

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】令和 1 年 12 月 26 日 (2019.12.26)

【公表番号】特表 2018-538264 (P2018-538264A)

【公表日】平成 30 年 12 月 27 日 (2018.12.27)

【年通号数】公開・登録公報 2018-050

【出願番号】特願 2018-525702 (P2018-525702)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/506

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 21/00

【手続補正書】

【提出日】令和 1 年 11 月 15 日 (2019.11.15)

【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

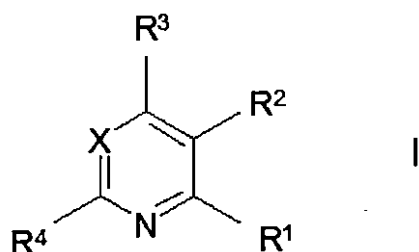
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

M S を治療又は予防する ための医薬組成物であって、治療有効量の式 I の化合物又はその医薬的に使用可能な塩、互変異性体若しくは立体異性体、或いはそれらの全ての比率における混合物を含み、

【化 1】



式中、

X は C H 又は N を表し、

R¹ は、N H₂、C O N H₂ 又は H を表し、

R² は、H a l、A r¹ 又は H e t¹ を表し、

R³ は、N R⁵ [C (R⁵)₂]_n H e t²、N R⁵ [C (R⁵)₂]_n C y c、H e t²、O [C (R⁵)₂]_n A r²、N R⁵ [C (R⁵)₂]_n A r²、O [C (R⁵)₂]_n H e t²、N R⁵ (C H₂)_p N R⁵ R⁶、O (C H₂)_p N R⁵ R⁶ 又は N R⁵ (C H₂)_p C R⁷ R⁸ N R⁵ R⁶ を表し、

R⁴ は、H、C H₃ 又は N H₂ を表し、

R^5 は、1、2、3又は4個のC原子を有するH又はアルキルを表し、

R^6 は、 $N(R^5)_2CH_2CH=CHCONH$ 、 $He t^3CH_2CH=CHCONH$ 、 $CH_2=CHCONH(CH_2)_n$ 、 $He t^4(CH_2)_nCOHe t^3$ -ジイル- $CH_2CH=CHCONH$ 、 $HC \quad CCO$ 、 $CH_3C \quad CCO$ 、 $CH_2=CH-CO$ 、 $CH_2=C(CH_3)CONH$ 、 $CH_3CH=CHCONH(CH_2)_n$ 、 $N \quad CCR^7R^8CONH(CH_2)_n$ 、 $He t^4NH(CH_2)_pCOHe t^3$ -ジイル- $CH_2CH=CHCONH$ 、 $He t^4(CH_2)_pCONH(CH_2CH_2O)_p(CH_2)_pCOHe t^3$ -ジイル- $CH_2CH=CHCONH$ 、 $CH_2=CHSO_2$ 、 $ACH=CHCO$ 、 $CH_3CH=CHCO$ 、 $He t^4(CH_2)_pCONH(CH_2)_pHe t^3$ -ジイル- $CH_2CH=CHCONH$ 、 $Ar^3CH=CHSO_2$ 、 $CH_2=CHSO_2NH$ 又は $N(R^5)CH_2CH=CHCO$ を表し、

R^7 、 R^8 は共に、2、3、4、又は5個のC原子を有するアルキレンを表し、

Ar^1 は、それぞれ非置換又は R^6 、 Hal 、 $(CH_2)_nNH_2$ 、 $CONHAr^3$ 、 $(CH_2)_nNHCOA$ 、 $O(CH_2)_nAr^3$ 、 $O C y c$ 、 A 、 $COHe t^3$ 、 OA 及び/又は $OH e t^3(CH_2)$ により一、二又は三置換されている、フェニル又はナフチルを表し、

Ar^2 は、それぞれ非置換又は R^6 、 Hal 、 OAr^3 、 $(CH_2)_nNH_2$ 、 $(CH_2)_nNHCOA$ 及び/又は $He t^3$ により一、二又は三置換されている、フェニル、ナフチル又はピリジルを表し、

Ar^3 は、非置換又は OH 、 OA 、 Hal 、 CN 及び/又は A により一、二又は三置換されている、フェニルを表し、

$He t^1$ は、非置換又は R^6 、 $O(CH_2)_nAr^3$ 及び/又は $(CH_2)_nAr^3$ により一、二又は三置換されていてもよい、1～4個のN、O及び/又はS原子を有する単環式又は二環式飽和、非飽和又は芳香族複素環を表し、

$He t^2$ は、非置換又は R^6 、 $He t^3$ 、 $C y c SO_2$ 、 OH 、 Hal 、 $COOH$ 、 OA 、 COA 、 $COHe t^3$ 、 $C y c CO$ 、 SO_2 及び/又は $=O$ により一、二又は三置換されていてもよい、1～4個のN、O及び/又はS原子を有する単環式又は二環式飽和複素環を表し、

$He t^3$ は、非置換又は Hal 、 A 及び/又は $=O$ により一、二又は三置換されていてもよい、1～4個のN、O及び/又はS原子を有する単環式非飽和、飽和又は芳香族複素環を表し、

$He t^4$ は、非置換又は A 、 NO_2 、 Hal 及び/又は $=O$ により一、二、三又は四置換されていてもよい、1～4個のN、O及び/又はS原子を有する二環式又は三環式非飽和、飽和又は芳香族複素環を表し、

$C y c$ は、非置換、 R^6 及び/又は OH により一置換又は二置換され、二重結合を含んでいてもよい、3、4、5又は6個のC原子を有する環状アルキルを表し、

A は、1～7個のH原子がF及び/又はClによって置換されていてもよい及び/又は一つ又は二つの非隣接 CH_2 及び/又は CH -基がO、NH及び/又はNによって置換されていてもよい、1～10個のC原子を有する非分岐状又は分岐状アルキルを表し、

Hal は、F、Cl、Br又はIを表し、

n は、0、1、2、3又は4を表し、

p は、1、2、3、4、5又は6を表す、前記医薬組成物。

【請求項2】

$He t^1$ は、それぞれ非置換又は R^6 、 $O(CH_2)_nAr^3$ 及び/又は $(CH_2)_nAr^3$ により一、二又は三置換されている、ペリリジニル、ペラジニル、ピロリジニル、モルホリニル、フリル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、トリーアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリダジニル、ピラジニル、ベンズイミダゾリル、ベンゾトリアゾリル、インドリル、ベンゾ-1,3-ジオキサソリル、インダゾリル、アザピシクロ[3.2.1]オクチル、アザピシクロ[2.2.2]オクチル、イミダゾリジニル、アゼチジニル、アゼパニル、ベンゾ-2,1,3-チアジアゾリル、テトラヒドロフリル、ジオキサラニル、テトラヒドロチエニル、ジヒドロピロリル

、テトラヒドロイミダゾリル、ジヒドロピラゾリル、テトラヒドロピラゾリル、テトラヒドロピリジル、ジヒドロピリジル又はジヒドロベンゾチオキシニルを表す、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

Het^1 は、それぞれ非置換又は R^6 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_n\text{Ar}^3$ 及び / 又は $(\text{CH}_2)_n\text{Ar}^3$ により一、二又は三置換されている、ピラゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ジヒドロピリジル又はジヒドロベンゾチオキシニルを表す、請求項 1 又は 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

Het^2 は、それぞれ非置換又は R^6 、 Het^3 、 CycSO_2 、 OH 、 OA 、 COA 、 COHet^3 、 CycCO 、 SO_2 及び / 又は $=\text{O}$ により一、二又は三置換されている、ピペリジニル、ピペラジニル、ピロリジニル、モルホリニル、アザピシクロ[3.2.1]オクチル、アザピシクロ[2.2.2]オクチル、2,7-ジアザスピロ[3.5]ノニル、2,8-ジアザスピロ[4.5]デシル、2,7-ジアザスピロ[4.4]ノニル、3-アザピシクロ[3.1.0]ヘキシル、2-アザスピロ[3.3]ヘプチル、6-アザスピロ[3.4]オクチル、7-アザスピロ[3.5]ノニル、5-アザスピロ[3.5]ノニル、イミダゾリジニル、アゼチジニル、アゼパニル、テトラヒドロフリル、ジオキサニル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロイミダゾリル、テトラヒドロピラゾリル、テトラヒドロピリジルを表す、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

Het^3 は、それぞれ非置換又は Hal 、 A 及び / 又は $=\text{O}$ により一、二又は三置換されていてもよい、ピペリジニル、ピペラジニル、ピロリジニル、モルホリニル、フリル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、トリーアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリダジニル、ピラジニル、イミダゾリジニル、アゼチジニル、アゼパニル、テトラヒドロフリル、ジオキサニル、テトラヒドロチエニル、ジヒドロピロリル、テトラヒドロイミダゾリル、ジヒドロピラゾリル、テトラヒドロピラゾリル、テトラヒドロピリジル又はジヒドロピリジルを表す、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

前記方法。

【請求項 6】

Het^3 は、それぞれ非置換又は Hal 、 A 及び / 又は $=\text{O}$ により一、二又は三置換されていてもよい、ピペリジニル、ピロリジニル、モルホリニル、フリル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ジヒドロピロリル、ジヒドロピラゾリル又はジヒドロピリジルを表す、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

Het^4 は、それぞれ非置換又は A 、 NO_2 、 Hal 及び / 又は $=\text{O}$ により一、二、三又は四置換されていてもよい、ヘキサヒドロチエノ[3,4-d]イミダゾリル、ベンゾ[c][1,2,5]オキサジアゾリル又は 5H-ジピロロ[1,2-c:2',1'-f][1,3,2]ジアザボリニン-4-イウム-ウイジルを表す、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

X は CH 又は N を表し、
 R^1 は、 NH_2 、 CONH_2 又は H を表し、
 R^2 は、 Hal 、 Ar^1 又は Het^1 を表し、
 R^3 は、 $\text{NR}^5[\text{C}(\text{R}^5)_2]_n\text{Het}^2$ 、 $\text{NR}^5[\text{C}(\text{R}^5)_2]_n\text{Cyc}$ 、 Het^2 、 $\text{O}[\text{C}(\text{R}^5)_2]_n\text{Ar}^2$ 、 $\text{NR}^5[\text{C}(\text{R}^5)_2]_n\text{Ar}^2$ 、 $\text{O}[\text{C}(\text{R}^5)_2]_n\text{Het}^2$ 、 $\text{NR}^5(\text{CH}_2)_p\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_p\text{NR}^5\text{R}^6\text{NR}^5(\text{CH}_2)_p\text{CR}^7\text{R}^8\text{NR}^5\text{R}^6$ を表し、
 R^4 は、 H を表し、

R^5 は、1、2、3又は4個のC原子を有するH又はアルキルを表し、

R^6 は、 $N(R^5)_2CH_2CH=CHCONH$ 、 $Het^3CH_2CH=CHCONH$ 、 $CH_2=CHCONH(CH_2)_n$ 、 $Het^4(CH_2)_nCOHet^3-diy1-CH_2CH=CHCONH$ 、 $HC-C-CO$ 、 $CH_3C-C-CO$ 、 $CH_2=CH-CO$ 、 $CH_2=C(CH_3)CONH$ 、 $CH_3CH=CHCONH(CH_2)_n$ 、 $N-C-CR^7R^8CONH(CH_2)_n$ 、 $Het^4NH(CH_2)_pCOHet^3-diy1-CH_2CH=CHCONH$ 、 $Het^4(CH_2)_pCONH(CH_2CH_2O)_p(CH_2)_pCOHet^3-diy1-CH_2CH=CHCONH$ 、 $CH_2=CHSO_2$ 、 $ACH=CHCO$ 、 $CH_3CH=CHCO$ 、 $Het^4(CH_2)_pCONH(CH_2)_pHet^3-diy1-CH_2CH=CHCONH$ 、 $Ar^3CH=CHSO_2$ 、 $CH_2=CHSO_2NH$ 又は $N(R^5)CH_2CH=CHCO$ を表し、

R^7 、 R^8 は共に、2、3、4、又は5個のC原子を有するアルキレンを表し、

Ar^1 は、それぞれ非置換又は R^6 、 Hal 、 $(CH_2)_nNH_2$ 、 $CONHAr^3$ 、 $(CH_2)_nNHCOA$ 、 $O(CH_2)_nAr^3$ 、 $OCyc$ 、 A 、 $COHet^3$ 、 OA 及び/又は OH 、 $et^3(CH_2)$ により一、二又は三置換されている、フェニル又はナフチルを表し、

Ar^2 は、それぞれ非置換又は R^6 、 Hal 、 OAr^3 、 $(CH_2)_nNH_2$ 、 $(CH_2)_nNHCOA$ 及び/又は et^3 によって一、二又は三置換されている、フェニル又はナフチルを表し、

Ar^3 は、非置換又は OH 、 OA 、 Hal 、 CN 及び/又は A により一、二又は三置換されている、フェニルを表し、

Het^1 は、それぞれ非置換又は R^6 、 $O(CH_2)_nAr^3$ 及び/又は $(CH_2)_nAr^3$ により一、二又は三置換されている、ピペリジニル、ピペラジニル、ピロリジニル、モルホリニル、フリル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、トリーアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリダジニル、ピラジニル、ベンズイミダゾリル、ベンゾトリアゾリル、インドリル、ベンゾ-1,3-ジオキサゾリル、インダゾリル、アザビシクロ[3.2.1]オクチル、アザビシクロ[2.2.2]オクチル、イミダゾリジニル、アゼチジニル、アゼパニル、ベンゾ-2,1,3-チアジアゾリル、テトラ-ヒドロフリル、ジオキサソラニル、テトラヒドロチエニル、ジヒドロピロリル、テトラヒドロイミダゾリル、ジヒドロピラゾリル、テトラヒドロピラ-ゾリル、テトラ-ヒドロピリジニル、ジヒドロピリジニル又はジヒドロベンゾチオキシニルを表し、

Het^2 は、それぞれ非置換又は R^6 、 et^3 、 $CycSO_2$ 、 OH 、 OA 、 COA 、 $COHet^3$ 、 $CycCO$ 、 SO_2 及び/又は $=O$ により一、二又は三置換されている、ピペリジニル、ピペラジニル、ピロリジニル、モルホリニル、アザビシクロ[3.2.1]オクチル、アザビシクロ[2.2.2]オクチル、2,7-ジアザスピロ[3.5]ノニル、2,8-ジアザスピロ[4.5]デシル、2,7-ジアザスピロ[4.4]ノニル、3-アザビシクロ[3.1.0]ヘキシル、2-アザスピロ[3.3]ヘプチル、6-アザスピロ[3.4]オクチル、7-アザスピロ[3.5]ノニル、5-アザスピロ[3.5]ノニル、イミダゾリジニル、アゼチジニル、アゼパニル、テトラ-ヒドロフリル、ジオキサソラニル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロイミダゾリル、テトラヒドロピラ-ゾリル、テトラ-ヒドロピリジニルを表し、

et^3 は、それぞれ非置換又は Hal 、 A 及び/又は $=O$ により一、二又は三置換されていてもよい、ピペリジニル、ピペラジニル、ピロリジニル、モルホリニル、フリル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、トリーアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリダジニル、ピラジニル、イミダゾリジニル、アゼチジニル、アゼパニル、テトラ-ヒドロフリル、ジオキサソラニル、テトラヒドロチエニル、ジヒドロピロリル、テトラヒドロイミダゾリル、ジヒドロピラゾリル、テトラヒドロピラ-ゾリル、テトラ-ヒドロピリジニル又はジヒドロピリジニルを表し、

et^4 は、それぞれ非置換又は A 、 NO_2 、 Hal 及び/又は $=O$ により一、二、三又は四置換されていてもよい、ヘキサヒドロチエノ[3,4-d]イミダゾリル、ベンゾ[c

][1, 2, 5] オキサジアゾリル又は 5H - ジピロロ [1, 2 - c : 2', 1' - f]
[1, 3, 2] ジアザボリニン - 4 - イウム - ウィジルを表し、

Cyc は、非置換又は R^6 により一置換されている、二重結合を含んでいてもよい、3、4、5 又は 6 個の C 原子を有する環状アルキルを表し、

A は、1 ~ 7 個の H 原子が F 及び / 又は Cl によって置換されていてもよい及び / 又は一つ又は二つの非隣接 CH_2 及び / 又は CH - 基が O、NH 及び / 又は N によって置換されていてもよい、1 ~ 10 個の C 原子を有する非分岐状又は分岐状アルキルを表し、

Hal は、F、Cl、Br 又は I を表し、

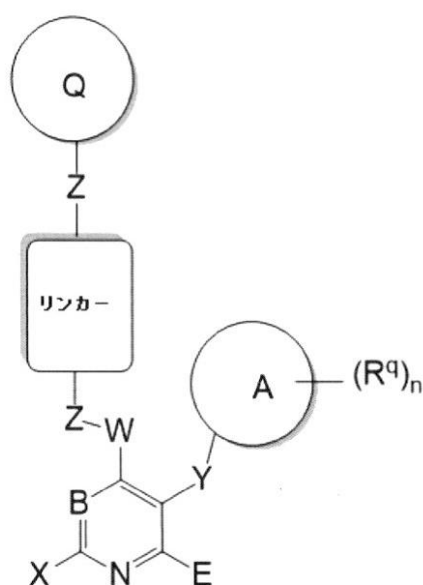
n は、0、1、2、3 又は 4 を表し、

p は、1、2、3、4、5 又は 6 を表す、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記化合物は式 (II) の化合物である：

【化 2】



式 (II) :

式中、

X は、H 又は CH_3 又は NH_2 であり、

Y は、H、Hal 又は存在せず、

B は、N 又は CH であり、

E は、 NH_2 又は H であり、

W は、NR、O 又は環状アミンであり、

Z は、独立して、 CH_2 、 CH_3 、 $CH_2 - CH_2$ 、 $CH - CH_2$ 、H、NH 又は存在せず、

「リンカー」は、 $(CH_2)_n$ であり、式中、 n はフェニル環、アリール環、ヘテロアリール環、分岐状又は非分岐状アルキル基、窒素又は酸素からそれぞれ独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 6 員単環式ヘテロアリール環、窒素又は酸素からそれぞれ独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 7 員飽和又は部分的非飽和複素環、窒素又は酸素からそれぞれ独立して選択される 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 7 ~ 10 員二環式飽和又は部分的非飽和複素環式環、又は複素飽和環に結合した 1 ~ 5 個のヘテロ原子を有する 7 ~ 10 員二環式飽和又は部分的非飽和複素環式環から選択される、一、二又は三置換若しくは任意に置換された基であり、リンカーは、ヘテロ原子 (窒素又は酸素からそれぞれ独立して選択される) により任意に置換されたシクロアルカン、-NH 又は OH により任意に置換されたシクロアルカン、融合又は架橋環又は任意に置換された任

意にヘテロ原子を含有するスピロ環状環であってもよく、

A は、非置換又は互いに独立して H a 1、OH 又は OR により一、二又は三置換されていてもよい、0、1、2、3 又は 4 個の N 及び / 又は O 原子及び 5、6、7、8、9、又は 10 個の骨格 C 原子を有する一環式又は二環式芳香族単組環又は複素環であり、

H a 1 は、F、Cl、Br 又は I であり、

R は、独立して水素、酸素、又は任意に置換された基であり、前記基は、C₁₋₆ 直鎖状又は環状脂肪族、ベンジル、フェニル、1、2 又は 3 個の O 原子により任意に置換されたフェニル基、窒素又は酸素からそれぞれ独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 7 員複素環式環、窒素又は酸素からそれぞれ独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 6 員単環式ヘテロアリール環、又は 0、1、2、3 又は 4 個の N、O 原子及び 5、6、7、又は 8 個の C 骨格原子を有する一環式又は二環式芳香族単組環又は複素環から選択され、非置換又は互いに独立して、H a 1、A、OH、NH₂、ニトリル、及び / 又は CH (H a 1)₃ により一、二又は三置換されていてもよく、若しくは R は、1、2、3、4、5、6、7 又は 8 個の C 原子を有する非分岐状又は分岐状直鎖状アルキルであり、一つ又は二つの CH₂ 基は、O 原子及び / 又は -NH-、-CO-、-NHCOO-、-NHCONH-、-CONH-、-NHCO- 又は -CH=CH- 基により置換されていてもよく、1 ~ 3 個の H 原子は、H a 1 により置換されていてもよく、

R^q は、- - R、- - A、ハロゲン、- - OR、- - O (CH₂)_r OR、- - R (NH)、- - NO₂、- - C (O) R、- - CO₂ R、- - C (O) N (R)₂、- - NRC (O) R、- - NRC (O) NR₂、- - NRSO₂ R 又は - - N (R)₂ から選択され、

r は、1 ~ 4 であり、

n は、0 ~ 4 であり、

Q は、求電子基である、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記化合物が、以下の表 2 :

【表 1 - 1】

表 2

番号	化学名
A 1	(R) - 1 - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) ピロリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 2	(R) - 1 - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 3	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) フェニル) アクリルアミド
A 4	(R) - 1 - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピロリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 5	N - ((1 - (6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) ピロリジン - 3 - イル) メチル) アクリルアミド
A 6	1 - (4 - ((5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 7	N - ((1 - (6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) ピペリジン - 4 - イル) メチル) アクリルアミド
A 8	4 - (4 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - カルボニル) - 1 - メチルピリジン - 2 (1 H) - オン
A 9	1 - (4 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) ブト - 2 - イン - 1 - オン
A 10	5 - (4 - フェノキシフェニル) - N4 - ((1 - (ピニルスルホニル) ピペリジン - 4 - イル) メチル) ピリミジン - 4, 6 - ジアミン
A 11	(E) - 1 - (4 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) - 4 - ((2 - メトキシエチル) (メチル) アミノ) ブト - 2 - エン - 1 - オン
A 12	(4 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) (2 - フルオロピリジン - 3 - イル) メタノン
A 13	(E) - 1 - (4 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) ブト - 2 - エン - 1 - オン
A 14	N4 - ((1 - (シクロプロピルスルホニル) ピペリジン - 4 - イル) メチル) - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4, 6 - ジアミン
A 15	(Z) - 1 - (4 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) ブト - 2 - エン - 1 - オン
A 16	1 - (4 - (2 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) エチル) ピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 17	1 - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 18	N - (2 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) エチル) アクリルアミド
A 19	(R) - 1 - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) ピロリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン

【表 1 - 2】

A 2 0	N-(1-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)シクロペンチル)アクリルアミド
A 2 1	1-(3-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)メチル)ピロリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 2 2	1-(4-((5-フルオロ-3-(4-フェノキシフェニル)ピリジン-2-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 2 3	1-(4-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)エタノン
A 2 4	(E)-7-(3-(4-(4-(3-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)アミノ)-4-オキソブト-2-エン-1-イル)ピペラジン-1-イル)-3-オキソプロピル)-5,5-ジフルオロ-1,3-ジメチル-5H-ジピロロ[1,2-c:2',1'-f][1,3,2]ジアザボリニン-4-イウム-5-ウイド
A 2 5	1-(4-((2-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 2 6	(S)-1-(3-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)メチル)ピロリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 2 7	N-(2-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)エチル)アクリルアミド
A 2 8	(S)-1-(3-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピロリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 2 9	1-(4-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)-2-メチルプロプ-2-エン-1-オン
A 3 0	(4-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)(シクロヘキス-1-エン-1-イル)メタノン
A 3 1	1-(4-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)-3-メチルブト-2-エン-1-オン
A 3 2	(4-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)(シクロペント-1-エン-1-イル)メタノン
A 3 3	1-(4-((6-アミノ-5-(1-ベンジル-1H-ピラゾール-4-イル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 3 4	1-(4-((6-アミノ-5-(4-(3-フルオロフェノキシ)フェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 3 5	(E)-7-(3-(2-(4-(4-(3-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)アミノ)-4-オキソブト-2-エン-1-イル)ピペラジン-1-イル)エチル)アミノ)-3-オキソプロピル)-5,5-ジフルオロ-1,3-ジメチル-5H-ジピロロ[1,2-c:2',1'-f][1,3,2]ジアザボリニン-4-イウム-5-ウイド

【表 1 - 3】

A 3 6	1- (4- (((6-アミノ-2-メチル-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピペリジン-1-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 3 7	1- (4- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) -4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 3 8	(R) -1- (3- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) メチル) ピロリジン-1-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 3 9	1- (4- (((6-アミノ-5- (4- (フェニルアミノ) フェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピペリジン-1-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 4 0	1- (3- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) フェニル) -1H-ピロール-2 (5H) -オン
A 4 1	1- (4- (((6-アミノ-5- (4-ベンジルフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピペリジン-1-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 4 2	(4- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピペリジン-1-イル) (シクロブト-1-エン-1-イル) メタノン
A 4 3	(Z) -1- (4- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) メチル) ピペリジン-1-イル) ブト-2-エン-1-オン
A 4 4	1- (4- (((6-アミノ-2-メチル-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) (メチル) アミノ) メチル) ピペリジン-1-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 4 5	1- (4- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピペリジン-1-イル) -2-クロロエタノン
A 4 6	1- (4- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピペリジン-1-イル) プロプ-2-イン-1-オン
A 4 7	1- (4- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) (メチル) アミノ) メチル) ピペリジン-1-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 4 8	1- (3- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-8-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 4 9	N- ((1S, 3S) -3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) シクロペンチル) アクリルアミド
A 5 0	N- (4- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) ブチル) アクリルアミド
A 5 1	N- (シス-3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) シクロヘキシル) アクリルアミド
A 5 2	1- (3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) アゼパン-1-イル) プロプ-2-エン-1-オン

【表 1 - 4】

A 5 3	N- (トランス-3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) シクロヘキシル) アクリルアミド
A 5 4	(E) -5- (4-フェノキシフェニル) -N4- ((1- (スチリルスルホニル) ピペリジン-4-イル) メチル) ピリミジン-4, 6-ジアミン
A 5 5	N4- ((1- (メチルスルホニル) ピペリジン-4-イル) メチル) -5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4, 6-ジアミン
A 5 6	1- (4- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピペリジン-1-イル) -2, 3-ジヒドロキシプロパン-1-オン
A 5 7	4- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピペリジン-2-オン
A 5 8	N- (3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) フェニル) エタンスルホンアミド
A 5 9	N- (3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) プロピル) アクリルアミド
A 6 0	N- (5- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) ピリジン-3-イル) アクリルアミド
A 6 1	(R) -1- (3- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピロリジン-1-イル) プロブ-2-イン-1-オン
A 6 2	(R, E) -1- (3- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピロリジン-1-イル) -4- (ジメチルアミノ) ブト-2-エン-1-オン
A 6 3	(E) -N- (シス-3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) シクロヘキシル) -4- (ジメチルアミノ) ブト-2-エナミド
A 6 4	N- (シス-3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) シクロヘキシル) プロピオールアミド
A 6 5	(S) -1- (2- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) メチル) モルホリノ) プロブ-2-エン-1-オン
A 6 6	(R) -1- (2- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) メチル) モルホリノ) プロブ-2-エン-1-オン
A 6 7	N- (3- ((6-アミノ-5- (1- (3-フルオロベンジル) -1H-ピラゾール-4-イル) ピリミジン-4-イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 6 8	1- (3- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-8-イル) プロブ-2-イン-1-オン
A 6 9	N- (3- ((6-アミノ-5- (1- (4-シアノベンジル) -1H-ピラゾール-4-イル) ピリミジン-4-イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 7 0	N- (3- ((6-アミノ-5- (1-ベンジル-1H-ピラゾール-4-イル) ピリミジン-4-イル) アミノ) フェニル) アクリルアミド
A 7 1	(E) -1- (3- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-8-イル) -4- (ジメチルアミノ) ブト-2-エン-1-オン
A 7 2	N- (3- ((6-アミノ-5- (1- (4-メトキシベンジル) -1H-ピラゾール-4-イル) ピリミジン-4-イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド

【表 1 - 5】

A 7 3	(R, E) - 1 - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) ピロリジン - 1 - イル) - 4 - (ジメチルアミノ) ブト - 2 - エン - 1 - オン
A 7 4	(R, E) - 1 - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 - (ジメチルアミノ) ブト - 2 - エン - 1 - オン
A 7 5	1 - (トランス - 3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) - 4 - ヒドロキシピロリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 7 6	1 - (4 - (((2 - アミノ - 3 - (4 - フェノキシフェニル) ピリジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 7 7	1 - (4 - (((6 - アミノ - 5 - (4 - フルオロフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 7 8	1 - (4 - (((6 - アミノ - 5 - (4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 7 9	1 - (4 - (((6 - アミノ - 5 - (4 - (4 - (トリフルオロメチル) フェノキシ) フェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 8 0	1 - (4 - (((6 - アミノ - 5 - (4 - (4 - (フルオロフェノキシ) フェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 8 1	1 - (4 - (((6 - アミノ - 5 - (4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 8 2	1 - (4 - (((6 - アミノ - 5 - (3, 4 - ジメトキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 8 3	1 - (4 - (((6 - アミノ - 5 - (3, 4, 5 - トリメトキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 8 4	1 - (4 - (((6 - アミノ - 5 - (2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] [1, 4] ジオキシン - 6 - イル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 8 5	1 - (4 - (((6 - アミノ - 5 - (4 - メトキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 8 6	4 - (4 - (4 - (((1 - アクリロイルピペリジン - 4 - イル) メチル) アミノ) - 6 - アミノピリミジン - 5 - イル) フェノキシ) ベンゾニトリル
A 8 7	1 - (4 - (((6 - アミノ - 5 - (2, 5 - ジフルオロ - 4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 8 8	1 - (4 - (((6 - アミノ - 5 - (2, 3 - ジフルオロ - 4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 8 9	1 - (4 - (((6 - アミノ - 5 - (4 - ((1 - メチルピペリジン - 4 - イル) オキシ) フェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン

【表 1 - 6】

A 9 0	1-(4-((6-アミノ-5-(4-フェノキシ-2-(トリフルオロメチル)フェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 9 1	1-(2-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)-2,7-ジアザスピロ[3.5]ノナン-7-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 9 2	1-(8-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)-2,8-ジアザスピロ[4.5]デカン-2-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 9 3	1-(7-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)-2,7-ジアザスピロ[4.4]ノナン-2-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 9 4	1-(4-((6-アミノ-5-(4-(4-ヒドロキシフェノキシ)フェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 9 5	1-(4-((6-アミノ-5-(4-(3-(トリフルオロメチル)フェノキシ)フェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 9 6	1-(4-((6-アミノ-5-(4-(ピリジン-3-イルオキシ)フェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 9 7	1-(4-((6-アミノ-5-(4-(ピリジン-4-イルオキシ)フェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 9 8	1-(4-((6-アミノ-5-(4-(p-トリルオキシ)フェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 9 9	1-(4-((6-アミノ-5-(4-(シクロヘキシルオキシ)フェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 1 0 0	N4-((1R, 5S, 6r)-3-アザビシクロ[3.1.0]ヘキサン-6-イルメチル)-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4,6-ジアミン塩酸塩
A 1 0 1	(3S, 4S)-4-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-3-オール塩酸塩
A 1 0 2	(E)-1-(6-((6-アミノ-5-クロロピリミジン-4-イル)オキシ)-2-アザスピロ[3.3]ヘプタン-2-イル)-4-(ジメチルアミノ)ブト-2-エン-1-オン
A 1 0 3	1-(3-(2-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)エチル)アゼチジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 1 0 4	1-(3-(2-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)エチル)アゼチジン-1-イル)プロプ-2-イン-1-オン
A 1 0 5	(E)-1-(6-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)-2-アザスピロ[3.3]ヘプタン-2-イル)-4-(ジメチルアミノ)ブト-2-エン-1-オン
A 1 0 6	1-(6-((6-アミノ-5-(1-ベンジル-1H-ピラゾール-4-イル)ピリミジン-4-イル)オキシ)-2-アザスピロ[3.3]ヘプタン-2-イル)プロプ-2-エン-1-オン

【表 1 - 7】

A 1 0 7	1- (6- ((6-アミノ-5- (1-ベンジル-1H-ピラゾール-4-イル) ピリミジン-4-イル) アミノ) -2-アザスピロ [3. 3] ヘプタン-2-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 1 0 8	1- (6- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) -2-アザスピロ [3. 3] ヘプタン-2-イル) ブト-2-イン-1-オン
A 1 0 9	1- ((3S, 4S) -4- (((6-アミノ-5- (1-ベンジル-1H-ピラゾール-4-イル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) -3-ヒドロキシピペリジン-1-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 1 1 0	1- ((3S, 4S) -4- (((6-アミノ-5- (1-ベンジル-1H-ピラゾール-4-イル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) -3-ヒドロキシピペリジン-1-イル) プロプ-2-イン-1-オン
A 1 1 1	1- (6- ((6-アミノ-5- (1-ベンジル-1H-ピラゾール-4-イル) ピリミジン-4-イル) アミノ) -2-アザスピロ [3. 3] ヘプタン-2-イル) プロプ-2-イン-1-オン
A 1 1 2	1- (6- ((6-アミノ-5- (1-ベンジル-1H-ピラゾール-4-イル) ピリミジン-4-イル) オキシ) -2-アザスピロ [3. 3] ヘプタン-2-イル) プロプ-2-イン-1-オン
A 1 1 3	1- (2- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) -6-アザスピロ [3. 4] オクタン-6-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 1 1 4	1- (6- ((6-アミノ-5- (4- (ピリジン-4-イルオキシ) フェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) -2-アザスピロ [3. 3] ヘプタン-2-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 1 1 5	1- (2- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) -6-アザスピロ [3. 4] オクタン-6-イル) プロプ-2-イン-1-オン
A 1 1 6	1- (6- ((6-アミノ-5- (1- (ピリジン-4-イルメチル) -1H-ピラゾール-4-イル) ピリミジン-4-イル) アミノ) -2-アザスピロ [3. 3] ヘプタン-2-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 1 1 7	N- (1, 3-トランス-3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) シクロブチル) アクリルアミド
A 1 1 8	N- ((1, 3-シス-3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) シクロブチル) アクリルアミド
A 1 1 9	N4- (2- ((2-クロロエチル) スルホニル) -2-アザスピロ [3. 3] ヘプタン-6-イル) -5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4, 6-ジアミン
A 1 2 0	1- (6- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) -2-アザスピロ [3. 3] ヘプタン-2-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 1 2 1	1- (4- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) -4-メトキシピペリジン-1-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 1 2 2	N- (6- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) スピロ [3. 3] ヘプタン-2-イル) アクリルアミド

【表 1 - 8】

A 1 2 3	1- (1- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) -7-アザスピロ [3. 5] ノナン-7-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 1 2 4	1- (6- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) -2-アザスピロ [3. 3] ヘプタン-2-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 1 2 5	1- (8- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) -5-アザスピロ [3. 5] ノナン-5-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 1 2 6	(E) -1- ((3S, 4S) -4- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) -3-ヒドロキシペリジン-1-イル) -4- (ジメチルアミノ) ブト-2-エン-1-オン
A 1 2 7	(E) -1- (6- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) -2-アザスピロ [3. 3] ヘプタン-2-イル) -4- (ジメチルアミノ) ブト-2-エン-1-オン
A 1 2 8	3- ((6-アミノ-5-クロロ-ピリミジン-4-イルアミノ) -メチル) -安息香酸メチルエステル
A 1 2 9	トランス-3- (6-アミノ-5-クロロ-ピリミジン-4-イルアミノ) -シクロヘキサンカルボキシル酸メチルエステル
A 1 3 0	(1R, 3S) -3- (6-アミノ-5-クロロ-ピリミジン-4-イルアミノ) -シクロヘキサンカルボキシル酸メチルエステル
A 1 3 1	3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) -ピリミジン-4-イルアミノ) -メチル) -安息香酸メチルエステル
A 1 3 2	トランス-3- (6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) -ピリミジン-4-イルアミノ) -シクロヘキサンカルボキシル酸メチルエステル
A 1 3 3	(1R, 3S) -3- (6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) -ピリミジン-4-イルアミノ) -シクロヘキサンカルボキシル酸メチルエステル
A 1 3 4	- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) -ピリミジン-4-イルアミノ) -メチル) -安息香酸
A 1 3 5	(1S, 3S) -3- (6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) -ピリミジン-4-イルアミノ) -シクロヘキサンカルボキシル酸
A 1 3 6	(1R, 3S) -3- (6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) -ピリミジン-4-イルアミノ) -シクロヘキサンカルボキシル酸
A 1 3 7	(4- (6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) -ピリミジン-4-イルアミノ) -フェニル) -N-メトキシ-N-メチル-アセトアミド
A 1 3 8	3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) -ピリミジン-4-イルアミノ) -メチル) -N-メトキシ-N-メチル-ベンズアミド
A 1 3 9	(1S, 3S) -3- (6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) -ピリミジン-4-イルアミノ) -シクロヘキサンカルボキシル酸メトキシ-メチル-アミド
A 1 4 0	(1R, 3S) -3- (6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) -ピリミジン-4-イルアミノ) -シクロヘキサンカルボキシル酸メトキシ-メチル-アミド
A 1 4 1	1- (3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) -ピリミジン-4-イルアミノ) -メチル) -フェニル) -ブト-2-イン-1-オン

【表 1 - 9】

A 1 4 2	1- (3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) -ピリミジン-4-イルアミノ) -メチル) -フェニル) -ブト-2-エン-1-オン
A 1 4 3	1- ((1S, 3S) -3- (6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) -ピリミジン-4-イルアミノ) -シクロヘキシル) -プロペノン
A 1 4 4	1- ((1S, 3S) -3- (6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) -ピリミジン-4-イルアミノ) -シクロヘキシル) -ブト-2-エン-1-オン
A 1 4 5	1- ((1S, 3S) -3- (6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) -ピリミジン-4-イルアミノ) -シクロヘキシル) -ブト-2-イン-1-オン
A 1 4 6	1- ((1S, 3R) -3- (6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) -ピリミジン-4-イルアミノ) -シクロヘキシル) -ブト-2-エン-1-オン
A 1 4 7	1- ((1S, 3R) -3- (6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) -ピリミジン-4-イルアミノ) -シクロヘキシル) -ブト-2-イン-1-オン
A 1 4 8	(S) -1- (3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) ピロリジン-1-イル) プロブ-2-エン-1-オン
A 1 4 9	N- (3- ((2-アミノ-3- (4- (ベンジルオキシ) フェニル) ピリジン-4-イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 1 5 0	1- (3- ((2-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) ピペリジン-1-イル) プロブ-2-エン-1-オン
A 1 5 1	(E) -N- (3- ((2-アミノ-3- (4-フェノキシフェニル) ピリジン-4-イル) オキシ) フェニル) -4- (ジメチルアミノ) ブト-2-エナミド
A 1 5 2	(E) -N- (3- ((2-アミノ-3- (4- (ベンジルオキシ) フェニル) ピリジン-4-イル) オキシ) フェニル) -4- (ジメチルアミノ) ブト-2-エナミド
A 1 5 3	(E) -1- (4- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピペリジン-1-イル) -4- (ジメチルアミノ) ブト-2-エン-1-オン
A 1 5 4	N-シス-4- ((6-アミノ-5- (4- (ベンジルオキシ) フェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) シクロヘキシル) アクリルアミド
A 1 5 5	4- (4- ((1-アクリロイルピロリジン-3-イル) メチル) アミノ) -6-アミノピリミジン-5-イル) -N-フェニルベンズアミド
A 1 5 6	1- (3- ((6-アミノ-5- (4- (ベンジルオキシ) フェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピロリジン-1-イル) プロブ-2-エン-1-オン
A 1 5 7	4- (4- ((1-アクリロイルピペリジン-4-イル) メチル) アミノ) -6-アミノピリミジン-5-イル) -N-フェニルベンズアミド
A 1 5 8	N- (3- ((2-アミノ-3- (4-フェノキシフェニル) ピリジン-4-イル) オキシ) -4-フルオロフェニル) アクリルアミド
A 1 5 9	4- (4- ((シス-4-アクリルアミドシクロヘキシル) アミノ) -6-アミノピリミジン-5-イル) -N-フェニルベンズアミド

【表 1 - 10】

A 1 6 0	(E) - 1 - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) ピペリジン - 1 - イル) - 4 - (ジメチルアミノ) プロ - 2 - エン - 1 - オン
A 1 6 1	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (6 - フェノキシピリジン - 3 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) - 4 - フルオロフェニル) アクリルアミド
A 1 6 2	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - (ピリジン - 2 - イルオキシ) フェニル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 1 6 3	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (3 - スルファモイルフェニル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 1 6 4	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (3 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 1 6 5	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (6 - (2 - フルオロフェノキシ) ピリジン - 3 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 1 6 6	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (6 - (4 - フルオロフェノキシ) ピリジン - 3 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 1 6 7	N - (6 - ((5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) ピリジン - 2 - イル) アクリルアミド
A 1 6 8	1 - (4 - (((6 - アミノ - 5 - (6 - フェノキシピリジン - 3 - イル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) プロ - 2 - エン - 1 - オン
A 1 6 9	1 - (4 - (((6 - アミノ - 5 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル) フェノキシ) フェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) プロ - 2 - エン - 1 - オン
A 1 7 0	1 - ((3 S, 4 S) - 4 - (((6 - アミノ - 5 - (4 - (3 - (トリフルオロメチル) フェノキシ) フェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) - 3 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) プロ - 2 - エン - 1 - オン
A 1 7 1	1 - (4 - (((6 - アミノ - 2' - フェノキシ - [5, 5' - ビピリミジン] - 4 - イル) アミノ) メチル) ピペリジン - 1 - イル) プロ - 2 - エン - 1 - オン
A 1 7 2	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (1 - ベンジル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 1 7 3	N - ((1 S, 3 R) - 3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) シクロヘキシル) アクリルアミド
A 1 7 4	N - ((1 R, 3 S) - 3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) シクロヘキシル) アクリルアミド
A 1 7 5	N - ((1 R, 3 R) - 3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) シクロヘキシル) アクリルアミド
A 1 7 6	N - ((1 S, 3 S) - 3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) シクロヘキシル) アクリルアミド
A 1 7 7	N - (4 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) b i シクロ [2. 1. 1] ヘキサン - 1 - イル) アクリルアミド

【表 1 - 1 1】

A 1 7 8	(R) - N 4 - (1 - ((パーフルオロフェニル) スルホニル) ピロリジン - 3 - イル) - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4, 6 - ジアミン
A 1 7 9	(R) - N 4 - (1 - ((パーフルオロフェニル) スルホニル) ピペリジン - 3 - イル) - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4, 6 - ジアミン
A 1 8 0	(R) - 1 - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (1 - ベンジル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) ピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 1 8 1	N - (シス - 3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) シクロペンチル) アクリルアミド
A 1 8 2	N - (3 - (((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) シクロブチル) アクリルアミド
A 1 8 3	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (1 - (3, 5 - ジフルオロベンジル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 1 8 4	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (1 - (2 - フルオロベンジル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 1 8 5	1 - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) アゼチジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 1 8 6	N - (5 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) ピリジン - 3 - イル) アクリルアミド
A 1 8 7	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (1 - (4 - フルオロベンジル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 1 8 8	N - ((1 R, 3 S, 5 R) - 3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) - 5 - ヒドロキシシクロヘキシル) アクリルアミド (ラセミ体)
A 1 8 9	N - (5 - ((6 - アミノ - 5 - (1 - ベンジル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) ピリジン - 3 - イル) アクリルアミド
A 1 9 0	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (1 - (3 - メチルベンジル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 1 9 1	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (1 - (3 - クロロベンジル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 1 9 2	(R) - 1 - (2 - (((6 - アミノ - 5 - (1 - ベンジル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) メチル) モルホリノ) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 1 9 3	(S) - 1 - (2 - (((6 - アミノ - 5 - (1 - ベンジル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) メチル) モルホリノ) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 1 9 4	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (1 - (2 - シアノベンジル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 1 9 5	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (1 - (3 - (トリフルオロメチル) ベンジル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド

【表 1 - 1 2】

A 1 9 6	(R) - 1 - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (1 - ベンジル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) メチル) ピロリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 1 9 7	N - (5 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - (4 - シアノフェノキシ) フェニル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) ピリジン - 3 - イル) アクリルアミド
A 1 9 8	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (1 - (3 - メトキシベンジル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 1 9 9	4 - (4 - (4 - (((3 S, 4 S) - 1 - アクリロイル - 3 - ヒドロキシピペリジン - 4 - イル) メチル) アミノ) - 6 - アミノピリミジン - 5 - イル) フェノキシ) ベンゾニトリル
A 2 0 0	(R) - 4 - (4 - (4 - ((4 - アクリロイルモルホリン - 2 - イル) メトキシ) - 6 - アミノピリミジン - 5 - イル) フェノキシ) ベンゾニトリル
A 2 0 1	(R) - 4 - (4 - (4 - ((1 - アクリロイルピロリジン - 3 - イル) メトキシ) - 6 - アミノピリミジン - 5 - イル) フェノキシ) ベンゾニトリル
A 2 0 2	4 - (4 - (4 - ((2 - アクリロイル - 2 - アザスピロ [3. 3] ヘプタン - 6 - イル) オキシ) - 6 - アミノピリミジン - 5 - イル) フェノキシ) ベンゾニトリル
A 2 0 3	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (1 - (3 - シアノベンジル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 2 0 4	1 - ((3 S, 5 S) - 3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) - 5 - フルオロピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 2 0 5	1 - ((3 R, 5 R) - 3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) - 5 - フルオロピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 2 0 6	メチル 3 - ((4 - (4 - (3 - アクリルアミドフェノキシ) - 6 - アミノピリミジン - 5 - イル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) メチル) ベンゾエート
A 2 0 7	4 - (4 - (4 - ((2 - アクリロイル - 2 - アザスピロ [3. 3] ヘプタン - 6 - イル) アミノ) - 6 - アミノピリミジン - 5 - イル) フェノキシ) ベンゾニトリル
A 2 0 8	4 - (4 - (4 - ((8 - アクリロイル - 8 - アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン - 3 - イル) メチル) アミノ) - 6 - アミノピリミジン - 5 - イル) フェノキシ) ベンゾニトリル
A 2 0 9	1 - (3 - (((6 - アミノ - 5 - (1 - ベンジル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) メチル) - 8 - アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン - 8 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン
A 2 1 0	1 - ((3 R, 4 R) - 3 - ((6 - アミノ - 5 - (4 - フェノキシフェニル) ピリミジン - 4 - イル) アミノ) - 4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) プロプ - 2 - エン - 1 - オン (ラセミック)
A 2 1 1	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (1 - (3 - (メチルスルホニル) ベンジル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 2 1 2	N - (3 - ((6 - アミノ - 5 - (1 - (3 - (ジメチルアミノ) ベンジル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド

【表 1 - 13】

A 2 1 3	N-(3-(6-アミノ-5-(4-(3-シアノフェノキシ)フェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)アクリルアミド
A 2 1 4	3-(4-(4-(1-アクリロイルピペリジン-4-イル)メチル)アミノ)-6-アミノピリミジン-5-イル)フェノキシ)ベンゾニトリル
A 2 1 5	1-(3S, 4S)-4-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)-3-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ブト-2-エン-1-オン
A 2 1 6	1-アクリロイル-4-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-4-カルボキシル酸
A 2 1 7	(E)-4-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)-1-(4-(ジメチルアミノ)ブト-2-エノイル)ピペリジン-4-カルボキシル酸
A 2 1 8	(E)-1-(4-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)-4-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)ブト-2-エン-1-オン
A 2 1 9	(E)-1-(4-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)-4-(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)ブト-2-エン-1-オン
A 2 2 0	(E)-1-(4-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)-4-(ピロリジン-1-イル)ブト-2-エン-1-オン
A 2 2 1	1-(6-(6-アミノ-5-(4-(ピリジン-3-イルオキシ)フェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)-2-アザスピロ[3.3]ヘプタン-2-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 2 2 2	(E)-1-(6-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)-2-アザスピロ[3.3]ヘプタン-2-イル)-4-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)ブト-2-エン-1-オン
A 2 2 3	(E)-1-(6-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)-2-アザスピロ[3.3]ヘプタン-2-イル)-4-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)ブト-2-エン-1-オン
A 2 2 4	(E)-N-(1,3-シス-3-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)シクロブチル)-4-(ジメチルアミノ)ブト-2-エナミド
A 2 2 5	1-(4-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)-4-フルオロピペリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン (2)
A 2 2 6	(E)-1-(2-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)-6-アザスピロ[3.4]オクタン-6-イル)-4-(ジメチルアミノ)ブト-2-エン-1-オン
A 2 2 7	(E)-1-(4-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)-4-フルオロピペリジン-1-イル)-4-(ジメチルアミノ)ブト-2-エン-1-オン
A 2 2 8	(E)-N-(1,3-トランス-3-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)シクロブチル)-4-(ジメチルアミノ)ブト-2-エナミド

【表 1 - 1 4】

A 2 2 9	N- (1, 3-シス-3- ((6-アミノ-5- (1-ベンジル-1H-ピラゾール-4-イル) ピリミジン-4-イル) アミノ) シクロブチル) アクリルアミド
A 2 3 0	(E) -N- (1, 3-シス-3- ((6-アミノ-5- (1-ベンジル-1H-ピラゾール-4-イル) ピリミジン-4-イル) アミノ) シクロブチル) -4- (ジメチルアミノ) ブト-2-エナミド
A 2 3 1	(E) -1- (4- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピペリジン-1-イル) -3-フェニルプロプ-2-エン-1-オン
A 2 3 2	1- ((3S, 4S) -4- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) -3-ヒドロキシピペリジン-1-イル) -3- (ジメチルアミノ) プロパン-1-オン
A 2 3 3	1- ((3S, 4S) -4- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) -3-ヒドロキシピペリジン-1-イル) -3- (ピペリジン-1-イル) プロパン-1-オン
A 2 3 4	1- ((3S, 4S) -4- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) -3-ヒドロキシピペリジン-1-イル) -3-モルホリノプロパン-1-オン
A 2 3 5	1- (4- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) -4-フルオロピペリジン-1-イル) -3- (ピペリジン-1-イル) プロパン-1-オン
A 2 3 6	(E) -N- (1, 3-シス-3- ((6-アミノ-5- (4- (3- (トリフルオロメチル) フェノキシ) フェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) シクロブチル) -4- (ジメチルアミノ) ブト-2-エナミド
A 2 3 7	N- (1, 3-トランス-3- ((6-アミノ-5- (4- (3- (トリフルオロメチル) フェノキシ) フェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) シクロブチル) アクリルアミド
A 2 3 8	N- (1, 3-シス-3- ((6-アミノ-5- (4- (3- (トリフルオロメチル) フェノキシ) フェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) シクロブチル) アクリルアミド
A 2 3 9	1-アクリロイル-4- (((6-アミノ-5- (4- (3- (トリフルオロメチル) フェノキシ) フェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピペリジン-4-カルボキシル酸
A 2 4 0	N- (3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) -2-フルオロフェニル) アクリルアミド
A 2 4 1	N- (3- (4-アミノ-6- ((4-フェノキシフェニル) アミノ) ピリミジン-5-イル) フェニル) アクリルアミド
A 2 4 2	N- (3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 2 4 3	N- (3- (2-アミノ-4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-3-イル) フェニル) アクリルアミド
A 2 4 4	N- (3- ((2-アミノ-3- (4-フェノキシフェニル) ピリジン-4-イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 2 4 5	N- (3- (4-アミノ-6- (4-フェノキシフェノキシ) ピリミジン-5-イル) フェニル) アクリルアミド
A 2 4 6	N- (3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) -4-フルオロフェニル) アクリルアミド
A 2 4 7	(R) -1- (3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) ピペリジン-1-イル) プロプ-2-エン-1-オン

【表 1 - 15】

A 2 4 8	(E) -N-(3-(4-アミノ-6-(4-フェノキシフェノキシ)ピリミジン-5-イル)フェニル)-4-(ジメチルアミノ)ブト-2-エナミド
A 2 4 9	N-(3-(6-アミノ-5-(4-(ベンジルオキシ)フェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)アクリルアミド
A 2 5 0	1-(4-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン (1)
A 2 5 1	N-(5-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)-2,4-ジフルオロフェニル)アクリルアミド
A 2 5 2	(E)-N-(3-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)-4-(ジメチルアミノ)ブト-2-エナミド
A 2 5 3	1-(3-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 2 5 4	N-(3-(6-アミノ-5-(4-(2-メトキシベンジル)オキシ)フェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)アクリルアミド
A 2 5 5	N-(3-(5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)アクリルアミド
A 2 5 6	N-(3-(6-アミノ-5-(4-(ベンジルオキシ)-3-メトキシフェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)アクリルアミド
A 2 5 7	N-(3-(6-アミノ-5-(4-(ベンジルオキシ)-2,3-ジフルオロフェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)アクリルアミド
A 2 5 8	4-(4-(3-アクリルアミドフェノキシ)-6-アミノピリミジン-5-イル)-N-フェニルベンズアミド
A 2 5 9	N-(3-(6-アミノ-5-(6-(ベンジルオキシ)ピリジン-3-イル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)アクリルアミド
A 2 6 0	N-(3-(6-アミノ-5-(4-(3-フルオロベンジル)オキシ)フェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)アクリルアミド
A 2 6 1	N-(3-(6-アミノ-2'-(ベンジルオキシ)-[5,5'-ビピリミジン]-4-イル)オキシ)フェニル)アクリルアミド
A 2 6 2	1-(3-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピロリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 2 6 3	1-(4-(4-アミノ-6-(4-フェノキシフェノキシ)ピリミジン-5-イル)-5,6-ジヒドロピリジン-1(2H)-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 2 6 4	N-(3-(6-アミノ-5-(4-(4-メトキシベンジル)オキシ)フェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)アクリルアミド
A 2 6 5	(E)-N-(3-(6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)-4-モルホリノブト-2-エナミド

【表 1 - 16】

A 2 6 6	N-((1s, 4s)-4-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)シクロヘキシル)アクリルアミド
A 2 6 7	N-(3-(4-((4-フェノキシフェニル)アミノ)ピリジン-3-イル)フェニル)アクリルアミド
A 2 6 8	N-(3-((6-アミノ-5-(6-フェノキシピリジン-3-イル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)アクリルアミド
A 2 6 9	1-(3-((6-アミノ-5-(4-(ベンジルオキシ)フェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 2 7 0	N-(3-((3-(4-フェノキシフェニル)ピリジン-4-イル)オキシ)フェニル)アクリルアミド
A 2 7 1	N-(3-((2-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)アクリルアミド
A 2 7 2	3-(3-アクリルアミドフェニル)-4-(4-フェノキシフェノキシ)ピコリンアミド
A 2 7 3	1-(3-(4-アミノ-6-((4-フェノキシフェニル)アミノ)ピリミジン-5-イル)-5, 6-ジヒドロピリジン-1(2H)-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 2 7 4	(E)-N-(3-(4-アミノ-6-(4-フェノキシフェノキシ)ピリミジン-5-イル)フェニル)-4-モルホリノブト-2-エナミド
A 2 7 5	(S)-1-(3-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 2 7 6	N-((1r, 4r)-4-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)シクロヘキシル)アクリルアミド
A 2 7 7	N-(3-((6-アミノ-5-(4-フルオロ-3-メトキシフェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)アクリルアミド
A 2 7 8	N-(3-((6-アミノ-5-(4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)フェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)アクリルアミド
A 2 7 9	1-(3-(4-アミノ-6-(4-フェノキシフェノキシ)ピリミジン-5-イル)-5, 6-ジヒドロピリジン-1(2H)-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 2 8 0	N-(4-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)アクリルアミド
A 2 8 1	N-(4-(4-(4-フェノキシフェノキシ)ピリジン-3-イル)フェニル)アクリルアミド
A 2 8 2	(E)-4-(ジメチルアミノ)-N-(3-(4-(4-フェノキシフェノキシ)ピリジン-3-イル)フェニル)ブト-2-エナミド
A 2 8 3	N-(3-(4-((4-フェノキシフェニル)アミノ)ピリミジン-5-イル)フェニル)アクリルアミド
A 2 8 4	1-(3-((5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)ピペリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン
A 2 8 5	N-(3-((6-アミノ-5-(4-(ピロリジン-1-カルボニル)フェニル)ピリミジン-4-イル)オキシ)フェニル)アクリルアミド
A 2 8 6	1-(3-((6-アミノ-5-(4-フェノキシフェニル)ピリミジン-4-イル)アミノ)メチル)ピペリジン-1-イル)プロプ-2-エン-1-オン

【表 1 - 17】

A 2 8 7	N- (4- (4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-3-イル) ベンジル) アクリルアミド
A 2 8 8	1- (4'- (4-フェノキシフェノキシ) -5, 6-ジヒドロ- [3, 3'-ビピリジン] -1 (2H) -イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 2 8 9	N- (3- ((6-アミノ-5- (4-イソプロポキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 2 9 0	(E) -N- (4- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) フェニル) -4- (ジメチルアミノ) ブト-2-エナミド
A 2 9 1	N- (3- ((6-アミノ-5- (5-メトキシピリジン-3-イル) ピリミジン-4-イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 2 9 2	1- (4- ((6-アミノ-5- (4- (ベンジルオキシ) フェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピペリジン-1-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 2 9 3	(E) -4-モルホリノ-N- (3- (4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-3-イル) フェニル) ブト-2-エナミド
A 2 9 4	N- (3- ((6-アミノ-5- (4- (ベンジルオキシ) -2, 6-ジフルオロフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 2 9 5	(E) -N- (3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) フェニル) -4- (4- (5- ((4S) -2-オキソヘキサヒドロ-1H-チエノ [3, 4-d] イミダゾール-4-イル) ペンタノイル) ピペラジン-1-イル) ブト-2-エナミド
A 2 9 6	N- (3- (4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-3-イル) フェニル) ブト-2-イナミド
A 2 9 7	N- (4- ((3- (4-フェノキシフェニル) ピリジン-4-イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 2 9 8	N- (1- (6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) ピペリジン-3-イル) アクリルアミド
A 2 9 9	1- (4- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) ピペリジン-1-イル) プロプ-2-エン-1-オン
A 3 0 0	3- (3-アミノフェニル) -4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-2-アミン
A 3 0 1	(E) -N- (3- (4-アミノ-6- (4-フェノキシフェノキシ) ピリミジン-5-イル) フェニル) -4- (3, 3-ジフルオロピペリジン-1-イル) ブト-2-エナミド
A 3 0 2	N- (3- (4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-3-イル) ベンジル) アクリルアミド
A 3 0 3	6- (4-アミノフェノキシ) -5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-アミン
A 3 0 4	N- (3- (4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-3-イル) ベンジル) ブト-2-イナミド
A 3 0 5	6- (3-アミノフェノキシ) -5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-アミン
A 3 0 6	N- (3- (2-アミノ-4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリミジン-5-イル) フェニル) アクリルアミド
A 3 0 7	(E) -N- (3- (4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-3-イル) フェニル) ブト-2-エナミド

【表 1 - 18】

A 3 0 8	N- (4- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) フェニル) プロピオンアミド
A 3 0 9	N- ((1- (6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) ピペリジン-3-イル) メチル) アクリルアミド
A 3 1 0	N- (3- (2-アミノ-4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-3-イル) フェニル) プロピオンアミド
A 3 1 1	(R) -N- (3- (4-アミノ-6- ((1-フェニルエチル) アミノ) ピリミジン-5-イル) フェニル) アクリルアミド
A 3 1 2	3- (4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-3-イル) アニリン
A 3 1 3	4- (3-アミノフェノキシ) -3- (4-フェノキシフェニル) ピリジン-2-アミン
A 3 1 4	4- (4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-3-イル) アニリン
A 3 1 5	(4- (4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-3-イル) フェニル) メタンアミン
A 3 1 6	(3- (4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-3-イル) フェニル) メタンアミン
A 3 1 7	5- (3-アミノフェニル) -6- (4-フェノキシフェノキシ) ピリミジン-4-アミン
A 3 1 8	N- (3- ((3- (4-フェノキシフェニル) ピリジン-4-イル) オキシ) フェニル) プロピオンアミド
A 3 1 9	N- (3- (4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-3-イル) フェニル) プロピオンアミド
A 3 2 0	N- (4- (4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-3-イル) フェニル) プロピオンアミド
A 3 2 1	N- (4- ((3- (4-フェノキシフェニル) ピリジン-4-イル) オキシ) フェニル) プロピオンアミド
A 3 2 2	N- (3- (4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-3-イル) フェニル) メタクリルアミド
A 3 2 3	N- (3- (4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-3-イル) ベンジル) プロピオンアミド
A 3 2 4	N- (4- (4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-3-イル) ベンジル) プロピオンアミド
A 3 2 5	N- (3- (4-アミノ-6- (4-フェノキシフェノキシ) ピリミジン-5-イル) フェニル) プロピオンアミド
A 3 2 6	N- (3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) フェニル) プロピオンアミド
A 3 2 7	(E) -N- (3- (4- (4-フェノキシフェノキシ) ピリジン-3-イル) ベンジル) ブト-2-エナミド
A 3 2 8	3- (4-フェノキシフェニル) -4- (3-プロピオンアミドフェノキシ) ピコリンアミド
A 3 2 9	N- (3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) フェニル) -1-シアノシクロプロパンカルボキサミド
A 3 3 0	N- (3- (4-アミノ-6- (4-フェノキシフェノキシ) ピリミジン-5-イル) フェニル) -1-シアノシクロプロパンカルボキサミド
A 3 3 1	(E) -3- (7- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) ナフタレン-2-イル) -N, N-ジメチルアクリルアミド

【表 1 - 19】

A 3 3 2	1- (4- (1- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) エチル) ピペリジン-1-イル) プロブ-2-エン-1-オン
A 3 3 3	1- (4- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピペリジン-1-イル) プロパン-1-オン
A 3 3 4	1- (4- (((5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピペリジン-1-イル) プロブ-2-エン-1-オン
A 3 3 5	1- (4- (((6-アミノ-5- (4- (ピリジン-2-イルオキシ) フェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピペリジン-1-イル) プロブ-2-エン-1-オン
A 3 3 6	1- (4- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) ピペリジン-1-イル) ブト-2-イン-1-オン
A 3 3 7	N 4- ((1- (6-クロロピリジン-2-イル) ピペリジン-4-イル) メチル) -5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4, 6-ジアミン
A 3 3 8	1- (4- (((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) メチル) ピペリジン-1-イル) プロブ-2-エン-1-オン
A 3 3 9	N- (3- ((6-アミノ-5- (4- (ベンジルオキシ) -2, 5-ジフルオロフェニル) ピリミジン-4-イル) オキシ) フェニル) アクリルアミド
A 3 4 0	N- (3- ((2-アミノ-3- (4-フェノキシフェニル) ピリジン-4-イル) オキシ) フェニル) ブト-2-イナミド
A 3 4 1	(R) -1- (3- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) ピロリジン-1-イル) ブト-2-イン-1-オン
A 3 4 2	N- [3- [6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) -ピリミジン-4-イルオキシ] -フェニル] -2-クロロアセトアミド
A 3 4 3	N- (3- [6-アミノ-5- [4- (2-フルオロベンジルオキシ) -フェニル] -ピリミジン-4-イルオキシ] -フェニル) -アクリルアミド
A 3 4 4	N- (3- [6-アミノ-5- [4- (4-フルオロベンジルオキシ) -フェニル] -ピリミジン-4-イルオキシ] -フェニル) -アクリルアミド
A 3 4 5	N- (3- [6-アミノ-5- [4- (3-フルオロベンジルオキシ) -フェニル] -ピリミジン-4-イルオキシ] -フェニル) -2-クロロアセトアミド
A 3 4 6	N- [3- [6-アミノ-5- (4-ベンジルオキシフェニル) -ピリミジン-4-イルオキシ] -フェニル] -プロピオンアミド
A 3 4 7	N- [3- [6-アミノ-5- (4-ベンジルオキシフェニル) -ピリミジン-4-イルオキシ] -フェニル] -2-クロロアセトアミド
A 3 4 8	N- [3- [6-アミノ-5- (4-ベンジルオキシ-3-フルオロフェニル) -ピリミジン-4-イルオキシ] -フェニル] -アクリルアミド
A 3 4 9	N- [3- [6-アミノ-5- (4-ベンジルオキシ-2-フルオロフェニル) -ピリミジン-4-イルオキシ] -フェニル] -アクリルアミド
A 3 5 0	N- [3- (6-アミノ-5- (4-ベンジルオキシ-2-フルオロフェニル) -ピリミジン-4-イルオキシ] -フェニル] -2-クロロアセトアミド
A 3 5 1	N- [3- [6-アミノ-5- (4-ベンジルオキシ-3-フルオロフェニル) -ピリミジン-4-イルオキシ] -フェニル] -2-クロロアセトアミド
A 3 5 2	N- [4- [4- (3-アクリロイルアミノフェノキシ) -6-アミノピリミジン-5-イル] -フェニル] -ベンズアミド

から選択される化合物である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記化合物が、N- [(1-アクリロイルピペリジン-4-イル) メチル] -5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4, 6-ジアミン (1) 及び 1- (4- ((6-アミノ-5- (4-フェノキシフェニル) ピリミジン-4-イル) アミノ) メチル) -4-フルオロピペリジン-1-イル) プロブ-2-エン-1-オン (2) から選択される、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2】

前記 MS が、再発型 MS (RMS)、再発寛解型 MS (RRMS)、進行型 MS (PM S)、二次性進行型 MS (SPMS)、一次性進行型 MS (PPMS)、及び進行再発型 MS (PRMS) から選択される、請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3】

賦形剤及び / 又は補助剤を含む、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

少なくとも一つのさらなる医薬活性成分を含む、請求項 1 ~ 1 3 のいずれか一項に記載の医薬組成物。