

【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 07 D 241/44	(2006.01)
A 61 K 31/498	(2006.01)
C 07 D 403/12	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
C 07 D 487/04	(2006.01)
A 61 K 31/4985	(2006.01)
C 07 D 403/04	(2006.01)
C 07 D 409/12	(2006.01)
C 07 D 405/12	(2006.01)
C 07 D 417/12	(2006.01)
C 07 D 403/14	(2006.01)
C 07 D 401/12	(2006.01)
C 07 D 413/12	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)
A 61 K 31/551	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 241/44	C S P
A 61 K 31/498	
C 07 D 403/12	
A 61 K 31/5377	
C 07 D 487/04	1 4 7
A 61 K 31/4985	
C 07 D 487/04	1 4 4
C 07 D 403/04	
C 07 D 409/12	
C 07 D 405/12	
C 07 D 417/12	
C 07 D 403/14	
C 07 D 401/12	
C 07 D 413/12	
C 07 D 471/04	1 1 1
A 61 K 31/551	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 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】

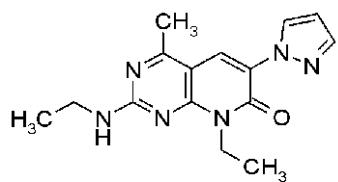
【化 4 4】

## 実施例

## 構造

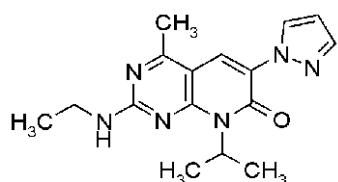
## 名前

88



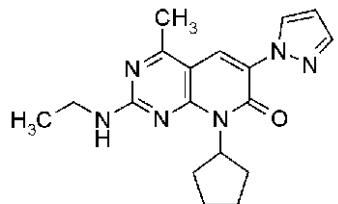
8-エチル-2-(エチルアミノ)-4-メチル-  
6-(1H-ピラゾール-1-イル)ピリド[2,3-d]  
ピリミジン-7(8H)-オン

89



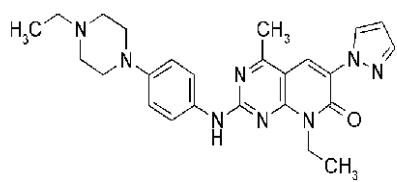
2-(エチルアミノ)-4-メチル-8-(1-メチル  
エチル)-6-(1H-ピラゾール-1-イル)ピリ  
ド[2,3-d]ピリミジン-7(8H)-オン

90



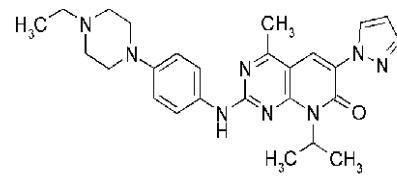
8-シクロペンチル-2-(エチルアミノ)-4-  
メチル-6-(1H-ピラゾール-1-イル)ピリ  
ド[2,3-d]ピリミジン-7(8H)-オン

91



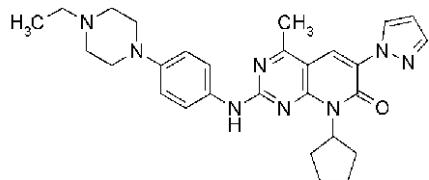
8-エチル-2-[(4-(4-エチルピペラジン-  
1-イル)フェニル)アミノ]-4-メチル-6-  
(1H-ピラゾール-1-イル)ピリド[2,3-d]ピ  
リミジン-7(8H)-オン

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-(1H-ピラゾール-1-イル)ピリ  
ド[2,3-d]ピリミジン-7(8H)-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-(1H-ピラゾール-1-イル)ピリド  
[2,3-d]ピリミジン-7(8H)-オン

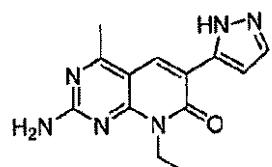
## 【化45】

## 実施例

## 構造

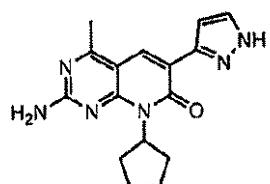
## 名前

94



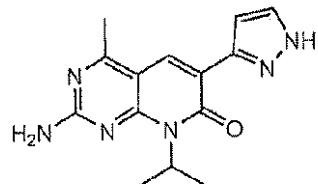
2-アミノ-8-エチル-4-メチル-6-(1H-ピラゾール-5-イル)ピリド[2, 3-d]ピリミジン-7(8H)-オーン

95



2-アミノ-8-シクロ pentyl-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)-オーン

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)-オーン

本発明の一実施形態において、PI3K阻害剤は、PI3K結合親和性が約9μM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、PI3K阻害剤は、PI3K結合親和性が約5μM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、PI3K阻害剤は、PI3K結合親和性が約3μM以下である表1の化合物から選択される。PI3K阻害剤は、PI3K結合親和性が約1.5μM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、PI3K阻害剤は、PI3K結合親和性が約1μM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、PI3K阻害剤は、PI3K結合親和性が約0.6μM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、PI3K阻害剤は、PI3K結合親和性が約0.3μM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、PI3K阻害剤は、PI3K結合親和性が約0.2μM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、PI3K阻害剤は、PI3K結合親和性が約0.1μM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、PI3K阻害剤は、PI3K結合親和性が約0.04μM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、PI3K阻害剤は、PI3K結合親和性が約0.020μM以下である表1の化合物から選択される。