

【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29年2月2日 (2017.2.2)

【公表番号】特表2016-505596(P2016-505596A)

【公表日】平成28年2月25日 (2016.2.25)

【年通号数】公開・登録公報2016-012

【出願番号】特願2015-549821(P2015-549821)

【国際特許分類】

C 0 7 D 217/16 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/472 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 7/06 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

C 1 2 N 9/99 (2006.01)

C 1 2 N 5/071 (2010.01)

C 1 2 N 9/10 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 217/16

C 0 7 D 487/04 1 4 2

C 0 7 D 401/12 C S P

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 417/12

C 0 7 D 401/14

A 6 1 K 31/4725

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/472

A 6 1 K 31/497

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/10  
 A 6 1 P 7/06  
 A 6 1 P 7/00  
 C 1 2 N 9/99 Z N A  
 C 1 2 N 5/071  
 C 1 2 N 9/10

## 【手続補正書】

【提出日】平成28年12月15日(2016.12.15)

## 【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

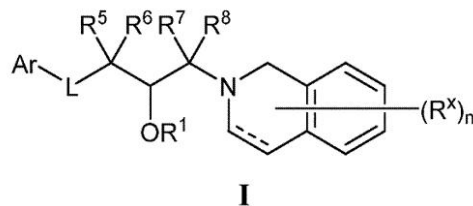
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物又はその薬学的に許容される塩。



(式中、

-----

が、単結合又は二重結合を表し；

$R^1$  が、水素、 $R^2$ 、又は  $C(O)R^2$  であり、ここで、 $R^2$  が、任意に置換される  $C_{1-6}$  アルキルであり；

$L$  が、 $-N(R)C(O)-$ 、 $-C(O)N(R)-$ 、 $-N(R)C(O)O-$ 、又は  $OC(O)N(R)-$  であり；

各  $R$  が、独立して、水素又は任意に置換される  $C_{1-6}$  脂肪族であり；

$Ar$  が、窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される0～4個のヘテロ原子を有する単環式又は二環式芳香環であり、ここで、原子価が許容される場合、 $Ar$  が、0、1、2、3、4、又は5つの  $R^y$  基で置換され；

各  $R^y$  が、独立して、ハロ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、任意に置換される脂肪族、任意に置換されるカルボシクリル、任意に置換されるアリール、任意に置換されるヘテロシクリル、任意に置換されるヘテロアリール、 $-OR^A$ 、 $-N(R^B)_2$ 、 $-SR^A$ 、 $-C(=O)R^A$ 、 $-C(O)OR^A$ 、 $-C(O)SR^A$ 、 $-C(O)N(R^B)_2$ 、 $-C(O)N(R^B)N(R^B)_2$ 、 $-OC(O)R^A$ 、 $-OC(O)N(R^B)_2$ 、 $-NR^B C(O)R^A$ 、 $-NR^B C(O)N(R^B)_2$ 、 $-NR^B C(O)N(R^B)N(R^B)_2$ 、 $-NR^B C(O)OR^A$ 、 $-SC(O)R^A$ 、 $-C(=NR^B)R^A$ 、 $-C(=NNR^B)R^A$ 、 $-C(=NOR^A)R^A$ 、 $-C(=NR^B)N(R^B)_2$ 、 $-NR^B C(=NR^B)R^B$ 、 $-C(=S)R^A$ 、 $-C(=S)N(R^B)_2$ 、 $-NR^B C(=S)R^A$ 、 $-S(O)R^A$ 、 $-OS(O)_2 R^A$ 、 $-SO_2 R^A$ 、 $-NR^B SO_2 R^A$  及び  $SO_2 N(R^B)_2$  からなる群から選択され；

各  $R^A$  が、独立して、水素、任意に置換される脂肪族、任意に置換されるカルボシクリル、任意に置換されるヘテロシクリル、任意に置換されるアリール、および任意に置換されるヘテロアリールからなる群から選択され；

各  $R^B$  が、独立して、水素、任意に置換される脂肪族、任意に置換されるカルボシクリル

ル、任意に置換されるヘテロシクリル、任意に置換されるアリール、および任意に置換されるヘテロアリールからなる群から選択され、又は2つの $R^B$ 基が、それらの介在原子と一緒に、任意に置換される複素環を形成し；

$R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、および $R^8$ が、独立して、水素、ハロ、又は任意に置換される脂肪族であり；

各 $R^x$ が、独立して、ハロ、 $-CN$ 、任意に置換される脂肪族、 $-OR'$ 、および $-N(R'')$ からなる群から選択され；

$R'$ が、水素又は任意に置換される脂肪族であり；

各 $R''$ が、独立して、水素又は任意に置換される脂肪族であり、又は2つの $R''$ が、それらの介在原子と一緒に、複素環を形成し；

原子価が許容される場合、 $n$ が、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、又は10であり；

ここで、特に規定されない限り、

ヘテロシクリル又は複素環式が、環炭素原子および1～4個の環ヘテロ原子を有する3～10員非芳香環系の基を指し、各ヘテロ原子が、独立して、窒素、酸素、および硫黄から選択され；

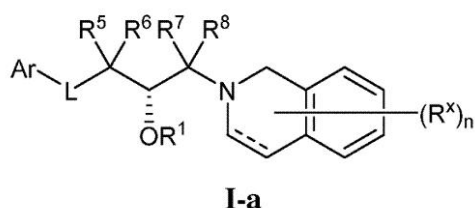
カルボシクリル又は炭素環式が、前記非芳香環系中に3～10個の環炭素原子および0個のヘテロ原子を有する非芳香族環状炭化水素基の基を指し；

アリールが、単環式又は多環式芳香環系であって、前記芳香環系に提供される6～14個の環炭素原子および0個のヘテロ原子を有する単環式又は多環式芳香環系の基を指し；

ヘテロアリールが、5～10員単環式又は二環式の $4n+2$ 個の芳香環系であって、前記芳香環系に提供される環炭素原子および1～4個の環ヘテロ原子を有する5～10員単環式又は二環式の $4n+2$ 個の芳香環系の基を指し、各ヘテロ原子が、独立して、窒素、酸素および硫黄から選択される。)又は許容される塩

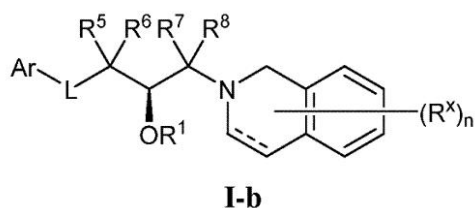
#### 【請求項2】

前記化合物が、式(I-a)の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項1に記載の化合物。



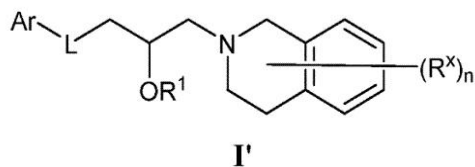
#### 【請求項3】

前記化合物が、式(I-b)の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項1に記載の化合物。



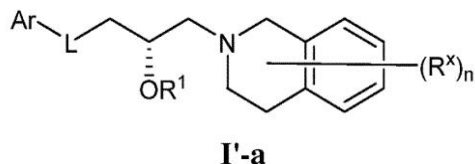
#### 【請求項4】

前記化合物が、式(I')の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項1に記載の化合物。



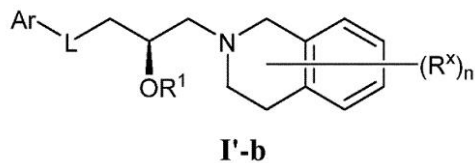
## 【請求項 5】

前記化合物が、式 ( I ' - a ) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 4 に記載の化合物。



## 【請求項 6】

前記化合物が、式 ( I ' - b ) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 4 に記載の化合物。



## 【請求項 7】

L が - C ( O ) N ( R ) - である請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 8】

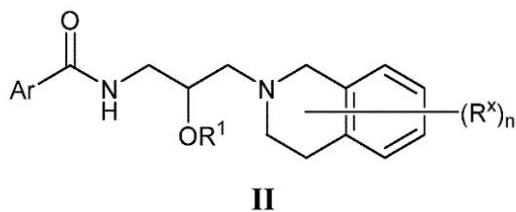
L が - N ( R ) C ( O ) - である請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 9】

L が - O C ( O ) N H - である請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物。

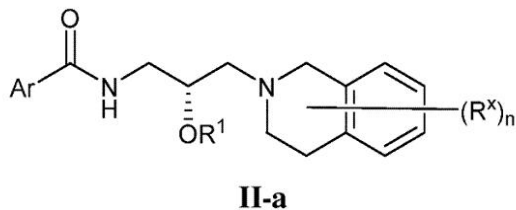
## 【請求項 10】

前記化合物が、式 ( I I ) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。



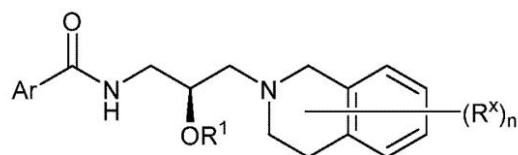
## 【請求項 11】

前記化合物が、式 ( I I - a ) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 10 に記載の化合物。



## 【請求項 12】

前記化合物が、式 ( I I - b ) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 10 に記載の化合物。

**II-b****【請求項 13】**

R<sup>1</sup> が水素である請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 14】**

n が 0 である請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 15】**

n が 1 である請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 16】**

n が 2 である請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 17】**

Ar がフェニルである請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 18】**

Ar がヘテロアリールである請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 19】**

Ar が、窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 6 員ヘテロアリールである請求項 18 に記載の化合物。

**【請求項 20】**

Ar がピリジルである請求項 19 に記載の化合物。

**【請求項 21】**

Ar が非置換である請求項 1 ~ 20 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 22】**

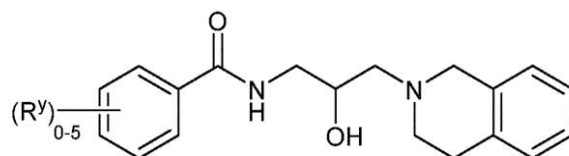
Ar が、1 つ又は 2 つの R<sup>y</sup> 基で置換される請求項 1 ~ 20 のいずれか一項に記載の化合物。

**【請求項 23】**

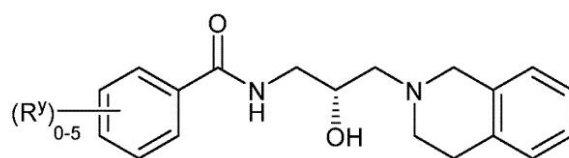
Ar が、1 つの R<sup>y</sup> 基で置換される請求項 22 に記載の化合物。

**【請求項 24】**

前記化合物が、式 (III) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**III****【請求項 25】**

前記化合物が、式 (III-a) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 24 に記載の化合物。

**III-a**

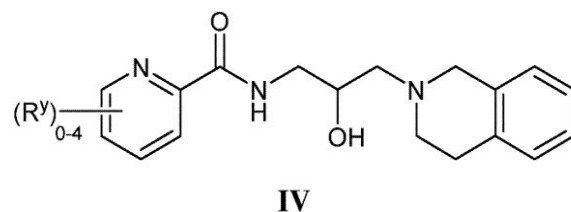
## 【請求項 26】

前記化合物が、式 (III-b) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 24 に記載の化合物。



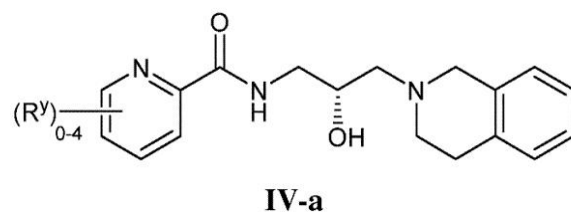
## 【請求項 27】

前記化合物が、式 (IV) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。



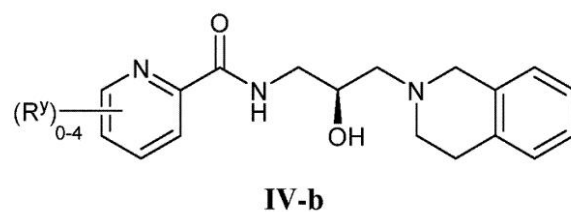
## 【請求項 28】

前記化合物が、式 (IV-a) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。



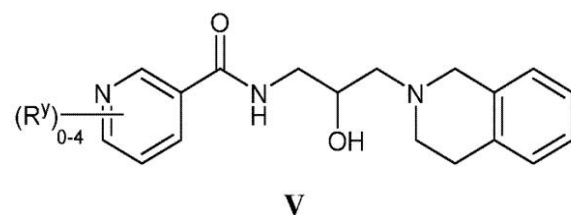
## 【請求項 29】

前記化合物が、式 (IV-b) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。



## 【請求項 30】

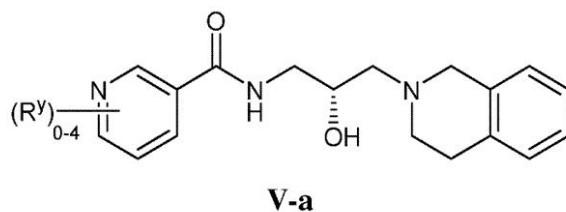
前記化合物が、式 (V) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。



## 【請求項 31】

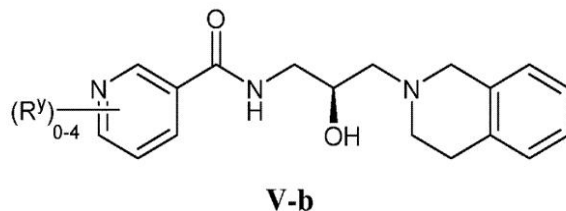
前記化合物が、式 (V-a) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に

記載の化合物。



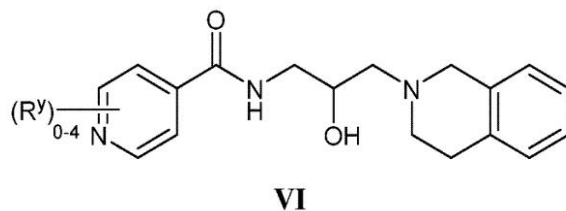
【請求項 3 2】

前記化合物が、式 ( V - b ) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。



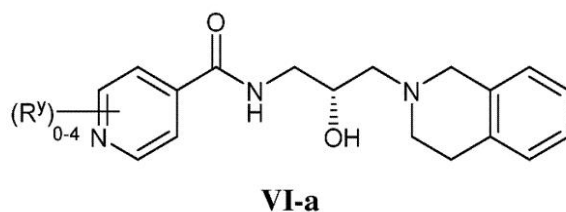
【請求項 3 3】

前記化合物が、式 ( V I ) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。



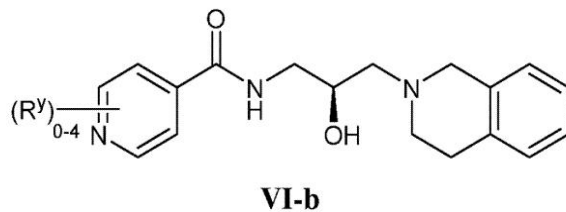
【請求項 3 4】

前記化合物が、式 ( V I - a ) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。



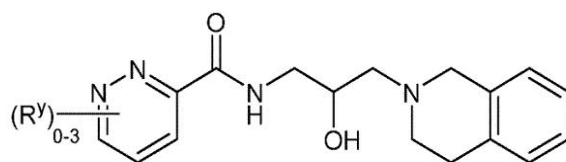
【請求項 3 5】

前記化合物が、式 ( V I - b ) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

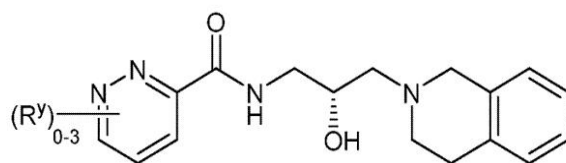


【請求項 3 6】

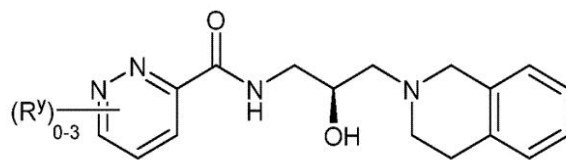
前記化合物が、式 ( V I I ) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**VII****【請求項 37】**

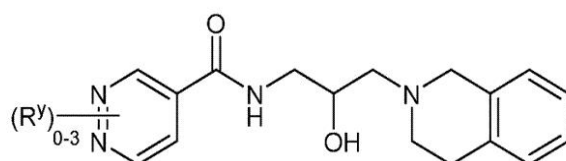
前記化合物が、式 (VII-a) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**VII-a****【請求項 38】**

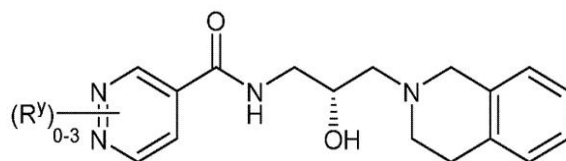
前記化合物が、式 (VII-b) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**VII-b****【請求項 39】**

前記化合物が、式 (VIII) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

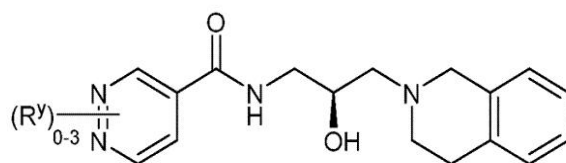
**VIII****【請求項 40】**

前記化合物が、式 (VIII-a) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

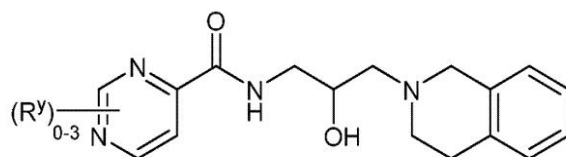
**VIII-a****【請求項 41】**

前記化合物が、式 (VIII-b) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

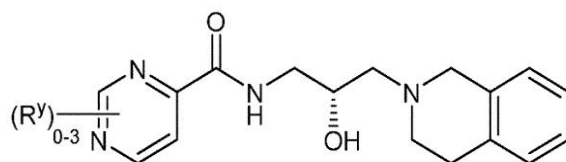


**VIII-b****【請求項 4 2】**

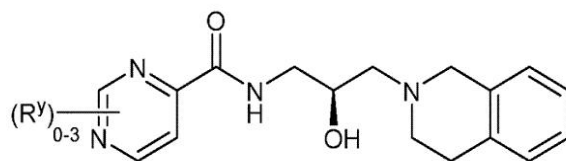
前記化合物が、式 (IX) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**IX****【請求項 4 3】**

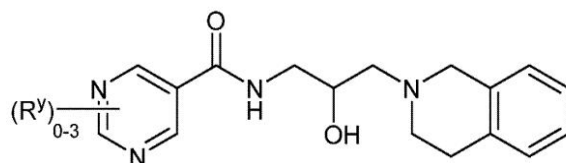
前記化合物が、式 (IX-a) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**IX-a****【請求項 4 4】**

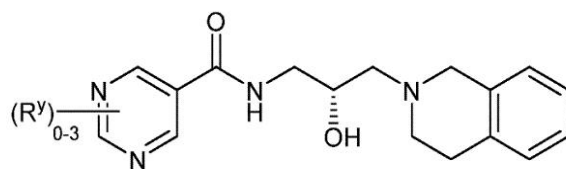
前記化合物が、式 (IX-b) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**IX-b****【請求項 4 5】**

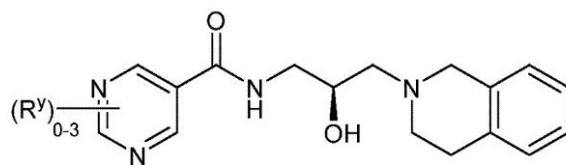
前記化合物が、式 (X) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**X****【請求項 4 6】**

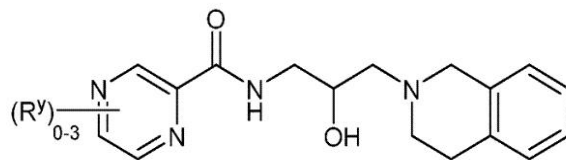
前記化合物が、式 (X-a) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**X-a****【請求項 47】**

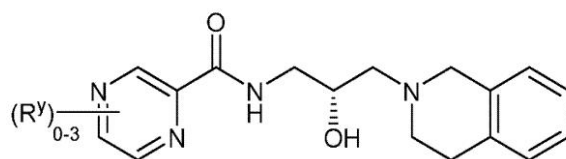
前記化合物が、式 (X - b) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**X-b****【請求項 48】**

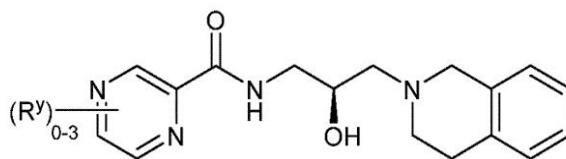
前記化合物が、式 (XI) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**XI****【請求項 49】**

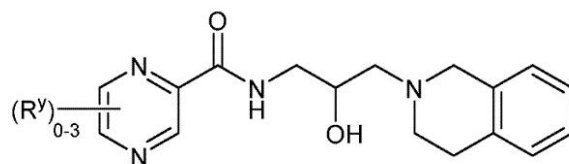
前記化合物が、式 (XI - a) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**XI-a****【請求項 50】**

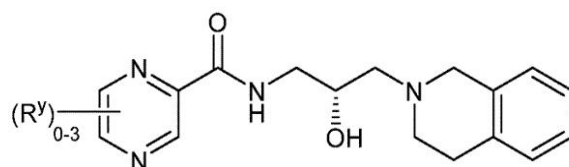
前記化合物が、式 (XI - b) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**XI-b****【請求項 51】**

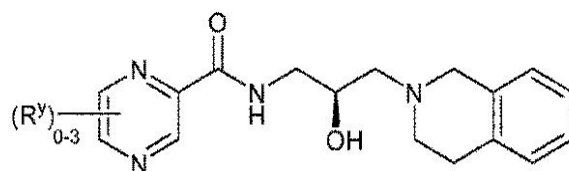
前記化合物が、式 (XII) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**XII****【請求項 5 2】**

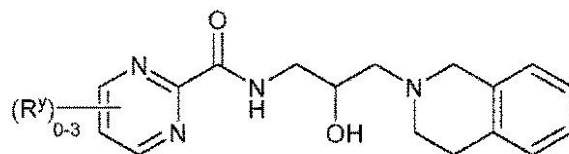
前記化合物が、式 (XII-a) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**XII-a****【請求項 5 3】**

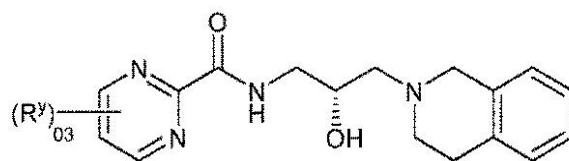
前記化合物が、式 (XII-b) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**XII-b****【請求項 5 4】**

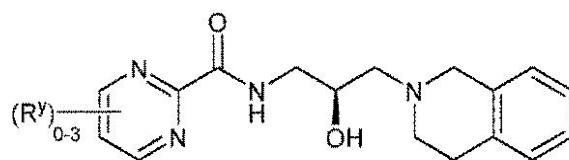
前記化合物が、式 (XIII) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**XIII****【請求項 5 5】**

前記化合物が、式 (XIII-a) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**XIII-a****【請求項 5 6】**

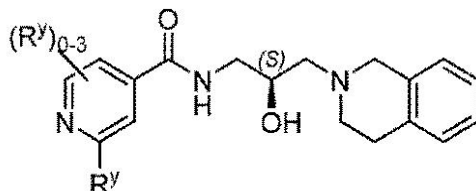
前記化合物が、式 (XIII-b) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。



XIII-b

## 【請求項 57】

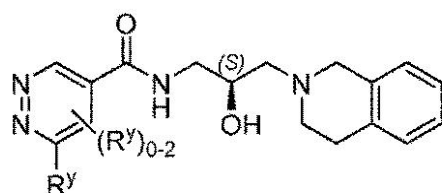
前記化合物が、式 (XV) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。



XV

## 【請求項 58】

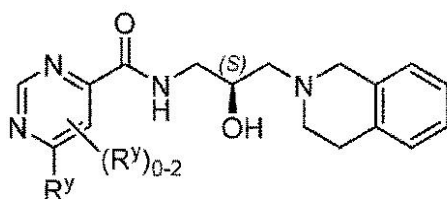
前記化合物が、式 (XVI) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。



XVI

## 【請求項 59】

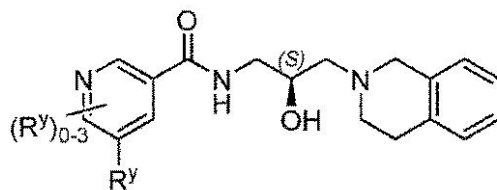
前記化合物が、式 (XVII) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。



XVII

## 【請求項 60】

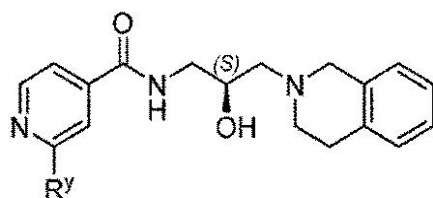
前記化合物が、式 (XVIII) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。



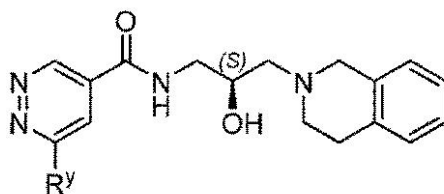
XVIII

## 【請求項 61】

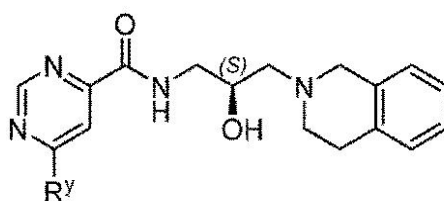
前記化合物が、式 (XV-a) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**XV-a****【請求項 6 2】**

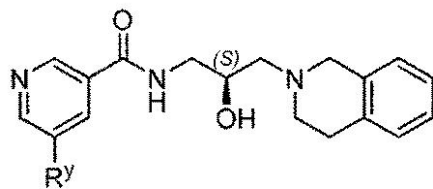
前記化合物が、式 (XVI-a) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**XVI-a****【請求項 6 3】**

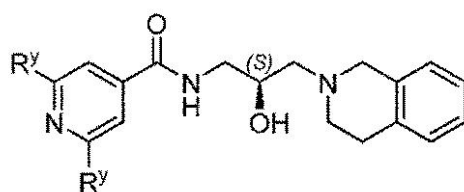
前記化合物が、式 (XVII-a) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**XVII-a****【請求項 6 4】**

前記化合物が、式 (XVIII-a) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**XVIII-a****【請求項 6 5】**

前記化合物が、式 (XV-b) の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 に記載の化合物。

**XV-b**

## 【請求項 66】

少なくとも1つのR<sup>Y</sup>が、ヘテロアリール又はヘテロシクリルである請求項1～20および22～65のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 67】

少なくとも1つのR<sup>Y</sup>が、窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される1～3個のヘテロ原子を有する5～6員ヘテロアリールである請求項66に記載の化合物。

## 【請求項 68】

少なくとも1つのR<sup>Y</sup>が、1～3個の窒素を有する6員ヘテロアリールである請求項67に記載の化合物。

## 【請求項 69】

少なくとも1つのR<sup>Y</sup>がピリジルである請求項68に記載の化合物。

## 【請求項 70】

少なくとも1つのR<sup>Y</sup>が、窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される1～3個のヘテロ原子を有する5員ヘテロアリールである請求項67に記載の化合物。

## 【請求項 71】

少なくとも1つのR<sup>Y</sup>が、任意に置換されるピラゾールである請求項70に記載の化合物。

## 【請求項 72】

少なくとも1つのR<sup>Y</sup>がピロールである請求項70に記載の化合物。

## 【請求項 73】

少なくとも1つのR<sup>Y</sup>が、窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される1～2個のヘテロ原子を有する5～6員ヘテロシクリルである請求項66に記載の化合物。

## 【請求項 74】

少なくとも1つのR<sup>Y</sup>が、窒素、酸素、および硫黄から選択される1個のヘテロ原子を有する5員ヘテロシクリルである請求項73に記載の化合物。

## 【請求項 75】

少なくとも1つのR<sup>Y</sup>が、任意に置換されるピロリジンである請求項74に記載の化合物。

## 【請求項 76】

少なくとも1つのR<sup>Y</sup>が、窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される1～2個のヘテロ原子を有する6員ヘテロシクリルである請求項73に記載の化合物。

## 【請求項 77】

少なくとも1つのR<sup>Y</sup>が、任意に置換されるピペラジンである請求項76に記載の化合物。

## 【請求項 78】

少なくとも1つのR<sup>Y</sup>がモルホリンである請求項76に記載の化合物。

## 【請求項 79】

少なくとも1つのR<sup>Y</sup>が、任意に置換される脂肪族である請求項1～20および22～65のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 80】

少なくとも1つのR<sup>Y</sup>が、任意に置換されるC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルである請求項79に記載の化合物。

## 【請求項 81】

少なくとも1つのR<sup>Y</sup>が、アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリルで置換されるC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルである請求項80に記載の化合物。

## 【請求項 82】

少なくとも1つのR<sup>Y</sup>が、-CH<sub>2</sub>-アリール、-CH<sub>2</sub>-ヘテロアリール、又はCH<sub>2</sub>-ヘテロシクリルである請求項81に記載の化合物。

## 【請求項 83】

少なくとも1つのR<sup>Y</sup>が-N(R<sup>B</sup>)<sub>2</sub>である請求項1～20および22～65のい

れか一項に記載の化合物。

【請求項 8 4】

一方の  $R^B$  が、任意に置換されるヘテロシクリルであり、他方の  $R^B$  が  $C_1 \sim 4$  アルキルである請求項 8 3 に記載の化合物。

【請求項 8 5】

一方の  $R^B$  が、任意に置換されるヘテロアリールであり、他方の  $R^B$  が  $C_1 \sim 4$  アルキルである請求項 8 3 に記載の化合物。

【請求項 8 6】

一方の  $R^B$  が、任意に置換されるシクロアルキルであり、他方の  $R^B$  が  $C_1 \sim 4$  アルキルである請求項 8 3 に記載の化合物。

【請求項 8 7】

少なくとも 1 つの  $R^Y$  が  $-NHR^B$  である請求項 8 3 に記載の化合物。

【請求項 8 8】

$R^B$  が、任意に置換されるヘテロシクリルである請求項 8 7 に記載の化合物。

【請求項 8 9】

$R^B$  が、任意に置換されるヘテロアリールである請求項 8 7 に記載の化合物。

【請求項 9 0】

$R^B$  が、任意に置換されるシクロアルキルである請求項 8 7 に記載の化合物。

【請求項 9 1】

少なくとも 1 つの  $R^Y$  が  $-SO_2N(R^B)_2$  である請求項 1 ~ 2 0 および 2 2 ~ 6 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9 2】

少なくとも 1 つの  $R^Y$  が  $-SO_2NHR^B$  である請求項 9 1 に記載の化合物。

【請求項 9 3】

少なくとも 1 つの  $R^Y$  が  $-SO_2NH_2$  である請求項 9 2 に記載の化合物。

【請求項 9 4】

少なくとも 1 つの  $R^Y$  が  $-C(O)N(R^B)_2$  である請求項 1 ~ 2 0 および 2 2 ~ 6 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9 5】

少なくとも 1 つの  $R^Y$  が  $-C(O)NHR^B$  である請求項 9 4 に記載の化合物。

【請求項 9 6】

少なくとも 1 つの  $R^Y$  が  $-C(O)NH_2$  である請求項 9 5 に記載の化合物。

【請求項 9 7】

少なくとも 1 つの  $R^Y$  が  $-NR^BC(O)R^A$  である請求項 1 ~ 2 0 および 2 2 ~ 6 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9 8】

少なくとも 1 つの  $R^Y$  が  $-NHC(O)R^A$  である請求項 9 7 に記載の化合物。

【請求項 9 9】

少なくとも 1 つの  $R^Y$  が  $-NHC(O)CH_3$  である請求項 9 8 に記載の化合物。

【請求項 1 0 0】

少なくとも 1 つの  $R^Y$  が  $-NR^BSO_2R^A$  である請求項 1 ~ 2 0 および 2 2 ~ 6 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 0 1】

少なくとも 1 つの  $R^Y$  が  $-NH SO_2R^A$  である請求項 1 0 0 に記載の化合物。

【請求項 1 0 2】

少なくとも 1 つの  $R^Y$  が  $-NH SO_2CH_3$  である請求項 1 0 1 に記載の化合物。

【請求項 1 0 3】

少なくとも 1 つの  $R^Y$  が  $-OR^A$  である請求項 1 ~ 2 0 および 2 2 ~ 6 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 0 4】

$R^A$  が、任意に置換されるヘテロシクリルである請求項 103 に記載の化合物。

【請求項 105】

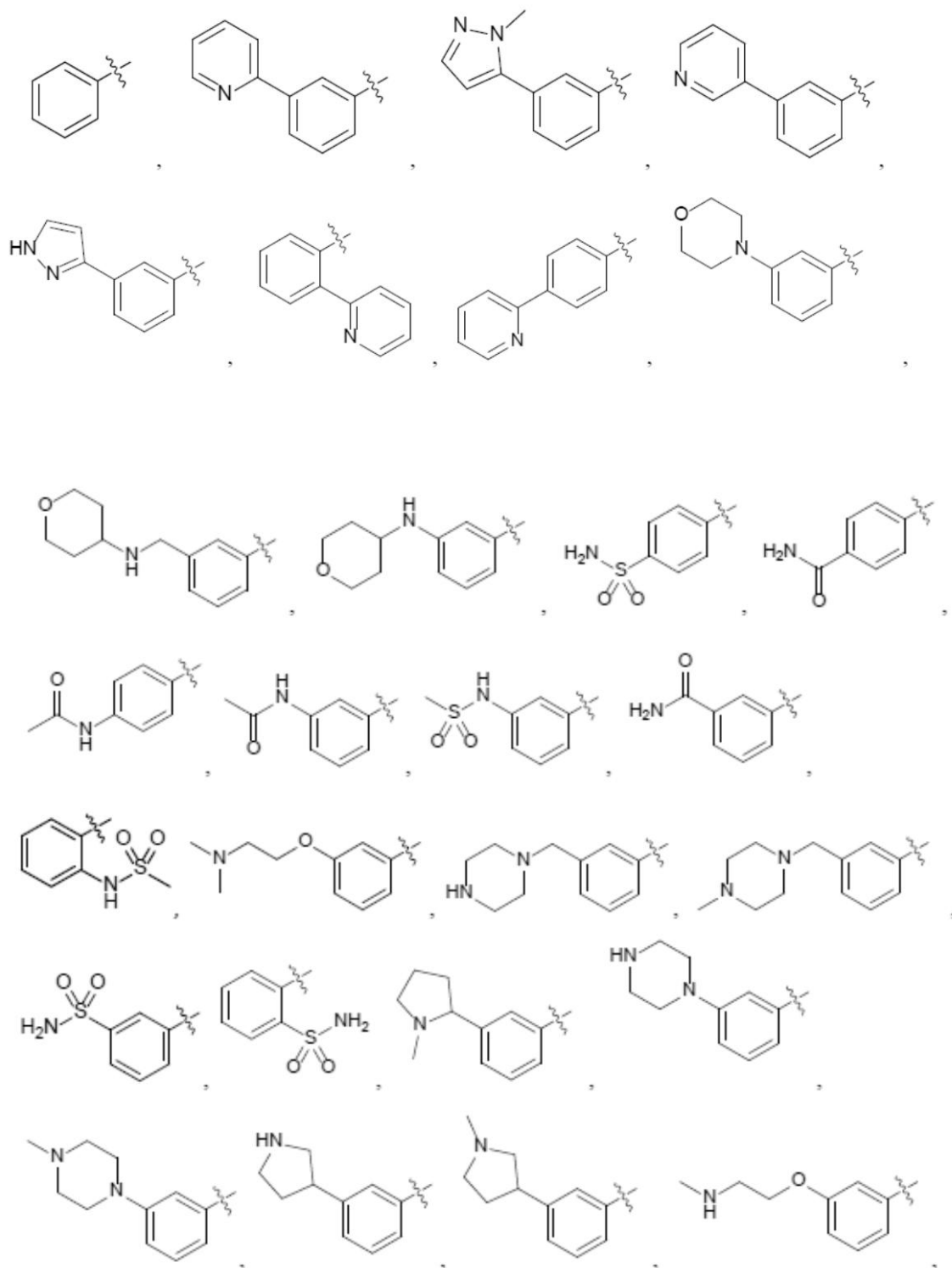
$R^A$  が、任意に置換されるヘテロアリールである請求項 103 に記載の化合物。

【請求項 106】

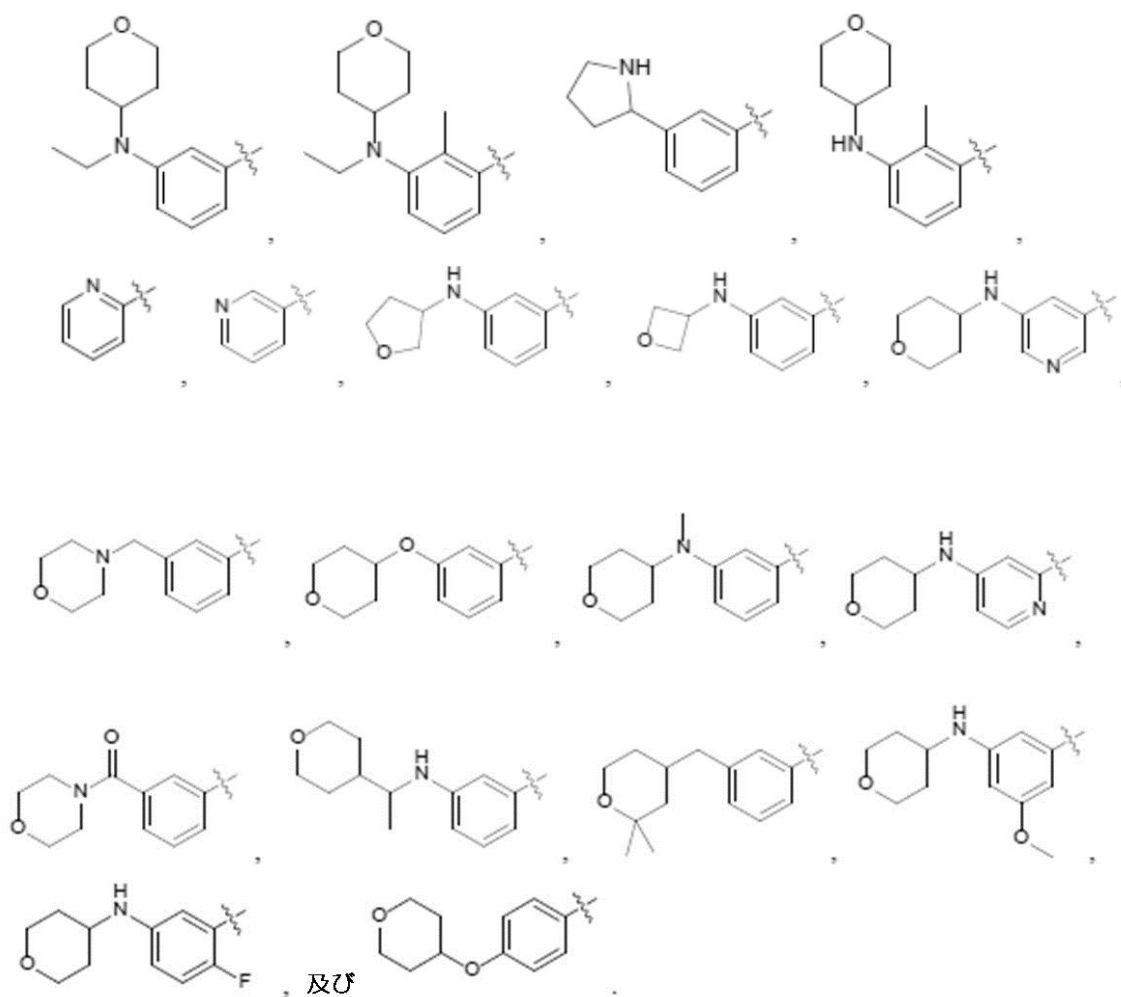
$R^A$  が、任意に置換されるシクロアルキルである請求項 103 に記載の化合物。

【請求項 107】

$Ar$  が、以下の基からなる群から選択される請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物。

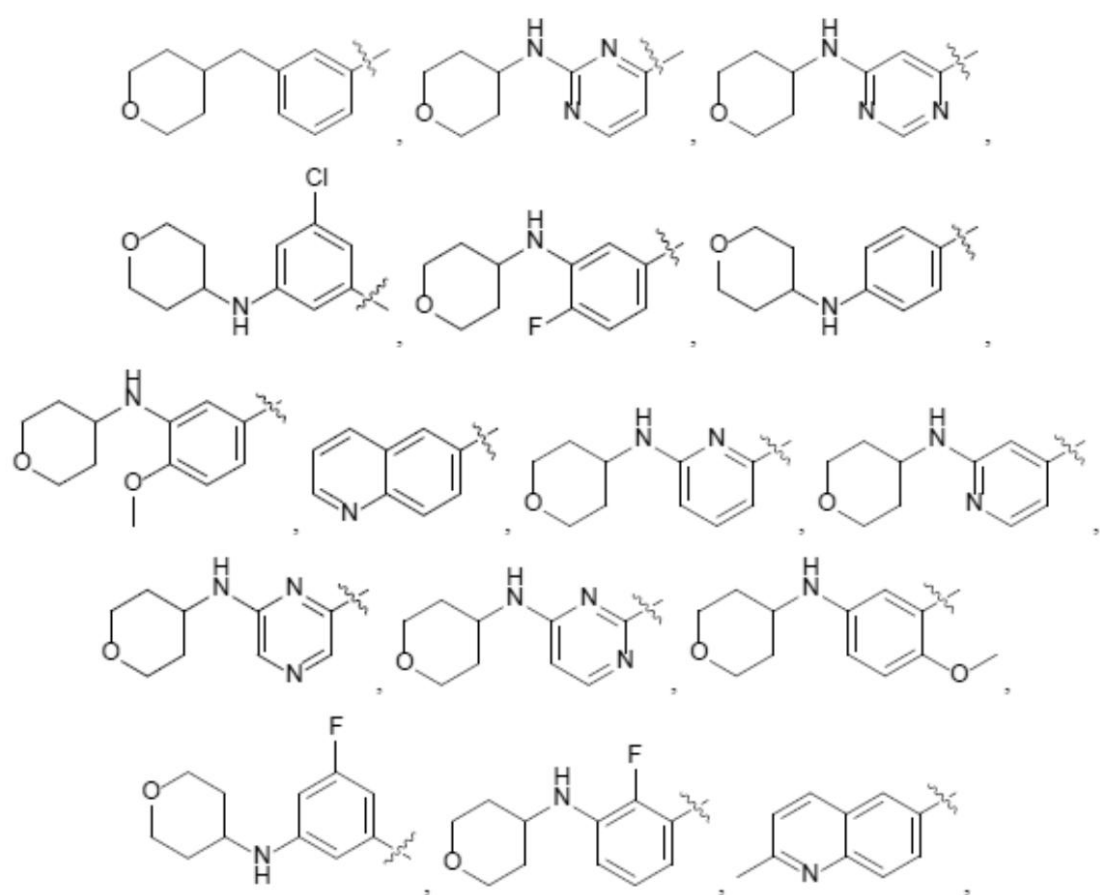


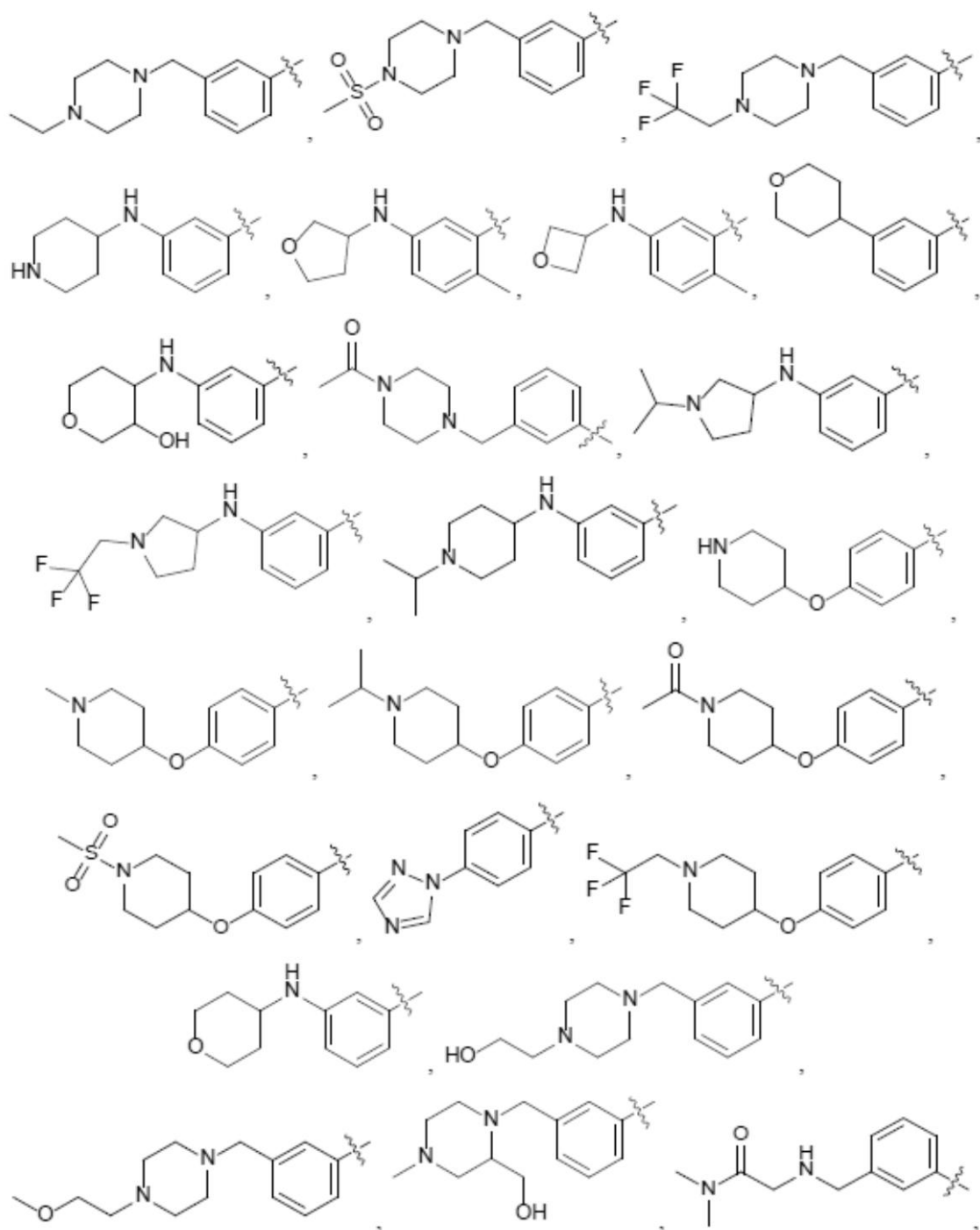


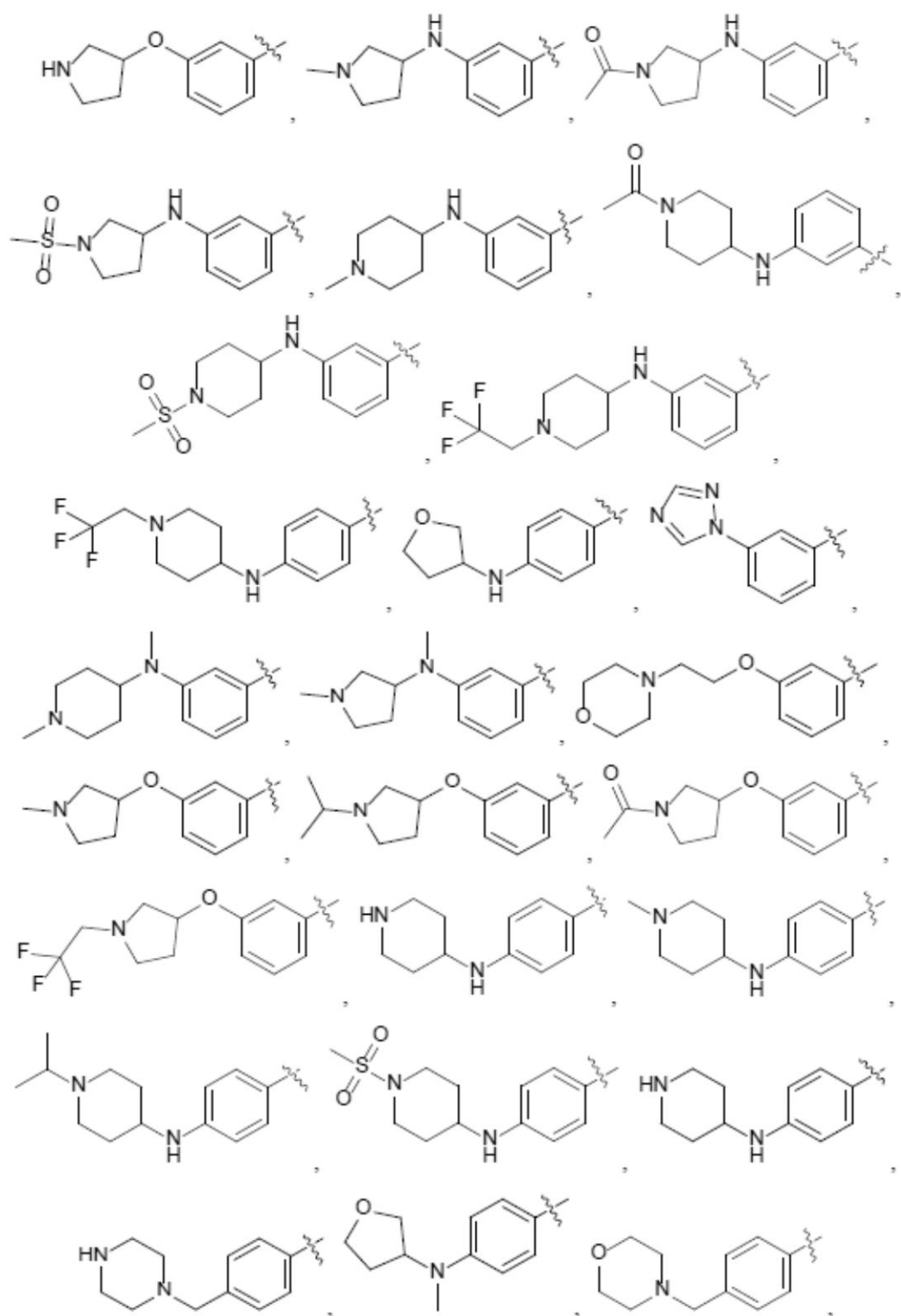


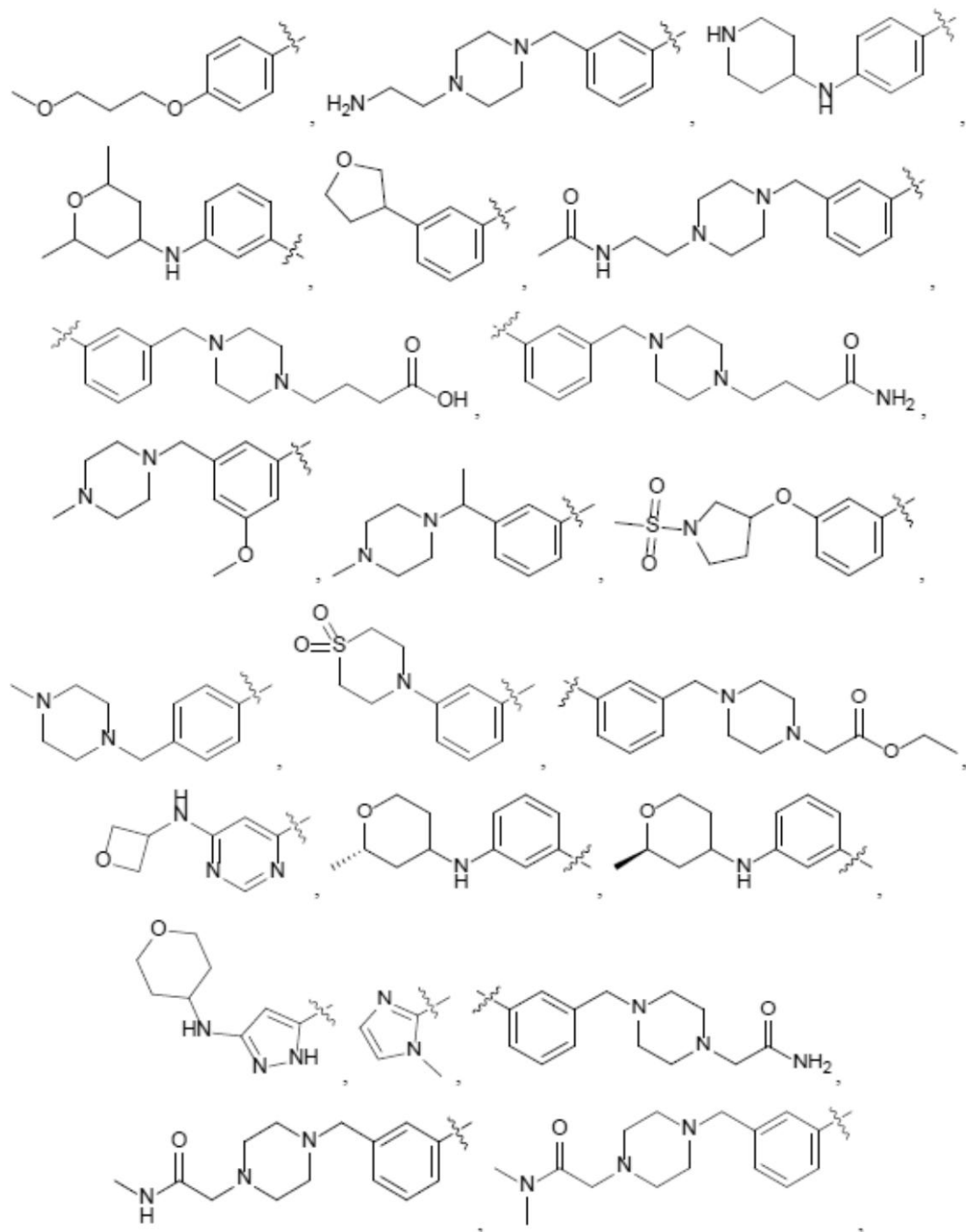
## 【請求項 108】

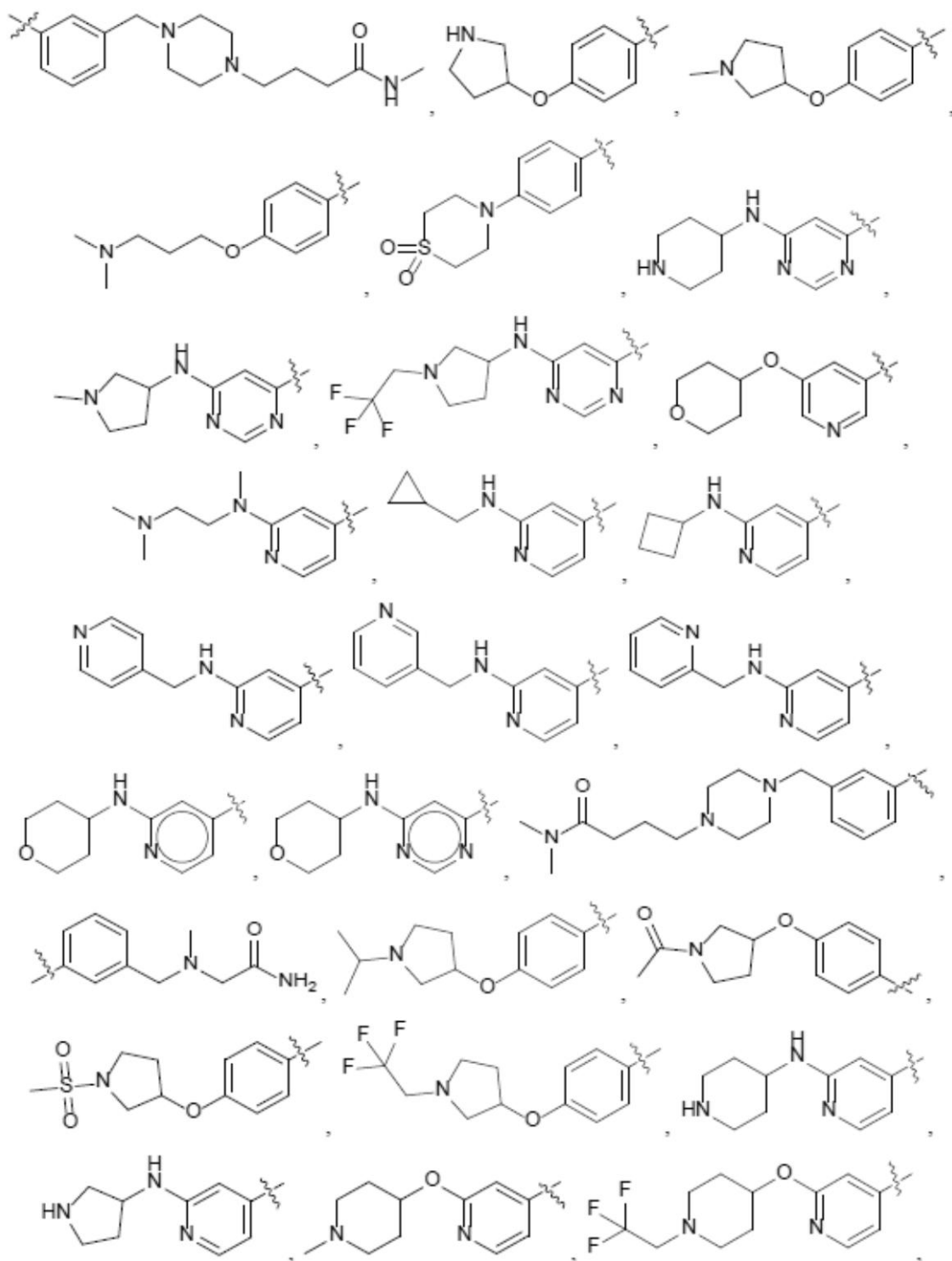
A r が、以下の基からなる群から選択される請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物。

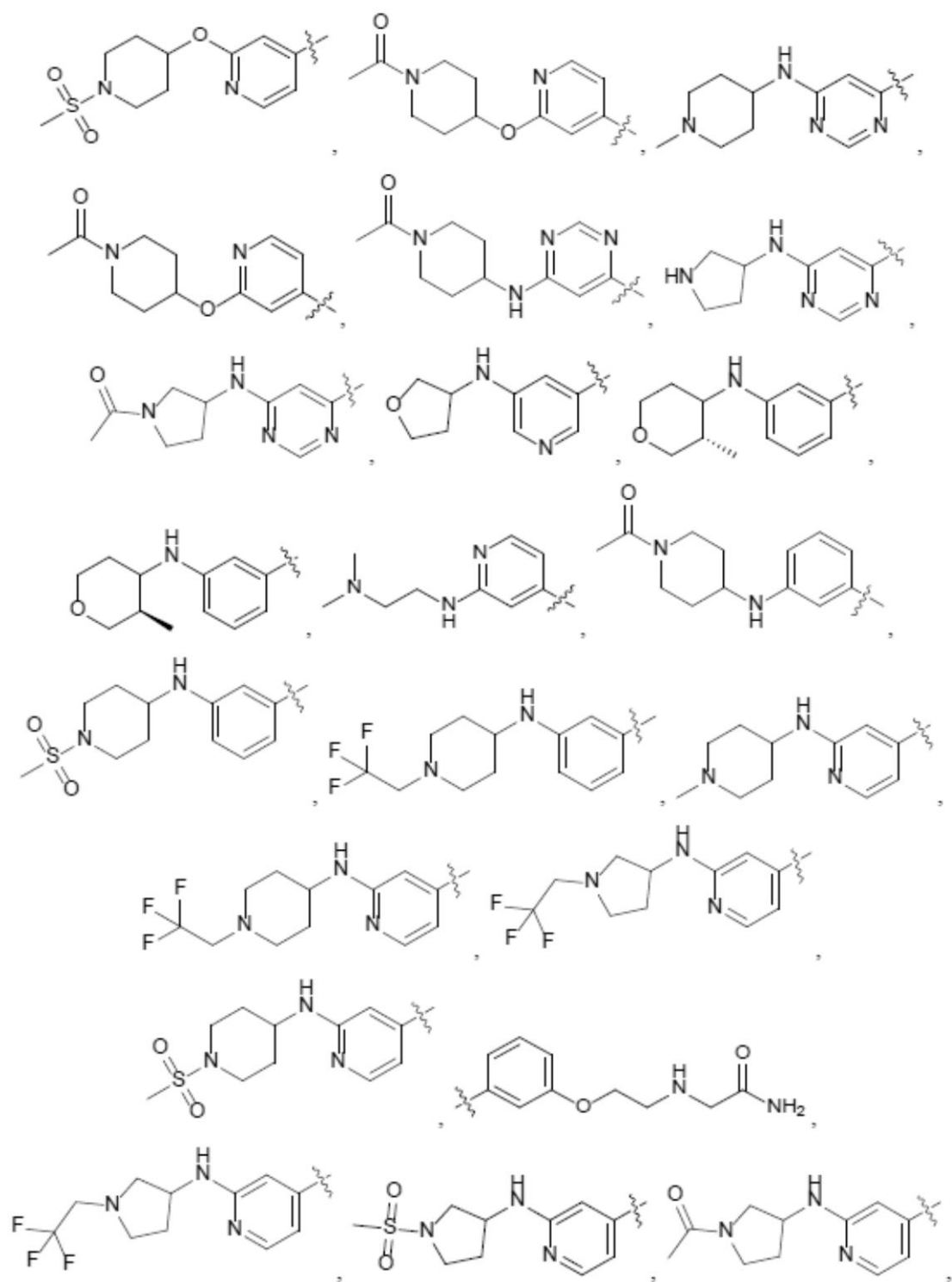


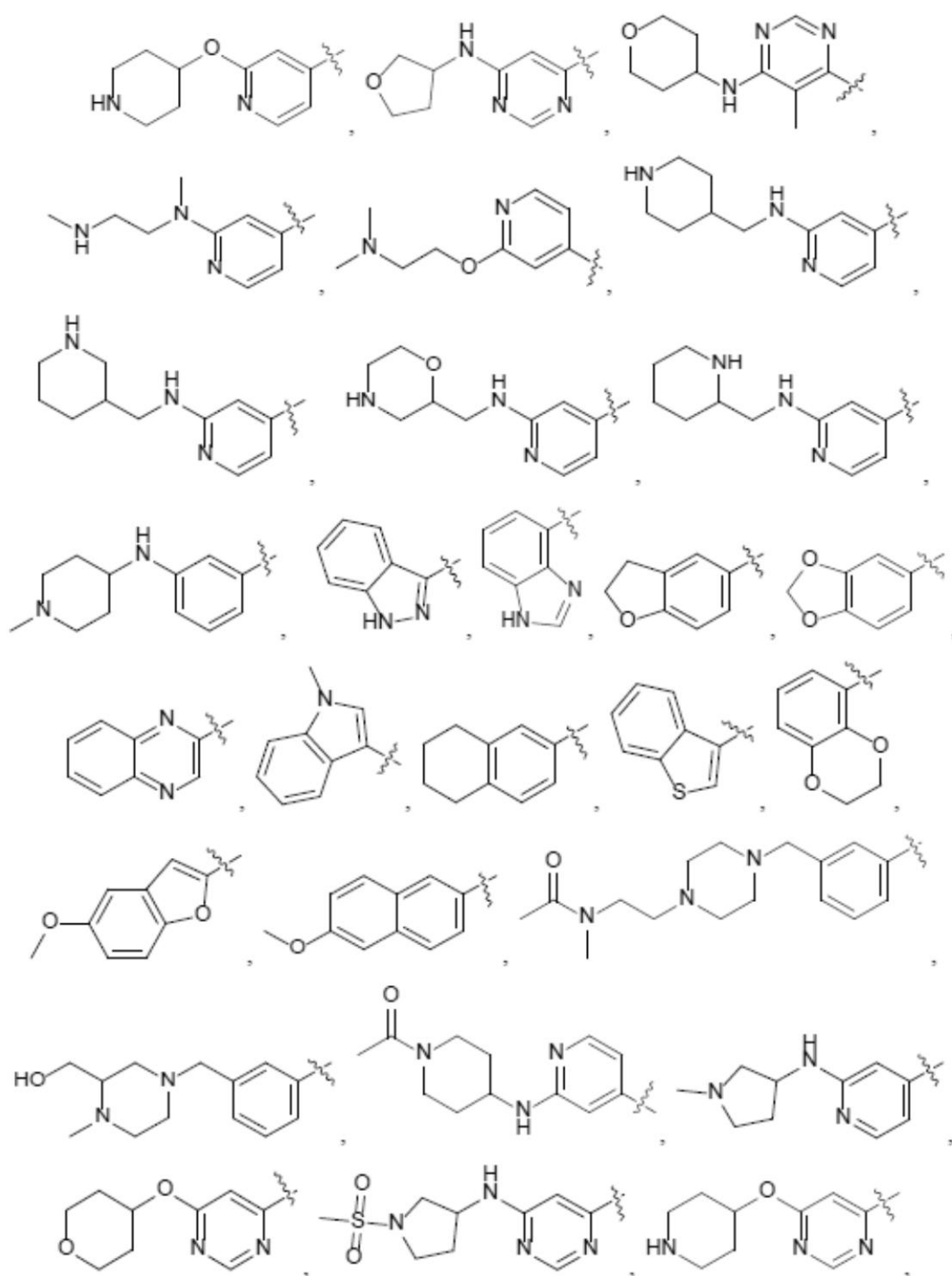




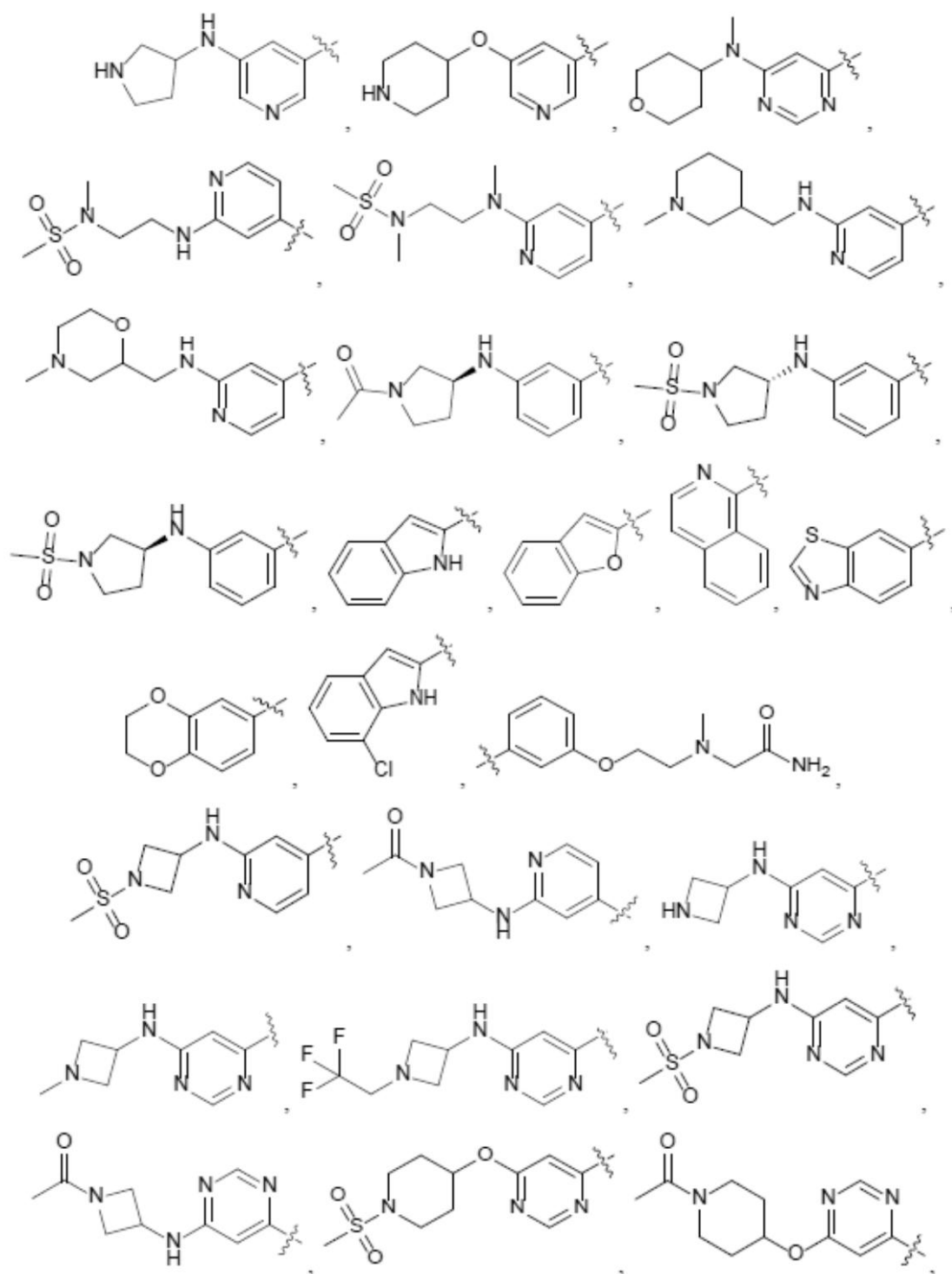


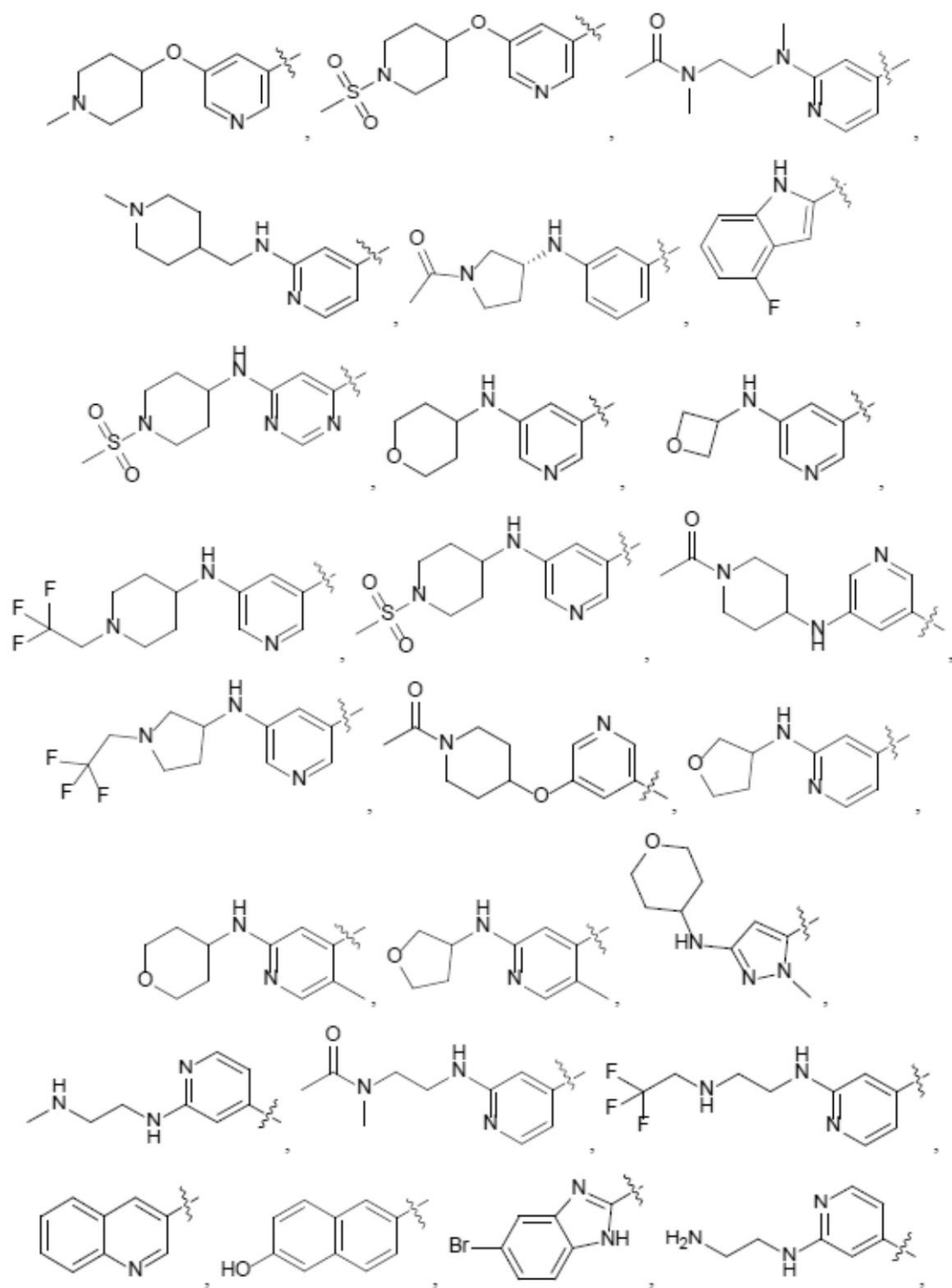








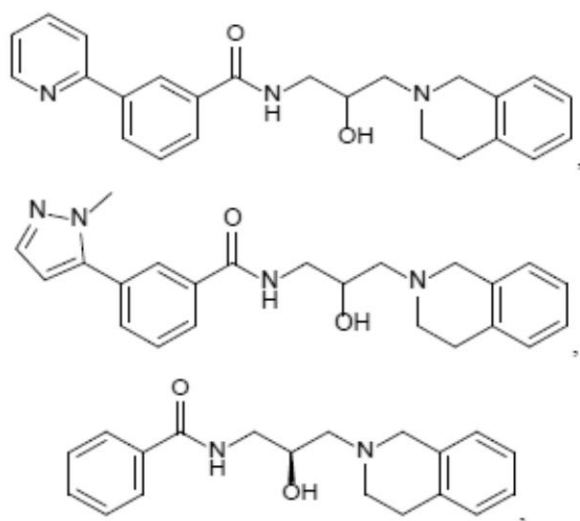


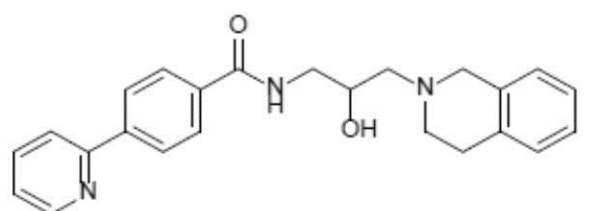
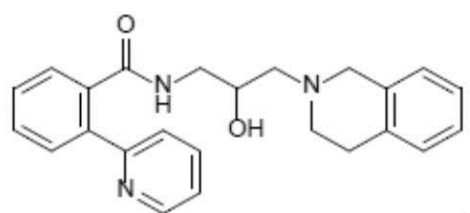
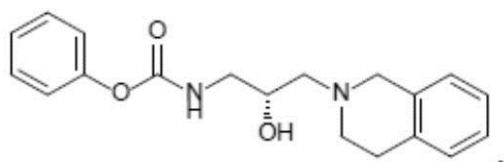
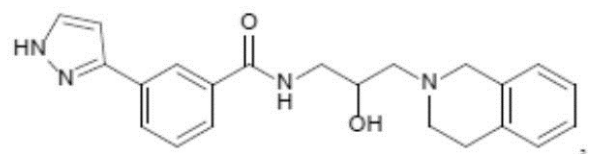
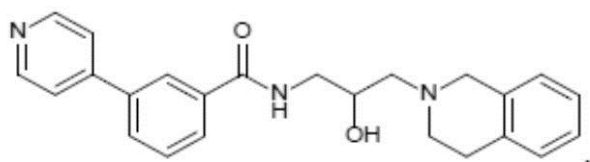
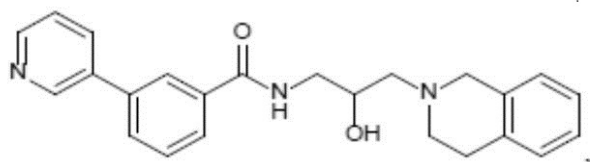
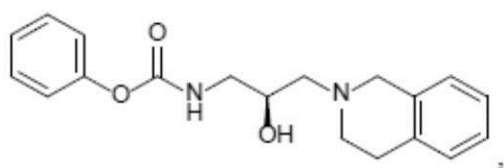
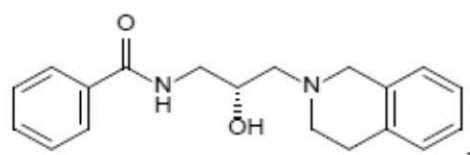


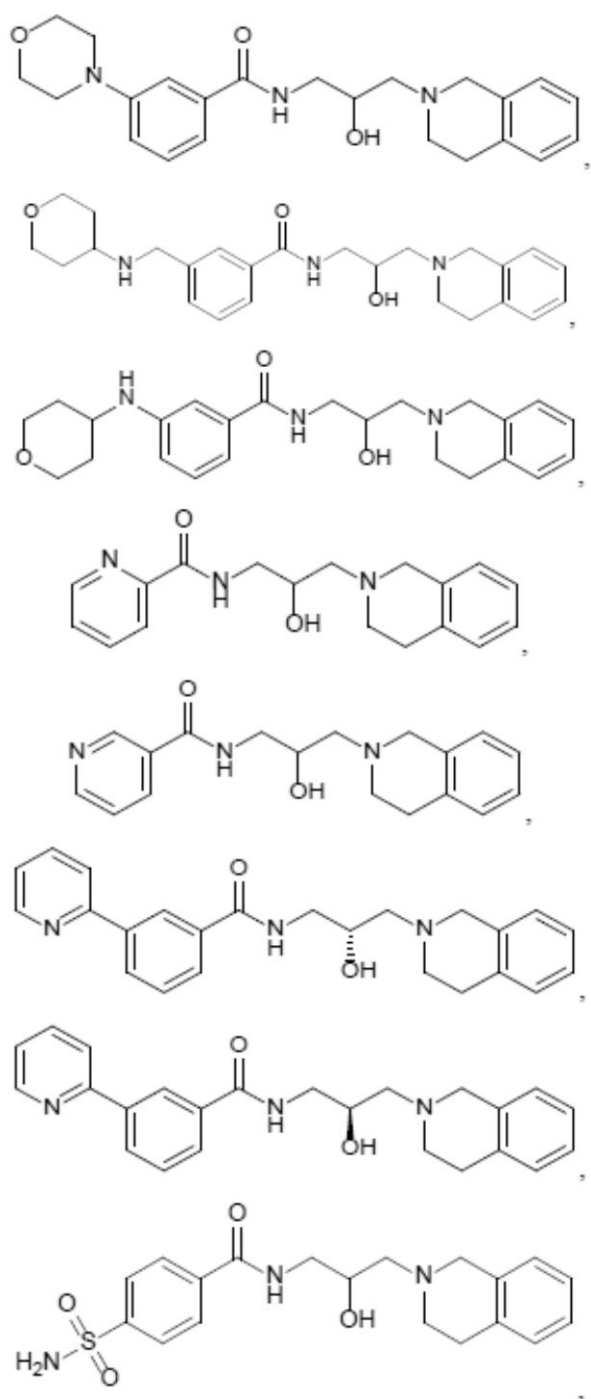


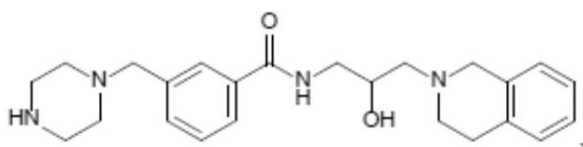
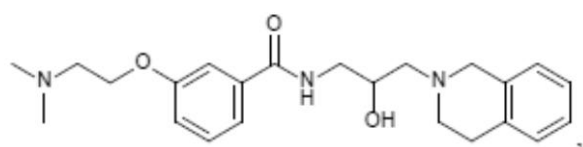
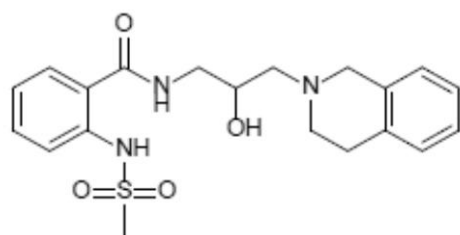
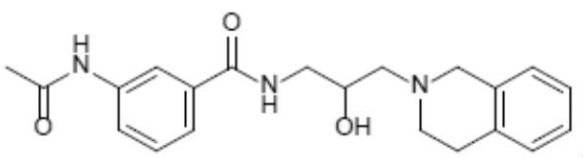
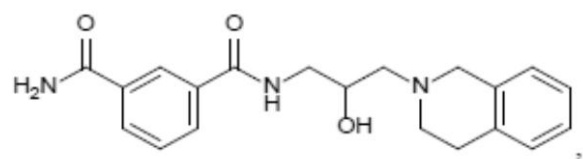
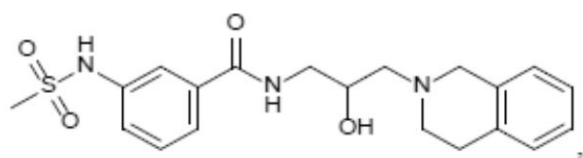
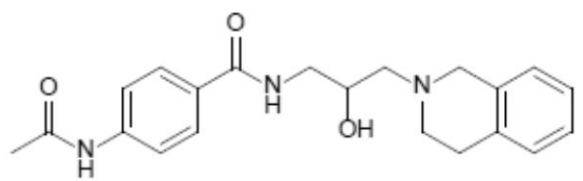
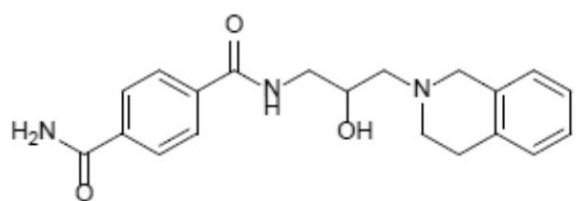
【請求項 109】

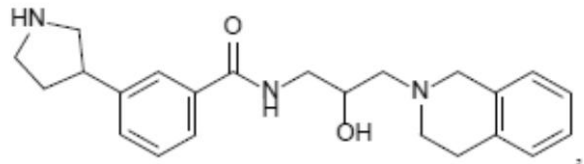
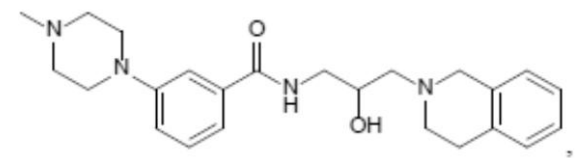
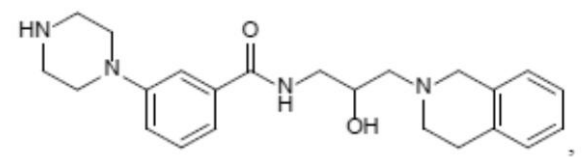
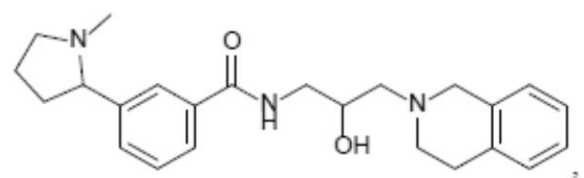
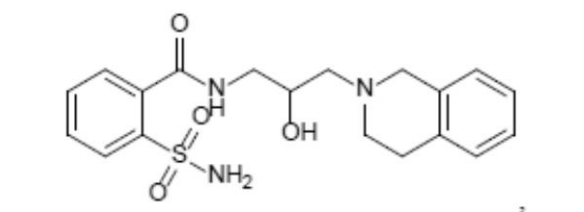
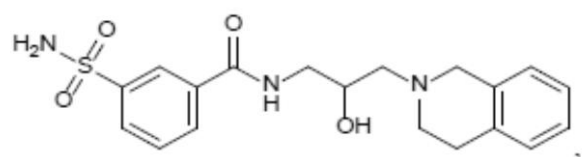
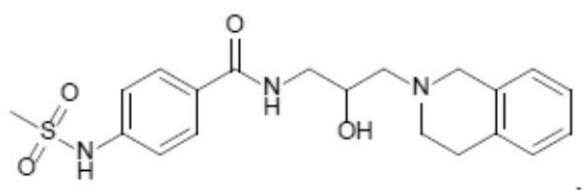
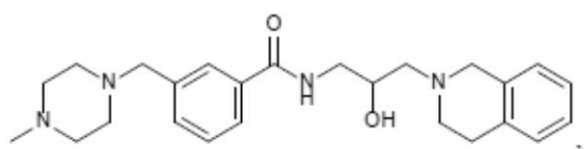
前記化合物が、以下に列挙された化合物及びその薬学的に許容される塩からなる群から選択される請求項 1 に記載の化合物。

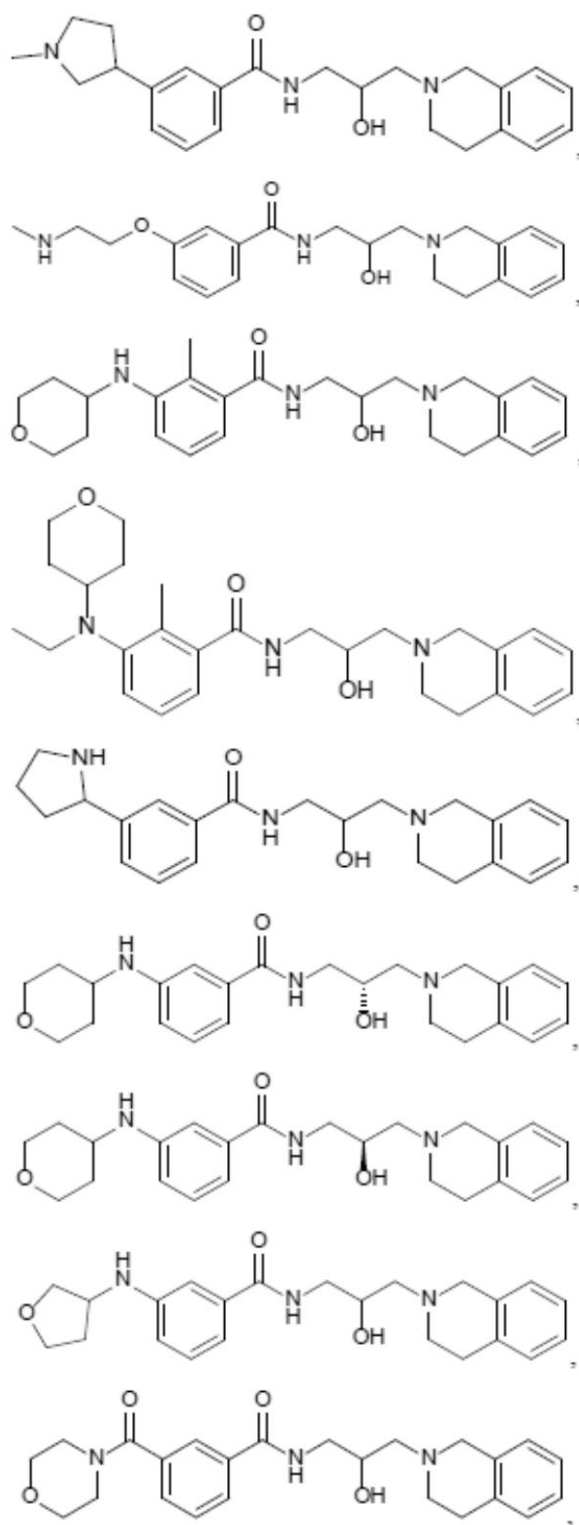




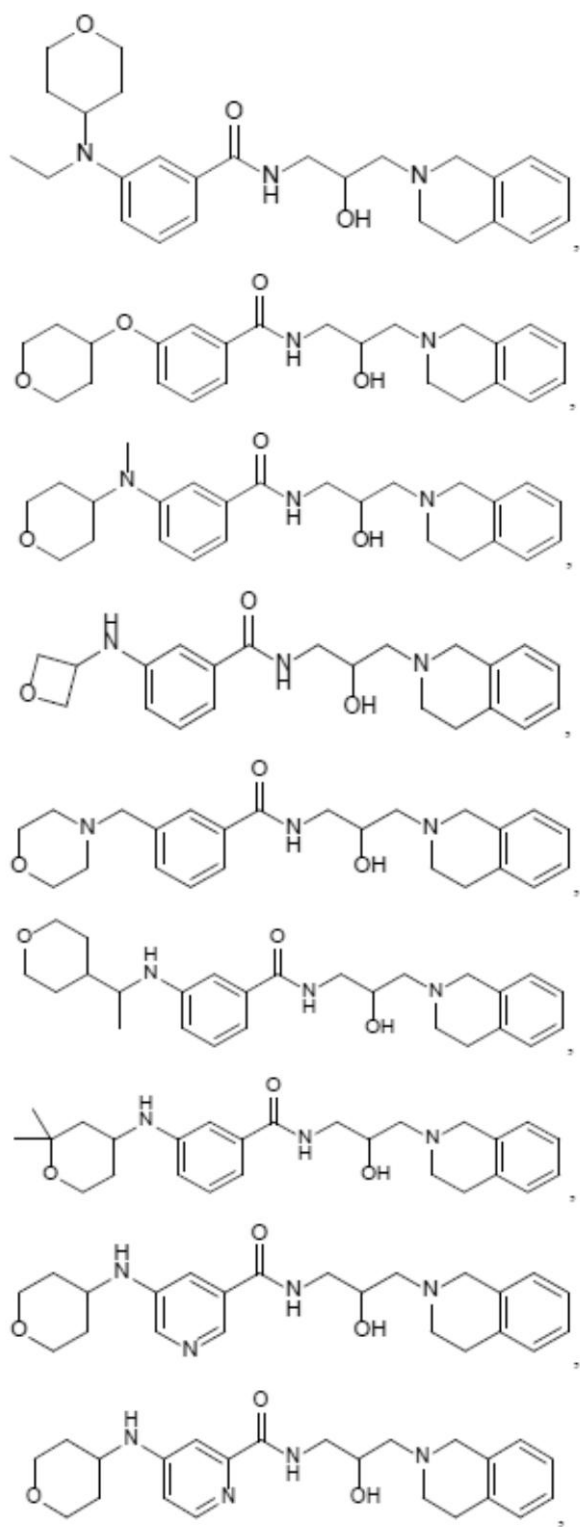


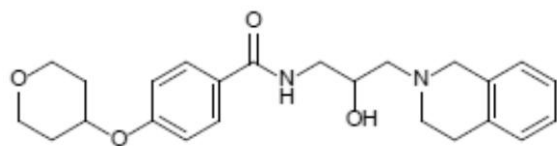
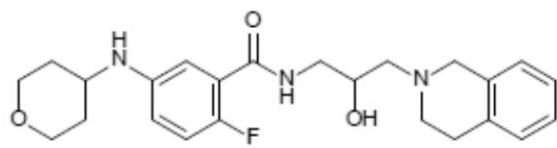
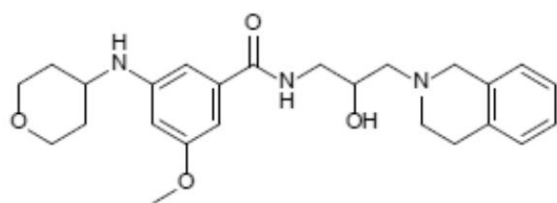






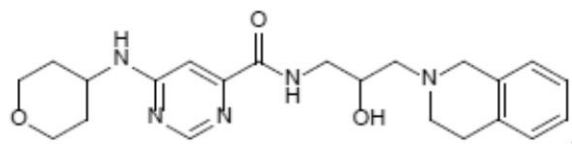
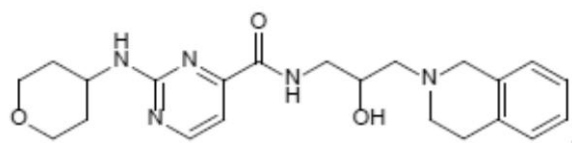
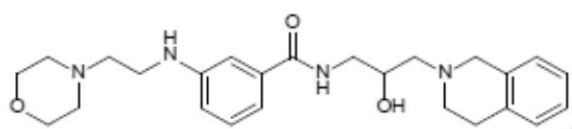
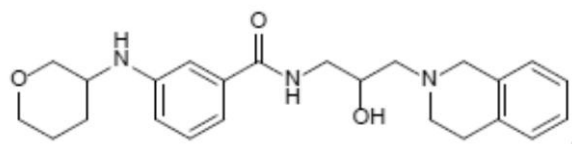
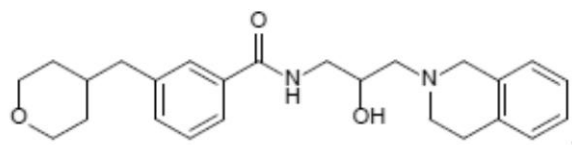


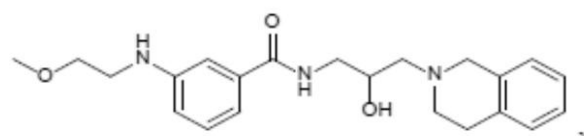
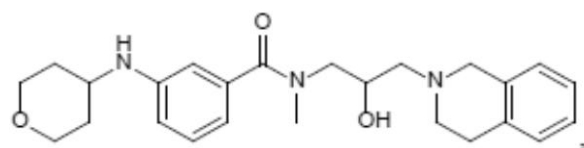
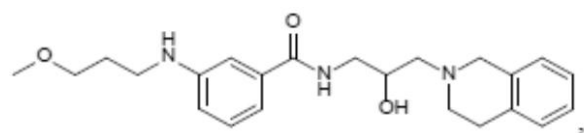
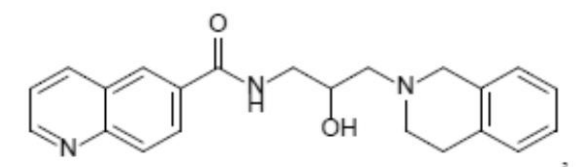
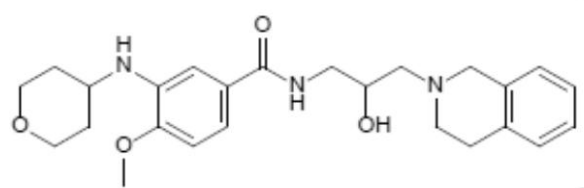
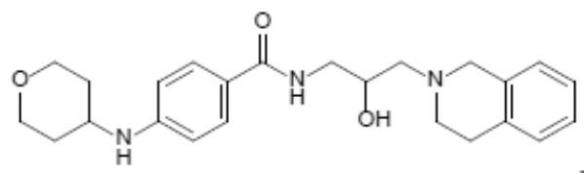
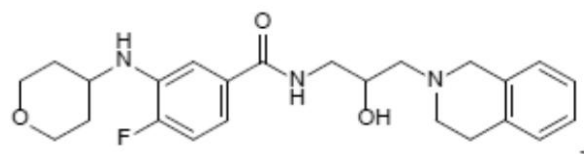
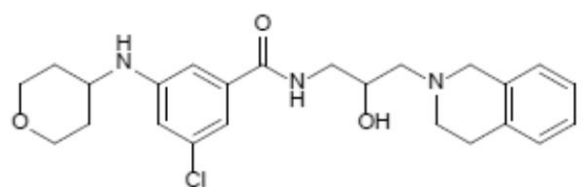


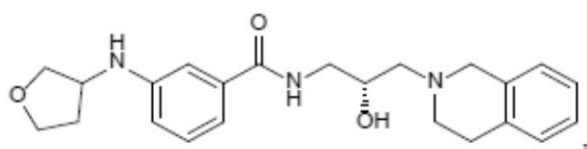
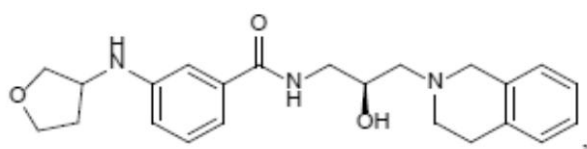
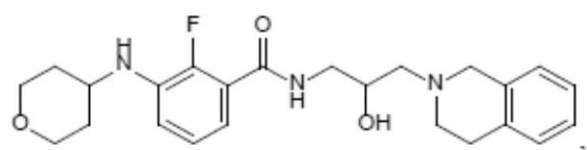
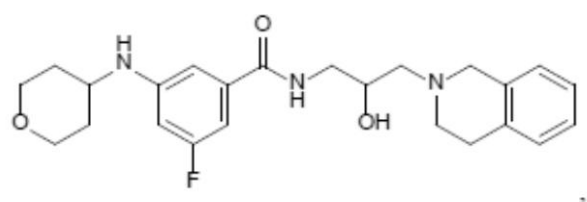
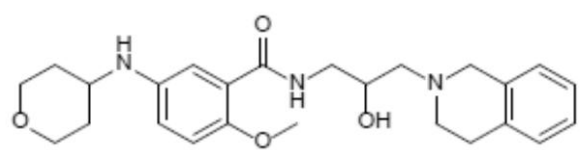
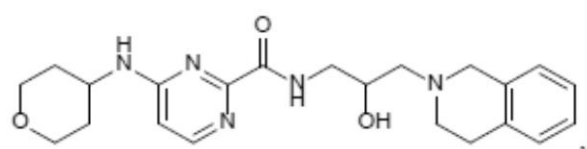
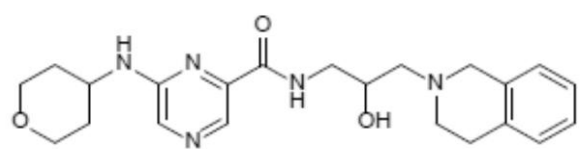
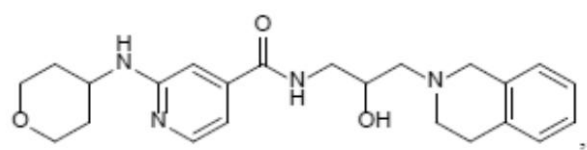
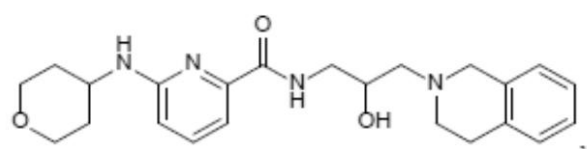


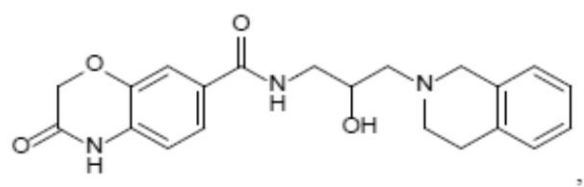
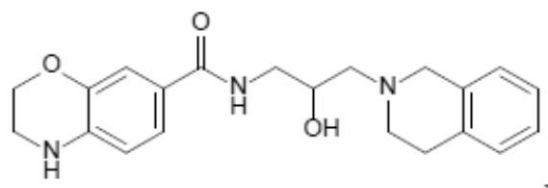
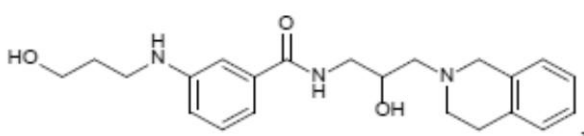
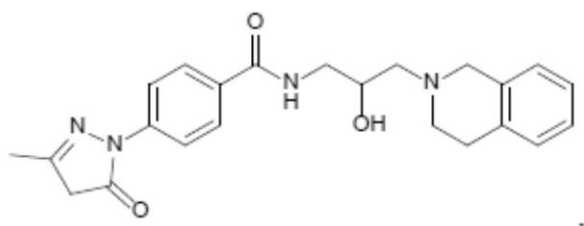
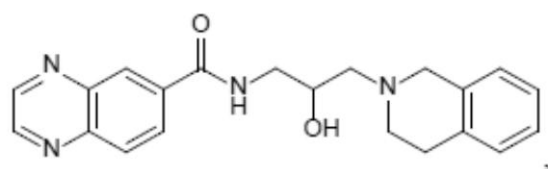
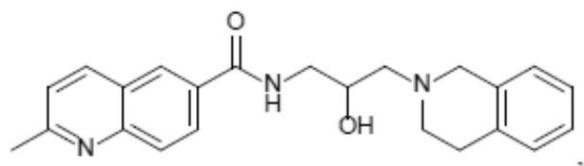
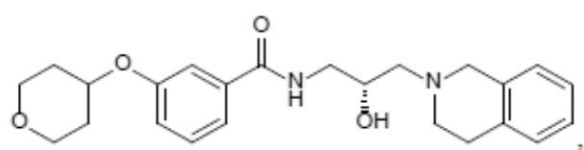
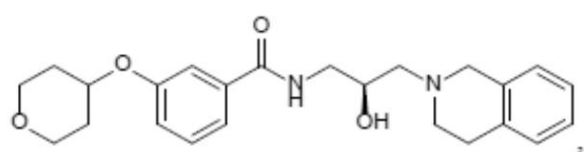
## 【請求項 110】

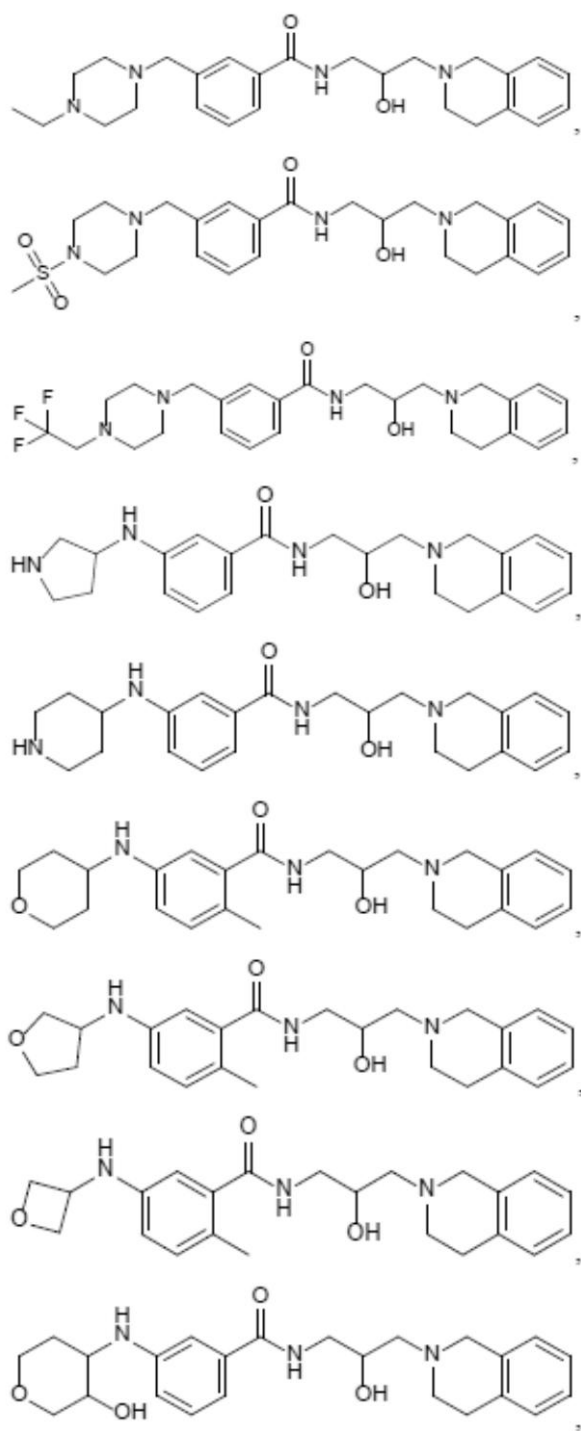
前記化合物が、以下に列挙された化合物及びその薬学的に許容される塩からなる群から選択される請求項 1 に記載の化合物。

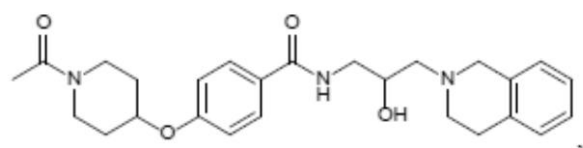
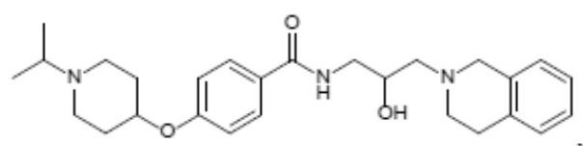
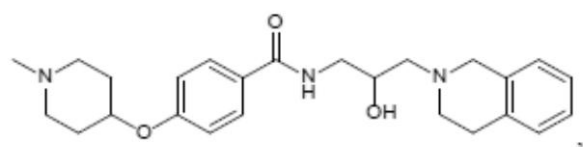
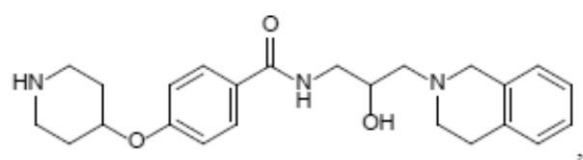
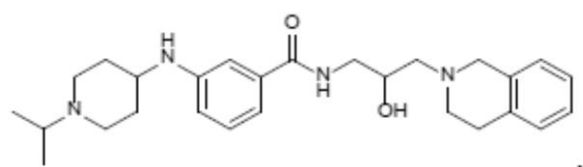
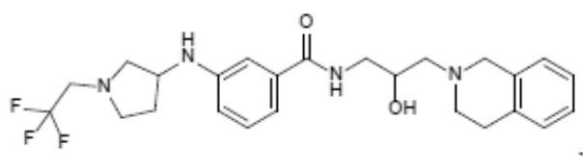
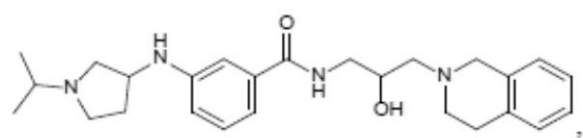
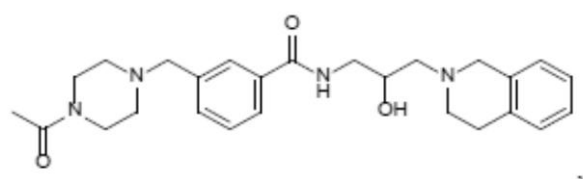
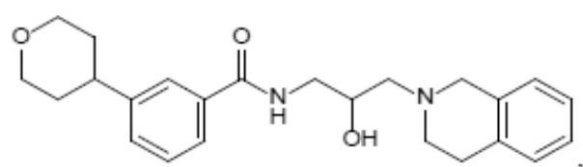


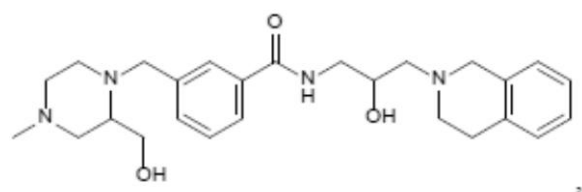
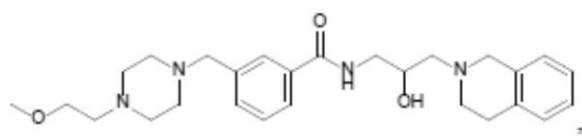
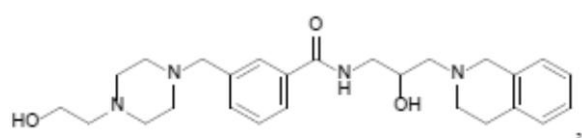
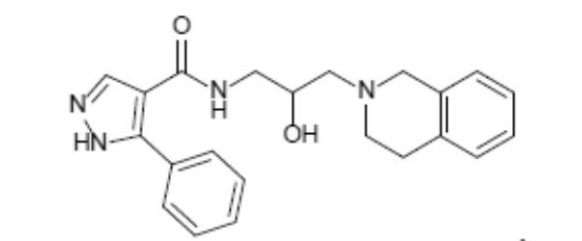
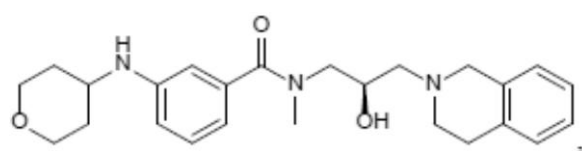
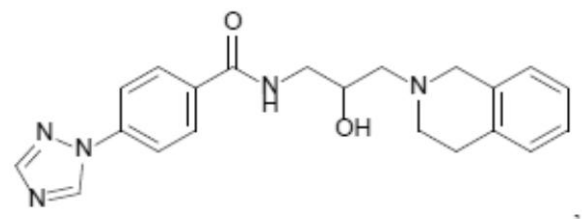
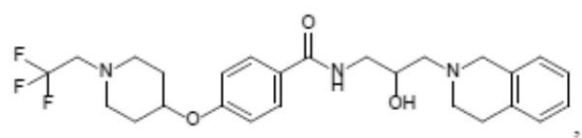
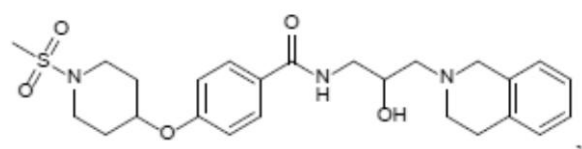




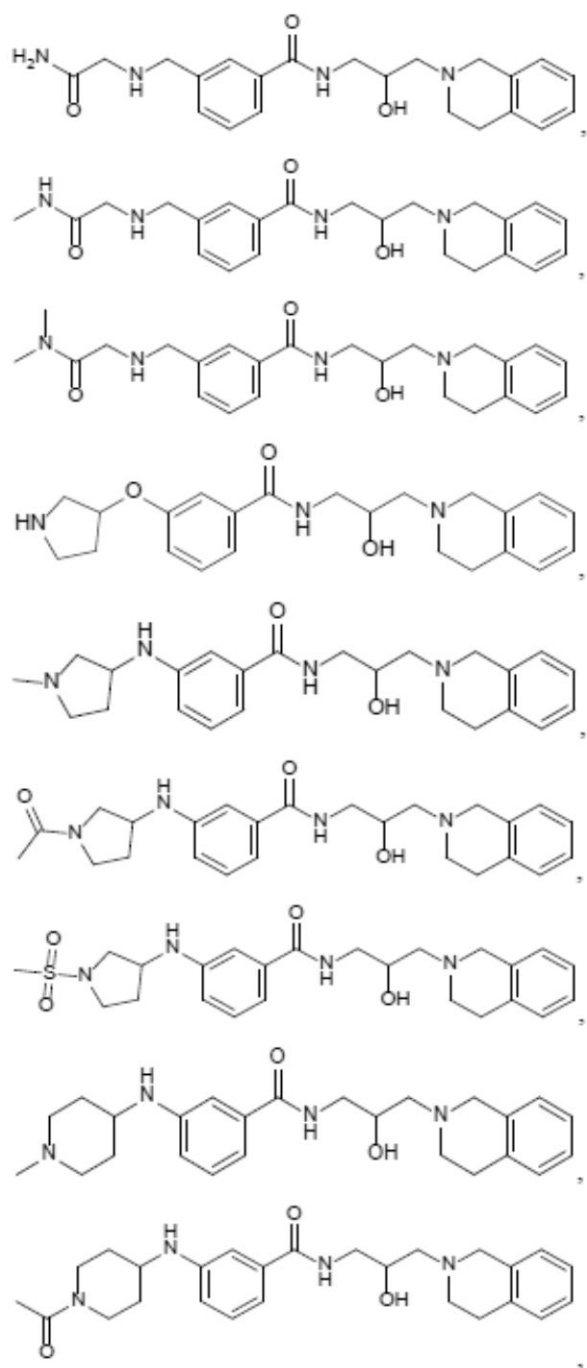


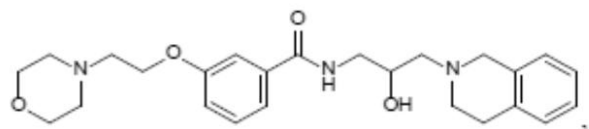
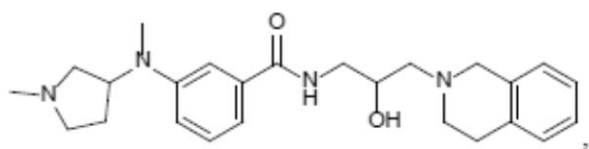
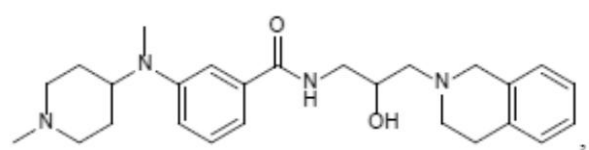
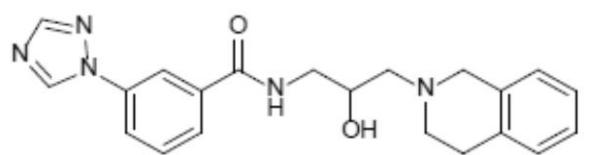
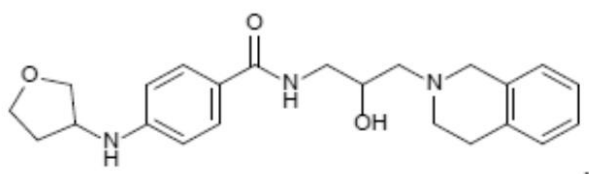
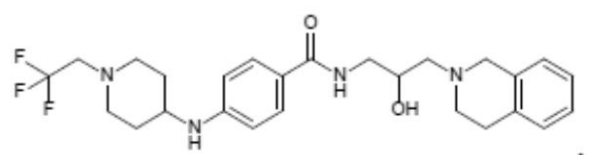
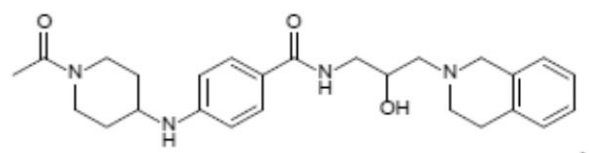
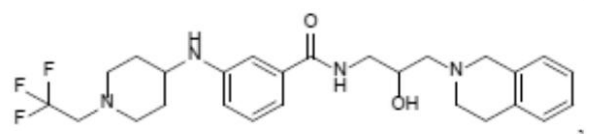
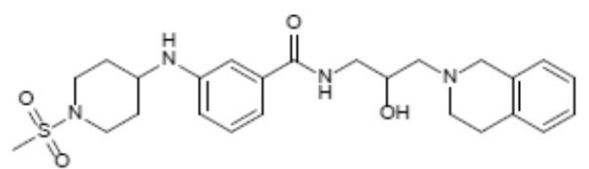


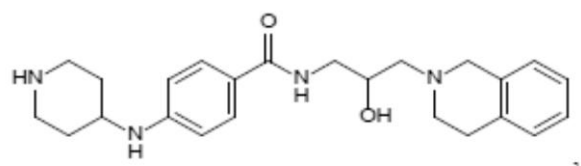
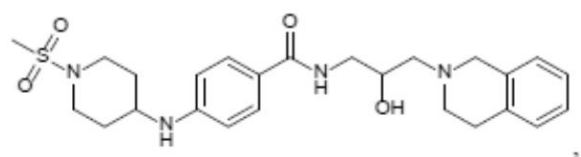
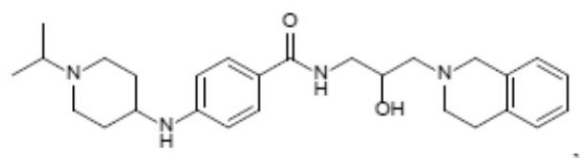
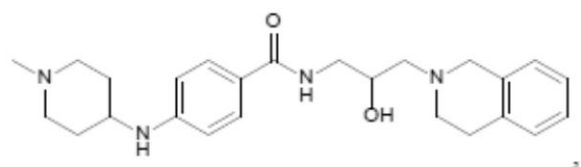
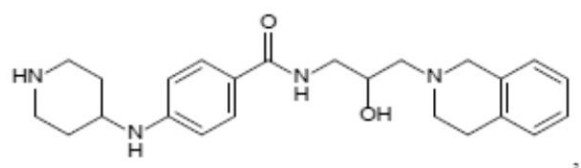
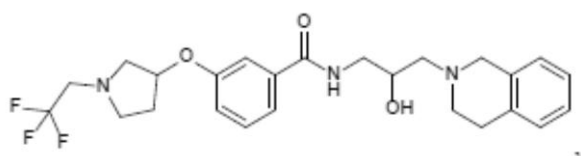
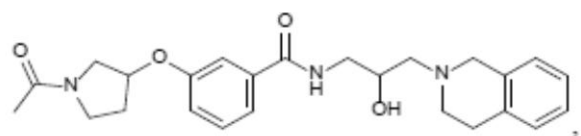
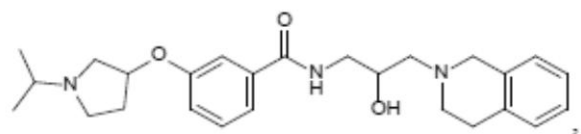
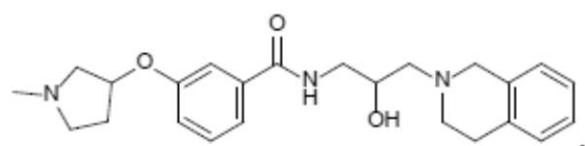


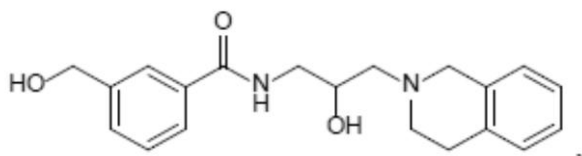
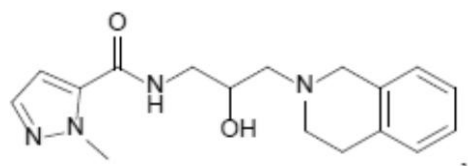
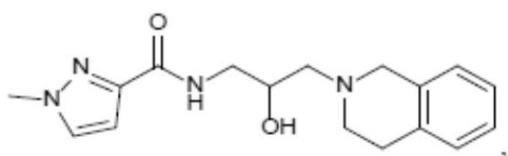
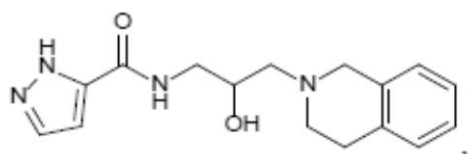
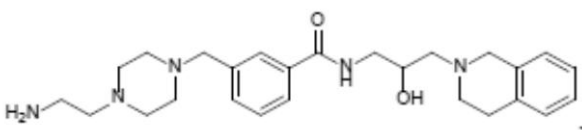
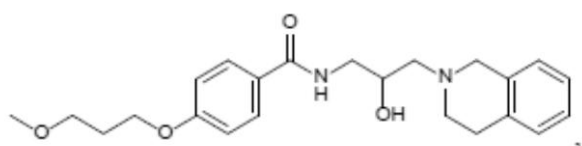
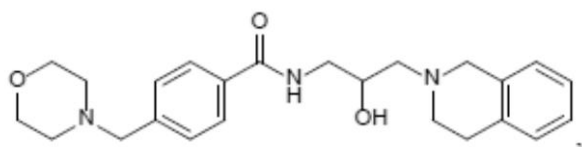
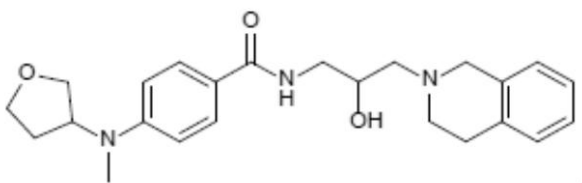
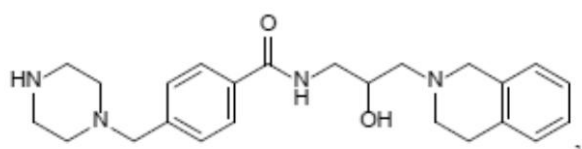


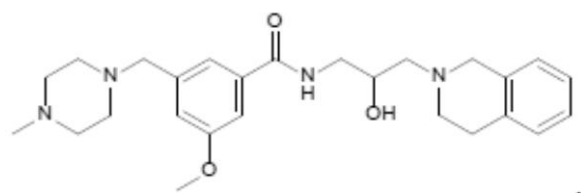
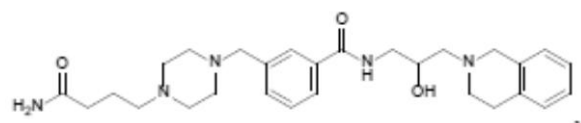
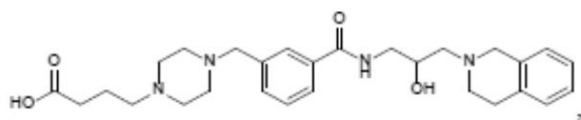
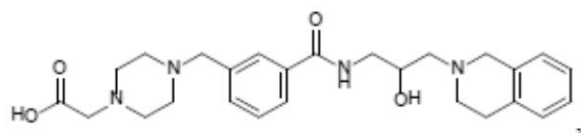
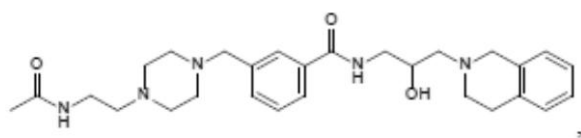
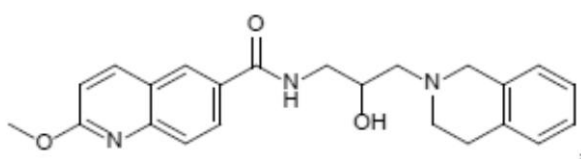
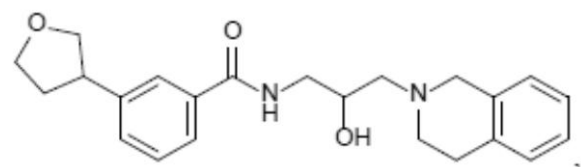
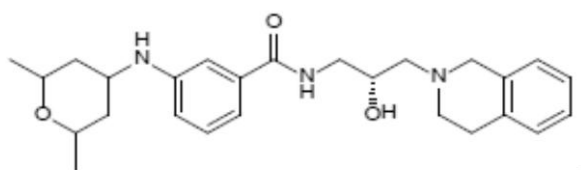
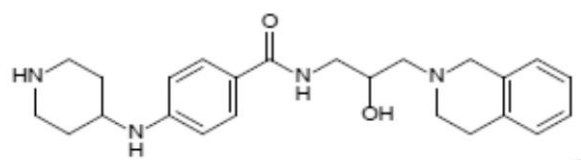


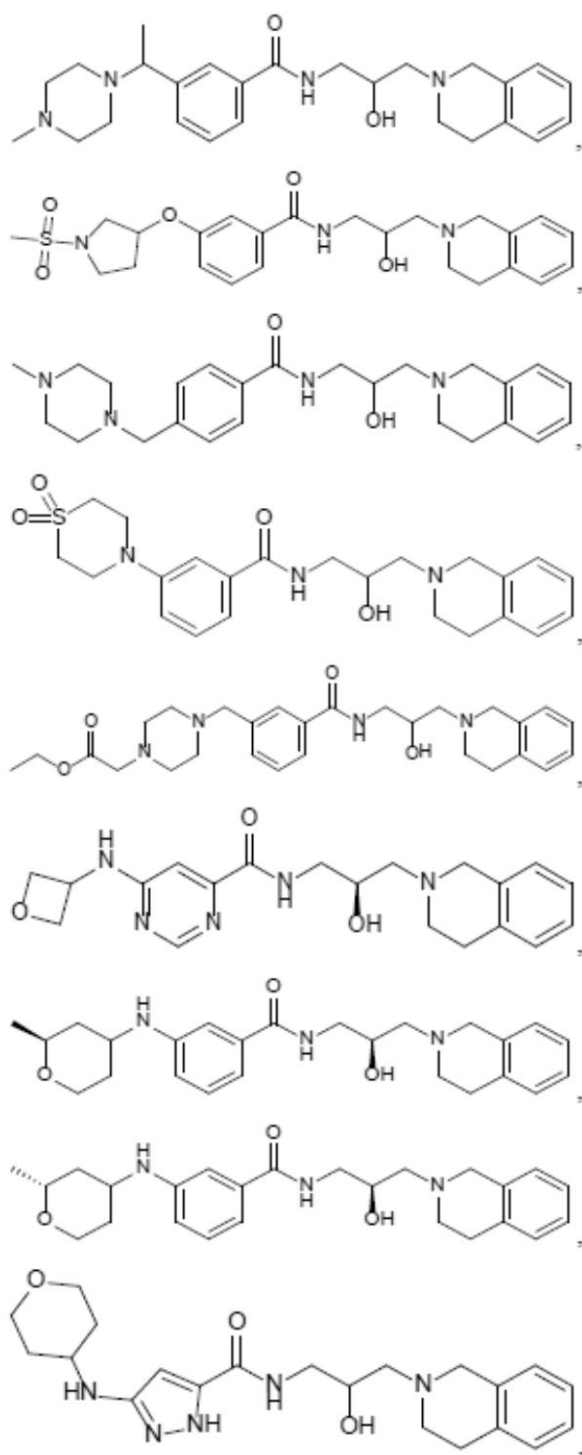


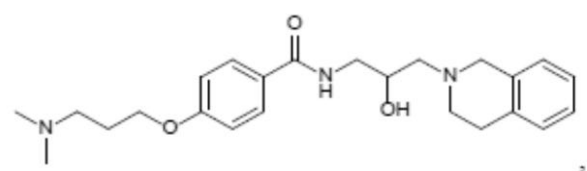
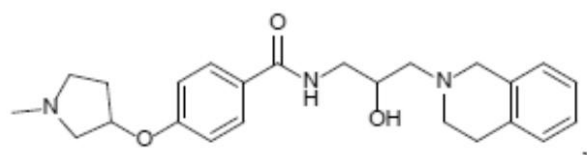
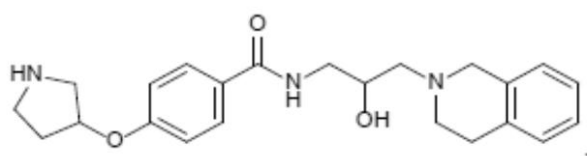
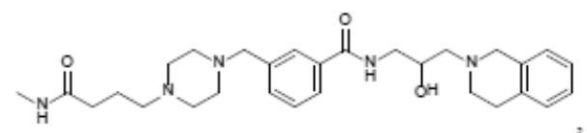
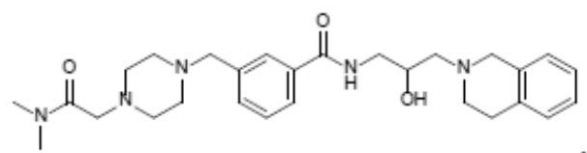
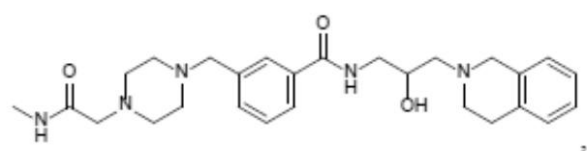
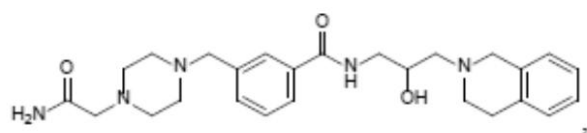
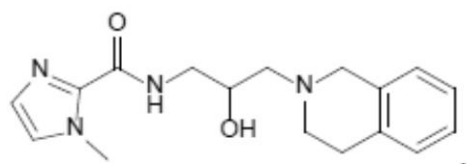
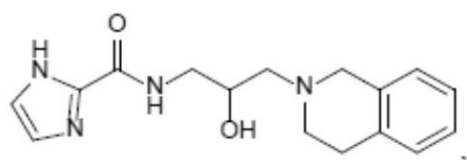


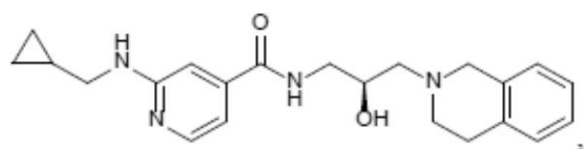
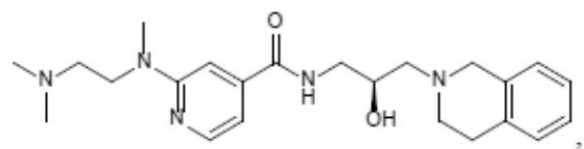
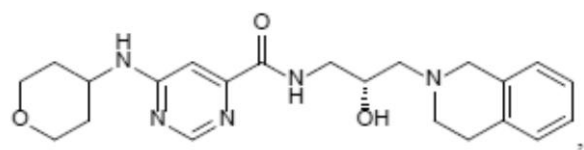
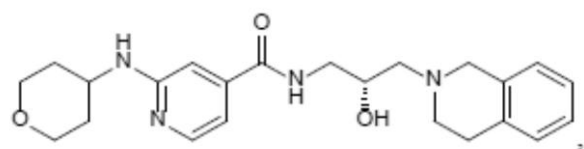
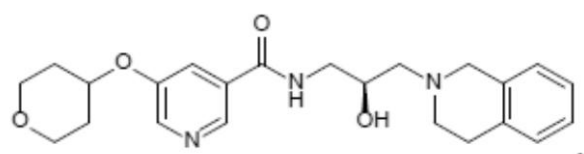
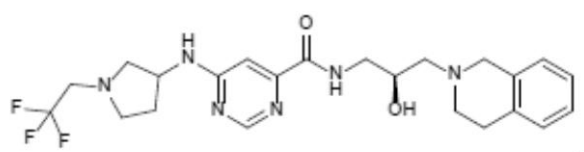
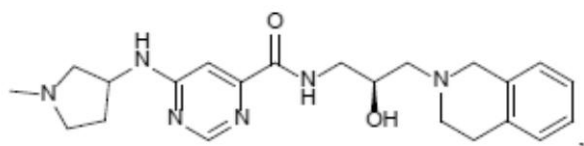
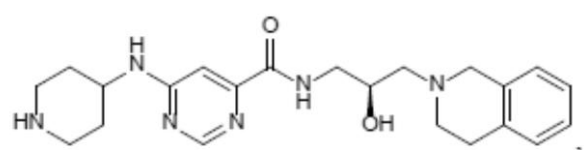
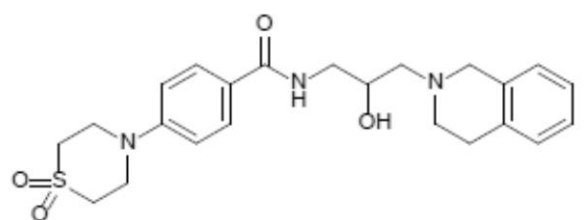




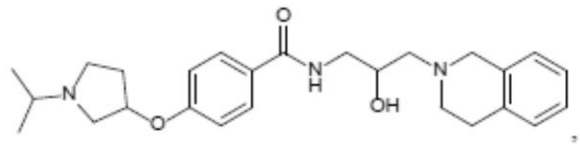
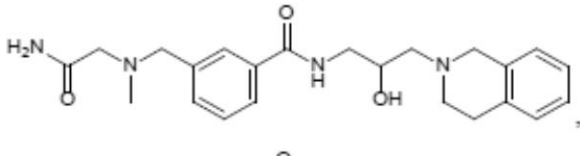
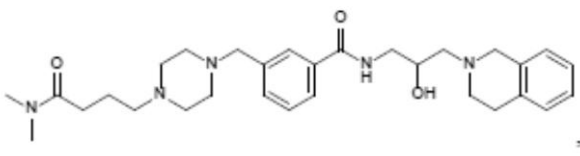
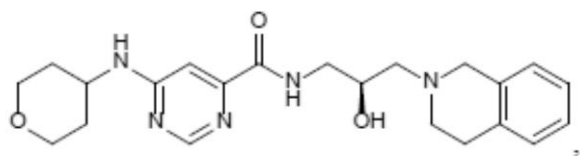
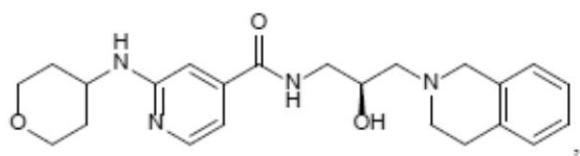
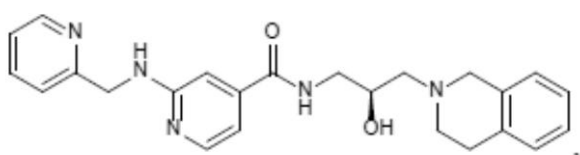
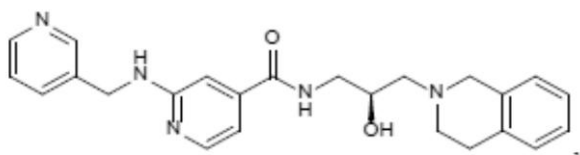
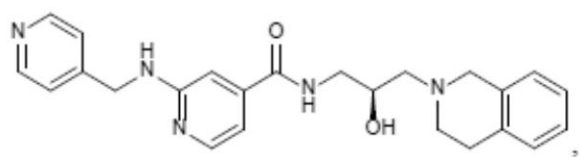
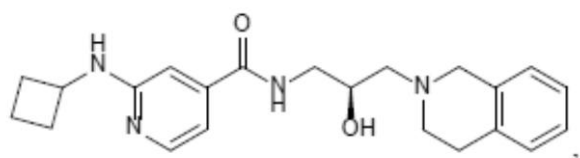


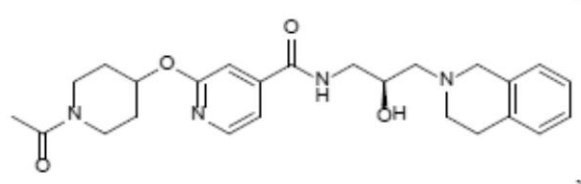
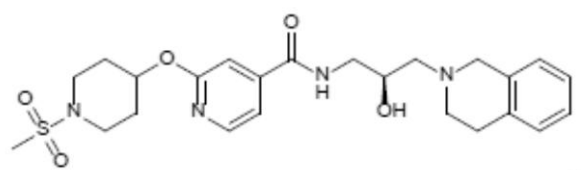
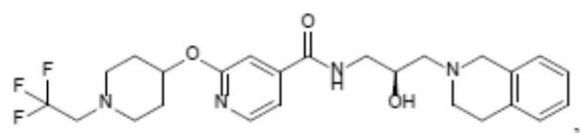
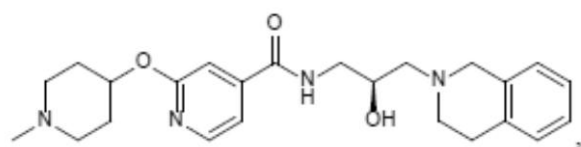
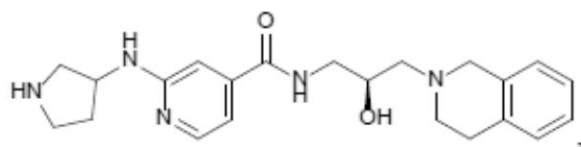
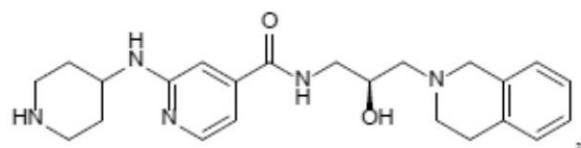
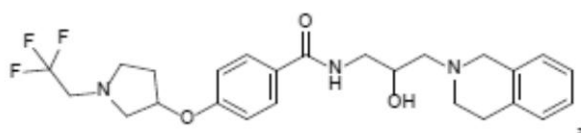
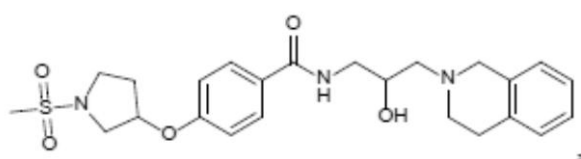
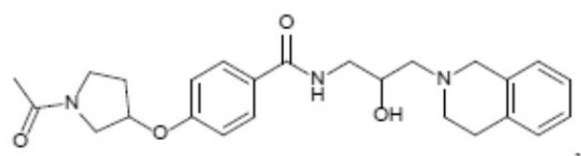


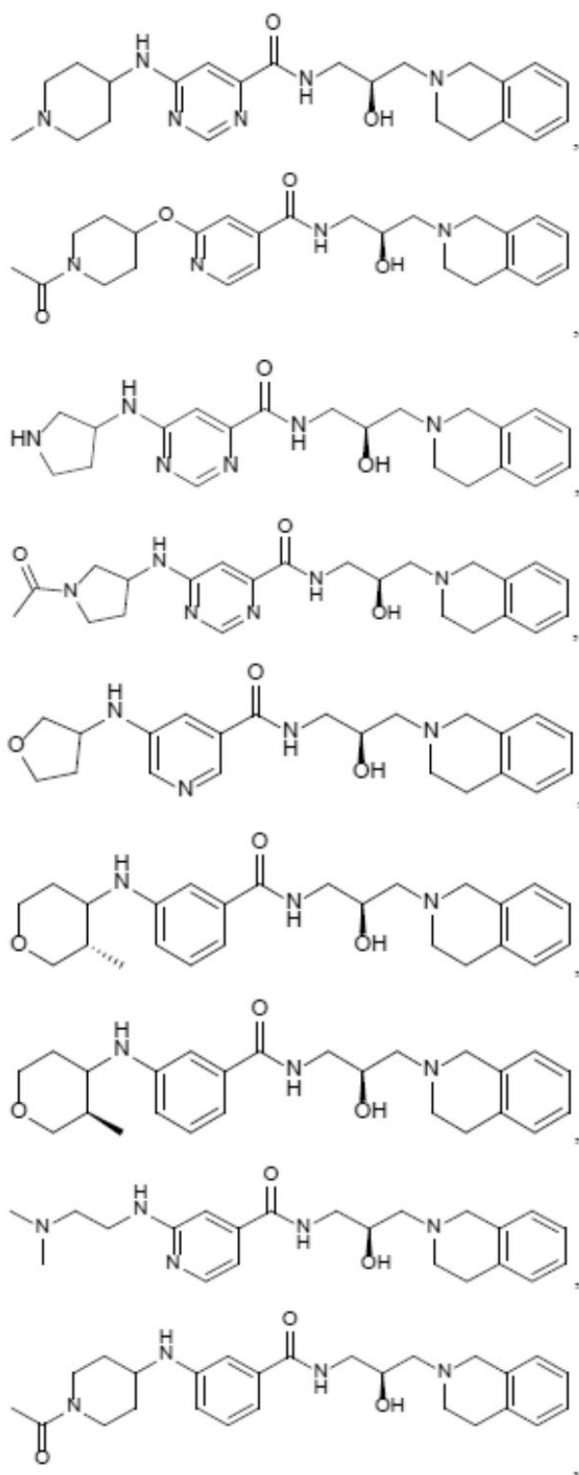


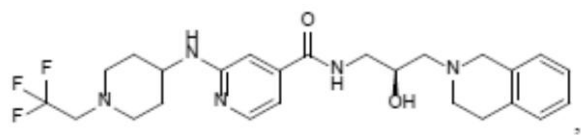
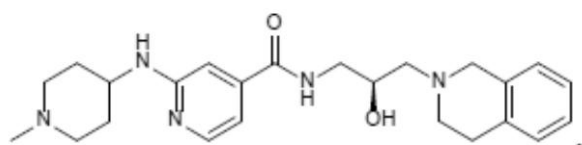
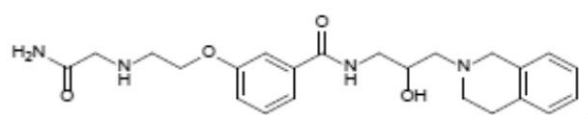
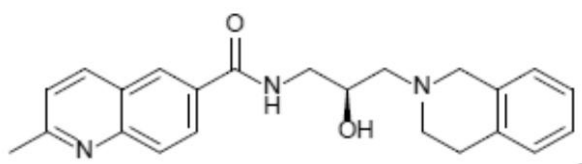
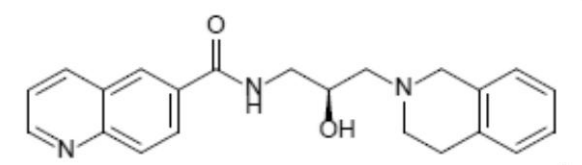
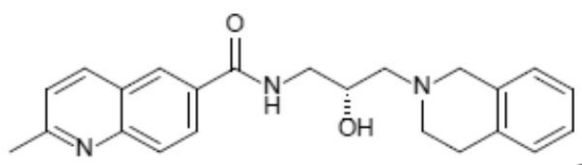
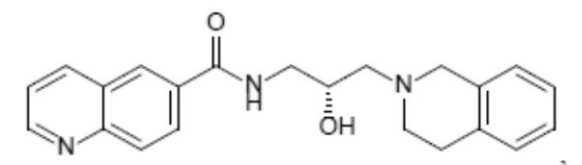
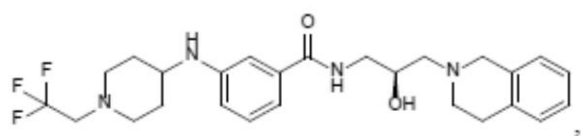
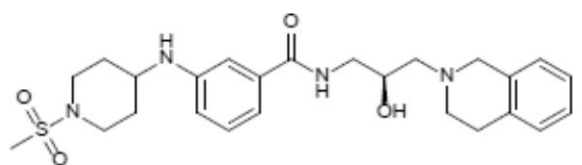


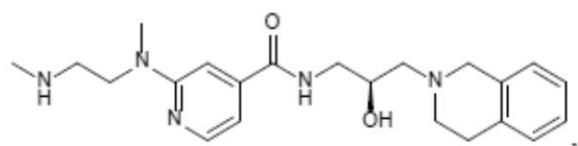
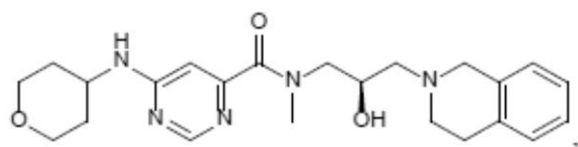
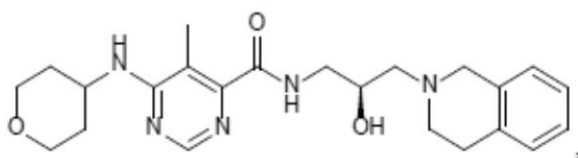
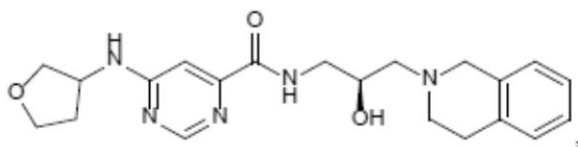
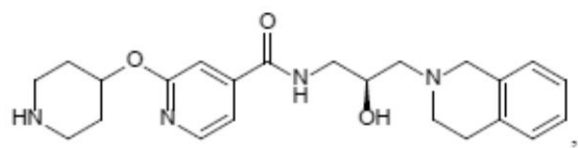
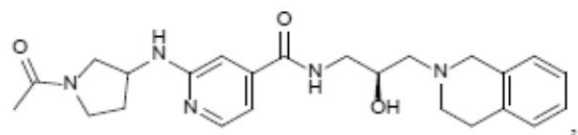
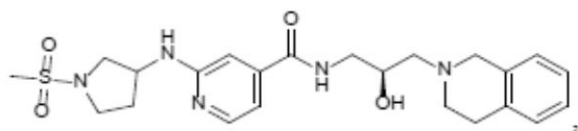
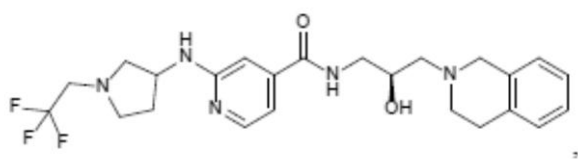
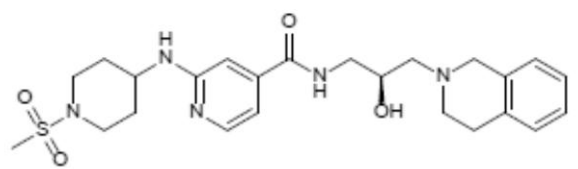


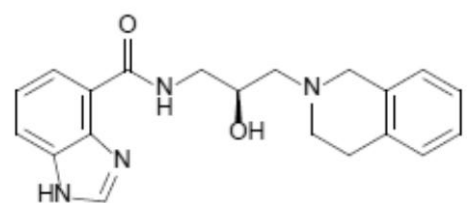
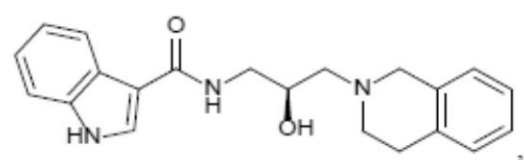
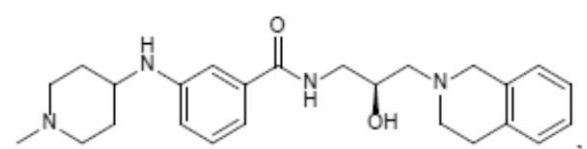
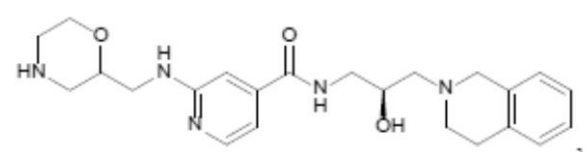
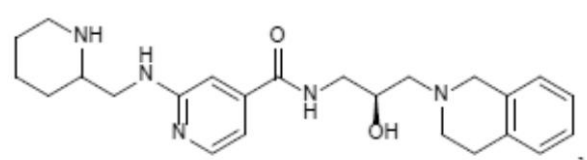
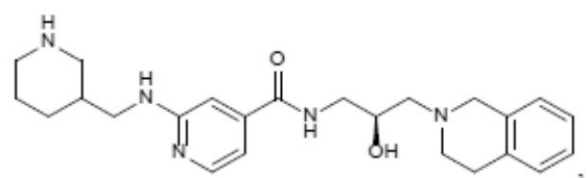
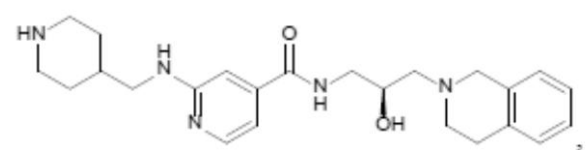
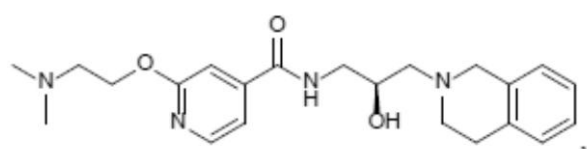


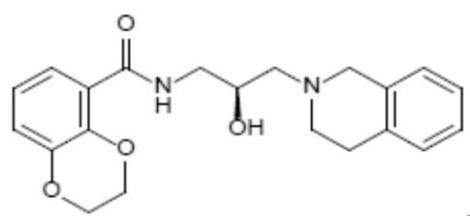
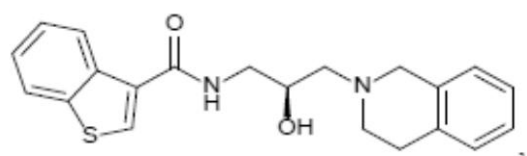
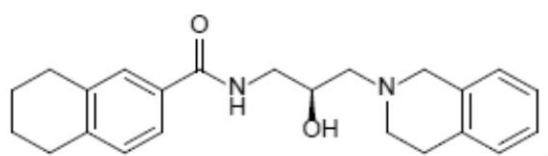
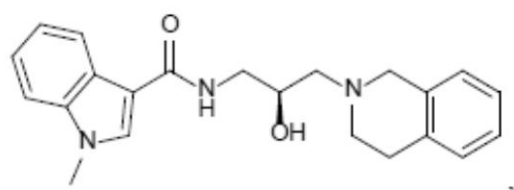
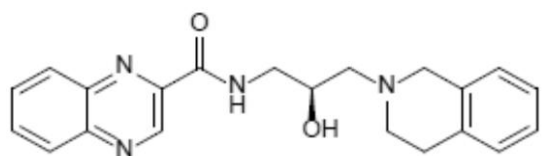
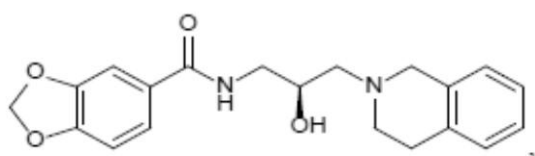
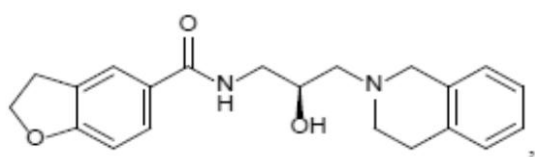
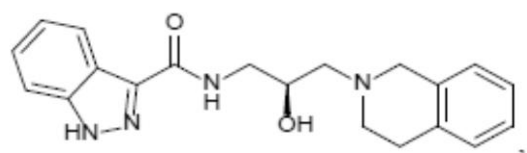


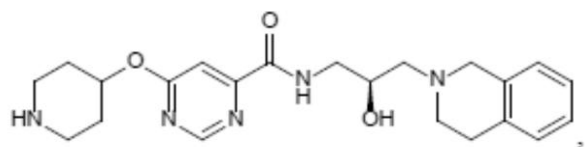
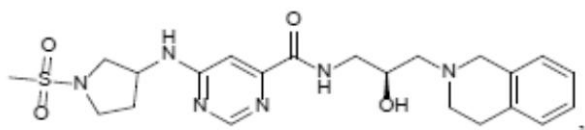
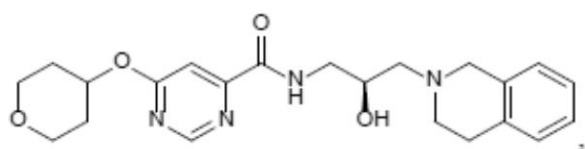
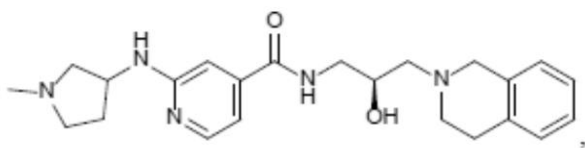
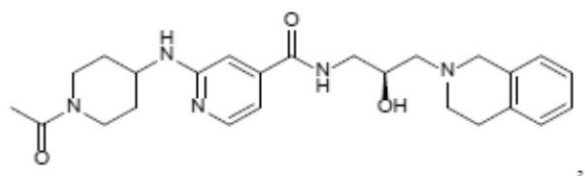
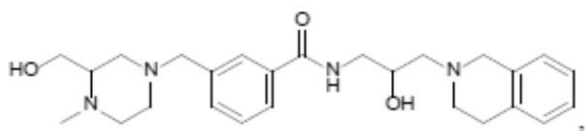
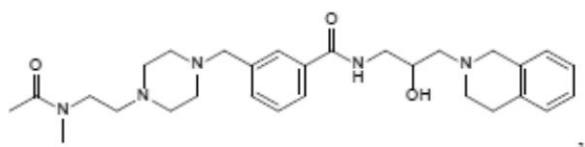
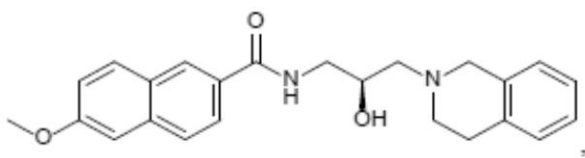
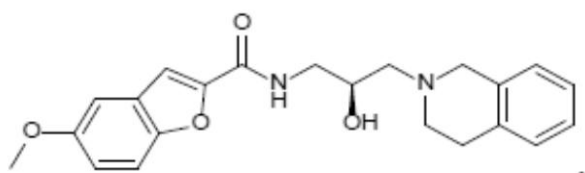




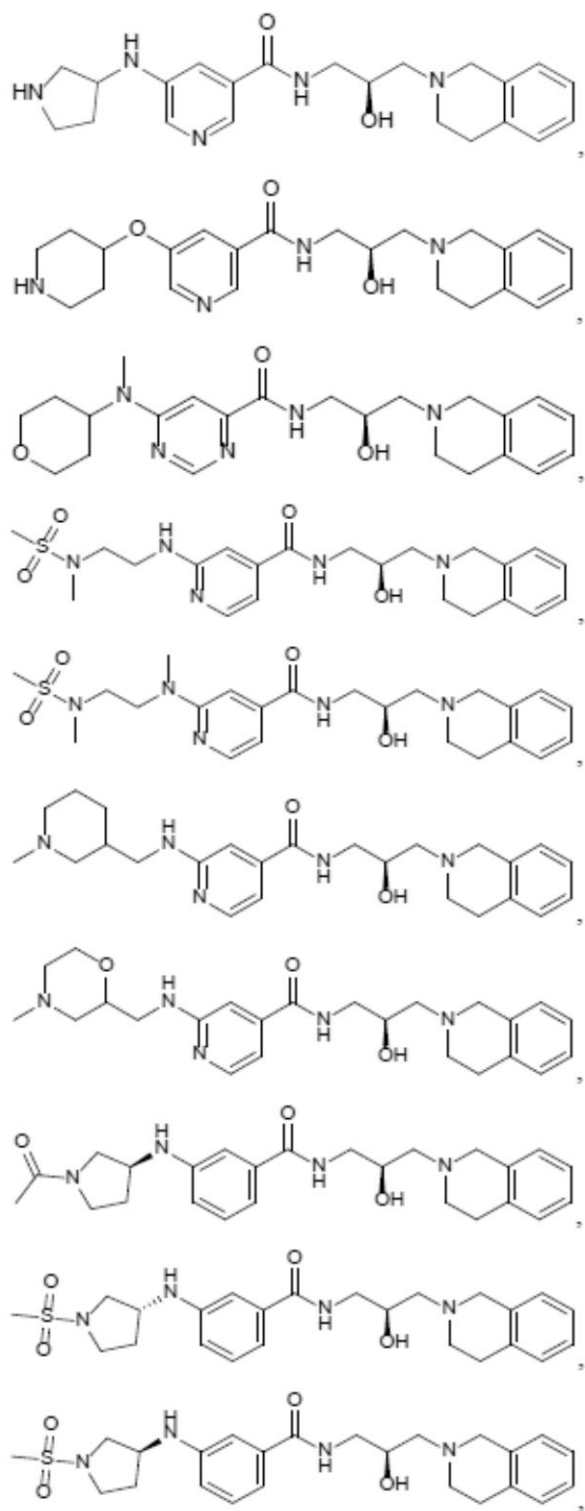


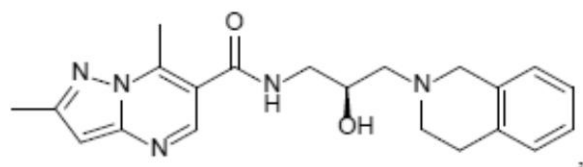
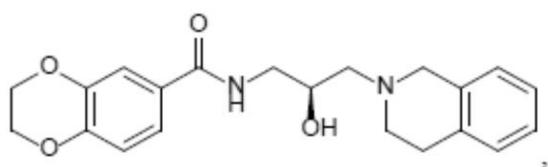
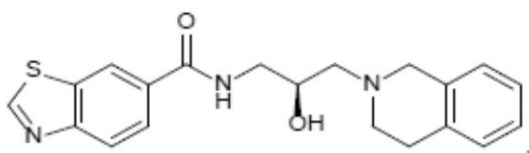
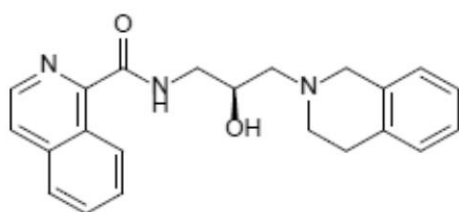
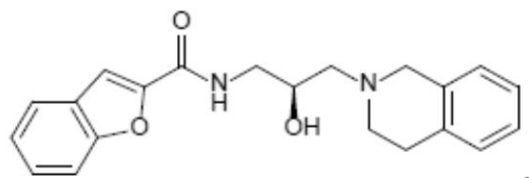
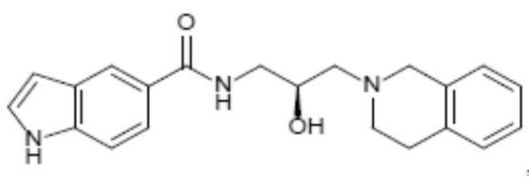
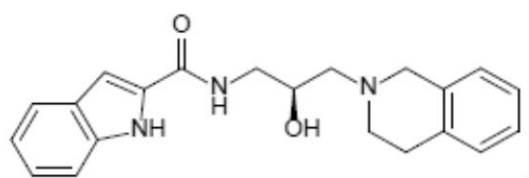


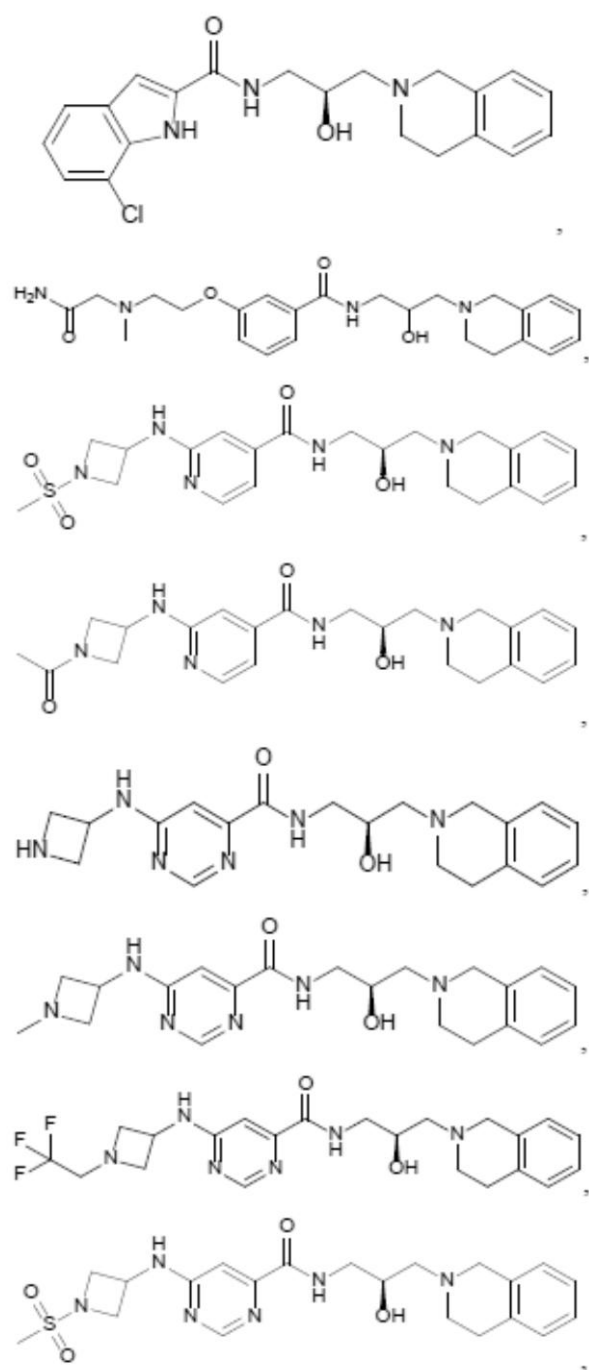


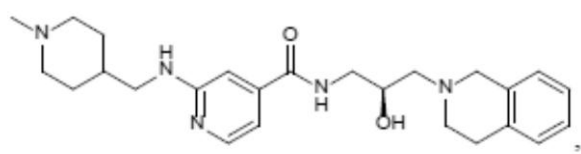
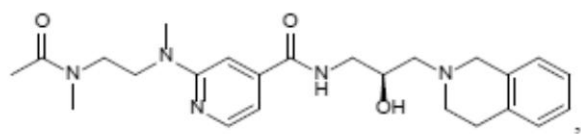
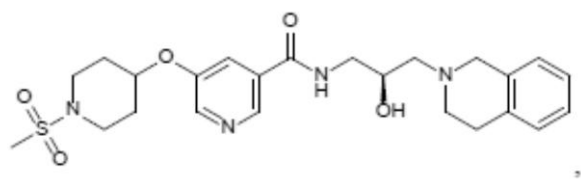
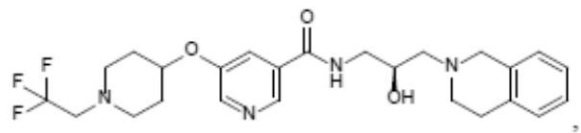
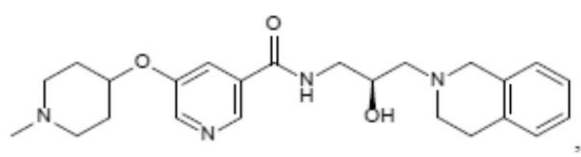
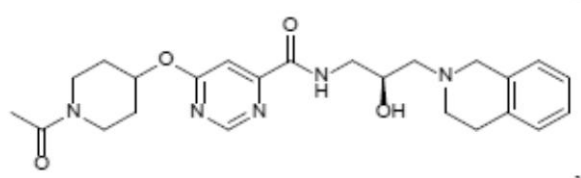
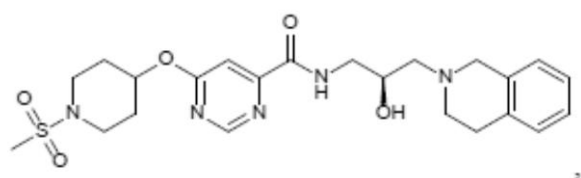
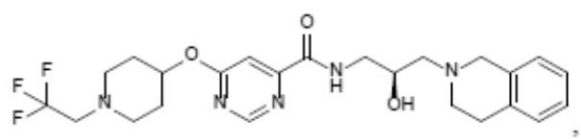
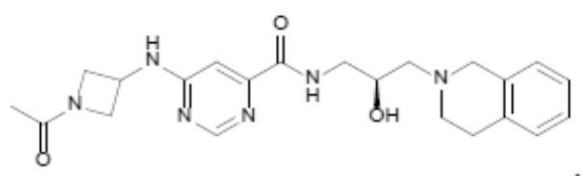


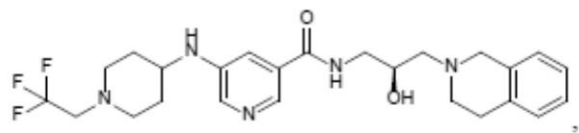
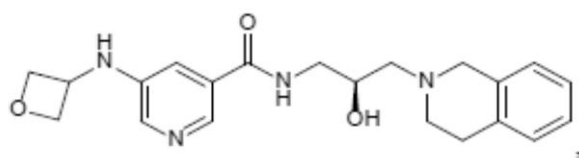
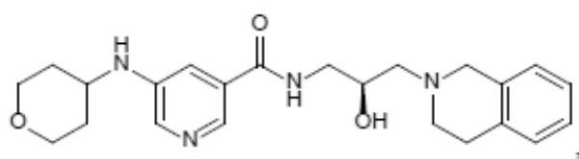
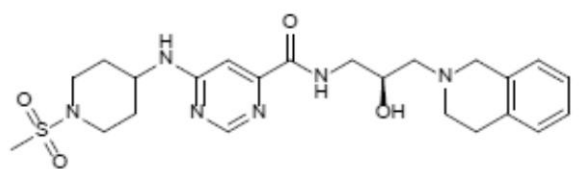
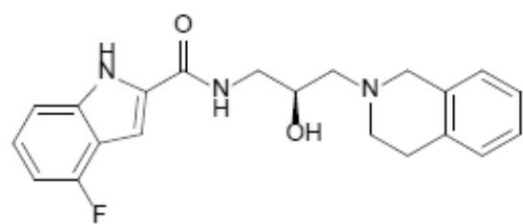
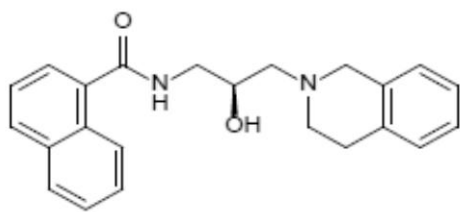
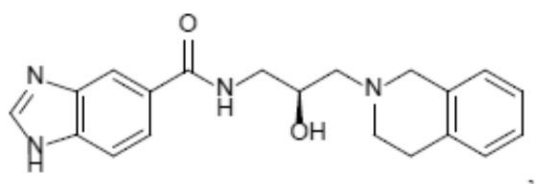
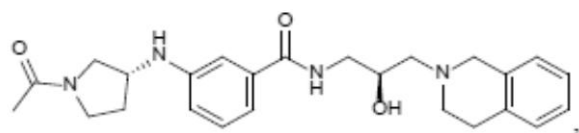


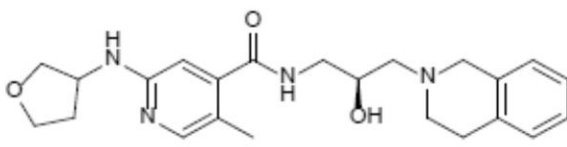
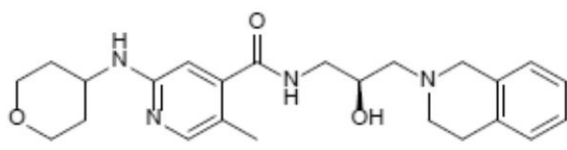
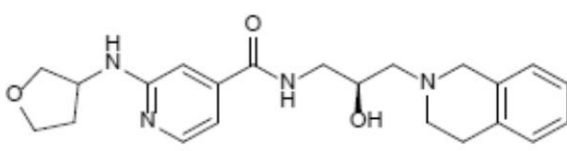
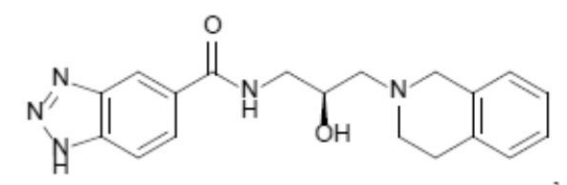
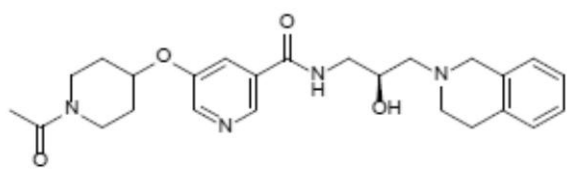
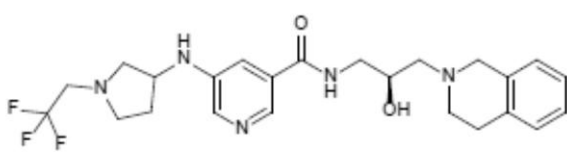
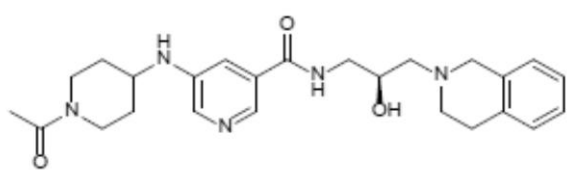
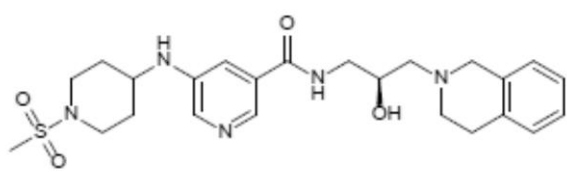


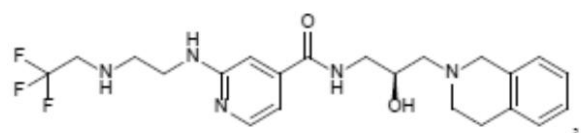
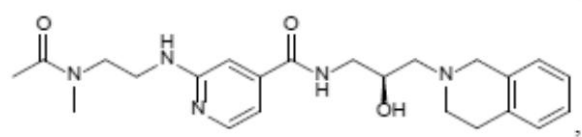
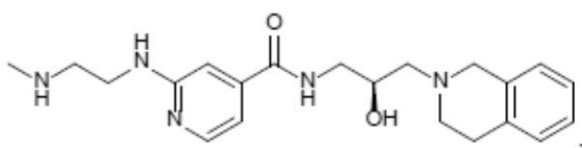
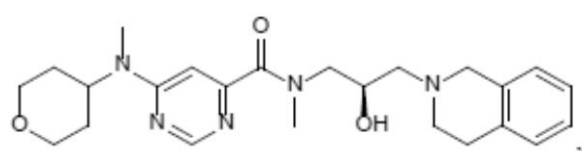
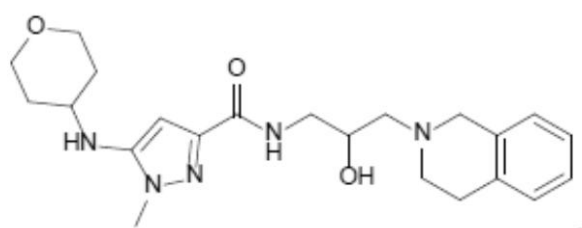
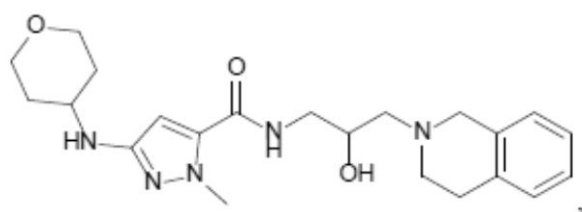
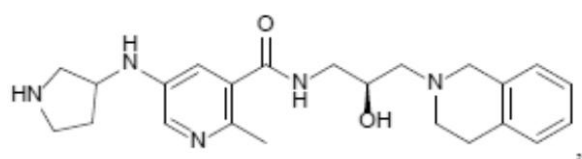
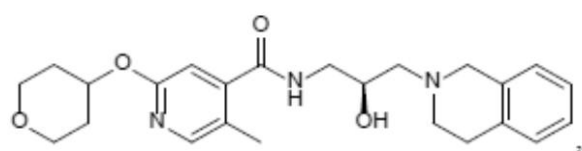


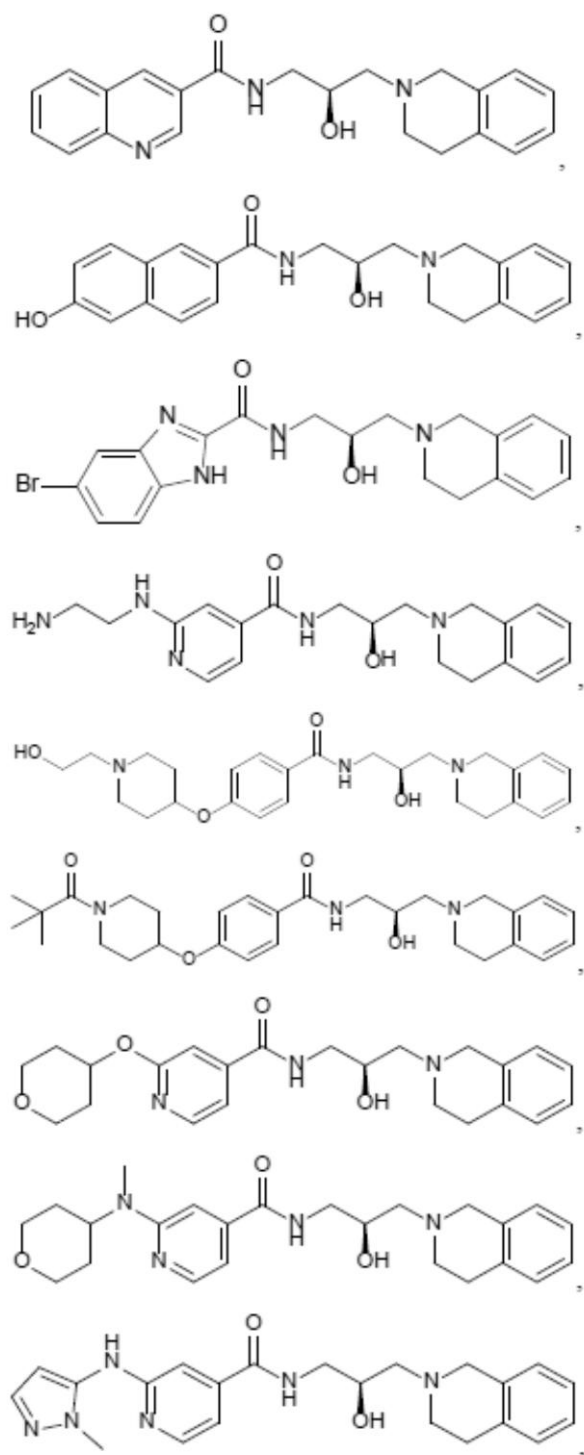




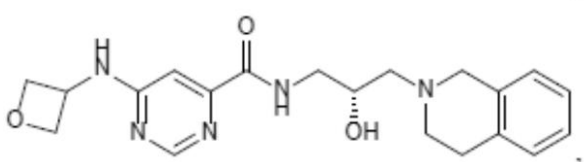
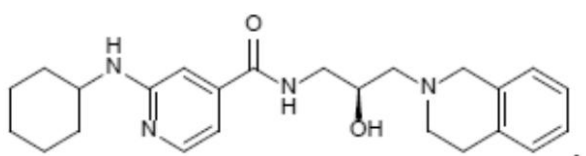
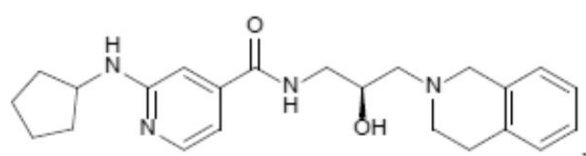
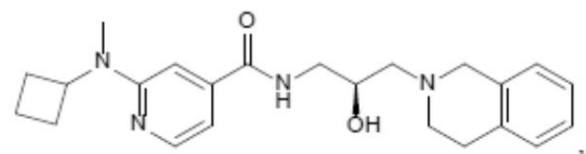
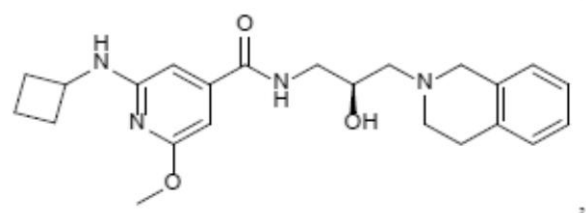
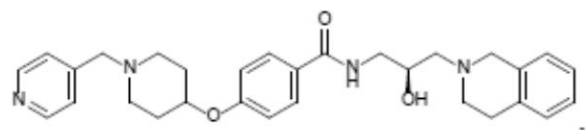
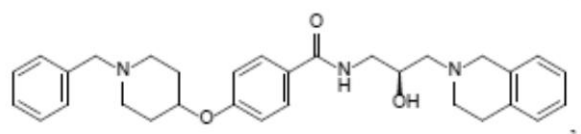
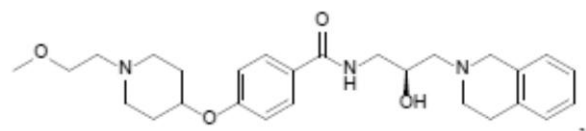
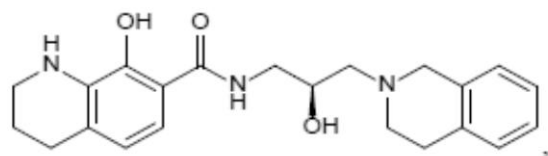
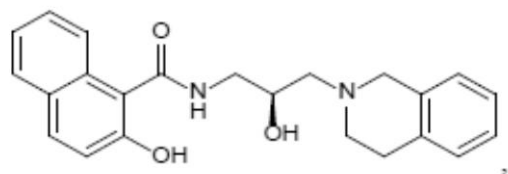
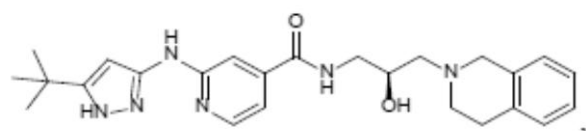






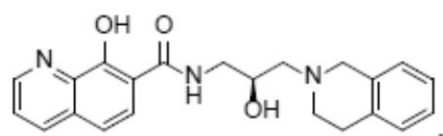
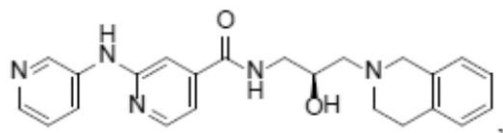
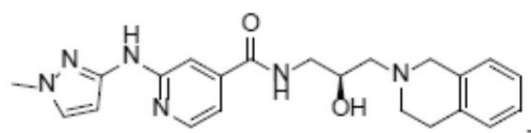
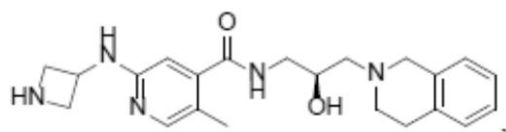
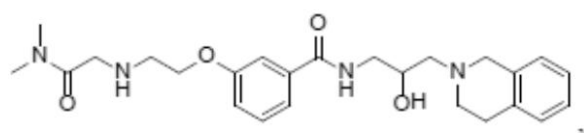
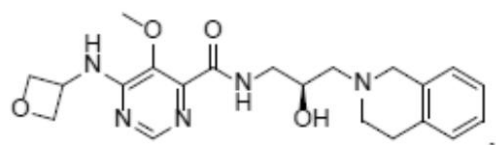
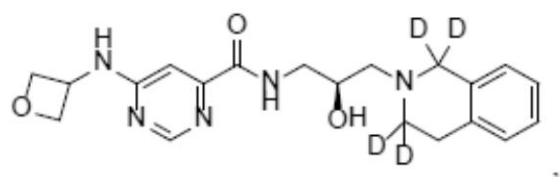


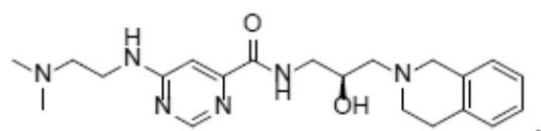
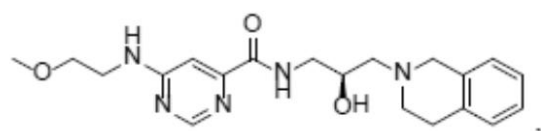
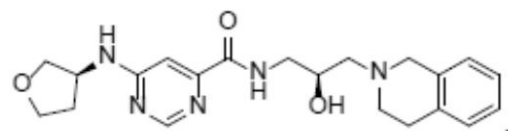
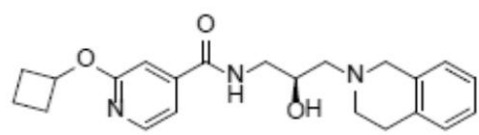
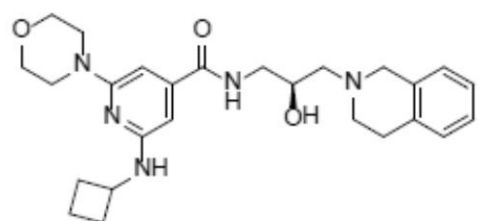
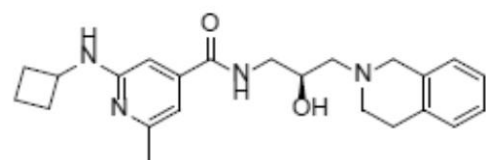
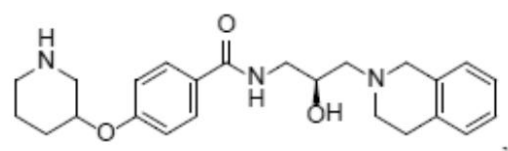
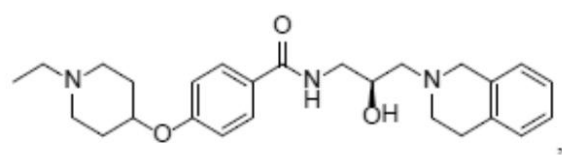
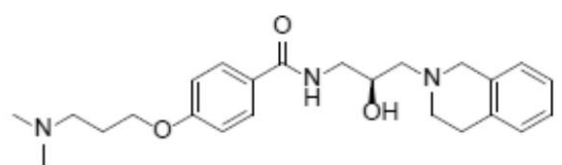


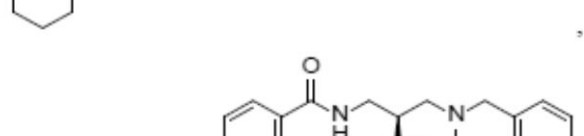
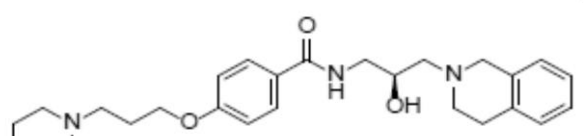
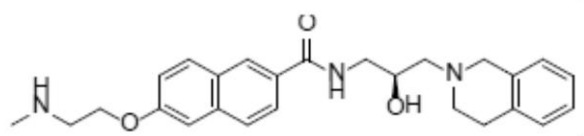
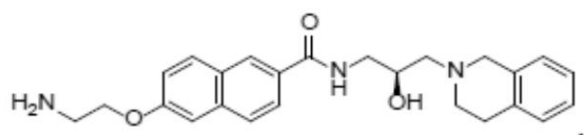
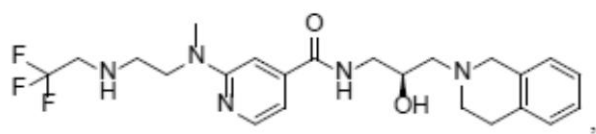
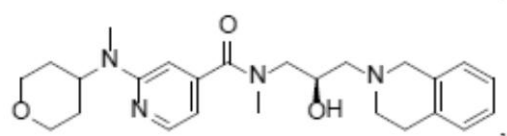
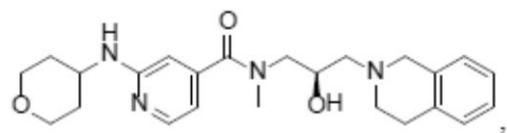
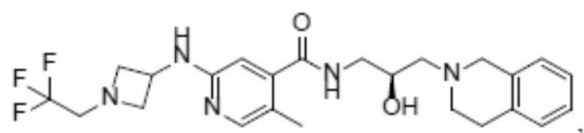
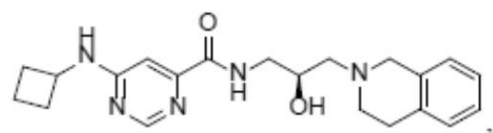
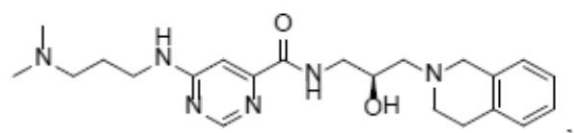


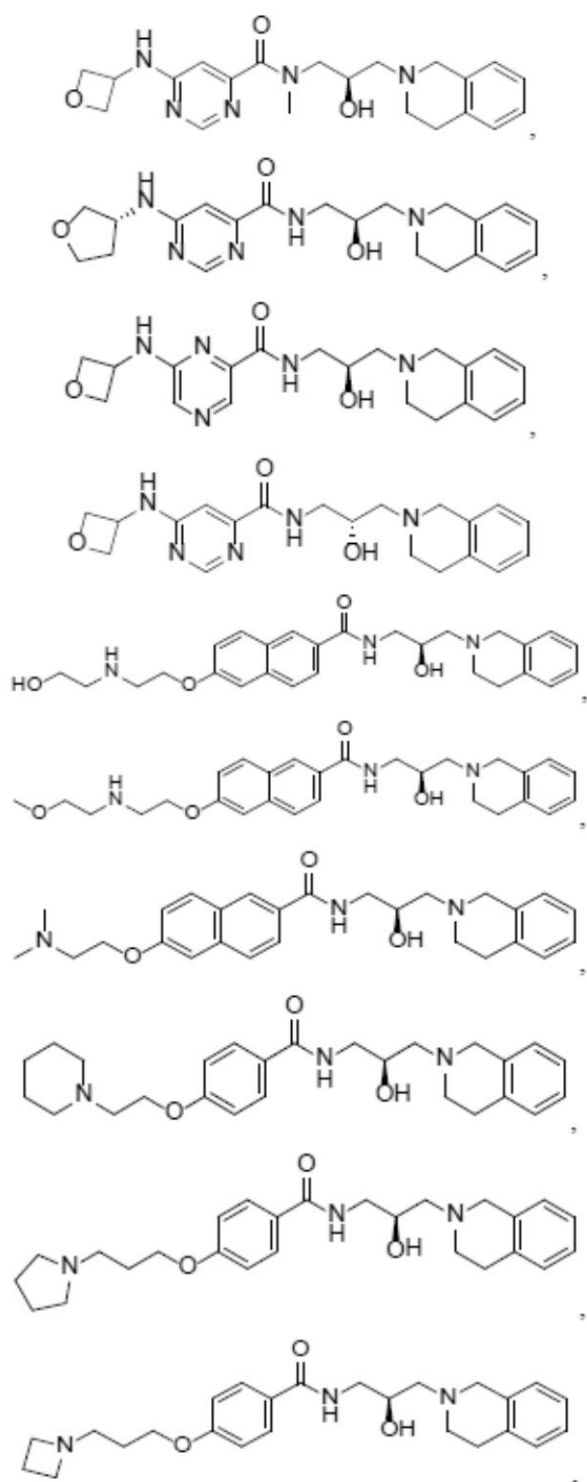
## 【請求項 1 1 1】

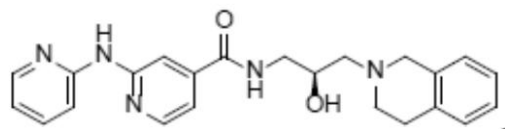
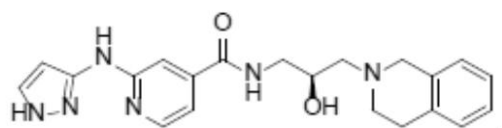
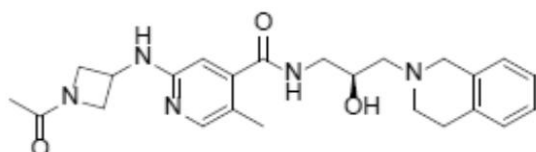
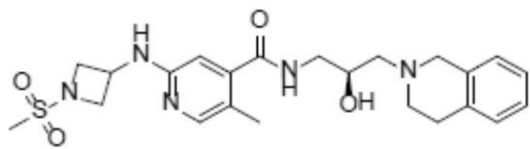
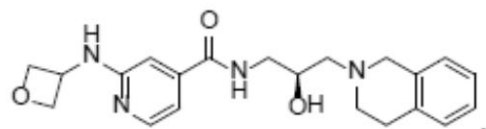
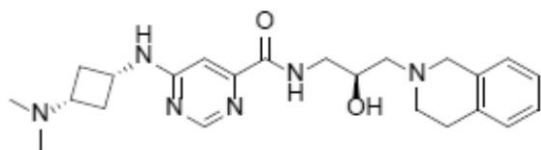
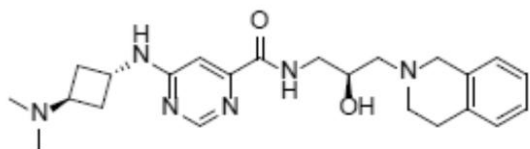
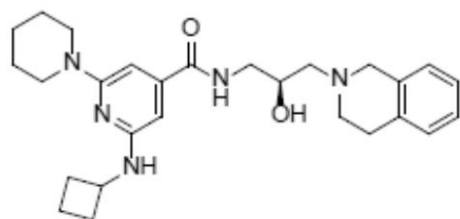
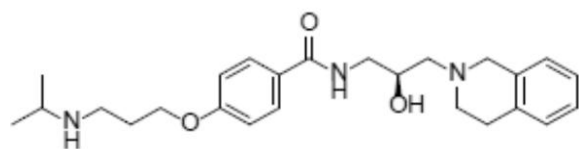
前記化合物が、以下に列挙された化合物及びその薬学的に許容される塩からなる群から選択される請求項 1 に記載の化合物。

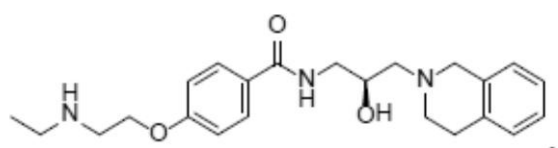
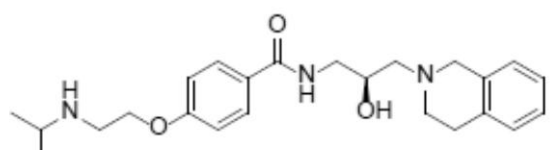
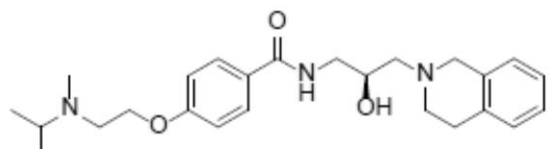
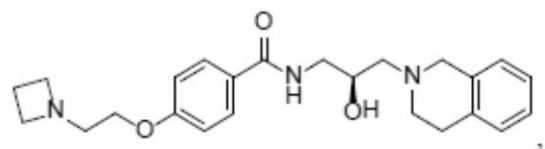
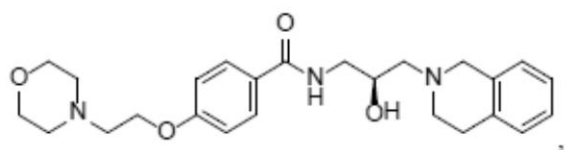
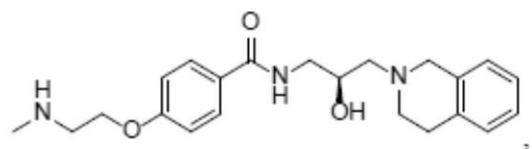
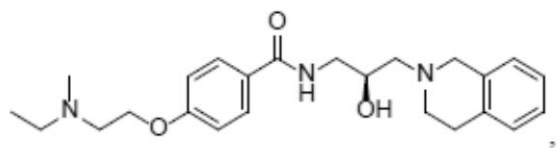
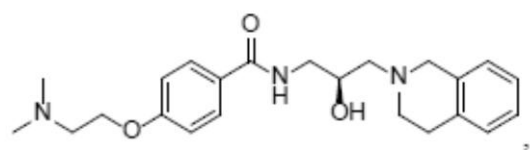
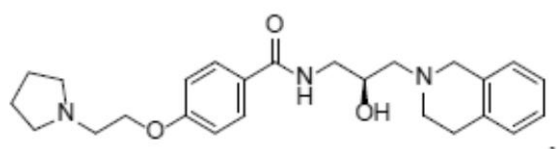


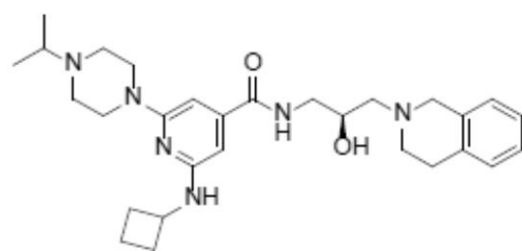
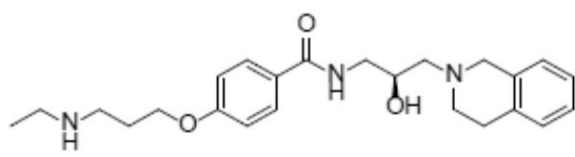
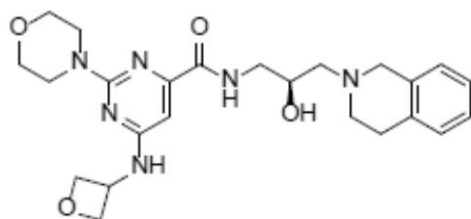
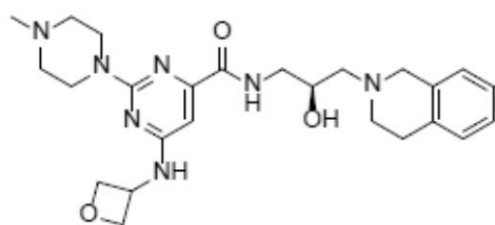
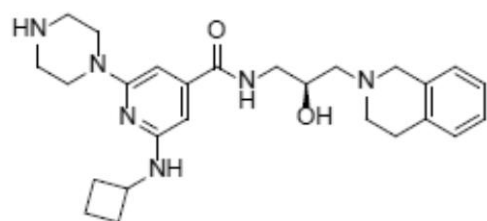
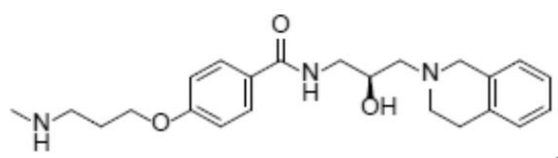




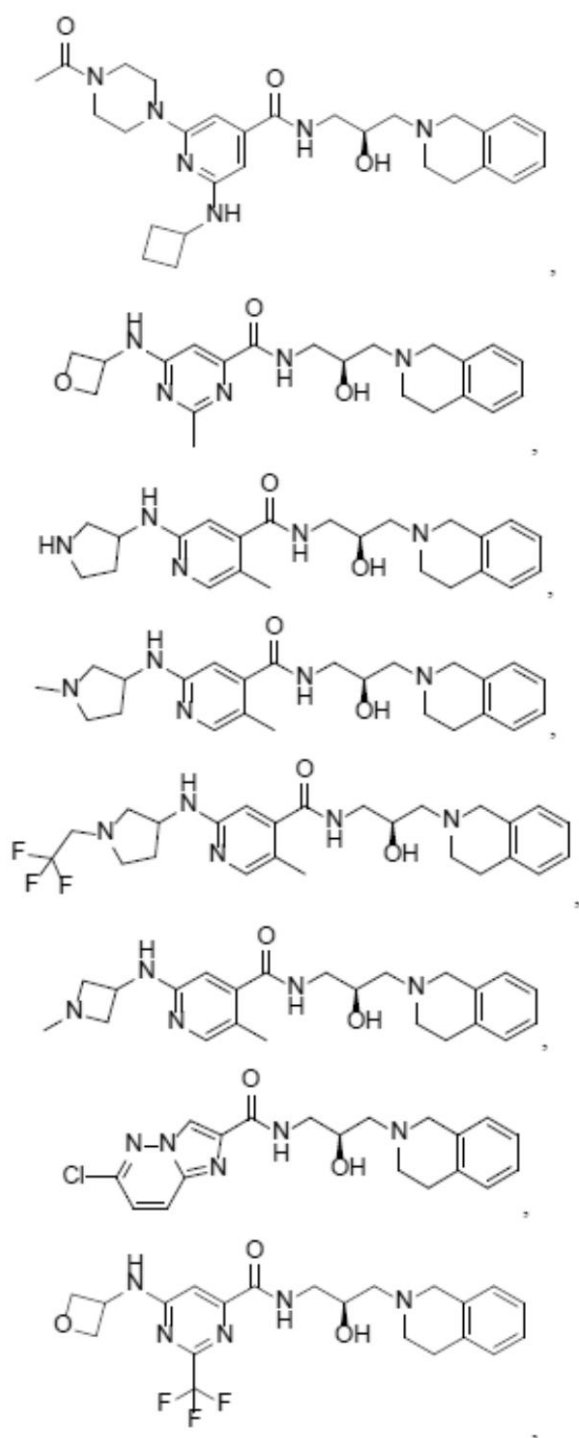


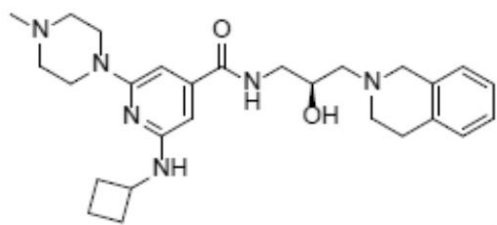
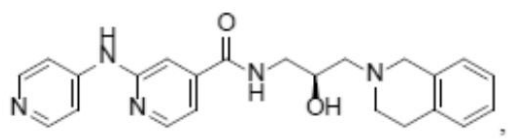
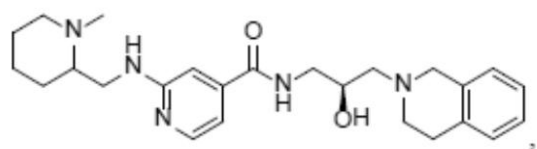
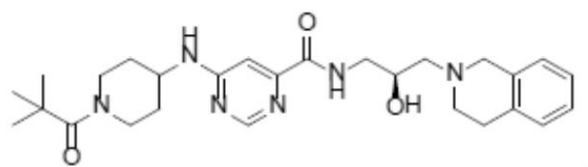
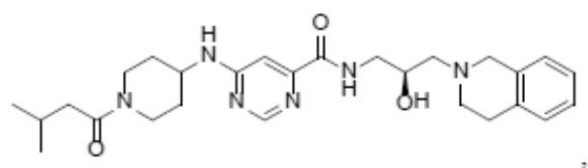
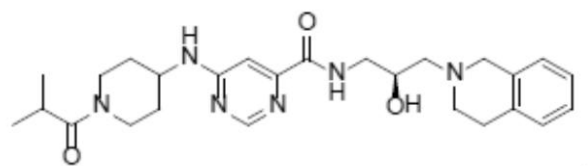
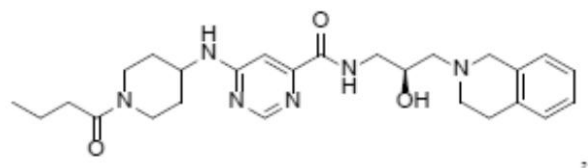
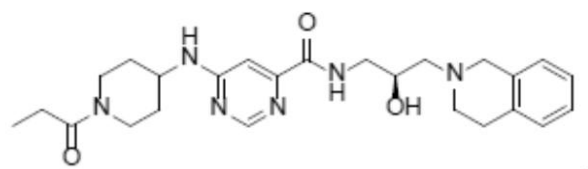


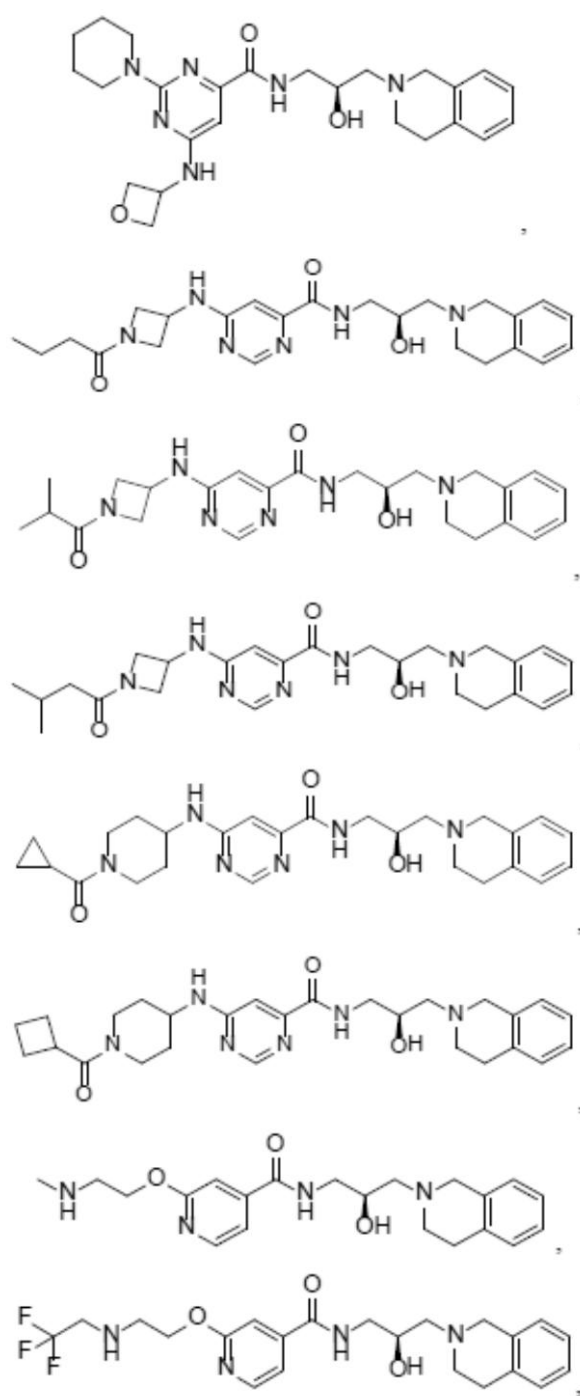


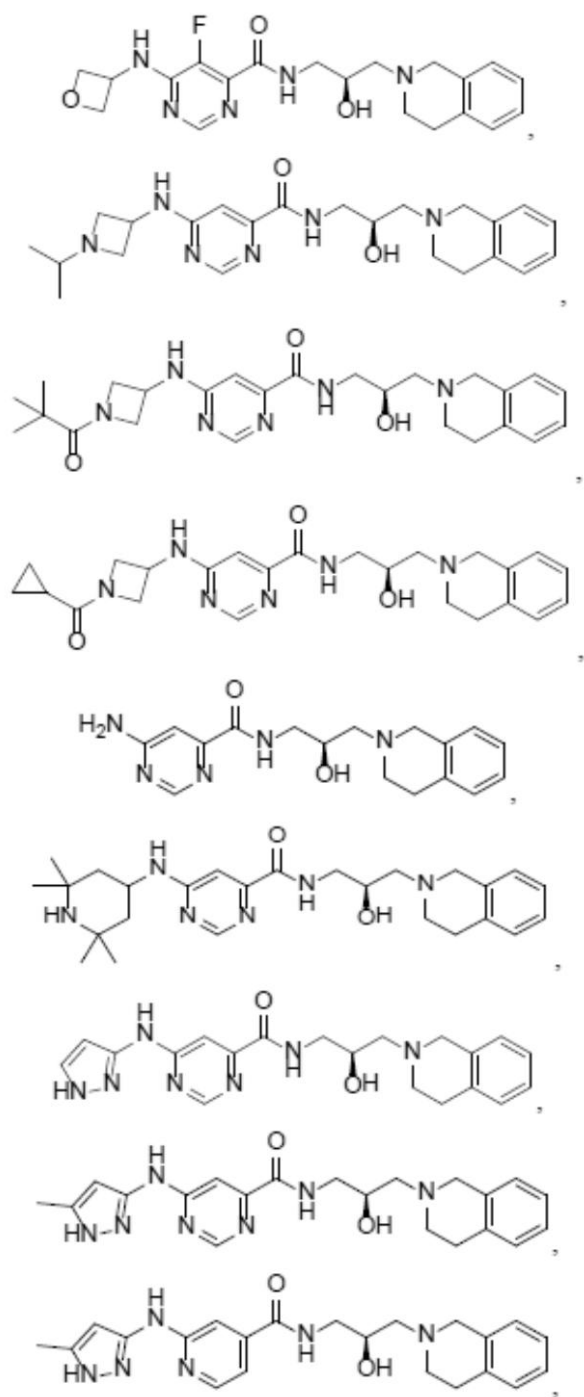


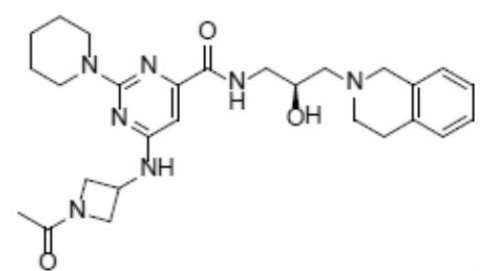
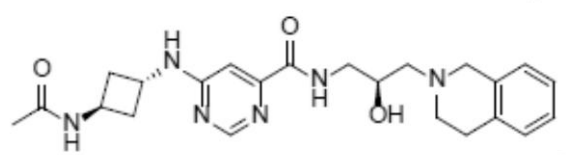
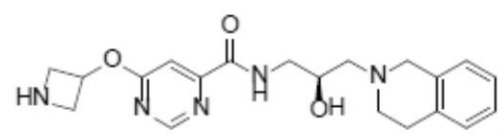
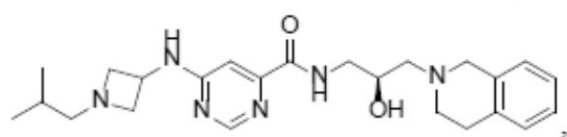
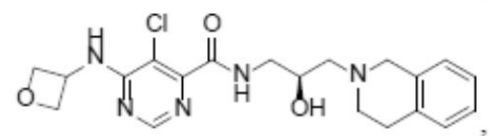
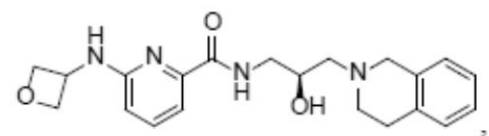
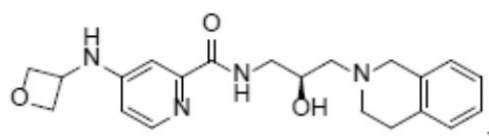
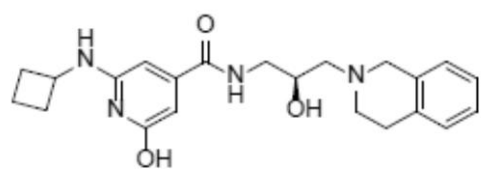


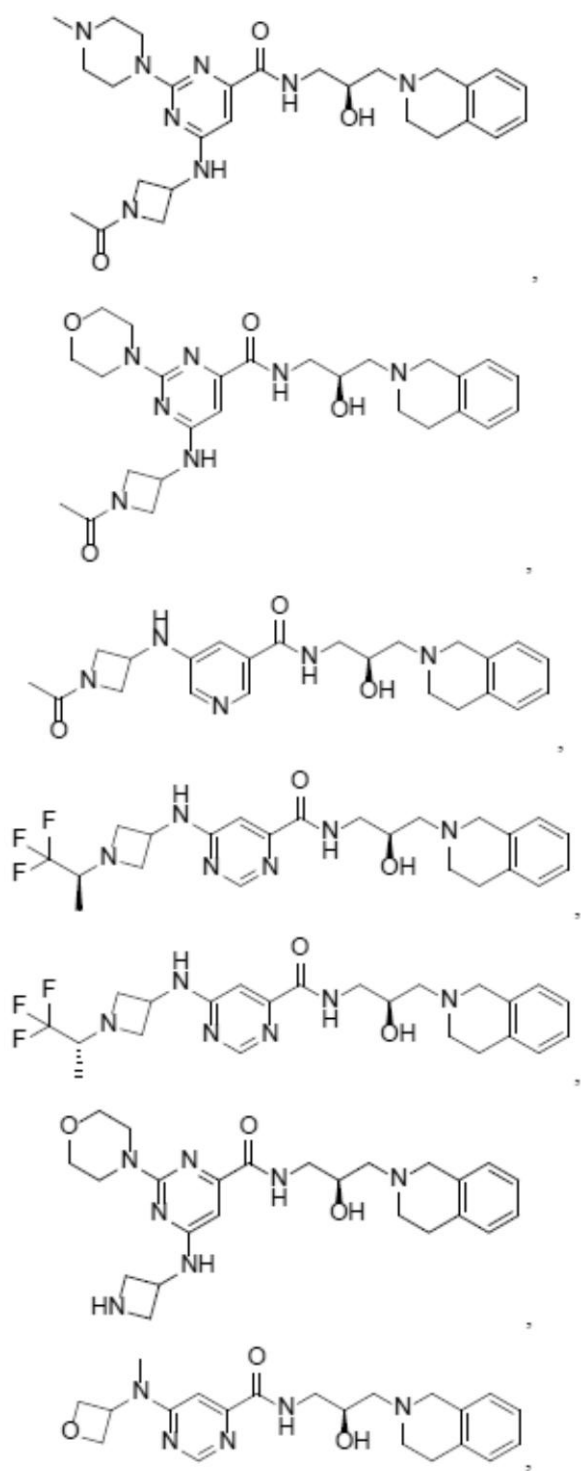


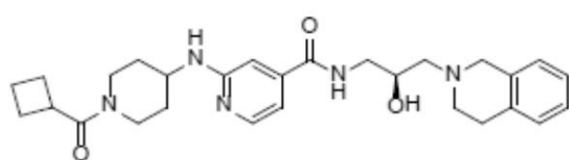
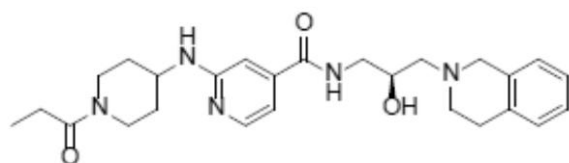
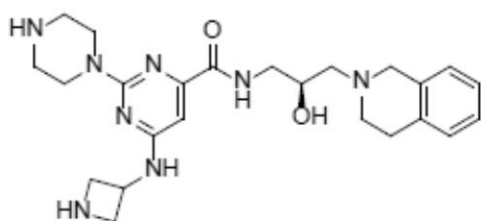
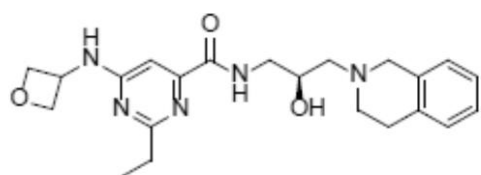
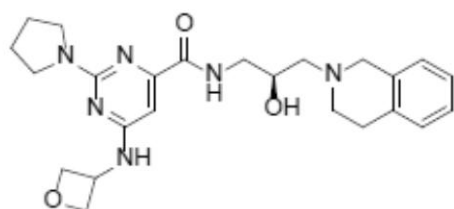
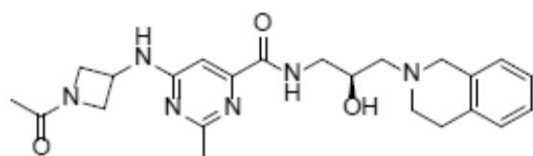
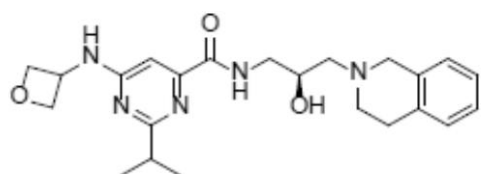


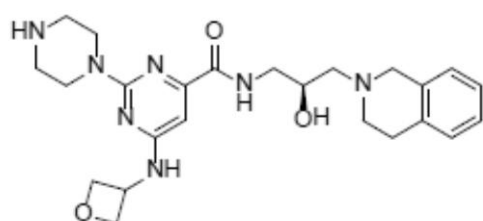
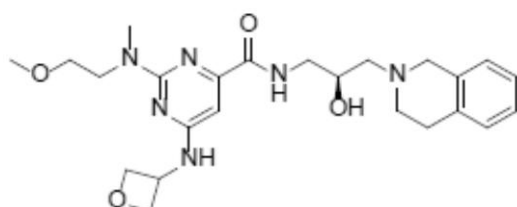
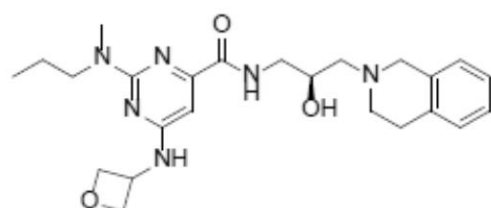
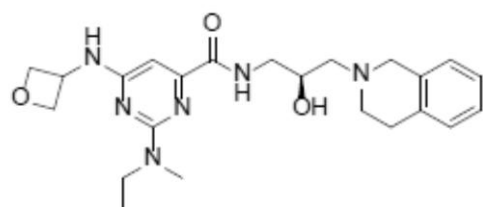
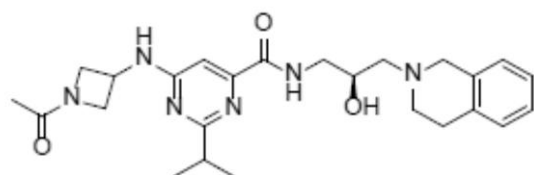
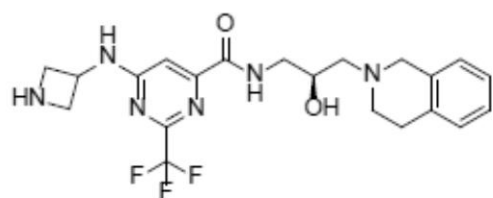






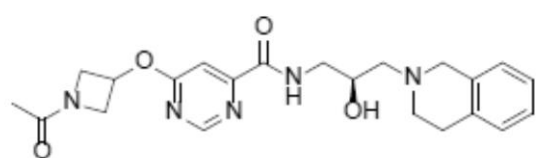
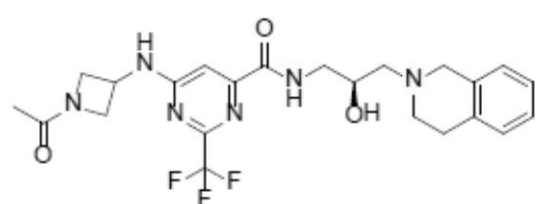
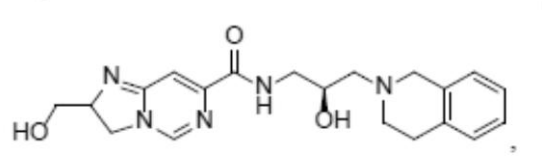
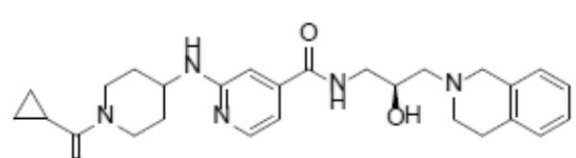
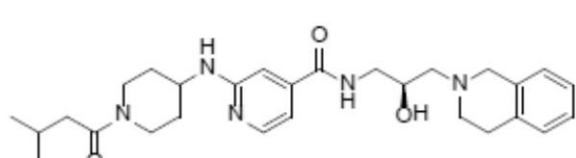
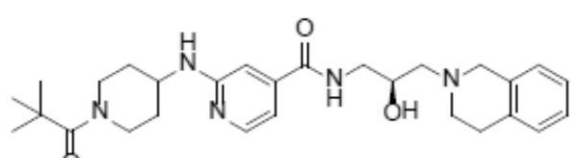
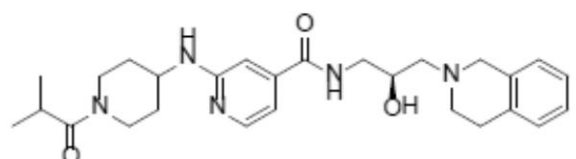
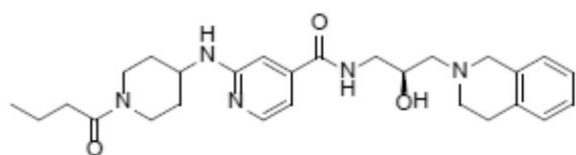


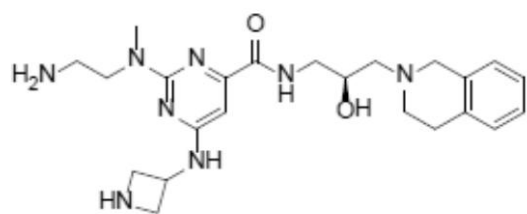
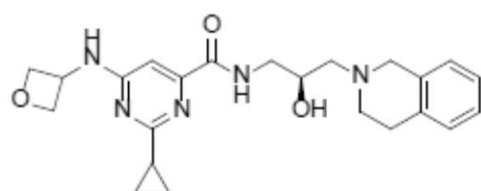
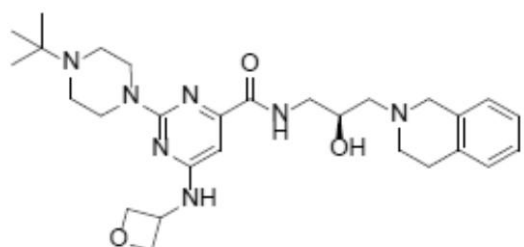
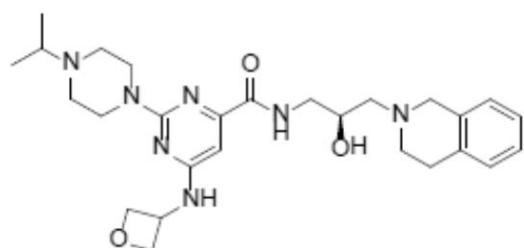
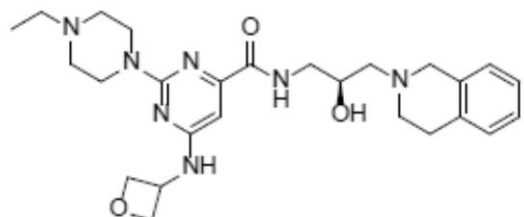
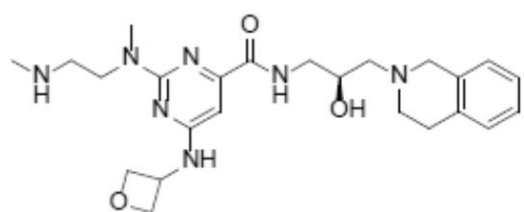


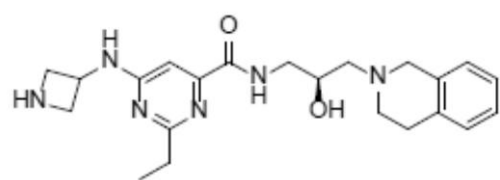
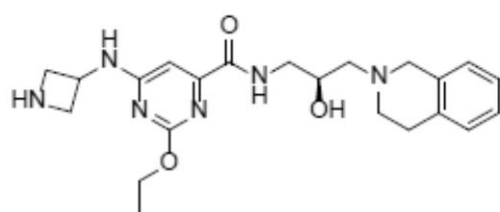
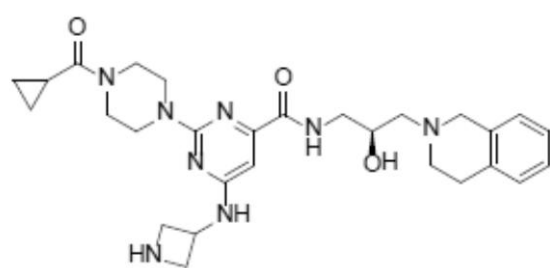
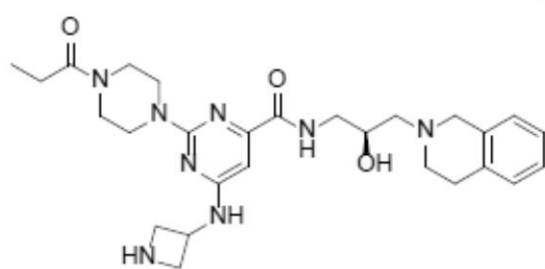
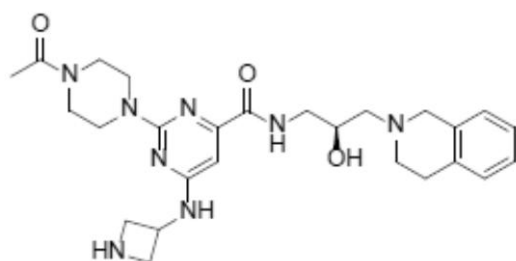
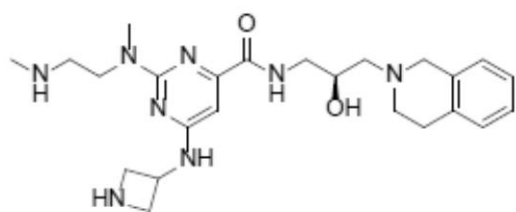


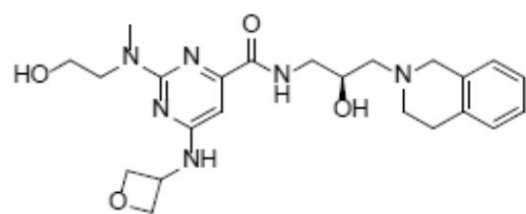
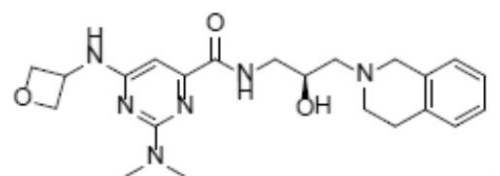
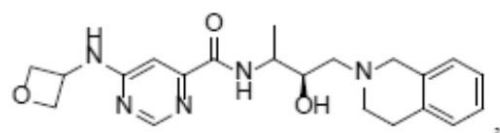
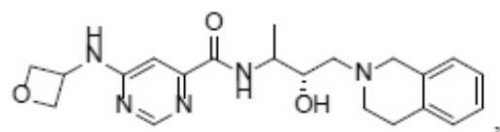
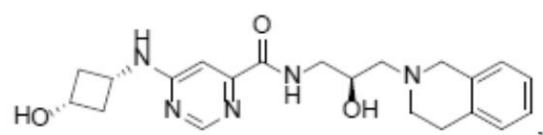
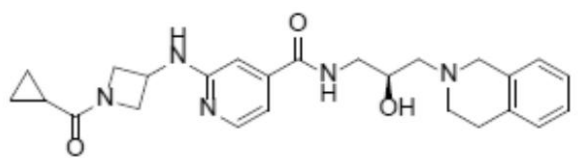
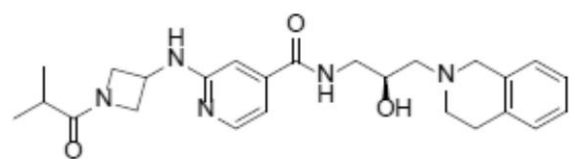
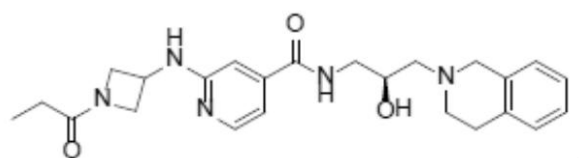


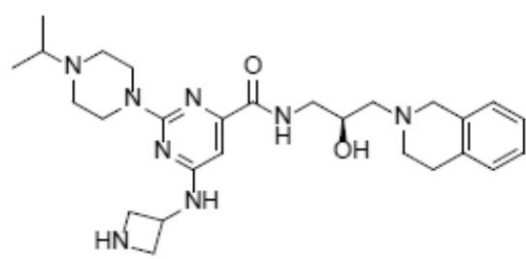
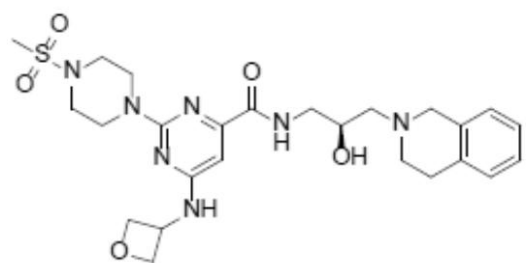
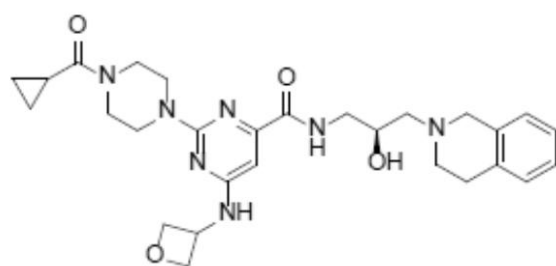
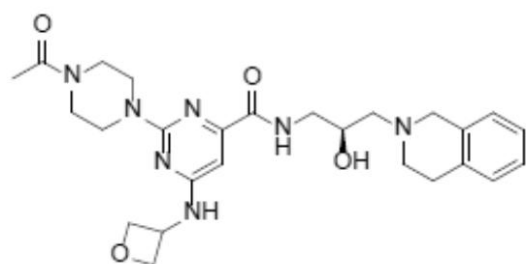
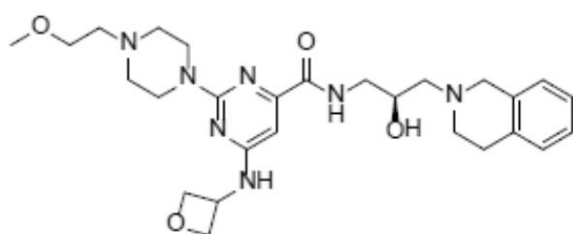


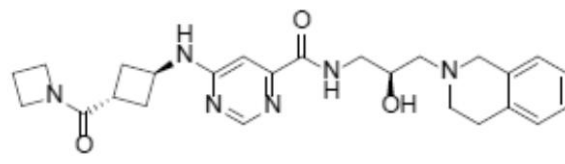
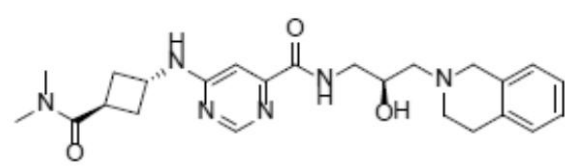
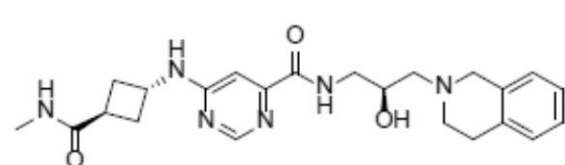
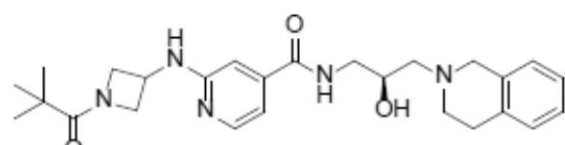
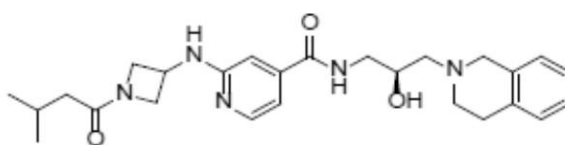
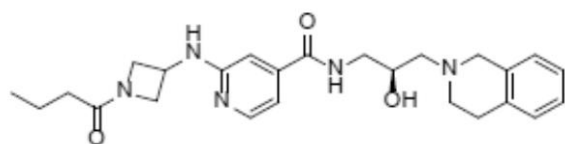
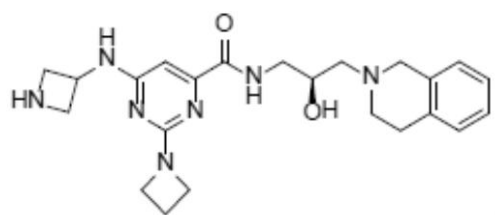
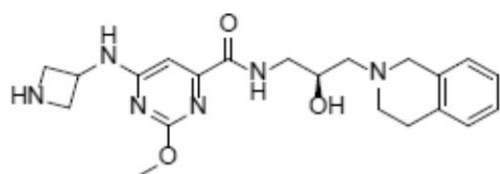


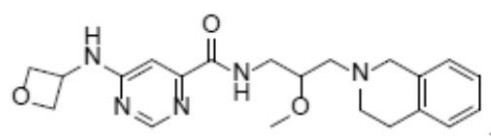
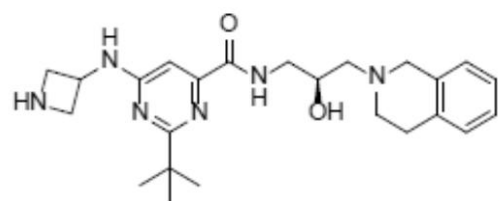
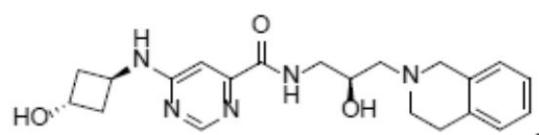
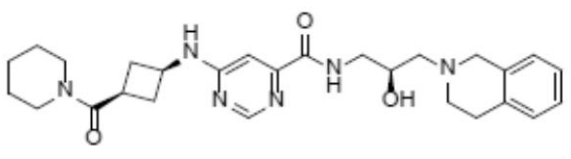
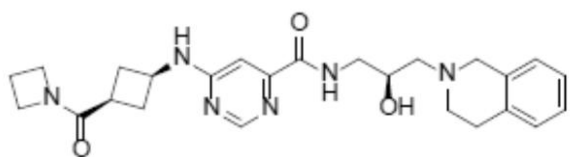
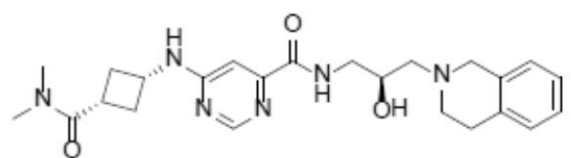
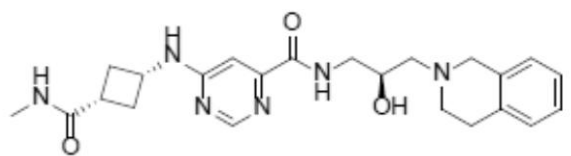
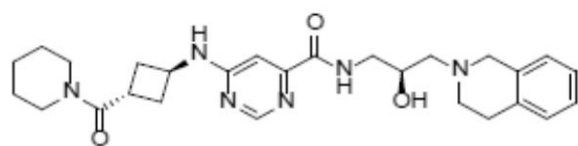




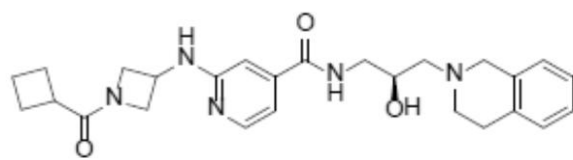
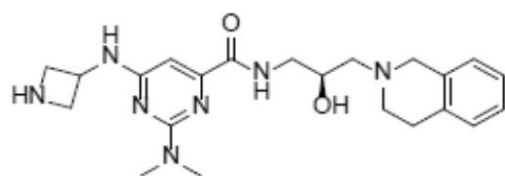
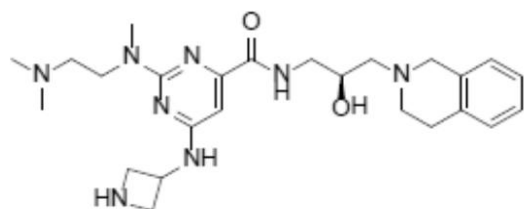
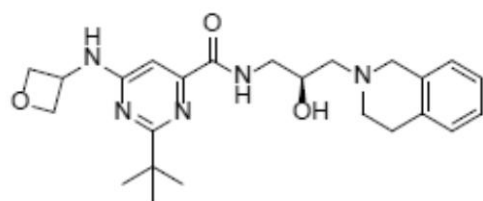
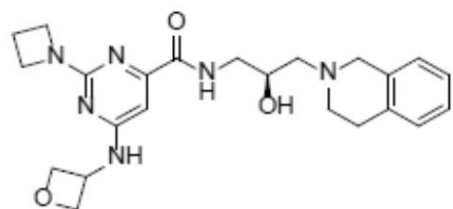
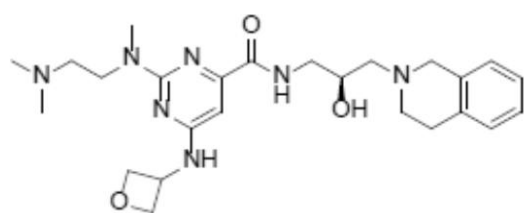
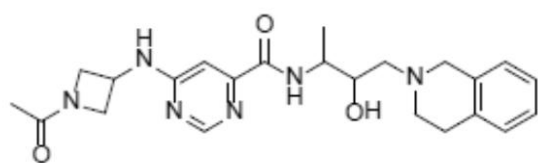


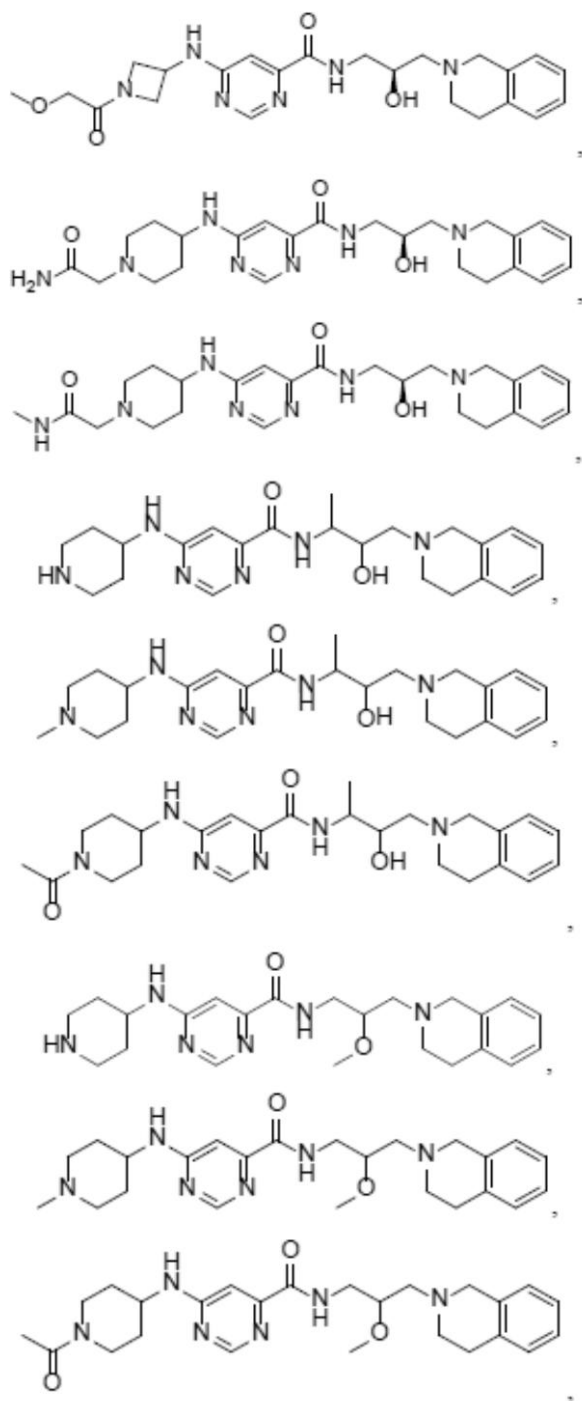


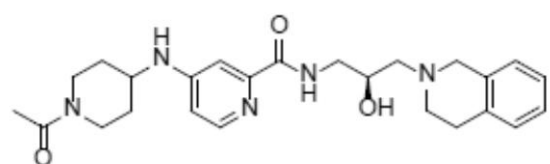
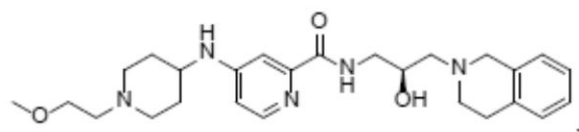
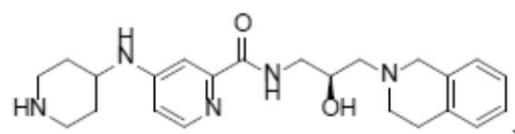
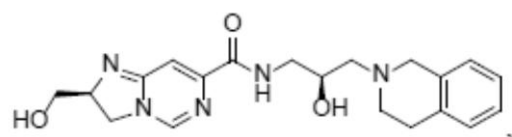
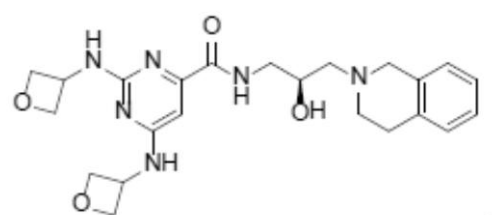
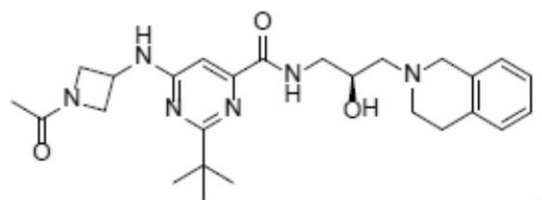
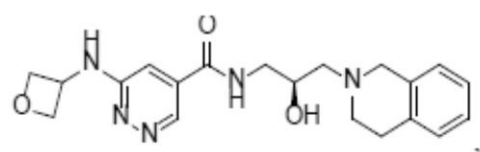
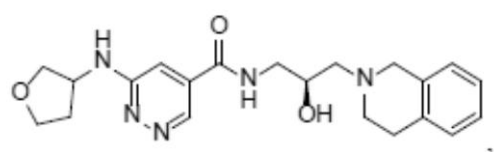


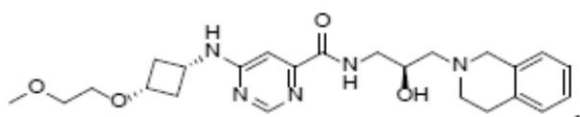
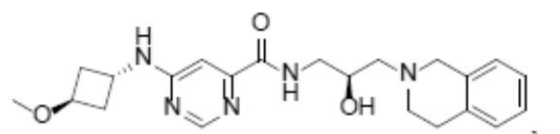
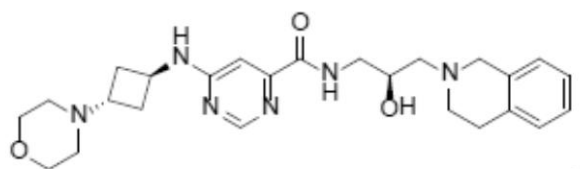
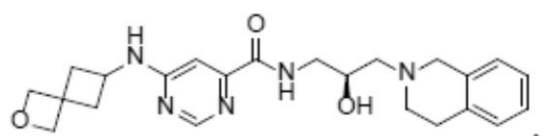
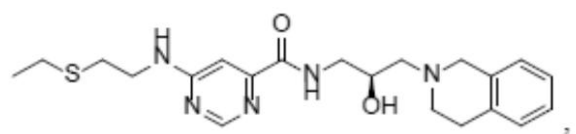
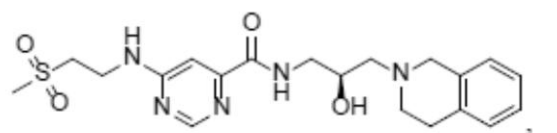
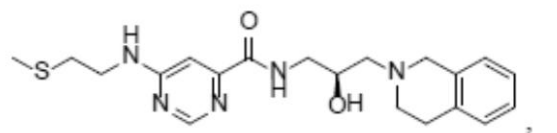
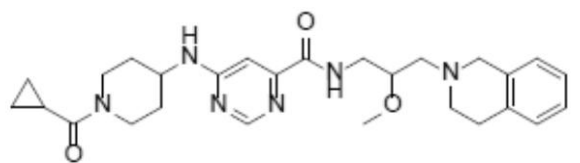
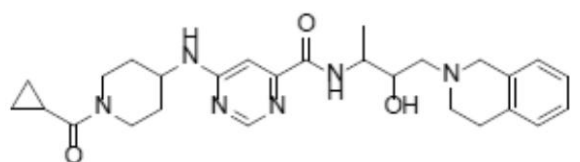


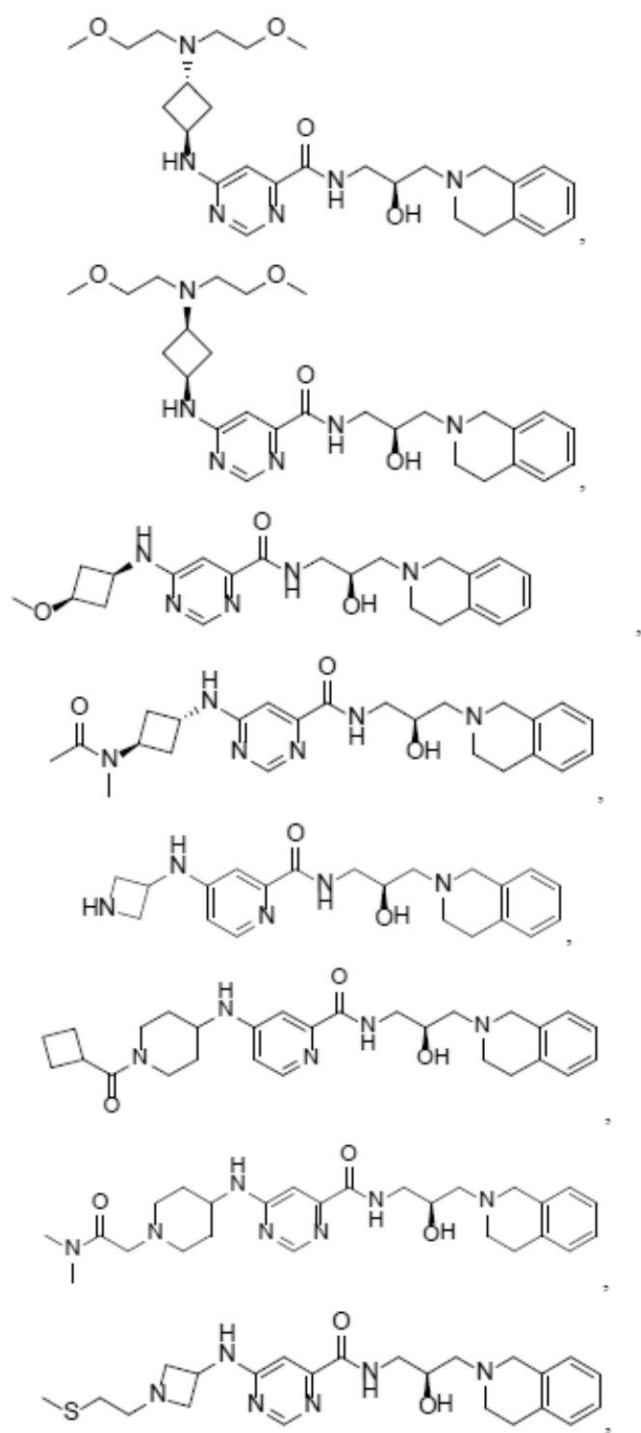


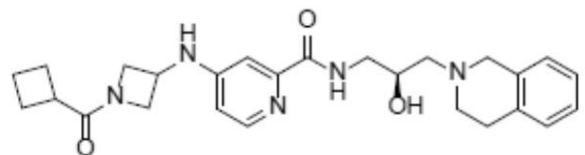
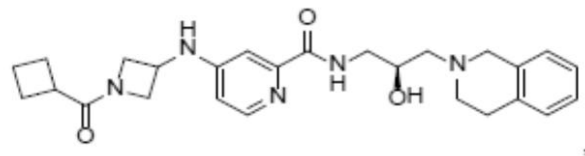
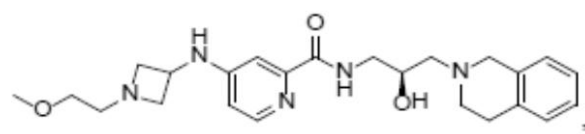
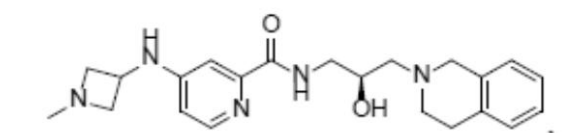
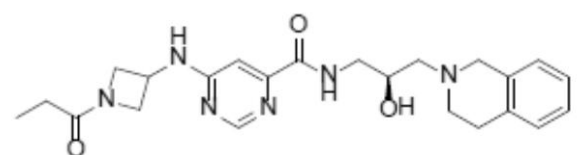
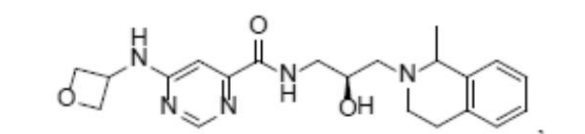
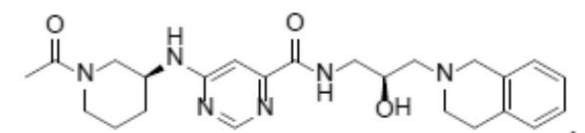
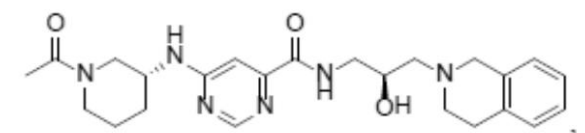
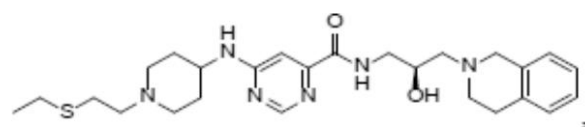
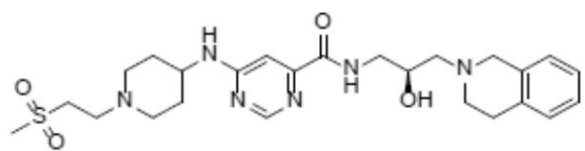


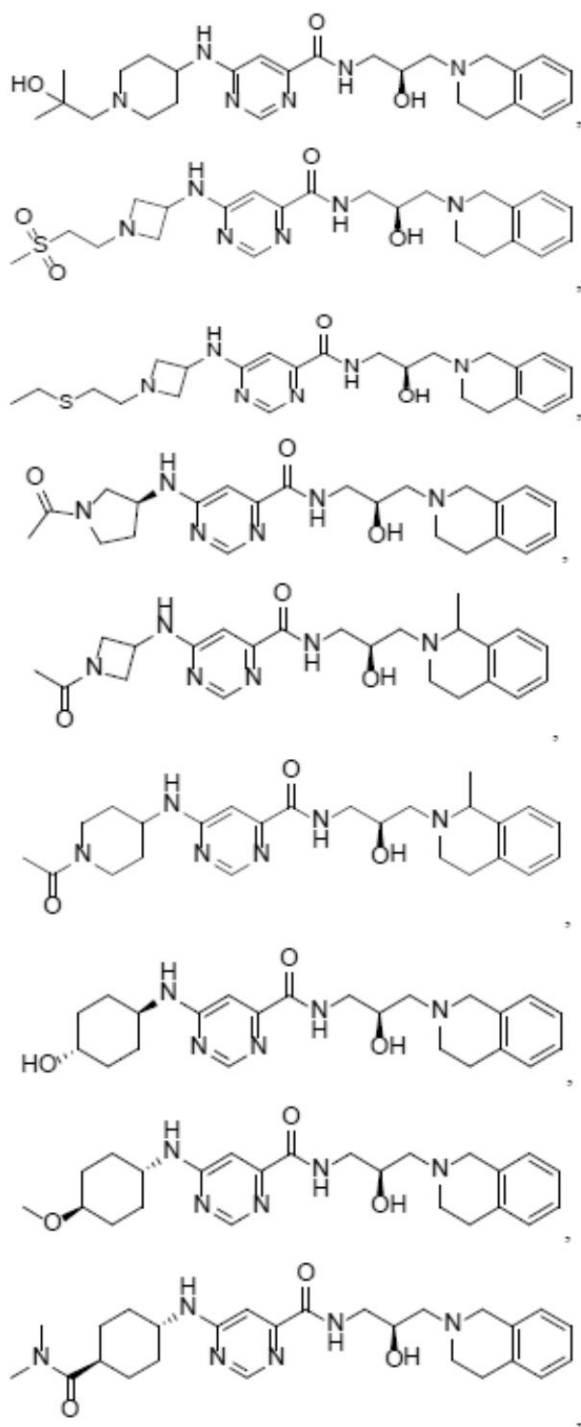


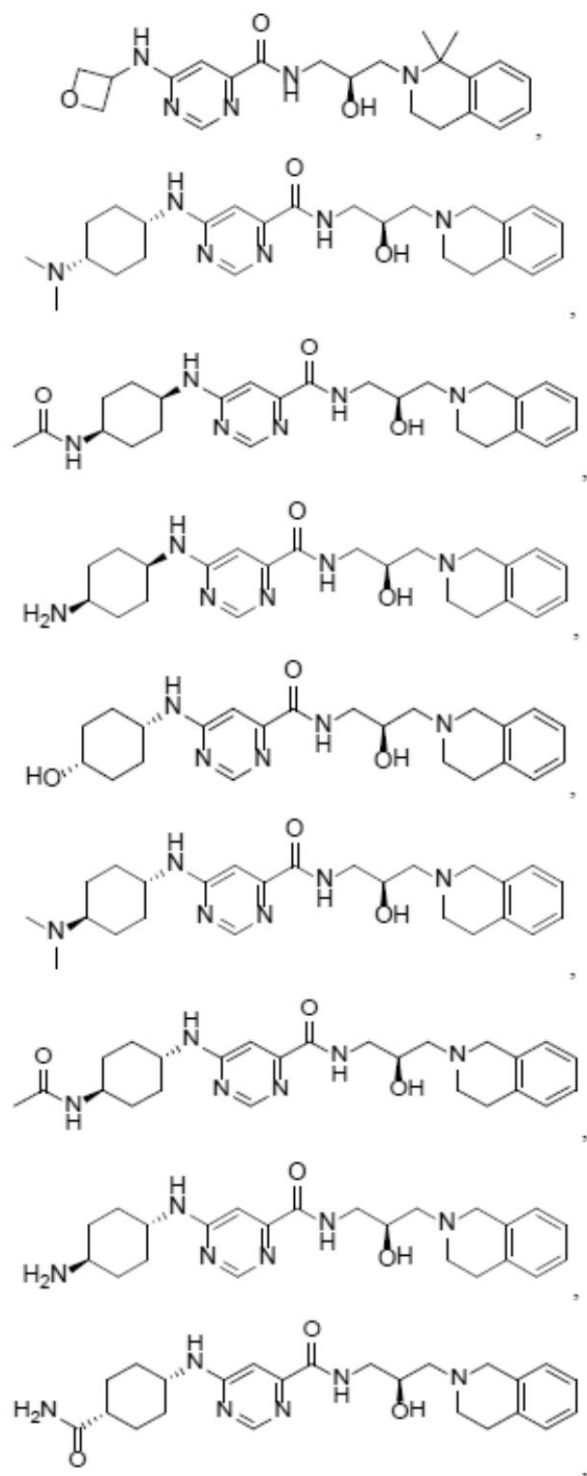




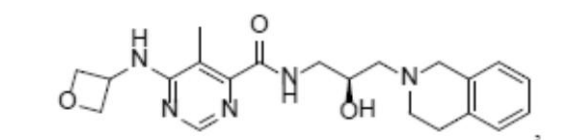
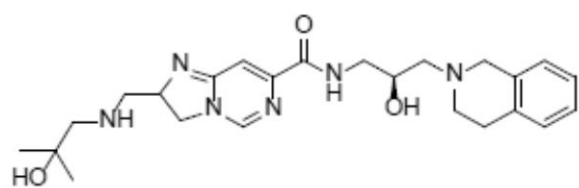
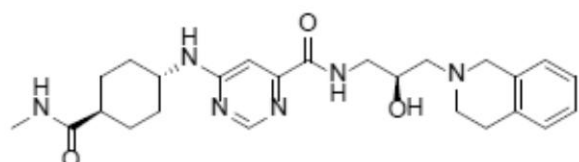
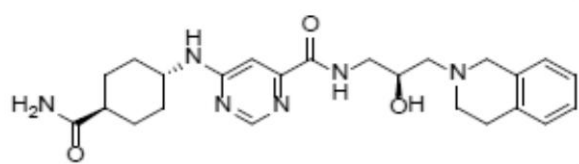
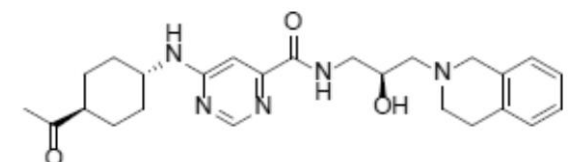
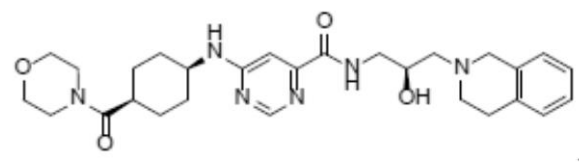
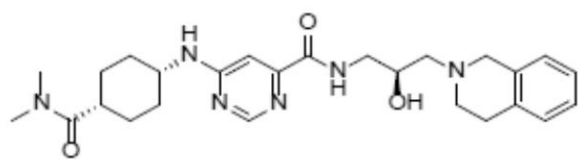
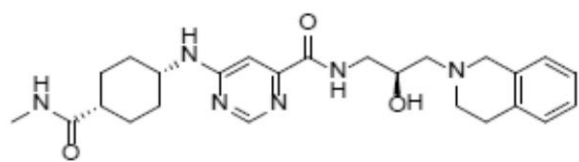


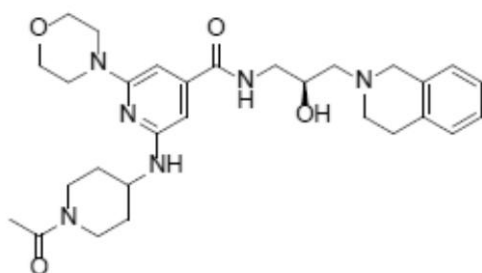
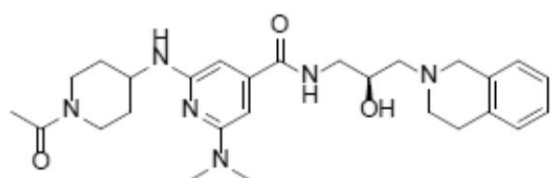
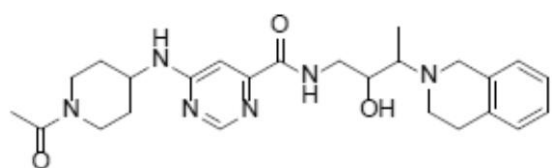
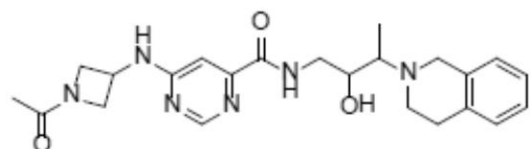
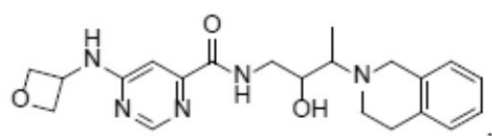
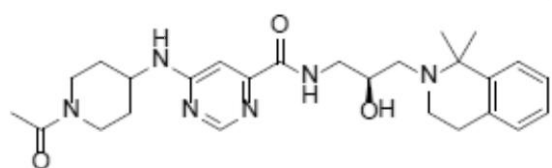
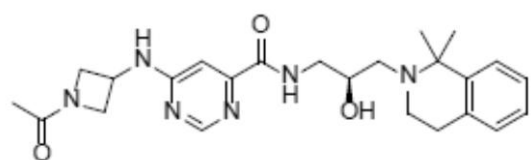


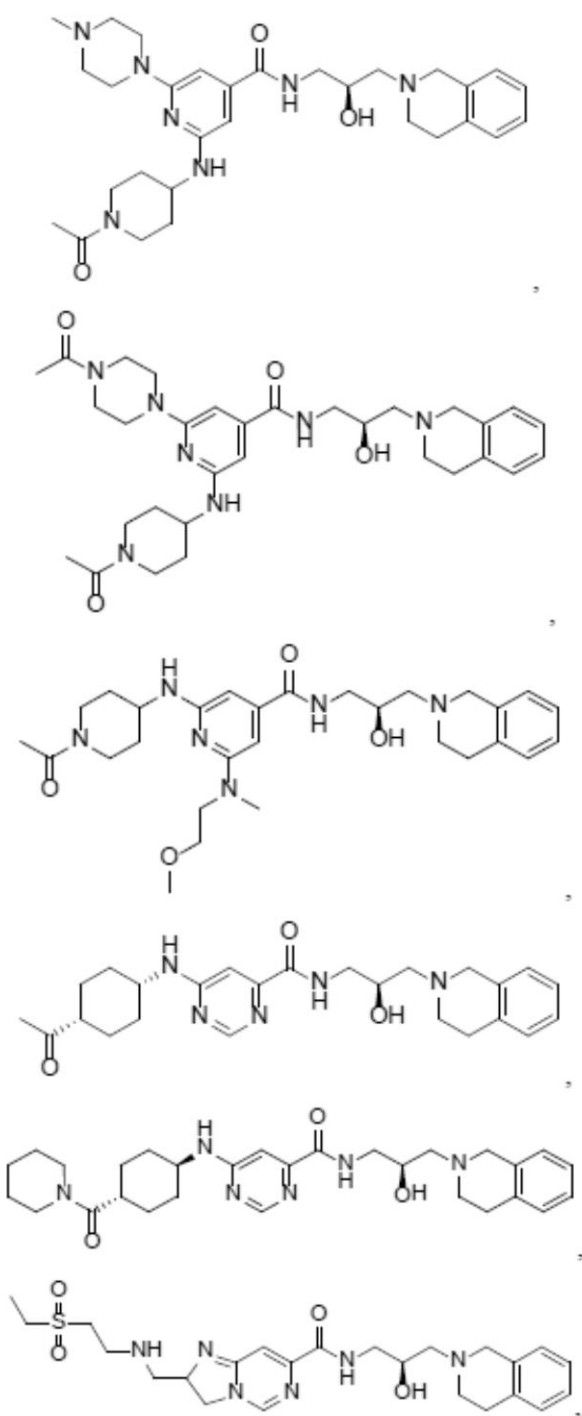


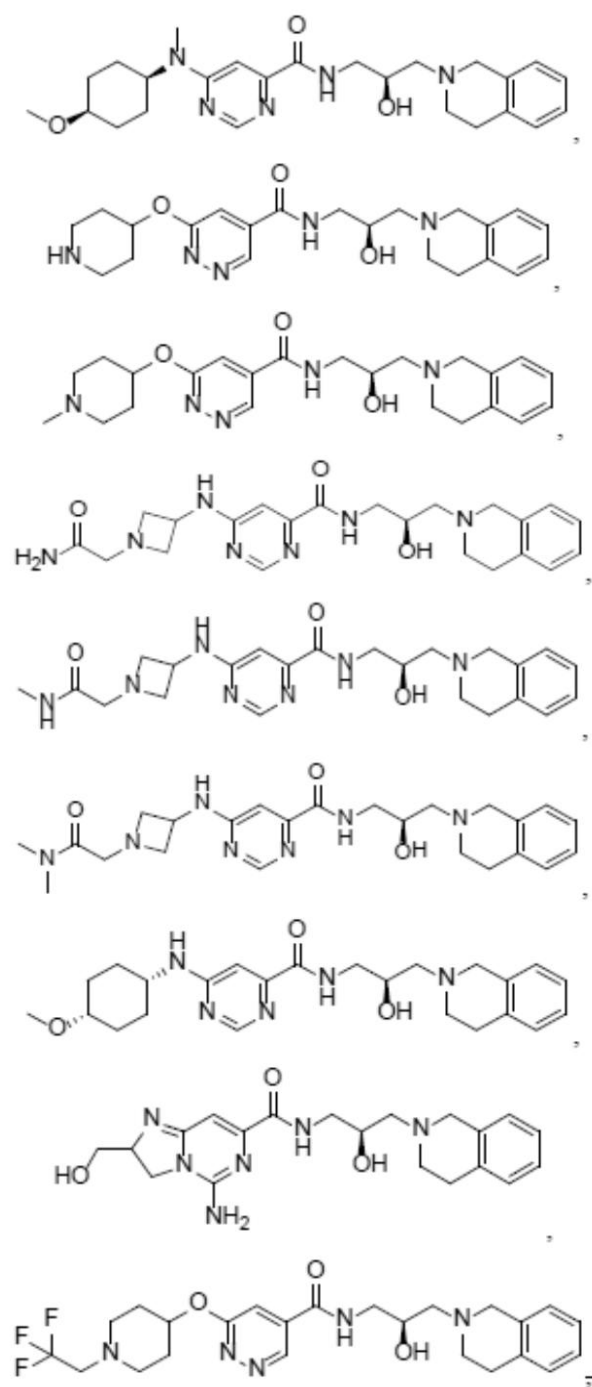


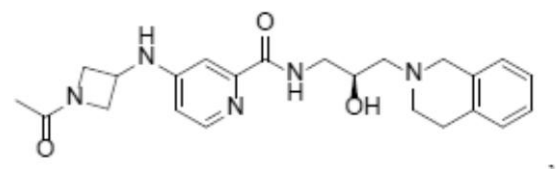
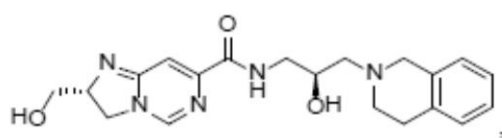
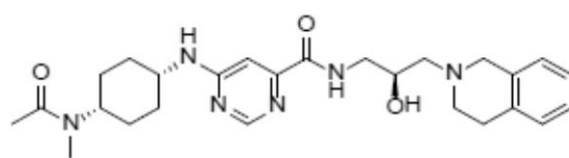
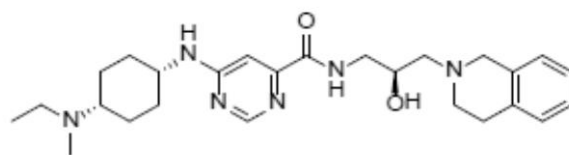
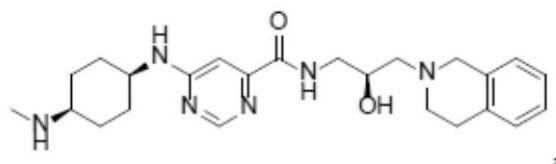
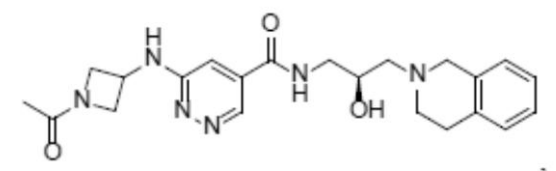
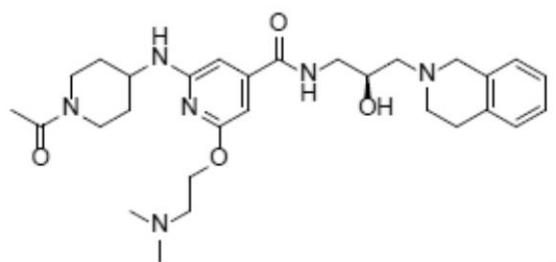
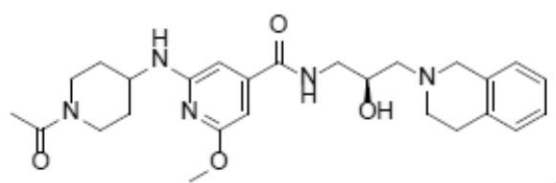


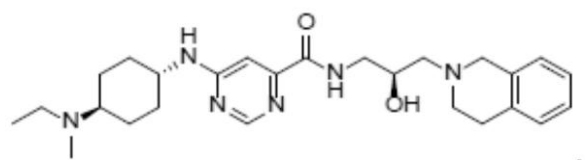
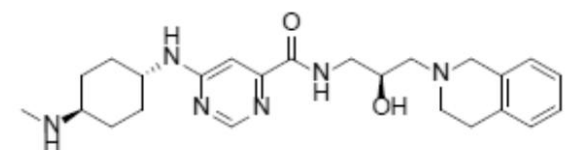
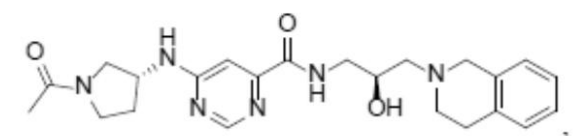
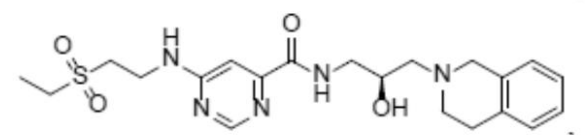
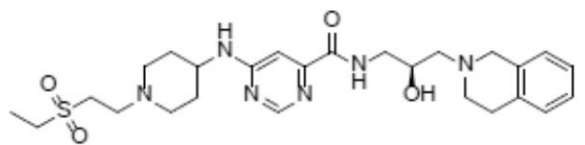
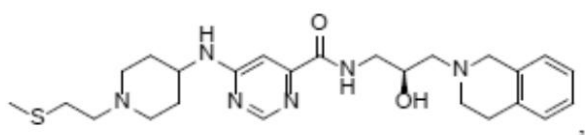
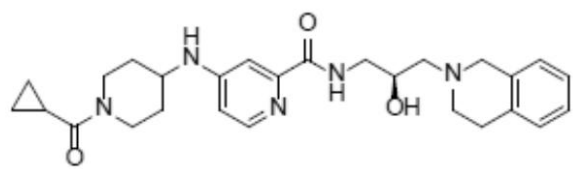
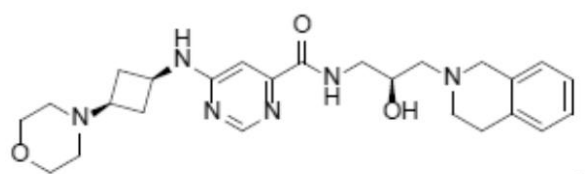
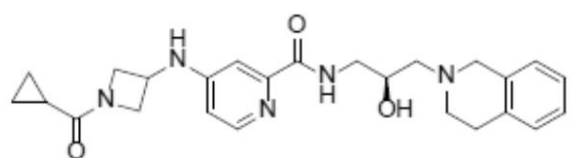




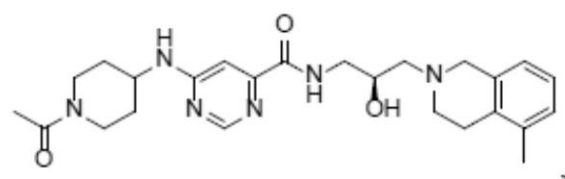
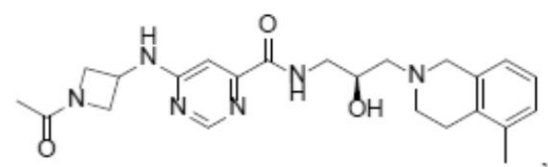
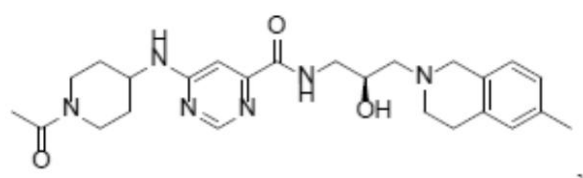
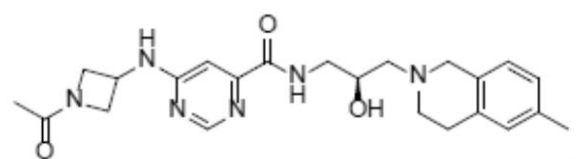
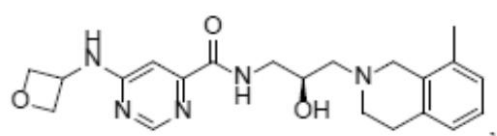
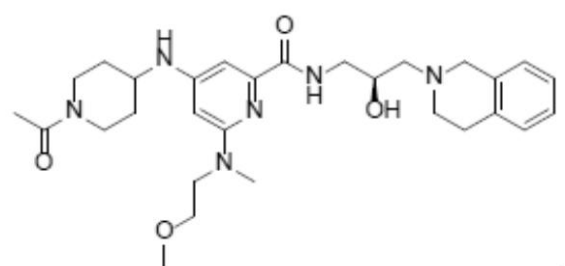
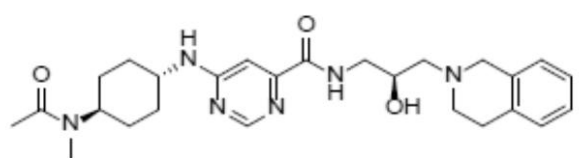




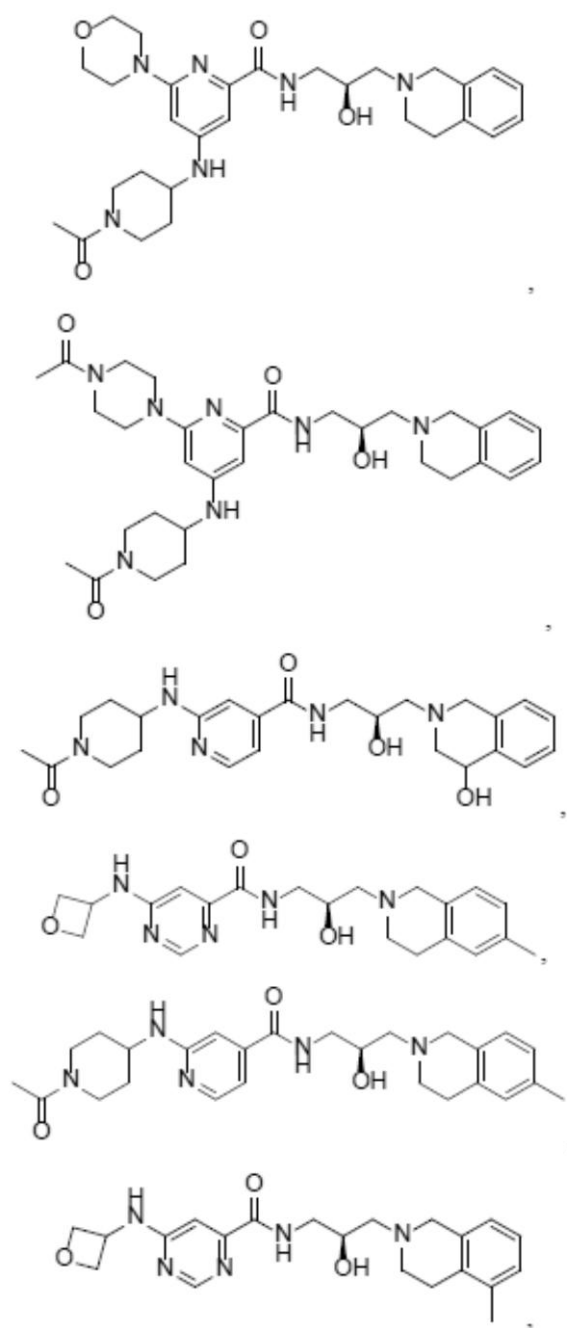


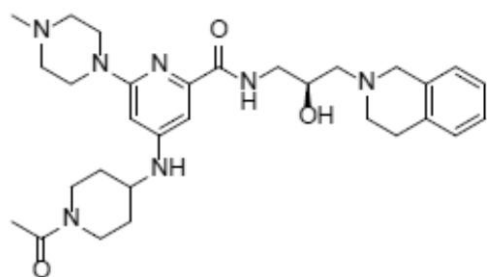




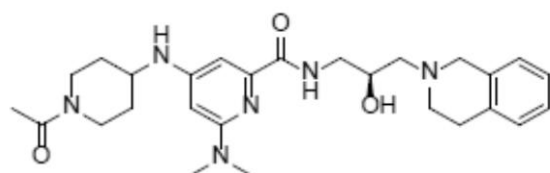




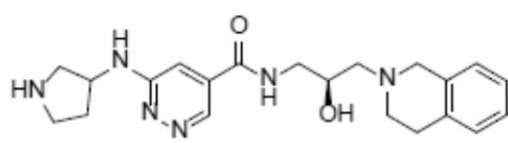




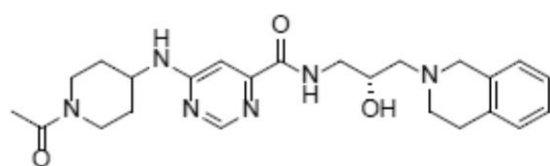
,



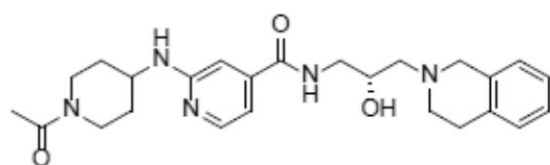
,



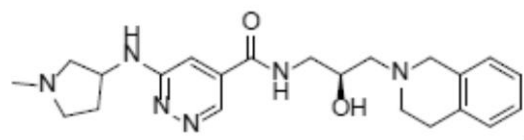
,



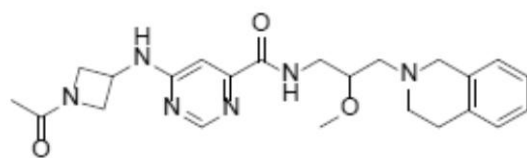
,



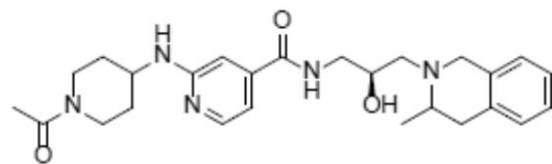
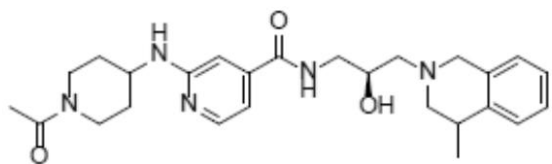
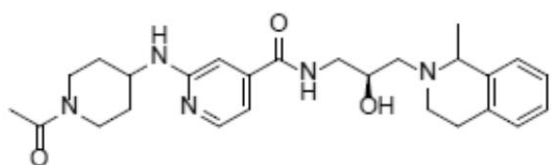
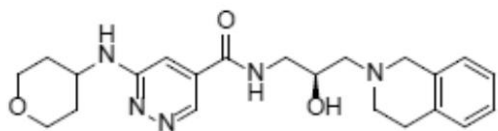
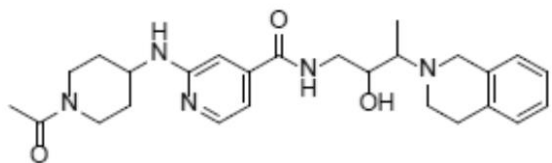
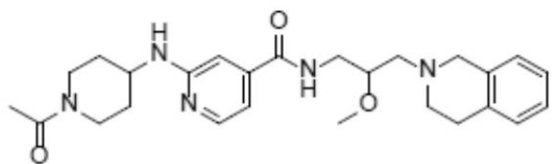
,



,

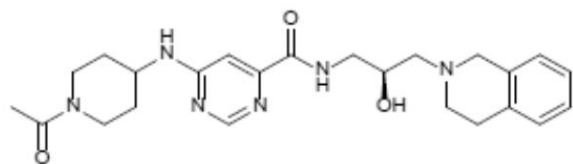


,



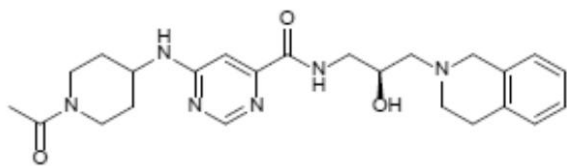
## 【請求項 1 1 2】

以下の化合物又はその薬学的に許容される塩。



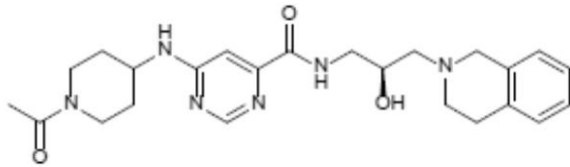
## 【請求項 1 1 3】

化合物が、以下の化合物である請求項 1 1 2 に記載の化合物。



## 【請求項 1 1 4】

薬学的に許容される塩が、以下の化合物である請求項 1 1 2 に記載の化合物。



## 【請求項 1 1 5】

請求項 1 ~ 1 1 1 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される賦形剤とを含む医薬組成物。

## 【請求項 1 1 6】

請求項 1 1 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される賦形剤とを含む医薬組成物。

## 【請求項 1 1 7】

請求項 1 1 3 に記載の化合物と、薬学的に許容される賦形剤とを含む医薬組成物。

## 【請求項 1 1 8】

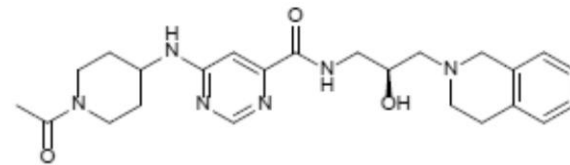
請求項 1 1 4 に記載の化合物と、薬学的に許容される賦形剤とを含む医薬組成物。

## 【請求項 1 1 9】

請求項 1 ~ 1 1 2 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩およびその使用説明書を含むキット又は包装された医薬品。

## 【請求項 1 2 0】

化合物が、以下の化合物又はその薬学的に許容される塩である請求項 1 1 9 に記載のキット又は包装された医薬品。



## 【請求項 1 2 1】

有効量の請求項 1 ~ 1 1 2 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩を含む P R M T 5 を阻害する医薬組成物。

## 【請求項 1 2 2】

有効量の請求項 1 ~ 1 1 2 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩を含む遺伝子発現を改変する医薬組成物。

## 【請求項 1 2 3】

有効量の請求項 1 ~ 1 1 2 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩を含む転写を改変する医薬組成物。

## 【請求項 1 2 4】

有効な量の請求項 1 ~ 1 1 2 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩を含む P R M T 5 媒介性疾患を治療又は予防用医薬組成物。

## 【請求項 1 2 5】

前記疾患が増殖性疾患である請求項 1 2 4 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 1 2 6】

前記疾患が癌である請求項 1 2 5 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 1 2 7】

前記癌が、頭頸部扁平上皮癌、脳腫瘍、肝細胞癌、腎細胞癌、腎細胞癌、胆道癌、膵臓癌、膵癌、卵巣嚢胞腺癌、造血癌、肺癌、前立腺癌、メラノーマ又は膵臓癌である請求項 1 2 6 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 1 2 8】

前記疾患が代謝障害である請求項 1 2 4 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 1 2 9】

前記代謝障害が糖尿病である請求項 1 2 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3 0】

前記代謝障害が肥満である請求項 1 2 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3 1】

前記疾患が血液疾患である請求項 1 2 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3 2】

前記疾患が異常血色素症である請求項 1 3 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3 3】

前記疾患が鎌状赤血球貧血である請求項 1 3 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3 4】

前記疾患が - サラセミアである請求項 1 3 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3 5】

化合物が、以下の化合物又はその薬学的に許容される線である請求項 1 2 1 ~ 1 3 4 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

