

【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24年4月5日(2012.4.5)

【公表番号】特表2010-516812(P2010-516812A)

【公表日】平成22年5月20日(2010.5.20)

【年通号数】公開・登録公報2010-020

【出願番号】特願2009-548286(P2009-548286)

【国際特許分類】

C 07 D 487/04 (2006.01)

A 61 K 31/519 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 35/02 (2006.01)

【F I】

C 07 D 487/04 1 4 3

C 07 D 487/04 C S P

A 61 K 31/519

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 35/00

A 61 P 35/02

【手続補正書】

【提出日】平成23年1月28日(2011.1.28)

【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

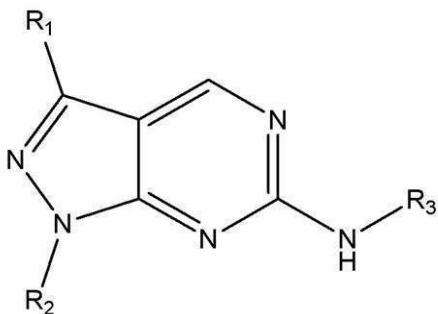
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物、そのプロドラッグ、多形体、互変異性体、エナンチオマー、立体異性体、溶媒和化合物、N-オキシド又は薬理学的に許容できる塩。

【化1】



(式中、R<sup>1</sup>は水素又はハロ基であり、

R<sup>2</sup>は-L<sub>1</sub>-R<sub>a</sub>であり、

L<sub>1</sub>は結合であり、

R<sub>a</sub>はアルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基又はヘテロアリール基であって、各々のシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基及びヘテロアリール基が任意に置換されてもよく、かつ8~16個の環原子を有するか、又は、

L<sub>1</sub>はアルキル基であり、

R<sub>a</sub>は水素、アルケニル基、アルキニル基、アミノ基、ヒドロキシ基、アルコキシカルボニル基、アルキルカルボニルオキシ基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基又はヘテロアリール基であって、各々のシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基及びヘテロアリール基が任意に置換されてもよく、かつ8~16個の環原子を有し、

R<sup>3</sup>は-R<sub>b</sub>-L<sub>2</sub>-R<sub>c</sub>であり、

R<sub>b</sub>はアリール基、ヘテロアリール基、シクロアルキル基又はヘテロシクロアルキル基であって、1~3個の置換基で任意に置換されてもよく、置換基のうちの2つが隣接するときは、それらが結合する1つ以上の原子と共に、0~6個のヘテロ環原子を有する5~16員環を形成してもよく、

R<sub>b</sub>は、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、ヘテロアリール基、アリール基、ヘテロアリール基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、-OR、-SR、-NRR'、オキソ基、-C(O)-OR、-C(O)-NRR'、ハロ基、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、-C(O)R、-P(O)(OR)R'、-O-P(O)(OR)R'、-NR-P(O)(OR')R"、-S(O)<sub>2</sub>-(OR)、-O-S(O)<sub>2</sub>-(OR)、-NR-S(O)<sub>2</sub>-OR'、-NR-C(O)-OR'、-NR-C(O)-NR'R"、-NR-C(S)-NR'R"、-C(S)-NRR'及びチオアルキル基、からなる群から各々独立に選択される1~3個の置換基で任意に置換されてもよく、

R<sub>c</sub>は水素、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、シクロアルケニル基、ヘテロシクロアルケニル基、アリール基、ヘテロアリール基、シクロアルキルアルキル基、ヘテロシクロアルキル基-アルキル基、シクロアルケニル基-アルキル基、ヘテロシクロアルケニル基-アルキル基、アラルキル基又はヘテロアラルキル基であって、かつ、水素を除いて、1~3個の置換基で任意に置換されてもよく、

R<sub>c</sub>は、水素である場合を除き、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、ヘテロアリール基、アリール基、ヘテロアリール基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、-OR、-SR、-NRR'、オキソ基、-C(O)-OR、-C(O)-NRR'、ハロ基、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、-C(O)R、-P(O)(OR)R'、-O-P(O)(OR)R'、-NR-P(O)(OR)R'、-NR-P(O)(OR')R"、-S(O)<sub>2</sub>-(OR)、-O-S(O)<sub>2</sub>-(OR)、-NR-S(O)<sub>2</sub>-OR'、-NR-C(O)-NR'R"、-NR-C(S)-NR'R"、-C(S)-NRR'及びチオアルキル基、からなる群から各々独立に選択される1~3個の置換基により任意に置換されてもよく、

R及びR'が各々独立に水素、アルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、アラルキル基又はヘテロアラルキル基であって、かつ、R"がアルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、アラルキル基又はヘテロアラルキル基であり、

L<sub>2</sub>は結合、-(CR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>)<sub>n</sub>、-N=、-O-、-S-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-CO-、-CO-O-、-O-CO-、-NR<sub>x</sub>-、-NR<sub>x</sub>-CO-、-NR<sub>x</sub>-SO<sub>2</sub>-、-CO-NR<sub>x</sub>-、-SO<sub>2</sub>-NR<sub>x</sub>-、-NR<sub>x</sub>-CO-O-、-NR<sub>x</sub>-SO<sub>2</sub>-O-、-NR<sub>x</sub>-CO-NR<sub>y</sub>-、-NR<sub>x</sub>-SO<sub>2</sub>-NR<sub>y</sub>-、-CO-NR

$\text{x} - \text{N R}_y - , - \text{S O}_2 - \text{N R}_x - \text{N R}_y - , - \text{N R}_x - \text{C O} - \text{C O} - \text{O} - , - \text{N R}_x - \text{S O}_2 - \text{S O}_2 - \text{O} - , - \text{S}(\text{O})_2 - \text{N}_x - \text{C O} - \text{R}_y - , - \text{C O} - \text{N}_x - \text{S}(\text{O})_2 - \text{R}_y$  - 又は  $(\text{N R}_x \text{R}_y) \text{C} = \text{N} - \text{O} -$  であり、

$\text{R}_x$  及び  $\text{R}_y$  は各々独立に水素、ヒドロキシ基、アルキル基、アルコキシ基、アミノ基、 $-\text{C O}$ -アルキル基、 $-\text{C O}$ -アリール基、 $-\text{S O}_2$ -アルキル基、 $-\text{S O}_2$ -アリール基、 $-\text{S O}_2$ -ヘテロアリール基又は $-\text{P}(\text{O})(\text{O}-\text{アルキル})_2$  であって、 $\text{R}_x$  又は  $\text{R}_y$  のアルキル部分又はアリール部分は、1~3個の置換基で任意に置換されてもよく、該置換基は、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、ヘテロアリール基、アリール基、ヘテロアリール基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、 $-\text{O R}$ 、 $-\text{S R}$ 、 $-\text{N R R}'$ 、オキソ基、 $-\text{C}(\text{O})-\text{O R}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N R R}'$ 、ハロ基、 $-\text{C N}$ 、 $-\text{N O}_2$ 、 $-\text{N}_3$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{O R})\text{R}'$ 、 $-\text{O}-\text{P}(\text{O})(\text{O R})\text{R}'$ 、 $-\text{N R}-\text{P}(\text{O})(\text{O R}')\text{R}''$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-(\text{O R})$ 、 $-\text{O}-\text{S}(\text{O})_2-(\text{O R})$ 、 $-\text{N R}-\text{S}(\text{O})_2-\text{O R}'$ 、 $-\text{N R}-\text{C}(\text{O})-\text{O R}'$ 、 $-\text{N R}-\text{C}(\text{O})-\text{N R}'\text{R}''$ 、 $-\text{N R}-\text{C}(\text{S})-\text{N R}'\text{R}''$ 、 $-\text{C}(\text{S})-\text{N R R}'$  及びチオアルキル基、からなる群から各々独立に選択され、

(n は 0、1、2、又は 3 である)

#### 【請求項 2】

$\text{R}_3$  が 4-ビス(メタンスルホニル)アミノフェニル基、4-ビス(エタンスルホニル)アミノフェニル基、4-(4-メチルピペリジン-1-イル)フェニル基、4-ビス(メタンスルホニル)アミノフェニル基、4-ビス((クロロメタン)スルホニル)アミノフェニル基、4-(メタンスルホニル)アミノフェニル基、4-(N'-ヒドロキシカルバミミドイル)フェニル基、4-(4-メチルピペリジン-1-イル)フェニル基、4-アミノフェニル基、4-(メタンスルホニルカルバモイル)フェニル基、4-シアノフェニル基、4-(テトラゾール-5-イル)アミノフェニル基、2-(4-ニトロフェニル)エチル基、2-(4-アミノフェニル)エチル基又は 2-(4-ビス(メタンスルホニル)アミノフェニル)エチル基である、請求項 1 記載の化合物。

#### 【請求項 3】

$\text{R}_a$  がシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基及びヘテロアリール基である、請求項 1 から 2 のいずれか 1 項記載の化合物。

#### 【請求項 4】

$\text{R}_a$  がジヒドロインデニル基、テトラヒドロナフチル基、ジヒドロアセナフチレニル基、ナフチレニル基、テトラヒドロベンゾ[7]アヌレニル基、キノリニル基、イソキノリニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾキサゾリル基、フェナントレニル基又はテトラヒドロジベンゾ[7]アヌレニル基、であり、

$\text{R}_a$  が 1~3 の置換基で任意に置換されてもよい、請求項 1 から 3 のいずれか 1 項記載の化合物。

#### 【請求項 5】

$\text{R}_a$  がジヒドロインデニル基、テトラヒドロナフチル基、ジヒドロアセナフチレニル基又はナフチル基であり、

$\text{R}_a$  が 1~3 個の置換基で任意に置換されてもよい、請求項 1 から 4 のいずれか 1 項記載の化合物。

#### 【請求項 6】

$\text{R}_a$  がジヒドロインデン-1-イル基、4-ヒドロキシジヒドロインデン-1-イル基、4-ベンゾイルオキシジヒドロインデン-1-イル基、4-ジヒドロホスホリルオキシジヒドロインデン-1-イル基、5,6-ジオキソールジヒドロインデン-1-イル基、5-アセトアミドジヒドロインデン-1-イル基、5-ベンゾイルオキシジヒドロインデン-1-イル基、4-ベンゾイルオキシジヒドロインデン-1-イル基、4-(ジ-te-r-t-ブチルホスホリルオキシ)ジヒドロインデン-1-イル基、5-(2-メトキシエトキシ)メチル)ジヒドロインデン-1-イル基又は 5-メトキシジヒドロインデン-1-イル基である、請求項 1 から 5 のいずれか 1 項記載の化合物。

**【請求項 7】**

$R_a$  が、1～3個の置換基で任意に置換されてもよいインドリル基である、請求項1から6のいずれか1項記載の化合物。

**【請求項 8】**

$R_a$  が、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、インドール-5-イル基、7-メチルインドール-5-イル基、1-tert-ブチルカルボキシ-7-メチルインドール-5-イル基又は(1-tert-ブチルカルボキシ)インドール-5-イル基である、請求項1から7のいずれか1項記載の化合物。

**【請求項 9】**

$R_3$  が4-ビス(メタンスルホニル)アミノフェニル基である、請求項1から8のいずれか1項記載の化合物。

**【請求項 10】**

$L_1$  がメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基又はブチル基であり、 $R_a$  が水素、アミノ基、ヒドロキシ基、アルコキシカルボニル基、アルキルカルボニルオキシ基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基又はヘテロアリール基であり、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基及びヘテロアリール基の各々が、1～3個の置換基により任意に置換されてもよい、請求項1から9のいずれか1項記載の化合物。

**【請求項 11】**

$R_2$  がナフタレン-1-イルメチル基である、請求項1から10のいずれか1項記載の化合物。

**【請求項 12】**

$R_3$  が4-(ペリジン-1-イル)フェニル基又は4-(ビス(メチルスルホニル)アミノ)フェニル基である、請求項1から11のいずれか1項記載の化合物。

**【請求項 13】**

$R_b$  が、フェニル基であって、かつ1～3個の置換基で任意に置換されてもよく、 $L_2$  が、-O-、-S-、-SO<sub>2</sub>-、-CO-、-CO-O-、-NR<sub>x</sub>-、-NR<sub>x</sub>-CO-、-NR<sub>x</sub>-CO-O-、-NR<sub>x</sub>-CO-NR<sub>y</sub> 又は-NR<sub>x</sub>-CO-CO-O-であり、

$R_x$  及び $R_y$  の各々が、水素、アルキル基、-CO-アルキル基又は-SO<sub>2</sub>-アルキル基である、

請求項1記載の化合物。

**【請求項 14】**

$R_c$  が水素、アルキル基、アリール基又はヘテロアリール基である、請求項1から13のいずれか1項記載の化合物。

**【請求項 15】**

$L_2$  が結合であり、

$R_c$  がシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、(シクロアルキル)アルキル基、(ヘテロシクロアルキル)アルキル基、アラルキル基又はヘテロアラルキル基である、請求項1から14のいずれか1項記載の化合物。

**【請求項 16】**

$L_2$  が結合であり、

$R_c$  がテトラゾリル基、モリホリノ基又はピペラジニル基である、請求項1から15のいずれか1項記載の化合物。

**【請求項 17】**

$R_c$  がシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、シクロアルキルアルキル基、ヘテロシクロアルキル基-アルキル基、アラルキル基又はヘテロアラルキル基である、請求項1から16のいずれか1項記載の化合物。

**【請求項 18】**

$R_b$  が、-NRR' 及び-C(O)OR からなる群から各々独立に選択される1～3個

の置換基で置換されたフェニル基であり、

$L_2$  が結合であり、

$R_c$  が水素である、請求項 1 から 17 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 19】

$R_1$  が水素である、請求項 1 から 17 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 20】

$L_1$  が結合であり、

$R_a$  がシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基及びヘテロアリール基であり、

$R_b$  がフェニル基であり、

$L_2$  が -O- 、 -S- 、 -SO<sub>2</sub>- 、 -CO- 、 -CO-O- 、 -NR<sub>x</sub>- 、 -NR<sub>x</sub>-CO- 、 -NR<sub>x</sub>-SO<sub>2</sub>- 、 -NR<sub>x</sub>-CO-O- 、 -NR<sub>x</sub>-CO-NR<sub>y</sub>- 又は -NR<sub>x</sub>-CO-CO-O- であって、

$R_x$  が水素、アルキル基、-CO-アルキル基、-SO<sub>2</sub>-アルキル基、-SO<sub>2</sub>-アリール基又は-SO<sub>2</sub>-ヘテロアリール基であり、

$R_c$  が水素、アルキル基、アリール基又はヘテロアリール基である、請求項 1 から 19 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 21】

$L_1$  が結合であり、 $R_a$  がジヒドロインデニル基、テトラヒドロナフチル基、ジヒドロアセナフチレニル基又はナフチル基であり、

$R_b$  がフェニル基であり、

$L_2$  が -CO-O- 、 -NR<sub>x</sub>- 、 -NR<sub>x</sub>-SO<sub>2</sub>- 、 -NR<sub>x</sub>-CO-O- 、 又は -NR<sub>x</sub>-CO-NR<sub>y</sub>- であって、

$R_x$  が水素、アルキル基、-CO-アルキル基、-SO<sub>2</sub>-アルキル基又は-SO<sub>2</sub>-アリール基であり、

$R_c$  が水素、アルキル基又はアリール基である、請求項 1 から 19 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 22】

$L_1$  が結合であり、

$R_a$  がシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基又はヘテロアリール基であり、

$R_b$  がフェニル基であり、

$L_2$  が結合であり、

$R_c$  がシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、(シクロアルキル)アルキル基、(ヘテロシクロアルキル)アルキル基、アラルキル基又はヘテロアラルキル基である、請求項 1 から 19 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 23】

$L_1$  が結合であり、

$R_a$  がジヒドロインデニル基、テトラヒドロナフチル基、ジヒドロアセナフチレニル基又はナフチル基であり、

$R_b$  がフェニル基であり、

$L_2$  が結合であり、

$R_c$  がテトラゾリル基、モリホリノ基又はピペラジニル基である、請求項 1 から 22 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 24】

$L_1$  がアルキル基であり、

$R_a$  が水素、アルケニル基、アルキニル基、アミノ基、ヒドロキシ基、アルコキシカルボニル基、アルキルカルボニルオキシ基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基又はヘテロアリール基であって、各々のシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基及びヘテロアリール基が、1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されてもよ

く、かつ8~16個の環原子を有する、請求項1から23のいずれか1項記載の化合物。

**【請求項25】**

R<sub>b</sub>が、各々独立に-NRR'又は-C(=O)ORである1~3個の置換基で置換されたフェニル基であり、

L<sub>2</sub>が結合であり、

R<sub>c</sub>が水素である、請求項1から19のいずれか1項記載の化合物。

**【請求項26】**

L<sub>2</sub>が、結合であるか又は-NR<sub>x</sub>-SO<sub>2</sub>-であって、

かつR<sub>x</sub>が水素又は-SO<sub>2</sub>-アルキル基であり、

R<sub>c</sub>が水素、アルキル基、ヘテロシクロアルキル基、ヘテロアリール基、ヘテロシクロアルキル基-アルキル基又はヘテロアラルキル基である、請求項1から19のいずれか1項記載の化合物。

**【請求項27】**

R<sub>b</sub>が、-NRR'又は-C(=O)ORで任意に置換されてもよいフェニル基であり、

L<sub>2</sub>が結合であるか又は-NR<sub>x</sub>-SO<sub>2</sub>-であって、

かつR<sub>x</sub>が水素又は-SO<sub>2</sub>-アルキル基であり、

R<sub>c</sub>がテトラゾリル基、モリホリノ基又はピペラジニル基である、請求項1から26のいずれか1項記載の化合物。

**【請求項28】**

R<sub>2</sub>が2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル基、(S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル基、(R)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル基、1,2-ジヒドロアセナフチレン-1-イル基、(R)-1,2-ジヒドロアセナフチレン-1-イル基、(S)-1,2-ジヒドロアセナフチレン-1-イル基、フェナントレン-1-イル基又はフェナントレン-4-イル基である、請求項1から27のいずれか1項記載の化合物。

**【請求項29】**

R<sub>3</sub>が4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル基、3-ヒドロキシ-4-メトキシフェニル基、4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニル基、4-(ピペラジン-1-イル)フェニル基、4-アミノフェニル基、4-安息香酸、4-モルホリノフェニル基、4-(N,N-ジメチルスルホンアミド)フェニル基又は4-(メタンスルホンアミド)フェニル基である、請求項1から28のいずれか1項記載の化合物。

**【請求項30】**

前記化合物が、

N-(メチルスルホニル)-N-(4-(1-(ナフタレン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)メタンスルホンアミド、N-メチル-N-(4-(1-(ナフタレン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)メタンスルホンアミド、N-メチル-N-(4-(1-(ナフタレン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)メタンスルホンアミド、1-(メチルスルホニル)-N-(4-(1-(ナフタレン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)メタンスルホンアミド、N<sup>1</sup>-(1-(ナフタレン-2-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イル)ベンゼン-1,4-ジアミン、エチル-2-(4-(1-(ナフタレン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)メタンスルホンアミド、N<sup>1</sup>-(1-(ナフタレン-2-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イル)ベンゼン-1,4-ジアミン、エチル-2-(4-(1-(ナフタレン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)メタンスルホンアミド、3,3,3-トリフルオロ-N-(4-(1-(ナフタレン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)プロパン-1-スルホンアミド、メチル-4-(1-(ナフタレン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニルカルバメート、N-(3,4-ジメトキシフェニル)-1-(ナフタレン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,

, 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 - ( ナフタレン - 2 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、エチル - 2 - ヒドロキシ - 4 - ( 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニルカルバメート、N - ( 4 - ( 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ) フェニル ) - 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、メチル 3 - ( 4 - ( 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニルアミノ ) - 3 - オキソプロパノエート、N<sup>1</sup> - ( 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) ベンゼン - 1 , 4 - ジアミン、N - ( 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 4 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル ) - 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 4 - エトキシフェニル ) - 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、( S ) - 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、( S ) - 4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) 安息香酸、( S ) - N - ( 4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、( S ) - N<sup>1</sup> - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) ベンゼン - 1 , 4 - ジアミン、( S ) - 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 4 - モルホリノフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、( S ) - 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 4 - ( プロピルスルホニル ) ピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) 安息香酸、1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 3 - ( ピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N<sup>1</sup> - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) ベンゼン - 1 , 4 - ジアミン、N - ( 4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 4 - ( 4 - ( プロピルスルホニル ) ピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、( S ) - 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 4 - ( 4 - ( メチルスルホニル ) ピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、( S ) - 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 4 - ( ピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) ベンズアミド、( S ) - 5 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) - 2 - メトキシフェノール、1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 4 - ( ピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 4 - モルホリノフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、3 - ( 4 - ( 4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) ピペラジン - 1 - イル ) プロパン - 1 - オール、4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イ

ルアミノ)ベンゾヒドラジド、2-(4-(4-(1-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)ピペラジン-1-イル)エチルアセテート、1-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-N-(4-(4-(4-メトキシ-3,5-ジメチルピリジン-2-イル)メチル)ピペラジン-1-イル)フェニル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、3-(4-(4-(1-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)ピペラジン-1-イル)プロピルアセテート、2-(4-(4-(1-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)ピペラジン-1-イル)エタノール、1-((S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-N-(3-(1-((R)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルオキシ)-4-メトキシフェニル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、(S)-エチル-4-(1-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)ベンゾアート、(S)-1-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-N-(4-モルホリノフェニル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(1-(4-ヒドロキシ-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)-N-(メチルスルホニル)メタンスルホンアミド、(S)-N-(4-(1-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)-N-(エチルスルホニル)エタンスルホンアミド、1-(6-(4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニルアミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-1-イル)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-オール、1-(6-(4-(N-(メチルスルホニル)メチルスルホンアミド)フェニルアミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-1-イル)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イルベンゾアート、1-(6-(4-(N-(メチルスルホニル)メチルスルホンアミド)フェニルアミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-1-イル)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イルニ水素ホスフェート、(S)-1-クロロ-N-(クロロメチルスルホニル)-N-(4-(1-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)メタンスルホンアミド、N-(4-(1-(6,7-ジヒドロ-5H-インデノ[5,6-d][1,3]ジオキソール-5-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)-N-(メチルスルホニル)メタンスルホンアミド、N-(1-(6-(4-(N-(メチルスルホニル)メチルスルホンアミド)フェニルアミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-1-イル)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イル)アセトアミド、N-(4-(1-(4-ヒドロキシ-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)メタンスルホンアミド、1-(6-(4-(N-(メチルスルホニル)メチルスルホンアミド)フェニルアミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-1-イル)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イルベンゾアート、(S,Z)-4-(1-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)-N'-ヒドロキシベンズイミドアミド、1-(6-(4-(4-メチルピペラジン-1-イル)フェニルアミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-1-イル)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イルベンゾアート、1-(6-(4-アミノフェニルアミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-1-イル)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-オール、1-(6-(4-アミノフェニルアミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-1-イル)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イルベンゾアート、ジ-tert-ブチル1-(6-(4-(N-(メチルスルホニル)メチルスルホンアミド)フェニルアミノ)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-1-イル)

ル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 4 - イル ホスフェート、(S) - 4 - (1  
 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピ  
 リミジン - 6 - イルアミノ) - N - (メチルスルホニル) ベンズアミド、N - (4 - (1  
 - (5 - ((2 - メトキシエトキシ) メトキシ) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1H - インデン -  
 1 - イル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イルアミノ) フェニル) -  
 N - (メチルスルホニル) メタンスルホンアミド、N - (1 - (6 - (4 - アミノフェニ  
 ルアミノ) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 1 - イル) - 2 , 3 - ジヒドロ  
 - 1H - インデン - 5 - イル) アセトアミド、(S) - 4 - (1 - (2 , 3 - ジヒドロ -  
 1H - インデン - 1 - イル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イルアミ  
 ノ) ベンゾニトリル、(S) - N - (4 - (1H - テトラゾール - 5 - イル) フェニル)  
 - 1 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1H - インデ  
 ン - 1 - イル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - アミン、N 1 - (1 -  
 (5 - メトキシ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル) - 1H - ピラゾロ [3  
 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イル) ベンゼン - 1 , 4 - ジアミン、N - (4 - (1 - (5  
 - メトキシ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4  
 - d] ピリミジン - 6 - イルアミノ) フェニル) - N - (メチルスルホニル) メタンスル  
 ホンアミド、1 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 2 - イル) - N - (4 - モルホ  
 リノフェニル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - アミン、N - (4 - (1 -  
 (1H - インドール - 4 - イル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 -  
 イルアミノ) フェニル) - N - (メチルスルホニル) メタンスルホンアミド、N - (4 -  
 (1 - (1H - インドール - 6 - イル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 -  
 イルアミノ) フェニル) - N - (メチルスルホニル) メタンスルホンアミド、N - (4 -  
 (1 - (1H - インドール - 5 - イル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン -  
 6 - イルアミノ) フェニル) - N - (メチルスルホニル) メタンスルホンアミド、1 - (1H -  
 インドール - 4 - イル) - N - (4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) フェニ  
 尔) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - アミン、N - (4 - (1 - (1 -  
 メチル - 1H - インドール - 5 - イル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 -  
 イルアミノ) フェニル) - N - (メチルスルホニル) メタンスルホンアミド、1 - (7 -  
 メチル - 1H - インドール - 4 - イル) - N - (4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イ  
 尔) フェニル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - アミン、tert - ブ  
 チル7 - メチル - 4 - (6 - (4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) フェニルアミノ  
 ) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 1 - イル) - 1H - インドール - 1 - カ  
 ルボキシレート、tert - ブチル4 - (6 - (4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル  
 ) フェニルアミノ) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 1 - イル) - 1H - イ  
 ンドール - 1 - カルボキシレート、1 - (1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル  
 ) - N - (4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) フェニル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4  
 - d] ピリミジン - 6 - アミン、N - (4 - (1 - (1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン -  
 1 - イル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イルアミノ) フェニル) -  
 N - (メチルスルホニル) メタンスルホンアミド、N<sup>1</sup> - (1 - (1 , 2 - ジヒドロアセ  
 ナフチレン - 1 - イル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イル) ベンゼ  
 ン - 1 , 4 - ジアミン、1 - (1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル) - N - (4  
 - モルホリノフェニル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - アミン、4 -  
 (1 - (1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピ  
 リミジン - 6 - イルアミノ) ベンゾニトリル、1 - (1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン  
 - 1 - イル) - N - (4 - (2 - (トリメチルスタンニル) - 2H - テトラゾール - 5 -  
 イル) フェニル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - アミン、1 - (1 ,  
 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル) - N - (4 - (ピペラジン - 1 - イル) フェニ  
 尔) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - アミン、N - (4 - モルホリノフ  
 ェニル) - 1 - (ナフタレン - 1 - イルメチル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミ  
 ジン - 6 - アミン、又は、N - (4 - モルホリノフェニル) - 1 - (ナフタレン - 1 - イ

ルメチル) - 1H - ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、である、請求項1記載の化合物。

【請求項31】

前記化合物が、

N-(4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル)-1-((S)-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル)-1-((R)-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル)-1-((2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル)-1-((S)-(1,2-ジヒドロアセナフチレン-1-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル)-1-((R)-(1,2-ジヒドロアセナフチレン-1-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル)-1-((1,2-ジヒドロアセナフチレン-1-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル)-1-((1-ナフチル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル)-1-((フェナントレン-4-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(1H-テトラゾール-5-イル)フェニル)-1-((モルホリノフェニル))-1-((S)-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(モルホリノフェニル))-1-((R)-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(モルホリノフェニル))-1-((S)-(1,2-ジヒドロアセナフチレン-1-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(モルホリノフェニル))-1-((R)-(1,2-ジヒドロアセナフチレン-1-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(モルホリノフェニル))-1-((1,2-ジヒドロアセナフチレン-1-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(モルホリノフェニル))-1-((1-ナフチル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(モルホリノフェニル))-1-((フェナントレン-4-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(ピペラジン-1-イル)フェニル)-1-((S)-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(ピペラジン-1-イル)フェニル)-1-((R)-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(ピペラジン-1-イル)フェニル)-1-((1,2-ジヒドロアセナフチレン-1-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(ピペラジン-1-イル)フェニル)-1-((S)-(1,2-ジヒドロアセナフチレン-1-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(ピペラジン-1-イル)フェニル)-1-((R)-(1,2-ジヒドロアセナフチレン-1-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(ピペラジン-1-イル)フェニル)-1-((1,2-ジヒドロアセナフチレン-1-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(ピペラジン-1-イル)フェニル)-1-((1-ナフチル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(ピペラジン-1-イル)フェニル)-1-((1-ナフチル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、N-(4-(ピペラジン-1-イル)フェニル)-1-((フェナントレン-4-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-アミン、(S)-4-(1-(2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル))-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)安息香酸、(R)-4-



- d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、N - ( 4 - ( 1 - ( 1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、N - ( 4 - ( 1 - ( 1 - ナフチル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、N - ( 4 - ( 1 - ( フェナントレン - 4 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、N - 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル - 1 - ( S ) - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル - 1 - ( R ) - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル - 1 - ( S ) - ( 1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル - 1 - ( R ) - ( 1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル - 1 - ( 1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル - 1 - ( 1 - ナフチル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 4 - ( 1 - ( フェナントレン - 4 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、N - ( 3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル ) - 1 - ( ( S ) - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル ) - 1 - ( ( R ) - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル ) - 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル ) - 1 - ( ( S ) - ( 1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル ) ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル ) - 1 - ( ( R ) - ( 1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル ) ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル ) - 1 - ( 1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル ) - 1 - ( 1 - ( 1 - ( ベンジルオキシ ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、1 - ( 4 - ( ベンジルオキシ ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル ) - N - ( 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N 1 - ( 1 - ( 4 - ( ベンジルオキシ ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) ベンゼン - 1 , 4 - ジアミン、N - ( 4 - モルホリノフェニル ) - 1 - ( 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、4 - ( 6 - ( 4 - アミノフェニルアミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、4 - ( 1 - ( 4 - ( ベンジルオキシ ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - オール、tert - ブチル 4 - ( 1 - ( 4 - ( ベンジルオキシ ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) ピペリジン - 1 - カルボ

キシレート、4 - ( 6 - ( 4 - ( N - ( メチルスルホニル ) メチルスルホンアミド ) フェニルアミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1 - イル ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イルメタンスルホネート、4 - ( 6 - ( メチルスルホンアミド ) フェニルアミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1 - イル ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イルメタンスルホネート、N - ( 4 - ( 1 - ( 4 - ( ベンジルオキシ ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、N - ( 4 - ( 1 - ( 4 - ヒドロキシ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、N - ( 4 - ( 1 - ( 4 - ヒドロキシ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、4 - ( 6 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニルアミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1 - イル ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - オール、1 - ( 4 - ( ベンジルオキシ ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル ) - N - ( 4 - モルホリノフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、4 - ( 6 - ( 4 - モルホリノフェニルアミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1 - イル ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - オール、1 - ( 6 - フルオロ - 4 H - ベンゾ [ d ] [ 1 , 3 ] ダイオキシン - 8 - イル ) メチル ) - N - ( 4 - モルホリノフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、1 - ブチル - N - ( 4 - ( ピペリジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、エチル 2 - ( 6 - ( 4 - ( ピペリジン - 1 - イル ) フェニルアミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1 - イル ) アセテート、1 - メチル - N - ( 4 - ( ピペリジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、1 - イソプロピル - N - ( 4 - ( ピペリジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 4 - ( 1 - ( 3 - アミノプロピル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、N - ( メチルスルホニル ) - N - ( 4 - ( 1 - プロピル - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、N - ( 4 - ( 1 - ブチル - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、N - ( 4 - ( 1 - ( 4 - ヒドロキシブチル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、4 - ( 6 - ( 4 - ( N - ( メチルスルホニル ) メチルスルホンアミド ) フェニルアミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1 - イル ) ブチルアセテート、N - ( 4 - ( 1 - エチル - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、N - ( 4 - ( 1 - イソプロピル - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、又は、N - ( 4 - ( 1 - メチル - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、である、請求項 1 記載の化合物。

### 【請求項 3 2】

前記化合物が、

N - ( 5 - ( 1 - ( 4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) ピリジン - 2 - イル ) メタンスルホンアミド、N - ( 2 , 3 - ジヒドロキシプロピル ) - N - ( 5 - ( 1 - ( 4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) ピリジン - 2 - イル ) メタンスルホンアミド、N - ( 2 , 3 - ジヒドロキシプロピル ) - N - ( 4 - ( 1 - ( 4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、

ルアミノ)フェニル)メタンスルホンアミド、N-(5-(1-(4-ヒドロキシ-2,3-ジヒドロ-1H-インден-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)ピリジン-2-イル)-N-(2-モルホリノエチル)メタンスルホンアミド、N-(4-(1-(4-ヒドロキシ-2,3-ジヒドロ-1H-インден-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)-N-(2-モルホリノエチル)メタンスルホンアミド、N-(4-(1-(4-ヒドロキシ-2,3-ジヒドロ-1H-インден-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)-N-(3-ヒドロキシプロピル)メタンスルホンアミド、N-(4-(1-(4-ヒドロキシ-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)-N-(2-ヒドロキシエチル)メタンスルホンアミド、N-(4-(1-(1-ヒドロキシ-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[c]ピリジン-5-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)メタンスルホンアミド、N-(4-(1-(1-ヒドロキシ-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[c]ピリジン-5-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)-N-(2-モルホリノエチル)メタンスルホンアミド、N-(4-(1-(4-ヒドロキシ-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[c]ピリジン-7-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)メタンスルホンアミド、N-(4-(1-(4-ヒドロキシ-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[c]ピリジン-7-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)-N-(2-モルホリノエチル)メタンスルホンアミド、N-(2,3-ジヒドロキシプロピル)-N-(4-(1-(1-ヒドロキシ-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[c]ピリジン-5-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)メタンスルホンアミド、N-(2,3-ジヒドロキシプロピル)-N-(4-(1-(4-ヒドロキシ-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[c]ピリジン-7-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)メタンスルホンアミド、N-(4-(1-(4-ヒドロキシ-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[b]ピリジン-7-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)メタンスルホンアミド、N-(4-(1-(4-ヒドロキシ-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[b]ピリジン-7-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)メタンスルホンアミド、N-(4-(1-(4-ヒドロキシ-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[b]ピリジン-7-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)メタンスルホンアミド、又は、N-(2,3-ジヒドロキシプロピル)-N-(4-(1-(4-ヒドロキシ-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[b]ピリジン-7-イル)-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン-6-イルアミノ)フェニル)メタンスルホンアミド、である、請求項1記載の化合物。

### 【請求項33】

請求項1から32のいずれか1項記載の化合物と、担体と、を含んでなる医薬組成物。

### 【請求項34】

プロテインキナーゼで媒介される疾患を治療するための組成物であって、前記疾患には、オーロラキナーゼ、サイクリン依存性キナーゼ又はpolo様キナーゼが関与し、前記組成物は、請求項1から33のいずれか1項記載の化合物または組成物を含む組成物。

### 【請求項35】

前記治療が、細胞内のプロテアーゼキナーゼを阻害することを含み、前記化合物と前記細胞とを接触させることを含む、請求項34記載の組成物。

【請求項36】

前記治療が、被験者の腫瘍又は癌を治療することを含む、請求項34記載の組成物。

【請求項37】

前記腫瘍又は癌が、骨癌、脳及びCNS腫瘍、乳癌、乳癌、結腸直腸癌、内分泌腺の癌、胃腸癌、尿生殖器癌、婦人科癌、頭部及び頸部癌、白血病、肺癌、リンパ腫、眼癌、皮膚癌、軟部組織肉腫、泌尿器系癌、及び他のタイプの若しくは関連する障害である、請求項36記載の組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0009

【補正方法】変更

【補正の内容】

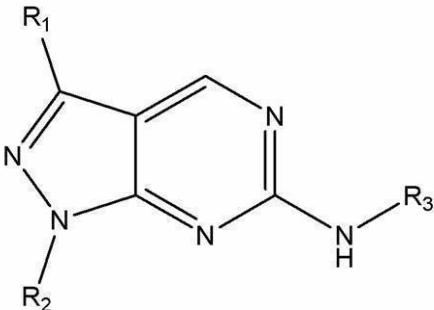
【0009】

本発明は、例えば、以下を提供する：

(項目1)

式(I)の化合物、そのプロドラッグ、多形体、互変異性体、エナンチオマー、立体異性体、溶媒和化合物、N-オキシド又は薬理学的に許容できる塩。

【化1】



I

(式中、R<sup>1</sup>は水素又はハロ基であり、

R<sup>2</sup>は-L<sub>1</sub>-R<sub>a</sub>であり、

L<sub>1</sub>は結合であり、

R<sub>a</sub>はアルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基又はヘテロアリール基であって、各々のシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基及びヘテロアリール基が任意に置換されてもよく、かつ8~16個の環原子を有するか、又は、

L<sub>1</sub>はアルキル基であり、

R<sub>a</sub>は水素、アルケニル基、アルキニル基、アミノ基、ヒドロキシ基、アルコキシカルボニル基、アルキルカルボニルオキシ基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基又はヘテロアリール基であって、各々のシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基及びヘテロアリール基が任意に置換されてもよく、かつ8~16個の環原子を有し、

R<sup>3</sup>は-R<sub>b</sub>-L<sub>2</sub>-R<sub>c</sub>であり、

R<sub>b</sub> はアリール基、ヘテロアリール基、シクロアルキル基又はヘテロシクロアルキル基であって、1～3個の置換基で任意に置換されてもよく、置換基のうちの2つが隣接するときは、それらが結合する1つ以上の原子と共に、0～6個のヘテロ環原子を有する5～16員環を形成し、

L<sub>2</sub> は結合、-(C R<sub>x</sub> R<sub>y</sub>)<sub>n</sub>-、-N=、-O-、-S-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-CO-、-CO-O-、-O-CO-、-NR<sub>x</sub>-、-NR<sub>x</sub>-CO-、-NR<sub>x</sub>-SO<sub>2</sub>-、-CO-NR<sub>x</sub>-、-SO<sub>2</sub>-NR<sub>x</sub>-、-NR<sub>x</sub>-CO-O-、-NR<sub>x</sub>-SO<sub>2</sub>-O-、-NR<sub>x</sub>-CO-NR<sub>y</sub>-、-NR<sub>x</sub>-SO<sub>2</sub>-NR<sub>y</sub>-、-CO-NR<sub>x</sub>-NR<sub>y</sub>-、-SO<sub>2</sub>-NR<sub>x</sub>-NR<sub>y</sub>-、-NR<sub>x</sub>-CO-CO-O-、-NR<sub>x</sub>-SO<sub>2</sub>-SO<sub>2</sub>-O-、-S(O)<sub>2</sub>-N<sub>x</sub>-CO-R<sub>y</sub>-、-CO-N<sub>x</sub>-S(O)<sub>2</sub>-R<sub>y</sub>-又は-(NR<sub>x</sub> R<sub>y</sub>) C=N-O-であり、

R<sub>c</sub> は水素、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、シクロアルケニル基、ヘテロシクロアルケニル基、アリール基、ヘテロアリール基、シクロアルキルアルキル基、ヘテロシクロアルキル基-アルキル基、シクロアルケニル基-アルキル基、ヘテロシクロアルケニル基-アルキル基、アラルキル基又はヘテロアラルキル基であって、かつ、水素を除いて、1～3個の置換基で任意に置換されてもよく、

R<sub>x</sub> 及び R<sub>y</sub> は各々独立に水素、ヒドロキシ基、アルキル基、アルコキシ基、アミノ基、-CO-アルキル基、-CO-アリール基、-SO<sub>2</sub>-アルキル基、-SO<sub>2</sub>-アリール基、-SO<sub>2</sub>-ヘテロアリール基又は-P(O)(O-アルキル)<sub>2</sub> であって、

R<sub>x</sub> 又は R<sub>y</sub> のアルキル部分又はアリール部分は、1～3個の置換基で任意に置換されてもよく、

(n は 0、1、2、又は 3 である)

(項目 2)

R<sub>b</sub> が、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、ヘテロアリール基、アリール基、ヘテロアリール基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、-OR、-SR、-NRR'、オキソ基、-C(O)-OR、-C(O)-NRR'、ハロ基、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、-C(O)R、-P(O)(OR)R'、-O-P(O)(OR)R'、-NR-P(O)(OR')R''、-S(O)<sub>2</sub>-(OR)、-O-S(O)<sub>2</sub>-(OR)、-NR-S(O)<sub>2</sub>-OR'、-NR-C(O)-OR'、-NR-C(O)-NR'R''、-NR-C(S)-NR'R''、-C(S)-NRR' 及びチオアルキル基、からなる群から各々独立に選択される1～3個の置換基で任意に置換されてもよく、

R 及び R' が各々独立に水素、アルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、アラルキル基又はヘテロアラルキル基であって、かつ、R'' がアルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、アラルキル基又はヘテロアラルキル基である、項目 1 記載の化合物。

(項目 3)

R<sub>c</sub> が、水素である場合を除き、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、ヘテロアリール基、アリール基、ヘテロアリール基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、-OR、-SR、-NRR'、オキソ基、-C(O)-OR、-C(O)-NRR'、ハロ基、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、-C(O)R、-P(O)(OR)R'、-O-P(O)(OR)R'、-NR-P(O)(OR')R''、-S(O)<sub>2</sub>-(OR)、-O-S(O)<sub>2</sub>-(OR)、-NR-S(O)<sub>2</sub>-OR'、-NR-C(O)-OR'、-NR-C(O)-NR'R''、-NR-C(S)-NR'R''、-C(S)-NRR' 及びチオアルキル基、からなる群から各々独立に選択される1～3個の置換基により任意に置換されてもよく、

R 及び R' が各々独立に水素、アルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、アラルキル基又はヘテロアラルキル基であって、かつ、R'' がアルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテ

ロアリール基、アラルキル基又はヘテロアラルキル基である、項目1記載の化合物。

(項目4)

$R_x$  及び  $R_y$  のアルキル部分又はアリール部分が、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、ヘテロアリール基、アリール基、ヘテロアリール基、アリールアルキル基、ヘテロアリールアルキル基、-OR、-SR、-NRR'、オキソ基、-C(O)-OR、-C(O)-NRR'、ハロ基、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、-C(O)R、-P(O)(OR)R'、-O-P(O)(OR)R'、-NR-P(O)(OR')R''、-S(O)<sub>2</sub>-(OR)、-O-S(O)<sub>2</sub>-(OR)、-NR-S(O)<sub>2</sub>-OR'、-NR-C(O)-OR'、-NR-C(O)-NR'R''、-NR-C(S)-NR'R''、-C(S)-NRR' 及びチオアルキル基、からなる群から各々独立に選択される1~3個の置換基で任意に置換されてもよく、

$R$  及び  $R'$  が各々独立に水素、アルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、アラルキル基又はヘテロアラルキル基であって、かつ、 $R''$  がアルキル基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、アラルキル基又はヘテロアラルキル基である、項目1記載の化合物。

(項目5)

$L_2$  が結合である、項目1記載の化合物。

(項目6)

$R_3$  が4-ビス(メタンスルホニル)アミノフェニル基、4-ビス(エタンスルホニル)アミノフェニル基、4-(4-メチルピペリジン-1-イル)フェニル基、4-ビス(メタンスルホニル)アミノフェニル基、4-ビス((クロロメタン)スルホニル)アミノフェニル基、4-(メタンスルホニル)アミノフェニル基、4-(N'-ヒドロキシカルバミミドイル)フェニル基、4-(4-メチルピペリジン-1-イル)フェニル基、4-アミノフェニル基、4-(メタンスルホニルカルバモイル)フェニル基、4-シアノフェニル基、4-(テトラゾール-5-イル)アミノフェニル基、2-(4-ニトロフェニル)エチル基、2-(4-アミノフェニル)エチル基又は2-(4-ビス(メタンスルホニル)アミノフェニル)エチル基である、項目1記載の化合物。

(項目7)

$L_1$  が結合である、項目1記載の化合物。

(項目8)

$R_a$  がシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基及びヘテロアリール基である、項目7記載の化合物。

(項目9)

$R_a$  がジヒドロインデニル基、テトラヒドロナフチル基、ジヒドロアセナフチレニル基、ナフチレニル基、テトラヒドロベンゾ[7]アヌレニル基、キノリニル基、イソキノリニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾキサゾリル基、フェナントレニル基又はテトラヒドロジベンゾ[7]アヌレニル基、であり、

$R_a$  が1~3の置換基で任意に置換されてもよい、項目8記載の化合物。

(項目10)

$R_a$  がジヒドロインデニル基、テトラヒドロナフチル基、ジヒドロアセナフチレニル基又はナフチル基であり、

$R_a$  が1~3個の置換基で任意に置換されてもよい、項目9記載の化合物。

(項目11)

$R_a$  がナフチル基、ジヒドロアセナフチレニル基又はジヒドロインデニル基である、項目10記載の化合物。

(項目12)

$R_a$  がナフタ-1-イル基、1,2-ジヒドロアセナフチレン-1-イル基、2,3-ジヒドロインデン-2-イル基又は2,3-ジヒドロインデン-1-イル基である、項目11記載の化合物。

(項目13)

R<sub>a</sub> が、1～3個の置換基で任意に置換されてもよいジヒドロインデニル基である、項目8記載の化合物。

(項目14)

R<sub>a</sub> がジヒドロインデン-1-イル基、4-ヒドロキシジヒドロインデン-1-イル基、4-ベンゾイルオキシジヒドロインデン-1-イル基、4-ジヒドロホスホリルオキシジヒドロインデン-1-イル基、5,6-ジオキソールジヒドロインデン-1-イル基、5-アセトアミドジヒドロインデン-1-イル基、5-ベンゾイルオキシジヒドロインデン-1-イル基、4-ベンゾイルオキシジヒドロインデン-1-イル基、4-(ジ-tert-ブチルホスホリルオキシ)ジヒドロインデン-1-イル基、5-(2-メトキシエトキシ)メチル)ジヒドロインデン-1-イル基又は5-メトキシジヒドロインデン-1-イル基である、項目13記載の化合物。

(項目15)

R<sub>3</sub> が4-ビス(メタンスルホニル)アミノフェニル基、4-ビス(エタンスルホニル)アミノフェニル基、4-(4-メチルピペリジン-1-イル)フェニル基、4-ビス(メタンスルホニル)アミノフェニル基、4-ビス((クロロメタン)スルホニル)アミノフェニル基、4-(メタンスルホニル)アミノフェニル基、4-(N'-ヒドロキシカルバミミドイル)フェニル基、4-(4-メチルピペリジン-1-イル)フェニル基、4-アミノフェニル基、4-(メタンスルホニルカルバモイル)フェニル基、4-シアノフェニル基、4-(テトラゾール-5-イル)アミノフェニル基、2-(4-ニトロフェニル)エチル基、2-(4-アミノフェニル)エチル基又は2-(4-ビス(メタンスルホニル)アミノフェニル)エチル基である、項目14記載の化合物。

(項目16)

R<sub>a</sub> が、1～3個の置換基で任意に置換されてもよいインドリル基である、項目8記載の化合物。

(項目17)

R<sub>a</sub> が、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、インドール-5-イル基、7-メチルインドール-5-イル基、1-tert-ブチルカルボキシ-7-メチルインドール-5-イル基又は(1-tert-ブチルカルボキシ)インドール-5-イル基である、項目16記載の化合物。

(項目18)

R<sub>3</sub> が4-ビス(メタンスルホニル)アミノフェニル基である、項目17記載の化合物。

。

(項目19)

R<sub>a</sub> が、1～3個の置換基で任意に置換されてもよいテトラヒドロナフチル基である、項目10記載の化合物。

(項目20)

上記1～3個の任意の置換基が、各々独立にベンジルオキシ基、ヒドロキシ基及びメチルスルホニルオキシ基からなる群から選択される、項目19記載の化合物。

(項目21)

R<sub>a</sub> が1-ベンジルオキシ-5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-4-イル基、1-ヒドロキシ-5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-4-イル基又は1-メタンスルホニルオキシ-5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-4-イル基である、項目20記載の化合物。

(項目22)

L<sub>1</sub> がアルキル基であり、

R<sub>a</sub> が水素、アルケニル基、アルキニル基、アミノ基、ヒドロキシ基、アルコキシカルボニル基、アルキルカルボニルオキシ基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基又はヘテロアリール基であり、各々のシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基及びヘテロアリール基が、1～3個の置換基で任意に置換されやすく、8～16個の環原子を有する、項目21記載の化合物。

(項目23)

L<sub>1</sub> がメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基又はブチル基であり、  
R<sub>a</sub> が水素、アミノ基、ヒドロキシ基、アルコキシカルボニル基、アルキルカルボニル  
 オキシ基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基又はヘテロアリール  
 基であり、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基及びヘテロアリール  
 基の各々が、1～3個の置換基により任意に置換されてもよい、項目22記載の化合物。

(項目24)

R<sub>2</sub> が、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、3-アミノブ  
 ロピル基、ヒドロキシブチル基、エトキシカルボニルメチル基、メチルカルボニルオキシ  
 ブチル基又はナフタレン-1-イルメチル基である、項目23記載の化合物。

(項目25)

R<sub>3</sub> が、1～3個の置換基で任意に置換されてもよいフェニル基である、項目24記載  
 の化合物。

(項目26)

R<sub>3</sub> がパラ位で置換されたフェニル基である、項目25記載の化合物。

(項目27)

R<sub>3</sub> が4-(ペペリジン-1-イル)フェニル基又は4-(ビス(メチルスルホニル)  
 アミノ)フェニル基である、項目26記載の化合物。

(項目28)

R<sub>b</sub> が、フェニル基であって、かつ1～3個の置換基で任意に置換されてもよい、項目  
 1記載の化合物。

(項目29)

L<sub>2</sub> が、-O-、-S-、-SO<sub>2</sub>-、-CO-、-CO-O-、-NR<sub>x</sub>-、-NR<sub>x</sub>-CO-、-NR<sub>x</sub>-SO<sub>2</sub>-、-NR<sub>x</sub>-CO-O-、-NR<sub>x</sub>-CO-NR<sub>y</sub> 又  
 は-NR<sub>x</sub>-CO-CO-O-である、項目28記載の化合物。

(項目30)

R<sub>x</sub> 及び R<sub>y</sub> の各々が、水素、アルキル基、-CO-アルキル基又は-SO<sub>2</sub>-アルキ  
 ル基である、項目29記載の化合物。

(項目31)

R<sub>c</sub> が水素、アルキル基又はアリール基である、項目30記載の化合物。

(項目32)

L<sub>2</sub> が、-CO-O-、-NR<sub>x</sub>-、-NR<sub>x</sub>-SO<sub>2</sub>-、-NR<sub>x</sub>-CO-O- 又は  
 -NR<sub>x</sub>-CO-NR<sub>y</sub>-であって、

R<sub>x</sub> 及び R<sub>y</sub> の各々が水素、アルキル基、-CO-アルキル基、-SO<sub>2</sub>-アルキル基  
 、-SO<sub>2</sub>-アリール基又は-SO<sub>2</sub>-ヘテロアリール基である、項目29記載の化合物  
 。

(項目33)

R<sub>c</sub> が水素、アルキル基、アリール基又はヘテロアリール基である、項目32記載の化  
 合物。

(項目34)

L<sub>2</sub> が結合であり、

R<sub>c</sub> がシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、  
 (シクロアルキル)アルキル基、(ヘテロシクロアルキル)アルキル基、アラルキル基又  
 はヘテロアラルキル基である、項目32記載の化合物。

(項目35)

L<sub>2</sub> が結合であり、

R<sub>c</sub> がヘテロシクロアルキル基、ヘテロアリール基、ヘテロシクロアルキル基-アルキ  
 ル基又はヘテロアラルキル基である、項目28記載の化合物。

(項目36)

L<sub>2</sub> が結合であり、

R<sub>c</sub> がテトラゾリル基、モリホリノ基又はピペラジニル基である、項目 2 8 記載の化合物。

(項目 3 7 )

R<sub>c</sub> がシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、シクロアルキルアルキル基、ヘテロシクロアルキル基 - アルキル基、アラルキル基又はヘテロアラルキル基である、項目 1 記載の化合物。

(項目 3 8 )

R<sub>b</sub> が、-NRR' 及び -C(=O)OR からなる群から各々独立に選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されたフェニル基であり、

L<sub>2</sub> が結合であり、

R<sub>c</sub> が水素である、項目 1 記載の化合物。

(項目 3 9 )

R<sub>1</sub> が水素である、項目 1 記載の化合物。

(項目 4 0 )

L<sub>1</sub> が結合であり、

R<sub>a</sub> がシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基及びヘテロアリール基であり、

R<sub>b</sub> がフェニル基であり、

L<sub>2</sub> が -O- 、 -S- 、 -SO<sub>2</sub>- 、 -CO- 、 -CO-O- 、 -NR<sub>x</sub>- 、 -NR<sub>x</sub>-CO- 、 -NR<sub>x</sub>-SO<sub>2</sub>- 、 -NR<sub>x</sub>-CO-O- 、 -NR<sub>x</sub>-CO-NR<sub>y</sub>- 又は -NR<sub>x</sub>-CO-CO-O- であって、

R<sub>x</sub> が水素、アルキル基、-CO-アルキル基、-SO<sub>2</sub>-アルキル基、-SO<sub>2</sub>-アリール基又は-SO<sub>2</sub>-ヘテロアリール基であり、

R<sub>c</sub> が水素、アルキル基、アリール基又はヘテロアリール基である、項目 3 9 記載の化合物。

(項目 4 1 )

L<sub>1</sub> が結合であり、R<sub>a</sub> がジヒドロインデニル基、テトラヒドロナフチル基、ジヒドロアセナフチレニル基又はナフチル基であり、

R<sub>b</sub> がフェニル基であり、

L<sub>2</sub> が -CO-O- 、 -NR<sub>x</sub>- 、 -NR<sub>x</sub>-SO<sub>2</sub>- 、 -NR<sub>x</sub>-CO-O- 、 又は -NR<sub>x</sub>-CO-NR<sub>y</sub>- であって、

R<sub>x</sub> が水素、アルキル基、-CO-アルキル基、-SO<sub>2</sub>-アルキル基又は-SO<sub>2</sub>-アリール基であり、

R<sub>c</sub> が水素、アルキル基又はアリール基である、項目 3 9 記載の化合物。

(項目 4 2 )

L<sub>1</sub> が結合であり、

R<sub>a</sub> がシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基又はヘテロアリール基であり、

R<sub>b</sub> がフェニル基であり、

L<sub>2</sub> が結合であり、

R<sub>c</sub> がシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基、ヘテロアリール基、(シクロアルキル)アルキル基、(ヘテロシクロアルキル)アルキル基、アラルキル基又はヘテロアラルキル基である、項目 3 9 記載の化合物。

(項目 4 3 )

L<sub>1</sub> が結合であり、

R<sub>a</sub> がジヒドロインデニル基、テトラヒドロナフチル基、ジヒドロアセナフチレニル基又はナフチル基であり、

R<sub>b</sub> がフェニル基であり、

L<sub>2</sub> が結合であり、

R<sub>c</sub> がテトラゾリル基、モリホリノ基又はピペラジニル基である、項目 4 3 記載の化合

物。

(項目44)

L<sub>1</sub> がアルキル基であり、

R<sub>a</sub> が水素、アルケニル基、アルキニル基、アミノ基、ヒドロキシ基、アルコキシカルボニル基、アルキルカルボニルオキシ基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基又はヘテロアリール基であって、各々のシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基及びヘテロアリール基が、1～3個の置換基で任意に置換されてもよい、かつ8～16個の環原子を有する、項目44記載の化合物。

(項目45)

L<sub>1</sub> がメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基又はブチル基であり、

R<sub>a</sub> が水素、アミノ基、ヒドロキシ基、アルコキシカルボニル基、アルキルカルボニルオキシ基、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基又はヘテロアリール基であって、シクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基及びヘテロアリール基の各々が、1～3個の置換基で任意に置換されてもよい、項目44記載の化合物。

(項目46)

R<sub>2</sub> がメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、3-アミノプロピル基、ヒドロキシブチル基、エトキシカルボニルメチル基、メチルカルボニルオキシブチル基又はナフタレン-1-イルメチル基である、項目45記載の化合物。

(項目47)

R<sub>3</sub> が、1～3個の置換基で任意に置換されてもよいフェニル基である、項目46記載の化合物。

(項目48)

R<sub>3</sub> が4-(ピペリジン-1-イル)フェニル基又は4-(ビス(メチルスルホニル)アミノ)フェニル基である、項目47記載の化合物。

(項目49)

R<sub>b</sub> が1～3個の置換基で任意に置換されてもよいフェニル基であり、

L<sub>2</sub> が結合であるか、又は-NR<sub>x</sub>-SO<sub>2</sub>-であり、

R<sub>x</sub> が水素であるか、又は-SO<sub>2</sub>-アルキル基であり、

R<sub>c</sub> が水素、アルキル基、ヘテロシクロアルキル基、ヘテロアリール基、ヘテロシクロアルキル基-アルキル基又はヘテロアラルキル基である、項目1記載の化合物。

(項目50)

R<sub>x</sub> が-SO<sub>2</sub>-アルキル基であり、

R<sub>c</sub> がアルキル基である、項目49記載の化合物。

(項目51)

R<sub>b</sub> が、1～3個の置換基で任意に置換されてもよいフェニル基である、項目1記載の化合物。

(項目52)

R<sub>c</sub> がテトラゾリル基、モリホリノ基又はピペラジニル基である、項目51記載の化合物。

(項目53)

R<sub>b</sub> が、各々独立に-NRR'又は-C(O)ORである1～3個の置換基で置換されたフェニル基であり、

L<sub>2</sub> が結合であり、

R<sub>c</sub> が水素である、項目1記載の化合物。

(項目54)

L<sub>1</sub> が結合であり、

R<sub>a</sub> がジヒドロインデニル基、テトラヒドロナフチル基、ジヒドロアセナフチレニル基、ナフチル基、テトラヒドロベンゾ[7]アヌレニル基、キノリニル基、イソキノリニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾキサゾリル基、フェナントレニル基又はテトラヒドロジベンゾ[7]アヌレニル基である、項目1記載の化合物。

(項目55)

R<sub>b</sub> が、各々独立に - N R R' 又は - C (O) O R である 1 ~ 3 個の置換基によって任意に置換されてもよいフェニル基である、項目39記載の化合物。

(項目56)

R<sub>b</sub> が、各々独立に - N R R' 又は - C (O) O R である 1 ~ 3 個の置換基で置換されたフェニル基であり、

L<sub>2</sub> が結合であり、R<sub>c</sub> が水素である、項目55記載の化合物。

(項目57)

L<sub>2</sub> が、結合であるか又は - N R<sub>x</sub> - S O<sub>2</sub> - であって、

かつ R<sub>x</sub> が水素又は - S O<sub>2</sub> - アルキル基であり、

R<sub>c</sub> が水素、アルキル基、ヘテロシクロアルキル基、ヘテロアリール基、ヘテロシクロアルキル基 - アルキル基又はヘテロアラルキル基である、項目54記載の化合物。

(項目58)

R<sub>c</sub> が水素、アルキル基、ヘテロシクロアルキル基、ヘテロアリール基、ヘテロシクロアルキル基 - アルキル基又はヘテロアラルキル基である、項目54記載の化合物。

(項目59)

R<sub>1</sub> が水素である、項目58記載の化合物。

(項目60)

R<sub>b</sub> が、 - N R R' 又は - C (O) O R で任意に置換されてもよいフェニル基であり、

L<sub>2</sub> が結合であるか又は - N R<sub>x</sub> - S O<sub>2</sub> - であって、

かつ R<sub>x</sub> が水素又は - S O<sub>2</sub> - アルキル基であり、

R<sub>c</sub> がテトラゾリル基、モリホリノ基又はピペラジニル基である、項目59記載の化合物。

(項目61)

R<sub>2</sub> が 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル基、(S) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル基、(R) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル基、1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル基、(R) - 1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル基、(S) - 1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル基、フェナントレン - 1 - イル基又はフェナントレン - 4 - イル基である、項目1記載の化合物。

(項目62)

R<sub>3</sub> が 4 - ( 1 H - テトラゾール - 5 - イル ) フェニル基、3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル基、4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル基、4 - ( ピペラジン - 1 - イル ) フェニル基、4 - アミノフェニル基、4 - 安息香酸、4 - モルホリノフェニル基、4 - ( N , N - ジメチルスルホンアミド ) フェニル基又は 4 - ( メタンスルホンアミド ) フェニル基である、項目1記載の化合物。

(項目63)

上記化合物が、

N - ( メチルスルホニル ) - N - ( 4 - ( 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、N - メチル - N - ( 4 - ( 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、N - メチル - N - ( 4 - ( 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、1 - ( メチルスルホニル ) - N - ( 4 - ( 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、1 - ( メチルスルホニル ) - N - ( 4 - ( 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、N<sup>1</sup> - ( 1 - ( ナフタレン - 2 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、N - ( 4 - ( 1 - ( ナフタレン - 2 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、3 , 3 , 3 - トリフルオロ - N - ( 4 - ( 1 - ( ナフタ

レン - 1 - イル) - 1H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) プロパン - 1 - スルホンアミド、メチル - 4 - ( 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニルカルバメート、N - ( 3 , 4 - ジメトキシフェニル ) - 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 - ( ナフタレン - 2 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、エチル - 2 - ヒドロキシ - 4 - ( 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニルカルバメート、N - ( 4 - ( 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ) フェニル ) - 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、メチル 3 - ( 4 - ( 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニルアミノ ) - 3 - オキソプロパノエート、N<sup>1</sup> - ( 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) ベンゼン - 1 , 4 - ジアミン、N - ( 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 4 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル ) - 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 4 - エトキシフェニル ) - 1 - ( ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、( S ) - 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) 安息香酸、( S ) - N - ( 4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、( S ) - N<sup>1</sup> - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) ベンゼン - 1 , 4 - ジアミン、( S ) - 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 4 - モルホリノフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、( S ) - 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 4 - ( 4 - ( プロピルスルホニル ) ピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) 安息香酸、1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 3 - ( ピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N<sup>1</sup> - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 4 - ( 4 - ( プロピルスルホニル ) ピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、( S ) - 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 4 - ( 4 - ( メチルスルホニル ) ピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、( S ) - 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 4 - ( ピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) ベンズアミド、( S ) - 5 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - 2 - メトキシフェノール、1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 4 - ( ピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 4 - モルホリノフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [

3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、3 - ( 4 - ( 4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1  
 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ  
 ) フェニル ) ピペラジン - 1 - イル ) プロパン - 1 - オール、4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒ  
 ドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イ  
 ルアミノ ) ベンゾヒドラジド、2 - ( 4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イン  
 デン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニ  
 ル ) ピペラジン - 1 - イル ) エチルアセテート、1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデ  
 ソン - 1 - イル ) - N - ( 4 - ( 4 - ( 4 - メトキシ - 3 , 5 - ジメチルピリジン - 2 -  
 イル ) メチル ) ピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリ  
 ミジン - 6 - アミン、3 - ( 4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1  
 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) ピペ  
 ラジン - 1 - イル ) プロピルアセテート、2 - ( 4 - ( 4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ -  
 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミ  
 ノ ) フェニル ) ピペラジン - 1 - イル ) エタノール、1 - ( ( S ) - 2 , 3 - ジヒドロ -  
 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 3 - ( 1 - ( ( R ) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イ  
 ンデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルオキシ ) - 4  
 - メトキシフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、( S )  
 - エチル - 4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾ  
 ロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) ベンゾアート、( S ) - 1 - ( 2 , 3 -  
 ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - N - ( 4 - モルホリノフェニル ) - 1 H - ピラ  
 ゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 4 - ( 1 - ( 4 - ヒドロキシ - 2 , 3  
 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン -  
 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホニアミド、( S )  
 - N - ( 4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ  
 [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( エチルスルホニル ) エ  
 タンスルホニアミド、1 - ( 6 - ( 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニルア  
 ミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1  
 H - インデン - 4 - オール、1 - ( 6 - ( 4 - ( N - ( メチルスルホニル ) メチルスルホ  
 ナミド ) フェニルアミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1 - イル ) -  
 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イルベンゾアート、1 - ( 6 - ( 4 - ( N - (  
 メチルスルホニル ) メチルスルホニアミド ) フェニルアミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4  
 - d ] ピリミジン - 1 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イルニ水素ホ  
 スフェート、( S ) - 1 - クロロ - N - ( クロロメチルスルホニル ) - N - ( 4 - ( 1 -  
 ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリ  
 ミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホニアミド、N - ( 4 - ( 1 - ( 6 , 7  
 - ジヒドロ - 5 H - インデノ [ 5 , 6 - d ] [ 1 , 3 ] ジオキソール - 5 - イル ) - 1 H  
 - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスル  
 ホニル ) メタンスルホニアミド、N - ( 1 - ( 6 - ( 4 - ( N - ( メチルスルホニル ) メ  
 チルスルホニアミド ) フェニルアミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1  
 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 5 - イル ) アセトアミド、N - ( 4 -  
 1 - ( 4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾ  
 ロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホニアミド、1 -  
 ( 6 - ( 4 - ( N - ( メチルスルホニル ) メチルスルホニアミド ) フェニルアミノ ) - 1  
 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデ  
 ソン - 5 - イルベンゾアート、( S , Z ) - 4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデ  
 ソン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) - N ' -  
 ヒドロキシベンズイミドアミド、1 - ( 6 - ( 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル )  
 フェニルアミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1 - イル ) - 2 , 3 - ジ  
 ヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イルベンゾアート、1 - ( 6 - ( 4 - アミノフェニルアミ  
 ノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H

- インデン - 4 - オール、1 - ( 6 - ( 4 - アミノフェニルアミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イルベンゾアート、ジ - tert - ブチル 1 - ( 6 - ( 4 - ( N - ( メチルスルホニル ) メチルスルホンアミド ) フェニルアミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ホスフェート、( S ) - 4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) - N - ( メチルスルホニル ) ベンズアミド、N - ( 4 - ( 1 - ( 5 - ( ( 2 - メトキシエトキシ ) メトキシ ) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、N - ( 1 - ( 6 - ( 4 - アミノフェニルアミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1 - イル ) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 5 - イル ) アセトアミド、( S ) - 4 - ( 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) ベンゾニトリル、( S ) - N - ( 4 - ( 1 H - テトラゾール - 5 - イル ) フェニル ) - 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N 1 - ( 1 - ( 5 - メトキシ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) ベンゼン - 1 , 4 - ジアミン、N - ( 4 - ( 1 - ( 5 - メトキシ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 2 - イル ) - N - ( 4 - モルホリノフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 4 - ( 1 - ( 1 H - インドール - 4 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、N - ( 4 - ( 1 - ( 1 H - インドール - 6 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、N - ( 4 - ( 1 - ( 1 H - インドール - 5 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、1 - ( 1 H - インドール - 4 - イル ) - N - ( 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 4 - ( 1 - ( 1 - メチル - 1 H - インドール - 5 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、1 - ( 7 - メチル - 1 H - インドール - 4 - イル ) - N - ( 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、tert - ブチル 7 - メチル - 4 - ( 6 - ( 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニルアミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1 - イル ) - 1 H - インドール - 1 - カルボキシレート、tert - ブチル 4 - ( 6 - ( 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニルアミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1 - イル ) - 1 H - インドール - 1 - カルボキシレート、1 - ( 1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル ) - N - ( 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、N - ( 4 - ( 1 - ( 1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、N 1 - ( 1 - ( 1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) ベンゼン - 1 , 4 - ジアミン、1 - ( 1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル ) - N - ( 4 - モルホリノフェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、4 - ( 1 - ( 1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) ベンゾニトリル、1 - ( 1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル ) - N - ( 4 - ( 2 - ( トリメチルスタンニル ) - 2 H - テトラゾール - 5 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、1 - ( 1 , 2 - ジ

ヒドロアセナフチレン - 1 - イル) - N - (4 - (ピペラジン - 1 - イル) フェニル) - 1 H - ピラゾロ [3, 4 - d] ピリミジン - 6 - アミン、N - (4 - モルホリノフェニル) - 1 - (ナフタレン - 1 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [3, 4 - d] ピリミジン - 6 - アミン、又は、N - (4 - モルホリノフェニル) - 1 - (ナフタレン - 1 - イルメチル) - 1 H - ピラゾロ [3, 4 - d] ピリミジン - 6 - アミン、である、項目 1 記載の化合物。

(項目64)

上記化合物が、



, 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、 ( S ) -  
- ( 4 - ( 1 - ( 1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 ,  
4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、 ( R ) - N -  
( 4 - ( 1 - ( 1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4  
- d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、 N - ( 4 - ( 1  
- ( 1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリ  
ミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、 N - ( 4 - ( 1 - ( 1 - ナ  
フチル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタ  
ンスルホンアミド、 N - ( 4 - ( 1 - ( フェナントレン - 4 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [  
3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンスルホンアミド、 N - 4 -  
( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル - 1 - ( S ) - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H  
- インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、 N -  
4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル - 1 - ( R ) - ( 2 , 3 - ジヒドロ -  
1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、  
N - 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル - 1 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H  
- インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、 N -  
4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル - 1 - ( S ) - ( 1 , 2 - ジヒドロア  
セナフチレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、 N -  
- 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル - 1 - ( R ) - ( 1 , 2 - ジヒドロ  
アセナフチレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、  
N - 4 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル - 1 - ( 1 , 2 - ジヒドロアセナ  
フチレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、 N - 4  
- ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) フェニル - 1 - ( 1 - ナフチル ) - 1 H - ピラゾ  
ロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、 N - ( 4 - ( 1 - ( フェナントレン - 4 - イ  
ル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ ) フェニル ) メタンス  
ルホンアミド、 N - ( 3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル ) - 1 - ( ( S ) - ( 2 ,  
3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジ  
ン - 6 - アミン、 N - ( 3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル ) - 1 - ( ( R ) - ( 2 ,  
3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジ  
ン - 6 - アミン、 N - ( 3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル ) - 1 - ( 2 , 3 - ジ  
ヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 -  
アミン、 N - ( 3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル ) - 1 - ( ( S ) - ( 1 , 2 - ジ  
ヒドロアセナフチレン - 1 - イル ) ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 -  
アミン、 N - ( 3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル ) - 1 - ( ( R ) - ( 1 , 2 - ジ  
ヒドロアセナフチレン - 1 - イル ) ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 -  
アミン、 N - ( 3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル ) - 1 - ( 1 , 2 - ジヒドロア  
セナフチレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、 N -  
- ( 3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル ) - 1 - ( 1 - ナフチル ) - 1 H - ピラゾロ  
[ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、 N - ( 3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシフェニル  
) - 1 - ( フェナントレン - 4 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6  
- アミン、 N - ( 4 - ( 1 - ( 4 - ( ベンジルオキシ ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ  
ナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イルアミノ )  
フェニル ) - N - ( メチルスルホニル ) メタンスルホンアミド、 1 - ( 4 - ( ベンジルオ  
キシ ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル ) - N - ( 4 - ( 4 - メチ  
ルピペラジン - 1 - イル ) フェニル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 -  
アミン、 N 1 - ( 1 - ( 4 - ( ベンジルオキシ ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタ  
レン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) ベンゼン - 1  
, 4 - ジアミン、 N - ( 4 - モルホリノフェニル ) - 1 - ( 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒド  
ロナフタレン - 1 - イル ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 6 - アミン、 4  
- ( 6 - ( 4 - アミノフェニルアミノ ) - 1 H - ピラゾロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 1

- イル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - オール、tert-ブチル 4 - (1 - (4 - (ベンジルオキシ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イルアミノ) ピペリジン - 1 - カルボキシレート、4 - (6 - (4 - (N - (メチルスルホニル) メチルスルホニアミド) フェニルアミノ) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 1 - イル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イルメタンスルホネート、4 - (6 - (メチルスルホニアミド) フェニルアミノ) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 1 - イル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イルメタンスルホネート、N - (4 - (1 - (4 - (ベンジルオキシ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イルアミノ) フェニル) メタンスルホニアミド、N - (4 - (1 - (4 - ヒドロキシ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イルアミノ) フェニル) メタンスルホニアミド、N - (4 - (1 - (4 - ヒドロキシ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イルアミノ) フェニル) メタンスルホニアミド、4 - (6 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) フェニルアミノ) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 1 - イル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - オール、1 - (4 - (ベンジルオキシ) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル) - N - (4 - モルホリノフェニル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - アミン、4 - (6 - (4 - モルホリノフェニルアミノ) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 1 - イル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロナフタレン - 1 - オール、1 - ((6 - フルオロ - 4H - ベンゾ [d] [1 , 3] ダイオキシン - 8 - イル) メチル) - N - (4 - モルホリノフェニル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - アミン、1 - ブチル - N - (4 - (ピペリジン - 1 - イル) フェニル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - アミン、エチル 2 - (6 - (4 - (ピペリジン - 1 - イル) フェニルアミノ) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 1 - イル) アセテート、1 - メチル - N - (4 - (ピペリジン - 1 - イル) フェニル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - アミン、1 - イソプロピル - N - (4 - (ピペリジン - 1 - イル) フェニル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - アミン、N - (4 - (1 - (3 - アミノプロピル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イルアミノ) フェニル) - N - (メチルスルホニル) メタンスルホニアミド、N - (メチルスルホニル) - N - (4 - (1 - プロピル - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イルアミノ) フェニル) メタンスルホニアミド、N - (4 - (1 - ブチル - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イルアミノ) フェニル) - N - (メチルスルホニル) メタンスルホニアミド、N - (4 - (1 - (4 - ヒドロキシブチル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イルアミノ) フェニル) - N - (メチルスルホニル) メタンスルホニアミド、4 - (6 - (4 - (N - (メチルスルホニル) メチルスルホニアミド) フェニルアミノ) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イルアミノ) ピリミジン - 1 - イル) ブチルアセテート、N - (4 - (1 - エチル - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イルアミノ) フェニル) - N - (メチルスルホニル) メタンスルホニアミド、N - (4 - (1 - イソプロピル - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イルアミノ) フェニル) - N - (メチルスルホニル) メタンスルホニアミド、又は、N - (4 - (1 - メチル - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イルアミノ) フェニル) - N - (メチルスルホニル) メタンスルホニアミド、である、項目 1 記載の化合物。

(項目 65)

上記化合物が、

N - (5 - (1 - (4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 6 - イルアミノ) ピリジン - 2 - イル) メタンスルホニアミド、N - (2 , 3 - ジヒドロキシプロピル) - N - (5 - (1 - (4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イル) - 1H - ピラゾロ [3 , 4

( 項目 6 6 )

項目 1 から 6 6 のいずれか 1 項記載の化合物と、担体と、を含んでなる医薬組成物。

( 項目 67 )

プロテインキナーゼで媒介される疾患に罹患する被験者を治療する方法であって、上記

被験者に、薬理学的に有効量の、項目 1 から 6 5 のいずれか 1 項記載の化合物を投与することを含む方法。

(項目 6 8)

細胞内のプロテアーゼキナーゼを阻害する方法であって、項目 1 から 6 5 のいずれか 1 項記載の化合物と上記細胞とを接触させることを含む方法。

(項目 6 9)

上記プロテアーゼキナーゼが、細胞の有糸分裂に関与する 1 つ以上のプロテアーゼキナーゼである、項目 6 8 記載の方法。

(項目 7 0)

上記プロテアーゼキナーゼが、オーロラキナーゼ、サイクリン依存性キナーゼ又は polo 様キナーゼである、項目 6 8 記載の方法。

(項目 7 1)

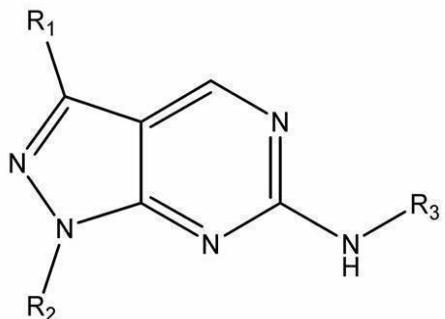
被験者の腫瘍又は癌を治療する方法であって、かかる治療を必要とする被験者に、項目 1 から 6 5 のいずれか 1 項記載の化合物を投与することを含む方法。

(項目 7 2)

上記腫瘍又は癌が、骨癌、脳及び CNS 腫瘍、乳癌、乳癌、結腸直腸癌、内分泌腺の癌、胃腸癌、尿生殖器癌、婦人科癌、頭部及び頸部癌、白血病、肺癌、リンパ腫、眼癌、皮膚癌、軟部組織肉腫、泌尿器系癌、及び他のタイプの若しくは関連する障害である、項目 7 1 記載の方法。

本発明の一態様は、式 (I) の化合物、そのプロドラッグ、多形体、互変異性体、エナンチオマー、立体異性体、溶媒和化合物、N - オキシド又は薬理学的に許容できる塩に関する。

#### 【化 1】



I