漿レベル( $C_{max}$ )および7%、26%および69%の経口バイオアベイラビリティをもたらした。

本発明の実施形態として、例えば以下を挙げることができる。

## (1) 式(I):

## 【化66】



(式中、

$m$ は1または2であり；

$o$ は1、2、3または4であり；

各 $R^1$ は、H；ハロゲン；CN； $C(O)OR^2$ ； $OR^{2a}$ ；オキソ(=O)； $C(O)R^2$ ； $C(O)N(R^2R^{2a})$ ； $S(O)_2N(R^2R^{2a})$ ； $S(O)N(R^2R^{2a})$ ； $S(O)_2R^2$ ； $S(O)R^2$ ； $N(R^2)S(O)_2N(R^{2a}R^{2b})$ ； $N(R^2)S(O)N(R^{2a}R^{2b})$ ； $SR^2$ ； $N(R^2R^{2a})$ ； $NO_2$ ； $OC(O)R^2$ ； $N(R^2)C(O)R^{2a}$ ； $N(R^2)S(O)_2R^{2a}$ ； $N(R^2)S(O)R^{2a}$ ； $N(R^2)C(O)N(R^{2a}R^{2b})$ ； $N(R^2)C(O)OR^{2a}$ ； $OC(O)N(R^2R^{2a})$ ；および $C_1 \sim 6$ アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$ アルキルは同じかまたは異なっている1つ以上の $R^3$ で任意選択で置換されており；

任意選択で、2つの $R^1$ は、それらが結合している環と一緒に結合して8～11員ヘテロピサイクルを形成しており；

$R^2$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ は、H； $C_1 \sim 6$ アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$ アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲンで任意選択で置換されており；

$R^3$ は、ハロゲン；CN； $C(O)OR^4$ ； $OR^4$ ； $C(O)R^4$ ； $C(O)N(R^4R^{4a})$ ； $S(O)_2N(R^4R^{4a})$ ； $S(O)N(R^4R^{4a})$ ； $S(O)_2R^4$ ； $S(O)R^4$ ； $N(R^4)S(O)_2N(R^{4a}R^{4b})$ ； $N(R^4)S(O)N(R^{4a}R^{4b})$ ； $SR^4$ ； $N(R^4R^{4a})$ ； $NO_2$ ； $OC(O)R^4$ ； $N(R^4)C(O)R^{4a}$ ； $N(R^4)S(O)_2R^{4a}$ ； $N(R^4)S(O)R^{4a}$ ； $N(R^4)C(O)N(R^{4a}R^{4b})$ ； $N(R^4)C(O)OR^{4a}$ ；または $OC(O)N(R^4R^{4a})$ ；であり、

$R^4$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$ は、H；および $C_1 \sim 6$ アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$ アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲンで任意選択で置換されており；

$T^1$ は、フェニル；または5～6員芳香族複素環であり、 $T^1$ は、 $N(R^{5a})C(O)N(R^{5b}R^5)$ または $N(R^{5a})C(O)OR^5$ で置換されており、同じかまたは異なっている1つ以上の $R^6$ で任意選択でさらに置換されており；

$R^6$ は、ハロゲン；CN； $C(O)OR^7$ ； $OR^7$ ； $C(O)R^7$ ； $C(O)N(R^7R^{7a})$ ； $S(O)_2N(R^7R^{7a})$ ； $S(O)N(R^7R^{7a})$ ； $S(O)_2R^7$ ； $S(O)R^7$ ； $N(R^7)S(O)_2N(R^{7a}R^{7b})$ ； $N(R^7)S(O)N(R^{7a}R^{7b})$ ； $SR^7$ ； $N(R^7R^{7a})$ ； $NO_2$ ； $OC(O)R^7$ ； $N(R^7)C(O)R^{7a}$ ； $N(R^7)S(O)_2R^{7a}$ ； $N(R^7)S(O)R^{7a}$ ； $N(R^7)C(O)N(R^{7a}R^{7b})$ ； $N(R^7)C(O)OR^{7a}$ ； $OC(O)N(R^7R^{7a})$ ；または $C_1 \sim 6$ アルキルであり、 $C_1 \sim 6$ アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲンで任意選択で置換されており；

$R^{5a}$ 、 $R^{5b}$ 、 $R^7$ 、 $R^{7a}$ 、 $R^{7b}$ は、H； $C_1 \sim 6$ アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$ アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲンで任意選択で置換されており；

$R^5$ は、H； $T^2$ ；および $C_1 \sim 6$ アルキルであり、 $C_1 \sim 6$ アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上の $R^8$ で任意選択で置換されており；

$R^8$ は、ハロゲン；CN； $C(O)OR^9$ ； $OR^9$ ； $C(O)R^9$ ； $C(O)N(R^9R^{9a})$ ； $S(O)_2N(R^9R^{9a})$ ； $S(O)N(R^9R^{9a})$ ；

$R^9$ ;  $S(O)_2R^9$ ;  $S(O)R^9$ ;  $N(R^9)S(O)_2N(R^9aR^9b)$ ;  $N(R^9)S(O)N(R^9aR^9b)$ ;  $SR^9$ ;  $N(R^9R^9a)$ ;  $NO_2$ ;  $OC(O)R^9$ ;  $N(R^9)C(O)R^9a$ ;  $N(R^9)S(O)_2R^9a$ ;  $N(R^9)S(O)R^9a$ ;  $N(R^9)C(O)N(R^9aR^9b)$ ;  $N(R^9)C(O)OR^9a$ ;  $OC(O)N(R^9R^9a)$ ; または  $T^2$ ; であり;

$R^9$ 、 $R^9a$ 、 $R^9b$ は、H; および  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲンで任意選択で置換されており;

任意選択で、 $R^5$ 、 $R^{5b}$ は結合して、それらが結合している窒素原子と一緒に、環ヘテロ原子として少なくとも窒素原子を含有する4~7員ヘテロシクリル環; または8~11員ヘテロビシクリル環を形成しており、4~7員ヘテロシクリル環; および8~11員ヘテロビシクリル環は、同じかまたは異なっている1つ以上の  $R^{10}$  で任意選択で置換されており;

$T^2$ は、 $C_3 \sim 7$  シクロアルキル; 4~7員ヘテロシクリル; 4~7員ヘテロアリール; 8~11員ヘテロビシクリル; フェニル; ナフチル; インデニル; またはインダニルであり、 $T^2$ は、同じかまたは異なっている1つ以上の  $R^{10}$  で任意選択で置換されており;

$R^{10}$ は、ハロゲン;  $CN$ ;  $C(O)OR^{11}$ ;  $OR^{11}$ ; オキソ(=O)(この場合、その環は少なくとも部分的に飽和している);  $C(O)R^{11}$ ;  $C(O)N(R^{11}R^{11a})$ ;  $S(O)_2N(R^{11}R^{11a})$ ;  $S(O)N(R^{11}R^{11a})$ ;  $S(O)_2R^{11}$ ;  $S(O)R^{11}$ ;  $N(R^{11})S(O)_2N(R^{11a}R^{11b})$ ;  $N(R^{11})S(O)N(R^{11a}R^{11b})$ ;  $SR^{11}$ ;  $N(R^{11}R^{11a})$ ;  $NO_2$ ;  $OC(O)R^{11}$ ;  $N(R^{11})C(O)R^{11a}$ ;  $N(R^{11})S(O)_2R^{11a}$ ;  $N(R^{11})S(O)R^{11a}$ ;  $N(R^{11})C(O)N(R^{11a}R^{11b})$ ;  $N(R^{11})C(O)OR^{11a}$ ;  $OC(O)N(R^{11}R^{11a})$ ; または  $C_1 \sim 6$  アルキルであり、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上の  $R^{12}$  で任意選択で置換されており;

$R^{11}$ 、 $R^{11a}$ 、 $R^{11b}$ は、H;  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲンで任意選択で置換されており;

$R^{12}$ は、ハロゲン;  $CN$ ;  $C(O)OR^{13}$ ;  $OR^{13}$ ;  $C(O)R^{13}$ ;  $C(O)N(R^{13}R^{13a})$ ;  $S(O)_2N(R^{13}R^{13a})$ ;  $S(O)N(R^{13}R^{13a})$ ;  $S(O)_2R^{13}$ ;  $S(O)R^{13}$ ;  $N(R^{13})S(O)_2N(R^{13a}R^{13b})$ ;  $N(R^{13})S(O)N(R^{13a}R^{13b})$ ;  $SR^{13}$ ;  $N(R^{13}R^{13a})$ ;  $NO_2$ ;  $OC(O)R^{13}$ ;  $N(R^{13})C(O)R^{13a}$ ;  $N(R^{13})S(O)_2R^{13a}$ ;  $N(R^{13})S(O)R^{13a}$ ;  $N(R^{13})C(O)N(R^{13a}R^{13b})$ ;  $N(R^{13})C(O)OR^{13a}$ ; または  $OC(O)N(R^{13}R^{13a})$ ; であり、

$R^{13}$ 、 $R^{13a}$ 、 $R^{13b}$ は、H; および  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲンで任意選択で置換されており;

$R^a$ 、 $R^b$ は結合して  $-(CR^{14}R^{14a})_p-S(O)_r-(CR^{14b}R^{14c})_q-$  を形成しており;

$r$ は0、1または2であり;

$p$ 、 $q$ は0、1、2または3であり、但し  $p+q$ は2、3または4であり;

$R^{14}$ 、 $R^{14a}$ 、 $R^{14b}$ 、 $R^{14c}$ は、H; ハロゲン;  $CN$ ;  $C(O)OR^{15}$ ;  $OR^{15}$ ;  $C(O)R^{15}$ ;  $C(O)N(R^{15}R^{15a})$ ;  $S(O)_2N(R^{15}R^{15a})$ ;  $S(O)N(R^{15}R^{15a})$ ;  $S(O)_2R^{15}$ ;  $S(O)R^{15}$ ;  $N(R^{15})S(O)_2N(R^{15a}R^{15b})$ ;  $N(R^{15})S(O)N(R^{15a}R^{15b})$ ;  $SR^{15}$ ;  $N(R^{15}R^{15a})$ ;  $NO_2$ ;  $OC(O)R^{15}$ ;  $N(R^{15})C(O)R^{15a}$ ;  $N(R^{15})S(O)_2R^{15a}$ ;  $N(R^{15})S(O)R^{15a}$ ;  $N(R^{15})C(O)N(R^{15a}R^{15b})$ ;  $N(R^{15})C(O)OR^{15a}$ ;  $OC(O)N(R^{15}R^{15a})$ ; または  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上の  $R^{16}$  で任意選択で置換されており;

任意選択で、対  $R^{14}$ 、 $R^{14a}$  および  $R^{14b}$ 、 $R^{14c}$  の一方またはそれらの両方の対はオキソ基(=O)を形成しており;

任意選択で、 $R^{14}$ 、 $R^{14a}$ ;  $R^{14}$ 、 $R^{14b}$ ;  $p>1$  の場合の2つの隣接する  $R^{14}$ ; および  $q>1$  の場合の2つの隣接する  $R^{14b}$  からなる群から選択される対の1つは、結合して、それらが結合している環と一緒に、6~11員ヘテロビサイクルを形成しており;

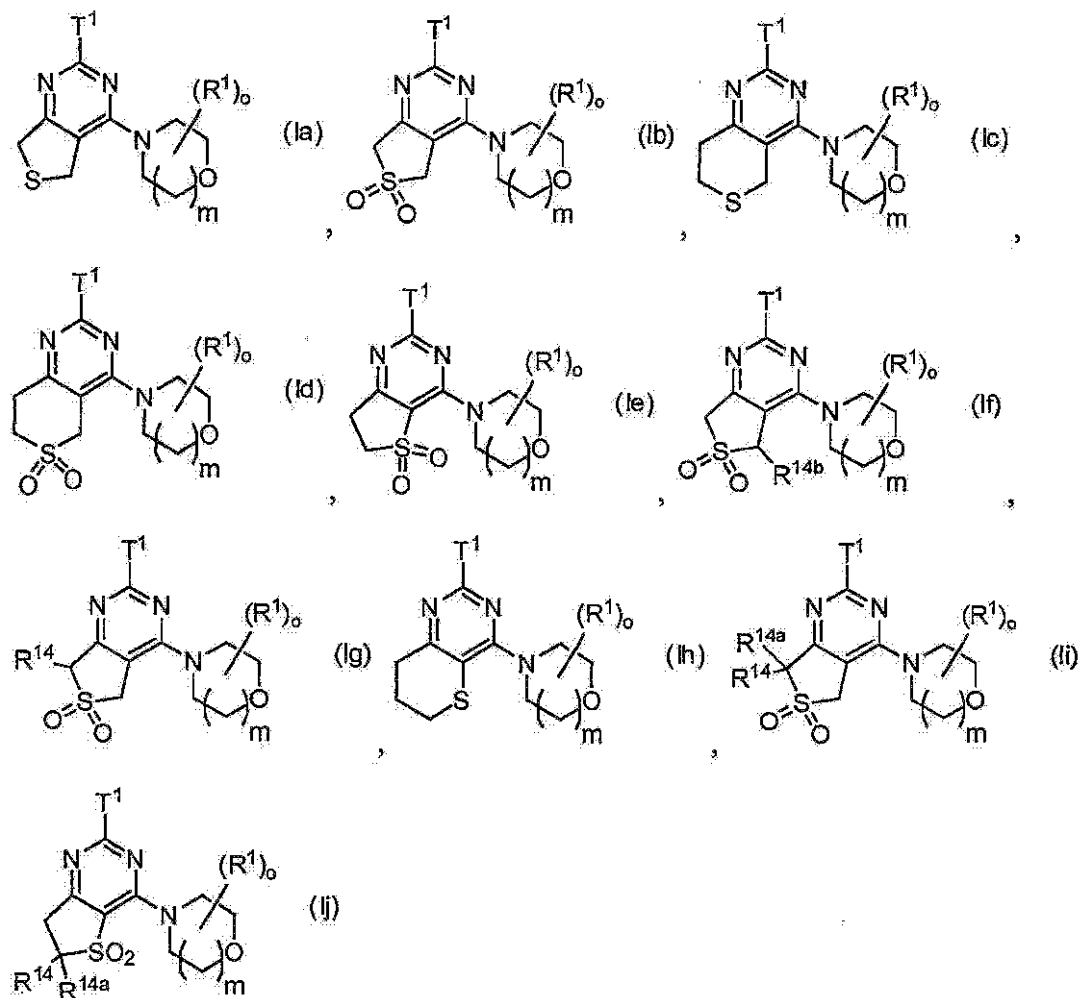
$R^{15}$ 、 $R^{15a}$ 、 $R^{15b}$ は、H;  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲンで任意選択で置換されており;

$R^{16}$ は、ハロゲン;  $CN$ ;  $C(O)OR^{17}$ ;  $OR^{17}$ ;  $C(O)R^{17}$ ;  $C(O)N(R^{17}R^{17a})$ ;  $S(O)_2N(R^{17}R^{17a})$ ;  $S(O)N(R^{17}R^{17a})$ ;  $S(O)_2R^{17}$ ;  $S(O)R^{17}$ ;  $N(R^{17})S(O)_2N(R^{17a}R^{17b})$ ;  $N(R^{17})S(O)N(R^{17a}R^{17b})$ ;  $SR^{17}$ ;  $N(R^{17}R^{17a})$ ;  $NO_2$ ;  $OC(O)R^{17}$ ;  $N(R^{17})C(O)R^{17a}$ ;  $N(R^{17})S(O)_2R^{17a}$ ;  $N(R^{17})S(O)R^{17a}$ ;  $N(R^{17})C(O)N(R^{17a}R^{17b})$ ;  $N(R^{17})C(O)OR^{17a}$ ; または  $OC(O)N(R^{17}R^{17a})$ ; であり、

$R^{17}$ 、 $R^{17a}$ 、 $R^{17b}$ は、H;  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲンで任意選択で置換されている)  
の化合物またはその薬学的に許容される塩。

(2) 式(1)において  $R^a$  および  $R^b$  が式(1a)~(1j):

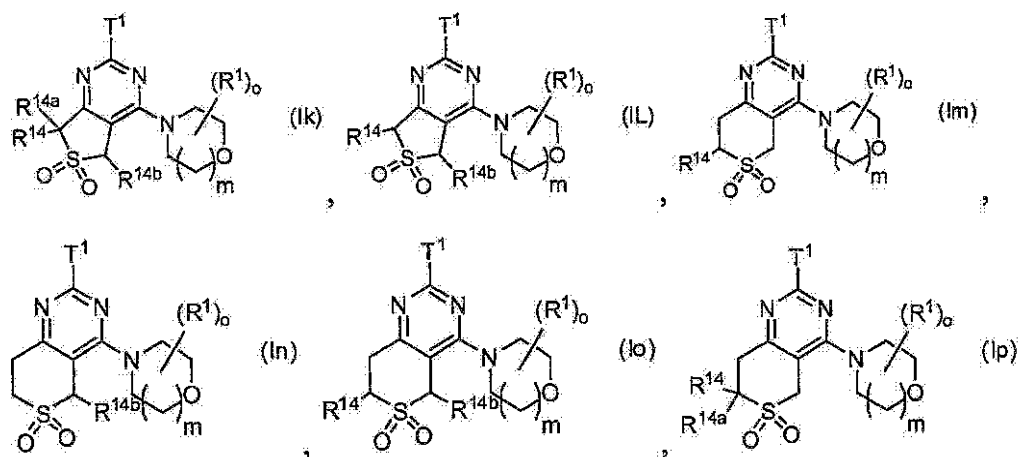
## 【化 6 7】



[式中、 $T^1$ 、 $R^1$ 、 $o$ 、 $m$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{14a}$ 、 $R^{14b}$ は(1)に記載される意味を有する]  
 のうちの1つを与えるように選択される、(1)に記載の化合物。

(3) 式(I)において $R^a$ および $R^b$ が式(Ik)~(Ip):

## 【化 6 8】



[式中、 $T^1$ 、 $R^1$ 、 $o$ 、 $m$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{14a}$ 、 $R^{14b}$ は(1)に記載される意味を有する]  
 のうちの1つを与えるように選択される、(1)に記載の化合物。

(4)  $T^1$ がフェニルであり、 $T^1$ が $N(R^{5a})C(O)N(R^{5b}R^5)$ または $N(R^{5a})C(O)OR^5$ で置換されており、同じかまたは異なっている1つ以上の $R^6$ で任意選択でさらに置換されている、(1)~(3)

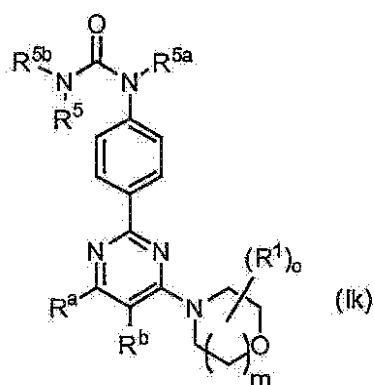
のいずれかに記載の化合物。

(5)  $T^1$ が $N(R^{5a})C(O)N(R^{5b}R^5)$ で置換されており、同じかまたは異なっている1つ以上の $R^6$ で任意選択でさらに置換されている、(1)～(4)のいずれか1項に記載の化合物。

(6)  $T^1$ が1つ以上の $R^6$ でさらに置換されていない、(1)～(5)のいずれかに記載の化合物。

(7) 式(1)において $T^1$ が式(1k)：

【化69】



[式中、 $o$ 、 $m$ 、 $R^1$ 、 $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^5$ 、 $R^{5a}$ 、 $R^{5b}$ は(1)～(6)のいずれかに記載される意味を有する]

のうちの1つを与えるように選択される、(1)～(6)のいずれかに記載の化合物。

(8)  $R^{5a}$ 、 $R^{5b}$ がHである、(1)～(7)のいずれかに記載の化合物。

(9)  $R^5$ が $T^2$ であり、 $T^2$ が、置換されていないかまたは同じかもしくは異なっている1つ以上の $R^{10}$ で置換されており、 $T^2$ がフェニル；ピリジル；シクロプロピル；シクロブチル；シクロペンチル；シクロヘキシル；オキセタニル；またはテトラヒドロフラニルである、(1)～(8)のいずれかに記載の化合物。

(10)  $R^5$ が非置換の $C_{1-6}$ アルキルである、(1)～(8)のいずれかに記載の化合物。

(11)  $R^5$ が、同じかまたは異なっており、F； $OR^9$ ；および $N(R^9R^{9a})$ からなる群から選択される1つ以上の $R^8$ で置換された $C_{1-6}$ アルキルである、(1)～(8)のいずれかに記載の化合物。

(12)  $r$ が0；または2である、(1)～(11)のいずれかに記載の化合物。

(13)  $r$ が1；または2である、(1)～(11)のいずれかに記載の化合物。

(14)  $p$ 、 $q$ が1；2；または3である、(1)～(13)のいずれかに記載の化合物。

(15)  $p + q$ が2；または3である、(1)～(14)のいずれかに記載の化合物。

(16)  $p$ および $q$ が両方1である、(1)～(15)のいずれかに記載の化合物。

(17)  $p$ および $q$ が両方1であり、 $r$ が2である、(1)～(16)のいずれかに記載の化合物。

(18)  $R^{14}$ 、 $R^{14a}$ 、 $R^{14b}$ 、 $R^{14c}$ のうちの多くて2つはH以外のものである、(1)～(17)のいずれかに記載の化合物。

(19)  $R^{14}$ 、 $R^{14a}$ 、 $R^{14b}$ 、 $R^{14c}$ のうちの1つがH以外のものである、(1)～(18)のいずれかに記載の化合物。

(20)  $R^{14}$ 、 $R^{14a}$ 、 $R^{14b}$ 、 $R^{14c}$ のうちの2つがH以外のものである、(1)～(19)のいずれかに記載の化合物。

(21)  $R^{14}$ 、 $R^{14a}$ 、 $R^{14b}$ 、 $R^{14c}$ のうちの3つがH以外のものである、(1)～(19)のいずれかに記載の化合物。

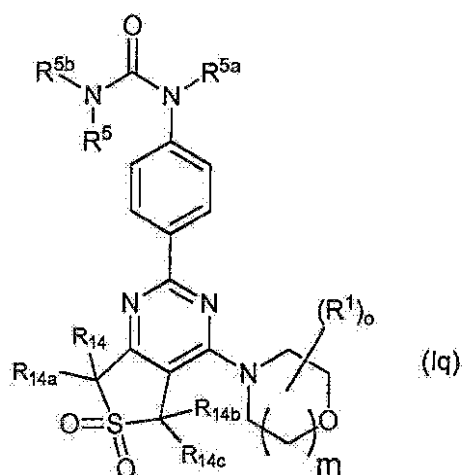
(22)  $R^{14}$ 、 $R^{14a}$ 、 $R^{14b}$ 、 $R^{14c}$ がH；F；エチル；およびメチルからなる群から独立に選択される、(1)～(21)のいずれかに記載の化合物。

(23)  $R^{14}$ がメチルであり、 $R^{14a}$ が水素であり、 $R^{14b}$ が水素であり、 $R^{14c}$ が水素である、(1)～(19)および(22)のいずれかに記載の化合物。

(24)  $R^{14}$ がメチルであり、 $R^{14a}$ がメチルであり、 $R^{14b}$ が水素であり、 $R^{14c}$ が水素である、(1)～(20)および(22)のいずれかに記載の化合物。

- (25)  $R^{14}$ がメチルであり、 $R^{14a}$ がメチルであり、 $R^{14b}$ がメチルであり、 $R^{14c}$ が水素である、(1)～(19)、(21)および(22)のいずれかに記載の化合物。
- (26)  $R^{14}$ がメチルであり、 $R^{14a}$ がFであり、 $R^{14b}$ が水素であり、 $R^{14c}$ が水素である、(1)～(20)および(22)のいずれかに記載の化合物。
- (27)  $R^{14}$ がメチルであり、 $R^{14a}$ がFであり、 $R^{14b}$ がメチルであり、 $R^{14c}$ が水素である、(1)～(19)、(21)および(22)のいずれかに記載の化合物。
- (28)  $R^{14}$ がメチル、 $R^{14a}$ がメチル、 $R^{14b}$ がFであり、 $R^{14c}$ が水素である、(1)～(19)、(21)および(22)のいずれかに記載の化合物。
- (29)  $R^{14}$ がF、 $R^{14a}$ がFであり、 $R^{14b}$ が水素であり、 $R^{14c}$ が水素である、(1)～(20)および(22)のいずれかに記載の化合物。
- (30)  $m$ が1である、(1)～(29)のいずれかに記載の化合物。
- (31)  $o$ が1または2である、(1)～(30)のいずれかに記載の化合物。
- (32) 各 $R^1$ がH；ハロゲン；CN；オキソ(=O)または $C_1 \sim 6$ アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$ アルキルが、同じかまたは異なっている1つ以上の $R^3$ で任意選択で置換されている、(1)～(31)のいずれかに記載の化合物。
- (33)  $R^1$ が非置換 $C_1 \sim 6$ アルキル；または1つの $R^3$ で置換された $C_1 \sim 6$ アルキルである、(1)～(32)のいずれかに記載の化合物。
- (34) 2つの $R^1$ が、それらが結合している環と一緒に結合して8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イルまたは3-オキサ-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-イル環を形成している、(1)～(33)のいずれかに記載の化合物。
- (35) 式(I)において $R^a$ 、 $R^b$ 、 $T^1$ が式(Iq)：

【化70】



- [式中、 $R^5$ 、 $R^{5a}$ 、 $R^{5b}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{14a}$ 、 $R^{14b}$ 、 $R^{14c}$ 、 $R^1$ 、 $o$ 、 $m$ は(1)～(34)のいずれかに記載される意味を有する]
- を与えるように定義される、(1)～(34)のいずれかに記載の化合物。
- (36)  $R^{5b}$ および $R^{5a}$ がHであり、 $R^5$ が、同じかまたは異なっている $R^8$ の1つ以上で任意選択で置換された $C_1 \sim 6$ アルキルである、あるいは、 $R^5$ が、同じかまたは異なっている1つ以上の $R^{10}$ で任意選択で置換された $C_3 \sim 7$ シクロアルキルである、(1)～(35)のいずれかに記載の化合物。
- (37)  $R^{5b}$ および $R^{5a}$ がHであり、 $R^5$ が、同じかまたは異なっているハロゲン(例えば、フルオロ)または $R^8$ (例えば、OR<sup>9</sup>)の1つ以上で任意選択で置換された $C_1 \sim 6$ アルキル(例えば、メチル、エチル、プロピルまたはイソプロピル)である、あるいは、 $R^5$ が、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲン(例えば、フルオロ)または $R^{10}$ (例えば、OR<sup>11</sup>)で任意選択で置換された $C_3 \sim 7$ シクロアルキル(例えば、シクロプロピル)である、(1)～(36)のいずれかに記載の化合物。
- (38)  $R^{5b}$ および $R^{5a}$ がHであり、 $R^5$ が、同じかまたは異なっているハロゲン(例えば、フル

オロ)または $R^8$ (例えば、 $OR^9$ )の1つ以上で任意選択で置換された $C_{1-6}$ アルキル(例えば、メチル、エチル、プロピルまたはイソプロピル)である、あるいは、 $R^5$ が、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲン(例えば、フルオロ)または $R^{10}$ (例えば、 $OR^{11}$ )で任意選択で置換された $C_{3-7}$ シクロアルキル(例えば、シクロプロピル)であり、ここで $R^8$ および $R^{10}$ がHである、(1)~(37)のいずれかに記載の化合物。

(39)  $R^{5b}$ および $R^{5a}$ がHであり、 $R^5$ が1つ以上のフルオロまたはヒドロキシで置換された $C_{1-6}$ アルキル(例えばメチル、エチルまたはプロピル)である、(1)~(38)のいずれかに記載の化合物。

(40)  $R^5$ がシクロプロピル、メチル、エチル、フルオロエチル、ヒドロキシエチル、ジフルオロエチル、イソプロピル、フルオロプロピル、ピリジニルまたはオキセタニルである、(1)~(39)のいずれかに記載の化合物。

(41)  $R^1$ が $C_{1-6}$ アルキル(例えばメチル、またはエチル)であり、 $o$ が1である、(1)~(40)のいずれかに記載の化合物。

(42)  $(R^1)_o$ が3位で結合している、(1)~(41)のいずれかに記載の化合物。

(43)  $R^{14}$ 、 $R^{14a}$ 、 $R^{14b}$ および $R^{14c}$ が $C_{1-6}$ アルキル；FまたはHから選択される、(1)~(42)のいずれかに記載の化合物。

(44)  $R^{14}$ 、 $R^{14a}$ 、 $R^{14b}$ および $R^{14c}$ のうちの3つが $C_{1-6}$ アルキル(例えばメチル、エチルまたはプロピル)またはFから選択される、(1)~(22)、(25)および(30)~(34)のいずれかに記載の化合物。

(45)  $R^{14}$ 、 $R^{14a}$ 、 $R^{14b}$ および $R^{14c}$ のうちの3つがメチルまたはFから選択される、(1)~(22)、(25)および(30)~(34)のいずれかに記載の化合物。

(46) 化合物が以下：

1-シクロプロピル-3-(4-(4-モルホリノ-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(4-((2S,6R)-2,6-ジメチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-エチル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-メチル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-(2-ヒドロキシエチル)-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-(2-フルオロエチル)-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-(4-(4-(8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-エチル尿素；

1-(4-(4-(8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-(2-ヒドロキシエチル)尿素；

(R)-1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-(4-(4-(8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-シクロプロピル尿素；

1-(4-(4-(8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-メチル尿素；

1-(4-(4-(8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-(2-フルオロエチル)尿素；

(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-7,8-ジヒドロ-5H-チオピラノ[4,3-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ))-7,8-ジヒドロ-5H-チオピラノ[4,3-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-(4-(4-(8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-(2,2-ジフルオロエチル)尿素；

(S)-1-イソプロピル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-(4-(4-(3-オキサ-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-イル))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-シクロプロピル尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-エチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-(3-フルオロプロピル)-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-(4-(4-(8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-(3-フルオロプロピル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(7-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ))-5,5-ジオキシド-6,7-ジヒドロチエノ[3,2-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ))-7,8-ジヒドロ-6H-チオピラノ[3,2-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(5-メチル-4-モルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-エチルモルホリノ))-5-メチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-(4-(4-(3-オキサ-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-イル))-5-メチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-シクロプロピル尿素；

1-(4-(4-(8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル))-5-メチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-シクロプロピル尿素；

(S)-1-(4-(4-(3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-(ピリジン-4-イル)尿素；

(S)-1-(4-(4-(3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-(ピリジン-3-イル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-((R)-5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-((S)-5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(6,6-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ))-5,5-ジオキシド-6,7-ジヒドロチエノ[3,2-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-エチル-3-(4-(5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-エチル-3-(4-((R)-5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；



1-エチル-3-(4-((S)-5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-エチル-3-(4-(4-((S)-3-エチルモルホリノ)-7-メチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-エチル-3-(4-(5,7,7-トリメチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(7-フルオロ-7-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(5,7-ジメチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-(4-(5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-プロピル尿素；

1-(シクロプロピルメチル)-3-(4-(5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(4-((S)-3-エチルモルホリノ)-5-メチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(5-メチル-4-((R)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(5-エチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-エチル-3-(2-フルオロ-4-(5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-エチルモルホリノ)-7,7-ジメチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-エチル-3-(4-((R)-4-((S)-3-エチルモルホリノ)-5-メチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-エチル-3-(4-((S)-4-((S)-3-エチルモルホリノ)-5-メチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(R)-1-シクロプロピル-3-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(R)-1-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-エチル尿素；

(S)-1-エチル-3-(4-(4-(3-エチルモルホリノ)-7,7-ジメチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-メチル尿素；

1-メチル-3-(4-(5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-(4-(4-(3-オキサ-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-イル)-7,7-ジメチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-シクロプロピル尿素；

1-(4-(4-(3-オキサ-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-イル)-7,7-ジメチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-エチル尿素；

(S)-1-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-(2-フルオロエチル)尿素；

(S)-1-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-エチル尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-((S)-5-メチル-4-((R)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-(4-(4-(3-エチルモルホリノ)-7,7-ジメチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエ

ノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)-2-フルオロフェニル)-3-メチル尿素；  
(S)-1-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエ  
ノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)-2-フルオロフェニル)-3-メチル尿素；  
(S)-1-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエ  
ノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)-3-フルオロフェニル)-3-メチル尿素；  
1-エチル-3-(4-(5-エチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロ  
チエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；  
(S)-1-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエ  
ノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-(オキセタン-3-イル)尿素；  
(S)-1-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエ  
ノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)-3-フルオロフェニル)-3-エチル尿素；  
(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-  
7,8-ジヒドロ-5H-チオピラノ[4,3-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；  
1-シクロプロピル-3-(4-(7-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-7,8-  
ジヒドロ-5H-チオピラノ[4,3-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；  
1-シクロプロピル-3-(4-(5,7-ジメチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-  
7,8-ジヒドロ-5H-チオピラノ[4,3-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；  
(S)-1-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-7,8-ジヒドロ-5H-  
チオピラノ[4,3-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-エチル尿素；  
1-シクロプロピル-3-(4-(5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-7,8-  
ジヒドロ-5H-チオピラノ[4,3-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；  
1-(2-フルオロエチル)-3-(4-(5,7,7-トリメチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジ  
オキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；  
1-(4-(7,7-ジメチル-4-モルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミ  
ジン-2-イル)フェニル)-3-エチル尿素；  
1-メチル-3-(4-(5,7,7-トリメチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-  
ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；  
1-(3-フルオロ-4-(5,7,7-トリメチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,  
7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-メチル尿素；  
1-(4-(4-((S)-3-エチルモルホリノ))-5,7,7-トリメチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロ  
チエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)-3-フルオロフェニル)-3-メチル尿素；  
1-(4-(4-((S)-3-エチルモルホリノ))-5,7,7-トリメチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロ  
チエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-メチル尿素；  
1-(2-フルオロエチル)-3-(4-(5,7,7-トリメチル-4-モルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジ  
ヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；および  
1-シクロプロピル-3-(4-((R)-5,7,7-トリメチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオ  
キシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素  
 からなる群から選択される、(1)～(45)のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

(47) 薬学的に許容される担体と一緒に、任意選択で1つ以上の他の医薬組成物と組み合わせて、(1)～(46)のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含む医薬組成物。

(48) 医薬として使用するための(1)～(46)のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

(49) それを必要とする哺乳動物患者におけるmTORに関連する疾患および障害からなる群から選択される1つ以上の状態を治療する、制御する、遅延させるまたは防止するための方法であって、前記患者に治療有効量の(1)～(46)のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を投与することを含む、上記方法。

(50) mTORに関連する疾患または障害を治療または防止する方法において使用するための(1)～(46)のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

(51) mTORに関連する疾患または障害を治療または防止するための医薬の製造のための(1)~(46)のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩の使用。

(52) 免疫学的、炎症性、自己免疫性もしくはアレルギー性の障害または疾患あるいは移植拒絶反応または移植片対宿主病を治療または防止する方法において使用するための(1)~(46)のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

(53) 増殖性疾患、特に癌を治療または防止する方法において使用するための(1)~(46)のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

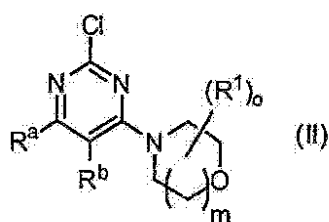
(54) 心臓血管疾患、代謝性疾患または神経変性疾患を治療または防止する方法において使用するための(1)~(46)のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

(55) 自己貪食関連疾患を治療または防止する方法において使用するための(1)~(46)のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

(56) ウイルス感染症を治療または防止する方法において使用するための(1)~(46)のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

(57) 式(II):

【化71】



(式中、 $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^1$ 、 $o$ 、 $m$ は(1)~(46)のいずれかに示した意味を有する)

の化合物を式 $T^1-X$ の化合物( $T^1$ は(1)~(26)のいずれかに示した意味を有し、 $X$ は鈴木反応に適した基である)

と反応させて式(I)の化合物を生成するステップを含む、(1)~(46)のいずれかに記載の化合物の製造方法。

【手続補正2】

【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

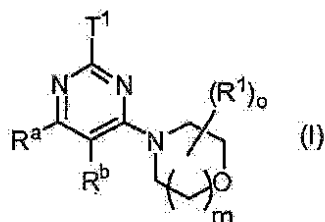
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I):

【化1】



(式中、

$m$ は1または2であり；

$o$ は1、2、3または4であり；

各 $R^1$ は、H；ハロゲン；CN； $C(O)OR^2$ ； $OR^{2a}$ ；オキソ(=O)； $C(O)R^2$ ； $C(O)N(R^2R^{2a})$ ； $S(O)_2N(R^2R^{2a})$ ； $S(O)N(R^2R^{2a})$ ； $S(O)_2R^2$ ； $S(O)R^2$ ； $N(R^2)S(O)_2N(R^{2a}R^{2b})$ ； $N(R^2)S(O)N(R^{2a}R^{2b})$

);  $SR^2$ ;  $N(R^2R^{2a})$ ;  $NO_2$ ;  $OC(O)R^2$ ;  $N(R^2)C(O)R^{2a}$ ;  $N(R^2)S(O)_2R^{2a}$ ;  $N(R^2)S(O)R^{2a}$ ;  $N(R^2)C(O)N(R^{2a}R^{2b})$ ;  $N(R^2)C(O)OR^{2a}$ ;  $OC(O)N(R^2R^{2a})$ ; および  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$  アルキルは同じかまたは異なっている1つ以上の  $R^3$  で任意選択で置換されており;

任意選択で、2つの  $R^1$  は、それらが結合している環と一緒に結合して8~11員ヘテロピサイクルを形成しており;

$R^2$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$  は、H;  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲンで任意選択で置換されており;

$R^3$  は、ハロゲン;  $CN$ ;  $C(O)OR^4$ ;  $OR^4$ ;  $C(O)R^4$ ;  $C(O)N(R^4R^{4a})$ ;  $S(O)_2N(R^4R^{4a})$ ;  $S(O)N(R^4R^{4a})$ ;  $S(O)_2R^4$ ;  $S(O)R^4$ ;  $N(R^4)S(O)_2N(R^{4a}R^{4b})$ ;  $N(R^4)S(O)N(R^{4a}R^{4b})$ ;  $SR^4$ ;  $N(R^4R^{4a})$ ;  $NO_2$ ;  $OC(O)R^4$ ;  $N(R^4)C(O)R^{4a}$ ;  $N(R^4)S(O)_2R^{4a}$ ;  $N(R^4)S(O)R^{4a}$ ;  $N(R^4)C(O)N(R^{4a}R^{4b})$ ;  $N(R^4)C(O)OR^{4a}$ ; または  $OC(O)N(R^4R^{4a})$ ; であり、

$R^4$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{4b}$  は、H; および  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲンで任意選択で置換されており;

$T^1$  は、フェニル; または5~6員芳香族複素環であり、 $T^1$  は、 $N(R^{5a})C(O)N(R^{5b}R^5)$  または  $N(R^{5a})C(O)OR^5$  で置換されており、同じかまたは異なっている1つ以上の  $R^6$  で任意選択でさらに置換されており;

$R^6$  は、ハロゲン;  $CN$ ;  $C(O)OR^7$ ;  $OR^7$ ;  $C(O)R^7$ ;  $C(O)N(R^7R^{7a})$ ;  $S(O)_2N(R^7R^{7a})$ ;  $S(O)N(R^7R^{7a})$ ;  $S(O)_2R^7$ ;  $S(O)R^7$ ;  $N(R^7)S(O)_2N(R^{7a}R^{7b})$ ;  $N(R^7)S(O)N(R^{7a}R^{7b})$ ;  $SR^7$ ;  $N(R^7R^{7a})$ ;  $NO_2$ ;  $OC(O)R^7$ ;  $N(R^7)C(O)R^{7a}$ ;  $N(R^7)S(O)_2R^{7a}$ ;  $N(R^7)S(O)R^{7a}$ ;  $N(R^7)C(O)N(R^{7a}R^{7b})$ ;  $N(R^7)C(O)OR^{7a}$ ;  $OC(O)N(R^7R^{7a})$ ; または  $C_1 \sim 6$  アルキルであり、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲンで任意選択で置換されており;

$R^{5a}$ 、 $R^{5b}$ 、 $R^7$ 、 $R^{7a}$ 、 $R^{7b}$  は、H;  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲンで任意選択で置換されており;

$R^5$  は、H;  $T^2$ ; および  $C_1 \sim 6$  アルキルであり、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上の  $R^8$  で任意選択で置換されており;

$R^8$  は、ハロゲン;  $CN$ ;  $C(O)OR^9$ ;  $OR^9$ ;  $C(O)R^9$ ;  $C(O)N(R^9R^{9a})$ ;  $S(O)_2N(R^9R^{9a})$ ;  $S(O)N(R^9R^{9a})$ ;  $S(O)_2R^9$ ;  $S(O)R^9$ ;  $N(R^9)S(O)_2N(R^{9a}R^{9b})$ ;  $N(R^9)S(O)N(R^{9a}R^{9b})$ ;  $SR^9$ ;  $N(R^9R^{9a})$ ;  $NO_2$ ;  $OC(O)R^9$ ;  $N(R^9)C(O)R^{9a}$ ;  $N(R^9)S(O)_2R^{9a}$ ;  $N(R^9)S(O)R^{9a}$ ;  $N(R^9)C(O)N(R^{9a}R^{9b})$ ;  $N(R^9)C(O)OR^{9a}$ ;  $OC(O)N(R^9R^{9a})$ ; または  $T^2$ ; であり;

$R^9$ 、 $R^{9a}$ 、 $R^{9b}$  は、H; および  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲンで任意選択で置換されており;

任意選択で、 $R^5$ 、 $R^{5b}$  は結合して、それらが結合している窒素原子と一緒に、環ヘテロ原子として少なくとも窒素原子を含有する4~7員ヘテロシクリル環; または8~11員ヘテロシクリル環を形成しており、4~7員ヘテロシクリル環; および8~11員ヘテロシクリル環は、同じかまたは異なっている1つ以上の  $R^{10}$  で任意選択で置換されており;

$T^2$  は、 $C_3 \sim 7$  シクロアルキル; 4~7員ヘテロシクリル; 4~7員ヘテロアリール; 8~11員ヘテロシクリル; フェニル; ナフチル; インデニル; またはインダニルであり、 $T^2$  は、同じかまたは異なっている1つ以上の  $R^{10}$  で任意選択で置換されており;

$R^{10}$  は、ハロゲン;  $CN$ ;  $C(O)OR^{11}$ ;  $OR^{11}$ ; オキソ(=O)(この場合、その環は少なくとも部分的に飽和している);  $C(O)R^{11}$ ;  $C(O)N(R^{11}R^{11a})$ ;  $S(O)_2N(R^{11}R^{11a})$ ;  $S(O)N(R^{11}R^{11a})$ ;  $S(O)_2R^{11}$ ;  $S(O)R^{11}$ ;  $N(R^{11})S(O)_2N(R^{11a}R^{11b})$ ;  $N(R^{11})S(O)N(R^{11a}R^{11b})$ ;  $SR^{11}$ ;  $N(R^{11}R^{11a})$ ;  $NO_2$ ;  $OC(O)R^{11}$ ;  $N(R^{11})C(O)R^{11a}$ ;  $N(R^{11})S(O)_2R^{11a}$ ;  $N(R^{11})S(O)R^{11a}$ ;  $N(R^{11})C(O)N(R^{11a}R^{11b})$ ;  $N(R^{11})C(O)OR^{11a}$ ;  $OC(O)N(R^{11}R^{11a})$ ; または  $C_1 \sim 6$  アルキルであり、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上の  $R^{12}$  で任意選択で置換されており;

$R^{11}$ 、 $R^{11a}$ 、 $R^{11b}$  は、H;  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲンで任意選択で置換されており;

$R^{12}$  は、ハロゲン;  $CN$ ;  $C(O)OR^{13}$ ;  $OR^{13}$ ;  $C(O)R^{13}$ ;  $C(O)N(R^{13}R^{13a})$ ;  $S(O)_2N(R^{13}R^{13a})$ ;  $S(O)N(R^{13}R^{13a})$ ;  $S(O)_2R^{13}$ ;  $S(O)R^{13}$ ;  $N(R^{13})S(O)_2N(R^{13a}R^{13b})$ ;  $N(R^{13})S(O)N(R^{13a}R^{13b})$

$b$ ) ;  $SR^{13}$  ;  $N(R^{13}R^{13a})$  ;  $NO_2$  ;  $OC(O)R^{13}$  ;  $N(R^{13})C(O)R^{13a}$  ;  $N(R^{13})S(O)_2R^{13a}$  ;  $N(R^{13})S(O)R^{13a}$  ;  $N(R^{13})C(O)N(R^{13a}R^{13b})$  ;  $N(R^{13})C(O)OR^{13a}$  ; または  $OC(O)N(R^{13}R^{13a})$  ; であり、

$R^{13}$ 、 $R^{13a}$ 、 $R^{13b}$ は、H ; および  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲンで任意選択で置換されており ;

$R^a$ 、 $R^b$ は結合して  $-(CR^{14}R^{14a})_p-S(O)_r-(CR^{14b}R^{14c})_q-$  を形成しており ;

$r$ は0、1または2であり ;

$p$ 、 $q$ は0、1、2または3であり、但し  $p+q$ は2、3または4であり ;

$R^{14}$ 、 $R^{14a}$ 、 $R^{14b}$ 、 $R^{14c}$ は、H ; ハロゲン ;  $CN$  ;  $C(O)OR^{15}$  ;  $OR^{15}$  ;  $C(O)R^{15}$  ;  $C(O)N(R^{15}R^{15a})$  ;  $S(O)_2N(R^{15}R^{15a})$  ;  $S(O)N(R^{15}R^{15a})$  ;  $S(O)_2R^{15}$  ;  $S(O)R^{15}$  ;  $N(R^{15})S(O)_2N(R^{15a}R^{15b})$  ;  $N(R^{15})S(O)N(R^{15a}R^{15b})$  ;  $SR^{15}$  ;  $N(R^{15}R^{15a})$  ;  $NO_2$  ;  $OC(O)R^{15}$  ;  $N(R^{15})C(O)R^{15a}$  ;  $N(R^{15})S(O)_2R^{15a}$  ;  $N(R^{15})S(O)R^{15a}$  ;  $N(R^{15})C(O)N(R^{15a}R^{15b})$  ;  $N(R^{15})C(O)OR^{15a}$  ;  $OC(O)N(R^{15}R^{15a})$  ; または  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上の  $R^{16}$  で任意選択で置換されており ;

任意選択で、対  $R^{14}$ 、 $R^{14a}$  および  $R^{14b}$ 、 $R^{14c}$  の一方またはそれらの両方の対はオキソ基 ( $=O$ ) を形成しており ;

任意選択で、 $R^{14}$ 、 $R^{14a}$  ;  $R^{14}$ 、 $R^{14b}$  ;  $p > 1$  の場合の2つの隣接する  $R^{14}$  ; および  $q > 1$  の場合の2つの隣接する  $R^{14b}$  からなる群から選択される対の1つは、結合して、それらが結合している環と一緒に、6~11員ヘテロピサイクルを形成しており ;

$R^{15}$ 、 $R^{15a}$ 、 $R^{15b}$ は、H ;  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲンで任意選択で置換されており ;

$R^{16}$ は、ハロゲン ;  $CN$  ;  $C(O)OR^{17}$  ;  $OR^{17}$  ;  $C(O)R^{17}$  ;  $C(O)N(R^{17}R^{17a})$  ;  $S(O)_2N(R^{17}R^{17a})$  ;  $S(O)N(R^{17}R^{17a})$  ;  $S(O)_2R^{17}$  ;  $S(O)R^{17}$  ;  $N(R^{17})S(O)_2N(R^{17a}R^{17b})$  ;  $N(R^{17})S(O)N(R^{17a}R^{17b})$  ;  $SR^{17}$  ;  $N(R^{17}R^{17a})$  ;  $NO_2$  ;  $OC(O)R^{17}$  ;  $N(R^{17})C(O)R^{17a}$  ;  $N(R^{17})S(O)_2R^{17a}$  ;  $N(R^{17})S(O)R^{17a}$  ;  $N(R^{17})C(O)N(R^{17a}R^{17b})$  ;  $N(R^{17})C(O)OR^{17a}$  ; または  $OC(O)N(R^{17}R^{17a})$  ; であり、

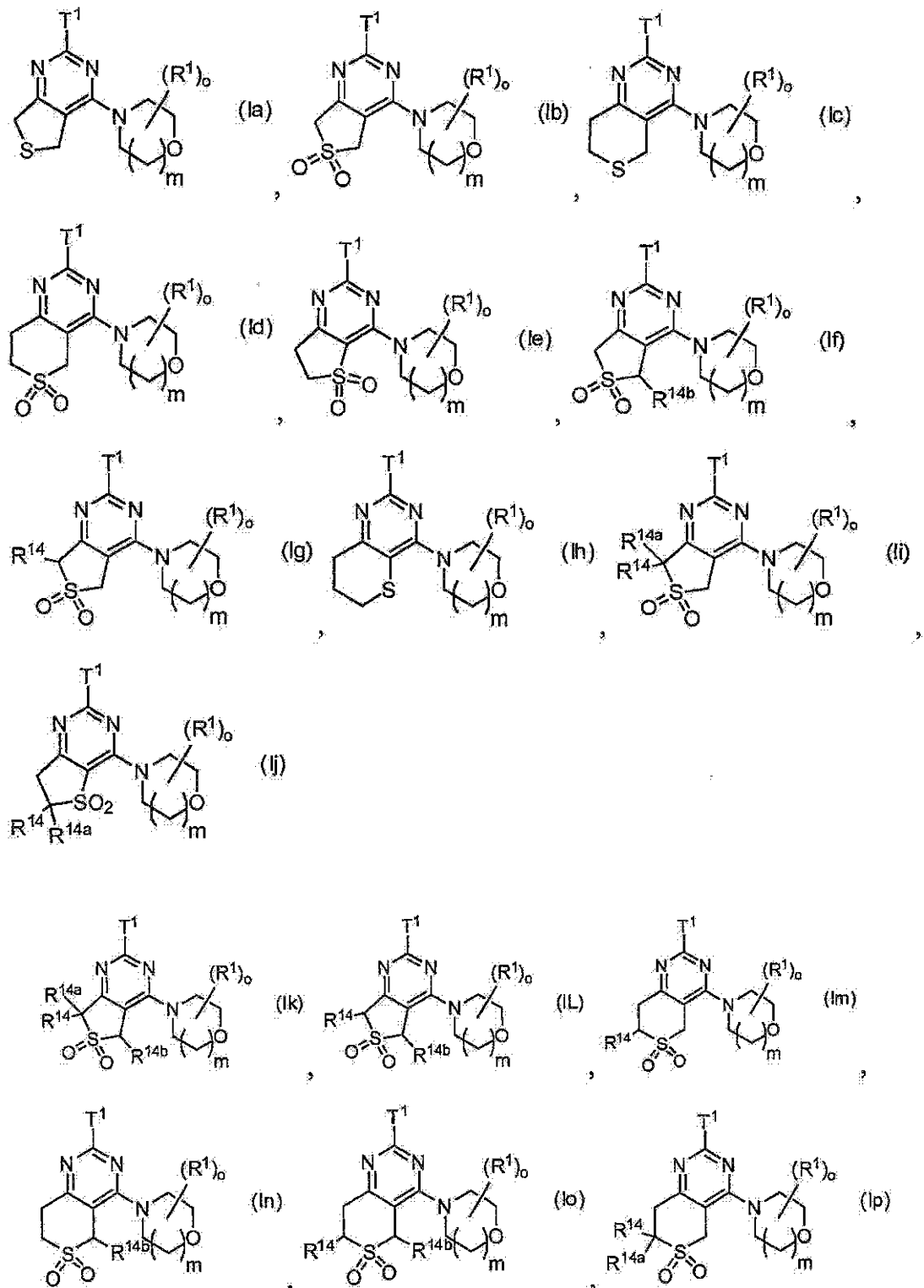
$R^{17}$ 、 $R^{17a}$ 、 $R^{17b}$ は、H ;  $C_1 \sim 6$  アルキルからなる群から独立に選択され、 $C_1 \sim 6$  アルキルは、同じかまたは異なっている1つ以上のハロゲンで任意選択で置換されている)

の化合物またはその薬学的に許容される塩。

#### 【請求項 2】

式(1)において  $R^a$  および  $R^b$  が式(1a) ~ (1p) :

## 【化 2】

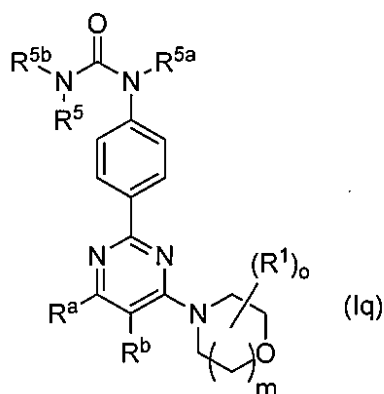


[式中、 $T^1$ 、 $R^1$ 、 $o$ 、 $m$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{14a}$ 、 $R^{14b}$ は請求項1に記載される意味を有する]のうちの1つを与えるように選択される、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項3】

式(I)において $T^1$ が式(Iq):

## 【化 3】



[式中、 $o$ 、 $m$ 、 $R^1$ 、 $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^5$ 、 $R^{5a}$ 、 $R^{5b}$ は請求項 1 または 2 のいずれか 1 項に記載される意味を有する]

のうちの 1 つを与えるように選択される、請求項 1 または 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

## 【請求項 4】

$R^{5a}$ 、 $R^{5b}$ がHであり、 $R^5$ が、同じかまたは異なっている、F； $OR^9$ ；および $N(R^9R^{9a})$ からなる群から選択される1つ以上の $R^8$ で任意選択で置換されている $C_{1-6}$ アルキルである、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

## 【請求項 5】

$R^{14}$ 、 $R^{14a}$ 、 $R^{14b}$ 、 $R^{14c}$ がH；F；エチル；およびメチルからなる群から独立に選択される、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

## 【請求項 6】

$R^1$ が非置換 $C_{1-6}$ アルキル；または1つの $R^3$ で置換された $C_{1-6}$ アルキルである、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

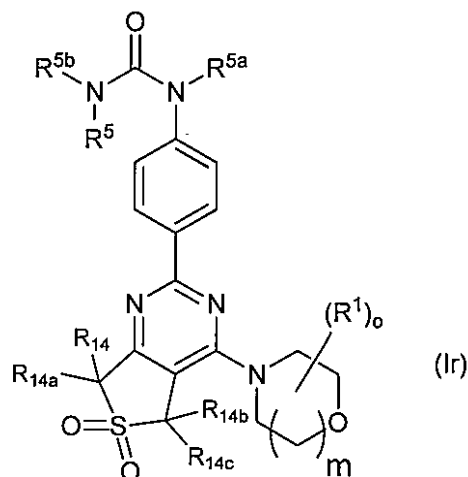
## 【請求項 7】

2つの $R^1$ が、それらが結合している環と一緒に結合して8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イルまたは3-オキサ-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-イル環を形成している、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

## 【請求項 8】

式(I)において $R^a$ 、 $R^b$ 、 $T^1$ が式(Ir)：

## 【化 4】



[式中、 $R^5$ 、 $R^{5a}$ 、 $R^{5b}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{14a}$ 、 $R^{14b}$ 、 $R^{14c}$ 、 $R^1$ 、 $o$ 、 $m$ は請求項 1 ~ 7 のいずれか1項に記載されるとおりに定義される]

を与えるように定義される、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9】

$R^{5b}$  および  $R^{5a}$  が H であり、 $R^5$  が、同じかまたは異なっている 1 つ以上の  $R^8$  で任意選択で置換された  $C_{1-6}$  アルキルである、あるいは、 $R^5$  が、同じかまたは異なっている 1 つ以上の  $R^{10}$  で任意選択で置換された  $C_{3-7}$  シクロアルキルである、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 10】

$R^5$  がシクロプロピル、メチル、エチル、フルオロエチル、ヒドロキシエチル、ジフルオロエチル、イソプロピル、フルオロプロピル、ピリジニルまたはオキセタニルである、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 11】

( $R^1$ ) が 3 位で結合している、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 12】

化合物が以下：

1-シクロプロピル-3-(4-(4-モルホリノ-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(4-((2S,6R)-2,6-ジメチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-エチル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-メチル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-(2-ヒドロキシエチル)-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-(2-フルオロエチル)-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-(4-(4-(8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-エチル尿素；

1-(4-(4-(8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-(2-ヒドロキシエチル)尿素；

(R)-1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-(4-(4-(8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-シクロプロピル尿素；

1-(4-(4-(8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-メチル尿素；

1-(4-(4-(8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-(2-フルオロエチル)尿素；

(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-7,8-ジヒドロ-5H-チオピラノ[4,3-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-7,8-ジヒドロ-5H-チオピラノ[4,3-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-(2,2-ジフルオロエチル)-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-(4-(4-(8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-(2,2-ジフルオロエチル)尿素；



(S)-1-イソプロピル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-(4-(4-(3-オキサ-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-イル)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-シクロプロピル尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-エチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-(3-フルオロプロピル)-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-(4-(4-(8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-(3-フルオロプロピル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(7-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-5,5-ジオキシド-6,7-ジヒドロチエノ[3,2-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-7,8-ジヒドロ-6H-チオピラノ[3,2-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(5-メチル-4-モルホリノ-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-エチルモルホリノ)-5-メチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-(4-(4-(3-オキサ-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-イル)-5-メチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-シクロプロピル尿素；

1-(4-(4-(8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-5-メチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-シクロプロピル尿素；

(S)-1-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-(ピリジン-4-イル)尿素；

(S)-1-(4-(4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-(ピリジン-3-イル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-((R)-5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-((S)-5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(6,6-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ)-5,5-ジオキシド-6,7-ジヒドロチエノ[3,2-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-エチル-3-(4-(5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-エチル-3-(4-((R)-5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-エチル-3-(4-((S)-5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-エチル-3-(4-(4-((S)-3-エチルモルホリノ)-7-メチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-エチル-3-(4-(5,7,7-トリメチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(7-フルオロ-7-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(5,7-ジメチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-(4-(5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-プロピル尿素；

1-(シクロプロピルメチル)-3-(4-(5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(4-((S)-3-エチルモルホリノ)-5-メチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(5-メチル-4-((R)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-(5-エチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-エチル-3-(2-フルオロ-4-(5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(4-(3-エチルモルホリノ)-7,7-ジメチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-エチル-3-(4-((R)-4-((S)-3-エチルモルホリノ)-5-メチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-エチル-3-(4-((S)-4-((S)-3-エチルモルホリノ)-5-メチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(R)-1-シクロプロピル-3-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(R)-1-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-エチル尿素；

(S)-1-エチル-3-(4-(4-(3-エチルモルホリノ)-7,7-ジメチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-メチル尿素；

1-メチル-3-(4-(5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

1-(4-(4-(3-オキサ-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-イル)-7,7-ジメチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-シクロプロピル尿素；

1-(4-(4-(3-オキサ-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-イル)-7,7-ジメチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-エチル尿素；

(S)-1-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-(2-フルオロエチル)尿素；

(S)-1-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-エチル尿素；

1-シクロプロピル-3-(4-((S)-5-メチル-4-((R)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-(4-(4-(3-エチルモルホリノ)-7,7-ジメチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)-2-フルオロフェニル)-3-メチル尿素；

(S)-1-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)-2-フルオロフェニル)-3-メチル尿素；

(S)-1-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)-3-フルオロフェニル)-3-メチル尿素；

1-エチル-3-(4-(5-エチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；

(S)-1-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエ

ノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-(オキセタン-3-イル)尿素；  
(S)-1-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエ  
ノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)-3-フルオロフェニル)-3-エチル尿素；  
(S)-1-シクロプロピル-3-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-  
7,8-ジヒドロ-5H-チオピラノ[4,3-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；  
1-シクロプロピル-3-(4-(7-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-7,8-  
ジヒドロ-5H-チオピラノ[4,3-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；  
1-シクロプロピル-3-(4-(5,7-ジメチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-  
7,8-ジヒドロ-5H-チオピラノ[4,3-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；  
(S)-1-(4-(7,7-ジメチル-4-(3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-7,8-ジヒドロ-5H-  
チオピラノ[4,3-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-エチル尿素；  
1-シクロプロピル-3-(4-(5-メチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-7,8-  
ジヒドロ-5H-チオピラノ[4,3-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；  
1-(2-フルオロエチル)-3-(4-(5,7,7-トリメチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジ  
オキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；  
1-(4-(7,7-ジメチル-4-モルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミ  
ジン-2-イル)フェニル)-3-エチル尿素；  
1-メチル-3-(4-(5,7,7-トリメチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,7-  
ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；  
1-(3-フルオロ-4-(5,7,7-トリメチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオキシド-5,  
7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-メチル尿素；  
1-(4-(4-((S)-3-エチルモルホリノ))-5,7,7-トリメチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロ  
チエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)-3-フルオロフェニル)-3-メチル尿素；  
1-(4-(4-((S)-3-エチルモルホリノ))-5,7,7-トリメチル-6,6-ジオキシド-5,7-ジヒドロ  
チエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)-3-メチル尿素；  
1-(2-フルオロエチル)-3-(4-(5,7,7-トリメチル-4-モルホリノ)-6,6-ジオキシド-5,7-ジ  
ヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素；および  
1-シクロプロピル-3-(4-((R)-5,7,7-トリメチル-4-((S)-3-メチルモルホリノ))-6,6-ジオ  
キシド-5,7-ジヒドロチエノ[3,4-d]ピリミジン-2-イル)フェニル)尿素  
からなる群から選択される、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬  
学的に許容される塩。

【請求項 13】

薬学的に許容される担体と一緒に、任意選択で1つ以上の他の医薬組成物と組み合わせ  
て、請求項 1 ~ 12 のいずれか1項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含  
む医薬組成物。

【請求項 14】

医薬として使用するための請求項 1 ~ 12 のいずれか1項に記載の化合物またはその薬  
学的に許容される塩。

【請求項 15】

免疫学的、炎症性または自己免疫性疾患、アレルギー性の障害または疾患、移植拒絶反  
応、移植片対宿主病、増殖性疾患(特に癌)、心臓血管疾患、代謝性疾患または神経変性疾  
患、自己貪食関連疾患またはウイルス感染症から選択されるmTORに関連する疾患または障  
害を治療または防止する方法において使用するための請求項 1 ~ 12 のいずれか1項に記  
載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 16】

免疫学的、炎症性または自己免疫性疾患、アレルギー性の障害または疾患、移植拒絶反  
応、移植片対宿主病、増殖性疾患(特に癌)、心臓血管疾患、代謝性疾患または神経変性疾  
患、自己貪食関連疾患またはウイルス感染症から選択されるmTORに関連する疾患または障  
害を治療または防止する方法において使用するための医薬の製造のための請求項 1 ~ 12  
のいずれか1項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩の使用。