

【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20年9月4日(2008.9.4)

【公表番号】特表2008-506708(P2008-506708A)

【公表日】平成20年3月6日(2008.3.6)

【年通号数】公開・登録公報2008-009

【出願番号】特願2007-521673(P2007-521673)

【国際特許分類】

C 07 D 471/04 (2006.01)

A 61 K 31/519 (2006.01)

A 61 K 31/5377 (2006.01)

A 61 P 31/18 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 37/02 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 17/06 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 7/06 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

【F I】

C 07 D 471/04 1 1 8 Z

C 07 D 471/04 C S P

A 61 K 31/519

A 61 K 31/5377

A 61 P 31/18

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 3/10

A 61 P 35/00

A 61 P 37/02

A 61 P 29/00 1 0 1

A 61 P 17/06

A 61 P 25/00

A 61 P 7/06

A 61 P 13/12

【手続補正書】

【提出日】平成20年7月14日(2008.7.14)

【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

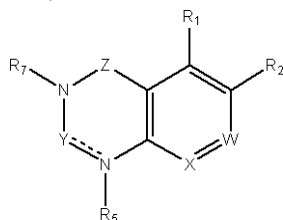
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式：

【化 1】



(式中：

Wは、 CR_3 およびNからなる群から選択され；

Xは、 CR_4 およびNからなる群から選択され；

Yは、CO、CS、SO、 SO_2 、 CR_6R_6' および $C=NR_6$ からなる群から選択され；

Zは、CO、CS、SO、 SO_2 および $C=NR_6$ からなる群から選択され；

R_1 は、それぞれ置換または無置換の、 (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール、ヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリール、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルケニル、アルキニル、カルボニル基、シアノ、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基からなる群から選択され；

R_2 は、アミノ (C_{1-6}) アルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリール、ヘテロアリールおよびシアノからなる群から選択され；

R_3 は、それぞれ置換または無置換の、水素、ハロ、パーハロ (C_{1-10}) アルキル、アミノ、ニトロ、シアノ、チオ、スルホンアミド、 (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール、ヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリール、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、 (C_{1-10}) アルキルアミノ、アミノ (C_{1-10}) アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基からなる群から選択されるか、あるいは、 R_2 および R_3 は、一緒になって、環を形成し；

R_4 は、それぞれ置換または無置換の、水素、ハロ、パーハロ (C_{1-10}) アルキル、アミノ、ニトロ、シアノ、チオ、スルホンアミド、 (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール、ヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリール、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニルアミノ、イミノ (C_{1-3}) アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基からなる群から選択されるか、あるいは、式中、 R_3 および R_4 は、一緒になって、環を形成し；

R_5 および R_7 は、それぞれ置換または無置換の、水素、ハロ (C_{1-10}) アルキル、アミノ、ニトロ、チオ、スルホンアミド、 (C_{1-10}) アルキル、 (C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、アリール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール (C_{1-5}) アルキル、 (C_{9-12}) ビシクロアリール、ヘテロ $(C$

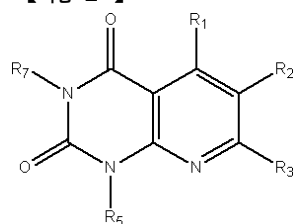
4 - 1 2) ビシクロアリール、(C₃ - 1 2) シクロアルキル (C₁ - 1 0) アルキル、カルボニル (C₁ - 3) アルキル、チオカルボニル (C₁ - 3) アルキル、スルホニル (C₁ - 3) アルキル、スルフィニル (C₁ - 3) アルキル、イミノ (C₁ - 3) アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基からなる群から独立して選択されるか、あるいはNが結合して二重結合の部分を形成する場合、R₅は不在であり；ならびに

R₆ および R₆ ' は、それぞれ置換または無置換の、水素、アミノ、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、ビシクロアリールおよびヘテロビシクロアリールからなる群からそれぞれ独立して選択されるか、あるいは、式中、R₅ および R₆ は、一緒になって、環を形成し、ただし、Yが二重結合の部分を形成する場合、R₆ ' は不在である。) を包含する化合物。

【請求項 2】

式：

【化 2】



(式中：

R₁ が、それぞれ置換または無置換の、(C₁ - 1 0) アルキル、(C₃ - 1 2) シクロアルキル、ヘテロ (C₃ - 1 2) シクロアルキル、アリール (C₁ - 1 0) アルキル、ヘテロアリール (C₁ - 5) アルキル、(C₉ - 1 2) ビシクロアリール、ヘテロ (C₄ - 1 2) ビシクロアリール、カルボニル (C₁ - 3) アルキル、チオカルボニル (C₁ - 3) アルキル、スルホニル (C₁ - 3) アルキル、スルフィニル (C₁ - 3) アルキル、イミノ (C₁ - 3) アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルケニル、アルキニル、カルボニル基、シアノ、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基からなる群から選択され；

R₂ が、それぞれ置換または無置換の、アミノ (C₁ - 6) アルキル、ヘテロ (C₃ - 1 2) シクロアルキル、ヘテロ (C₄ - 1 2) ビシクロアリール、ヘテロアリールおよびシアノからなる群から選択され；

R₃ が、それぞれ置換または無置換の、水素、ハロ、パーハロ (C₁ - 1 0) アルキル、アミノ、ニトロ、シアノ、チオ、スルホンアミド、(C₁ - 1 0) アルキル、(C₃ - 1 2) シクロアルキル、ヘテロ (C₃ - 1 2) シクロアルキル、アリール (C₁ - 1 0) アルキル、ヘテロアリール (C₁ - 5) アルキル、(C₉ - 1 2) ビシクロアリール、ヘテロ (C₄ - 1 2) ビシクロアリール、カルボニル (C₁ - 3) アルキル、チオカルボニル (C₁ - 3) アルキル、スルホニル (C₁ - 3) アルキル、スルフィニル (C₁ - 3) アルキル、イミノ (C₁ - 3) アルキル、(C₁ - 1 0) アルキルアミノ、アミノ (C₁ - 1 0) アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基からなる群から選択されるか、あるいは、式中、R₂ および R₃ が、一緒になって、環を形成し；ならびに

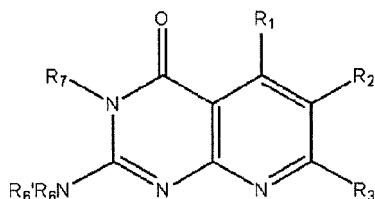
R₅ および R₇ が、それぞれ置換または無置換の、水素、ハロ (C₁ - 1 0) アルキル、アミノ、ニトロ、チオ、スルホンアミド、(C₁ - 1 0) アルキル、(C₃ - 1 2) シクロアルキル、ヘテロ (C₃ - 1 2) シクロアルキル、アリール (C₁ - 1 0) アルキル、ヘテロアリール (C₁ - 5) アルキル、(C₉ - 1 2) ビシクロアリール、ヘテロ (C₄ - 1 2) ビシクロアリール、(C₃ - 1 2) シクロアルキル (C₁ - 1 0) アルキル、

カルボニル (C₁₋₃) アルキル、チオカルボニル (C₁₋₃) アルキル、スルホニル (C₁₋₃) アルキル、スルフィニル (C₁₋₃) アルキル、イミノ (C₁₋₃) アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基からなる群から独立して選択される。) を包含する、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

式：

【化 3】



(式中：

R₁ が、それぞれ置換または無置換の、(C₁₋₁₀) アルキル、(C₃₋₁₂) シクロアルキル、ヘテロ (C₃₋₁₂) シクロアルキル、アリール (C₁₋₁₀) アルキル、ヘテロアリール (C₁₋₅) アルキル、(C₉₋₁₂) ビシクロアリール、ヘテロ (C₄₋₁₂) ビシクロアリール、カルボニル (C₁₋₃) アルキル、チオカルボニル (C₁₋₃) アルキル、スルホニル (C₁₋₃) アルキル、スルフィニル (C₁₋₃) アルキル、イミノ (C₁₋₃) アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルケニル、アルキニル、カルボニル基、シアノ、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基からなる群から選択され；

R₂ が、それぞれ置換または無置換の、アミノ (C₁₋₆) アルキル、ヘテロ (C₃₋₁₂) シクロアルキル、ヘテロ (C₄₋₁₂) ビシクロアリール、ヘテロアリールおよびシアノからなる群から選択され；

R₃ が、それぞれ置換または無置換の、水素、ハロ、パーハロ (C₁₋₁₀) アルキル、アミノ、ニトロ、シアノ、チオ、スルホンアミド、(C₁₋₁₀) アルキル、(C₃₋₁₂) シクロアルキル、ヘテロ (C₃₋₁₂) シクロアルキル、アリール (C₁₋₁₀) アルキル、ヘテロアリール (C₁₋₅) アルキル、(C₉₋₁₂) ビシクロアリール、ヘテロ (C₄₋₁₂) ビシクロアリール、カルボニル (C₁₋₃) アルキル、チオカルボニル (C₁₋₃) アルキル、スルホニル (C₁₋₃) アルキル、スルフィニル (C₁₋₃) アルキル、イミノ (C₁₋₃) アルキル、(C₁₋₁₀) アルキルアミノ、アミノ (C₁₋₁₀) アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基からなる群から選択されるか、あるいは、R₂ および R₃ が、一緒になって、環を形成し；

R₆ および R₆' が、それぞれ置換または無置換の、水素、アミノ、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、ビシクロアリールおよびヘテロビシクロアリールからなる群からそれぞれ独立して選択され；ならびに

R₇ が、それぞれ置換または無置換の、水素、ハロ (C₁₋₁₀) アルキル、アミノ、ニトロ、チオ、スルホンアミド、(C₁₋₁₀) アルキル、(C₃₋₁₂) シクロアルキル、ヘテロ (C₃₋₁₂) シクロアルキル、アリール (C₁₋₁₀) アルキル、ヘテロアリール (C₁₋₅) アルキル、(C₉₋₁₂) ビシクロアリール、ヘテロ (C₄₋₁₂) ビシクロアリール、(C₃₋₁₂) シクロアルキル (C₁₋₁₀) アルキル、カルボニル (C₁₋₃) アルキル、チオカルボニル (C₁₋₃) アルキル、スルホニル (C₁₋₃) アルキル、スルフィニル (C₁₋₃) アルキル、イミノ (C₁₋₃) アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基からなる群から選択される)

を包含する、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 4】

請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物であって、
式中：

R_2 が、 $-CR_8R_9NR_{10}R_{11}$ であり；

R_8 および R_9 は、それぞれ置換または無置換の、水素、ハロゲン、パーハロ (C_{1-10}) アルキル、シアノ、ニトロ、アルキル、シクロアルキル、アルケン、アルキン、アリーールおよびヘテロアリーールからなる群からそれぞれ独立して選択されるか、あるいは、式中、 R_8 および R_9 は、一緒になって、置換または無置換の環を形成し；ならびに

R_{10} および R_{11} は、それぞれ置換または無置換の、水素、パーハロ (C_{1-10}) アルキル、アミノ、チオ、(C_{1-10}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、アリーール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリーール (C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリーール、ヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリーール、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリーールオキシ、ヘテロアリーールオキシおよびイミノ基からなる群から独立して選択されるか、あるいは、 R_{10} および R_{11} は、一緒になって、環を形成する、化合物。

【請求項 5】

R_2 および R_3 が、一緒になって、環を形成する、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

R_2 および R_3 が一緒になって形成される環が、置換または無置換の 5 もしくは 6 員環である、請求項 5 記載の化合物。

【請求項 7】

R_2 および R_3 が一緒になって形成される環が、置換または無置換の、シクロアルキル、ビシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、(C_{9-12}) ビシクロアリーールもしくはヘテロ (C_{8-12}) ビシクロアリーールである、請求項 5 記載の化合物。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物であって、
式中：

R_3 が、 $-NR_{12}R_{13}$ であり；ならびに

R_{12} および R_{13} が、それぞれ置換または無置換の、水素、パーハロ (C_{1-10}) アルキル、アミノ、チオ、(C_{1-10}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ (C_{3-12}) シクロアルキル、アリーール (C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリーール (C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリーール、ヘテロ (C_{4-12}) ビシクロアリーール、カルボニル (C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル (C_{1-3}) アルキル、スルホニル (C_{1-3}) アルキル、スルフィニル (C_{1-3}) アルキル、イミノ (C_{1-3}) アルキル、アリーール、ヘテロアリーール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリーールオキシ、ヘテロアリーールオキシおよびイミノ基からなる群からそれぞれ独立して選択されるか、あるいは、 R_{12} および R_{13} が、一緒になって、環を形成する、化合物。

【請求項 9】

R_{12} および R_{13} が、一緒になって、環を形成する、請求項 8 記載の化合物。

【請求項 10】

R_{12} および R_{13} が一緒になって形成される環が、置換または無置換の 3、4、5 もしくは 6 員環である、請求項 9 記載の化合物。

【請求項 11】

R_{12} および R_{13} が一緒になって形成される環が、置換または無置換の、ヘテロシクロアルキル、ヘテロビシクロアルキル、アリーール、ヘテロアリーールもしくはヘテロ (C_{8-12})

12) ビシクロアリールである、請求項9記載の化合物。

【請求項12】

R_3 および R_4 が、一緒になって、環を形成する、請求項1および4～7のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項13】

R_3 および R_4 が一緒になって形成される環が、置換または無置換の5もしくは6員環である、請求項12記載の化合物。

【請求項14】

R_3 および R_4 が一緒になって形成される環が、置換または無置換の、シクロアルキル、ビシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、(C_{9-12}) ビシクロアリールもしくはヘテロ(C_{8-12}) ビシクロアリールである、請求項12記載の化合物。

【請求項15】

R_1 が、置換または無置換の(C_{3-7}) シクロアルキルである、請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項16】

R_1 が、置換または無置換の(C_{3-7}) ヘテロシクロアルキルである、請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項17】

R_1 が、置換または無置換のアリールである、請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項18】

R_1 が、置換または無置換のフェニルである、請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物。

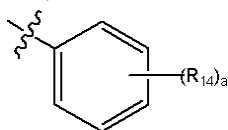
【請求項19】

R_1 が、置換または無置換のヘテロアリールである、請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項20】

R_1 が、

【化4】



(式中：

A は、0、1、2、3、4または5であり；ならびに

R_{14} は、それぞれ置換または無置換の、水素、ハロ、パーハロ(C_{1-10}) アルキル、アミノ、ニトロ、シアノ、チオ、スルホンアミド、(C_{1-10}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12}) シクロアルキル、アリール(C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリール、ヘテロ(C_{4-12}) ビシクロアリール、カルボニル(C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル(C_{1-3}) アルキル、スルホニル(C_{1-3}) アルキル、スルフィニル(C_{1-3}) アルキル、イミノ(C_{1-3}) アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基からなる群から選択される)である、請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項21】

R_1 が、環の2位もしくは3位に、水素でない置換基を有する環を持つ環状基である、請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物。

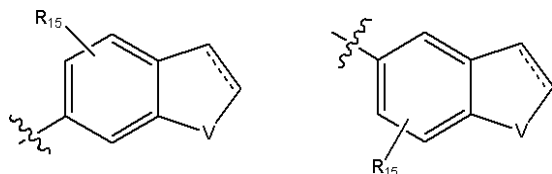
【請求項 2 2】

R_1 が、環の 2 位もしくは 3 位に、それぞれ置換または無置換の、(C_{1-10}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12}) シクロアルキル、アリール(C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリール、ヘテロ(C_{4-12}) ビシクロアリール、カルボニル(C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル(C_{1-3}) アルキル、スルホニル(C_{1-3}) アルキル、スルフィニル(C_{1-3}) アルキル、イミノ(C_{1-3}) アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、シアノ、ニトロ、ハロ、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基からなる群から選択される、水素でない置換基を有する環を持つ環状基である、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 3】

R_1 が、：

【化 5】



(式中：

V は、 S 、 O および NR_{16} からなる群から選択され；

R_{15} は、それぞれ置換または無置換の、水素、ハロ、パーハロ(C_{1-10}) アルキル、アミノ、ニトロ、シアノ、チオ、スルホンアミド、(C_{1-10}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12}) シクロアルキル、アリール(C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリール、ヘテロ(C_{4-12}) ビシクロアリール、カルボニル(C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル(C_{1-3}) アルキル、スルホニル(C_{1-3}) アルキル、スルフィニル(C_{1-3}) アルキル、イミノ(C_{1-3}) アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基からなる群から選択され；ならびに

R_{16} は、それぞれ置換または無置換の、水素、パーハロ(C_{1-10}) アルキル、アミノ、(C_{1-10}) アルキル、(C_{3-12}) シクロアルキル、ヘテロ(C_{3-12}) シクロアルキル、アリール(C_{1-10}) アルキル、ヘテロアリール(C_{1-5}) アルキル、(C_{9-12}) ビシクロアリール、ヘテロ(C_{8-12}) ビシクロアリール、カルボニル(C_{1-3}) アルキル、チオカルボニル(C_{1-3}) アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、イミノ基、カルボニル基、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニルおよびスルフィニル基からなる群から選択される) からなる群から選択される、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 4】

R_1 が、置換または無置換の、ハロフェニルもしくはジハロフェニルである、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 5】

R_1 が、置換または無置換の、ハロアリール、ハロヘテロアリール、ジハロアリールもしくはジハロヘテロアリールである、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 6】

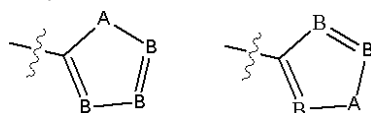
R_1 が、それぞれ置換または無置換の、(2-シアノ)フェニル；(3-シアノ)フェニル；(2-ヒドロキシ)フェニル；(3-ヒドロキシ)フェニル；(2-アルケニル)フェニル；(3-アルケニル)フェニル；(2-アルキニル)フェニル；(3-アルキニル)フェニル；

フェニル；(2-メトキシ)フェニル；(3-メトキシ)フェニル；(2-ニトロ)フェニル；(3-ニトロ)フェニル；(2-カルボキシ)フェニル；(3-カルボキシ)フェニル；-(CH₂)-(2-カルボキサミド)フェニル；(3-カルボキサミド)フェニル；(2-スルホンアミド)フェニル；(3-スルホンアミド)フェニル；(2-テトラゾリル)フェニル；(3-テトラゾリル)フェニル；(2-アミノメチル)フェニル；(3-アミノメチル)フェニル；(2-ヒドロキシメチル)フェニル；(3-ヒドロキシメチル)フェニル；(2-フェニル)フェニル；(3-フェニル)フェニル；(2-ハロ)フェニル；(3-ハロ)フェニル；(2-CONH₂)フェニル；(3-CONH₂)フェニル；(2-CONH(C₁₋₇)アルキル)フェニル；(3-CONH(C₁₋₇)アルキル)フェニル；(2-CO₂(C₁₋₇)アルキル)フェニル；(3-CO₂(C₁₋₇)アルキル)フェニル；(2-NH₂)フェニル；(3-NH₂)フェニル；(2-(C₃₋₇)アルキル)フェニル；(3-(C₃₋₇)アルキル)フェニル；(2-(C₃₋₇)シクロアルキル)フェニル；(3-(C₃₋₇)シクロアルキル)フェニル；(2-アリール)フェニル；(3-アリール)フェニル；(2-ヘテロアリール)フェニル；(3-ヘテロアリール)フェニル；2-ブromo-5-フルオロフェニル；2-クロロ-5-フルオロフェニル；2-シアノ-5-フルオロフェニル；2,5-ジクロロフェニル；2,5-ジフルオロフェニル；2,5-ジブromoフェニル；2-ブromo-3,5-ジフルオロフェニル；2-クロロ-3,5-ジフルオロフェニル；2,3,5-トリフルオロフェニル；2,3,5,6-テトラフルオロフェニル；2-ブromo-3,5,6-トリフルオロフェニル；2-クロロ-3,5,6-トリフルオロフェニル；2-シアノ-3,5-ジフルオロフェニル；2-シアノ-3,5,6-トリフルオロフェニル；(2-ヘテロシクロアルキル)フェニル；および(3-ヘテロシクロアルキル)フェニルからなる群から選択される、請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項27】

R₁が、

【化6】



(式中：

Aは、S、OまたはNR₁₋₇であり；

Bは、CR₁₋₈またはNであり；

R₁₋₇は、それぞれ置換または無置換の、水素、パーハロ(C₁₋₁₀)アルキル、アミノ、(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビスシクロアリール、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビスシクロアリール、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、イミノ基、カルボニル基、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニルおよびスルフィニル基からなる群から独立して選択され；ならびに

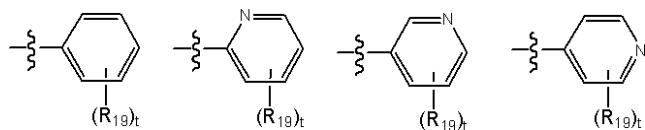
R₁₋₈は、それぞれ置換または無置換の、水素、ハロ、パーハロ(C₁₋₁₀)アルキル、アミノ、チオ、シアノ、CF₃、ニトロ、(C₁₋₁₀)アルキル、(C₃₋₁₂)シクロアルキル、ヘテロ(C₃₋₁₂)シクロアルキル、アリール(C₁₋₁₀)アルキル、ヘテロアリール(C₁₋₅)アルキル、(C₉₋₁₂)ビスシクロアリール、ヘテロ(C₈₋₁₂)ビスシクロアリール、カルボニル(C₁₋₃)アルキル、チオカルボニル(C₁₋₃)アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、イミノ基、カルボニル基、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニルおよびスルフィニル基からなる群から独立して選択され、あるいは、R₁₋₇およびR₁₋₈または二つのR₁₋₈が、一緒に

なって、無置換または置換の環を形成する) からなる群から選択される、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 8】

R₁ が、

【化 7】



(式中：

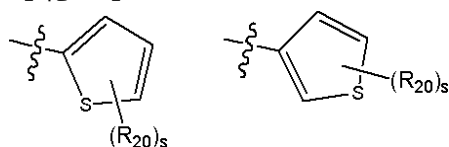
t は、0、1、2、3、4 または 5 であり；ならびに

各 R₁₉ は、それぞれ置換または無置換の、ハロ、パーハロ (C₁ - C₁₀) アルキル、CF₃、(C₁ - C₁₀) アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アミノ、チオ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基からなる群から独立して選択されるか、あるいは、二つの R₁₉ が、一緒になって、無置換または置換の環を形成する) からなる群から選択される、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 9】

R₁ が、

【化 8】



(式中：

s は、0、1、2 または 3 であり；ならびに

各 R₂₀ は、それぞれ置換または無置換の、ハロ、パーハロ (C₁ - C₁₀) アルキル、CF₃、(C₁ - C₁₀) アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アミノスルホニル、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アミノ、チオ、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボニル基、イミノ基、スルホニル基およびスルフィニル基からなる群から独立して選択されるか、あるいは、二つの R₂₀ が、一緒になって、無置換または置換の環を形成する) からなる群から選択される、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 3 0】

R₁ が、ハロ；ヒドロキシ (C₁ - C₆) アルキル；アミノ (C₁ - C₆) アルキル；および (C₁ - C₆) アルコキシからなる群から選択される一以上の置換基で置換されるアリールである、請求項 1 ~ 1 4 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 3 1】

7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (2, 4 - ジクロロ - フェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 2, 4 - ジオン；

7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (2 - ブロモ - 4 - フルオロ - フェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 2, 4 - ジオン；

7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (2 - ブロモ - フェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1

H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 6 - アミノメチル - 5 - (2 , 4 - ジクロロ - フェニル) - 7 - エチルアミノ - 1 , 3 -
 ジメチル - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 6 - アミノメチル - 5 - (2 , 4 - ジクロロ - フェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 7 - メチ
 ルアミノ - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 6 - アミノメチル - 5 - (2 , 4 - ジクロロ - フェニル) - 7 - ジメチルアミノ - 1 , 3
 - ジメチル - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - ヒドロキシ - 5 - (2 - ブロモ - 5 - フルオロ - フェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 2
 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 6 -
 カルボニトリル ;
 6 - アミノメチル - 5 - (2 - ブロモ - 5 - フルオロ - フェニル) - 7 - ヒドロキシ - 1
 , 3 - ジメチル - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 5 - (2 , 5 - ジクロロ - フェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキ
 ソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 6 - カルボニトリ
 ル ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (2 , 5 - ジクロロ - フェニル) - 1 , 3 - ジメチ
 ル - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (2 - ブロモ - 5 - フルオロ - フェニル) - 1 , 3
 - ジメチル - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 1 , 3 - ジメチル - 5 - (3 - メチル - チオフェン - 2
 - イル) - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (2 - クロロ - フェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1
 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (4 - フルオロ - フェニル) - 1 , 3 - ジメチル -
 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - 1 , 3 -
 ジメチル - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (4 - ブロモ - フェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1
 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (2 , 3 - ジクロロ - フェニル) - 1 , 3 - ジメチ
 ル - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (2 - クロロ - 6 - フルオロ - フェニル) - 1 , 3
 - ジメチル - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (3 - メトキシ - フェニル) - 1 , 3 - ジメチル -
 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (2 - メトキシ - フェニル) - 1 , 3 - ジメチル -
 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (2 - クロロ - 3 , 6 - ジフルオロ - フェニル) -
 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - フェニル - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピリド [2 ,
 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (3 - ブロモ - チオフェン - 2 - イル) - 1 , 3 -
 ジメチル - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (2 - クロロ - 5 - フルオロ - フェニル) - 1 , 3
 - ジメチル - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (2 - ブロモ - 5 - フルオロ - フェニル) - 1 , 3
 - ジメチル - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (2 - クロロ - 4 - フルオロ - フェニル) - 1 , 3
 - ジメチル - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - シクロペンチル - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピリド

[2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 1 , 3 - ジメチル - 5 - ピリジン - 3 - イル - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (4 , 5 - ジメチル - チオフェン - 2 - イル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - (5 - フルオロ - 2 - ニトロ - フェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 1 , 3 - ジメチル - 5 - (3 - メチル - 3 H - イミダゾール - 4 - イル) - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 5 - ベンゾ [b] チオフェン - 2 - イル - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - アミノメチル - 1 , 3 - ジメチル - 5 - (3 - メチル - ベンゾ [b] チオフェン - 2 - イル) - 1 H - ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 - ジオン ;
 6 - (アミノメチル) - 5 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 7 - ヒドロキシ - 1 , 3 - ジメチルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン ;
 6 - (アミノメチル) - 7 - クロロ - 5 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 , 3 - ジメチルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - (アミノメチル) - 5 - (2 - クロロ - 5 - フルオロフェニル) - 3 - メチルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - (アミノメチル) - 5 - (2 - (アミノメチル) フェニル) - 1 , 3 - ジメチルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン ;
 2 - (7 - アミノ - 6 - (アミノメチル) - 1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) ベンゾニトリル ;
 7 - アミノ - 5 - (2 - (アミノメチル) フェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 6 - カルボニトリル ;
 6 - (アミノメチル) - 7 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 5 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 , 3 - ジメチルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン ;
 2 - (7 - アミノ - 6 - (アミノメチル) - 1 - イソブチル - 3 - メチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) ベンゾニトリル ;
 6 - (アミノメチル) - 5 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 , 3 - ジメチルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - (アミノメチル) - 5 - (2 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 1 , 3 - ジメチルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - (アミノメチル) - 5 - (2 - クロロ - 5 - フルオロフェニル) - 1 - メチルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン ;
 7 - アミノ - 6 - (アミノメチル) - 5 - (2 - プロモ - 5 - フルオロフェニル) - 1 - メチルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン ;
 2 - (7 - アミノ - 6 - (アミノメチル) - 1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) - 4 - フルオロベンゾニトリル ;
 2 - (6 - (アミノメチル) - 7 - クロロ - 1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) - 4 - フルオロベンゾニトリル ;
 2 - (6 - (アミノメチル) - 1 , 3 , 7 - トリメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) - 4 - フルオロベンゾ

ニトリル；

2 - (6 - (アミノメチル) - 1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 7 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) - 4 - フルオロベンゾニトリル；

2 - (6 - (アミノメチル) - 1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) - 4 - フルオロベンゾニトリル；

2 - (6 - (アミノメチル) - 1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 7 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエチルアミノ) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) - 4 - フルオロベンゾニトリル；

2 - (6 - (アミノメチル) - 1 , 3 - ジメチル - 7 - (メチル (2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) アミノ) - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) - 4 - フルオロベンゾニトリル；

2 - (6 - (アミノメチル) - 7 - (ビス (トリフルオロメチル) アミノ) - 1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) - 4 - フルオロベンゾニトリル；

2 - (6 - (アミノメチル) - 1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 7 , 8 - イミダゾ - [1 , 2 - a] - 1 , 2 , 3 , 4 , 7 , 8 - ヘキサヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) - 5 - クロロベンゾニトリル；

2 - (6 - (アミノメチル) - 3 - (シクロプロピルメチル) - 1 , 7 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) - 5 - クロロベンゾニトリル；

6 - (アミノメチル) - 5 - (4 - クロロ - 2 - メトキシフェニル) - 1 , 3 , 7 - トリメチルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン；

2 - (6 - (アミノメチル) - 7 - メトキシ - 1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) - 5 - クロロベンゾニトリル；

2 - (6 - (アミノメチル) - 1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 7 - (ピロリジン - 1 - イル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) - 5 - クロロベンゾニトリル；

6 - (アミノメチル) - 5 - (5 - フルオロ - 2 - メトキシフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 7 - モルホリノピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン；

N - (6 - (アミノメチル) - 5 - (4 - クロロ - 2 - メトキシフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 7 - イル) メタンスルホンアミド；

2 - (6 - (アミノメチル) - 3 - ベンジル - 7 - メトキシ - 1 - メチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) - 5 - クロロベンゾニトリル；

6 - (アミノメチル) - 3 - ベンジル - 5 - (4 - クロロ - 2 - メトキシフェニル) - 1 - メチル - 7 - (トリフルオロメチル) ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン；

6 - (アミノメチル) - 5 - (3 , 5 - ジフルオロ - 2 - メトキシフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 7 - (トリフルオロメチル) ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン；

6 - (アミノメチル) - 3 - ベンジル - 5 - (2 - クロロ - 3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 1 - メチル - 7 - (トリフルオロメチル) ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン；

6 - (アミノメチル) - 5 - (2 - ブロモ - 3 , 5 - ジフルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 7 - (トリフルオロメチル) ピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 2 , 4 (1 H , 3 H) - ジオン；

6 - (アミノメチル) - 5 - (3, 5 - ジフルオロ - 2 - メトキシフェニル) - 1, 2 - イミダゾ - [1, 2 - a] - 3 - メチル - 7 - (トリフルオロメチル) - 2, 3 - ジヒドロピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 4 (1H) - オン;

6 - (アミノメチル) - 5 - (3, 5 - ジフルオロ - 2 - メトキシフェニル) - 3 - メチル - 2 - (メチルアミノ) - 7 - (トリフルオロメチル) ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 4 (3H) - オン;

2 - アミノ - 6 - (アミノメチル) - 5 - (2 - クロロ - 3, 5 - ジフルオロフェニル) - 3 - メチル - 7 - (トリフルオロメチル) ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 4 (3H) - オン;

2, 7 - ジアミノ - 6 - (1 - アミノエチル) - 5 - (2 - クロロ - 5 - フルオロフェニル) - 3 - メチルピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 4 (3H) - オン;

2 - (6 - (アミノメチル) - 7 - エトキシ - 1, 3 - ジメチル - 2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 5 - イル) - 5 - クロロベンゾニトリル;

6 - (アミノメチル) - 5 - (3, 5 - ジフルオロ - 2 - メトキシフェニル) - 2 - (ジメチルアミノ) - 3 - メチル - 7 - (トリフルオロメチル) ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 4 (3H) - オン;

6 - (アミノメチル) - 7 - (ビス (2, 2 - ジフルオロエチル) アミノ) - 5 - (2 - ブロモ - 5 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチルピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 2, 4 (1H, 3H) - ジオン;

6 - (アミノメチル) - 5 - (2 - ブロモ - 5 - フルオロフェニル) - 7 - (2, 2 - ジフルオロエチルアミノ) - 1, 3 - ジメチルピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 2, 4 (1H, 3H) - ジオン;

5 - (2 - ブロモ - 5 - フルオロフェニル) - 7 - クロロ - 1, 3 - ジメチル - 2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 6 - カルボニトリル;

5 - (2 - ブロモ - 5 - フルオロ - フェニル) - 1, 3 - ジメチル - 7 - モルホリン - 4 - イル - 2, 4 - ジオキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 6 - カルボニトリル;

6 - (アミノメチル) - 5 - (2 - ブロモ - 5 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 7 - モルホリノピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 2, 4 (1H, 3H) - ジオン;

6 - (アミノメチル) - 5 - (2 - ブロモ - 5 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 7 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 2, 4 (1H, 3H) - ジオン;

6 - (アミノメチル) - 5 - (2 - ブロモ - 5 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 7 - (ピリジン - 4 - イルメチルアミノ) ピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 2, 4 (1H, 3H) - ジオン;

6 - (アミノメチル) - 5 - (2 - ブロモ - 5 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 7 - (シクロプロピルアミノ) - 1, 3 - ジメチルピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 2, 4 (1H, 3H) - ジオン;

6 - (アミノメチル) - 5 - (2, 5 - ジクロロ) - 1, 3 - ジメチル - 7 - モルホリノピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 2, 4 (1H, 3H) - ジオン;

7 - アミノ - 6 - (アミノメチル) - 5 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 1 - メチルピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 2, 4 (1H, 3H) - ジオン;

6 - (アミノメチル) - 5 - (2 - ブロモ - 5 - フルオロフェニル) - 7 - (ジエチルアミノ) - 1, 3 - ジメチルピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 2, 4 (1H, 3H) - ジオン;

6 - (アミノメチル) - 5 - (2 - ブロモ - 5 - フルオロフェニル) - 7 - (エチルアミノ) - 1, 3 - ジメチルピリド [2, 3 - d] ピリミジン - 2, 4 (1H, 3H) - ジオン; および

6 - (アミノメチル) - 5 - (2 - プロモ - 5 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 7 - (メチルアミノ)ピリド[2, 3 - d]ピリミジン - 2, 4 (1 H, 3 H) - ジオン :

からなる群から選択される化合物。

【請求項 3 2】

化合物が、医薬的に許容される塩の形態にある、請求項 1 ~ 3 1 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 3 3】

化合物が、立体異性体の混合物で存在する、請求項 1 ~ 3 1 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 3 4】

化合物が、単一の立体異性体を含む、請求項 1 ~ 3 1 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 3 5】

活性成分として、請求項 1 ~ 3 1 のいずれか一項に記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 3 6】

経口投与に適合した固体処方物である、請求項 3 5 記載の医薬組成物。

【請求項 3 7】

錠剤である、請求項 3 5 記載の医薬組成物。

【請求項 3 8】

経口投与に適合した液体処方物である、請求項 3 5 記載の医薬組成物。

【請求項 3 9】

非経口投与に適合した液体処方物である、請求項 3 5 記載の医薬組成物。

【請求項 4 0】

請求項 1 ~ 3 1 のいずれか一項に記載の化合物を含む医薬組成物であって、該組成物が、経口、非経口、腹腔内、静脈内、動脈内、経皮、舌下、筋肉内、経直腸、経口腔、経鼻、リボソーム、吸入、経膈、眼内、局所送達（例えばカテーテルまたはステントによる）、皮下、脂肪内、関節内および鞘内からなる群から選択される経路を通して投与するのに適合している、医薬組成物。

【請求項 4 1】

請求項 1 ~ 3 1 のいずれか一項に記載の化合物；ならびに

該化合物を投与すべき疾患状態の表示、該化合物の保存情報、用量情報および該化合物を投与する方法に関する指示書からなる群から選択される、一種以上の形態の情報を含む指示：

を含む、キット。

【請求項 4 2】

反復投与形態で化合物を含む、請求項 4 1 記載のキット。

【請求項 4 3】

請求項 1 ~ 3 1 のいずれか一項に記載の化合物；および
包装材料：

を含む、製品。

【請求項 4 4】

前記包装材料が、化合物を収納するための容器を含む、請求項 4 3 記載の製品。

【請求項 4 5】

容器が、該化合物を投与すべき疾患状態、保存情報、用量情報および / または該組成物を投与する方法に関する指示書からなる群のうち一種以上のメンバーを示すラベルを含む、請求項 4 3 記載の製品。

【請求項 4 6】

反復投与形態で化合物を含む、請求項 4 3 記載の製品。

【請求項 4 7】

請求項 1 ~ 3 1 のいずれか一項に記載の化合物を含む、D P P - I V 阻害剤。

【請求項 48】

インビボで使用するためのものである請求項 47 記載の D P P - I V 阻害剤。

【請求項 49】

インビボで請求項 1 ~ 31 のいずれか一項に記載の化合物に変換される化合物を含む D P P - I V 阻害剤。

【請求項 50】

請求項 1 ~ 31 のいずれか一項に記載の化合物を含む、D P P - I V が疾患状態の病理および / または兆候に寄与する活性を有する疾患状態の治療剤。

【請求項 51】

疾患が、I 型または I I 型の糖尿病である、請求項 50 記載の治療剤。

【請求項 52】

請求項 1 ~ 31 のいずれか一項に記載の化合物を含む、癌の治療剤。

【請求項 53】

治療される癌が、結腸直腸癌、前立腺癌、乳癌、甲状腺癌、皮膚癌、肺癌または頭頸部癌である、請求項 52 記載の治療剤。

【請求項 54】

請求項 1 ~ 31 のいずれか一項に記載の化合物を含む、自己免疫疾患治療剤。

【請求項 55】

自己免疫疾患が、慢性関節リウマチ、乾癬または多発性硬化症である請求項 54 記載の治療剤。

【請求項 56】

請求項 1 ~ 31 のいずれか一項に記載の化合物を含む、リンパ球または造血細胞の活性化またはその濃度が不適當であることを特徴とする状態の治療剤。

【請求項 57】

該状態が、化学療法または放射線療法の副作用である、請求項 56 記載の治療剤。

【請求項 58】

該状態が、腎不全の結果である、請求項 56 記載の治療剤。

【請求項 59】

該状態が、骨髄障害の結果である、請求項 56 記載の治療剤。

【請求項 60】

請求項 1 ~ 31 のいずれか一項に記載の化合物を含む、H I V 感染の治療剤。

【請求項 61】

請求項 1 ~ 31 のいずれか一項に記載の化合物を含む、免疫不全症状によって特徴づけられる状態の治療剤。