

【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 24 年 5 月 24 日 (2012.5.24)

【公表番号】特表 2011-516558 (P2011-516558A)

【公表日】平成 23 年 5 月 26 日 (2011.5.26)

【年通号数】公開・登録公報 2011-021

【出願番号】特願 2011-504114 (P2011-504114)

【国際特許分類】

C 07D 239/70 (2006.01)

A 61P 35/00 (2006.01)

A 61P 35/04 (2006.01)

A 61P 43/00 (2006.01)

C 07D 491/052 (2006.01)

A 61K 31/519 (2006.01)

C 07D 491/20 (2006.01)

C 07D 491/147 (2006.01)

C 07D 491/22 (2006.01)

C 07D 471/04 (2006.01)

A 61K 31/517 (2006.01)

C 07D 487/04 (2006.01)

C 07D 401/12 (2006.01)

【FI】

C 07D 239/70

A 61P 35/00

A 61P 35/04

A 61P 43/00 1 1 1

C 07D 491/052 C S P

A 61K 31/519

C 07D 491/20

C 07D 491/147

C 07D 491/22

C 07D 471/04 1 1 6

A 61K 31/517

C 07D 487/04 1 4 0

C 07D 401/12

【手続補正書】

【提出日】平成 24 年 3 月 29 日 (2012.3.29)

【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

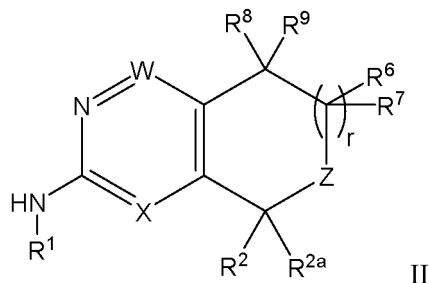
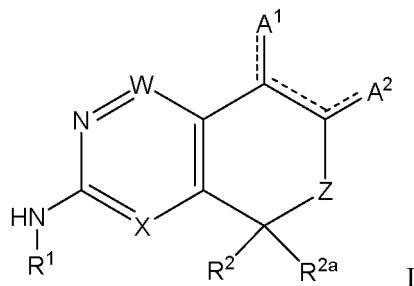
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I または I I

## 【化 1】



の化合物、そのエナンチオマー、ジアステレオマー、塩および溶媒和物

[ 式中、

A<sup>1</sup> および A<sup>2</sup> は、これらが結合している環炭素原子と一緒にあって、ベンゼン、シクロペンタジエン、ピリジン、ピリドン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン、2H-ピラン、ピロール、イミダゾール、ピラゾール、トリアゾール、フラン、オキサゾール、イソオキサゾール、オキサジアゾール、チオフェン、チアゾール、イソチアゾールまたはチアジアゾールを形成し、これらのいずれも、任意に部分的に飽和していても良く、並びにこれらのいずれも、価数によって許容される場合 1 個以上の R<sup>x</sup> 基で任意に独立して置換されていても良く、

W および X は独立して CH または N であり、

Z は存在しない、-O-、-S(O)<sub>n</sub>、または -NHR<sup>3</sup> - であり、

R<sup>1</sup> は -Y-R<sup>a</sup> であり、ここで

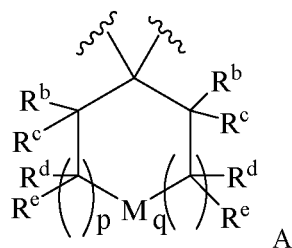
Y は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、複素環、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、価数によって許容される場合 1 個以上の R<sup>x</sup> 基で任意に独立して置換されていても良く、

R<sup>a</sup> は、複素環、-NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>、-C(=O)NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>、-O-R<sup>5</sup>、または -S(O)<sub>n</sub>-R<sup>5</sup> であり、

R<sup>2</sup> および R<sup>2a</sup> はそれぞれ、独立してアルキルまたはアルケニルであり、そのいずれかは、価数によって許容される場合 1 個以上の R<sup>x</sup> で任意に置換されていても良く、

または、R<sup>2</sup> および R<sup>2a</sup> は、これらが結合している環炭素原子と一緒にあって、下記式 A

## 【化 2】



のスピロ縮合環系を形成し、

ここで

Mは - C R<sup>d</sup> R<sup>e</sup> - 、 - O - 、 - S ( O )<sub>n</sub> - または - N H R<sup>3</sup> - であり、

R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup> および R<sup>e</sup> はそれぞれ独立して H もしくは R<sup>x</sup> であり、あるいは、隣接する炭素環原子上の R<sup>b</sup> および R<sup>d</sup> は、価数によって許容される場合二重結合を任意に形成していても良く、また、隣接する炭素環原子上の R<sup>d</sup> および R<sup>e</sup> は価数によって許容される場合二重結合を任意に形成していても良く、

R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> は各場合、独立して、

( i ) 水素または

( i i ) アルキル、シクロアルキル、複素環、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキルまたはヘテロアリールアルキル〔これらのいずれも、価数によって許容される場合 1 個以上の R<sup>x</sup> 基で任意に独立して置換されていても良い〕

であり、

または、R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> はこれらが結合している窒素原子と一緒にあって、価数によって許容される場合 1 個以上の R<sup>x</sup> 基で任意に独立して置換されている複素環を形成していても良く、

R<sup>3</sup> \* および R<sup>4</sup> \* は各場合、独立して、

( i ) 水素または

( i i ) アルキル、アルケニル、アルキニルシクロアルキル、複素環、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキルまたはヘテロアリールアルキル〔これらのいずれも、価数によって許容される場合 1 個以上の R<sup>x</sup> 基で任意に独立して置換されていても良い〕

であり、

または、R<sup>3</sup> \* および R<sup>4</sup> \* は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、価数によって許容される場合 1 個以上の R<sup>x</sup> 基で任意に独立して置換されている複素環を形成していても良く、

R<sup>5</sup> および R<sup>5</sup> \* は各場合、

( i ) 水素または

( i i ) アルキル、アルケニル、アルキニルシクロアルキル、複素環、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、またはヘテロアリールアルキル〔これらのいずれも、価数によって許容される場合 1 個以上の R<sup>x</sup> 基で任意に独立して置換されていても良い〕

であり、

R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> はそれぞれ独立して、H または R<sup>x</sup> であり、あるいは

( i ) R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> は、これらが結合している環炭素原子と一緒にあって、価数によって許容される場合 = O、= S または = N R<sup>3</sup> を形成していても良く、

( i i ) R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は、これらが結合している環炭素原子と一緒にあって、価数によって許容される場合 = O、= S または = N R<sup>3</sup> を形成していても良く、

( i i i ) 隣接する環炭素原子上の 2 個の R<sup>6</sup> 基は、価数によって許容される場合二重結合を形成していても良く、

( i v ) 隣接する環炭素原子上の R<sup>6</sup> および R<sup>8</sup> は、価数によって許容される場合二重結合を形成していても良く、

R<sup>x</sup> は各場合、独立して、ハロ、シアノ、ニトロ、オキソ、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、複素環、アリール、ヘテロアリール、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクロアルキル、- ( アルキレン )<sub>m</sub> - O R<sup>5</sup>、- ( アルキレン )<sub>m</sub> - S ( O )<sub>n</sub> R<sup>5</sup>、- ( アルキレン )<sub>m</sub> - N R<sup>3</sup> R<sup>4</sup>、- ( アルキレン )<sub>m</sub> - C ( = O ) R<sup>5</sup>、- ( アルキレン )<sub>m</sub> - C ( = S ) R<sup>5</sup>、- ( アルキレン )<sub>m</sub> - C ( = O ) O R<sup>5</sup>、- ( アルキレン )<sub>m</sub> - O C ( = O ) R<sup>5</sup>、- ( アルキレン )<sub>m</sub> - C ( = S ) O R<sup>5</sup>、- ( アルキレン )<sub>m</sub> - C ( = O ) N R<sup>3</sup> R<sup>4</sup>、- ( アルキレン )<sub>m</sub> - C ( = S ) N R<sup>3</sup> R<sup>4</sup>、- ( アルキレン )

$m - N(R^3)C(=O)NR^3R^4$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - N(R^3)C(=S)NR^3R^4$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - N(R^3)C(=O)R^5$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - N(R^3)C(=S)R^5$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - OC(=O)NR^3R^4$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - OC(=S)NR^3R^4$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - SO_2NR^3R^4$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - N(R^3)SO_2R^5$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - N(R^3)SO_2NR^3R^4$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - N(R^3)C(=O)OR^5$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - N(R^3)C(=S)OR^5$ 、または  $-(\text{アルキレン})_m - N(R^3)SO_2R^5$  であり、

ここで、前記アルキル、ハロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、複素環、アリール、ヘテロアリール、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シクロアルキルアルキルおよびヘテロシクロアルキル基は、1個以上の  $-(\text{アルキレン})_m - OR^{5*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - S(O)_nR^{5*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - NR^{3*}R^{4*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - C(=O)R^{5*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - C(=S)R^{5*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - C(=O)OR^{5*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - OC(=O)R^{5*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - C(=S)OR^{5*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - C(=O)NR^{3*}R^{4*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - C(=S)NR^{3*}R^{4*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - N(R^{3*})C(=O)NR^{3*}R^{4*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - N(R^{3*})C(=S)NR^{3*}R^{4*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - N(R^{3*})C(=O)R^{5*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - N(R^{3*})C(=S)R^{5*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - OC(=O)NR^{3*}R^{4*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - OC(=S)NR^{3*}R^{4*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - SO_2NR^{3*}R^{4*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - N(R^{3*})SO_2R^{5*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - N(R^{3*})SO_2NR^{3*}R^{4*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - N(R^{3*})C(=O)OR^{5*}$ 、 $-(\text{アルキレン})_m - N(R^{3*})C(=S)OR^{5*}$ 、または  $-(\text{アルキレン})_m - N(R^{3*})SO_2R^{5*}$  で独立してさらに置換されていても良く、

$n$  は、0、1 または 2 であり、

$m$  は 0 または 1 であり、

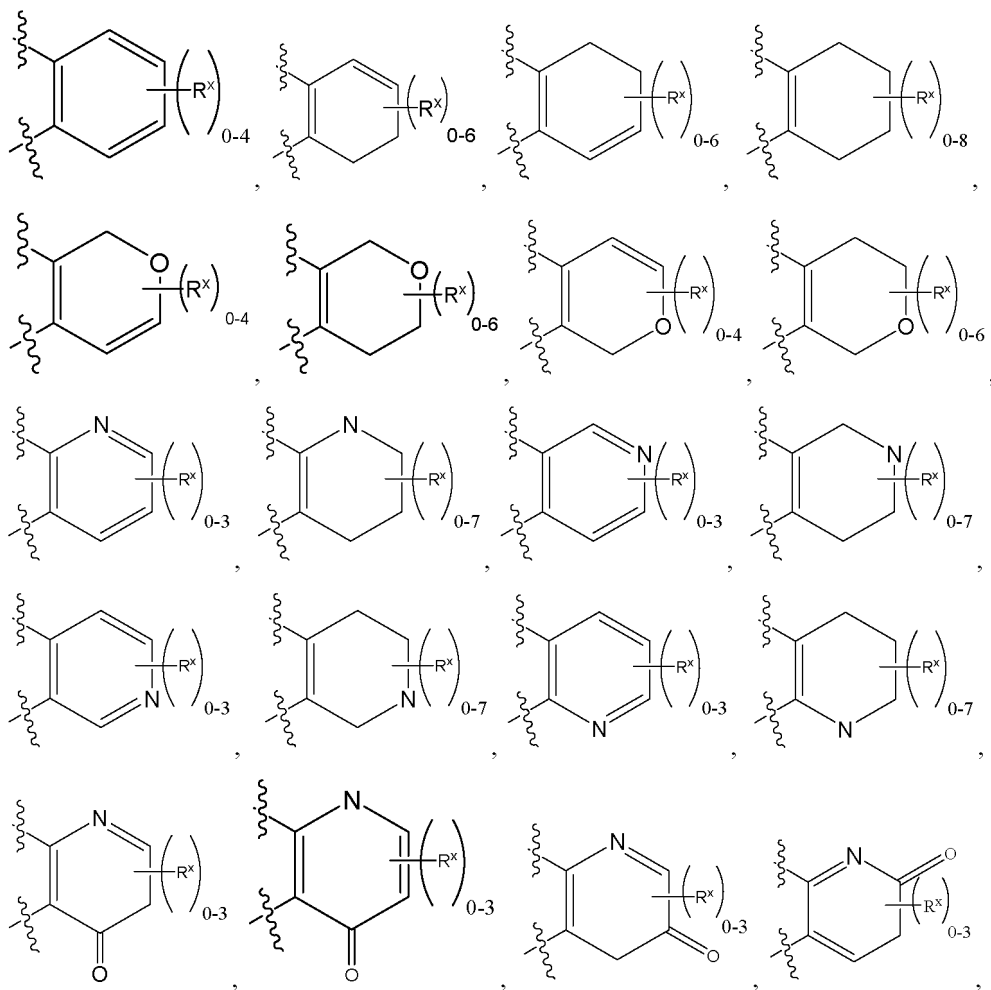
$p$  および  $q$  は独立して、0、1 または 2 であり、並びに

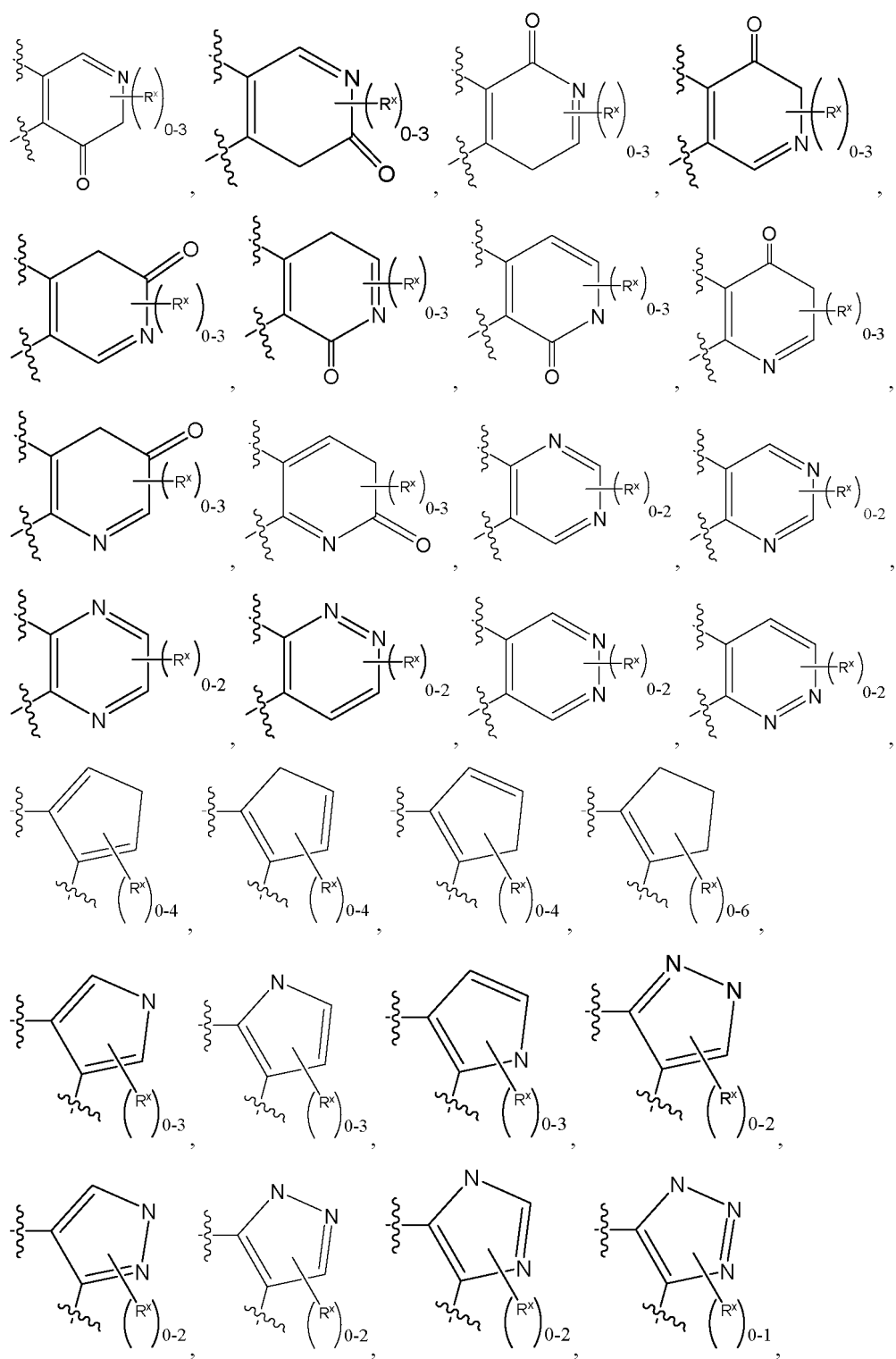
$r$  は、 $Z$  が存在しない場合、1、2 または 3 であり、または  $Z$  が存在する場合、0、1 または 2 である。

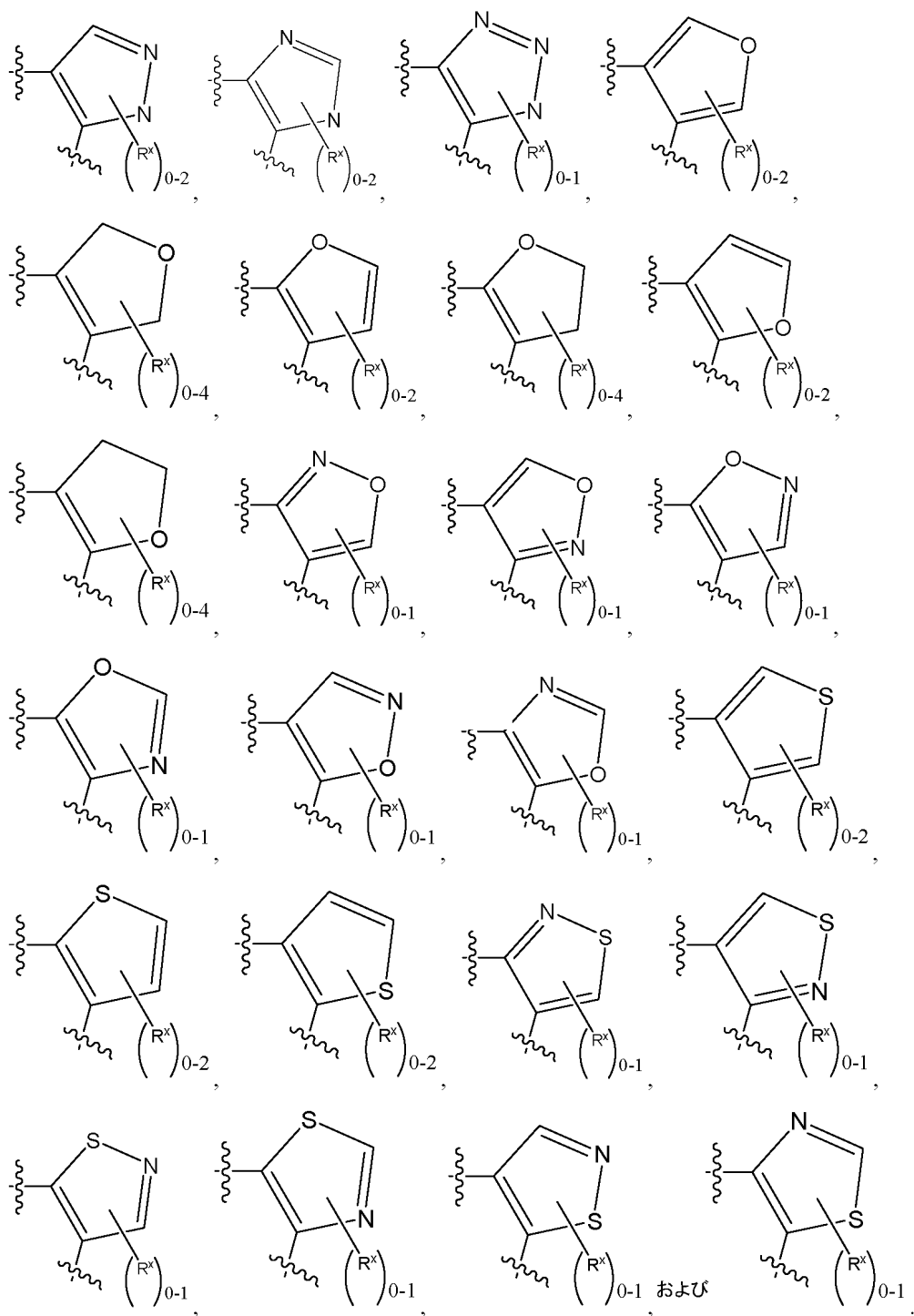
#### 【請求項 2】

$A^1$  および  $A^2$  が、これらが結合している環原子と一緒にあって、

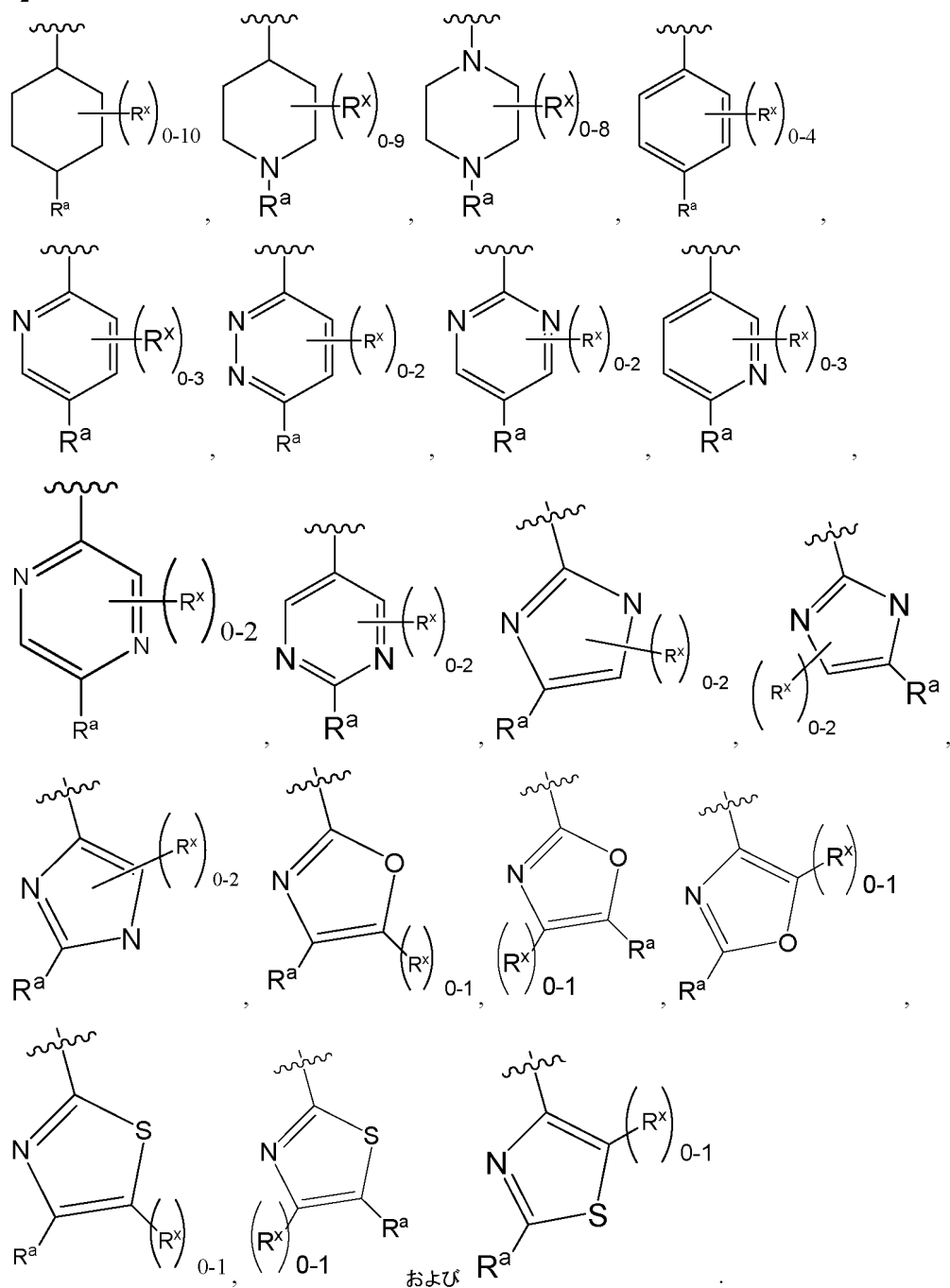
## 【化 3】







## 【化 4】



から選択される、請求項 3 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

$R^a$  が、

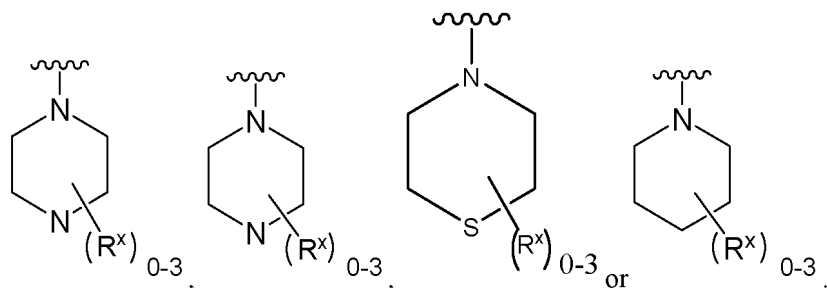
(a)  $R^5$  が、1 個以上の  $-OR^5$  \* または  $-NR^3$  \*  $R^4$  \* で任意に独立して置換されているアルキルである、 $-OR^5$  または  $-S(O)_n R^5$  ;

(b)  $R^3$  および  $R^4$  が独立して、1 個以上の  $-OR^5$  \* または  $-NR^3$  \*  $R^4$  \* で任意に独立して置換されているアルキルである、

または、 $R^3$  および  $R^4$  が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、



## 【化 5】

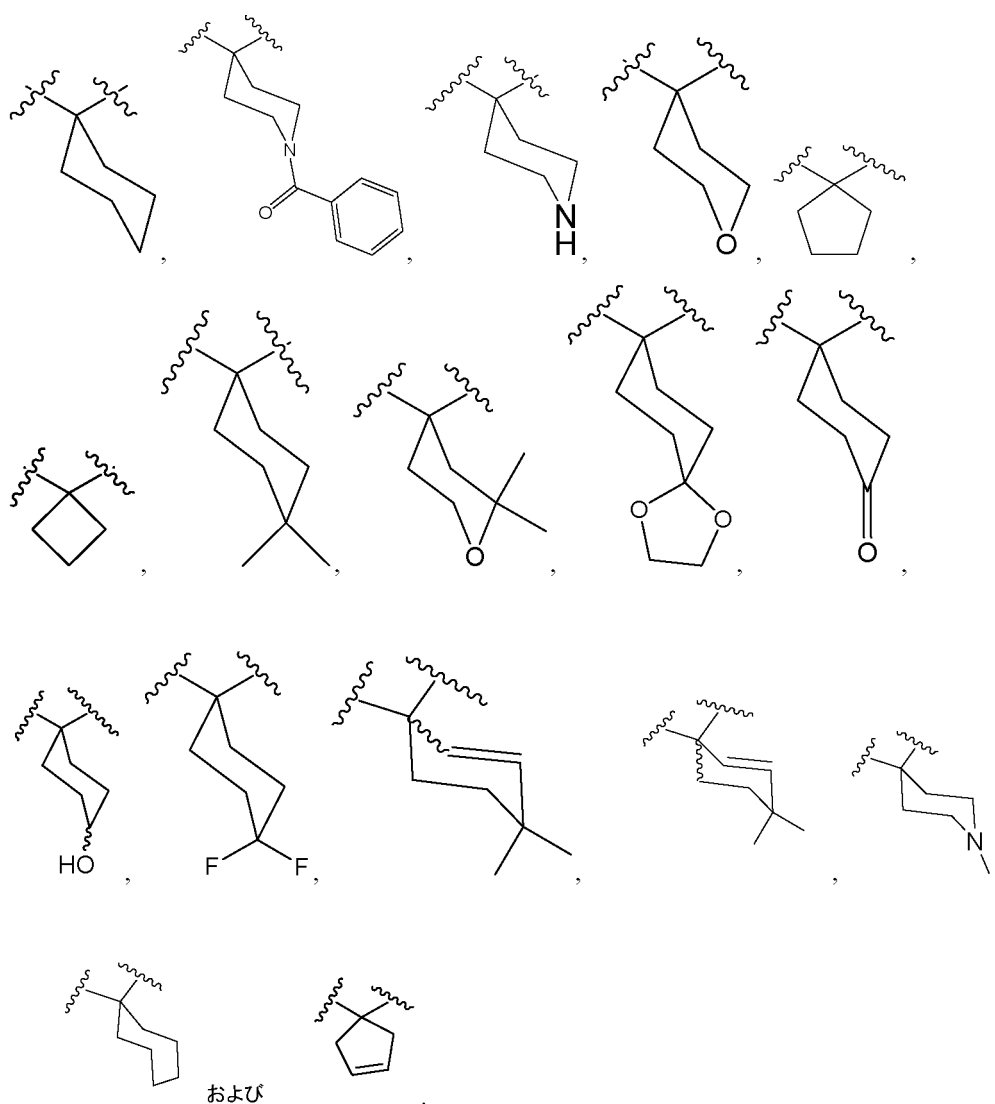


を形成する - C ( = O ) N R <sup>3</sup> R <sup>4</sup> または - N R <sup>3</sup> R <sup>4</sup> から選択される、請求項 4 に記載の化合物。

## 【請求項 6】

R <sup>2</sup> および R <sup>2 a</sup> が、これらが結合している環炭素原子と一緒に、

## 【化 6】



から選択されるスピロ縮合環系を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

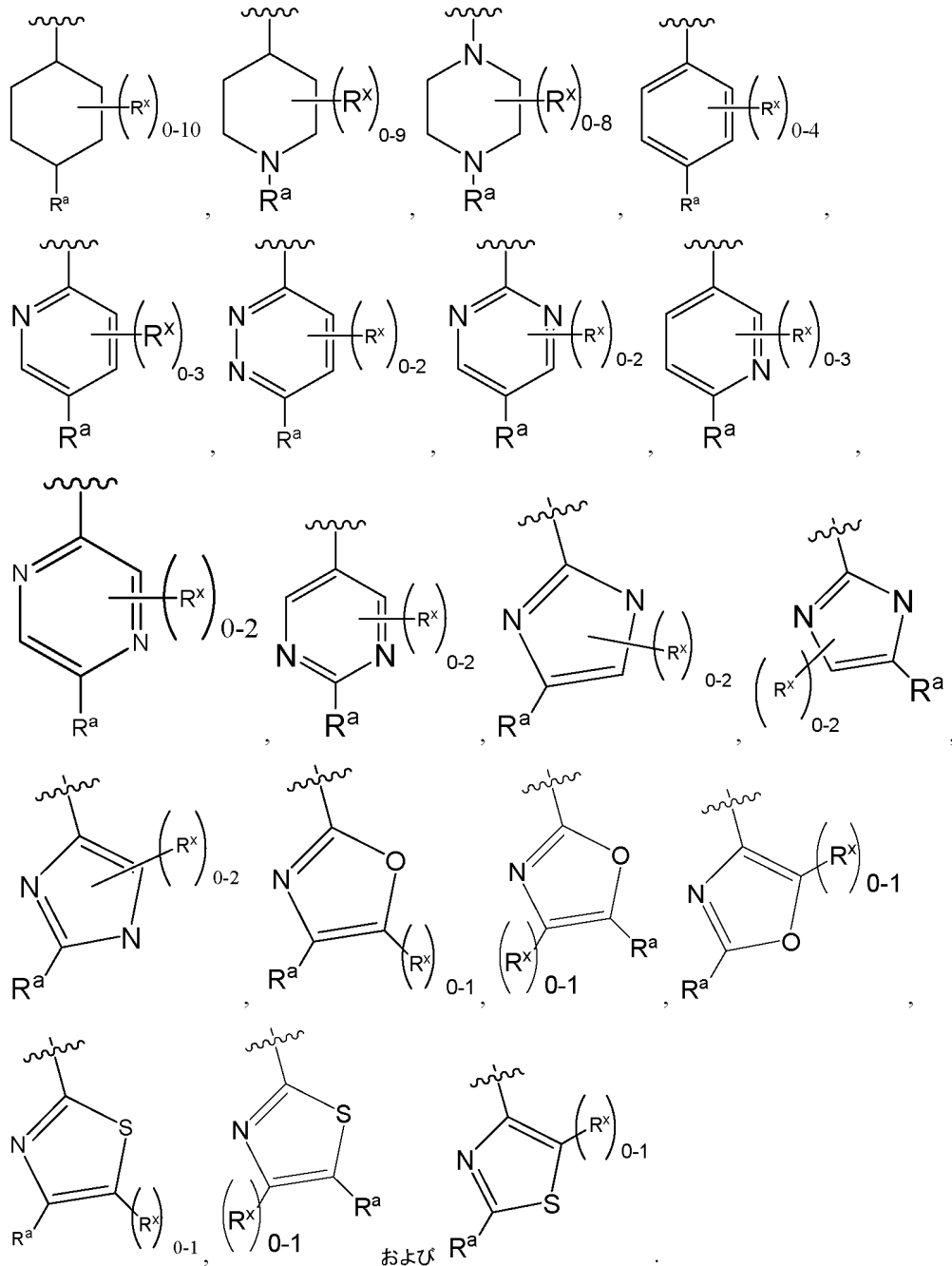
## 【請求項 7】

下記式 I A

IA

R<sup>1</sup>が、

## 【化 8】



から選択される、請求項 8 に記載の化合物。

## 【請求項 10】

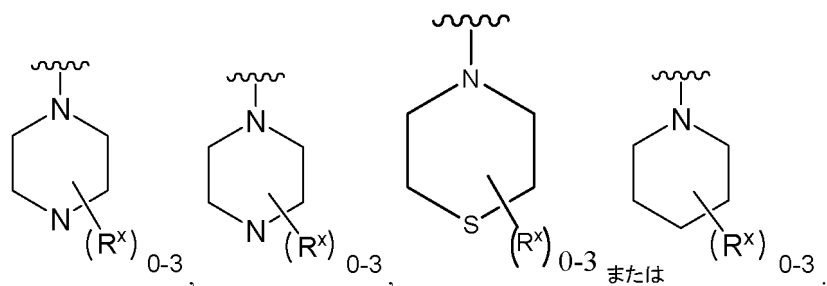
$R^a$  が、

(a)  $R^5$  が、1 個以上の  $-OR^5$  \* または  $-NR^3$  \*  $R^4$  \* で任意に独立して置換されているアルキルである、 $-OR^5$  または  $-S(O)_n R^5$  ;

(b)  $R^3$  および  $R^4$  が独立して、1 個以上の  $-OR^5$  \* または  $-NR^3$  \*  $R^4$  \* で任意に独立して置換されているアルキルである、

または、 $R^3$  および  $R^4$  が、これらが結合している窒素原子と一緒に、

## 【化 9】

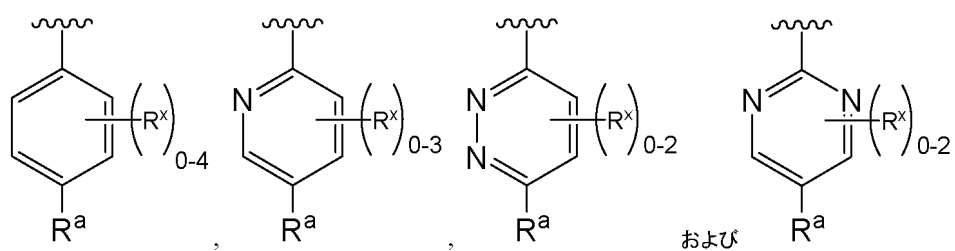


を形成する - C ( = O ) N R <sup>3</sup> R <sup>4</sup> または - N R <sup>3</sup> R <sup>4</sup> から選択される、請求項 9 に記載の化合物。

## 【請求項 1 1】

R <sup>1</sup> が、

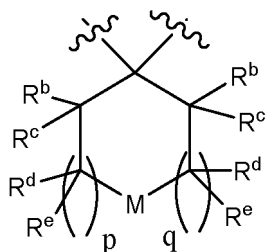
## 【化 1 0】



から選択される、請求項 9 に記載の化合物。

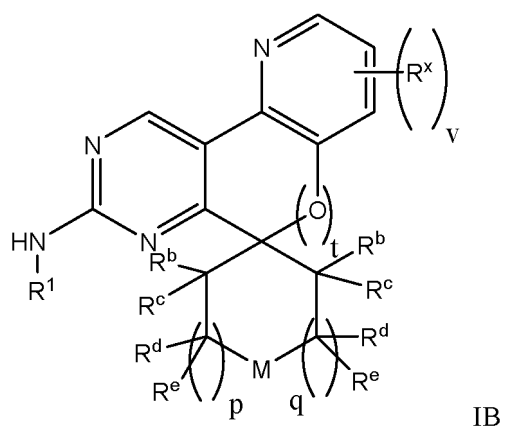
## 【請求項 1 2】

## 【化 1 1】



が、

【化 1 3】



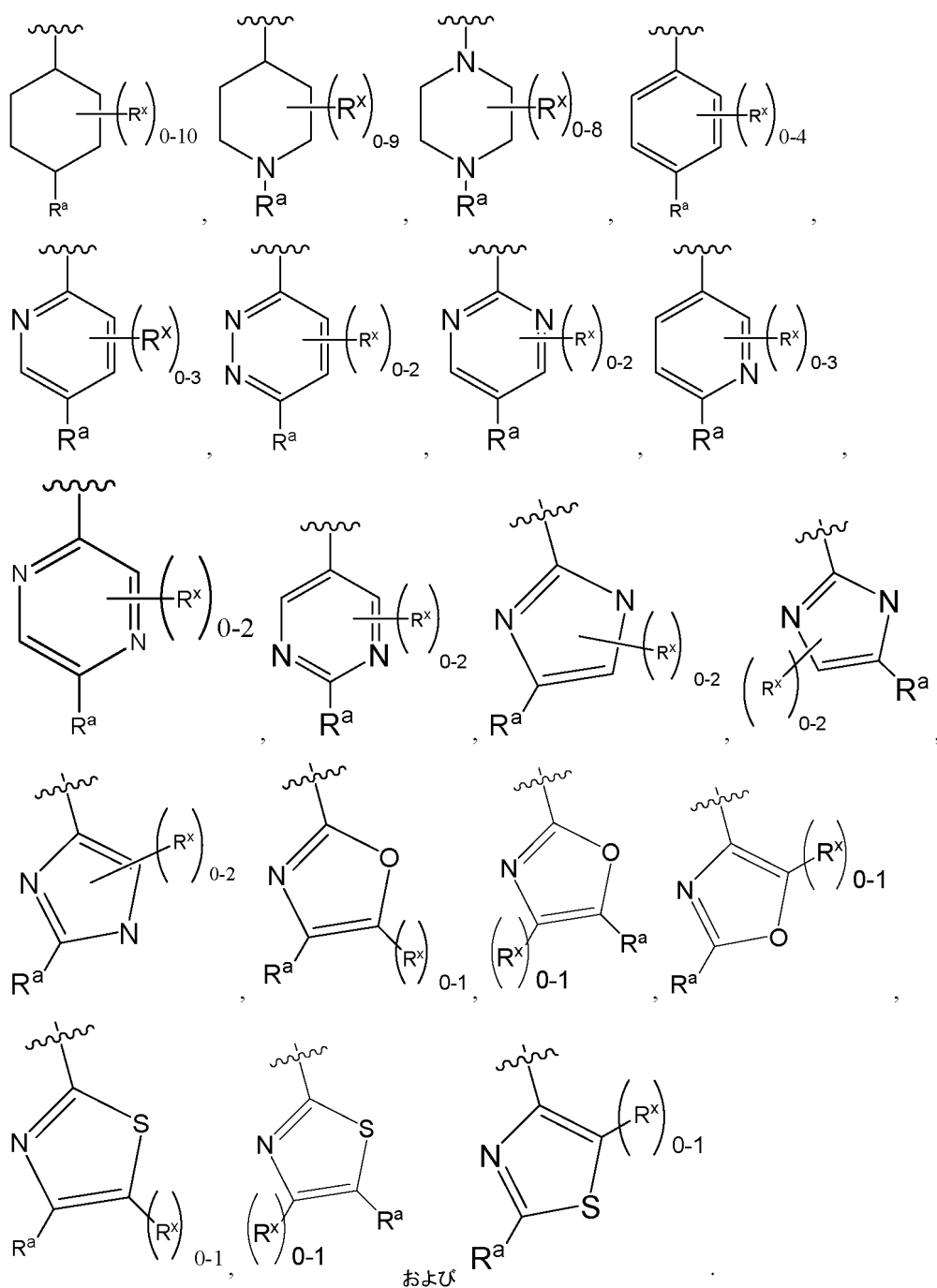
Y が、シクロペンチル、シクロヘキシル、ピペリジニル、ピペラジニル、フェニル、ピ

リジニル、ピリミジニル、シクロペンタジエニル、ピロリル、ピラジニル、ピリダジニル、イミダゾリル、オキサゾリルまたはチアゾリルである、請求項 1 3 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

R<sup>1</sup> が、

【化 1 4】



および

から選択される、請求項 1 4 に記載の化合物。

【請求項 1 6】

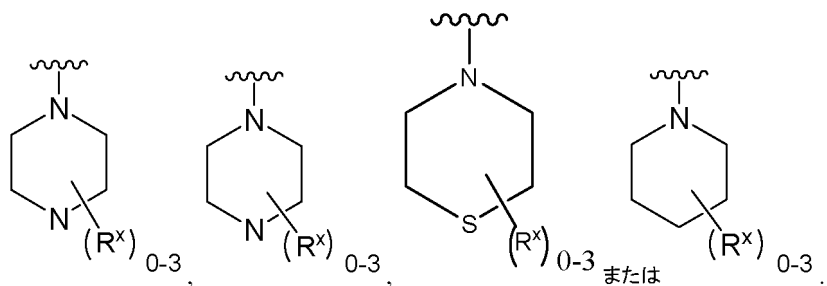
R<sup>a</sup> が、

(a) R<sup>5</sup> が、1 個以上の - OR<sup>5</sup> \* または - NR<sup>3</sup> \* R<sup>4</sup> \* で任意に独立して置換されているアルキルである、- OR<sup>5</sup> または - S(O)<sub>n</sub> R<sup>5</sup> ;

(b) R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> が独立して、1 個以上の - OR<sup>5</sup> \* または - NR<sup>3</sup> \* R<sup>4</sup> \* で任意に独立して置換されているアルキルである、

または、R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> が、これらが結合している窒素原子と一緒に、

## 【化 1 5】

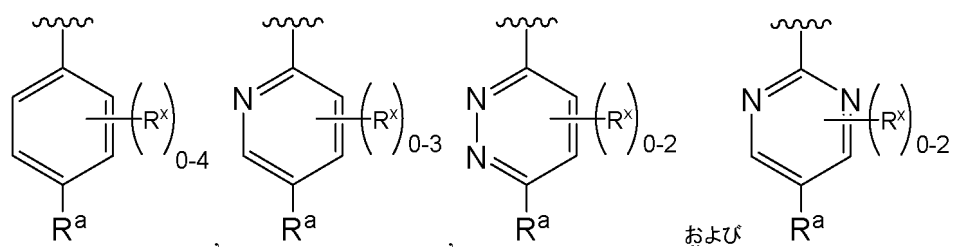


を形成する - C ( = O ) N R <sup>3</sup> R <sup>4</sup> または - N R <sup>3</sup> R <sup>4</sup> から選択される、請求項 1 5 に記載の化合物。

## 【請求項 1 7】

R <sup>1</sup> が、

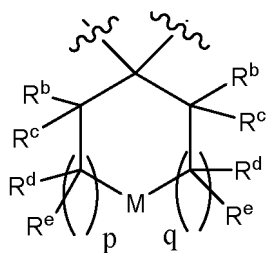
## 【化 1 6】



から選択される、請求項 1 5 に記載の化合物。

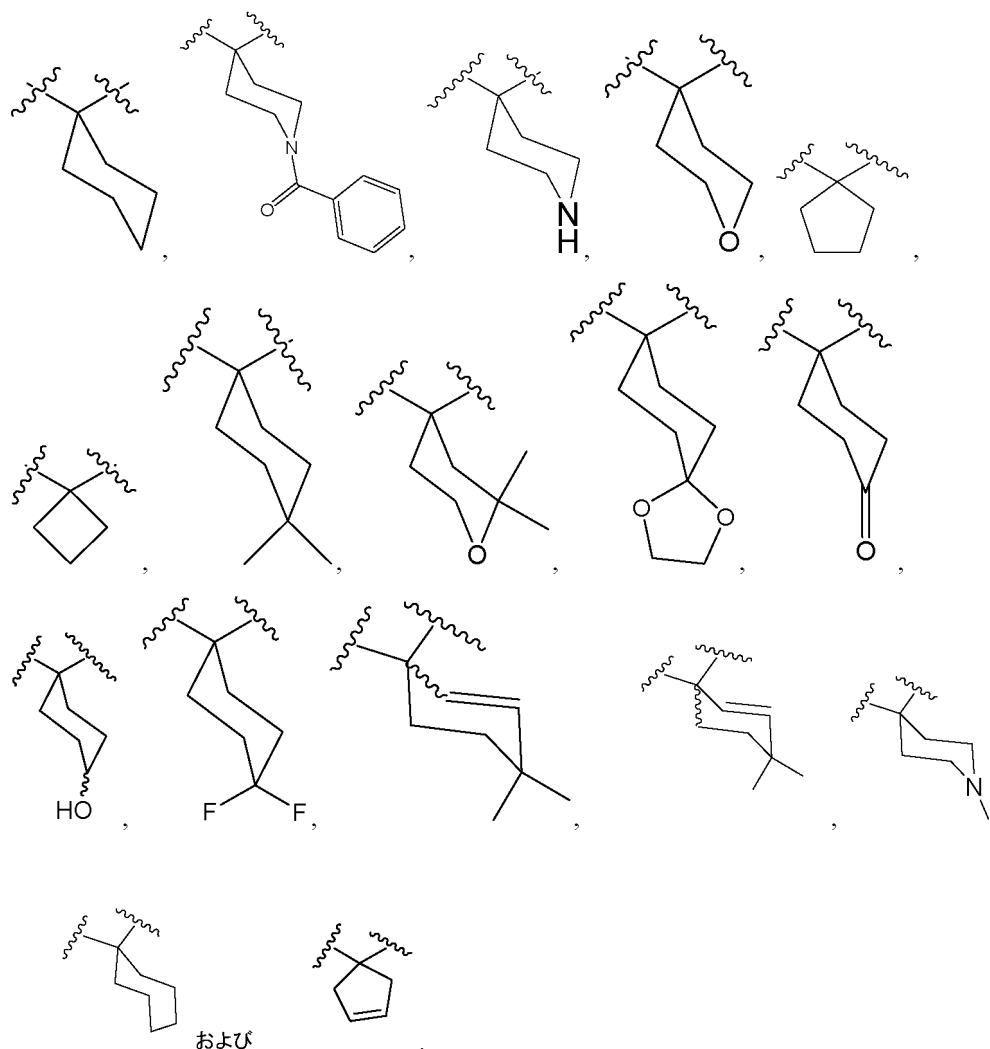
## 【請求項 1 8】

## 【化 1 7】



が、

【化 1 8】

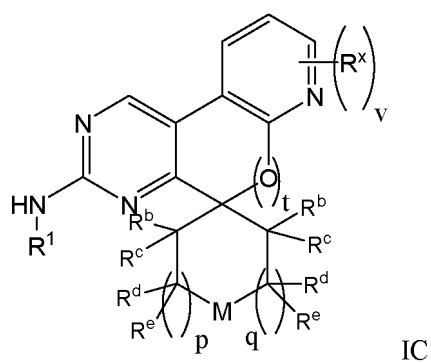


から選択される、請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 19】

下記式 I C

【化 1 9】



[ 式中、 $t$  は 0 または 1 であり、並びに  $v$  は、0、1、2 または 3 である ]  
を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 20】

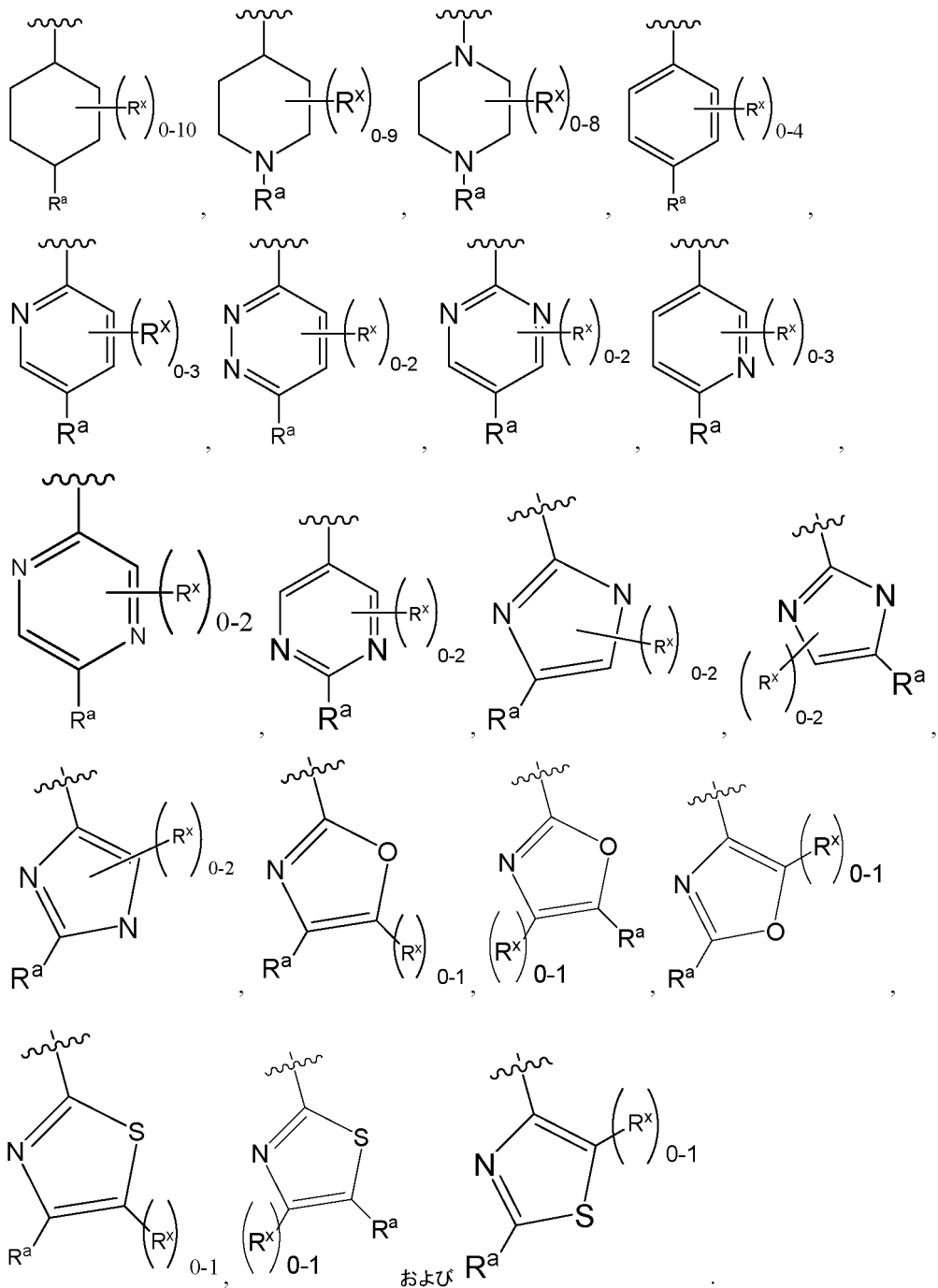
Yが、シクロペンチル、シクロヘキシル、ピペリジニル、ピペラジニル、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、シクロペンタジエニル、ピロリル、ピラジニル、ピリダジニル、イミダゾリル、オキサゾリルまたはチアゾリルである、請求項19に記載の化合物。



## 【請求項 21】

R<sup>1</sup> が

## 【化 20】

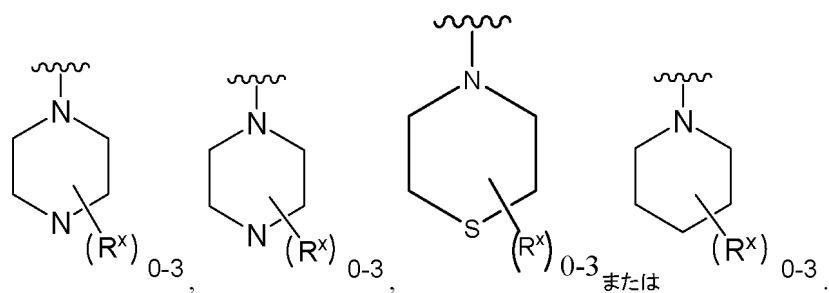


から選択される、請求項 20 に記載の化合物。

## 【請求項 22】

R<sup>a</sup> が、(a) R<sup>5</sup> が、1 個以上の -OR<sup>5\*</sup> または -NR<sup>3\*</sup>R<sup>4\*</sup> で任意に独立して置換されているアルキルである、-OR<sup>5</sup> または -S(O)<sub>n</sub>R<sup>5</sup> ;(b) R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> が独立して、1 個以上の -OR<sup>5\*</sup> または -NR<sup>3\*</sup>R<sup>4\*</sup> で任意に独立して置換されているアルキルである、または、R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> が、これらが結合している窒素原子と一緒に、

## 【化 2 1】

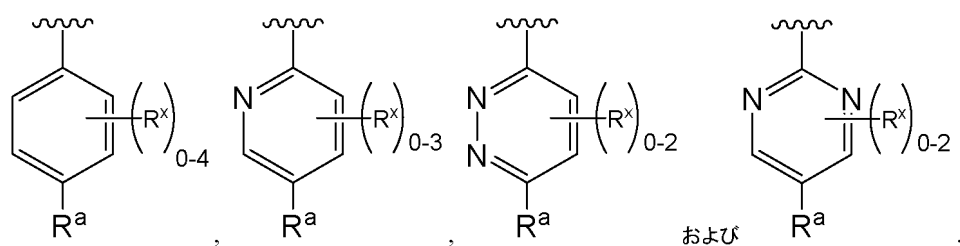


を形成する - C ( = O ) N R <sup>3</sup> R <sup>4</sup> または - N R <sup>3</sup> R <sup>4</sup> から選択される、請求項 2 1 に記載の化合物。

## 【請求項 2 3】

R <sup>1</sup> が、

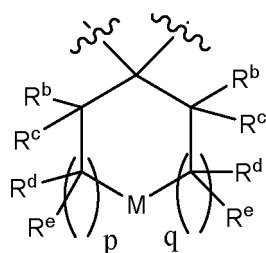
## 【化 2 2】



から選択される、請求項 2 1 に記載の化合物。

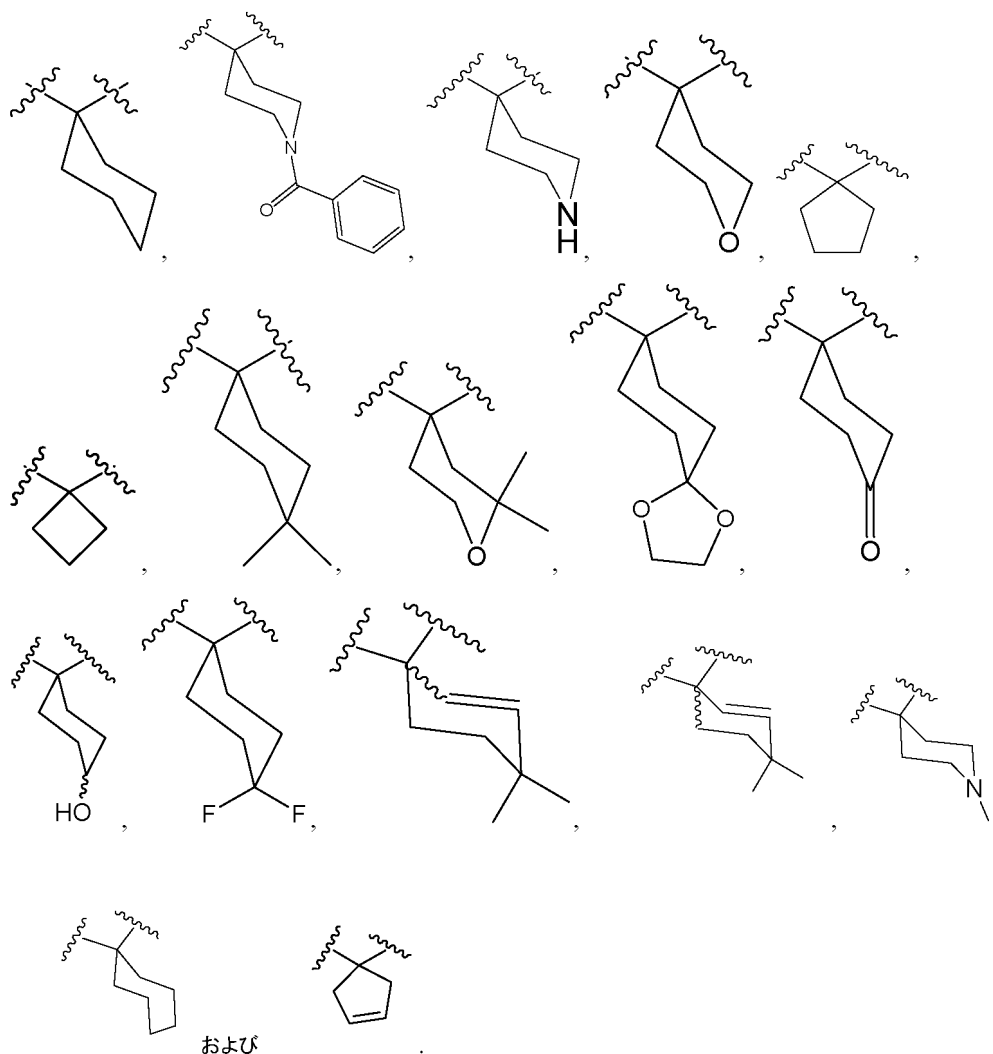
## 【請求項 2 4】

## 【化 2 3】



が、

【化 2 4】

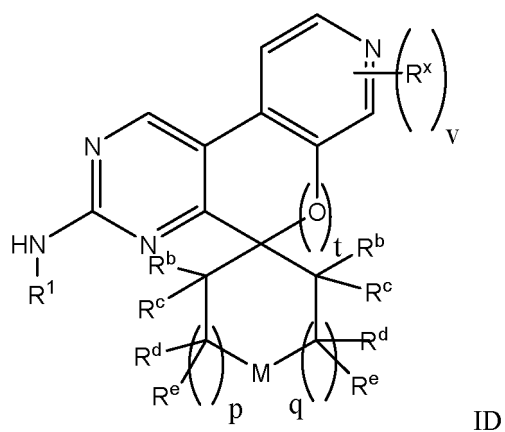


から選択される、請求項 19 に記載の化合物。

【請求項 25】

下記式 I D

【化 2 5】



[ 式中、 $t$  は 0 または 1 であり、並びに  $v$  は、0、1、2 または 3 である ]  
を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 26】

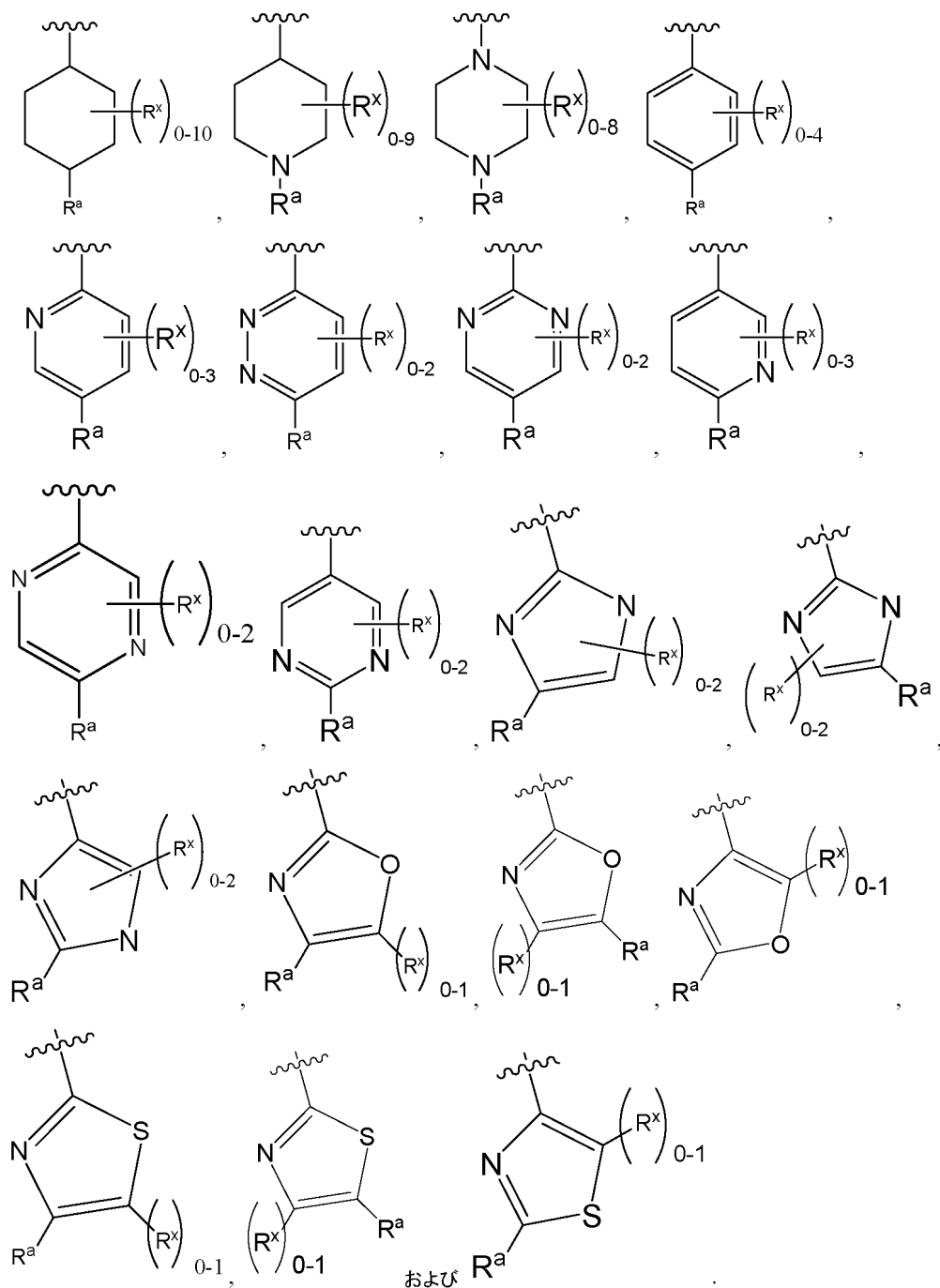
Yが、シクロペンチル、シクロヘキシル、ピペリジニル、ピペラジニル、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、シクロペンタジエニル、ピロリル、ピラジニル、ピリダジニル

、イミダゾリル、オキサゾリルまたはチアゾリルである、請求項 25 に記載の化合物。

【請求項 27】

$R^1$  が、

【化 26】



から選択される、請求項 26 に記載の化合物。

【請求項 28】

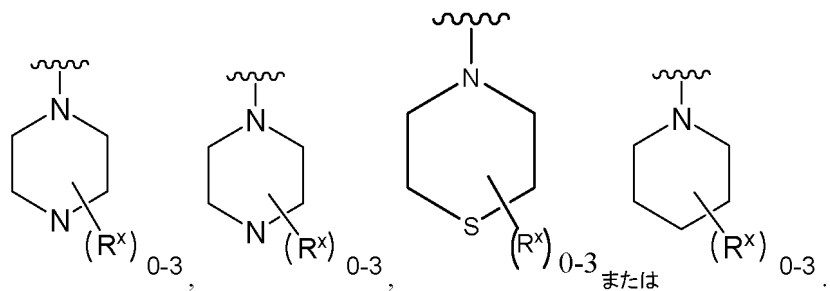
$R^a$  が、

(a)  $R^5$  が 1 個以上の  $-OR^5$  \* または  $-NR^3$  \*  $R^4$  \* で任意に独立して置換されているアルキルである  $-OR^5$  または  $-S(O)_n R^5$  ;

(b)  $R^3$  および  $R^4$  が独立して、1 個以上の  $-OR^5$  \* または  $-NR^3$  \*  $R^4$  \* で任意に置換されているアルキルである、

または、 $R^3$  および  $R^4$  が、これらが結合している窒素原子と一緒に、

【化 2 7】

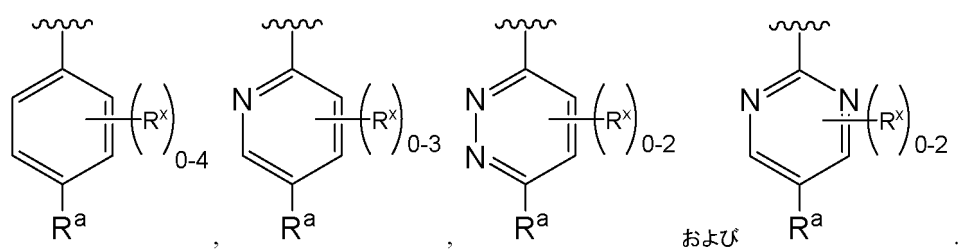


を形成する - C ( = O ) N R <sup>3</sup> R <sup>4</sup> または - N R <sup>3</sup> R <sup>4</sup> から選択される、請求項 2 7 に記載の化合物。

【請求項 2 9】

R <sup>1</sup> が、

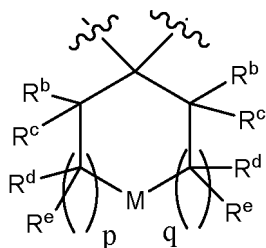
【化 2 8】



から選択される、請求項 2 7 に記載の化合物。

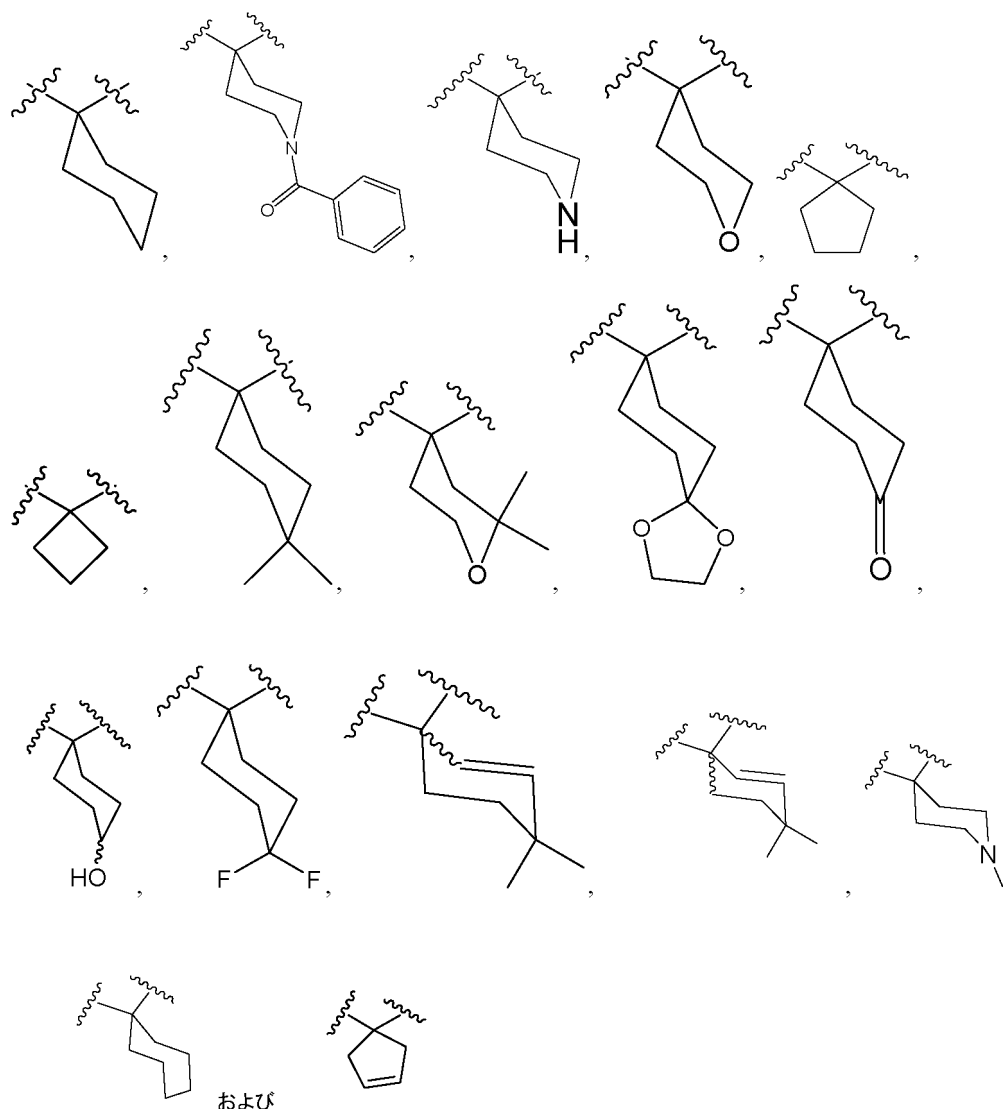
【請求項 3 0】

【化 2 9】



が

## 【化 3 0】



から選択される、請求項 25 に記載の化合物。

## 【請求項 31】

N - ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) スピロ [ クロメノ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 5 , 1 ' - シクロヘキサン ] - 3 - アミン ;  
 N - ( 4 - ( 4 - メチル - 1 - ピペラジニル ) フェニル ) スピロ [ クロメノ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 5 , 1 ' - シクロヘキサン ] - 3 - アミン ;  
 N - ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - ピリジニル ) スピロ [ クロメノ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 5 , 1 ' - シクロヘキサン ] - 3 - アミン ;  
 N - ( 4 - ( 4 - メチル - 1 - ピペラジニル ) フェニル ) - 1 ' - ( フェニルカルボニル ) スピロ [ クロメノ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 5 , 4 ' - ピペリジン ] - 3 - アミン ;  
 N - ( 4 - ( 4 - メチル - 1 - ピペラジニル ) フェニル ) スピロ [ クロメノ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 5 , 4 ' - ピペリジン ] - 3 - アミン ;  
 N - ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) - 2 ' , 3 ' , 5 ' , 6 ' - テトラヒドロスピロ [ クロメノ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 5 , 4 ' - ピラン ] - 3 - アミン ;  
 N - ( 6 - ( 1 - ピペラジニル ) - 3 - ピリジニル ) - 2 ' , 3 ' , 5 ' , 6 ' - テトラヒドロスピロ [ クロメノ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 5 , 4 ' - ピラン ] - 3 - アミン ;  
 N - ( 2 - ( 1 - ピペラジニル ) - 5 - ピリミジニル ) - 2 ' , 3 ' , 5 ' , 6 ' - テトラヒドロスピロ [ クロメノ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン - 5 , 4 ' - ピラン ] - 3 - アミン ;

N - ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - プリジニル ) - 2 ' , 3 ' , 5 ' , 6 ' - テトラ  
 ヒドロスピロ [ クロメノ [ 3 , 4 - d ] プリミジン - 5 , 4 ' - ピラン ] - 3 - アミン ;  
 N - ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) スピロ [ クロメノ [ 3 , 4 - d ] プリミジン  
 - 5 , 1 ' - シクロペンタン ] - 3 - アミン ;  
 N - ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - プリジニル ) スピロ [ クロメノ [ 3 , 4 - d ] プリ  
 ミジン - 5 , 1 ' - シクロペンタン ] - 3 - アミン ;  
 N - ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) スピロ [ クロメノ [ 3 , 4 - d ] プリミジン  
 - 5 , 1 ' - シクロブタン ] - 3 - アミン ;  
 7 - フルオロ - N - ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) - 2 ' , 3 ' , 5 ' , 6 ' -  
 テトラヒドロスピロ [ クロメノ [ 3 , 4 - d ] プリミジン - 5 , 4 ' - ピラン ] - 3 - ア  
 ミン ;  
 7 - フルオロ - N - ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) スピロ [ クロメノ [ 3 , 4 -  
 d ] プリミジン - 5 , 1 ' - シクロヘキサン ] - 3 - アミン ;  
 7 - フルオロ - N - ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - プリジニル ) スピロ [ クロメノ [ 3  
 , 4 - d ] プリミジン - 5 , 1 ' - シクロヘキサン ] - 3 - アミン ;  
 7 - ( メチルスルホニル ) - N - ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - プリジニル ) スピロ  
 [ クロメノ [ 3 , 4 - d ] プリミジン - 5 , 1 ' - シクロヘキサン ] - 3 - アミン ;  
 3 - ( ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - プリジニル ) アミノ ) スピロ [ クロメノ [ 3 ,  
 4 - d ] プリミジン - 5 , 1 ' - シクロヘキサン ] - 7 - カルボニトリル ;  
 N - ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) - 2 , 3 , 5 , 6 - テトラヒドロスピロ [ ピ  
 ラン - 4 , 6 ' - ピリド [ 2 ' , 3 ' : 5 , 6 ] ピラノ [ 3 , 4 - d ] プリミジン ] - 8  
 ' - アミン ;  
 4 , 4 - ジメチル - N - ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - プリジニル ) スピロ [ シクロ  
 ヘキサン - 1 , 5 ' - ピリド [ 3 ' , 2 ' : 5 , 6 ] ピラノ [ 3 , 4 - d ] プリミジン ]  
 - 3 ' - アミン ;  
 4 , 4 - ジメチル - N - ( 6 - ( 1 - ピペラジニル ) - 3 - プリジニル ) スピロ [ シクロ  
 ヘキサン - 1 , 5 ' - ピリド [ 3 ' , 2 ' : 5 , 6 ] ピラノ [ 3 , 4 - d ] プリミジン ]  
 - 3 ' - アミン ;  
 N - ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) スピロ [ シクロヘキサン - 1 , 5 ' - ピリド  
 [ 3 ' , 2 ' : 5 , 6 ] ピラノ [ 3 , 4 - d ] プリミジン ] - 3 ' - アミン ;  
 N - ( 6 - ( 1 - ピペラジニル ) - 3 - プリジニル ) スピロ [ シクロヘキサン - 1 , 5 '  
 - ピリド [ 3 ' , 2 ' : 5 , 6 ] ピラノ [ 3 , 4 - d ] プリミジン ] - 3 ' - アミン ;  
 N - ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - プリジニル ) スピロ [ シクロヘキサン - 1 , 5 '  
 - ピリド [ 3 ' , 2 ' : 5 , 6 ] ピラノ [ 3 , 4 - d ] プリミジン ] - 3 ' - アミン ;  
 N - ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) - 2 , 3 , 5 , 6 - テトラヒドロスピロ [ ピ  
 ラン - 4 , 5 ' - ピリド [ 3 ' , 2 ' : 5 , 6 ] ピラノ [ 3 , 4 - d ] プリミジン ] - 3  
 ' - アミン ;  
 N - ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - プリジニル ) - 2 , 3 , 5 , 6 - テトラヒドロス  
 ピロ [ ピラン - 4 , 5 ' - ピリド [ 3 ' , 2 ' : 5 , 6 ] ピラノ [ 3 , 4 - d ] プリミジ  
 ン ] - 3 ' - アミン ;  
 2 , 2 - ジメチル - N - ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) - 2 , 3 , 5 , 6 - テト  
 ラヒドロスピロ [ ピラン - 4 , 5 ' - ピリド [ 3 ' , 2 ' : 5 , 6 ] ピラノ [ 3 , 4 - d  
 ] プリミジン ] - 3 ' - アミン ;  
 ( 4 S ) - 2 , 2 - ジメチル - N - ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) - 2 , 3 , 5  
 , 6 - テトラヒドロスピロ [ ピラン - 4 , 5 ' - ピリド [ 3 ' , 2 ' : 5 , 6 ] ピラノ [ 3  
 , 4 - d ] プリミジン ] - 3 ' - アミン ;  
 ( 4 R ) - 2 , 2 - ジメチル - N - ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) - 2 , 3 , 5  
 , 6 - テトラヒドロスピロ [ ピラン - 4 , 5 ' - ピリド [ 3 ' , 2 ' : 5 , 6 ] ピラノ [ 3  
 , 4 - d ] プリミジン ] - 3 ' - アミン ;  
 ジスピロ [ 1 , 3 - ジオキソラン - 2 , 1 ' - シクロヘキサン - 4 ' , 5 " - ピリド [ 3

' , 2 ' : 5 , 6 ] ピラノ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン ] - 3 " - アミン ;  
 3 ' - ( ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - ピリジニル ) アミノ ) スピロ [ シクロヘキサ  
 ン - 1 , 5 ' - ピリド [ 3 ' , 2 ' : 5 , 6 ] ピラノ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン ] - 4 -  
 オール ;  
 4 , 4 - ジフルオロ - N - ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - ピリジニル ) スピロ [ シク  
 ロヘキサン - 1 , 5 ' - ピリド [ 3 ' , 2 ' : 5 , 6 ] ピラノ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン  
 ] - 3 ' - アミン ;  
 4 , 4 - ジメチル - N - ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - ピリジニル ) スピロ [ シクロ  
 ヘキサ - 2 - エン - 1 , 9 ' - ピリド [ 4 ' , 3 ' : 3 , 4 ] シクロペンタ [ 1 , 2 - d  
 ] ピリミジン ] - 2 ' - アミン ;  
 4 , 4 - ジメチル - N - ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) スピロ [ シクロヘキサ -  
 2 - エン - 1 , 9 ' - ピリド [ 4 ' , 3 ' : 3 , 4 ] シクロペンタ [ 1 , 2 - d ] ピリミ  
 ジン ] - 2 ' - アミン ;  
 N - ( 6 - ( 4 - ( ジメチルアミノ ) - 1 - ピペリジニル ) - 3 - ピリジニル ) - 4 , 4  
 - ジメチルスピロ [ シクロヘキサ - 2 - エン - 1 , 9 ' - ピリド [ 4 ' , 3 ' : 3 , 4 ]  
 シクロペンタ [ 1 , 2 - d ] ピリミジン ] - 2 ' - アミン ;  
 4 , 4 - ジメチル - N - ( 6 - ( 4 - メチル - 1 - ピペラジニル ) - 3 - ピリジニル ) ス  
 ピロ [ シクロヘキサ - 2 - エン - 1 , 9 ' - ピリド [ 4 ' , 3 ' : 3 , 4 ] シクロペンタ  
 [ 1 , 2 - d ] ピリミジン ] - 2 ' - アミン ;  
 N - ( 6 - ( 1 - ピペラジニル ) - 3 - ピリジニル ) スピロ [ シクロヘキサン - 1 , 9 '  
 - ピリド [ 4 ' , 3 ' : 3 , 4 ] シクロペンタ [ 1 , 2 - d ] ピリミジン ] - 2 ' - アミ  
 ン ;  
 N - ( 4 - ( 1 - ピペラジニルカルボニル ) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) スピロ [ シ  
 クロヘキサン - 1 , 9 ' - ピリド [ 4 ' , 3 ' : 3 , 4 ] シクロペンタ [ 1 , 2 - d ]  
 ピリミジン ] - 2 ' - アミン ;  
 7 , 7 - ジメチル - N - ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5  
 H - シクロペンタ [ d ] ピリミジン - 2 - アミン ;  
 N - ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) スピロ [ インデノ [ 2 , 1 - d ] ピリミジン  
 - 9 , 4 ' - ピペリジン ] - 2 - アミン ;  
 N - ( 4 - ( 1 - ピペリジニル ) フェニル ) スピロ [ インデノ [ 2 , 1 - d ] ピリミジン  
 - 9 , 4 ' - ピペリジン ] - 2 - アミン ;  
 N - ( 4 - ( 4 - モルホリニル ) フェニル ) スピロ [ インデノ [ 2 , 1 - d ] ピリミジン  
 - 9 , 4 ' - ピペリジン ] - 2 - アミン ;  
 1 ' - メチル - N - ( 4 - ( 4 - メチル - 1 - ピペラジニル ) フェニル ) スピロ [ インデ  
 ノ [ 2 , 1 - d ] ピリミジン - 9 , 4 ' - ピペリジン ] - 2 - アミン ;  
 N - ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) - 2 ' , 3 ' , 5 ' , 6 ' - テトラヒドロス  
 ピロ [ インデノ [ 2 , 1 - d ] ピリミジン - 9 , 4 ' - ピラン ] - 2 - アミン ;  
 N - ( 4 - ( 4 - メチル - 1 - ピペラジニル ) フェニル ) - 2 ' , 3 ' , 5 ' , 6 ' - テ  
 トラヒドロスピロ [ インデノ [ 2 , 1 - d ] ピリミジン - 9 , 4 ' - ピラン ] - 2 - アミ  
 ン ;  
 N - ( 3 - フルオロ - 4 - ( 4 - メチル - 1 - ピペラジニル ) フェニル ) - 2 ' , 3 ' ,  
 5 ' , 6 ' - テトラヒドロスピロ [ インデノ [ 2 , 1 - d ] ピリミジン - 9 , 4 ' - ピラ  
 ン ] - 2 - アミン ;  
 t e r t - ブチル 4 - ( 4 - ( スピロ [ シクロヘキサン - 1 , 9 ' - インデノ [ 2 , 1  
 - d ] ピリミジン ] - 2 ' - イルアミノ ) フェニル ) - 1 - ピペラジンカルボキシレート  
 ;  
 N - ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) スピロ [ シクロヘキサン - 1 , 9 ' - インデ  
 ノ [ 2 , 1 - d ] ピリミジン ] - 2 ' - アミン ;  
 N - ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - ピリジニル ) スピロ [ シクロペンタン - 1 , 9 '  
 - ピリド [ 4 ' , 3 ' : 3 , 4 ] シクロペンタ [ 1 , 2 - d ] ピリミジン ] - 2 ' - アミ



ン；

9, 9 - ジエチル - N - ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - ピリジニル ) - 9 H - ピリド  
[ 4 ' , 3 ' : 3 , 4 ] シクロペンタ [ 1 , 2 - d ] ピリミジン - 2 - アミン

N - ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - ピリジニル ) - 2 , 3 , 5 , 6 - テトラヒドロス  
ピロ [ ピラン - 4 , 9 ' - ピリド [ 4 ' , 3 ' : 3 , 4 ] シクロペンタ [ 1 , 2 - d ] ピ  
リミジン ] - 2 ' - アミン；

N - ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - ピリジニル ) スピロ [ シクロヘプタン - 1 , 9 '  
- ピリド [ 4 ' , 3 ' : 3 , 4 ] シクロペンタ [ 1 , 2 - d ] ピリミジン ] - 2 ' - アミ  
ン；

N - ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - ピリジニル ) スピロ [ シクロヘキサン - 1 , 9 '  
- ピリド [ 4 ' , 3 ' : 3 , 4 ] シクロペンタ [ 1 , 2 - d ] ピリミジン ] - 2 ' - アミ  
ン；

( 3 R ) - 1 - ( 6 - ( スピロ [ シクロヘキサン - 1 , 9 ' - ピリド [ 4 ' , 3 ' : 3 ,  
4 ] シクロペンタ [ 1 , 2 - d ] ピリミジン ] - 2 ' - イルアミノ ) - 3 - ビリダジニル  
 ) - 3 - ピロリジノール；

2 ' - ( ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) アミノ ) スピロ [ シクロヘプタン - 1 ,  
7 ' - ピロロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン ] - 5 ' ( 6 ' H ) - オン；

2 ' - ( ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) アミノ ) スピロ [ シクロヘキサン - 1 ,  
7 ' - ピロロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン ] - 5 ' ( 6 ' H ) - オン；

2 ' - ( ( 4 - ( 1 - ピペラジニル ) フェニル ) アミノ ) スピロ [ シクロペンタン - 1 ,  
7 ' - ピロロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン ] - 5 ' ( 6 ' H ) - オン；

2 ' - ( ( 4 - ( 4 - メチル - 1 - ピペラジニル ) フェニル ) アミノ ) スピロ [ シクロヘ  
キサン - 1 , 7 ' - ピロロ [ 3 , 4 - d ] ピリミジン ] - 5 ' ( 6 ' H ) - オン；

5 ' - メチル - 2 ' - ( ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - ピリジニル ) アミノ ) - 6 '  
 , 7 ' - ジヒドロ - 5 ' H - スピロ [ シクロペンタ - 3 - エン - 1 , 8 ' - キナゾリン ]  
 - 7 ' - オール；

5 ' - メチル - 2 ' - ( ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - ピリジニル ) アミノ ) - 6 '  
 , 7 ' - ジヒドロ - 5 ' H - スピロ [ シクロペンタン - 1 , 8 ' - キナゾリン ] - 7 ' -  
 オール；

5 ' - メチル - 2 ' - ( ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - ピリジニル ) アミノ ) - 7 '  
 H - スピロ [ シクロペンタン - 1 , 8 ' - キナゾリン ] - 7 ' - オン；

5 ' - メチル - 2 ' - ( ( 5 - ( 1 - ピペラジニル ) - 2 - ピリジニル ) アミノ ) - 5 '  
 , 6 ' - ジヒドロ - 7 ' H - スピロ [ シクロペンタ - 3 - エン - 1 , 8 ' - キナゾリン ]  
 - 7 ' - オン；

4 , 4 - ジメチル - N - ( 6 - ( 4 - ( ジメチルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ) - 3 -  
ピリジニル ) スピロ [ シクロヘキサ - 2 - エン - 1 , 9 ' - ピリド [ 4 ' , 3 ' : 3 , 4  
 ] シクロペンタ [ 1 , 2 - d ] ピリミジン ] - 2 ' - アミン；

4 , 4 - ジメチル - N - ( 6 - ( 4 - ( ジメチルアミノ ) ピペリジン - 1 - イル ) - ビリ  
ダジン - 3 - イル ) スピロ [ シクロヘキサ - 2 - エン - 1 , 9 ' - ピリド [ 4 ' , 3 ' :  
3 , 4 ] シクロペンタ [ 1 , 2 - d ] ピリミジン ] - 2 ' - アミン；および

4 , 4 - ジメチル - N - ( 6 - ( ( シス - 3 , 5 - ジメチルピペラジン - 1 - イル ) ピリ  
ジン - 3 - イル ) スピロ [ シクロヘキサ - 2 - エン - 1 , 9 ' - ピリド [ 4 ' , 3 ' : 3  
 , 4 ] シクロペンタ [ 1 , 2 - d ] ピリミジン ] - 2 ' - アミン

から選択される化合物およびこれらの薬学的に許容される塩。

#### 【請求項 3 2】

薬学的に許容される媒体、補助剤または希釈剤と共に、有効量の請求項 1 に記載の化合  
物を含む医薬組成物。

#### 【請求項 3 3】

対象の癌を治療するための、請求項 3 2 に記載の医薬組成物。

#### 【請求項 3 4】

抗生物質型薬剤、アルキル化剤、代謝拮抗剤、ホルモン剤、免疫剤、インターフェロン型薬剤および様々な薬剤から選択される、少なくとも１種の化合物をさらに含む、請求項３３に記載の医薬組成物。

【請求項３５】

対象の腫瘍サイズを低減するための、請求項３２に記載の医薬組成物。

【請求項３６】

対象のｃｄｋ４またはｃｄｋ６介在障害を治療するための、請求項３２に記載の医薬組成物。

【請求項３７】

対象の腫瘍の転移を低減するための、請求項３２に記載の医薬組成物。

【請求項３８】

癌の治療のための薬剤を調製するための、請求項１に記載の化合物の使用。