

【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28年11月10日(2016.11.10)

【公表番号】特表2015-528488(P2015-528488A)

【公表日】平成27年9月28日(2015.9.28)

【年通号数】公開・登録公報2015-060

【出願番号】特願2015-531648(P2015-531648)

【国際特許分類】

C 07 D 239/48 (2006.01)
C 07 D 403/12 (2006.01)
C 07 D 487/04 (2006.01)
A 61 K 31/505 (2006.01)
A 61 K 31/506 (2006.01)
A 61 K 31/519 (2006.01)
A 61 P 43/00 (2006.01)
A 61 P 37/08 (2006.01)
A 61 P 11/02 (2006.01)
A 61 P 11/06 (2006.01)
A 61 P 11/08 (2006.01)
A 61 P 11/00 (2006.01)
A 61 P 27/14 (2006.01)
A 61 P 17/00 (2006.01)
A 61 P 29/00 (2006.01)
A 61 P 19/02 (2006.01)
A 61 P 25/04 (2006.01)
A 61 P 9/10 (2006.01)
A 61 P 25/28 (2006.01)
A 61 P 1/16 (2006.01)
A 61 P 1/04 (2006.01)
A 61 P 13/12 (2006.01)
A 61 P 27/02 (2006.01)
A 61 P 27/06 (2006.01)
A 61 P 3/10 (2006.01)
A 61 P 31/12 (2006.01)
A 61 P 31/04 (2006.01)
A 61 P 21/00 (2006.01)
A 61 P 39/02 (2006.01)
A 61 P 37/06 (2006.01)
A 61 P 19/10 (2006.01)
A 61 P 25/00 (2006.01)
A 61 P 15/00 (2006.01)
A 61 P 15/02 (2006.01)
A 61 P 31/10 (2006.01)
A 61 P 35/00 (2006.01)
A 61 P 37/00 (2006.01)
A 61 P 3/04 (2006.01)
A 61 P 17/04 (2006.01)
A 61 P 17/06 (2006.01)
A 61 P 17/08 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)
C 0 7 D 401/14 (2006.01)
C 0 7 D 471/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 239/48
C 0 7 D 403/12
C 0 7 D 487/04 1 4 4
A 6 1 K 31/505
A 6 1 K 31/506
A 6 1 K 31/519
A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 P 37/08
A 6 1 P 11/02
A 6 1 P 11/06
A 6 1 P 11/08
A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 27/14
A 6 1 P 17/00
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 25/04
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 1/16
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 13/12
A 6 1 P 27/02
A 6 1 P 27/06
A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 31/12
A 6 1 P 31/04
A 6 1 P 21/00
A 6 1 P 39/02
A 6 1 P 37/06
A 6 1 P 19/10
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 15/00
A 6 1 P 15/02
A 6 1 P 31/10
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 37/00
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 17/04
A 6 1 P 17/06
A 6 1 P 17/08
A 6 1 P 17/14
C 0 7 D 401/14
C 0 7 D 471/04 1 1 7 Z

【手続補正書】

【提出日】平成28年9月15日(2016.9.15)

【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

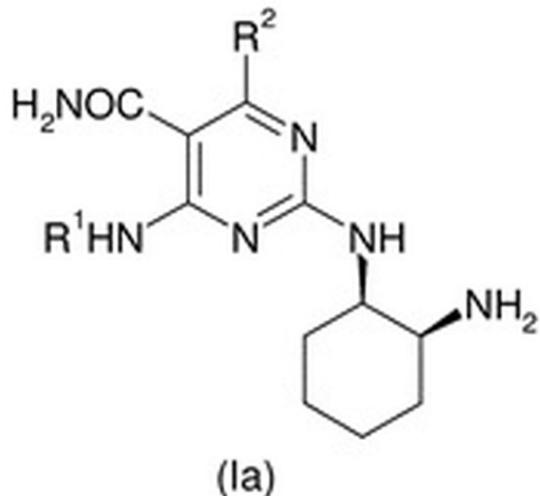
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(Ia)の化合物：

【化1】



もしくはその薬学的に許容される塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容される塩の薬学的に許容される溶媒和物であって、式中：

R¹は、1個のR³基および任意選択により1～3個のR⁴基で置換されているインドールであり；

R²は、HまたはOHであり；

R³は、-(CH₂)_n-Ar(式中、nは1、2、3または4であり、Arは1～3個のR⁴基で任意選択により置換されたフェニル基である)であり；

R⁴は、C₁～C₆アルキル、C₃～C₈シクロアルキル、ハロ、-CN、-OR⁵、-NR⁶R⁷、-SR⁵、-SOR⁸、-SO₂R⁸、-COR⁵、-OCOR⁵、-COOR⁵、-NR⁵COR⁵、-CONR⁶R⁷、-NR⁵SO₂R⁸、-SO₂NR⁶R⁷、-NR⁵CONR⁶R⁷、-NR⁵COOR⁸、-NR⁵SO₂NR⁶R⁷、-COR⁹および-COOOR⁹からそれぞれ独立して選択されるが、但し、-COR⁹および-COOOR⁹はR¹のN原子を介してのみ結合し；

R⁵は、H、C₁～C₆アルキルまたはC₃～C₈シクロアルキルであり；

R⁶およびR⁷は、それぞれ独立して、H、C₁～C₆アルキルもしくはC₃～C₈シクロアルキルであるか、またはそれらが結合している窒素原子と一緒にになって、1～2個の窒素原子もしくは1個の窒素原子および1個の酸素原子を含有し、1個以上のC₁～C₆アルキル基もしくはC₃～C₈シクロアルキル基で任意選択により置換されている4員、5員もしくは6員の飽和複素環式環を形成し；

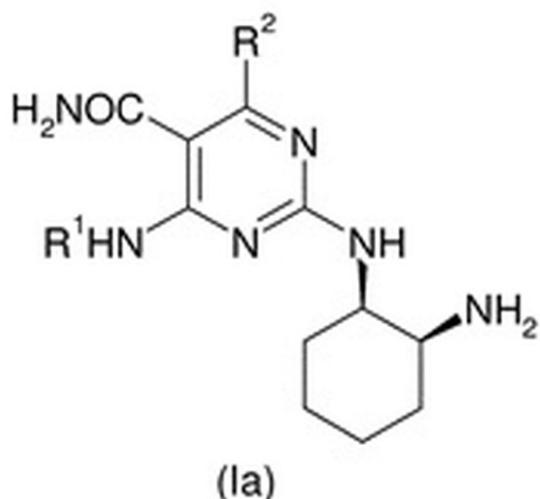
R⁸は、C₁～C₆アルキルまたはC₃～C₈シクロアルキルであり；

R⁹は、ハロ、OH、C₁～C₆アルキルおよびS-C₁～C₆アルキルで任意選択により置換されているピリジル、ベンジルまたはフェニルである；

化合物もしくはその薬学的に許容される塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容される塩の薬学的に許容される溶媒和物。

【請求項2】

式(Ia)の化合物：
【化2】



もしくはその薬学的に許容される塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容される塩の薬学的に許容される溶媒和物であって、式中：

R¹は、(i)任意選択により1個のR³基および1～3個のR⁴基で置換されているテトラヒドロイソキノリン；または、

(ii)任意選択により1～3個のR⁴基で置換されているベンジルフェニルまたはフェニルチオフェニルであり；

R²は、HまたはOHであり；

R³は、-(CH₂)_n-Ar(式中、nは0、1、2、3または4であり、Arは1～3個のR⁴基で任意選択により置換されたフェニル基である)であり；

R⁴は、C₁～C₆アルキル、C₃～C₈シクロアルキル、ハロ、-CN、-OR⁵、-NR⁶R⁷、-SR⁵、-SOR⁸、-SO₂R⁸、-COR⁵、-OCOR⁵、-COOR⁵、-OOR⁵、-NR⁵COR⁵、-CONR⁶R⁷、-NR⁵SO₂R⁸、-SO₂NR⁶R⁷、-NR⁵CONR⁶R⁷、-NR⁵COOR⁸、-NR⁵SO₂NR⁶R⁷、-COR⁹および-COOR⁹からそれぞれ独立して選択されるが、但し、-COR⁹および-COOR⁹はR¹のN原子を介してのみ結合し；

R⁵は、H、C₁～C₆アルキルまたはC₃～C₈シクロアルキルであり；

R⁶およびR⁷は、それぞれ独立して、H、C₁～C₆アルキルもしくはC₃～C₈シクロアルキルであるか、またはそれらが結合している窒素原子と一緒にになって、1～2個の窒素原子もしくは1個の窒素原子および1個の酸素原子を含有し、1個以上のC₁～C₆アルキル基もしくはC₃～C₈シクロアルキル基で任意選択により置換されている4員、5員もしくは6員の飽和複素環式環を形成し；

R⁸は、C₁～C₆アルキルまたはC₃～C₈シクロアルキルであり；

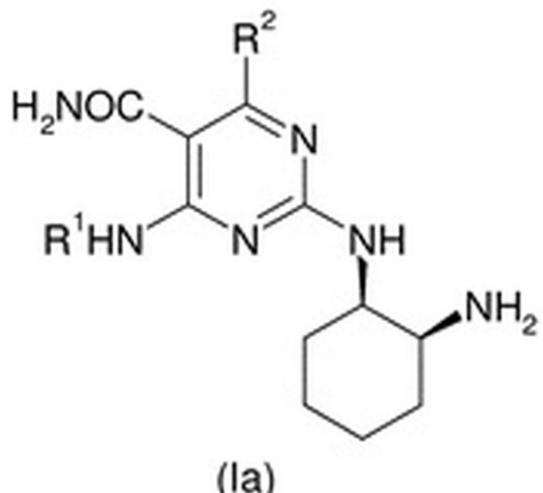
R⁹は、ハロ、OH、C₁～C₆アルキルおよびS-C₁～C₆アルキルで任意選択により置換されているピリジル、ベンジルまたはフェニルである；

化合物もしくはその薬学的に許容される塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容される塩の薬学的に許容される溶媒和物。

【請求項3】

式(Ia)の化合物：

【化3】



もしくはその薬学的に許容される塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容される塩の薬学的に許容される溶媒和物であって、式中：

R¹ は、任意選択により 1 ~ 3 個の R⁴ 基で置換されているビフェニルであり；

R² は、H または OH であり；

R⁴ は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、ハロ、-CN、-OH、-SR⁵、-SOR⁸、-SO₂R⁸、-COR⁵、-OCOR⁵、-COOR⁵、-NR⁵COR⁵、-CONR⁶R⁷、-NR⁵SO₂R⁸、-SO₂NR⁶R⁷、-NR⁵C_{ONR}⁶R⁷、-NR⁵COOR⁸、-NR⁵SO₂NR⁶R⁷、-COR⁹ および -COOR⁹ からそれぞれ独立して選択されるが、但し、-COR⁹ および -COOR⁹ は R¹ の N 原子を介してのみ結合し；

R⁵ は、H、C₁ ~ C₆ アルキルまたはC₃ ~ C₈ シクロアルキルであり；

R⁶ および R⁷ は、それぞれ独立して、H、C₁ ~ C₆ アルキルもしくはC₃ ~ C₈ シクロアルキルであるか、またはそれらが結合している窒素原子と一緒にになって、1 ~ 2 個の窒素原子もしくは 1 個の窒素原子および 1 個の酸素原子を含有し、1 個以上のC₁ ~ C₆ アルキル基もしくはC₃ ~ C₈ シクロアルキル基で任意選択により置換されている 4 員、5 員もしくは 6 員の飽和複素環式環を形成し；

R⁸ は、C₁ ~ C₆ アルキルまたはC₃ ~ C₈ シクロアルキルであり；

R⁹ は、ハロ、OH、C₁ ~ C₆ アルキルおよび S-C₁ ~ C₆ アルキルで任意選択により置換されているピリジル、ベンジルまたはフェニルである；

化合物であって、

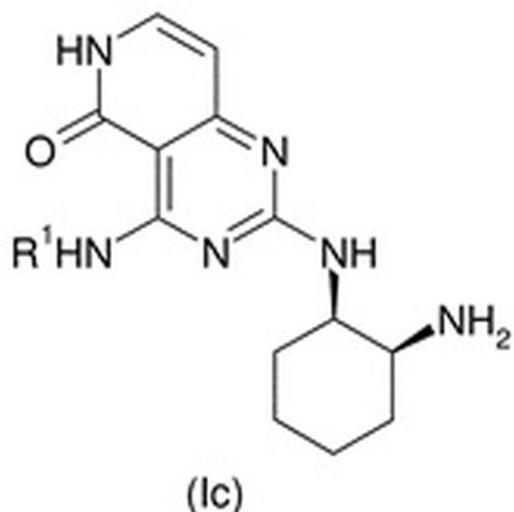
ここで、R² が H であるとき、R¹ は置換されていなければならず、R⁴ は F または SO₂CH₃ であってはならない。

化合物もしくはその薬学的に許容される塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容される塩の薬学的に許容される溶媒和物。

【請求項 4】

式(Ic)の化合物：

【化4】



もしくはその薬学的に許容される塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容される塩の薬学的に許容される溶媒和物であって、式中：

R^1 は、(i)(a) 1～4個のN原子、もしくは(b) 1個のO原子もしくはS原子および0～3個のN原子のいずれかを含有し、任意選択により1個の R^3 基および1～3個の R^4 基で置換されている9員の二環式芳香族複素環であるか、または(ii) 1～3個の R^4 基で任意選択により置換されているビフェニル基、ベンジルフェニル基、フェノキシフェニル基もしくはフェニルチオフェニル基であり；

R^2 は、HまたはOHであり；

R^3 は、 $- (CH_2)_n - Ar$ (式中、nは0、1、2、3または4であり、Arは1～3個の R^4 基で任意選択により置換されたフェニル基である)であり；

R^4 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、ハロ、-CN、-OR⁵、-NR⁶R⁷、-SR⁵、-SOR⁸、-SO₂R⁸、-COR⁵、-OCOR⁵、-COOR⁵、-NR⁵COR⁵、-CONR⁶R⁷、-NR⁵SO₂R⁸、-SO₂NR⁶R⁷、-NR⁵CONR⁶R⁷、-NR⁵COOR⁸、-NR⁵SO₂NR⁶R⁷、-COR⁹および-COOOR⁹からそれぞれ独立して選択されるが、但し、-COR⁹および-COOOR⁹は R^1 のN原子を介してのみ結合し；

R^5 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルであり；

R^6 および R^7 は、それぞれ独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキルもしくは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルであるか、またはそれらが結合している窒素原子と一緒にになって、1～2個の窒素原子もしくは1個の窒素原子および1個の酸素原子を含有し、1個以上の $C_1 \sim C_6$ アルキル基もしくは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル基で任意選択により置換されている4員、5員もしくは6員の飽和複素環式環を形成し；

R^8 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルであり；

R^9 は、ハロ、OH、 $C_1 \sim C_6$ アルキルおよびS-C₁～C₆アルキルで任意選択により置換されているピリジル、ベンジルまたはフェニルである；

化合物もしくはその薬学的に許容される塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容される塩の薬学的に許容される溶媒和物。

【請求項5】

R^1 がインドール；または1個の R^3 基および1～3個の R^4 基で任意選択により置換されているテトラヒドロイソキノリン；または1～3個の R^4 基で置換されているビフェニルである、請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

R^2 がHである、請求項1～4のいずれか一項に記載の化合物もしくはその薬学的に許容される塩、または前記化合物もしくは塩の薬学的に許容される溶媒和物。

【請求項 7】

R^3 が - (C₂H₅)_n - Ar (式中、n は 1、2、3 または 4 であり、Ar は 1 ~ 2 個の R^4 基で任意選択により置換されたフェニル基である) である、請求項 1、2、4 または 5 に記載の化合物。

【請求項 8】

R^5 が H または C₁ ~ C₆ アルキルである、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

R^4 が C₁ ~ C₆ アルキル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、ハロ、-CN、-SR⁵、-SOR⁸、-SO₂R⁸、-COR⁵、-OCOR⁵、-COOR⁵、-COR⁹、-COOR⁹、または-OH であるが、但し、-COR⁹ および -COOR⁹ は R¹ の N 原子を介してのみ結合する、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

請求項 1 に記載の化合物であって、前記化合物が、

2 - {[(1R^{*}, 2S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシリ]アミノ} - 4 - ({1 - [3 - (4 - ヒドロキシフェニル)プロピル] - 1H - インドール - 4 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1R^{*}, 2S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシリ]アミノ} - 4 - ({1 - [3 - (3 - ヒドロキシフェニル)プロピル] - 1H - インドール - 4 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1R^{*}, 2S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシリ]アミノ} - 4 - {[1 - (4 - メチルベンジル) - 1H - インドール - 4 - イル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1R^{*}, 2S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシリ]アミノ} - 4 - ({1 - [3 - (3 - メトキシフェニル)プロピル] - 1H - インドール - 4 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1R^{*}, 2S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシリ]アミノ} - 4 - {[1 - (3 - メチルベンジル) - 1H - インドール - 4 - イル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1R, 2S) - 2 - アミノシクロヘキシリ]アミノ} - 4 - [(1 - ベンジル - 1H - インドール - 4 - イル)アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1R^{*}, 2S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシリ]アミノ} - 4 - ({1 - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル)]エチル - 1H - インドール - 4 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1R^{*}, 2S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシリ]アミノ} - 4 - ({1 - [3 - (4 - メトキシフェニル)プロピル] - 1H - インドール - 4 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1R^{*}, 2S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシリ]アミノ} - 4 - ({1 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 1H - インドール - 4 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1R^{*}, 2S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシリ]アミノ} - 4 - {[1 - (4 - クロロベンジル) - 1H - インドール - 4 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1R^{*}, 2S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシリ]アミノ} - 4 - ({1 - [2 - (3 - ヒドロキシフェニル)エチル] - 1H - インドール - 4 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1R^{*}, 2S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシリ]アミノ} - 4 - ({1 - [3 - (2 - メトキシフェニル)プロピル] - 1H - インドール - 4 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1R^{*}, 2S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシリ]アミノ} - 4 - ({1 - [2 - (2 - ヒドロキシフェニル)エチル] - 1H - インドール - 4 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カ

ルボキサミド、

2 - {[(1 R, 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[1 - (4 - ヒドロキシベンジル) - 1 H - インドール - 4 - イル}アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - { [(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - [(1 - ベンジル - 1 H - インドール - 5 - イル)アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - ({ 1 - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル)エチル] - 1 H - インドール - 4 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - ({ 1 - [3 - (4 - ヒドロキシフェニル)プロピル] - 1 H - インドール - 4 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド.

2 - {[(1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[1 - (3 - ヒドロキシベンジル) - 1 H - インドール - 4 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[1 - (3 - フェニルプロピル) - 1 H - インドール - 4 - イル}アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド

カルボキサミド

2 - {[(1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - ({ 1 - [2 - (4 - メトキシフェニル)エチル] - 1 H - インドール - 4 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - ({1 - [2 - (2 - メトキシフェニル)エチル] - 1 H - インドール - 4 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[1 - (2 - フェニルエチル) - 1 H - インドール - 4 - イル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド

2 - {[(1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - ({ 1 - [3 - (4 - メトキシフェニル)プロピル] - 1 H - インドール - 4 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド

2 - { [(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - [(1 - ベンジル - 1 H - インドール - 6 - イル) アミノ] ピリミジン - 5 - カルボキサミド

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - ({1 - [3 - (メチルチオ)ベンジル] - 1 H - インドール - 4 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド

2 - {[(1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[1 - (2 - ヒドロキシベンジル) - 1 H - インドール - 4 - イル]アミノピリミジン - 5 - カリボキサミド

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[1 - (2 - フルオロベンジル) - 1 H - インドール - 4 - イリル]アミノヒドリニジン - 5 - カルボキサミド

口ペングル) - 1 H - イントール - 4 - イル}アミノ)ピリミン - 5 - カルボキサミド、
2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - ({1 - [4 - (メチ
ルチオ)ベンジル] - 1 H - インドール - 4 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミ
ド

ト、
2 - { [(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - { [1 - (2 - メチル

ヘンシル) - 1H - インドール - 4 - イル]アミノ}ヒリミシン - 5 - カルボキサミド、
 2 - {[(1R*, 2S*) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[1 - (2 - クロロ
 ベンゼンスルホニル) - 1 - メチルエチル]アミノ} - 5 - カルボキサミド。

ベンシル) - 1 H - インドール - 4 - イル]アミノ}ヒリミシン - 5 - カルボキサミド、
2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[1 - (3 - クロロ

ペニジル) - 1 H - インドール - 4 - イル]アミノ}ビリミジン - 5 - カルボキサミド、
2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[1 - (3 - メトキ

シベンジル) - 1 H - インドール - 6 - イル]アミノ}ビリミジン - 5 - カルボキサミド、
2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[1 - (4 - メトキ

シベンジル) - 1 H - インドール - 6 - イル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド、
 2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[1 - (2 - メトキ
 シベンジル) - 1 H - インドール - 6 - イル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド、
 2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[1 - (4 - ヒドロ
 キシベンジル) - 1 H - インドール - 6 - イル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド
 、
 2 - {[(1 R, 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[1 - (4 - ヒドロキシ
 ベンジル) - 1 H - インドール - 4 - イル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド、ま
 たは、
 2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[1 - (2 - メトキ
 シベンジル) - 1 H - インドール - 5 - イル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド、
 である、
 化合物。

【請求項 11】

請求項 2 に記載の化合物であって、前記化合物が、
 2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[2 - (ピリジン -
 3 - イルカルボニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル]アミノ}
 ピリミジン - 5 - カルボキサミド、
 2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[2 - (シクロブチ
 ルカルボニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル]アミノ}ピリミ
 ジン - 5 - カルボキサミド、
 2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[2 - (フェニルア
 セチル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル]アミノ}ピリミジン -
 5 - カルボキサミド、
 2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - [(2 - プロピオニ
 ル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル)アミノ]ピリミジン - 5 - カ
 ルボキサミド、
 2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - [(2 - イソニコチ
 ノイル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル)アミノ]ピリミジン - 5
 - カルボキサミド、
 2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[2 - (4 - ヒドロ
 キシベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル]アミノ}ピリ
 ミジン - 5 - カルボキサミド、
 メチル 7 - [2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 5 - カルバ
 モイルピリミジン - 4 - イル)アミノ] - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 2 (1 H) - カ
 ルボキシレート、
 エチル 7 - [2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 5 - カルバ
 モイルピリミジン - 4 - イル)アミノ] - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 2 (1 H) - カ
 ルボキシレート、
 2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[2 - (エチルスル
 フォニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル]アミノ}ピリミジン
 - 5 - カルボキサミド、
 2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[2 - (2 - ヒドロ
 キシベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル]アミノ}ピリ
 ミジン - 5 - カルボキサミド、
 フェニル 7 - [2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 5 - カルバ
 モイルピリミジン - 4 - イル)アミノ] - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 2 (1 H) - カ
 ルボキシレート、
 2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[2 - (3 - ヒドロ
 キシベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル]アミノ}ピリ

ミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[(2 - ベンゾイル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル)アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[{2 - [3 - (メチルチオ) ベンゾイル] - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル}アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

イソプロビル 7 - [2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 5 - カルバモイルピリミジン - 4 - イル)アミノ] - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 2 (1 H) - カルボキシレート、

4 - {[(2 - アセチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル)アミノ] - 2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

ベンジル 7 - [2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 5 - カルバモイルピリミジン - 4 - イル)アミノ] - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 2 (1 H) - カルボキシレート、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[{2 - (3 - フルオロベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル}アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

シクロプロピル 7 - [2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 5 - カルバモイルピリミジン - 4 - イル)アミノ] - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 2 (1 H) - カルボキシレート、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[{2 - (メチルスルフォニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル}アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[{2 - (シクロプロピルスルfonyl) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル}アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[{2 - (4 - フルオロベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル}アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[{2 - (3 - メトキシベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル}アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[{2 - (3 - エチルシベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル}アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[{2 - (シクロヘキシルカルボニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル}アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[{2 - (イソプロピルスルfonyl) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル}アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[{2 - (4 - メチルベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル}アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[{2 - (2 - クロロベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル}アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[{2 - (2 - フルオ

ロベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[2 - (4 - クロロ
ベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル]アミノ}ピリミジ
ン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[2 - (シクロペンチルカルボニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[2 - (3 - メチルベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[2 - (シクロプロピルカルボニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - ({ 2 - [4 - (メチルチオ)ベンゾイル] - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[2 - (4 - エチルベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[2 - (2 - エチルベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[2 - (3 - クロロ
ベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル]アミノ}ピリミジ
ン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[2 - (ピリジン - 2 - イルカルボニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル]アミノ} ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - ({ 2 - [2 - (メチルチオ)ベンゾイル] - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - [(2 - ベンジル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル)アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - ([2 - (2 - メチルベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - [(2 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル)アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - (1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イルアミノ) ピリミジン - 5 - カルボキサミド、
2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - [(2 - イソブチリ

ル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル)アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、
2 - {[(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[3 - (4 - メトキ

シベンジル)フェニル]アミノ}ピリミジン-5-カルボキサミド、
2-[[(1R*,2S*)-2-アミノシクロヘキシル]アミノ]-4-[3-(4-クロロ
ベンジル)フェニル]アミノ}ピリミジン-5-カルボキサミド、

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[3 - (4 - メチルベンジル)フェニル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[(3 - ベンジルフェニル)アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[(4 - ベンジルフェニル)アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - ({ 3 - [(3 - ヒドロキシフェニル)チオ]フェニル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - ({ 3 - [(4 - ヒドロキシフェニル)チオ]フェニル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - ({ 3 - [(4 - メトキシフェニル)チオ]フェニル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - ({ 3 - [(4 - クロロフェニル)チオ]フェニル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - ({ 3 - [(3 - メチルフェニル)チオ]フェニル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - ({ 3 - [(3 - メトキシフェニル)チオ]フェニル}アミノ)ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[3 - (フェニルチオ)フェニル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド、または、

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[4 - (フェニルチオ)フェニル]アミノ}ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

である、

化合物。

【請求項 1 2】

請求項 3 に記載の化合物であって、前記化合物が、

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[(4 - ヒドロキシフェニル - 3 - イル)アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[(3' - ヒドロキシビフェニル - 3 - イル)アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R, 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[(3' - ヒドロキシビフェニル - 3 - イル)アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R, 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[(4' - ヒドロキシビフェニル - 3 - イル)アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[(3' - メチルビフェニル - 3 - イル)アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[(4' - クロロ - 3' - ヒドロキシビフェニル - 3 - イル)アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、または、

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[(4' - クロロビフェニル - 3 - イル)アミノ]ピリミジン - 5 - カルボキサミド、

である、

化合物。

【請求項 1 3】

請求項 4 に記載の化合物であって、

2 - {[(1 R^{*}, 2 S^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - (1 H - インドール - 4 - イルアミノ)ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン - 5 (6 H) - オン、または、

2 - {[(1 R, 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシル]アミノ} - 4 - {[(4' - ヒドロキシビフェニル - 3 - イル)アミノ]ピリド [4 , 3 - d] ピリミジン - 5 (6 H) - オン、

である、

化合物。

【請求項 1 4】

請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物と、薬学的に許容される医薬品添加物とを含む医薬組成物。

【請求項 1 5】

治療を必要とする対象における、SYK 阻害剤の適応疾患または症状を治療するために用いられる、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 6】

請求項 1 5 に記載の化合物であって、前記疾患または症状が、アレルギー性鼻炎、鼻閉、鼻漏、通年性鼻炎、鼻の炎症、喘息、慢性閉塞性肺疾患（COPD）、慢性または急性気管支収縮、慢性気管支炎、末梢気道閉塞、肺気腫、慢性好酸球性肺炎、成人呼吸窮迫症候群、他の薬物療法の結果として起こる気道反応亢進の増悪、肺血管疾患（肺動脈高血圧症を含む）、急性肺損傷、気管支拡張症、副鼻腔炎、アレルギー性結膜炎、特発性肺線維症またはアトピー性皮膚炎、特に、喘息またはアレルギー性鼻炎またはアトピー性皮膚炎またはアレルギー性結膜炎、炎症、関節炎、疼痛、発熱、肺サルコイドーシス、珪肺症、心血管疾患（アテローム性動脈硬化症、心筋梗塞、血栓症、うっ血性心不全および心臓再灌流障害を含む）、心筋症、脳卒中、虚血、再灌流障害、脳浮腫、脳外傷、神経変性、肝疾患、炎症性腸疾患（クローン病および潰瘍性大腸炎を含む）、腎炎、網膜炎、網膜症、黄斑変性、緑内障、糖尿病（1型および2型糖尿病を含む）、ドライアイ症、糖尿病性神経障害、ウイルスおよび細菌感染、筋痛症、内毒素ショック、中毒性ショック症候群、自己免疫疾患、骨粗鬆症、多発性硬化症、子宮内膜症、月経性痙攣、腫瘍、カンジダ症、癌、結膜炎、食物アレルギー、線維症、肥満、筋ジストロフィー、多発筋炎、アルツハイマー病、皮膚潮紅、湿疹、乾癬、アトピー性皮膚炎、酒さ、円板状エリテマトーデス、結節性痒疹、脱毛症ならびに日焼けから選択される、

化合物。

【請求項 1 7】

請求項 1 5 に記載の化合物であって、前記疾患または症状が、喘息、COPD、アレルギー性鼻炎、慢性副鼻腔炎、アトピー性皮膚炎、乾癬、酒さ、脱毛症、アレルギー性結膜炎およびドライアイ症から選択される、

化合物。