

【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23年3月31日 (2011.3.31)

【公表番号】特表2010-500994(P2010-500994A)

【公表日】平成22年1月14日 (2010.1.14)

【年通号数】公開・登録公報2010-002

【出願番号】特願2009-524671(P2009-524671)

【国際特許分類】

C 0 7 D 241/44 (2006.01)

A 6 1 K 31/498 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4985 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 409/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 403/14 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 241/44 C S P

A 6 1 K 31/498

C 0 7 D 403/12

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 487/04 1 4 7

A 6 1 K 31/4985

C 0 7 D 487/04 1 4 4

C 0 7 D 403/04

C 0 7 D 409/12

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 417/12

C 0 7 D 403/14

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 471/04 1 1 1

A 6 1 K 31/551

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成23年2月14日 (2011.2.14)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】 0 2 9 1

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【 0 2 9 1 】

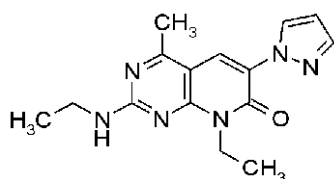
【 化 4 4 】

## 実施例

## 構造

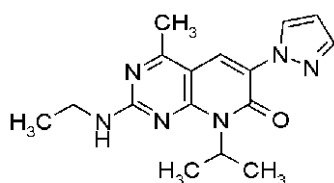
## 名前

88



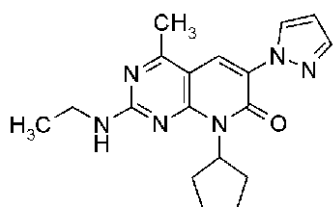
8-エチル-2-(エチルアミノ)-4-メチル-  
6-(1*H*ピラゾール-1-イル)ピリド[2,3-*d*]  
ピリミジン-7(8*H*)-オン

89



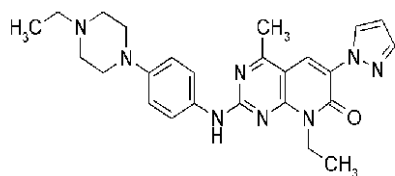
2-(エチルアミノ)-4-メチル-8-(1-メチル  
エチル)-6-(1*H*ピラゾール-1-イル)ピリ  
ド[2,3-*d*]ピリミジン-7(8*H*)-オン

90



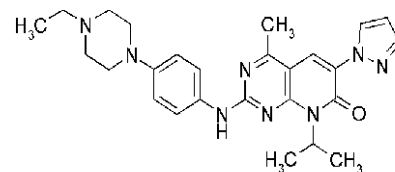
8-シクロペンチル-2-(エチルアミノ)-4-  
メチル-6-(1*H*ピラゾール-1-イル)ピリ  
ド[2,3-*d*]ピリミジン-7(8*H*)-オン

91



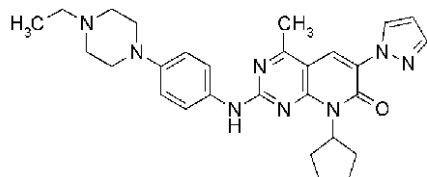
8-エチル-2-[[4-(4-エチルピペラジン-  
1-イル)フェニル]アミノ]-4-メチル-6-  
(1*H*ピラゾール-1-イル)ピリド[2,3-*d*]ピ  
リミジン-7(8*H*)-オン

92



2-[[4-(4-エチルピペラジン-1-  
イル)フェニル]アミノ]-4-メチル-8-(1-メ  
チルエチル)-6-(1*H*ピラゾール-1-イ  
ル)ピリド[2,3-*d*]ピリミジン-7(8*H*)-オン

93



8-シクロペンチル-2-[[4-(4-エチルピ  
ペラジン-1-イル)フェニル]アミノ]-4-メチ  
ル-6-(1*H*ピラゾール-1-イル)ピリド  
[2,3-*d*]ピリミジン-7(8*H*)-オン

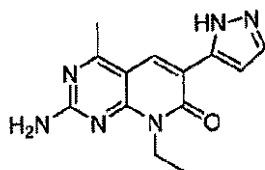
## 【化 4 5】

## 実施例

## 構造

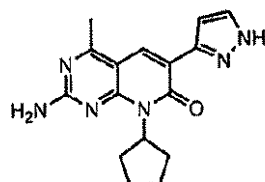
## 名前

94



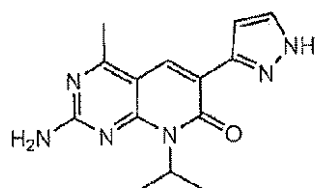
2-アミノ-8-エチル-4-メチル-  
6-(1H-ピラゾール-5-イル)ピリ  
ド[2, 3-d]ピリミジン-7(8H)-オ  
ン

95



2-アミノ-8-シクロペンチル-4-メ  
チル-6-(1H-ピラゾール-3-イル  
)ピリド[2, 3-d]ピリミジン-7(8H)  
-オン

96



2-アミノ-4-メチル-8-(1-メチ  
ルエチル)-6-(1H-ピラゾール-3  
-イル)ピリド[2, 3-d]ピリミジン-7(  
8H)-オン

本発明の一実施形態において、P I 3 K 阻害剤は、P I 3 K 結合親和性が約 9  $\mu$  M 以下である表 1 の化合物から選択される。他の実施形態では、P I 3 K 阻害剤は、P I 3 K 結合親和性が約 5  $\mu$  M 以下である表 1 の化合物から選択される。他の実施形態では、P I 3 K 阻害剤は、P I 3 K 結合親和性が約 3  $\mu$  M 以下である表 1 の化合物から選択される。P I 3 K 阻害剤は、P I 3 K 結合親和性が約 1 . 5  $\mu$  M 以下である表 1 の化合物から選択される。他の実施形態では、P I 3 K 阻害剤は、P I 3 K 結合親和性が約 1  $\mu$  M 以下である表 1 の化合物から選択される。他の実施形態では、P I 3 K 阻害剤は、P I 3 K 結合親和性が約 0 . 6  $\mu$  M 以下である表 1 の化合物から選択される。他の実施形態では、P I 3 K 阻害剤は、P I 3 K 結合親和性が約 0 . 3  $\mu$  M 以下である表 1 の化合物から選択される。他の実施形態では、P I 3 K 阻害剤は、P I 3 K 結合親和性が約 0 . 2  $\mu$  M 以下である表 1 の化合物から選択される。他の実施形態では、P I 3 K 阻害剤は、P I 3 K 結合親和性が約 0 . 1  $\mu$  M 以下である表 1 の化合物から選択される。他の実施形態では、P I 3 K 阻害剤は、P I 3 K 結合親和性が約 0 . 0 4  $\mu$  M 以下である表 1 の化合物から選択される。他の実施形態では、P I 3 K 阻害剤は、P I 3 K 結合親和性が約 0 . 0 2 0  $\mu$  M 以下である表 1 の化合物から選択される。