

【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30年10月25日(2018.10.25)

【公表番号】特表2017-529346(P2017-529346A)

【公表日】平成29年10月5日(2017.10.5)

【年通号数】公開・登録公報2017-038

【出願番号】特願2017-514615(P2017-514615)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 1 7 Z

C 0 7 D 471/04 C S P

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/5377

【手続補正書】

【提出日】平成30年9月13日(2018.9.13)

【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

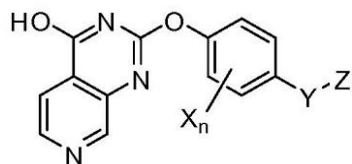
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩であって、

【化 1】



式(I)

式中、

X はハロゲンであり、n は 0 または 1 であり；

Y は、- O -、- S -、- S O₂ -、- C F₂ -、- (C H₂) - N (H) -、- (C H₂) - N (H) - (C = O) -、- (C H₂) - N (C₁ - C₃ アルキル) - (C = O) - であり；および

Z は、アリール、カルボシクリル、またはヘテロシクリルである、式 (I) の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2】

n が 0 である、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 3】

n が 1 であり、X がフルオロである、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4】

Y が - O - である、請求項 1 - 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5】

Y が - S - である、請求項 1 - 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6】

Y が - SO₂ である、請求項 1 - 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 7】

Y が - CF₂ - である、請求項 1 - 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 8】

Y が - (CH₂)N(H)(C=O) - である、請求項 1 - 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 9】

Y が - (CH₂) - N(C₁ - C₃ アルキル) - である、請求項 1 - 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 10】

Z がアリールである、請求項 1 - 9 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 11】

Z が、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、またはカルボシクリルで随意に置換されたフェニルである、請求項 10 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 12】

Z がカルボシクリルである、請求項 1 - 9 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 13】

Z が 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタレニルである、請求項 12 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 14】

Z がヘテロシクリルである、請求項 1 - 9 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

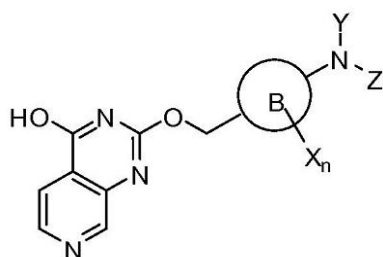
【請求項 15】

Z がクロマニルである、請求項 14 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 16】

式 (II) の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩であって、

【化 2】



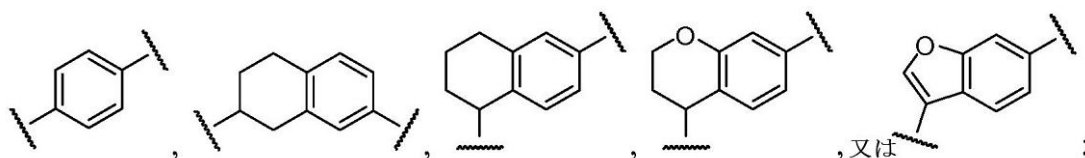
式(II)

式中、

X はハロゲンであり、n は 0 または 1 であり；

環 B は以下から選択され：

【化 3】



Y は $C_1 - C_3$ アルキルであり；

Z は、アリールまたはヘテロアリールである、式 (I I) の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 17】

n が 0 である、請求項 16 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 18】

n が 1 であり、X がフルオロである、請求項 16 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 19】

Y が C_1 アルキルである、請求項 16 - 18 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

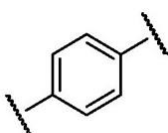
【請求項 20】

Y が C_2 アルキルである、請求項 16 - 18 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 21】

環 B が、

【化 4】

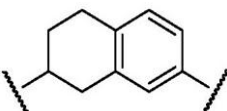


である、請求項 16 - 20 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 22】

環 B が、

【化 5】

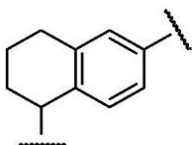


である、請求項 16 - 20 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 23】

環 B が、

【化 6】

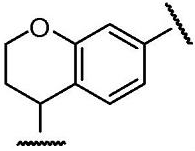


である、請求項 16 - 20 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 24】

環 B が、

【化 7】

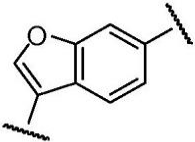


である、請求項 16 - 20 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 25】

環 B が、

【化 8】



である、請求項 16 - 20 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 26】

Z がアリールである、請求項 16 - 25 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 27】

Z が、アルキル、 $-(C=O)N(R^a)_2$ 、ヘテロアリール、またはヘテロシクリルで随意に置換されたフェニルであり；ここで、各 R^a が、独立して水素または $C_1 - C_3$ アルキルである、請求項 26 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

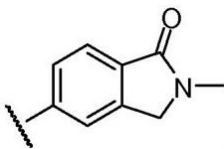
【請求項 28】

Z がヘテロアリールである、請求項 16 - 25 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 29】

Z が、

【化 9】

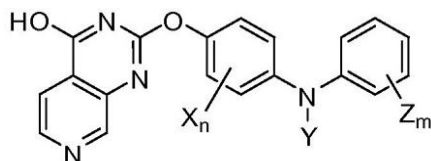


である、請求項 28 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 30】

式 (IIIa) の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩であって、

【化 10】



式 (IIIa)

式中、

X はハロゲンであり、n は 0 または 1 であり；

Y は、水素または $C_1 - C_3$ アルキルであり；

Z は、ハロゲン、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、アルキル、アルコキシ、アルキルアミノ、カルボシクリル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロシク

リルアルキル、またはカルボシクリルアルキルであり；およびmは、0、1、または2である、式(I I I a)の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項31】

nが0である、請求項30に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項32】

nが1である、請求項30に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項33】

Xがフルオロである、請求項32に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項34】

Yが水素である、請求項30 - 33のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項35】

YがC₁アルキルである、請求項30 - 33のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項36】

YがC₂アルキルである、請求項30 - 33のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項37】

mが0である、請求項30 - 35のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項38】

mが1である、請求項30 - 35のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項39】

mが2である、請求項30 - 35のいずれか1項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項40】

Zが、ハロゲン、-CN、アルキル、アルコキシ、カルボシクリル、またはヘテロシクリルである、請求項38または39に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

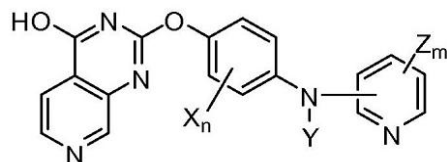
【請求項41】

Zが、フルオロ、クロロ、メチル、メトキシ、またはモルホリニルである、請求項38または39に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項42】

式(IV)の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩であって、

【化11】



式(IV)

式中、

Xはハロゲンであり、nは0または1であり；

Yは、水素またはC₁ - C₃アルキルであり；

Zは、ハロゲン、-OH、-NH₂、-CN、アルキル、アルコキシ、アルキルアミノ、カルボシクリル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロシクリルアルキル、またはカルボシクリルアルキルであり；およびmは、0、1、または2である、式(IV)の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項43】

nが0である、請求項42に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項44】

n が 1 である、請求項 4 2 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4 5】

X がフルオロである、請求項 4 4 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4 6】

Y が水素である、請求項 4 2 - 4 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4 7】

Y が C₁ アルキルである、請求項 4 2 - 4 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4 8】

Y が C₂ アルキルである、請求項 4 2 - 4 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4 9】

m が 0 である、請求項 4 2 - 4 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5 0】

m が 1 である、請求項 4 2 - 4 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5 1】

m が 2 である、請求項 4 2 - 4 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5 2】

Z が、ハロゲン、-CN、アルキル、アルコキシ、カルボシクリル、またはヘテロシクリルである、請求項 5 0 または 5 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

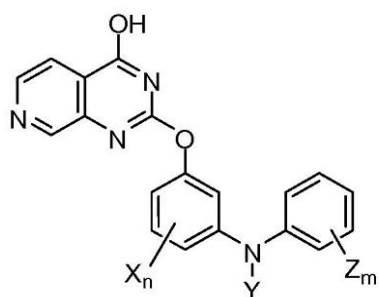
【請求項 5 3】

Z が、フルオロ、クロロ、メチル、メトキシ、またはホルホルニルである、請求項 5 0 または 5 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5 4】

式 (V) の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩であって、

【化 1 2】



式(V)

式中、

X はハロゲンであり、n は 0 または 1 であり；

Y は、水素または C₁ - C₃ アルキルであり；

Z は、ハロゲン、-OH、-NH₂、-CN、アルキル、アルコキシ、アルキルアミノ、カルボシクリル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロシクリルアルキル、またはカルボシクリルアルキルであり；および m は、0、1、または 2 である、式 (V) の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5 5】

n が 0 である、請求項 5 4 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5 6】

n が 1 である、請求項 5 4 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5 7】

X がフルオロである、請求項 5 6 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5 8】

Y が水素である、請求項 5 4 - 5 7 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5 9】

Y が C₁ アルキルである、請求項 5 4 - 5 7 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6 0】

Y が C₂ アルキルである、請求項 5 4 - 5 7 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6 1】

m が 0 である、請求項 5 4 - 6 0 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6 2】

m が 1 である、請求項 5 4 - 6 0 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6 3】

m が 2 である、請求項 5 4 - 6 0 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6 4】

Z が、ハロゲン、-CN、アルキル、アルコキシ、カルボシクリル、またはヘテロシクリルである、請求項 6 2 または 6 3 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

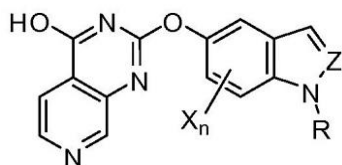
【請求項 6 5】

Z が、フルオロ、クロロ、メチル、メトキシ、またはモルホリニルである、請求項 6 2 または 6 3 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6 6】

式 (V I a) の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩であって、

【化 1 3】



式 (VIa)

式中、

X はハロゲンであり、n は 0 または 1 であり；

Z は、N または C - H であり；

R は、アルキル、アリール、アラルキル、またはカルボシクリルアルキルである、式 (V I a) の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6 7】

n が 0 である、請求項 6 6 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6 8】

n が 1 であり、X がフルオロである、請求項 6 6 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6 9】

Z が N である、請求項 6 6 - 6 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 7 0】

Z が C - H である、請求項 6 6 - 6 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 7 1】

R がアラルキルである、請求項 66 - 70 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 72】

アラルキルがベンジルである、請求項 71 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 73】

R がアルキルである、請求項 66 - 70 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 74】

アルキルがメチルである、請求項 73 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 75】

式 (VII) の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩であって、

【化 14】



式 (VII)

式中、

A1、A2、および A3 は、C - H、N または N - R から選択されるが、A1、A2、または A3 の少なくとも 1 つが C - H であり、A1、A2、または A3 の少なくとも 1 つが N - R であることを前提とし；および

R は、アリール、アラルキル、またはカルボシクリルアルキルである、式 (VII) の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

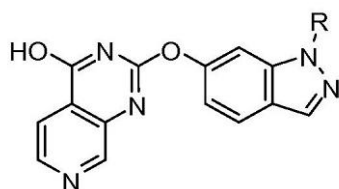
【請求項 76】

以下の式 (VIIa) - (VIId) から選択される構造を有する、請求項 75 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩：

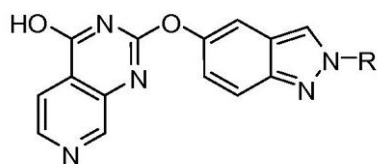
【化 15】



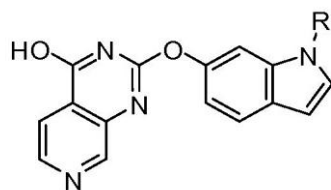
式 (VIIa);



式 (VIIb);



式 (VIIc); 又は



式 (VIIId).

【請求項 77】

R がアラルキルである、請求項 75 または 76 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

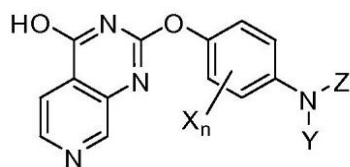
【請求項 78】

アラルキルがベンジルである、請求項 77 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 79】

式 (VIII) の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩であって、

【化 16】



式(VIII)

式中、

X はハロゲンであり、n は 0 または 1 であり；

Y は $C_1 - C_3$ アルキルであり；および

Z はアラルキルである、式 (VIII) の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 80】

n が 0 である、請求項 79 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 81】

n が 1 であり、X がフルオロである、請求項 79 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 82】

Y が C_1 アルキルである、請求項 79 - 81 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 83】

Y が C_2 アルキルである、請求項 79 - 81 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 84】

Z がベンジルである、請求項 79 - 83 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 85】

式 (IX) の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩であって、

【化 17】



式(IX)

式中、

X はハロゲンであり、n は 0 または 1 であり；

Y は $C_1 - C_3$ アルキルであり；および

Z はアラルキルである、式 (IX) の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 86】

n が 0 である、請求項 85 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 87】

n が 1 であり、X がフルオロである、請求項 85 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 88】

Y が C₁ アルキルである、請求項 85 - 87 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 89】

Y が C₂ アルキルである、請求項 85 - 87 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

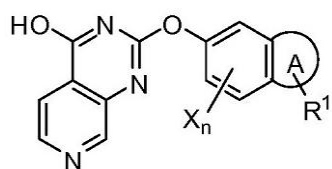
【請求項 90】

Z がベンジルである、請求項 85 - 89 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 91】

式 (X) の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩であって、

【化 18】

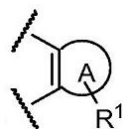


式(X)

式中、

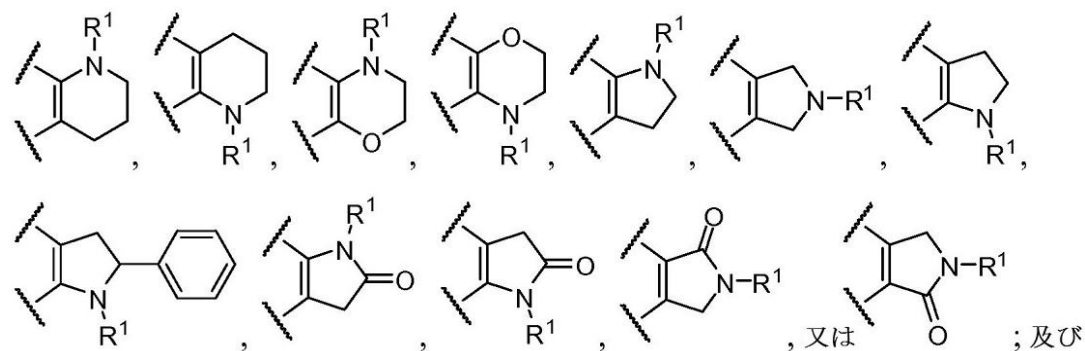
X はハロゲンであり、n は 0 または 1 であり；

【化 19】



によって表わされる環 A は以下から選択され：

【化 20】



R¹ は、アルキル、アリール、アラルキル、カルボシクリル、カルボシクリルアルキル、- (C=O) アリール、または - (SO₂) アリールである、式 (X) の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 92】

n が 0 である、請求項 91 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

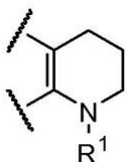
【請求項 93】

n が 1 であり、X がフルオロである、請求項 91 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 94】

環 A が、

【化 2 1】

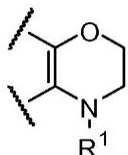


である、請求項 9 1 - 9 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 9 5】

環 A が、

【化 2 2】

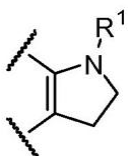


である、請求項 9 1 - 9 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 9 6】

環 A が、

【化 2 3】

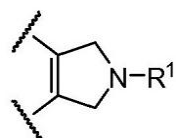


である、請求項 9 1 - 9 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 9 7】

環 A が、

【化 2 4】

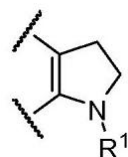


である、請求項 9 1 - 9 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 9 8】

環 A が、

【化 2 5】



である、請求項 9 1 - 9 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 9 9】

R^1 がアルキルである、請求項 9 1 - 9 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 0 0】

R¹ がアリールである、請求項 9 1 - 9 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 0 1】

アリールが、ハロゲンで随意に置換されたフェニルである、請求項 1 0 0 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 0 2】

R¹ がアラルキルである、請求項 9 1 - 9 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 0 3】

アラルキルが、ハロゲンで随意に置換されたベンジルである、請求項 1 0 2 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 0 4】

R¹ がカルボシクリルである、請求項 9 1 - 9 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 0 5】

R¹ がカルボシクリルアルキルである、請求項 9 1 - 9 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 0 6】

以下から選択される、化合物、またはその薬学的に許容可能な塩：

- 2 - [4 - (メチル - ピリジン - 2 - イル - アミノ) - フェノキシ] - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール；
- 2 - (1 - メチル - 1 H - インドール - 5 - イルオキシ) - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール；
- 2 - (1 - フェネチル - 1 H - インドール - 5 - イルオキシ) - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール；
- 2 - (1 - ベンジル - 1 H - インドール - 5 - イルオキシ) - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール；
- 2 - [4 - (メチル - フェニル - アミノ) - フェノキシ] - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール；
- 2 - [4 - (ベンジル - メチル - アミノ) - フェノキシ] - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール；
- 2 - [3 - (メチル - フェニル - アミノ) - フェノキシ] - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール；
- 2 - (1 - ベンジル - 1 H - インドール - 6 - イルオキシ) - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール；
- 2 - [3 - (ベンジル - メチル - アミノ) - フェノキシ] - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール；
- 2 - [3 - フルオロ - 4 - (メチル - フェニル - アミノ) - フェノキシ] - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール；
- 2 - (1 - ベンジル - 1 H - インダゾール - 6 - イルオキシ) - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール；
- 2 - (2 - ベンジル - 2 H - インダゾール - 6 - イルオキシ) - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール；
- 2 - { 4 - [メチル (2 - フェニルエチル) アミノ] フェノキシ } ピリジノ [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール；
- 2 - [2 - ベンジル - 2 H - インダゾール - 5 - イルオキシ] ピリジノ [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール；
- 2 - (1 - ベンジル - 1 H - インダゾール - 5 - イルオキシ) - ピリジノ [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール；

- 2 - { 4 - [(4 - メトキシ - フェニル) - メチル - アミノ] - フェノキシ } - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- 2 - { 4 - [(3 - メトキシ - フェニル) - メチル - アミノ] - フェノキシ } - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- 2 - { 4 - [メチル - (4 - モルホリン - 4 - イル - フェニル) - アミノ] - フェノキシ } - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- 2 - { 4 - [メチル - (3 - モルホリン - 4 - イル - フェニル) - アミノ] - フェノキシ } - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- 2 - [4 - (メチル - p - トリル - アミノ) - フェノキシ] - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ; および
- 2 - [4 - (メチル - m - トリル - アミノ) - フェノキシ] - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール .

【請求項 107】

以下から選択される、化合物、またはその薬学的に許容可能な塩：

- 2 - (4 - { メチル - [3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - フェニル] - アミノ } - フェノキシ) - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- 2 - (4 - { [4 - (4 - アミノ - ピペリジン - 1 - イル) - フェニル] - メチル - アミノ } - フェノキシ) - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- N - [4 - (4 - ヒドロキシ - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 2 - イルオキシ) - フェニル] - N - メチル - 2 - フェニル - アセトアミド ;
- 2 - [4 - (3 - フェニル - ピペリジン - 1 - イル) - フェノキシ] - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- 2 - [4 - (2 - フェニル - モルホリン - 4 - イル) - フェノキシ] - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- 2 - { 4 - [メチル - (5 - モルホリン - 4 - イル - ピリジン - 3 - イル) - アミノ] - フェノキシ } - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- 2 - { 4 - [メチル - (1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 1 - イルメチル) - アミノ] - フェノキシ } - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- 2 - (4 - { [4 - (2 - メトキシ - 1 - メチル - エチル) - フェニル] - メチル - アミノ } - フェノキシ) - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- 3 - (4 - { [4 - (4 - ヒドロキシ - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 2 - イルオキシ) - フェニル] - メチル - アミノ } - フェニル) - ブチロニトリル ;
- 2 - (1 - シクロペンチル - 1 H - インドール - 5 - イルオキシ) - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- 2 - (1 - フェニル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 5 - イルオキシ) - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- 2 - (1 - フェニル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 6 - イルオキシ) - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- 2 - { 4 - [(5 - イソプロピル - ピリジン - 2 - イル) - メチル - アミノ] - フェノキシ } - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- 2 - { 4 - [(4 - イソプロピル - 3 - モルホリン - 4 - イル - フェニル) - メチル - アミノ] - フェノキシ } - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- 2 - (4 - { [4 - (1 - メトキシ - エチル) - フェニル] - メチル - アミノ } - フェノキシ) - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- 2 - (4 - { [4 - (2 - アミノ - 1 - メチル - エチル) - フェニル] - メチル - アミノ } - フェノキシ) - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- 2 - { 4 - [(4 - { 2 - [(2 - メトキシ - エチル) - メチル - アミノ] - 1 - メチル - エチル } - フェニル) - メチル - アミノ] - フェノキシ } - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
- 2 - (4 - { [4 - (1 - シクロプロピル - エチル) - フェニル] - メチル - アミノ } -

フェノキシ) - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
3 - { [4 - (4 - ヒドロキシ - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 2 - イルオキシ) -
フェニル] - メチル - アミノ } - ベンゾニトリル ;
2 - (4 - { メチル - [3 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イルメチル) - フェニル]
- アミノ } - フェノキシ) - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - { 4 - [(4 - シクロプロピル - フェニル) - メチル - アミノ] - フェノキシ } - ピ
リド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - [メチル - (5 - メチルピリジン - 2 - イル) アミノ] フェノキシ] ピリド [3 ,
4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - [4 - (ジメチルアミノ) - N - メチルアニリノ] フェノキシ] ピリド [3 ,
4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
4 - [3 - [4 - (4 - ヒドロキシピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 2 - イル) オキシ
- N - メチルアニリノ] フェニル] - 1 - メチルピペラジン - 2 - オン ;
2 - [4 - [N - メチル - 4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) アニリノ] フェノキシ
] ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - [3 - (ジメチルアミノ) - N - メチルアニリノ] フェノキシ] ピリド [3 ,
4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - (N - メチル - 3 - ピロリジン - 1 - イルアニリノ) フェノキシ] ピリド [3
, 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - (N - メチル - 4 - ピロリジン - 1 - イルアニリノ) フェノキシ] ピリド [3
, 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - [3 - (4 - アミノピペリジン - 1 - イル) - N - メチルアニリノ] フェノキシ
] ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - [メチル - [(1 S) - 1 - フェニルエチル] アミノ] フェノキシ] ピリド [3
, 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - [メチル - [(1 R) - 1 - フェニルエチル] アミノ] フェノキシ] ピリド [3
, 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - (3 - フルオロ - N , 4 - ジメチルアニリノ) フェノキシ] ピリド [3 , 4 -
d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - (3 - フェニルピロリジン - 1 - イル) フェノキシ] ピリド [3 , 4 - d] ピ
リミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - (N , 4 - ジメチル - 3 - モルホリン - 4 - イルアニリノ) フェノキシ] ピリ
ド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - (N - メチル - 3 - メチルスルホニルアニリノ) フェノキシ] ピリド [3 , 4
- d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - (N - メチル - 4 - メチルスルホニルアニリノ) フェノキシ] ピリド [3 , 4
- d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - [3 - (3 - アミノピペリジン - 1 - イル) - N - メチルアニリノ] フェノキシ
] ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - (4 - エチル - N - メチル - 3 - モルホリン - 4 - イルアニリノ) フェノキシ
] ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - [4 - エチル - N - メチル - 3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) アニリ
ノ] フェノキシ] ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - [メチル - (2 - モルホリン - 4 - イルピリジン - 4 - イル) アミノ] フェノ
キシ] ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - [2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イルメチル (メチル) アミノ] フ
ェノキシ] ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - [N - メチル - 4 - (2 - メチルプロピル) アニリノ] フェノキシ] ピリド [3
, 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - [4 - [4 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - N - メチルアニリノ] フェノ

キシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[3-[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-4-エチル-N-メチルアニリ
 ノ]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[4-エチル-3-(2-メトキシエトキシ)-N-メチルアニリノ]フェ
 ノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[4-(1-メトキシ-2-メチルプロパン-2-イル)-N-メチルアニリ
 ノ]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[4-(1-ヒドロキシ-2-メチルプロパン-2-イル)-N-メチルアニ
 リノ]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-(N-メチル-4-プロピルアニリノ)フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピ
 リミジン-4-オール;
 2-[4-[N-メチル-4-[1-(メチルアミノ)プロパン-2-イル]アニリノ]
 フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[4-(4-アミノブタン-2-イル)-N-メチルアニリノ]フェノキシ]
 ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[N-メチル-4-[4-(メチルアミノ)ブタノ-2-イル]アニリノ]フ
 エノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[N-メチル-4-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)アニリノ]フェ
 ノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[N-メチル-4-(2-メチルプロボキシ)アニリノ]フェノキシ]ピリ
 ド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[4-(2, 2-ジメチルプロボキシ)-N-メチルアニリノ]フェノキシ]
 ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[4-(シクロプロピルメチル)-N-メチルアニリノ]フェノキシ]ピリ
 ド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[4-[(2S)-ブタノ-2-イル]-N-メチルアニリノ]フェノキシ]
 ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[4-[(2R)-ブタノ-2-イル]-N-メチルアニリノ]フェノキシ]
 ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[N-メチル-3-(4-メチルピペラジン-1-イル)アニリノ]フェ
 ノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-(N-エチルアニリノ)フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-
 オール;
 4-[4-(4-ヒドロキシピリド[3, 4-d]ピリミジン-2-イル)オキシ-N-
 メチルアニリノ]ベンゾニトリル;
 2-[4-[メチル-(2-メチルインダゾール-5-イル)アミノ]フェノキシ]ピリ
 ド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-(N, 3, 4-トリメチルアニリノ)フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリ
 ミジン-4-オール;
 2-[4-(4-エチル-N-メチルアニリノ)フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリ
 ミジン-4-オール;
 2-[4-(N-メチル-4-プロパン-2-イルアニリノ)フェノキシ]ピリド[3,
 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[N-メチル-3-(トリフルオロメチル)アニリノ]フェノキシ]ピリド[
 3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[N-メチル-4-(トリフルオロメチル)アニリノ]フェノキシ]ピリド[
 3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[N-メチル-3-(4-メチル-1, 4-ジアゼパン-1-イル)アニリノ]
]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[N-メチル-3-[メチル-(1-メチルピペリジン-4-イル)アミノ]

アニリノ]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[N, 3-ジメチル-5-(4-メチルピペラジン-1-イル)アニリノ]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[1-(オキサン-4-イル)インドール-5-イル]オキシピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール
 2-[4-(4-tert-ブチル-N-メチルアニリノ)フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-(N-メチル-3-プロパン-2-イルアニリノ)フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-(4-クロロ-N-メチルアニリノ)フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-(3-クロロ-N-メチルアニリノ)フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-(3-フルオロ-N-メチルアニリノ)フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[(5-エチルピリジン-2-イル)-メチルアミノ]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[4-(3, 6-ジヒドロ-2H-ピラン-4-イル)-N-メチルアニリノ]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[N-メチル-4-(オキサン-4-イル)アニリノ]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[4-[1-(2-メトキシエチルアミノ)プロパン-2-イル]-N-メチルアニリノ]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[4-(シクロプロピルメトキシ)-N-メチルアニリノ]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[N-(2-メトキシエチル)-4-プロパン-2-イルアニリノ]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-(1-フェニルインドール-5-イル)オキシピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-(1-ピペリジン-4-イルインドール-5-イル)オキシピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[N, 4-ジメチル-3-(4-メチルピペラジン-1-イル)アニリノ]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[N-メチル-4-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アニリノ]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[N-メチル-4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]アニリノ]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[N-メチル-4-(1, 1, 1-トリフルオロプロパン-2-イル)アニリノ]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[メチル-(6-プロパン-2-イルピリジン-3-イル)アミノ]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[N-メチル-4-(トリフルオロメトキシ)アニリノ]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-(N-メチル-4-プロパン-2-イルオキシアニリノ)フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-[N-(オキサラン-3-イル)-4-プロパン-2-イルアニリノ]フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-[4-(N-シクロブチル-4-プロパン-2-イルアニリノ)フェノキシ]ピリド[3, 4-d]ピリミジン-4-オール;
 2-{4-[(4-イソプロピル-フェニル)-(2, 2, 2-トリフルオロ-エチル)

- アミノ } - フェノキシ } - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
2 - (4 - { [4 - (3 - ジメチルアミノ - 1 - メチル - プロピル) - フェニル] - メチ
ル - アミノ } - フェノキシ) - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール ;
(3 , 3 - ジメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - ベンゾフラン - 6 - イル) - メチル - [4 - (4 -
メチル - ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 2 - イルオキシ) - フェニル] - アミン
;
2 - (4 - (エチル (4 - イソプロピルフェニル) アミノ) フェノキシ) ピリド [3 , 4
- d] ピリミジン - 4 - オール ; および
2 - (4 - ((4 - イソプロピルフェニル) (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イル)
アミノ) フェノキシ) ピリド [3 , 4 - d] ピリミジン - 4 - オール。

【請求項 108】

請求項 1 乃至 107 のいずれか 1 項の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、および少なくとも 1 つの薬学的に許容可能な賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項 109】

ヒストンデメチラーゼ酵素を阻害するための薬物の製造における、請求項 1 乃至 107 のいずれか 1 項の化合物の使用。

【請求項 110】

被験体の癌を処置するための薬物の製造における、請求項 1 乃至 107 のいずれか 1 項の化合物またはその薬学的に許容可能な塩を含む組成物の使用。