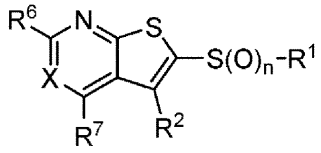
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和7年2月19日(2025.2.19)

【公開番号】特開2024-138500(P2024-138500A)
【公開日】令和6年10月8日(2024.10.8)
【年通号数】公開公報(特許)2024-188
【出願番号】特願2024-113104(P2024-113104)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ４９５/０４(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ４３/００(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ １７/００(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ １７/１４(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ １７/０２(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ０１/０２(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ０１/００(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ０９/００(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ０３/１０(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ２５/００(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ０９/１２(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ １３/１２(２００６.０１)
Ａ６１Ｋ ４５/００(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ３７/０６(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ １９/１０(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ １５/１０(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ３５/００(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ３５/０４(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ３５/０２(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ０９/１０(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ０１/０４(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ３７/０２(２００６.０１)
Ａ６１Ｋ ３８/１９(２００６.０１)
Ａ６１Ｋ ３１/３９５(２００６.０１)
Ａ６１Ｋ ３５/２８(２０１５.０１)
Ａ６１Ｐ １１/００(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ０１/１６(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ３１/１４(２００６.０１)
Ａ６１Ｐ ３１/２０(２００６.０１)
Ａ６１Ｋ ３１/５７３(２００６.０１)
Ａ６１Ｋ ３１/４３６５(２００６.０１)
Ｃ０７Ｄ５１９/００(２００６.０１)
Ａ６１Ｋ ３１/５０６(２００６.０１)
Ａ６１Ｋ ３１/４４４(２００６.０１)
Ａ６１Ｋ ８/４９(２００６.０１)
Ａ６１Ｑ １９/０２(２００６.０１)
Ａ６１Ｑ ７/００(２００６.０１)
Ａ６１Ｋ ３１/１６７(２００６.０１)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ４９５/０４ ＣＳＰ
Ａ６１Ｐ ４３/００ １１１

Ａ６１Ｐ １７/００
Ａ６１Ｐ １７/１４
Ａ６１Ｐ １７/０２
Ａ６１Ｐ　１/０２
Ａ６１Ｐ　１/００
Ａ６１Ｐ　９/００
Ａ６１Ｐ　３/１０
Ａ６１Ｐ ２５/００
Ａ６１Ｐ　９/１２
Ａ６１Ｐ １３/１２
Ａ６１Ｐ ４３/００ １２１
Ａ６１Ｋ ４５/００
Ａ６１Ｐ ４３/００ １０５
Ａ６１Ｐ ３７/０６
Ａ６１Ｐ １９/１０
Ａ６１Ｐ １５/１０
Ａ６１Ｐ ３５/００
Ａ６１Ｐ ３５/０４
Ａ６１Ｐ ３５/０２
Ａ６１Ｐ　９/１０
Ａ６１Ｐ　１/０４
Ａ６１Ｐ ３７/０２
Ａ６１Ｋ ３８/１９
Ａ６１Ｋ ３１/３９５
Ａ６１Ｋ ３５/２８
Ａ６１Ｐ １１/００
Ａ６１Ｐ　１/１６
Ａ６１Ｐ ３１/１４
Ａ６１Ｐ ３１/２０
Ａ６１Ｋ ３１/５７３
Ａ６１Ｋ ３１/４３６５
Ｃ０７Ｄ５１９/００ ３０１
Ａ６１Ｋ ３１/５０６
Ａ６１Ｋ ３１/４４４
Ａ６１Ｋ　８/４９
Ａ６１Ｑ １９/０２
Ａ６１Ｑ　７/００
Ａ６１Ｋ ３１/１６７

【手続補正書】
【提出日】令和７年２月１０日(２０２５.２.１０)
【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（ＩＡ）：

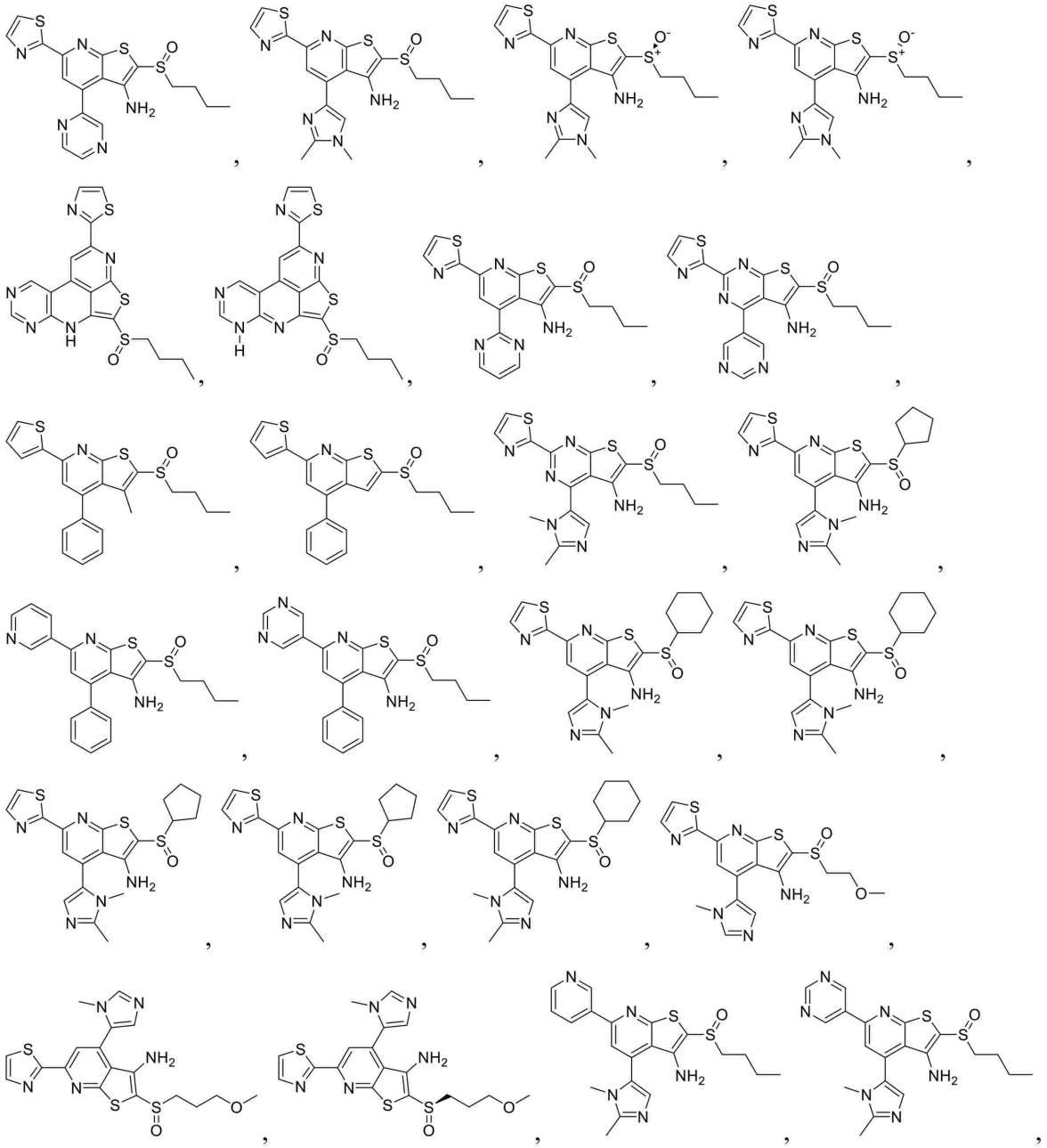
【化１】

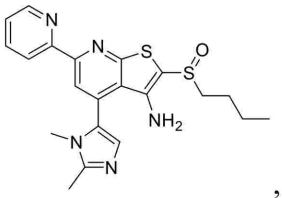
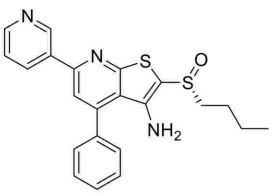
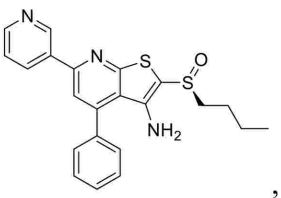
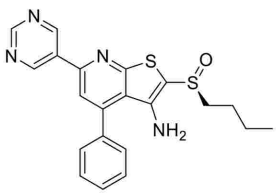
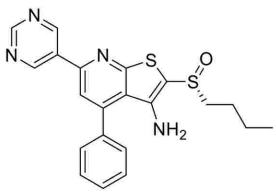
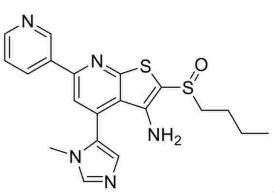
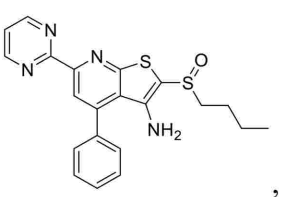
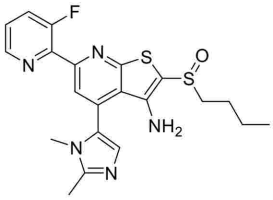
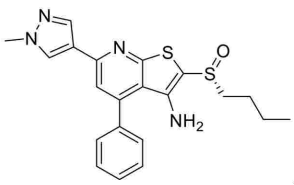
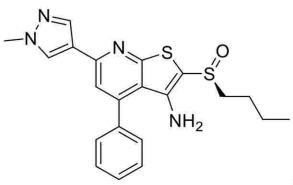
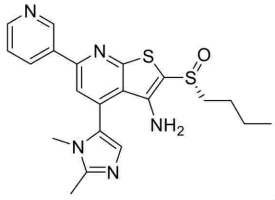
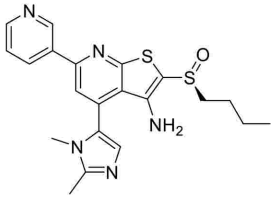
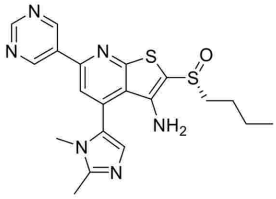
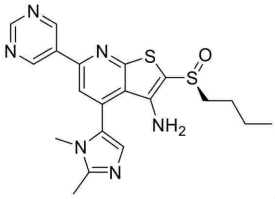
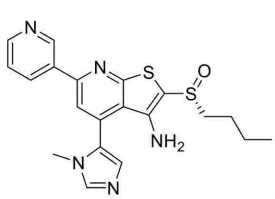
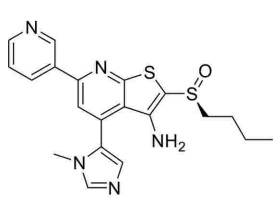
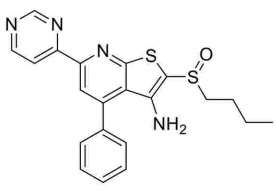
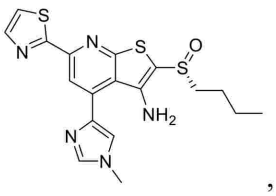
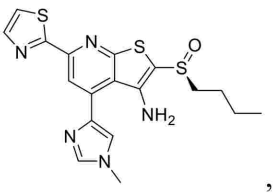
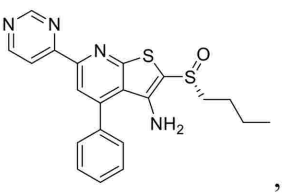
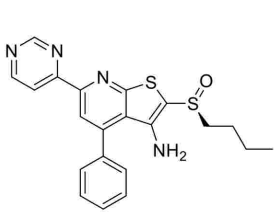
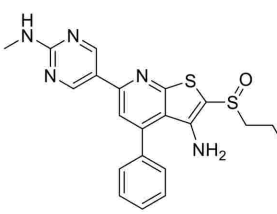
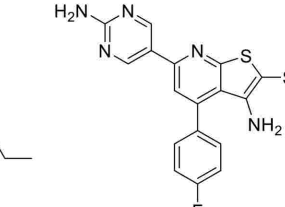
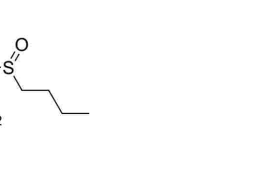


(IA)

（式中、
Ｒ１は、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルキレン－シクロアルキル、アルキレン－アルコキシ、ヘテロシクリル又はアルキレン－ヘテロシクリルであり；
Ｒ２は、－ＮＨ２、ＣＮ又は－ＮＨＣ（Ｏ）アルキルであり；
Ｒ６は、それぞれ１つ以上のＲ３で任意選択的に置換される５～６員ヘテロアリールであり；
Ｒ７は、それぞれ１つ以上のＲ４で任意選択的に置換されるアルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、－Ｃ（Ｏ）－アルキル、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－アルキル又は－Ｃ（Ｏ）ＮＲ５－アルキルであり；
Ｒ３は、オキソ、－ＯＨ、－Ｏ－アルキレン－ＯＨ、－Ｏ－アルキレン－Ｎ（Ｒ５）２、－Ｎ（Ｒ５）２、－Ｎ（Ｒ５）（アルキレン－ＯＨ）、－Ｎ（Ｒ５）（アルキレン－Ｏ－アルキル）、アルキル、－アルキレン－ＯＨ、ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ５）２、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ５）（アルキレン－ＯＨ）、－Ｃ（Ｏ）－アルキル、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－アルキル又は－Ｓ（Ｏ）ｍ－アルキルであり、ここで、前記シクロアルキル及び前記ヘテロシクリルは、それぞれＲ１０で任意選択的に置換され；
Ｒ４は、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－Ｎ（Ｒ５）２、－ＯＨ、－Ｏ－アルキレン－ＯＨ、－Ｓ（Ｏ）ｍ－アルキル、－Ｃ（Ｏ）－アルキル、－Ｃ（Ｏ）－シクロアルキル、アルキル、－アルキレン－Ｏ－アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル又はＲ８で任意選択的に置換される－アルキレン－アリールであり；
各Ｒ５は、独立して、Ｈ、アルキル、－ＯＨで任意選択的に置換される－アルキレン－ＯＨ、－アルキレン－ＮＨ２、－アルキレン－Ｎ（Ｒ９）２、－アルキレン－Ｏ－アルキレン－ＯＨ、－アルキレン－Ｏ－アルキレン－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－アルキル、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－アルキル、－アルキレン－ＣＯＯＨ又は－Ｓ（Ｏ）ｍ－アルキルであるか；又は
代わりに、２つのＲ５は、それらが結合されているＮ原子と共に、Ｏ、Ｓ又はＮから選択される追加のヘテロ原子を任意選択的に含有する４～７員ヘテロ環を形成することができ、ここで、前記ヘテロ環は、Ｒ８で任意選択的に置換され；
Ｒ８は、ハロゲン、アルキル又はアルコキシであり；
Ｒ９は、Ｈ若しくはアルキルであるか、又は２つのＲ９は、それらが結合されているＮ原子と共に、Ｏ、Ｓ（Ｏ）ｔ若しくはＮから選択される追加のヘテロ原子を任意選択的に含有する４～７員ヘテロ環を形成することができ；
Ｒ１０は、－ＯＨ、ハロゲン、アルキル又はアルコキシであり；
Ｘは、Ｎ又はＣＨであり；
ｍは、０、１又は２であり；
ｎは、０、１又は２であり；及び
ｔは、０、１又は２である）
の化合物又はその薬学的に許容される塩、互変異性体若しくは溶媒和物
（ただし、前記化合物は、以下の式：

【化２】

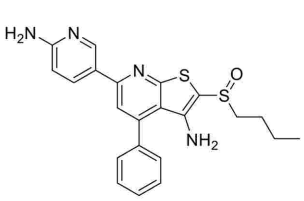
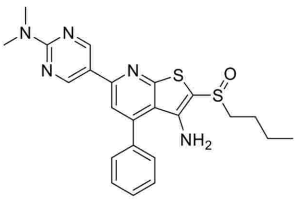
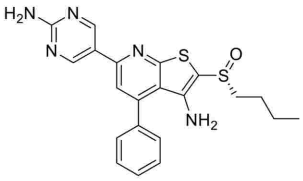
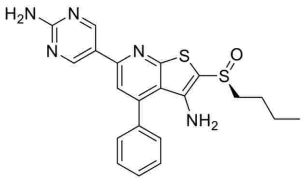
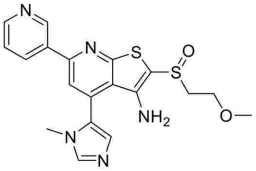
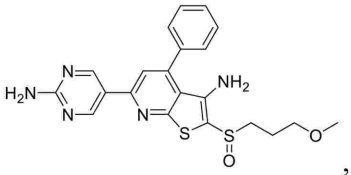
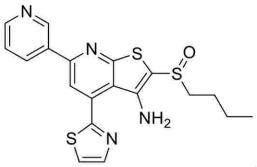
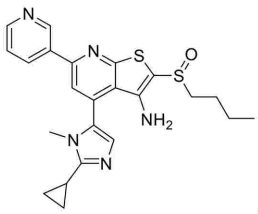
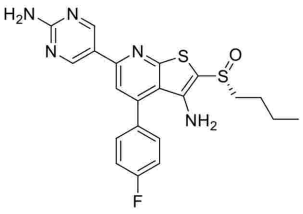
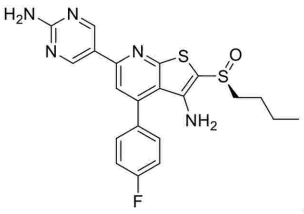
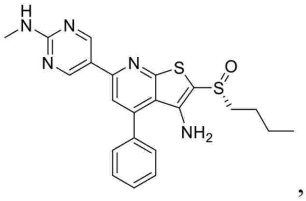
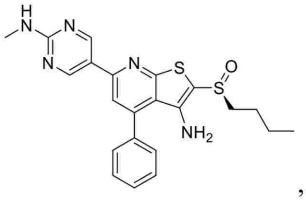
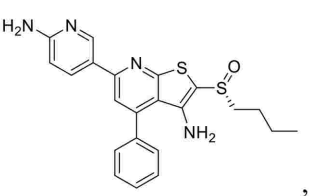
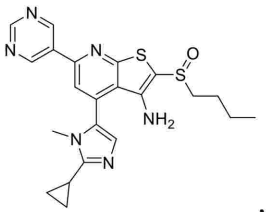
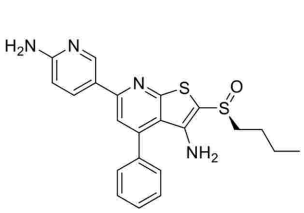
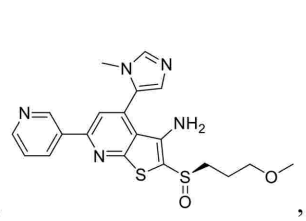
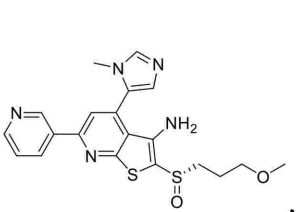
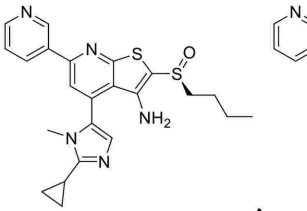
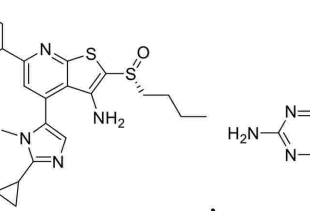
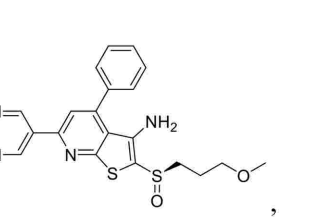



,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

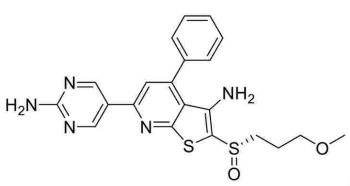
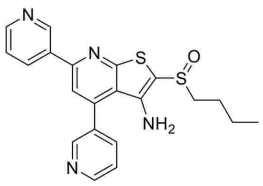
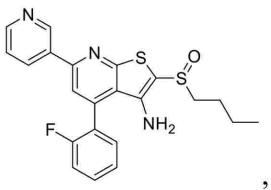
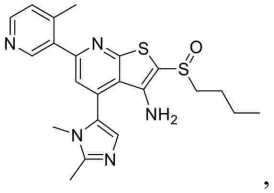
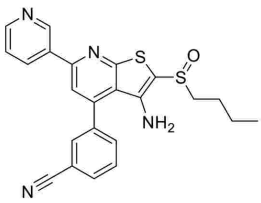
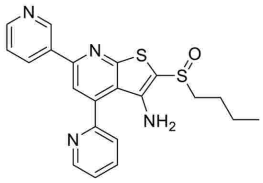
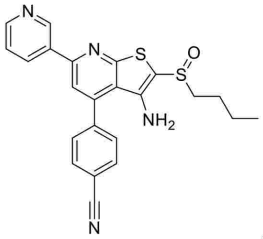
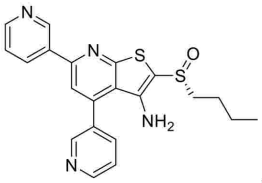
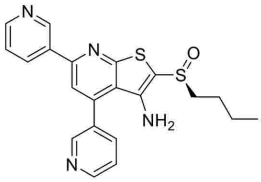
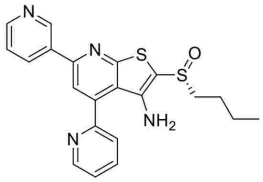
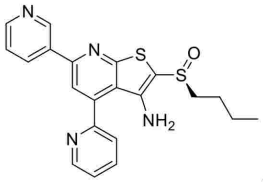
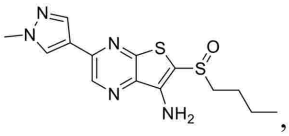
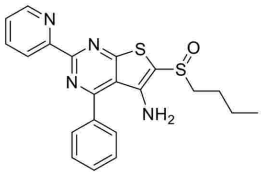
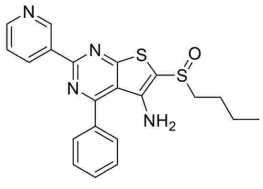
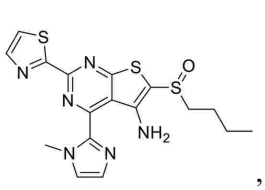
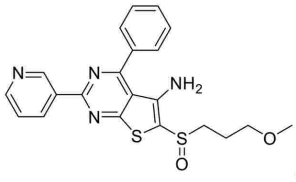
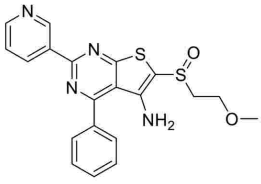
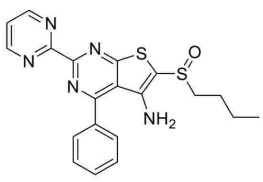
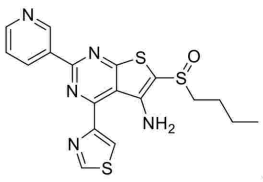
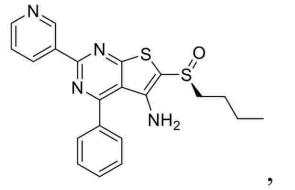
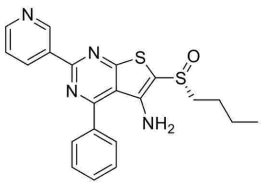
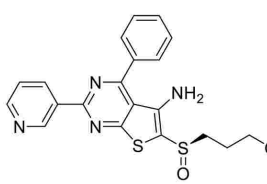
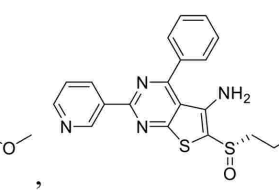
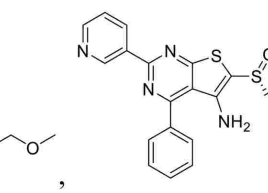
,

,

,

,

,

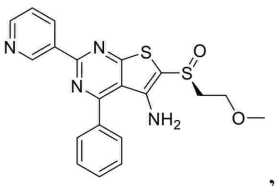
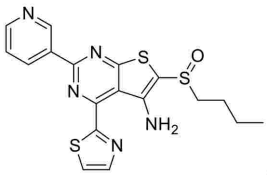
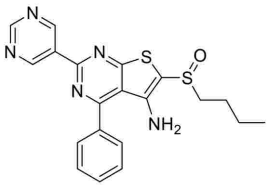
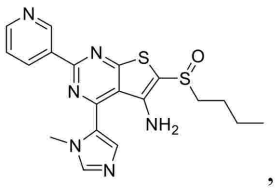
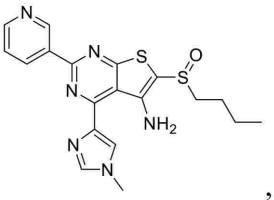
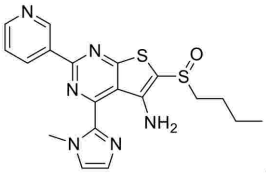
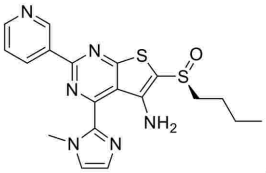
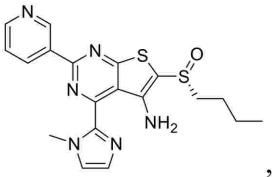
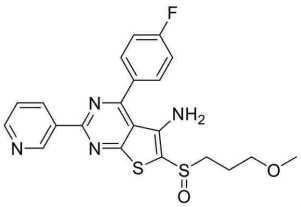
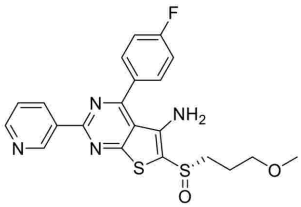
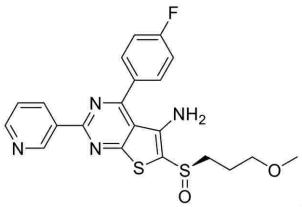
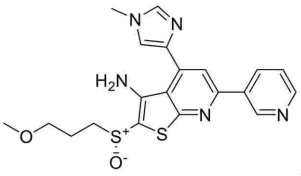

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

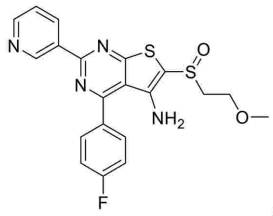
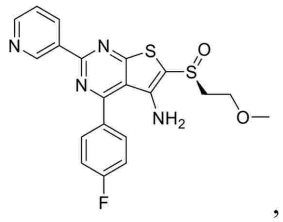
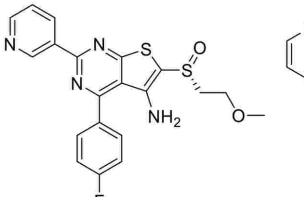
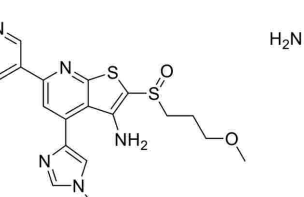
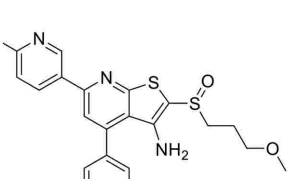
,

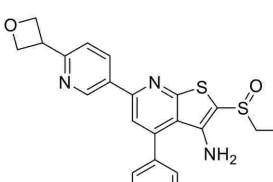
,

,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

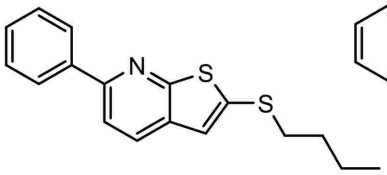
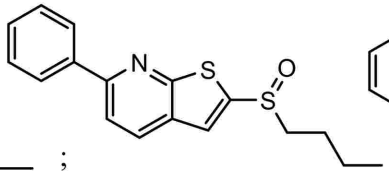
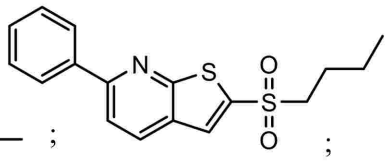
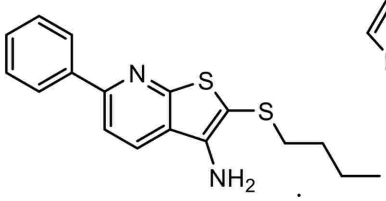
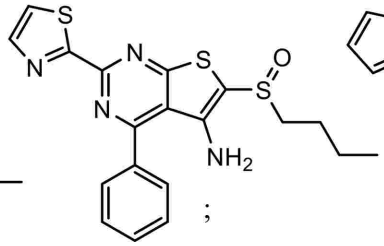
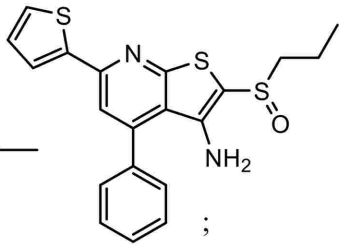
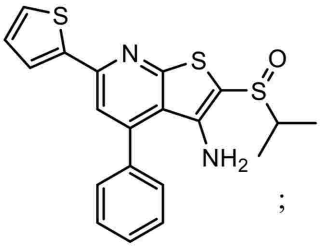
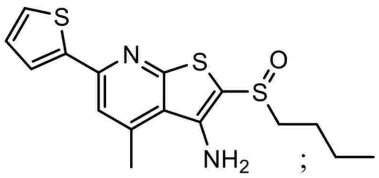
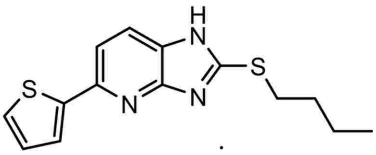
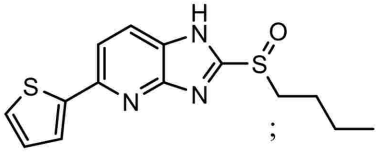
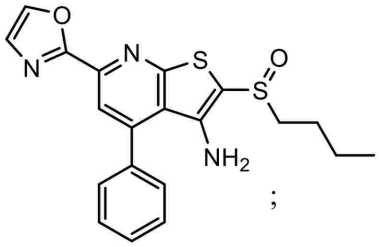
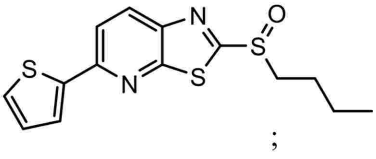
,

,

,

40

50


;

;

;

;

;

;

;

;

;

;

;

;

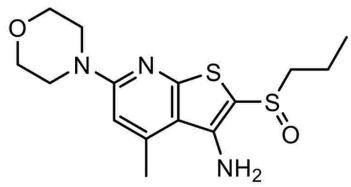
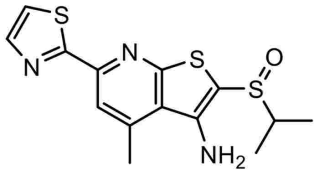
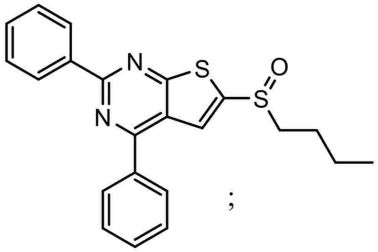
10

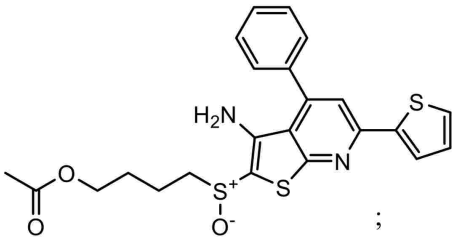
20

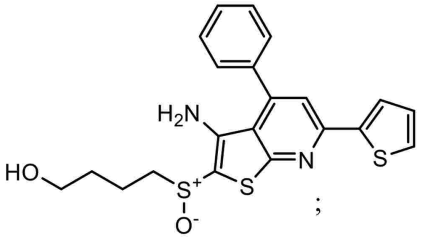
30

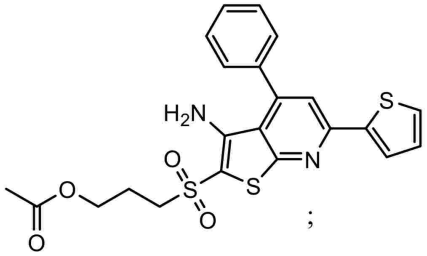
40

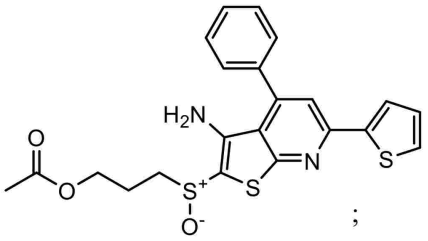
50

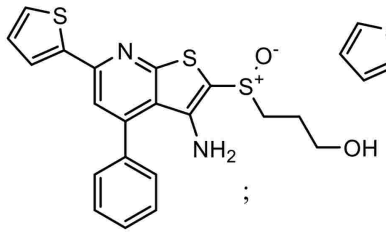

;

;

;

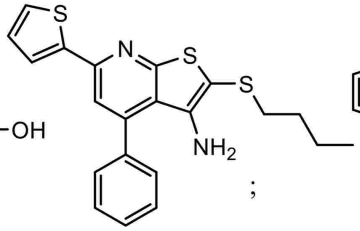

;

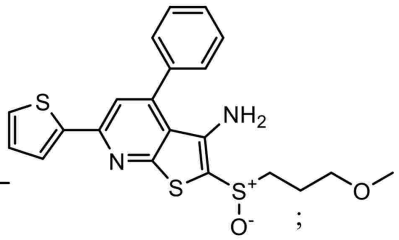

;

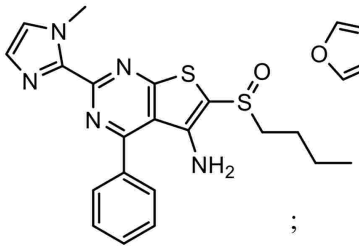

;

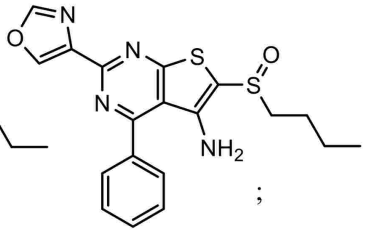

;

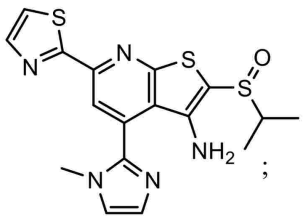

;

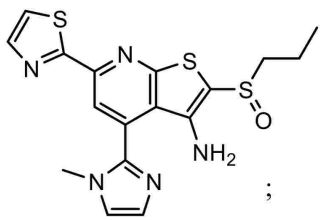

;

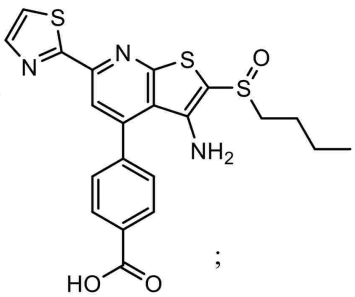

;

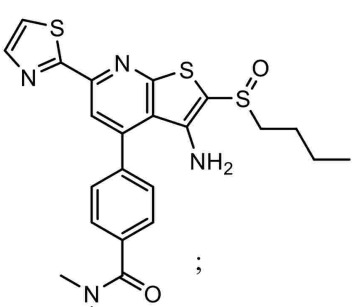

;


;


;


;

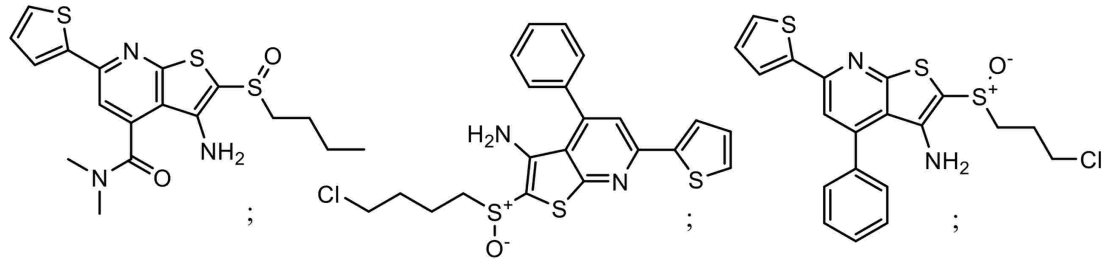

;


;

;

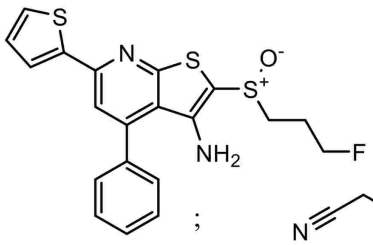
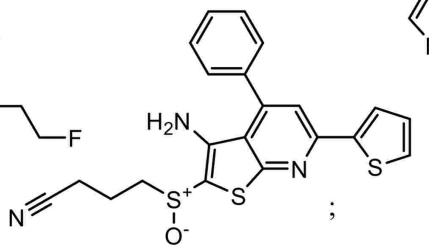
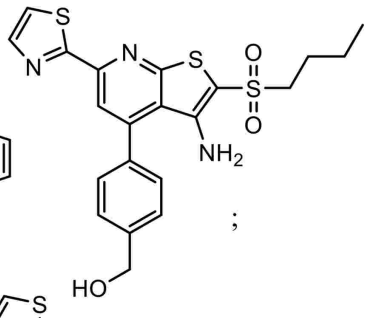
;

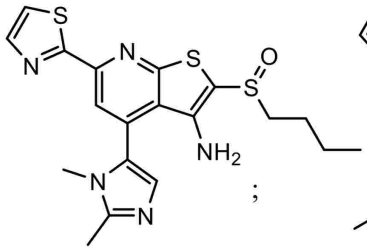
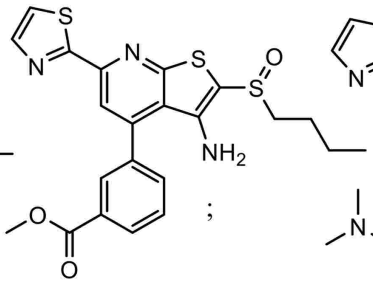
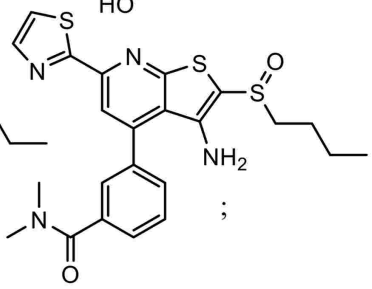
;

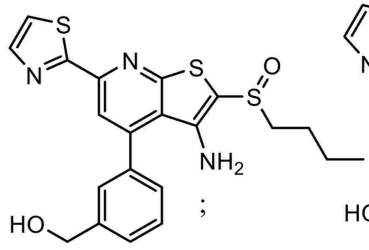
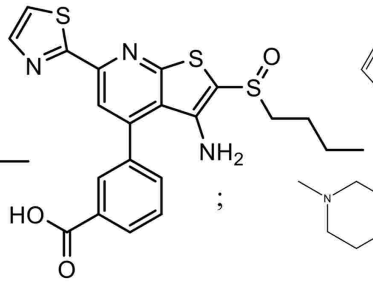
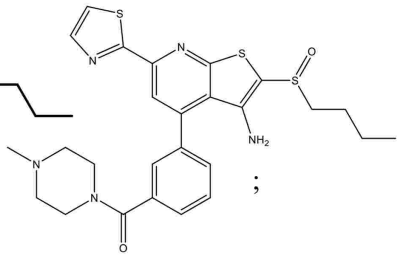

;

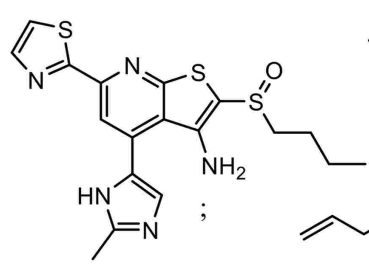
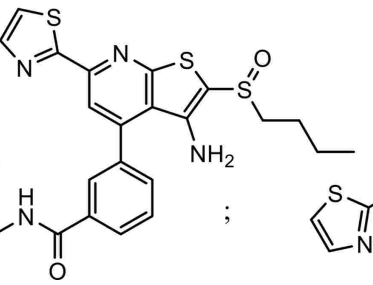
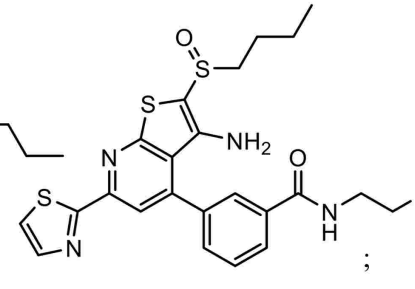
;

;


;

;

;


;

;

;

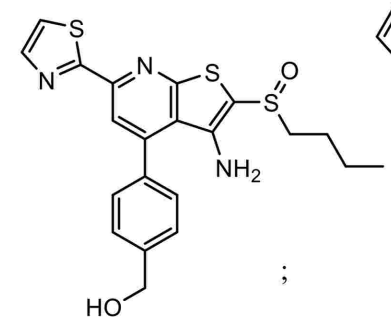
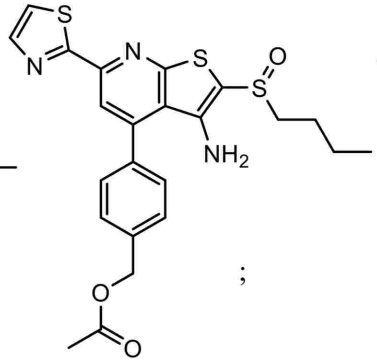
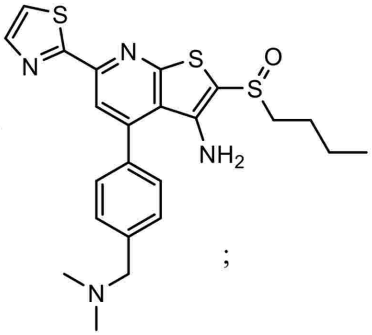
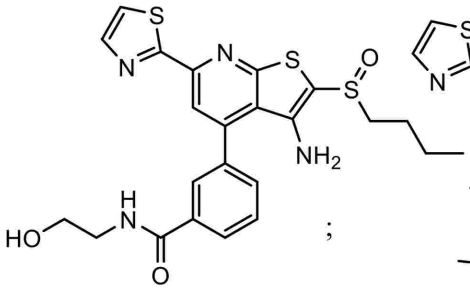
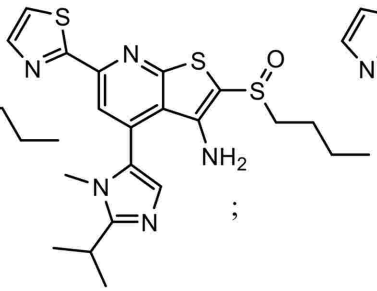
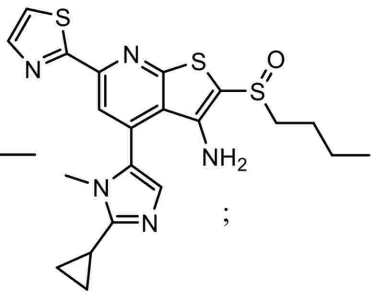
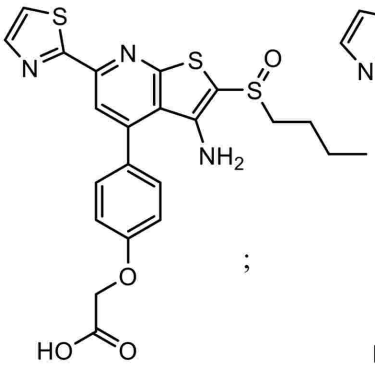
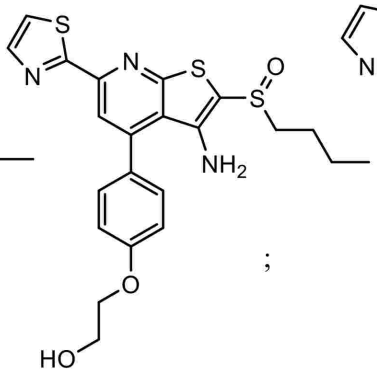
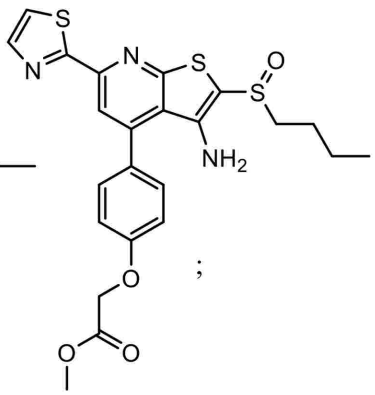
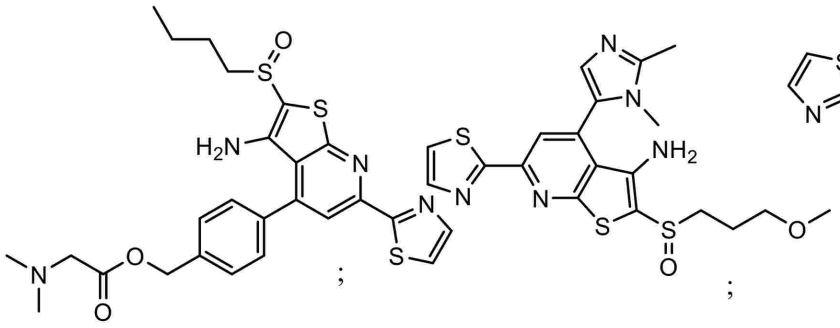
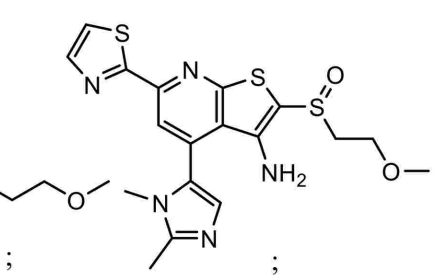

;

;

;


;

;

;

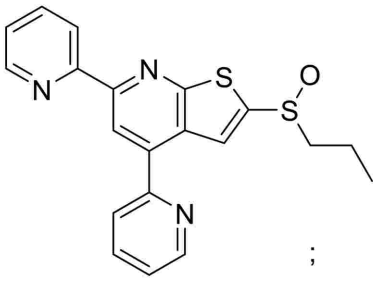
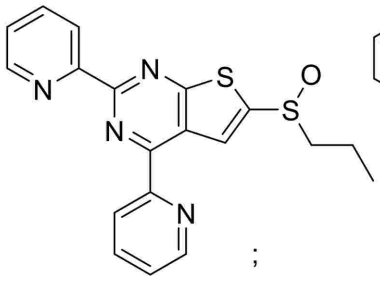
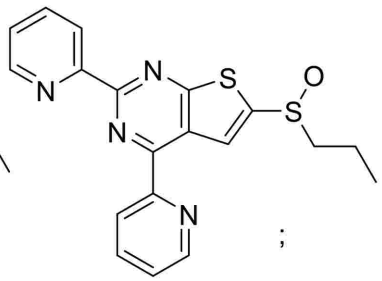
;

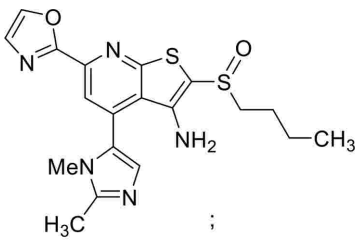
;

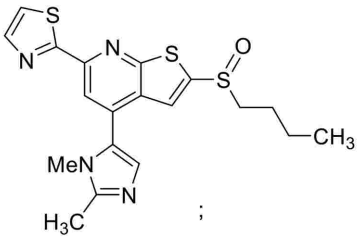
;

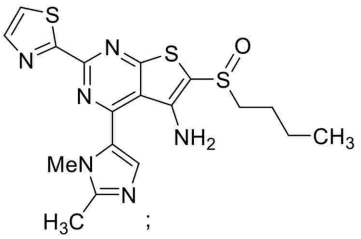

;

;

;

;

;

;

;

;

;

;

;

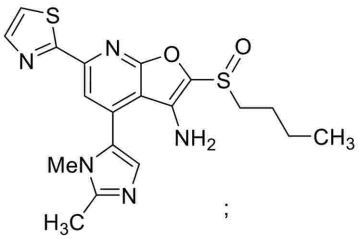
;

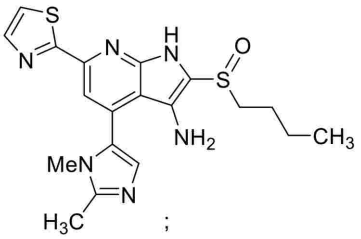

;

;

;

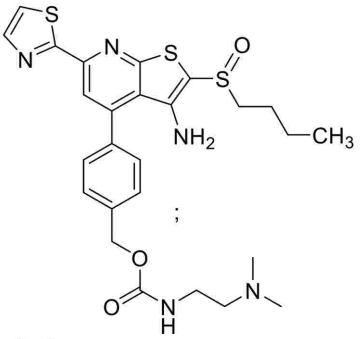

;

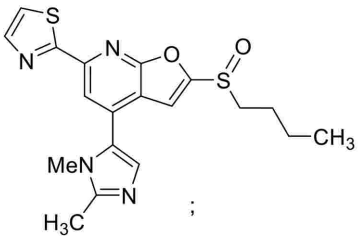

;

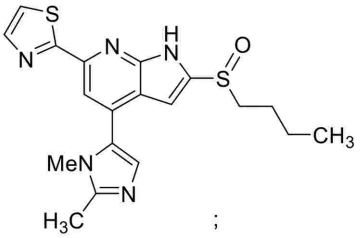

;

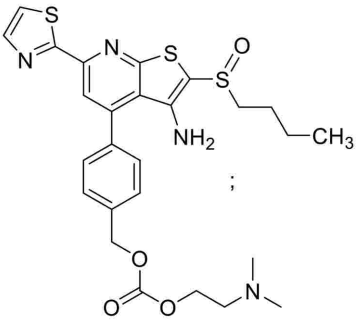

;

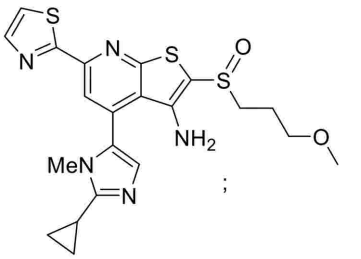

;

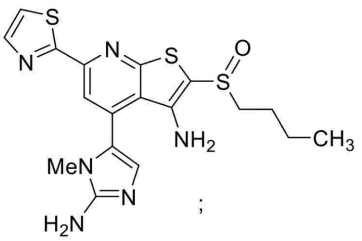

;

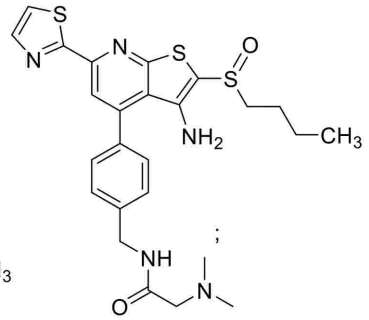

;

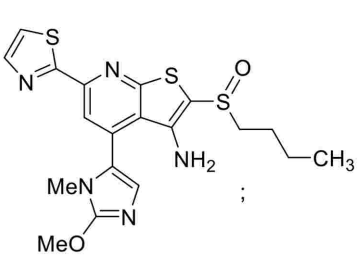

;

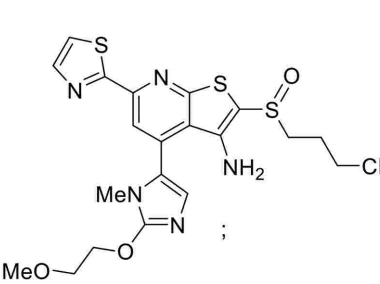

;

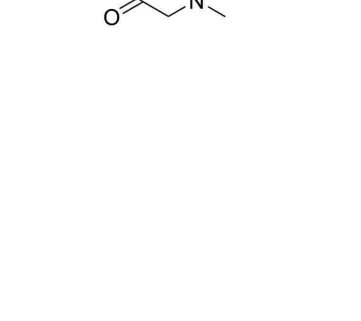

;


;


;

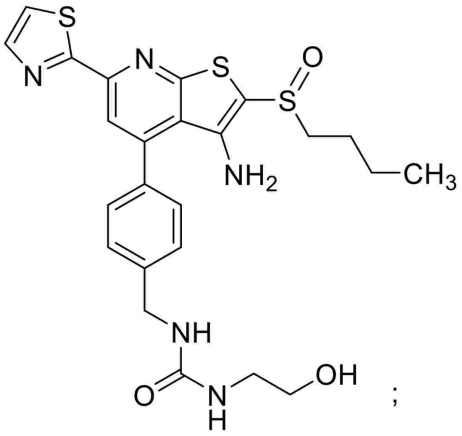

;

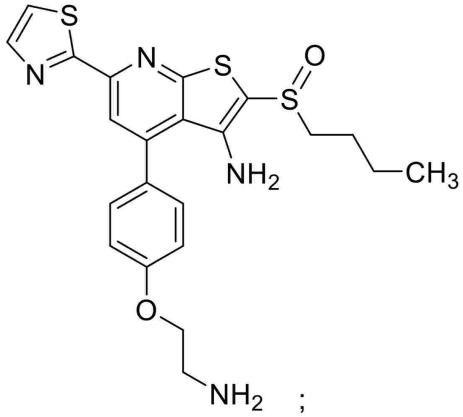

;

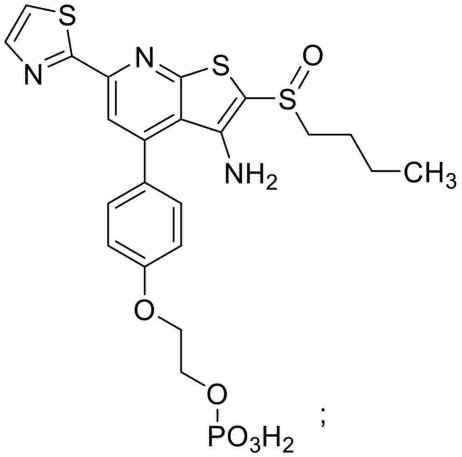

;

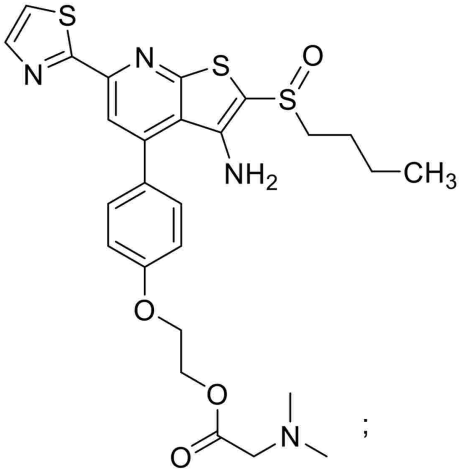
;

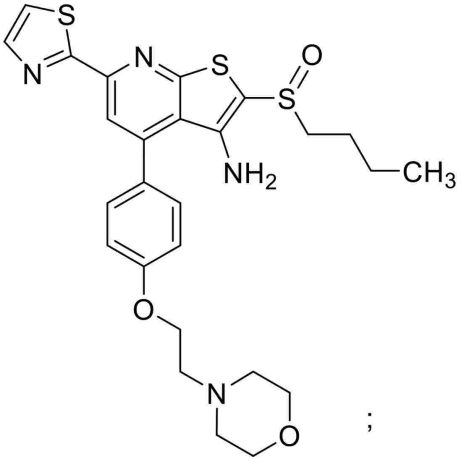
;

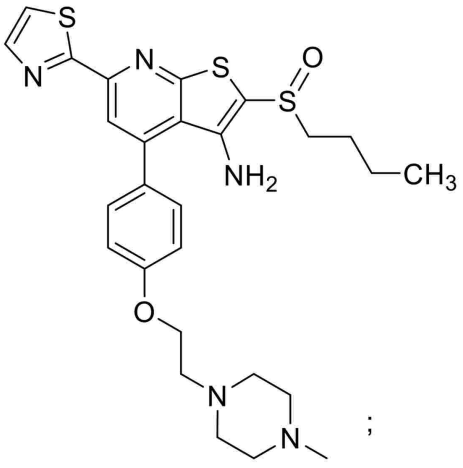

;

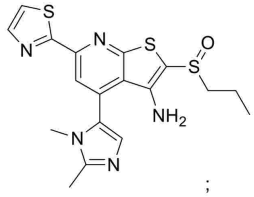
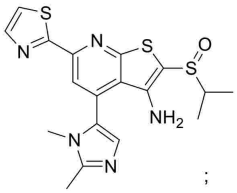
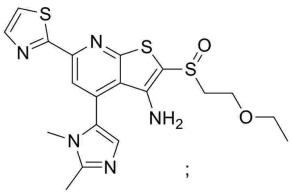
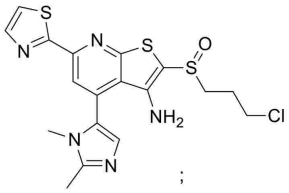
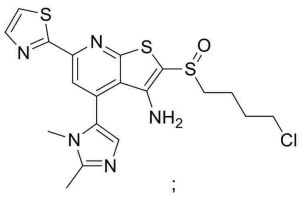
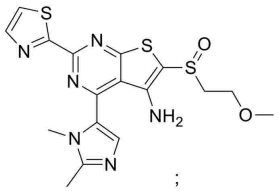
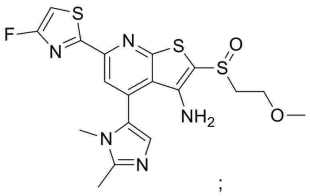
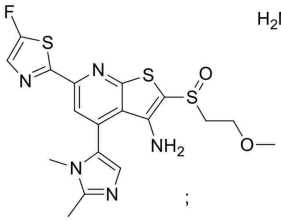
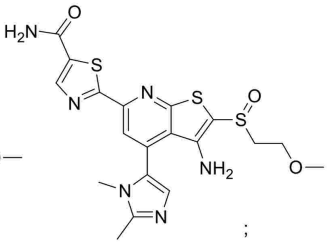
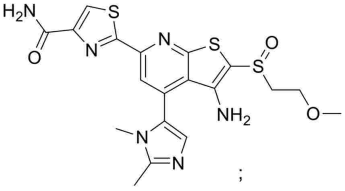
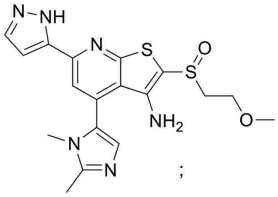
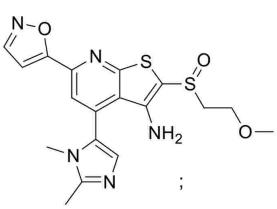
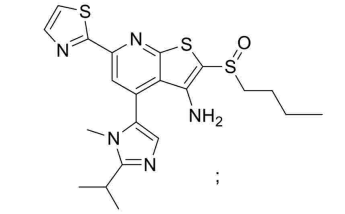
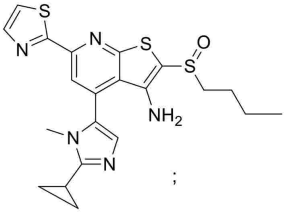
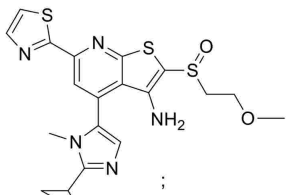
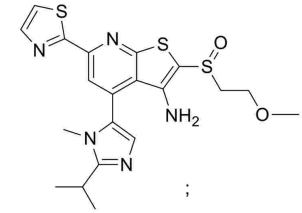

;


;


;


;


;

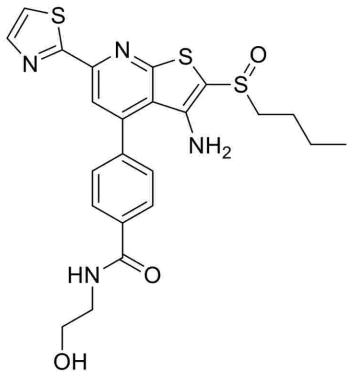
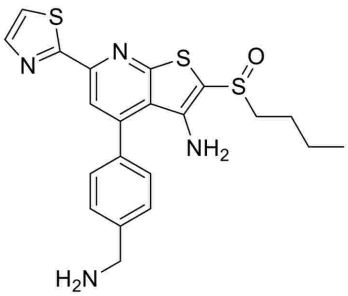
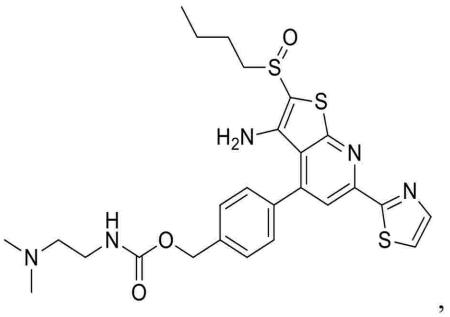
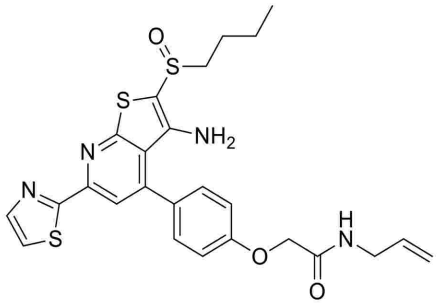
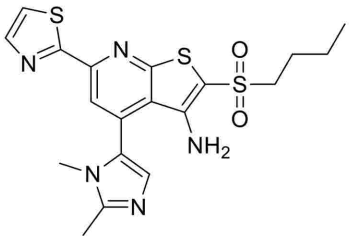
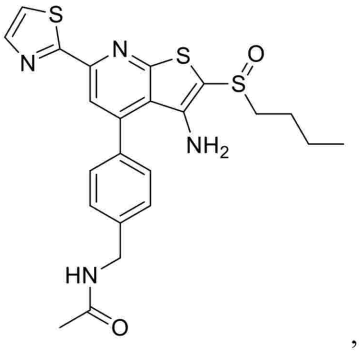
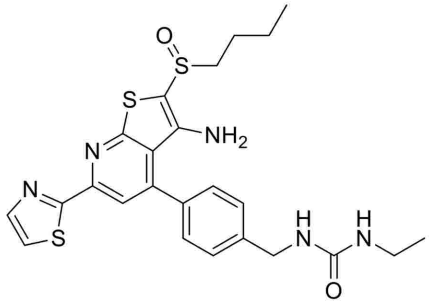
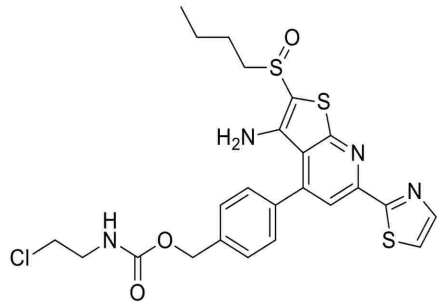
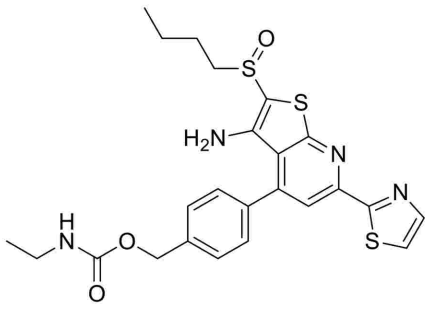
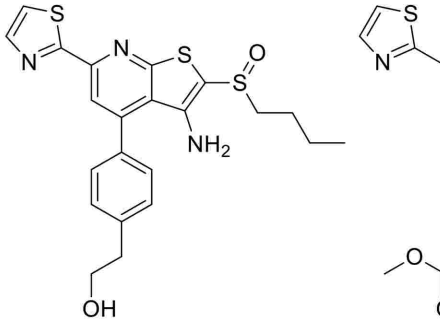

;

;

;

;

;

;

;

;

;

;

;

;

;

;

;

;

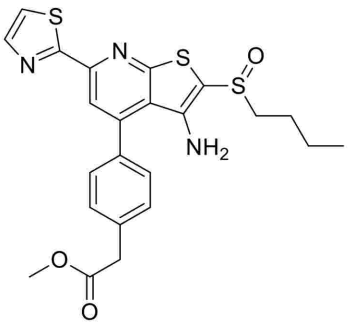
;

;

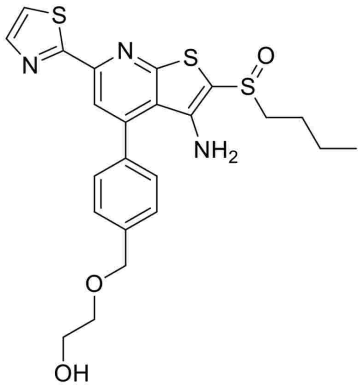
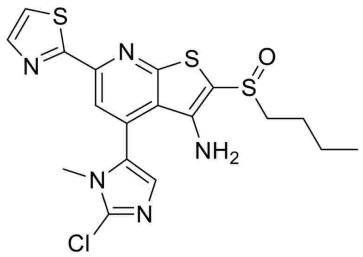
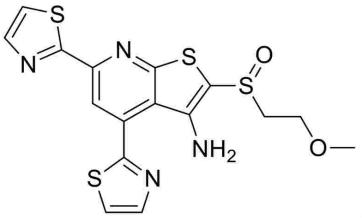
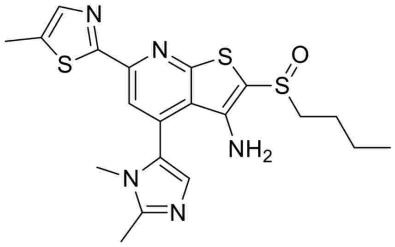
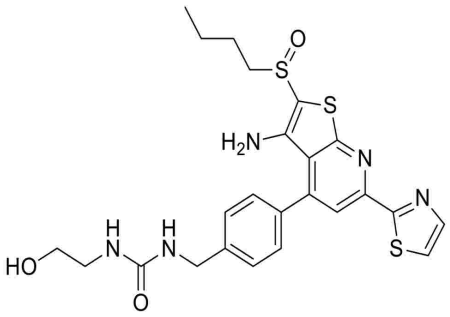
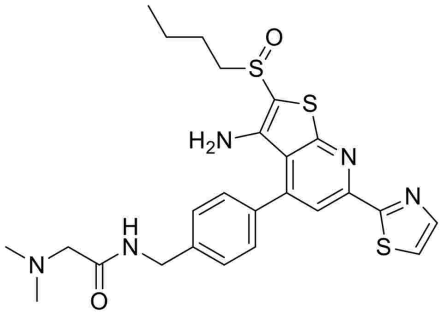
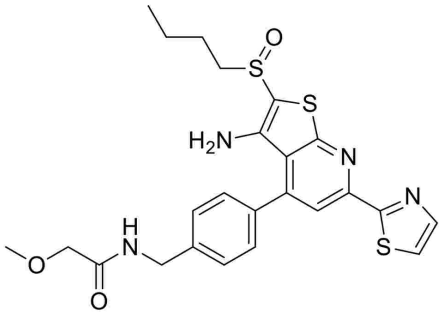
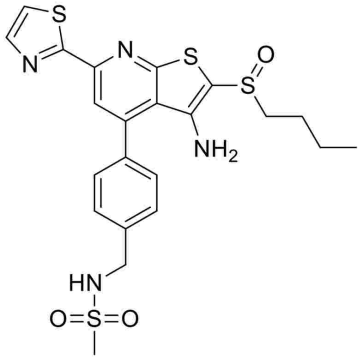
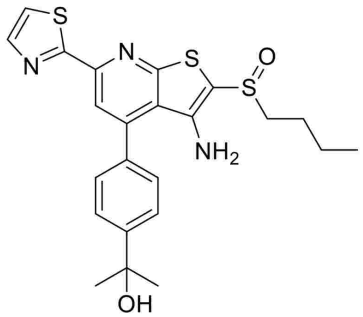
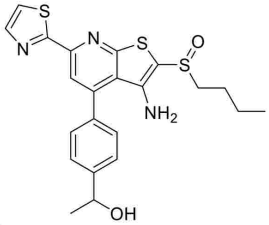
;

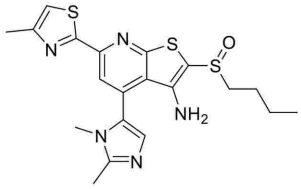
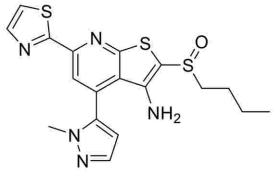
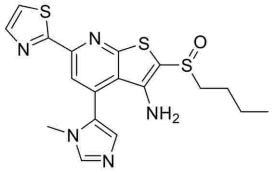
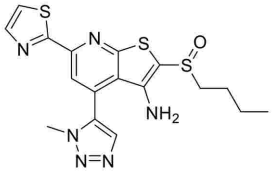
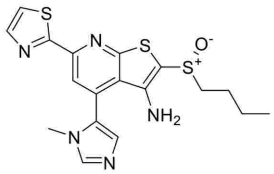
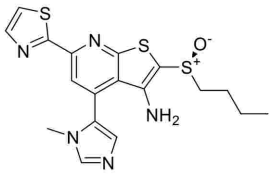
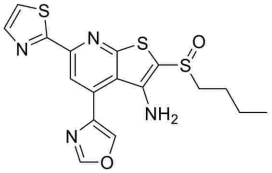
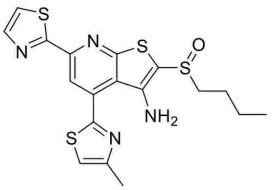
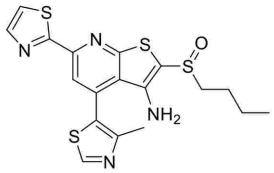
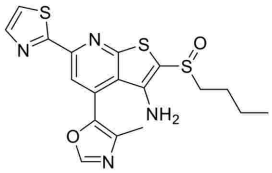
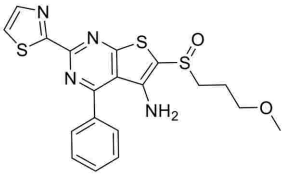
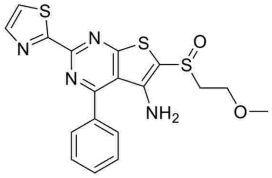
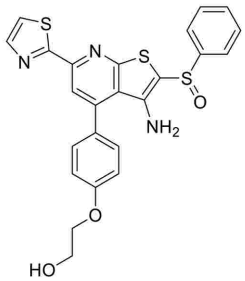
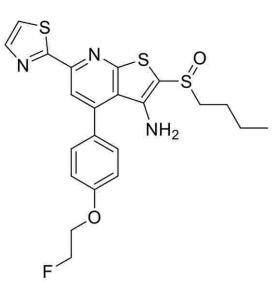
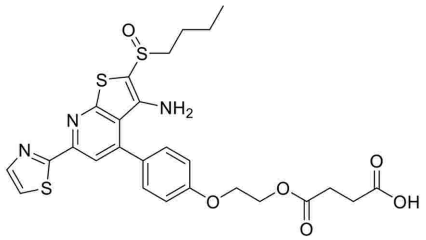
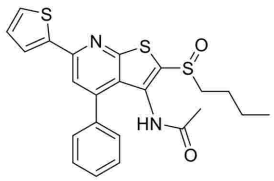
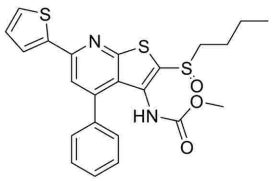
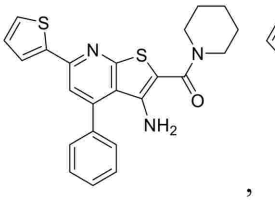
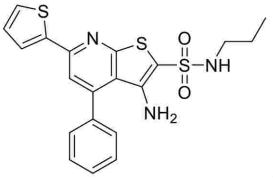
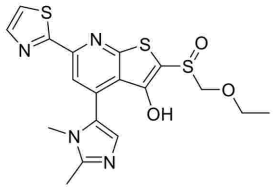
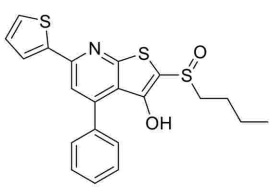
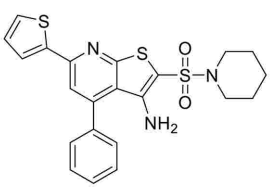
50


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

50


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

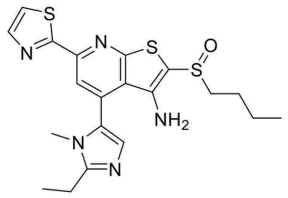
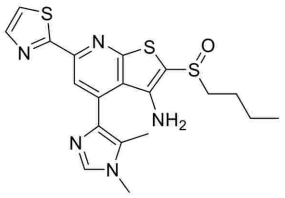
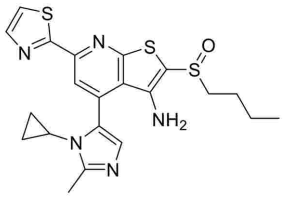
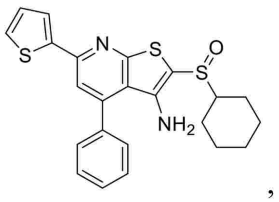
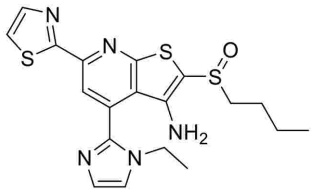
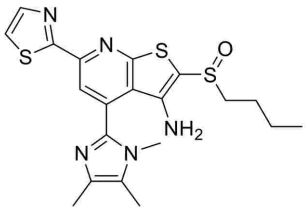

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,


,

,

,

,


, 及び

からなる群から選択される式を有しない化合物である。）。

【請求項２】

R^1は、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、３～６員シクロアルキル、－（C_1～C_6アルキレン）－（３～６員シクロアルキル）、－（C_1～C_6アルキレン）－（C_1～C_6アルコキシ）、３～６員ヘテロシクリル、又は－（C_1～C_6アルキレン）－（３～６員ヘテロシクリル）である、請求項１に記載の化合物、又はその塩若しくは溶媒和物。

【請求項３】

R^2は、－NH_2である、請求項１に記載の化合物、又はその塩若しくは溶媒和物。

【請求項４】

R^7は、それぞれ１つ以上のR^4で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、３～６員シクロアルキル、６～１０員アリール、３～６員ヘテロシクリル、５～１０員ヘテロアリール、－Ｃ（Ｏ）（C_1～C_6アルキル）、－Ｃ（Ｏ）Ｏ（C_1～C_6アルキル）又は－Ｃ（Ｏ）NR^5（C_1～C_6アルキル）である、請求項１に記載の化合物、又はその塩若しくは溶媒和物。

【請求項５】

R^3は、－Ｏ－（C_1～C_6アルキレン）－Ｎ（R^5）$_2$、－Ｎ（R^5）$_2$、－Ｎ（R^5）（C_1～C_6アルキレン－ＯＨ）、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^5）$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^5）（C_1～C_6アルキレン－ＯＨ）、－Ｃ（Ｏ）（C_1～C_6アルキル）、－Ｃ（Ｏ）Ｏ（C_1～C_6アルキル）又は－Ｓ（Ｏ）$_m$（C_1～C_6アルキル）である、請求項１に記載の化合物、又はその塩若しくは溶媒和物。

【請求項６】

R^4は、ハロゲン、－ＣＮ、－Ｎ（R^5）$_2$、－ＯＨ、－Ｏ－（C_1～C_6アルキレン）－ＯＨ、－Ｓ（Ｏ）$_m$（C_1～C_6アルキル）、－Ｃ（Ｏ）（C_1～C_6アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－（３～６員シクロアルキル）、C_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、３～６員シクロアルキル又は３～６員ヘテロシクリルである、請求項１に記載の化合物、又はその塩若しくは溶媒和物。

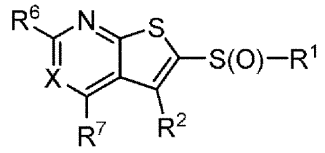
【請求項７】

ｎが１である、請求項１に記載の化合物、又はその塩若しくは溶媒和物。

【請求項８】

式（ＩＩ）：

【化３】

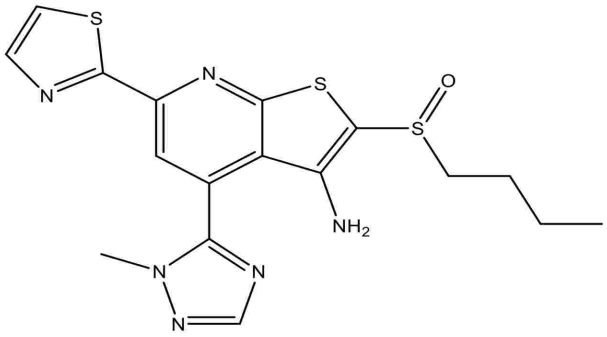
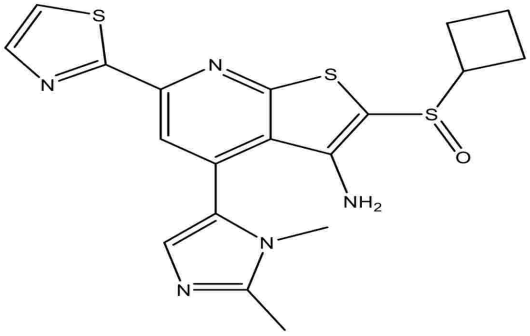
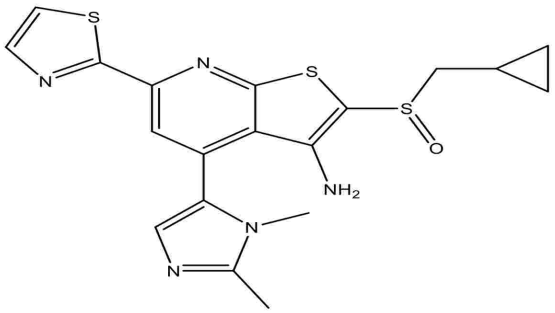
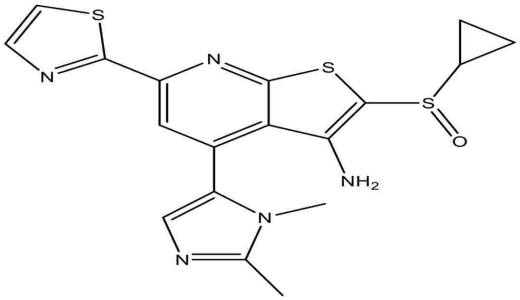
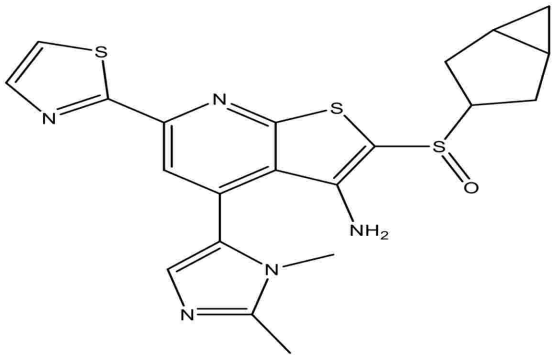
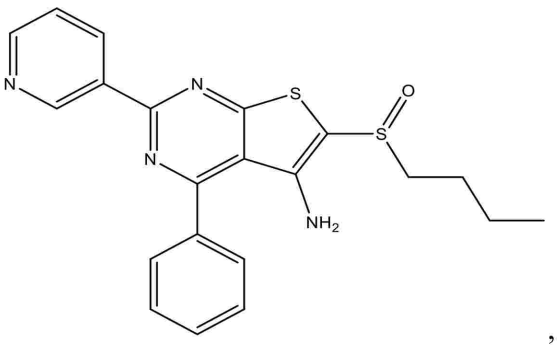
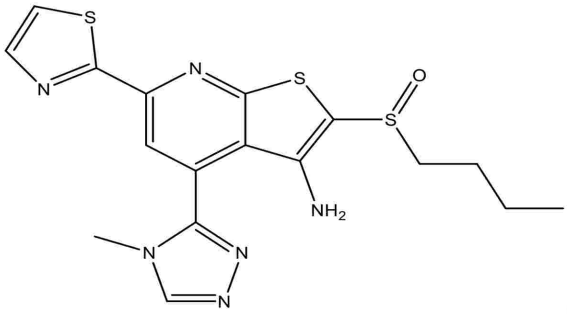
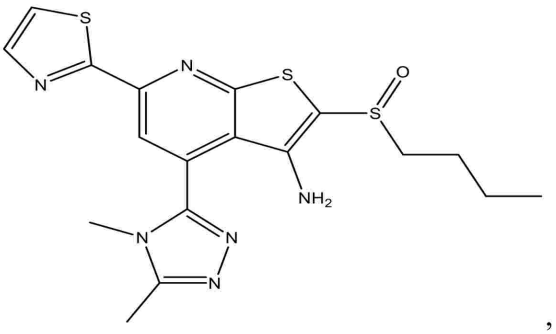


(II)

（式中、
R^1は、３～６員シクロアルキル、－（C_1～C_6アルキレン）－（３～６員シクロアルキル）、３～６員ヘテロシクリル又は－（C_1～C_6アルキレン）－（３～６員ヘテロシクリル）であり；
R^2は、－NH_2、ＣＮ又は－ＮＨＣ（Ｏ）アルキルであり；
R^6は、それぞれ１つ以上のR^3で任意選択的に置換される５～６員ヘテロアリールであり；
R^7は、それぞれ１つ以上のR^4で任意選択的に置換されるアルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、－Ｃ（Ｏ）－アルキル、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－アルキル又は－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^5－アルキルであり；
R^3は、オキソ、－ＯＨ、－Ｏ－アルキレン－Ｎ（R^5）$_2$、－Ｎ（R^5）$_2$、－Ｎ（R^5）（アルキレン－ＯＨ）、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^5）$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^5）（アルキレン－ＯＨ）、－Ｃ（Ｏ）－アルキル、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－アルキル又は－Ｓ（Ｏ）$_m$－アルキルであり；
R^4は、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－Ｎ（R^5）$_2$、－ＯＨ、－Ｏ－アルキレン－ＯＨ、－Ｓ（Ｏ）$_m$－アルキル、－Ｃ（Ｏ）－アルキル、－Ｃ（Ｏ）－シクロアルキル、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル又はR^8で任意選択的に置換される－アルキレン－アリールであり；
各R^5は、独立して、Ｈ、アルキル、－ＯＨで任意選択的に置換される－アルキレン－ＯＨ、－アルキレン－NH_2、－アルキレン－Ｎ（R^9）$_2$、－アルキレン－Ｏ－アルキレン－ＯＨ、－アルキレン－Ｏ－アルキレン－NH_2、－Ｃ（Ｏ）－アルキル、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－アルキル、－アルキレン－ＣＯＯＨ又は－Ｓ（Ｏ）$_m$－アルキルであるか；又は
代わりに、２つのR^5は、それらが結合されているＮ原子と共に、Ｏ、Ｓ又はＮから選択される追加のヘテロ原子を任意選択的に含有する４～７員ヘテロ環を形成することができ、ここで、前記ヘテロ環は、R^8で任意選択的に置換され；
R^8は、ハロゲン、アルキル又はアルコキシであり；
R^9は、Ｈ若しくはアルキルであるか、又は２つのR^9は、それらが結合されているＮ原子と共に、Ｏ、Ｓ（Ｏ）$_t$若しくはＮから選択される追加のヘテロ原子を任意選択的に含有する４～７員ヘテロ環を形成することができ；
Ｘは、Ｎ又はＣＨであり；
ｍは、０、１又は２であり；及び
ｔは、０、１又は２である）
の構造を有する、請求項１に記載の化合物、又はその塩若しくは溶媒和物。
【請求項９】
R^1は、３～５員シクロアルキル、又は－（C_1～C_6アルキレン）－（３～５員シクロアルキル）である、請求項８に記載の化合物、又はその塩若しくは溶媒和物。
【請求項１０】
R^1は、シクロブチルである、請求項８に記載の化合物、又はその塩若しくは溶媒和物。
【請求項１１】
R^1は、二環式４～６員シクロアルキルである、請求項８に記載の化合物、又はその塩若しくは溶媒和物。

【請求項１２】
R^7は、それぞれ１つ以上のR^4で任意選択的に置換されるC_1～C_6アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、３～６員シクロアルキル、６～１０員アリール、３～６員ヘテロシクリル、５～１０員ヘテロアリール、－Ｃ（Ｏ）（C_1～C_6アルキル）、－Ｃ（Ｏ）Ｏ（C_1～C_6アルキル）又は－Ｃ（Ｏ）ＮＲ^5（C_1～C_6アルキル）である、請求項８に記載の化合物、又はその塩若しくは溶媒和物。
【請求項１３】
R^7は、それぞれ１つ以上のR^4で任意選択的に置換されるC_1～C_4アルキル、C_1～C_6ハロアルキル、３～６員シクロアルキル、フェニル、３～６員ヘテロシクリル又は５～１０員ヘテロアリールである、請求項８に記載の化合物、又はその塩若しくは溶媒和物。
【請求項１４】
R^3は、－Ｏ－（C_1～C_6アルキレン）－Ｎ（R^5）$_2$、－Ｎ（R^5）$_2$、－Ｎ（R^5）（C_1～C_6アルキレン－ＯＨ）、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^5）$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（R^5）（C_1～C_6アルキレン－ＯＨ）、－Ｃ（Ｏ）（C_1～C_6アルキル）、－Ｃ（Ｏ）Ｏ（C_1～C_6アルキル）又は－Ｓ（Ｏ）$_m$（C_1～C_6アルキル）である、請求項８に記載の化合物、又はその塩若しくは溶媒和物。
【請求項１５】

【化４】


,

,

,

,

,

,

,

,

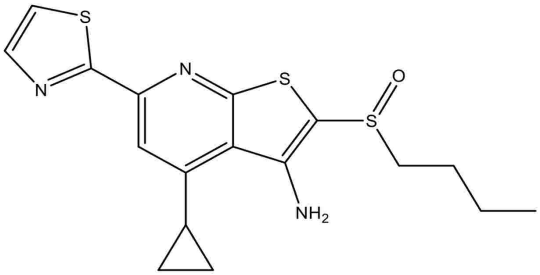
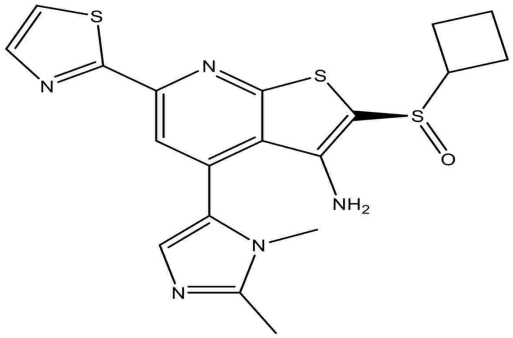
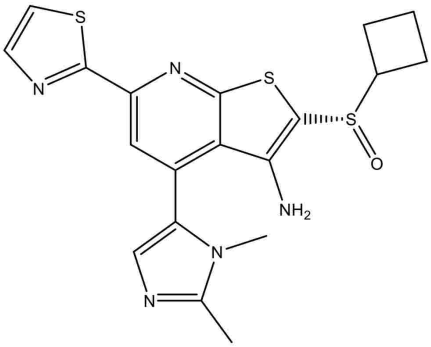
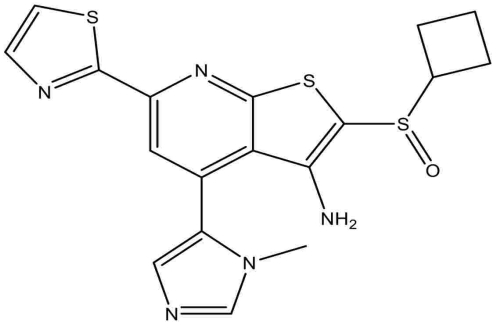
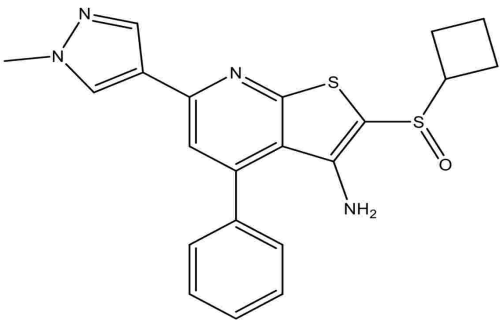
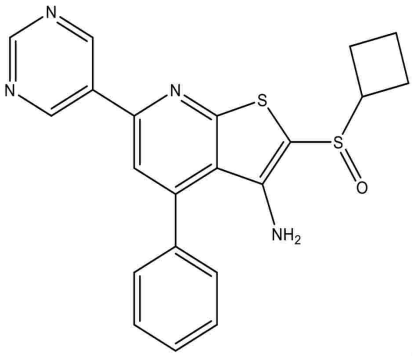
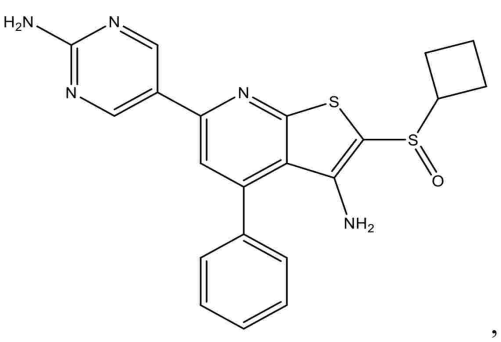
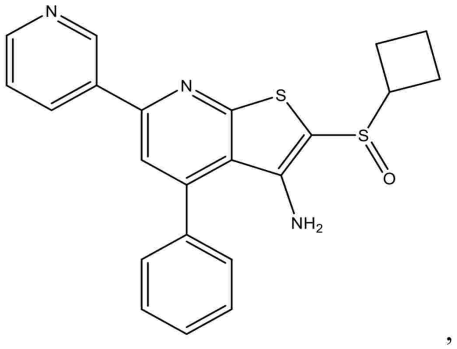
10

20

30

40

50


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

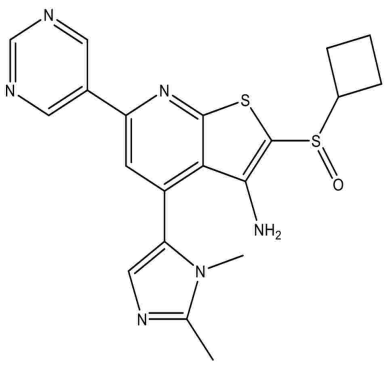
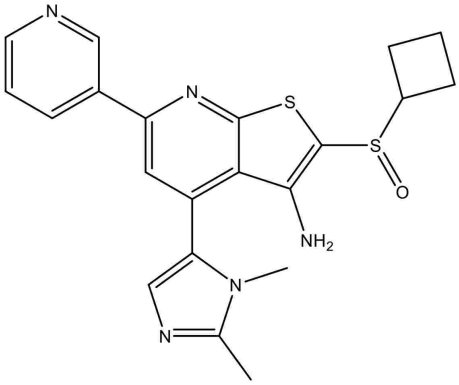
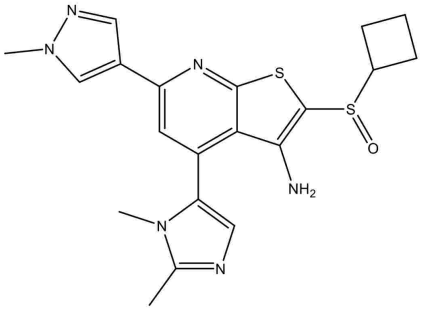
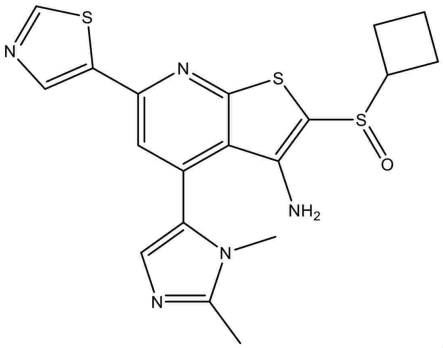
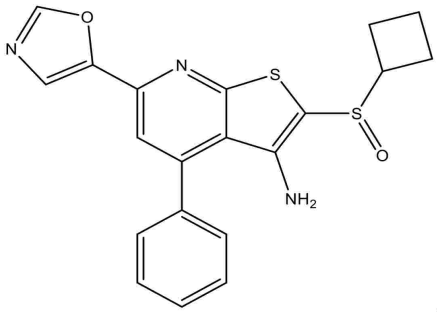
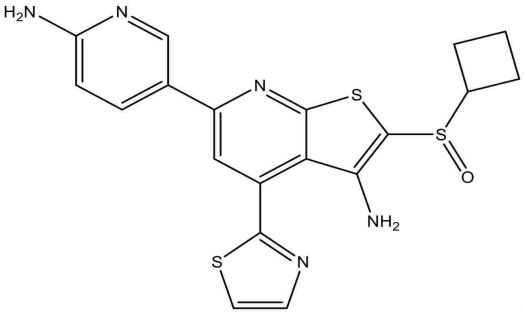
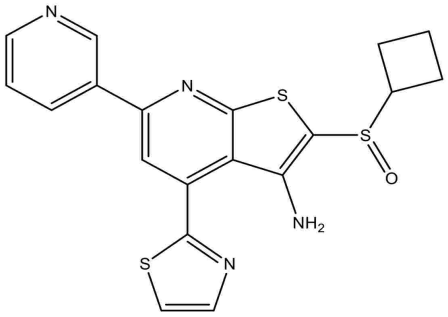
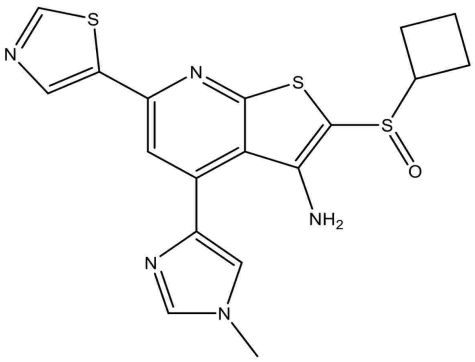
10

20

30

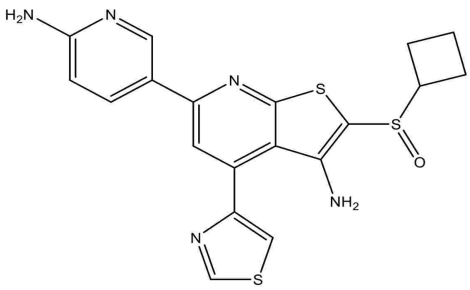
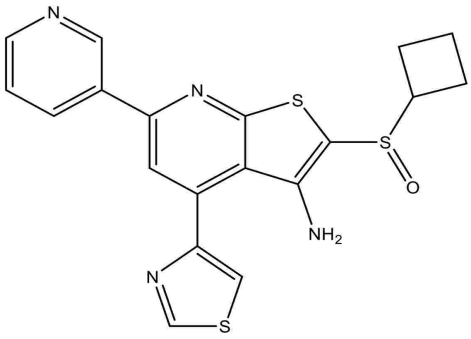
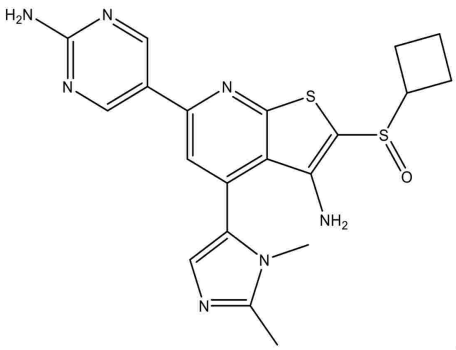
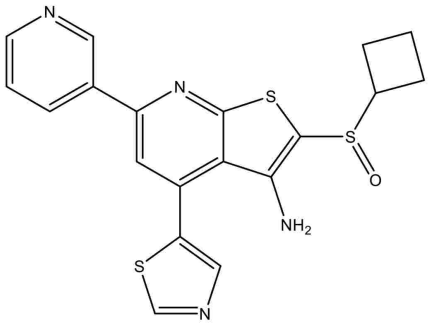
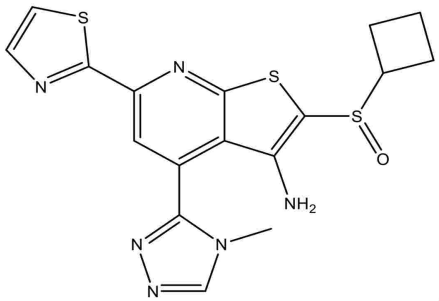
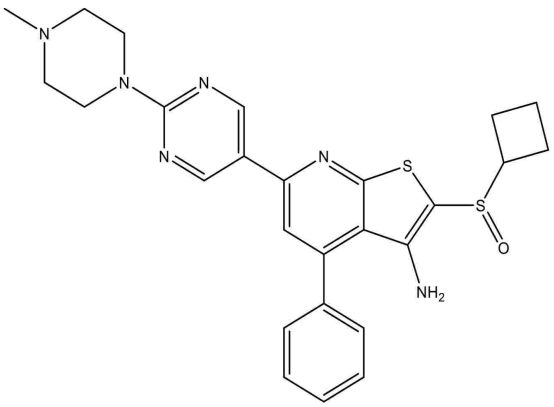
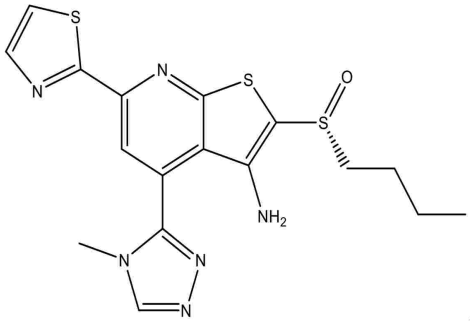
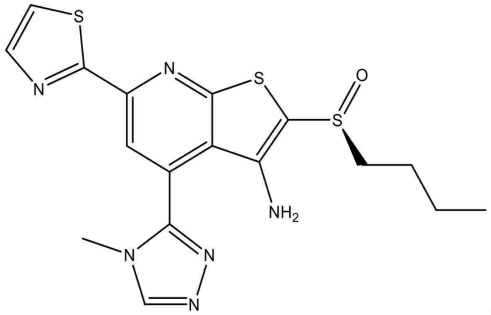
40

50

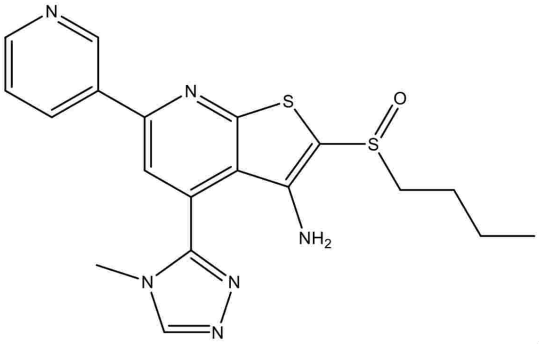
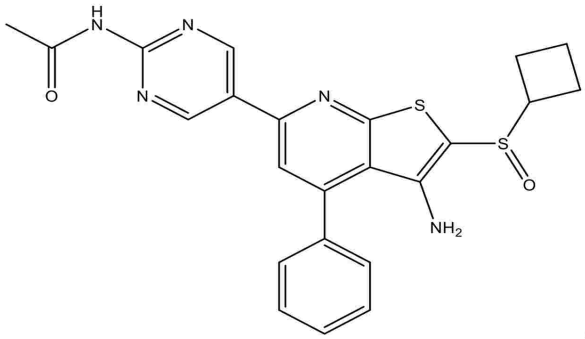
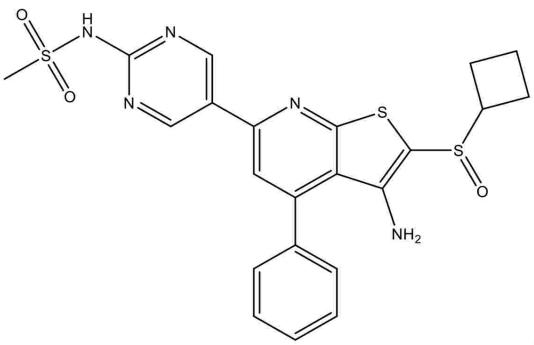
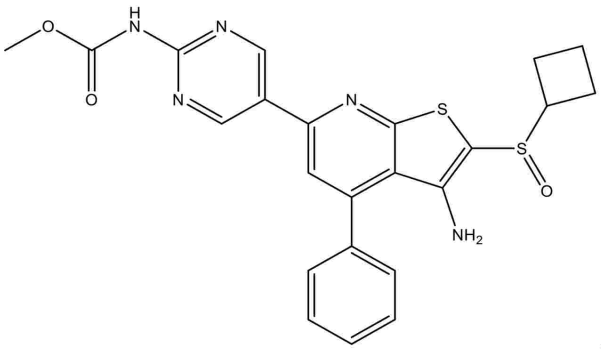
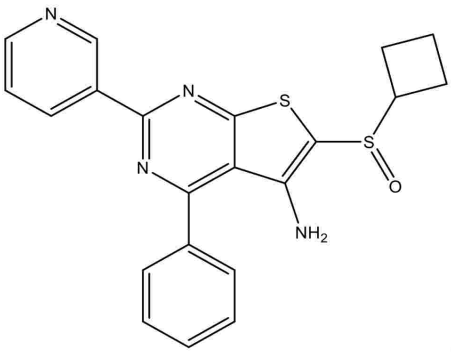
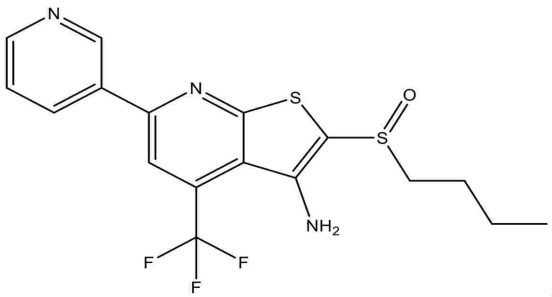
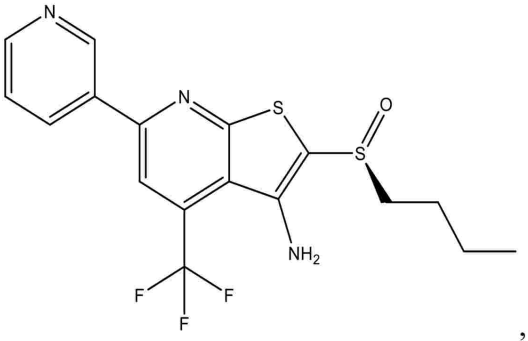
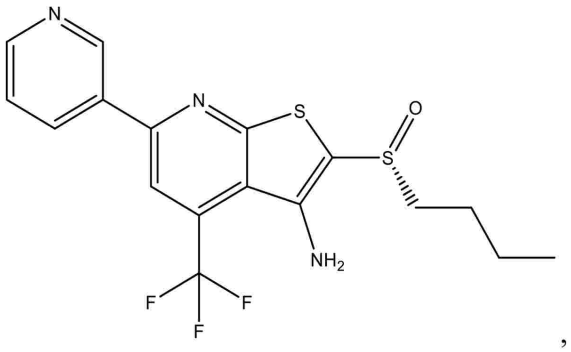

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,


,

,

,

,

,

,

,


50


,

,

,

,

,

,

,

,

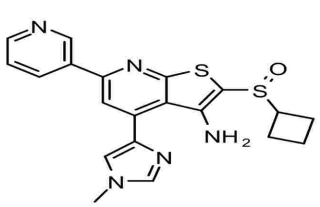
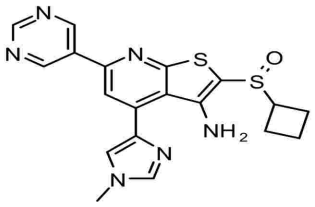
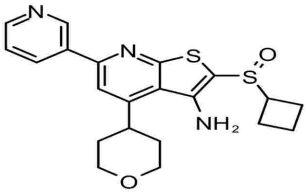
10

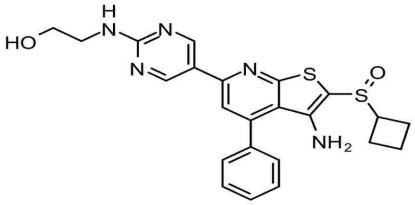
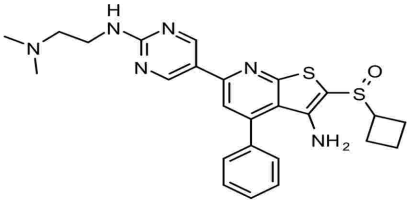
20

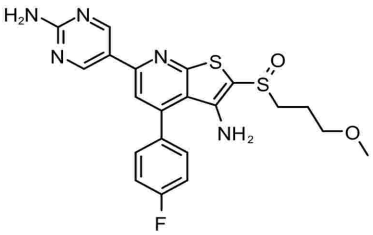
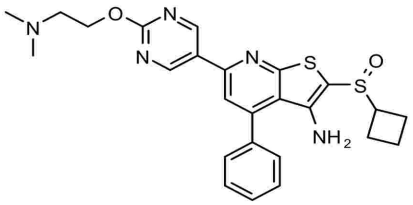
30

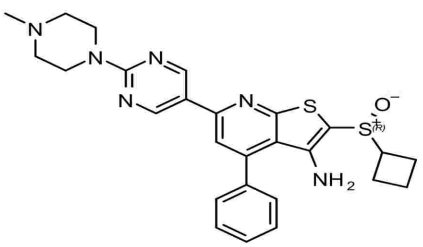
40

50


,

,

,


,

,


,

,


,

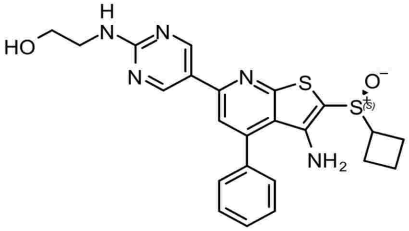
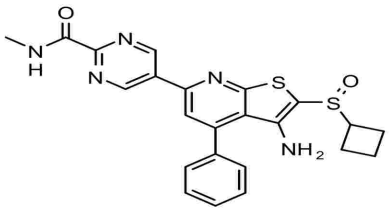
,

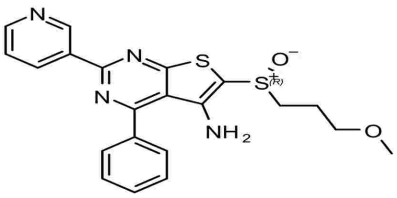
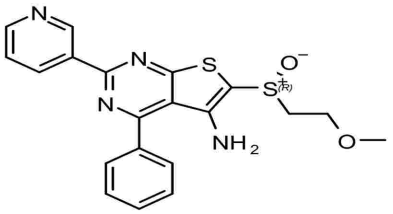
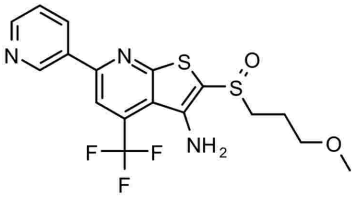
,

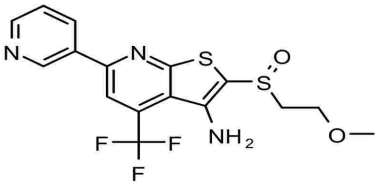
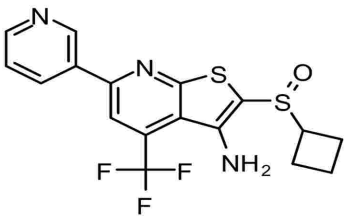
,

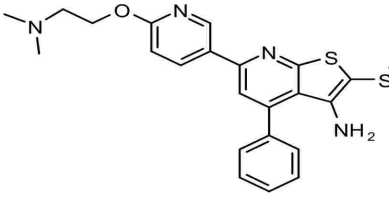
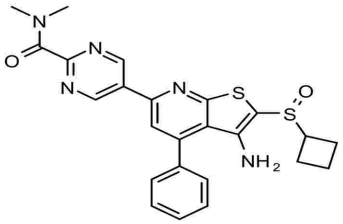
,

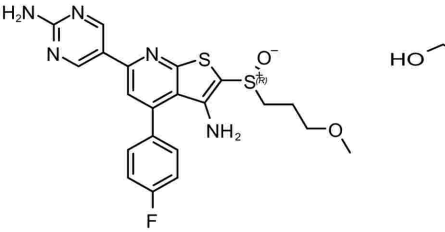
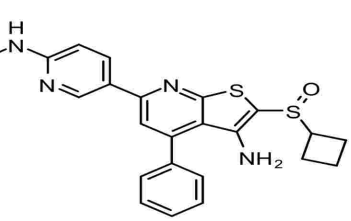
,


,

,


,

,

,

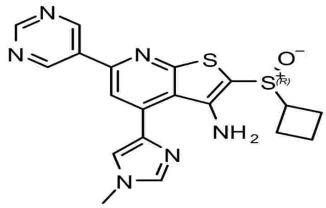
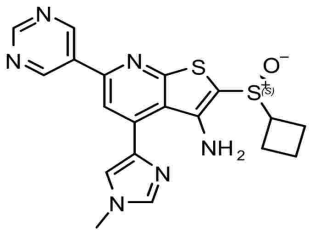
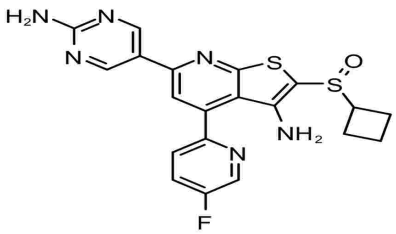
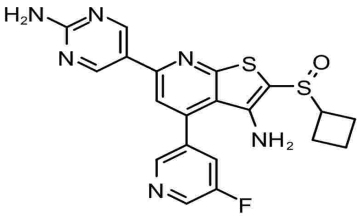
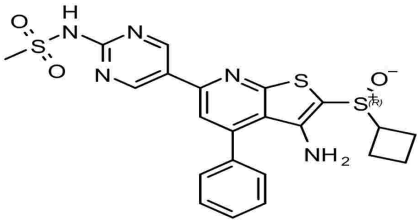
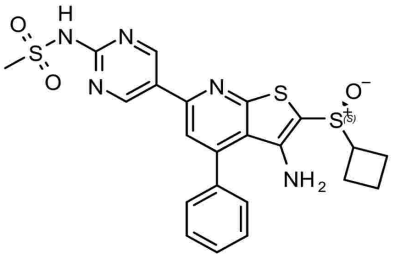
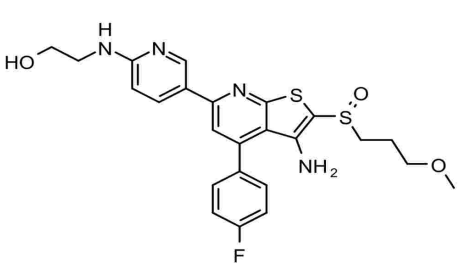
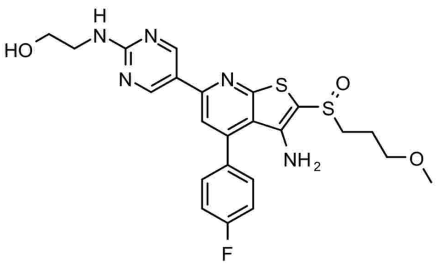
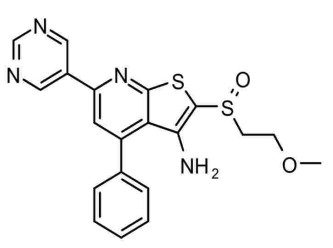
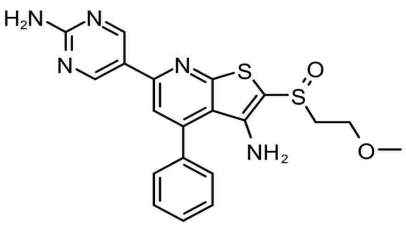
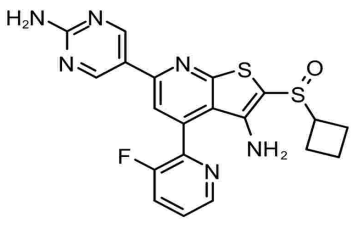

,

,


,

,


,

,

,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

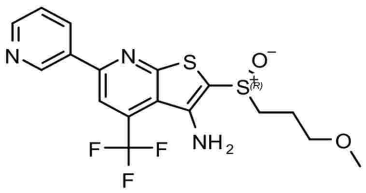
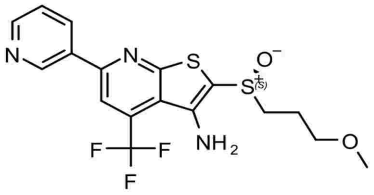
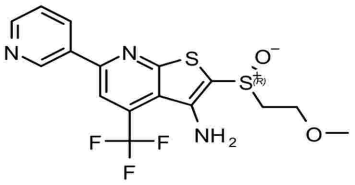
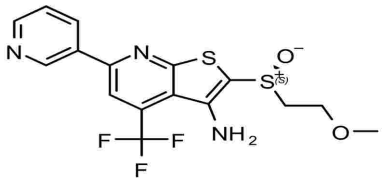
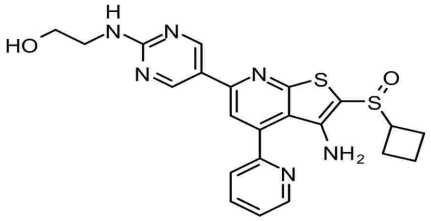
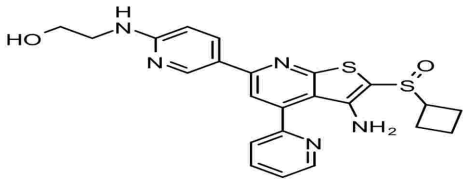
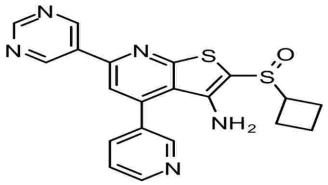
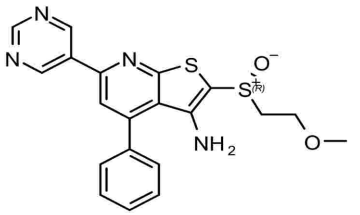
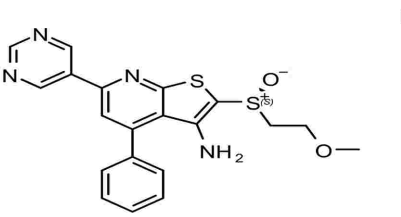
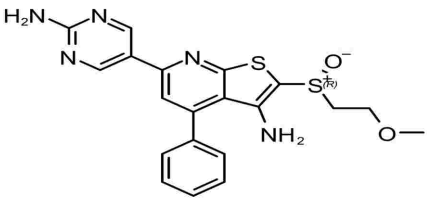
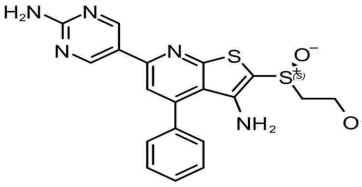
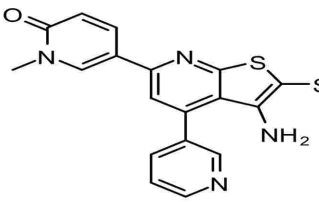
10

20

30

40

50


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

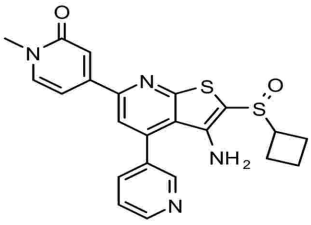
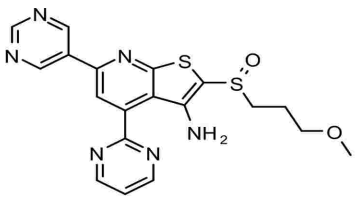
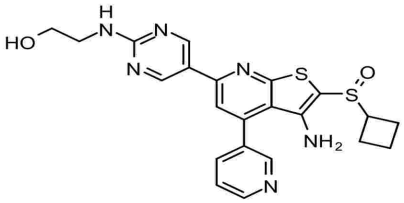
,

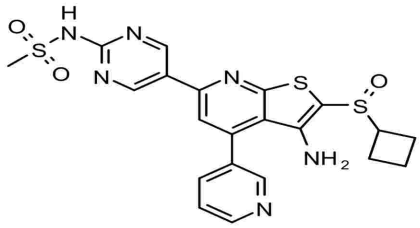
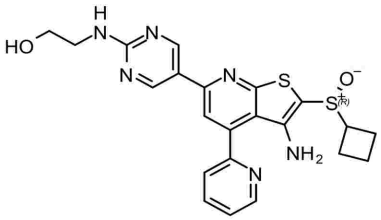
,

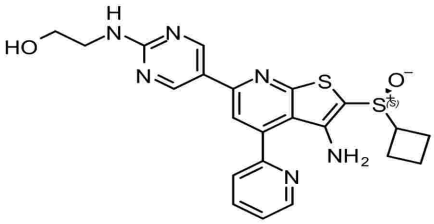
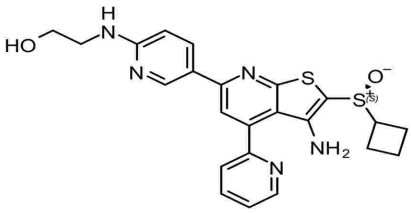
,

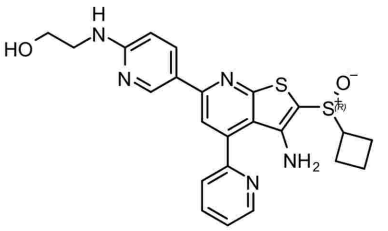
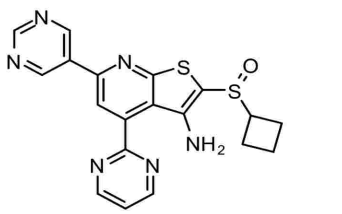
,

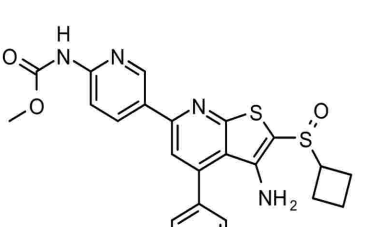
,

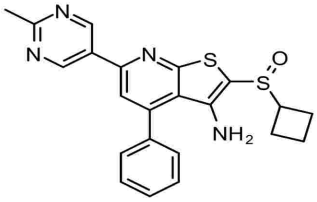

,

,

,

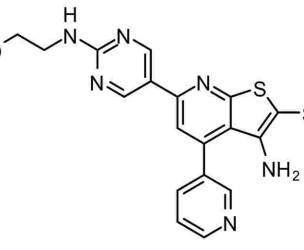
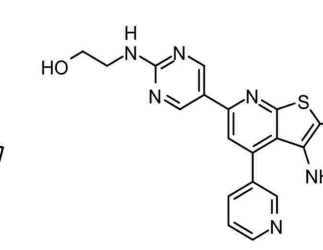

,

,


,

,


,

,


,

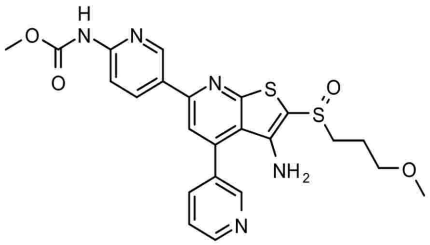
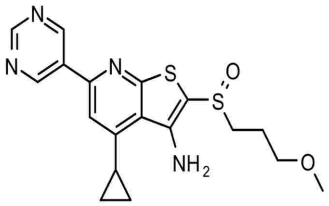
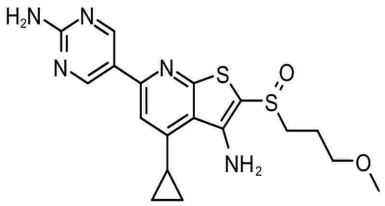
,

,

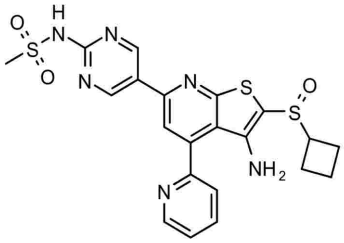
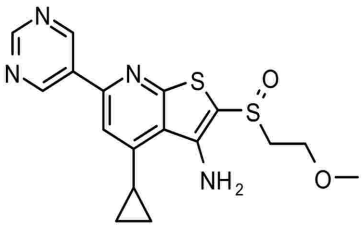
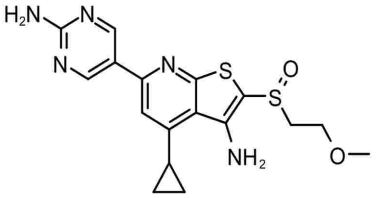
,

,

,

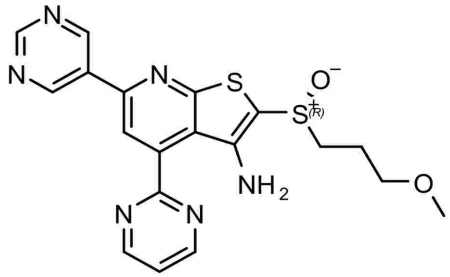
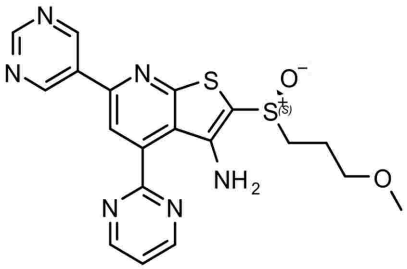
,

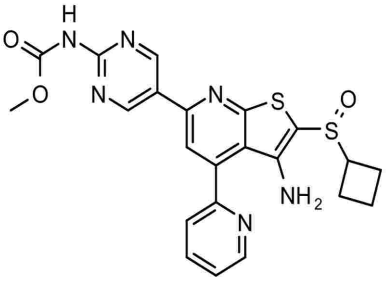
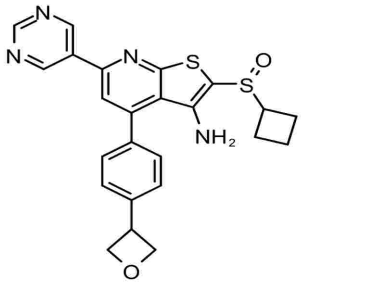
,

,


,

,

,

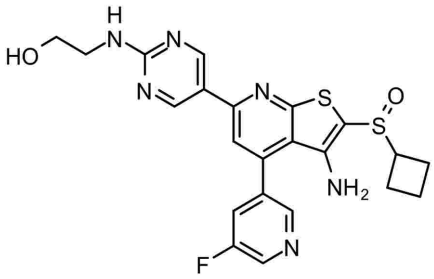
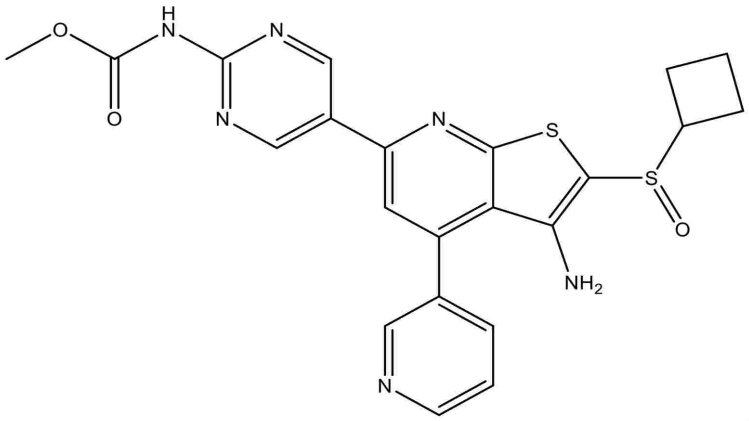
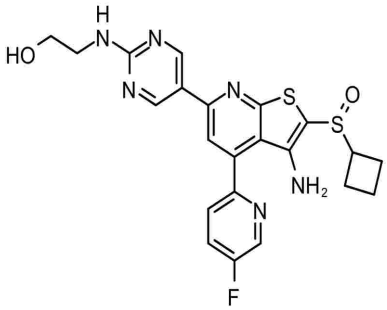
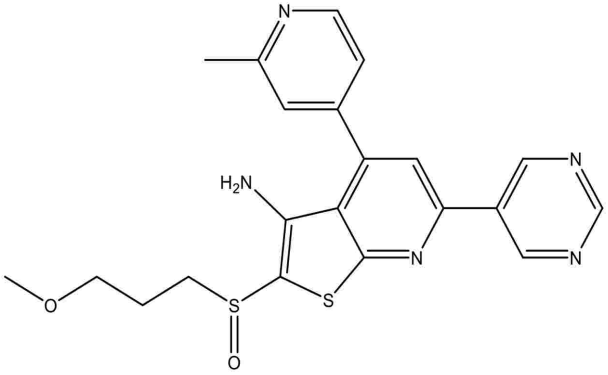
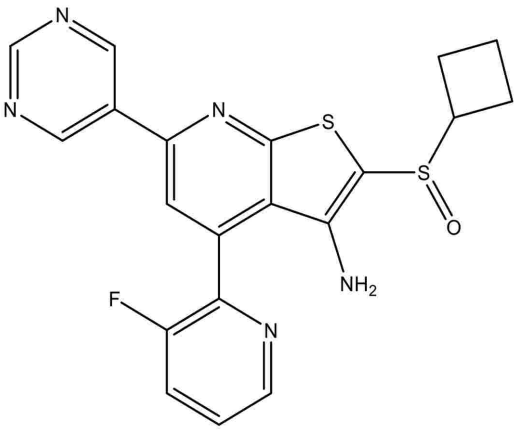
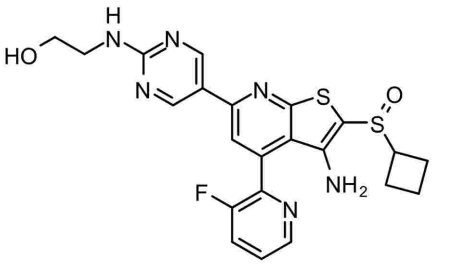

,

,

,

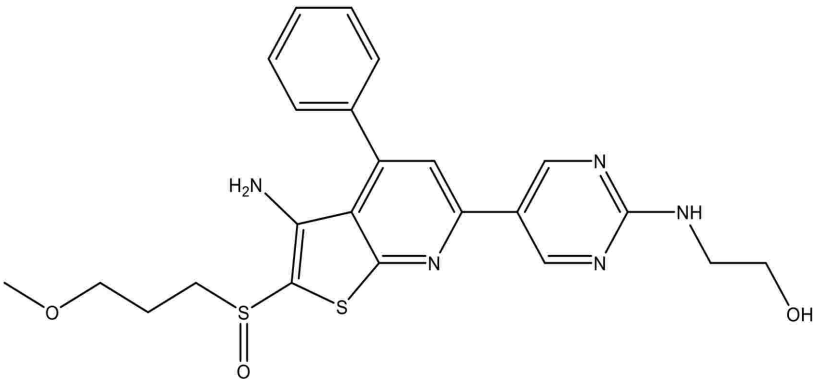
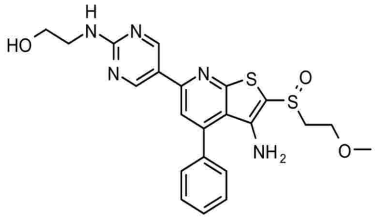
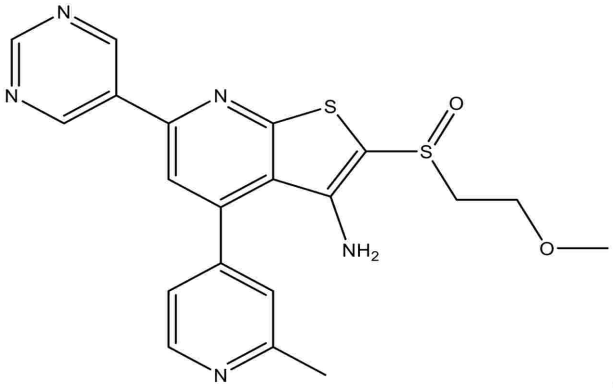
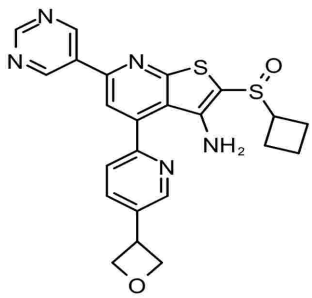
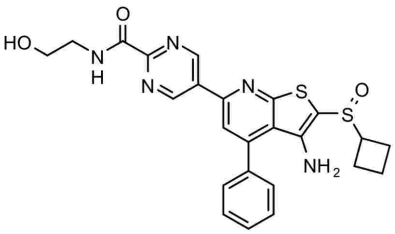
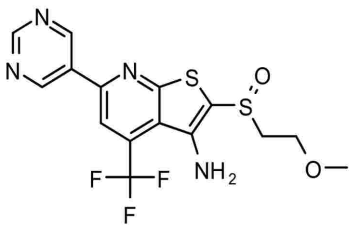
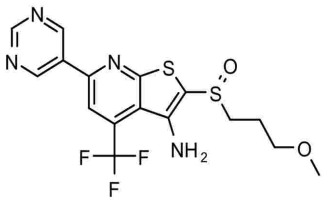
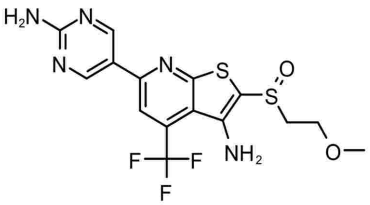
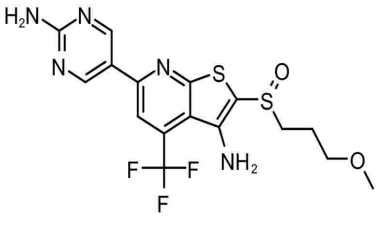
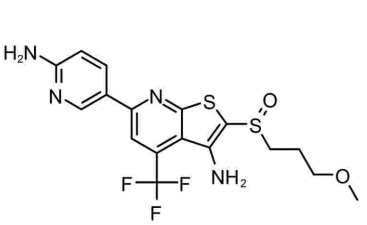

,

,


,

,

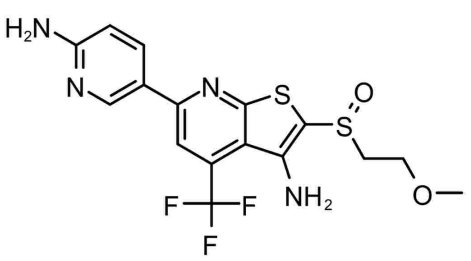
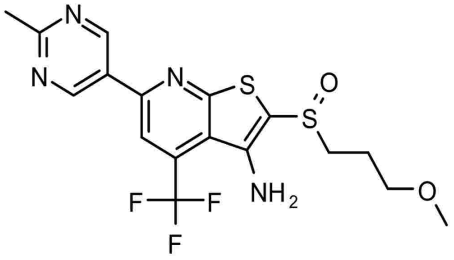
,

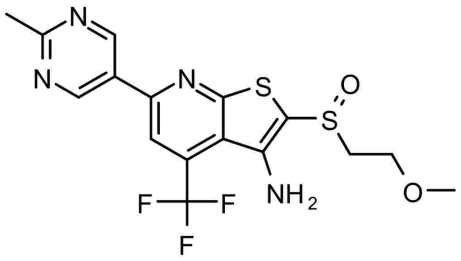
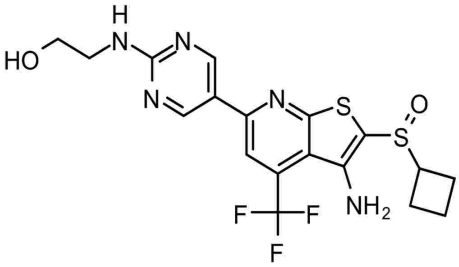
,

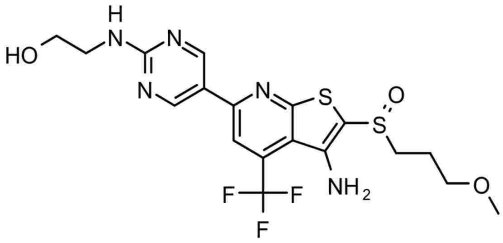
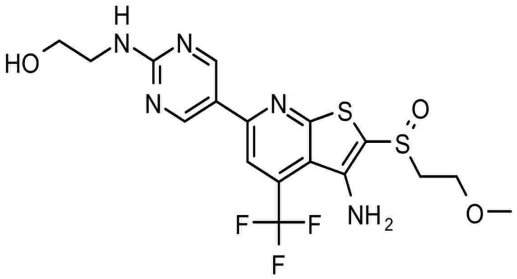

,

,

,

,

,

,

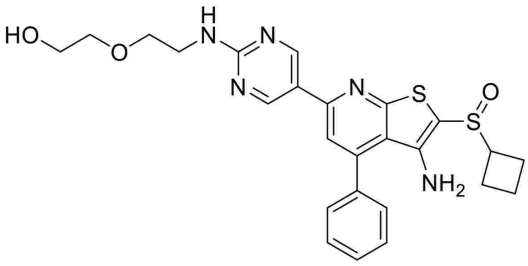
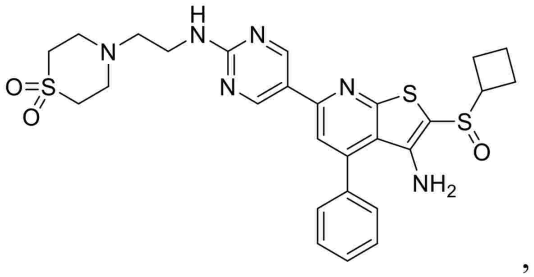

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

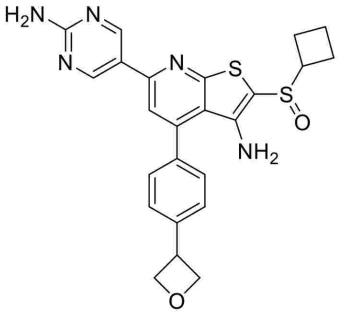
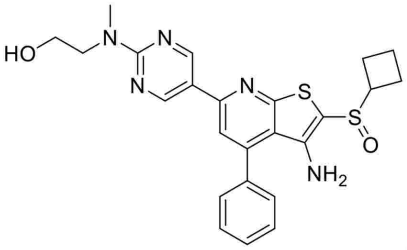
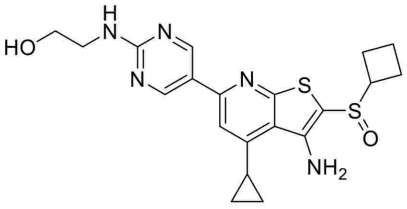
50

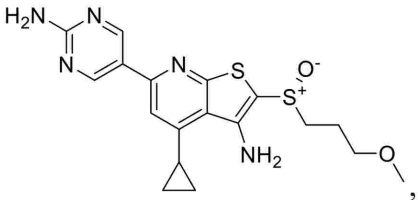
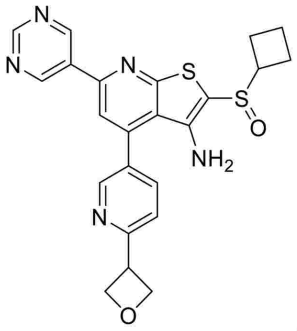
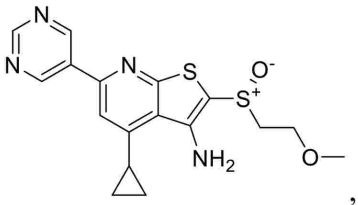

,

,

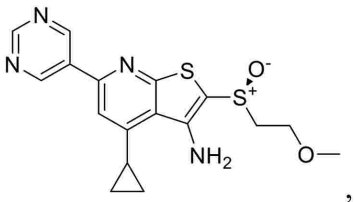
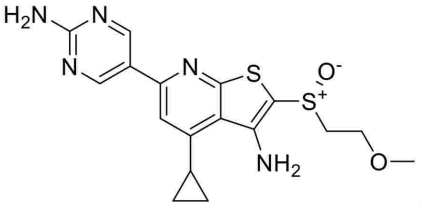
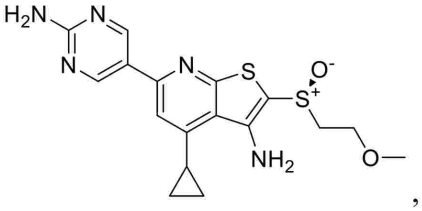

,

,

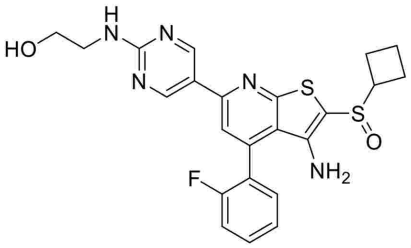
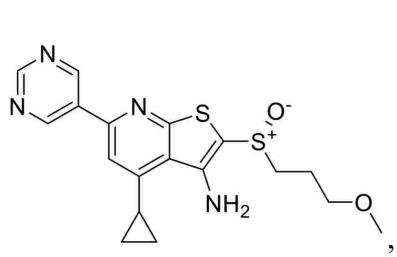
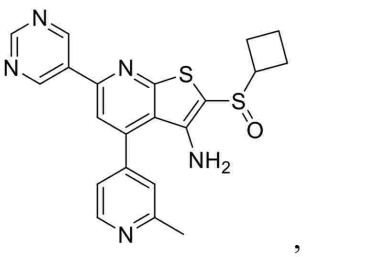

,

,

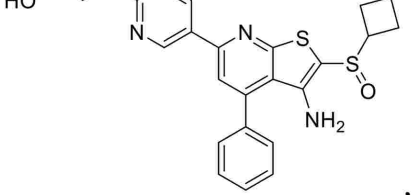
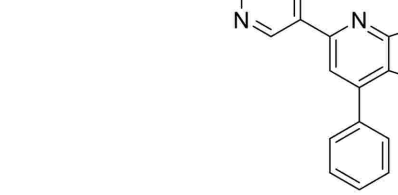

,

,


,

,

,


,

,

,


,

,

,

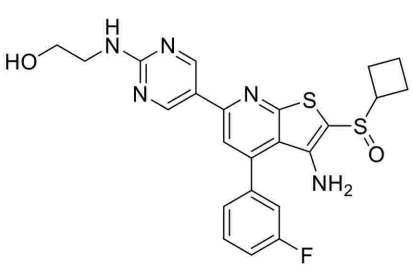
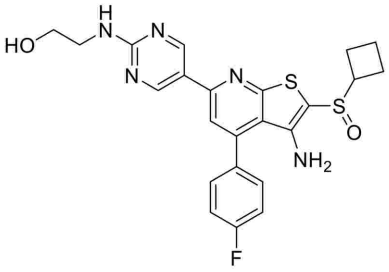
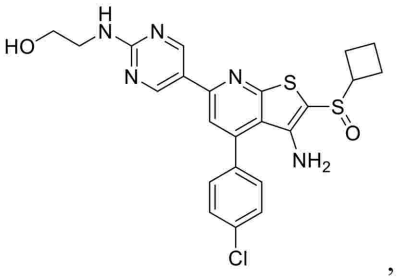
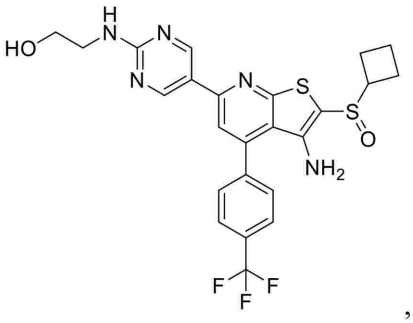
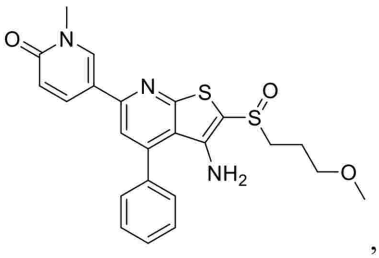
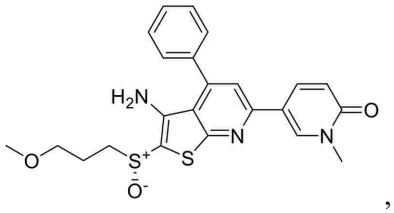
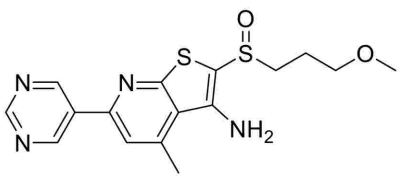
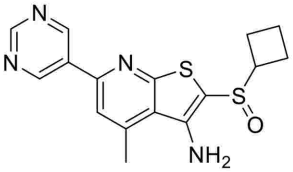
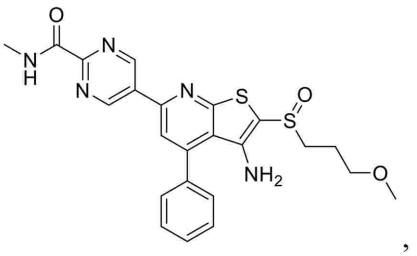
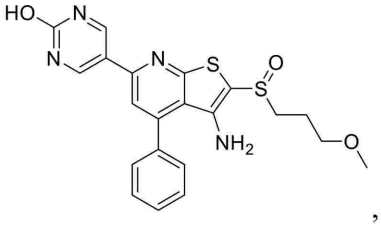
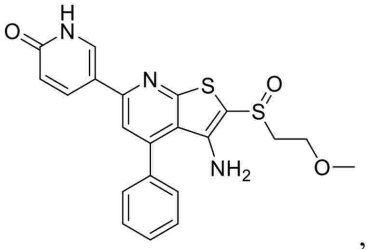
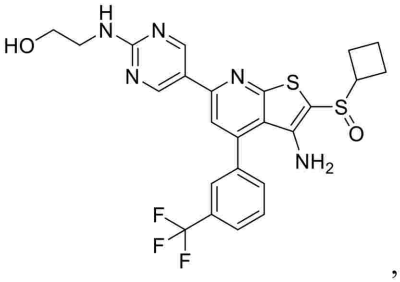

,

,

,


,

,

,

,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

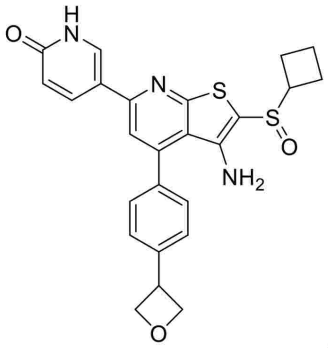
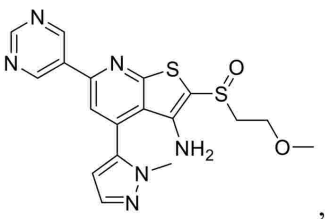
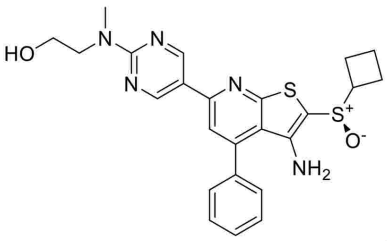
,

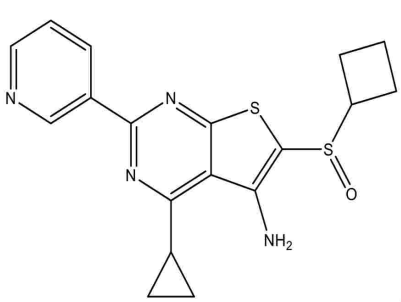
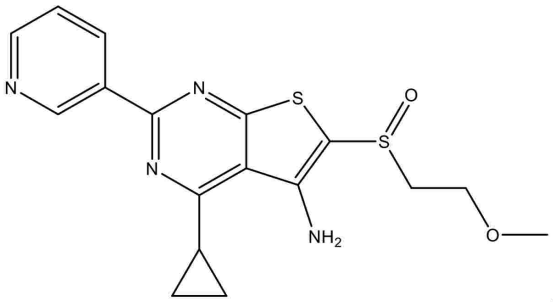
,

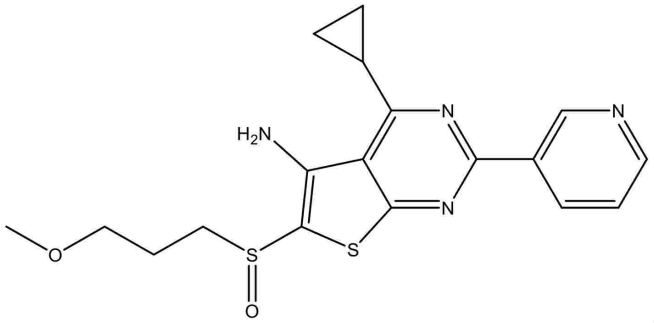
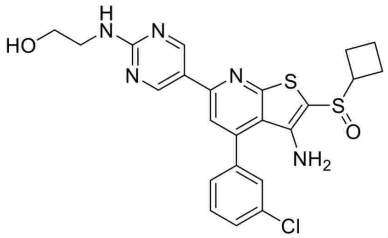
,

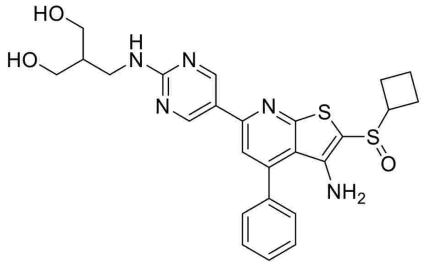
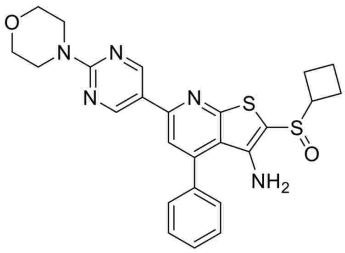
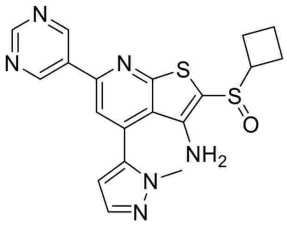
,

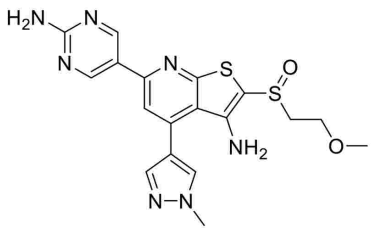
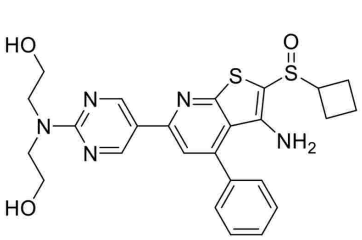
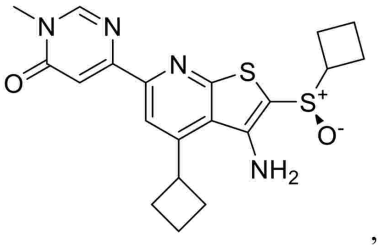
,

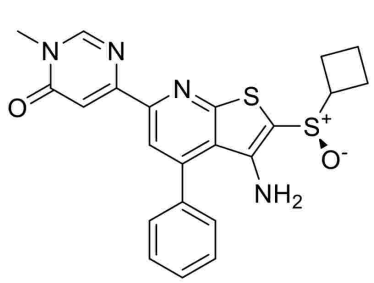
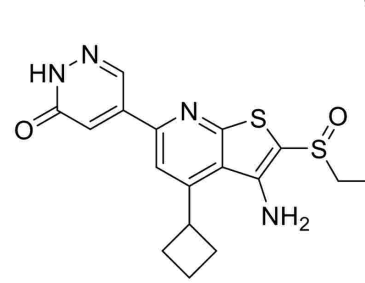
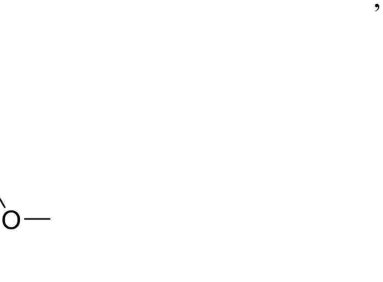

,

,

,


,

,


,

,

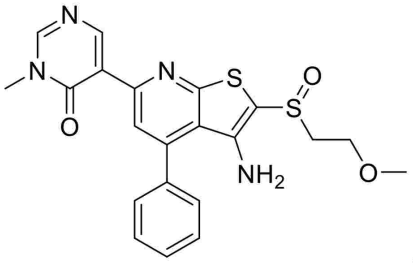
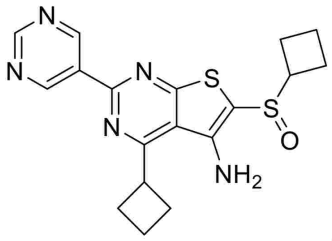
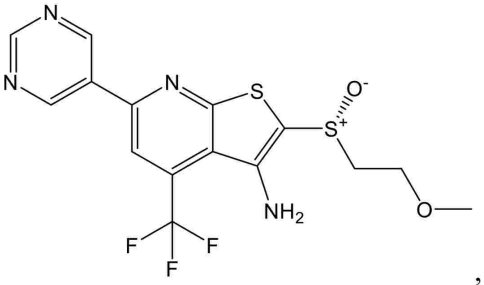
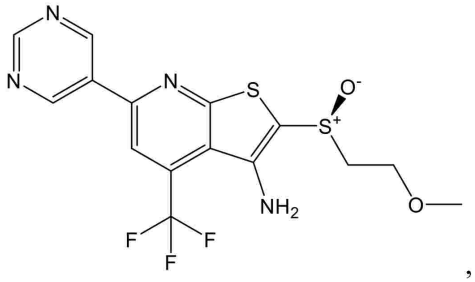
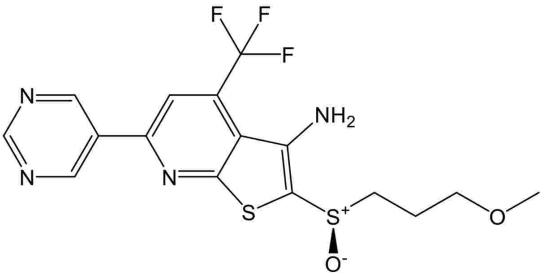
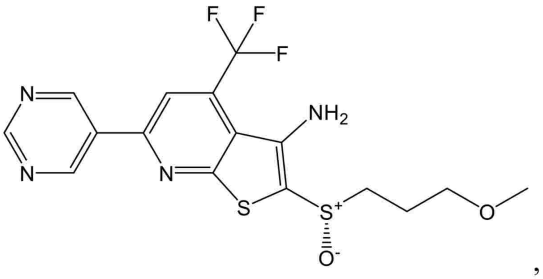
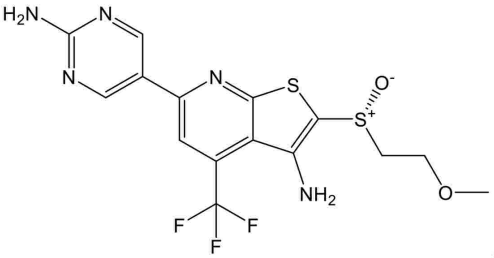
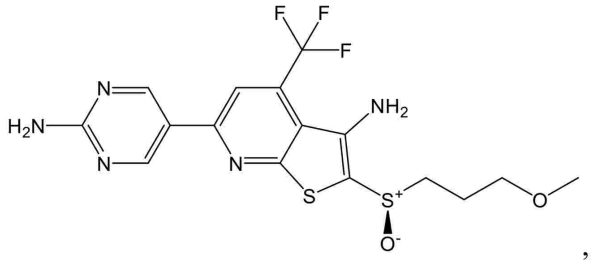
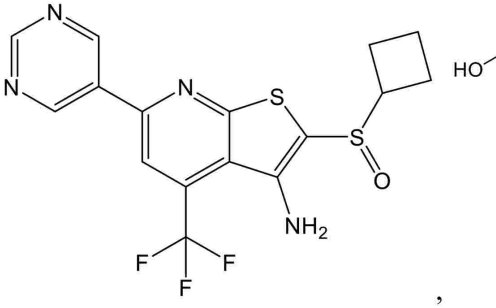

,

,

,

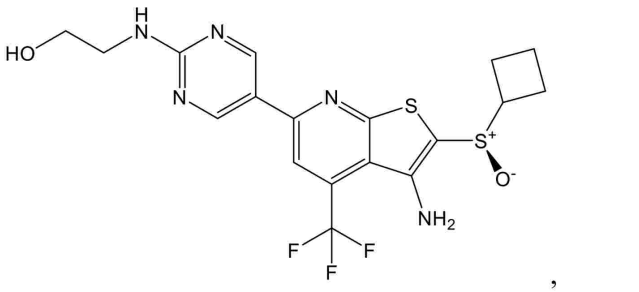

,

,

,


,

,

,

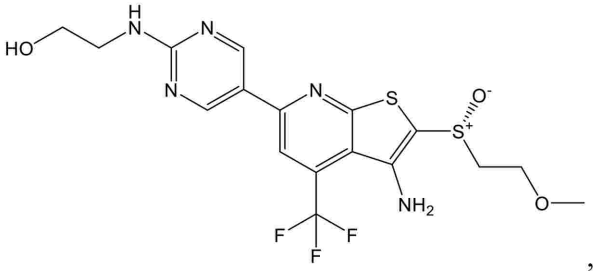
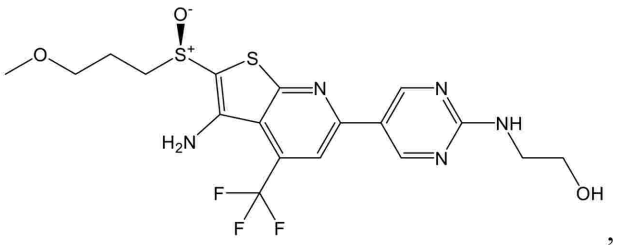
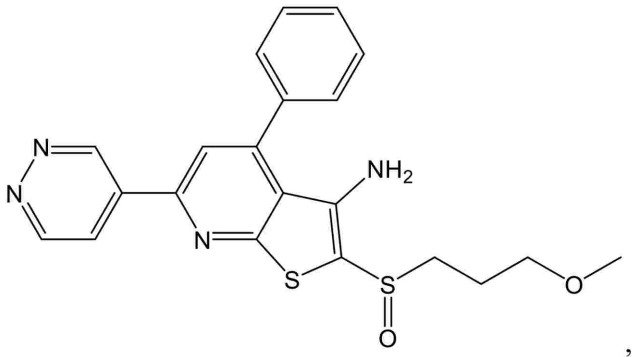
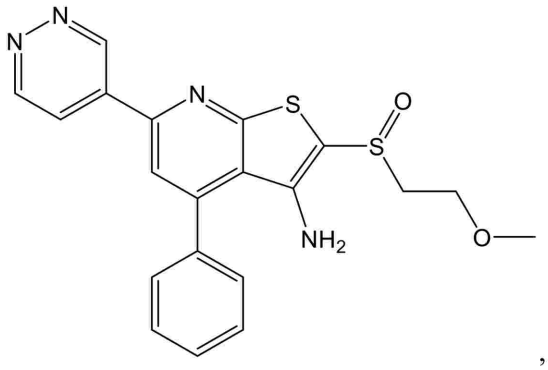
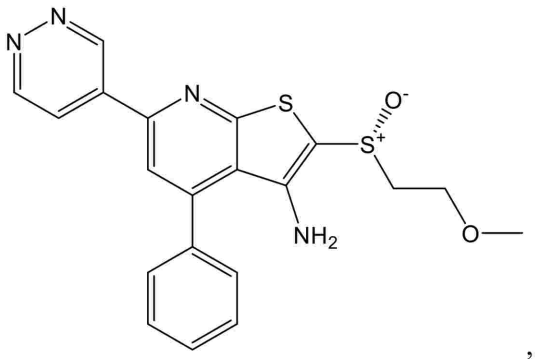
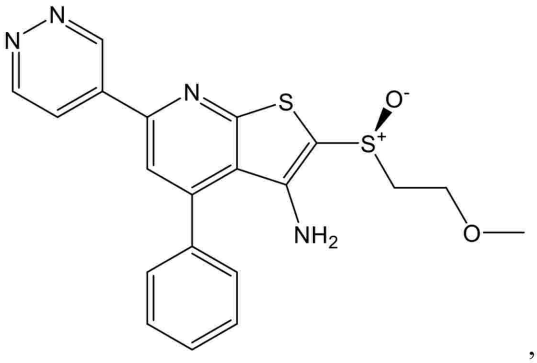
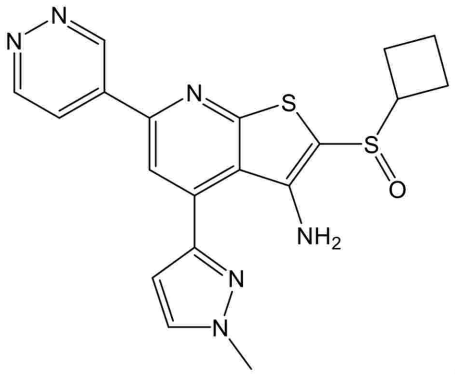
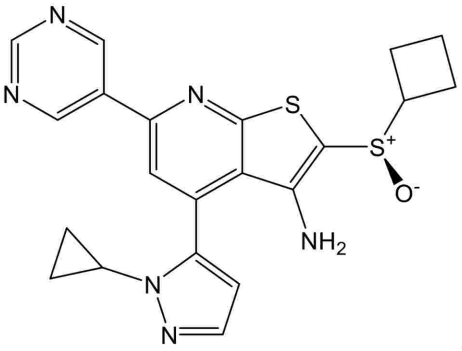
,

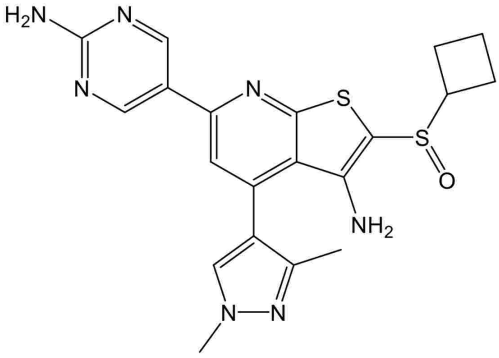
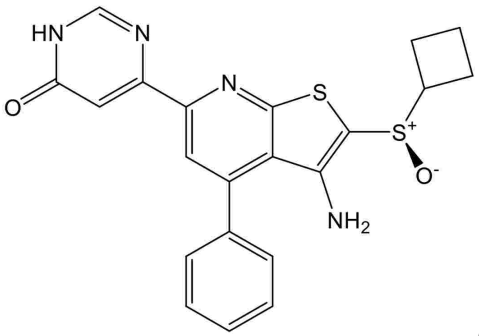
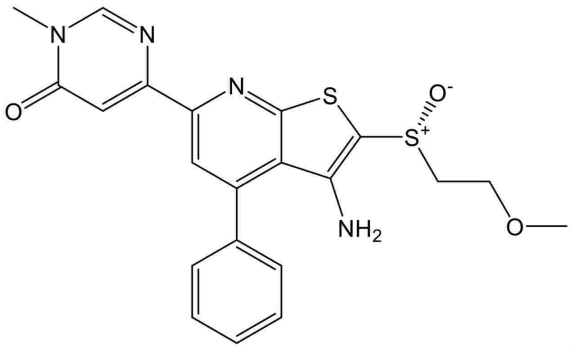
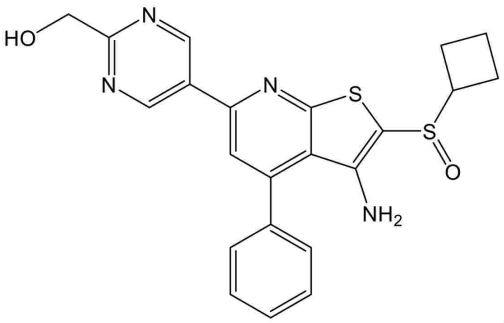
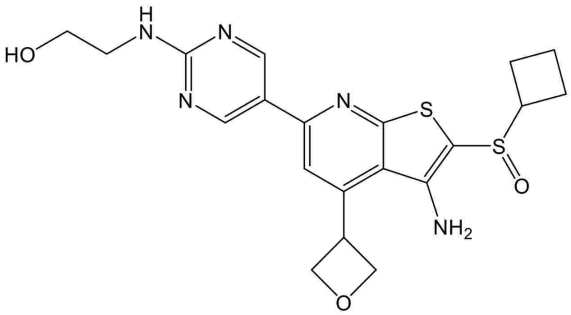
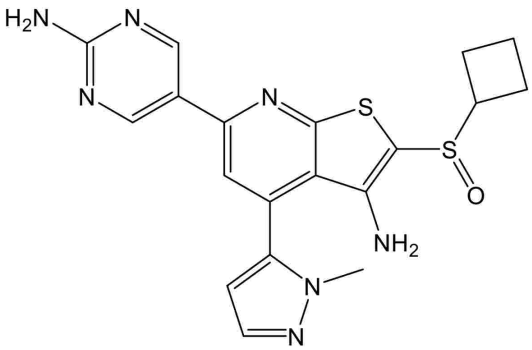
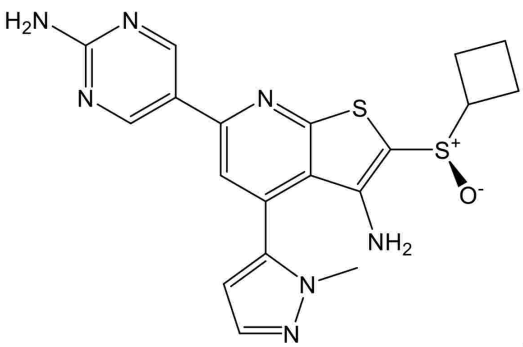
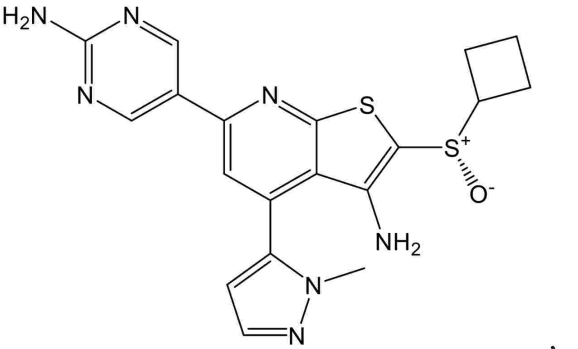
,

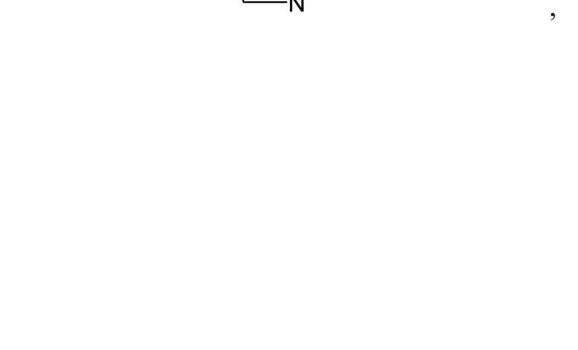










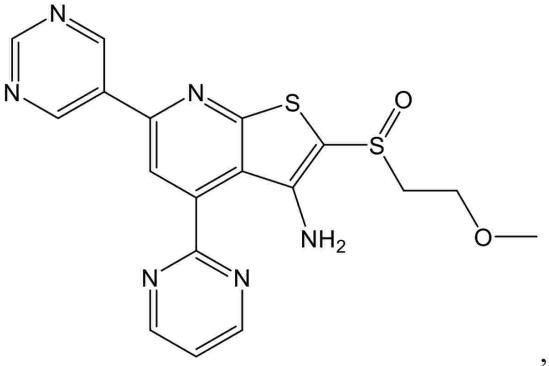
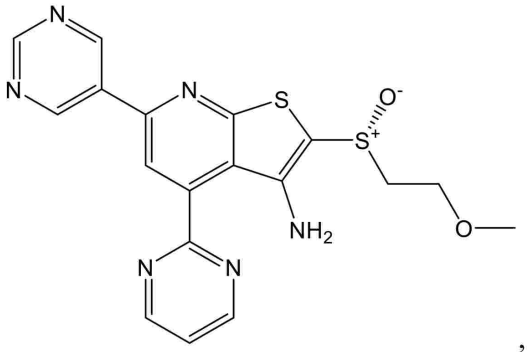
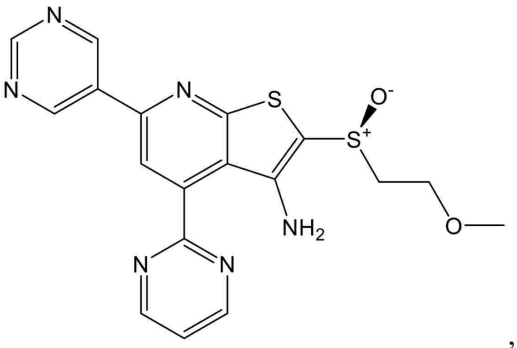
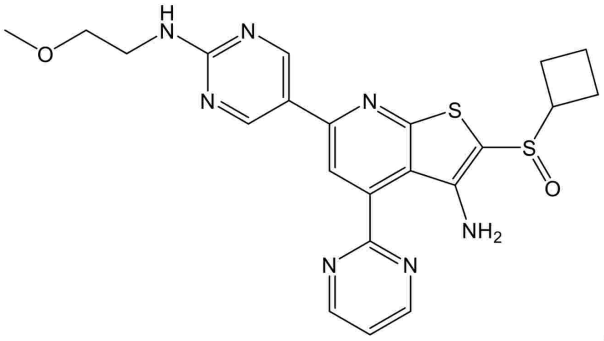
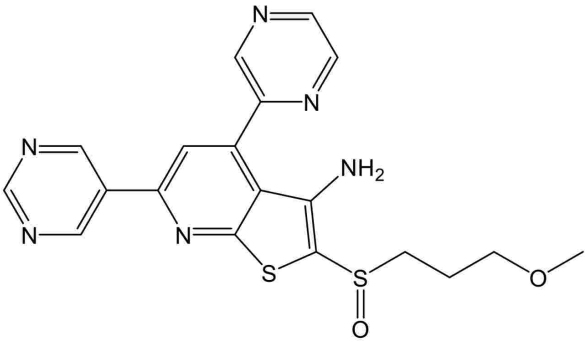
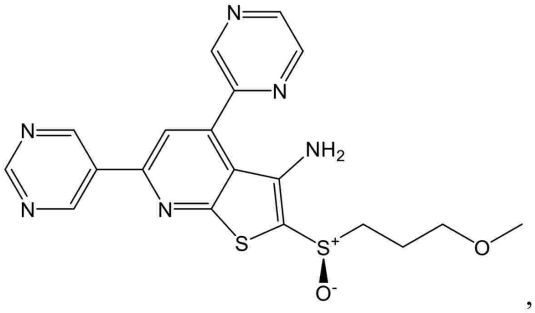
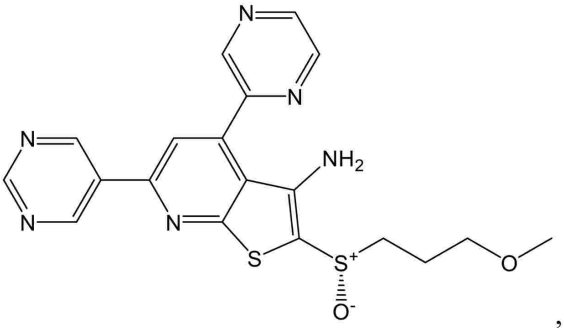
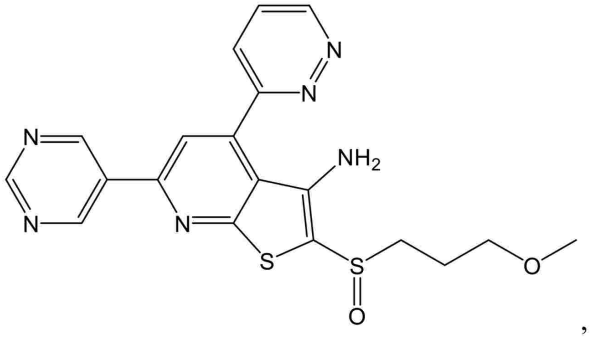


, , , ,


,

,

,

,

,

,

,

,

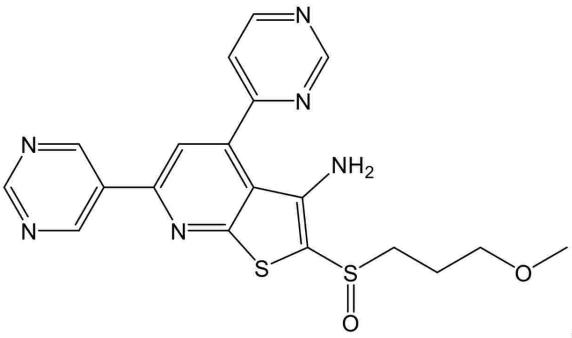
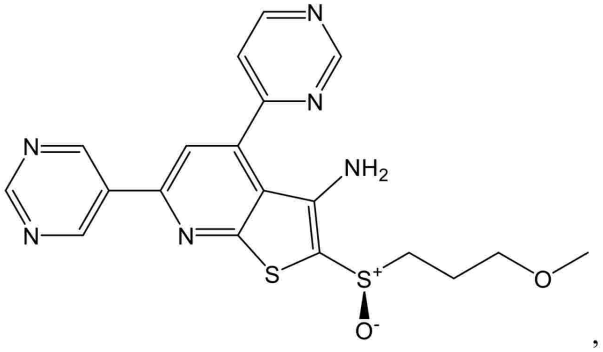
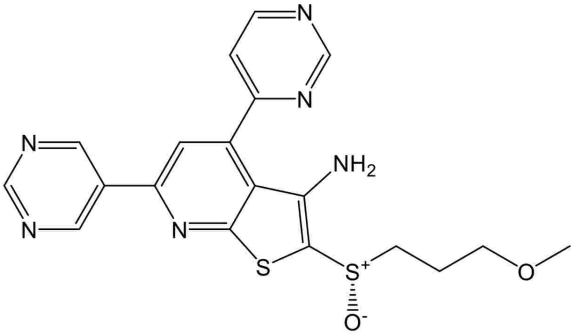

,

,

,

,

,

,

,

,

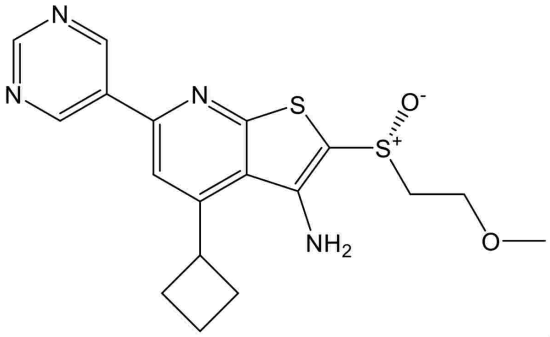
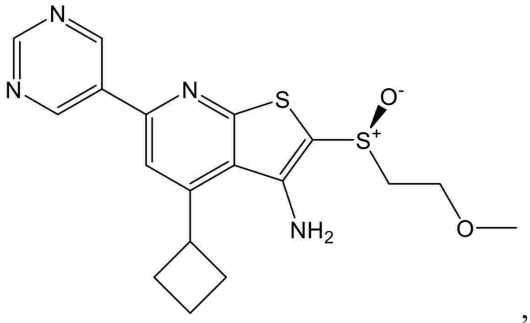
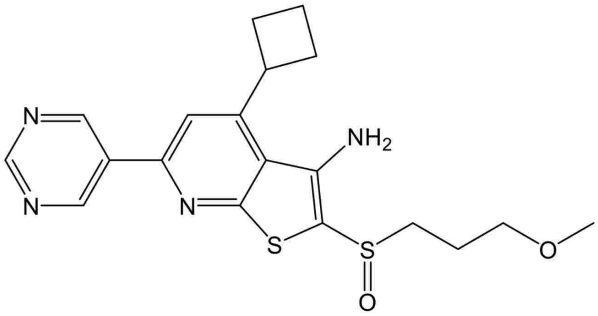
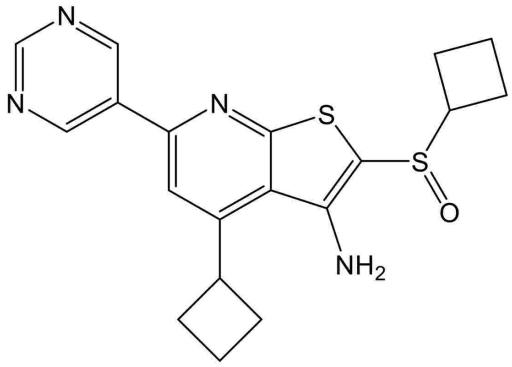
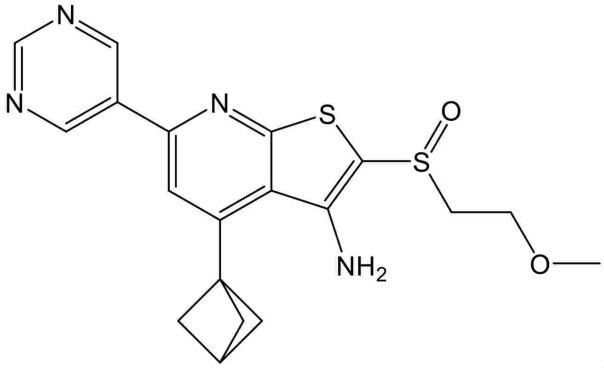
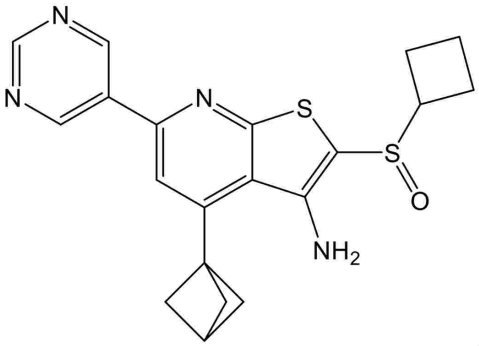
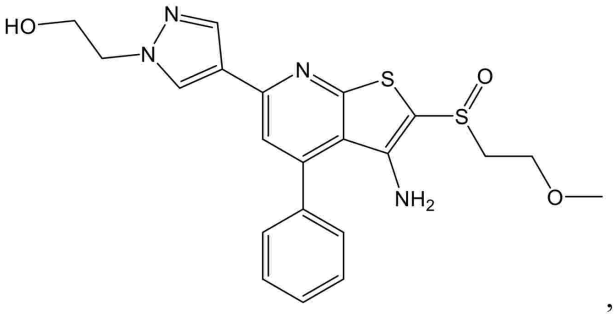
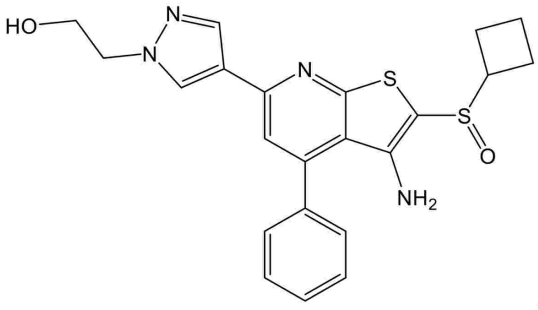
,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

,

,


,

,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

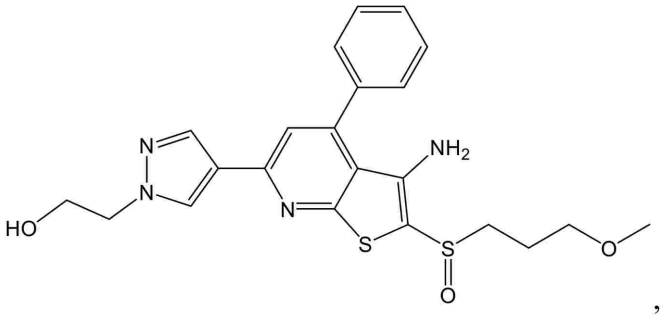
10

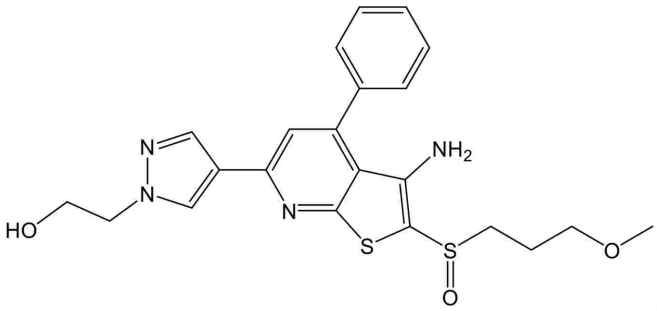
20

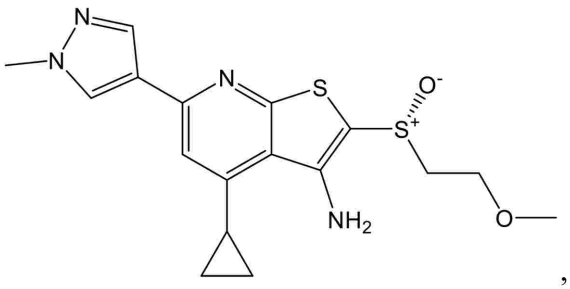
30

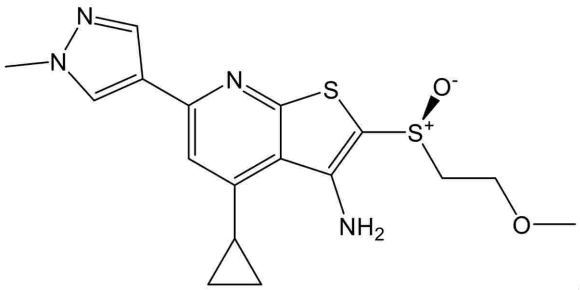
40

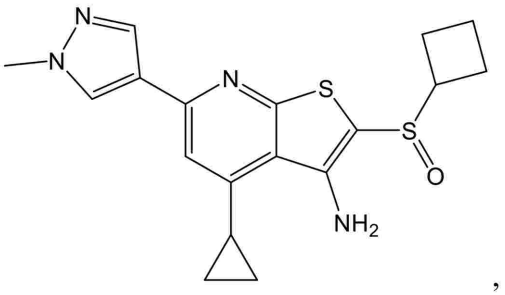
50

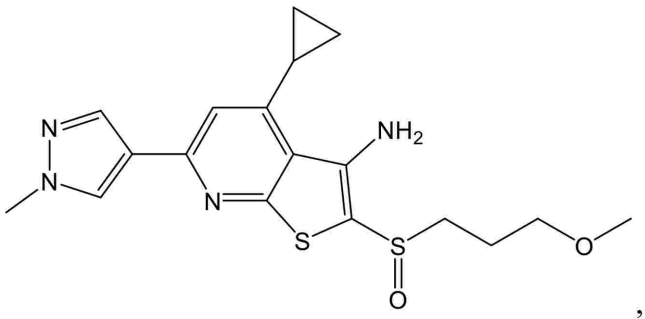

,

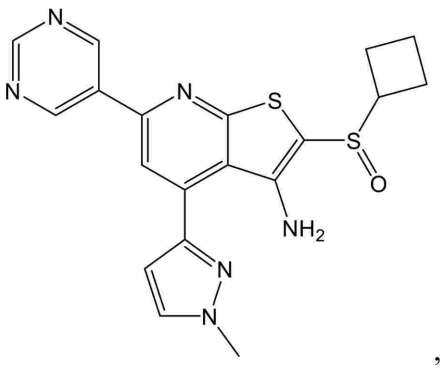

,

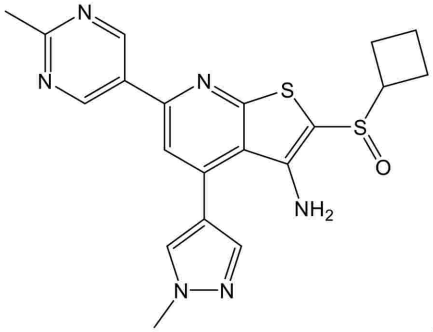
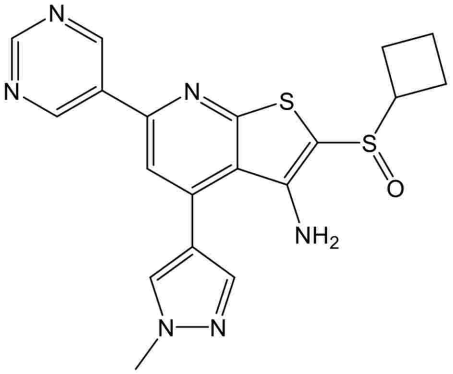

,

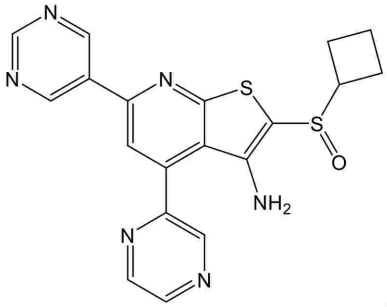
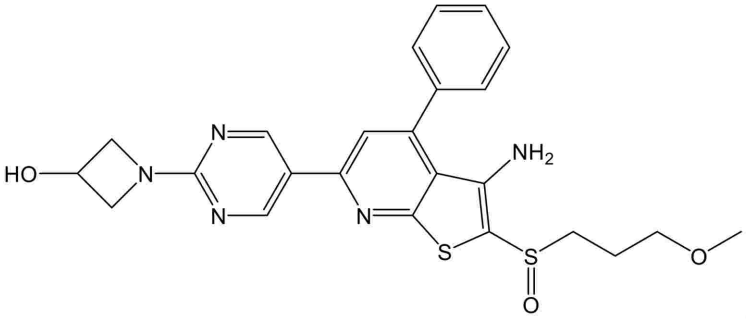

,

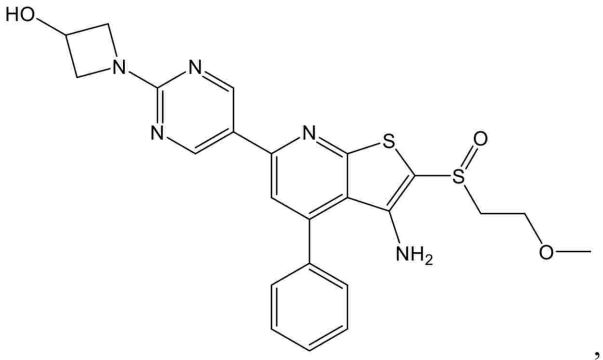
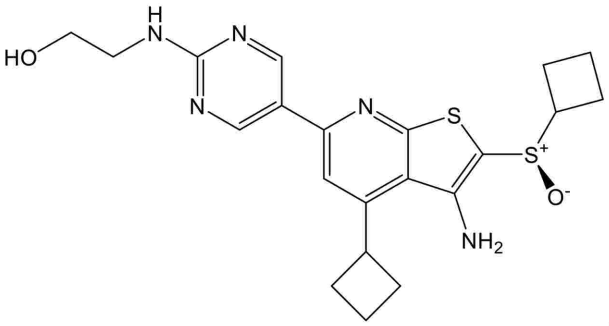

,

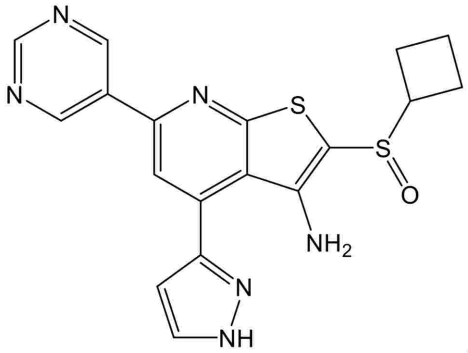
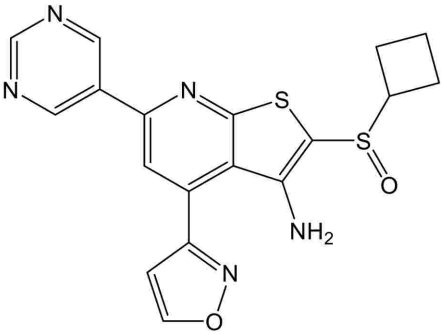

,


,


,

,

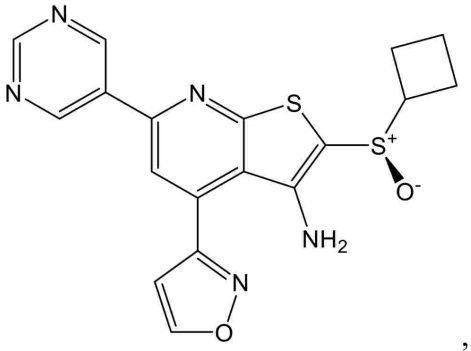
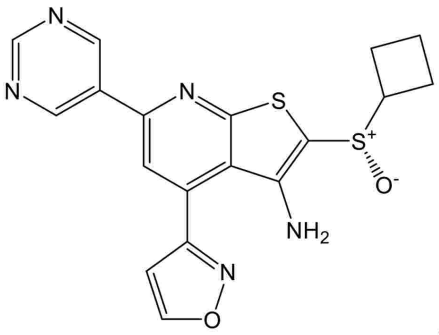

,

,

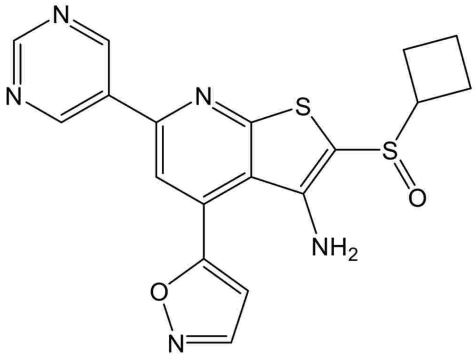
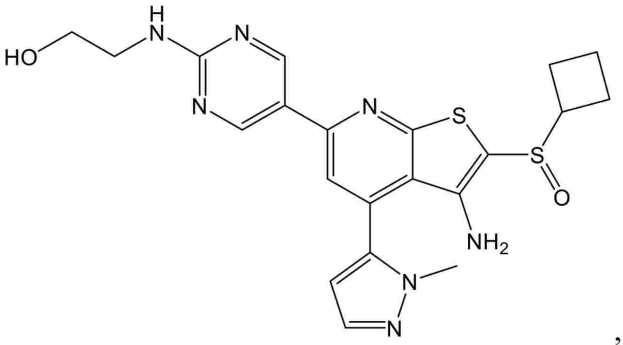

,

,

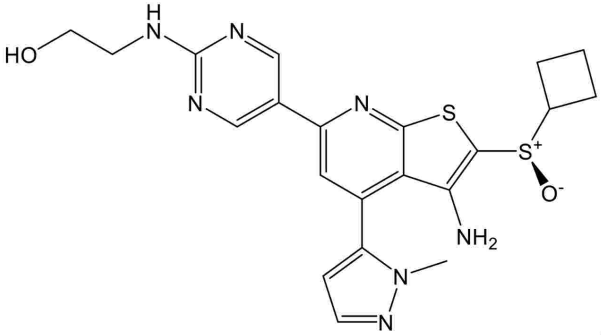
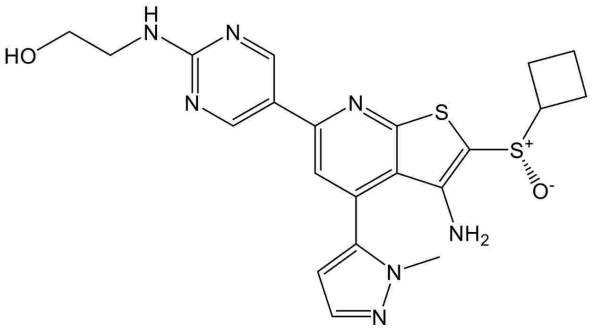

,

,

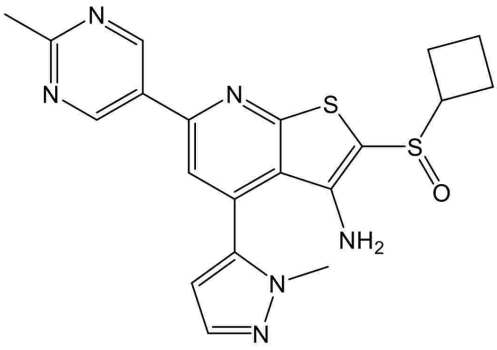
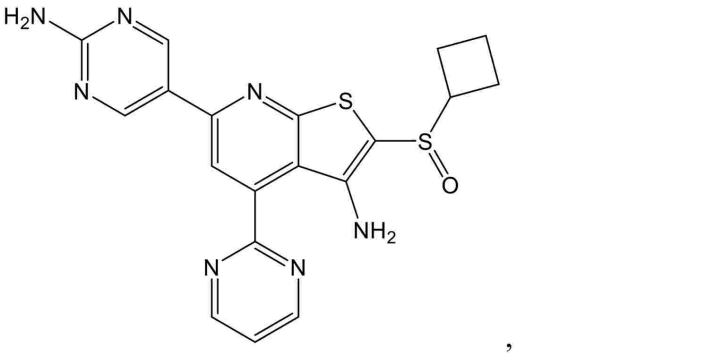
,

,

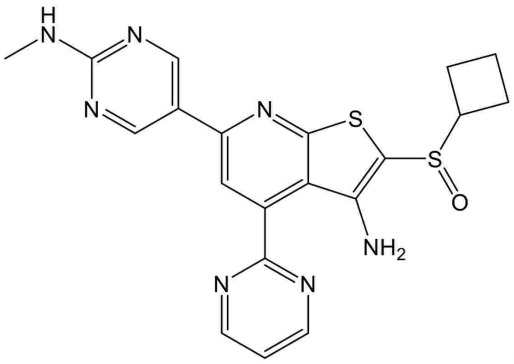
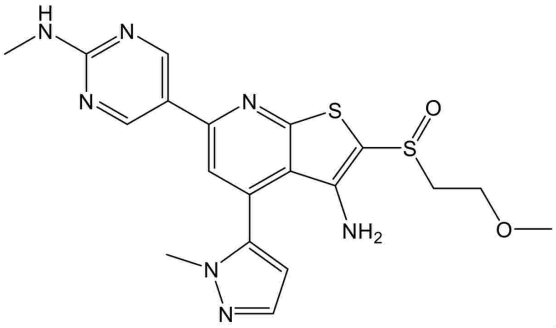
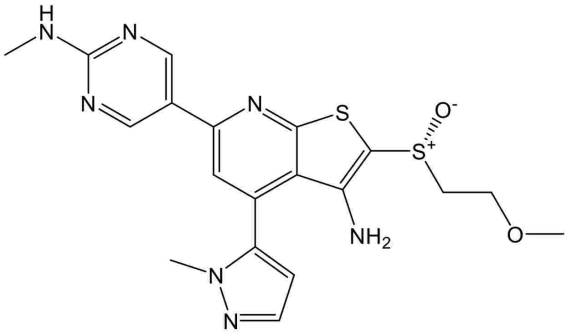
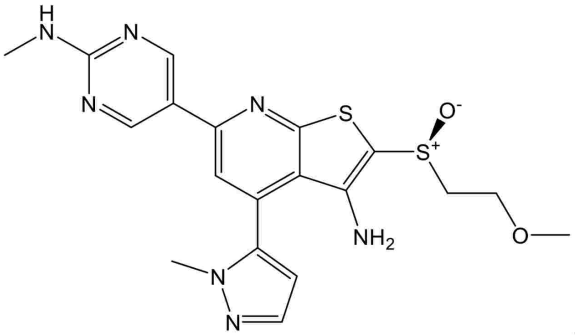
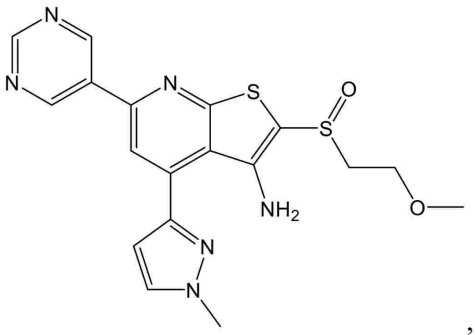
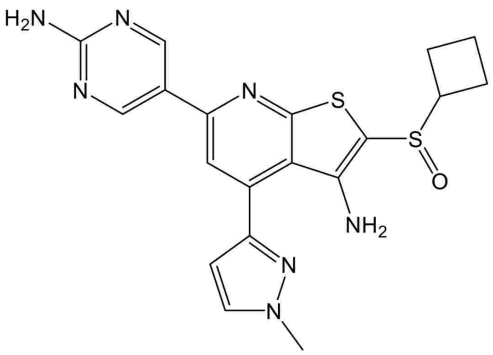
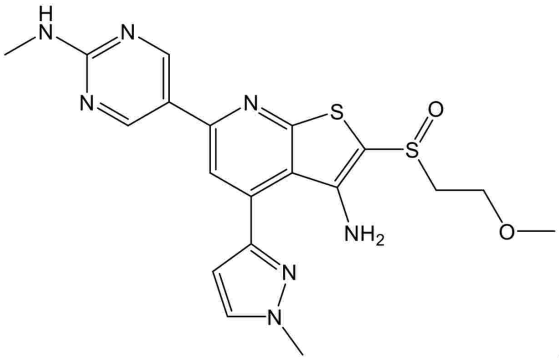
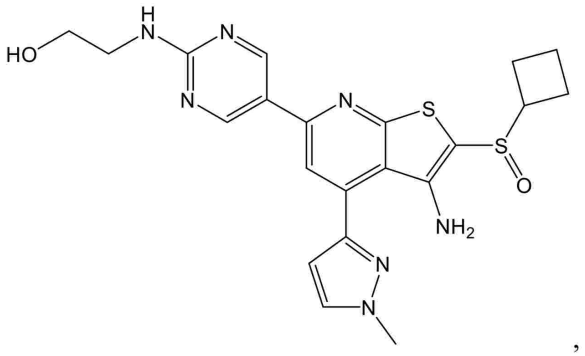

,

,


,

,


,

,


,

,

50


,

,

,

,

,

,

,

,

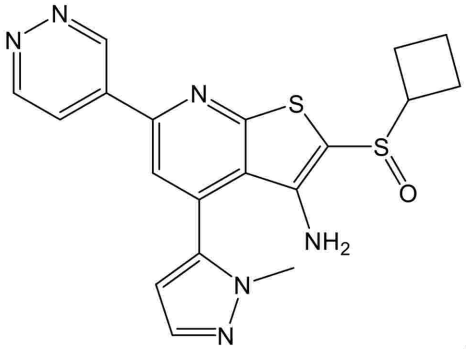
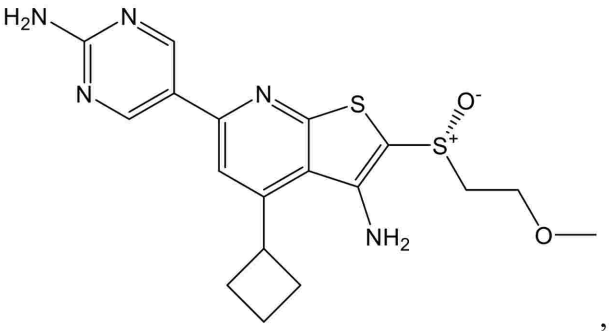
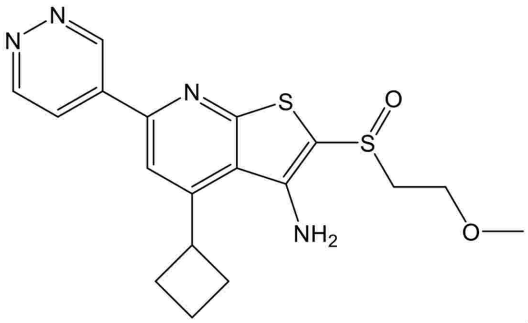
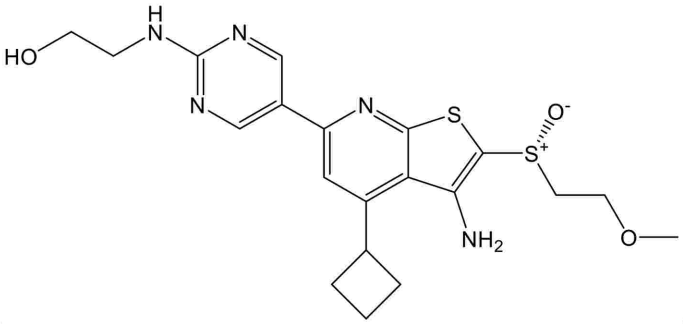
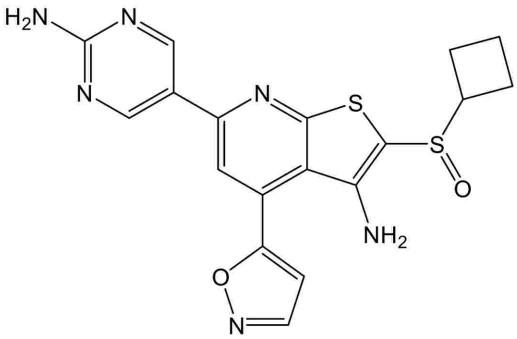
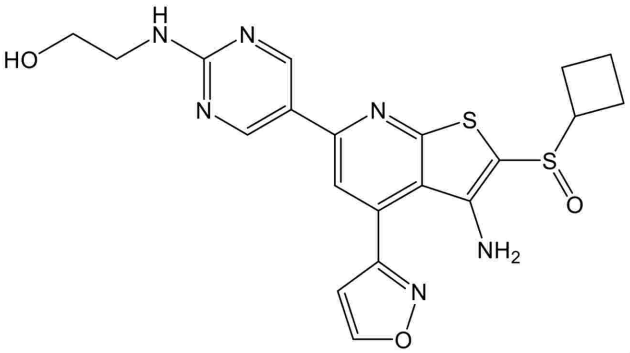
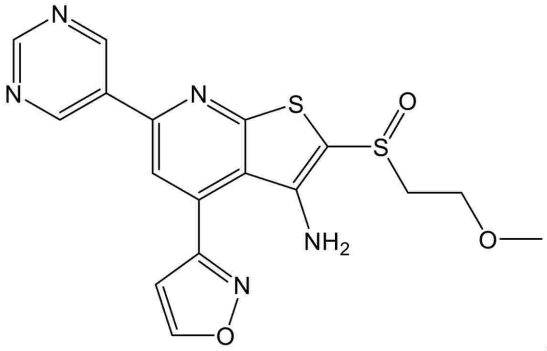
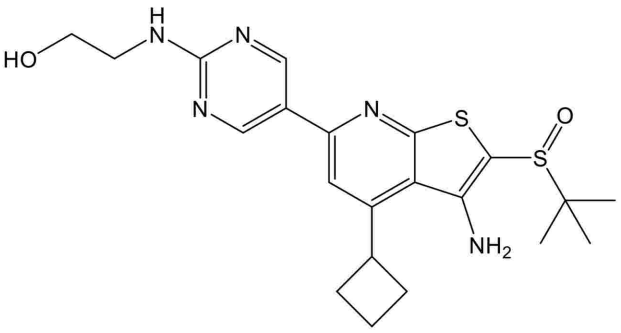
10

20

30

40

50


,

,

,

,

,

,

,

,

,

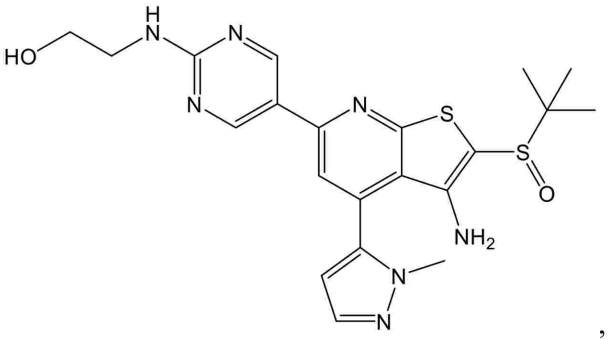
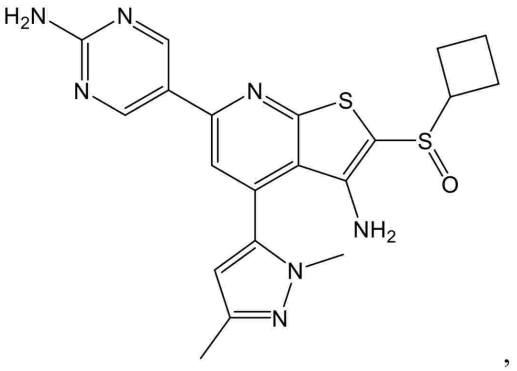
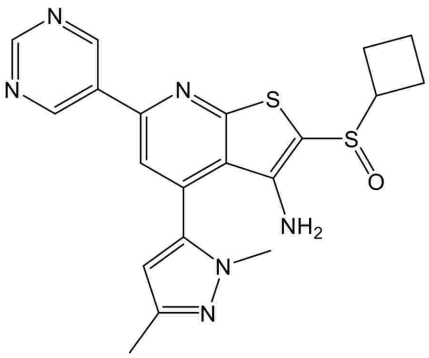
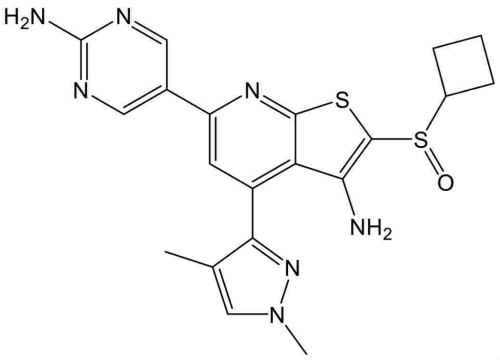
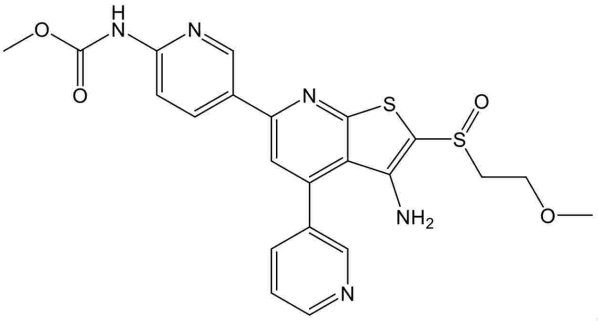
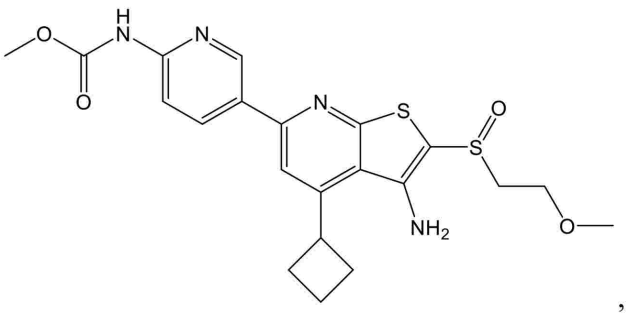
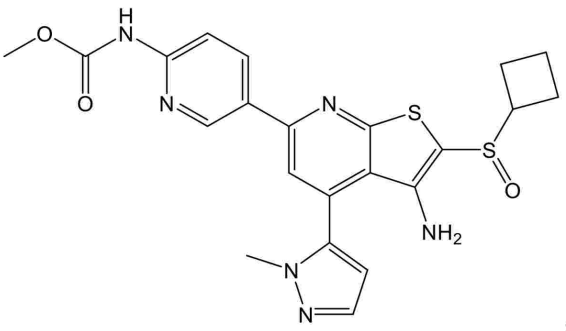
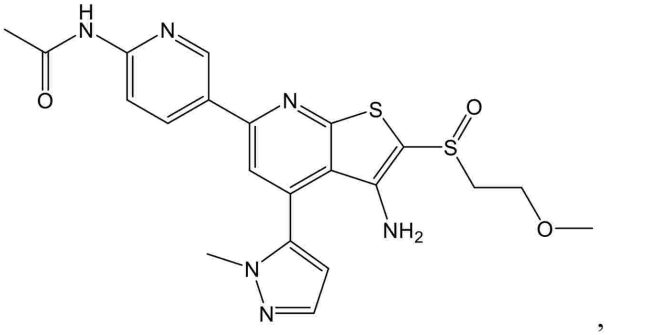
,

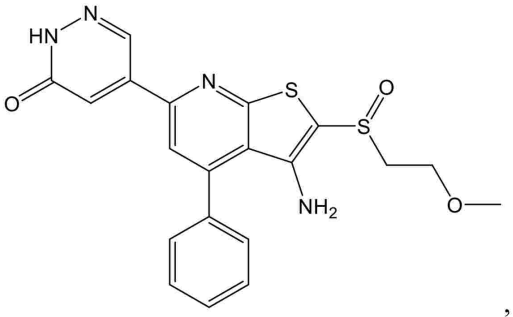
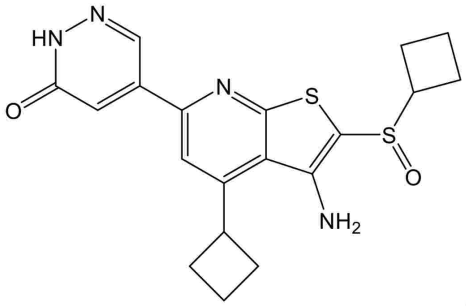
,

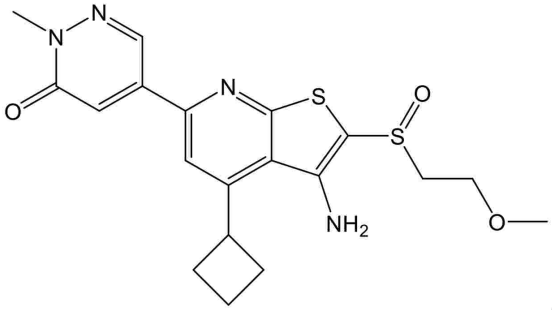
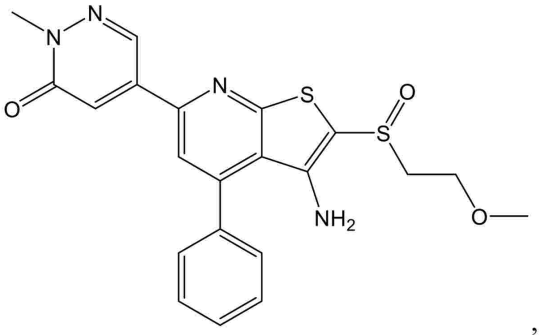
,

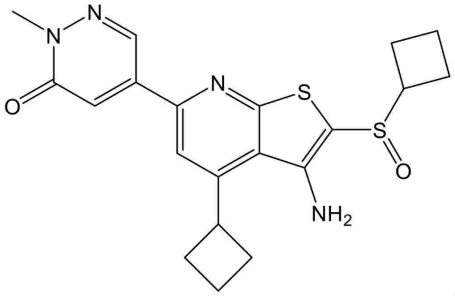
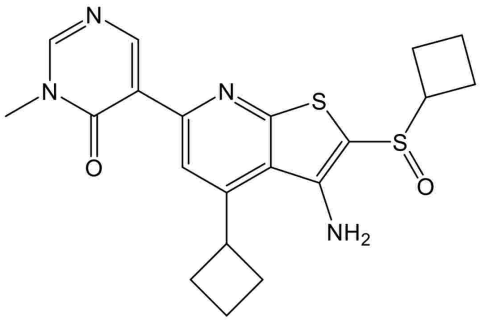
,

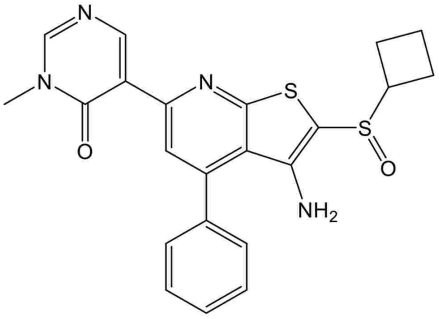
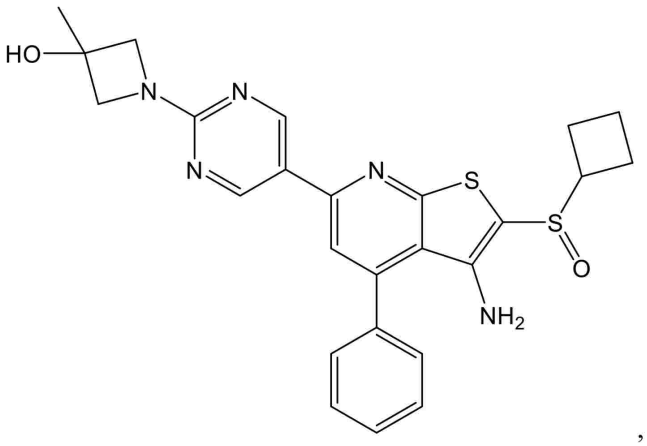
,

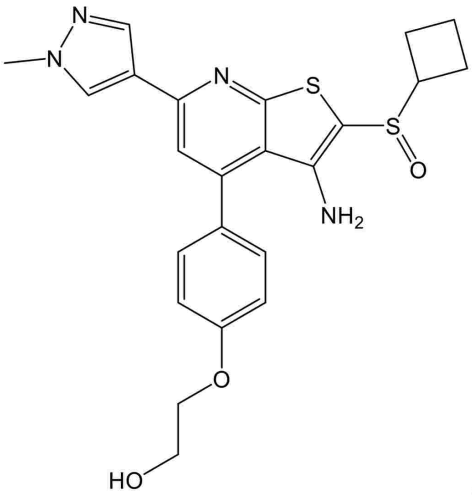
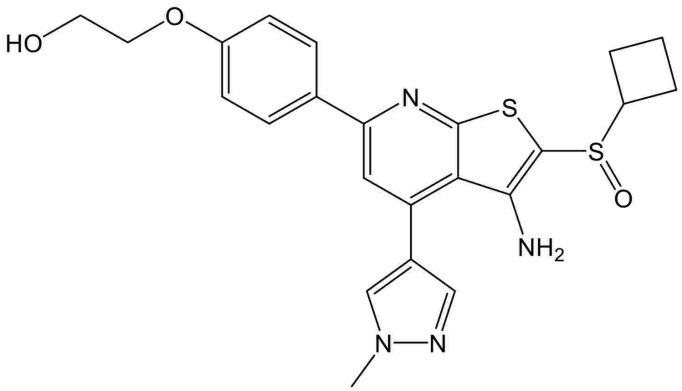
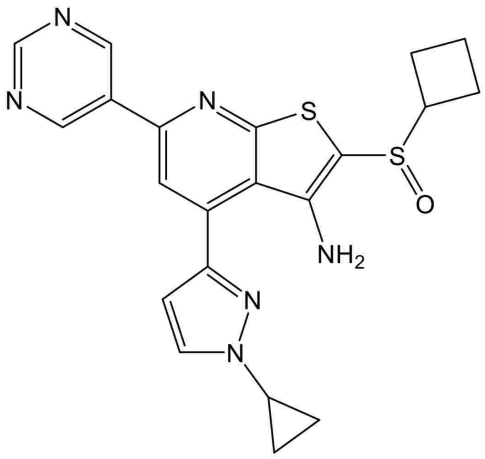
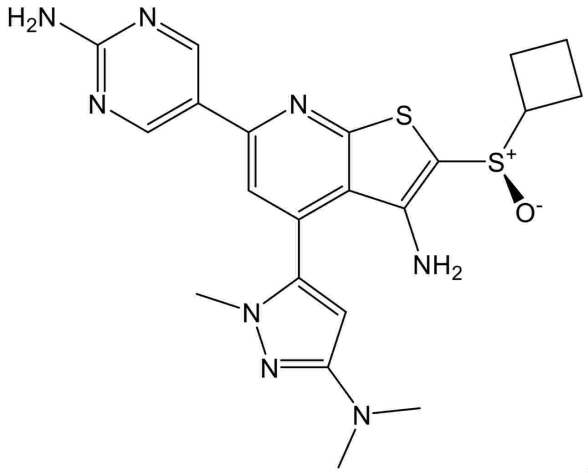
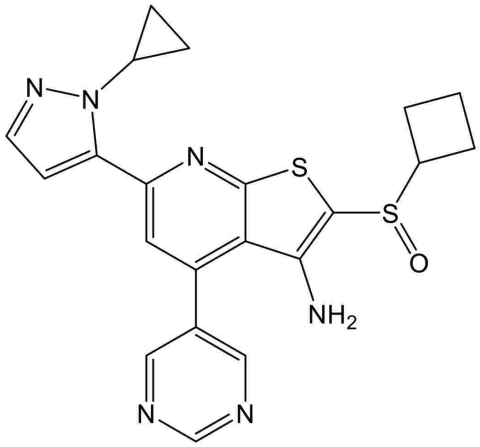
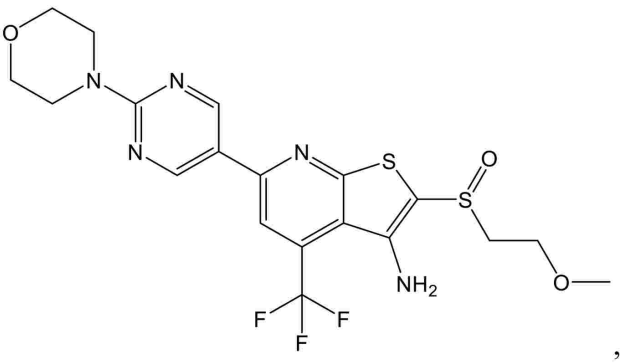

,

,

,

,

,

,

,

,

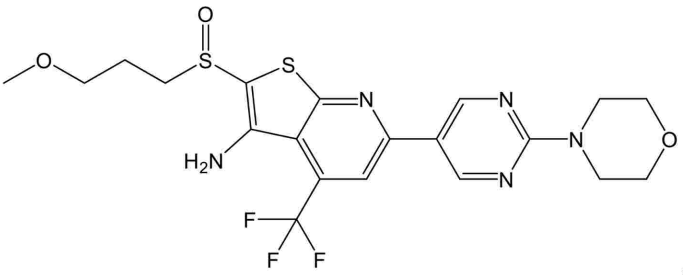
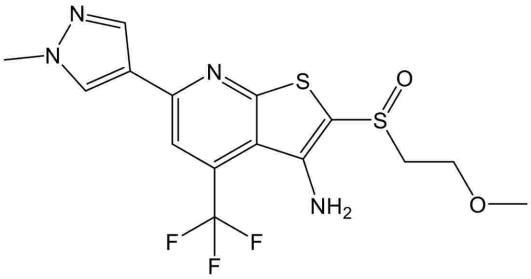
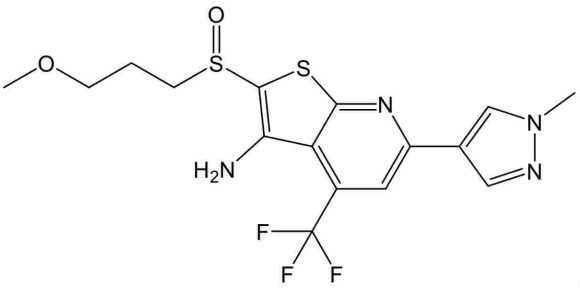
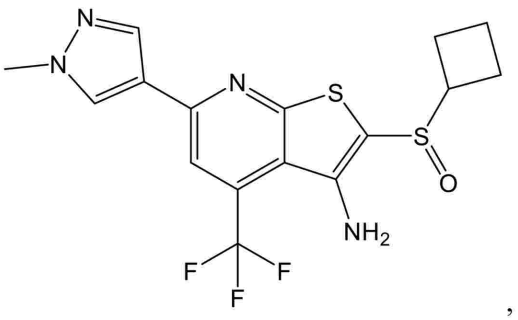
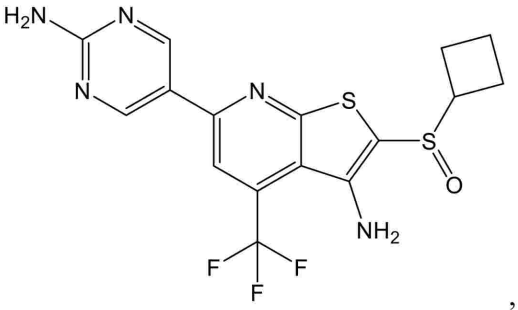
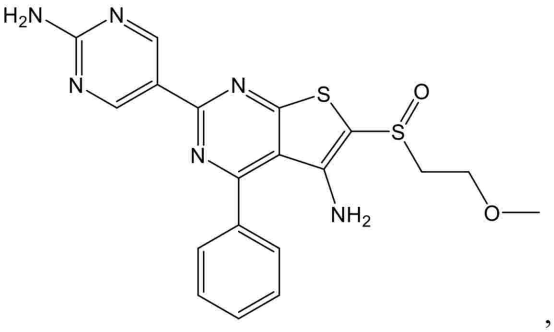
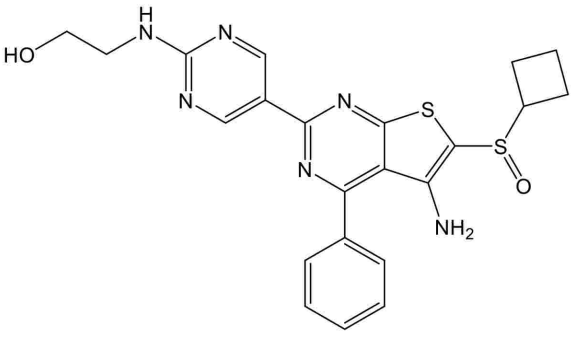
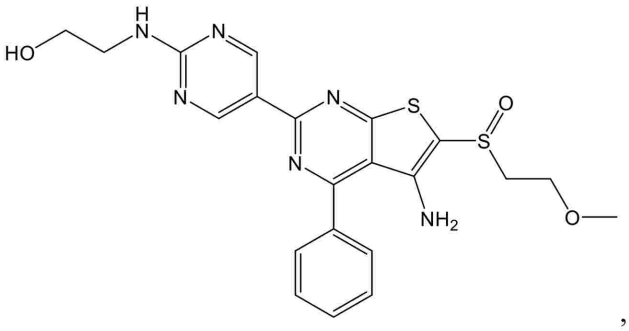

,

,


,

,


,

,


,

,


,

,

,

,

,

,


,

,

,

,

,

,

,

,

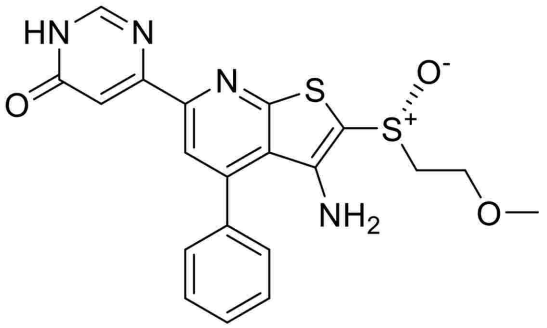
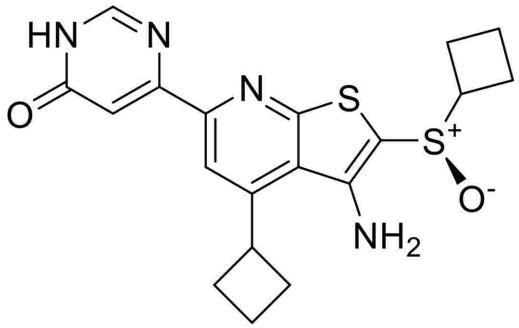
10

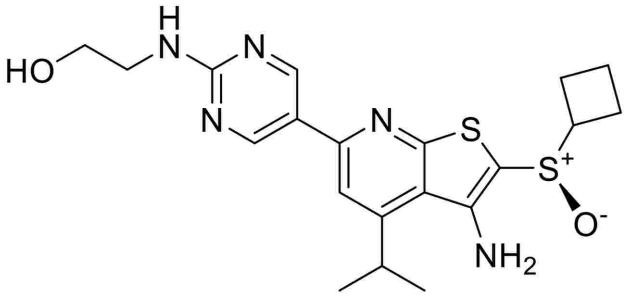
20

30

40

50



，及び



からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物、又はその塩若しくは溶媒和物。
【請求項１６】
請求項１に記載の化合物。
【請求項１７】
請求項１～１６のいずれか一項に記載の化合物又はその塩若しくは溶媒和物と、薬学的に許容される賦形剤又は担体とを含む医薬組成物。
【請求項１８】
炎症性腸疾患を治療する方法に使用するための医薬組成物であって、
前記方法が、前記治療を必要としているヒト対象に、治療有効量の請求項１～１６のいずれか一項に記載の化合物又はその塩若しくは溶媒和物を投与することを含み、
前記医薬組成物が、請求項１～１６のいずれか一項に記載の化合物又はその塩若しくは溶媒和物を含む、医薬組成物。
【請求項１９】
以下の方法：
（ｉ）細胞療法を必要としている対象を治療する方法であって、前記対象に、治療有効量の、ヒト造血幹細胞及び請求項１～１６のいずれか一項に記載の化合物又はその塩若しくは溶媒和物を含む製剤、及び／又は、ヒト造血幹細胞及び請求項１～１６のいずれか一項に記載の化合物又はその塩若しくは溶媒和物を含む治療用組成物を投与することを含む方法；又は
（ｉｉ）虚血組織又は虚血によって損傷を受けた組織に関連する少なくとも１つの症状を有する対象を治療する方法であって、前記対象に、治療有効量の、請求項１～１６のいずれか一項に記載の化合物又はその塩若しくは溶媒和物を含む製剤、及び／又は、ヒト造血幹細胞及び請求項１～１６のいずれか一項に記載の化合物又はその塩若しくは溶媒和物を含む治療用組成物を投与することを含む方法；又は
（ｉｉｉ）好中球の増加を、それを必要としている対象において行う方法であって、前記対象に、請求項１～１６のいずれか一項に記載の化合物又はその塩若しくは溶媒和物を投与することを含む方法；又は
（ｉｖ）末梢血造血幹細胞の数の増加及び／又は末梢血造血幹細胞の動員を、それを必要としている対象において行う方法であって、前記対象に、請求項１～１６のいずれか一項に記載の化合物又はその塩若しくは溶媒和物を投与することを含む方法；又は

（ｖ）血液又は骨髄中の造血幹細胞の数を増加させる方法であって、対象の血液又は骨髄に、請求項１～１６のいずれか一項に記載の化合物又はその塩若しくは溶媒和物を投与することを含む方法；又は
（ｖｉ）線維性疾患、障害又は病態の治療及び／又は予防を、それを必要としている対象において行う方法であって、前記対象に、治療有効量の、請求項１～１６のいずれか一項に記載の化合物又はその塩若しくは溶媒和物を投与することを含む方法；又は
（ｖｉｉ）腸障害、胃腸障害又は腸障害の治療を、それを必要としている対象において行う方法であって、前記対象に、治療有効量の、請求項１～１６のいずれか一項に記載の化合物又はその塩若しくは溶媒和物を単独で、又はコルチコステロイド及び／若しくは腫瘍壊死因子α（ＴＮＦα）阻害剤と組み合わせて投与することを含む方法；又は
（ｖｉｉｉ）腸障害、胃腸障害又は腸障害の治療を、それを必要としている対象において行う方法であって、前記対象に、治療有効量の、請求項１～１６のいずれか一項に記載の化合物又はその塩若しくは溶媒和物、及びコルチコステロイドを投与することを含む方法；又は
（ｉｘ）炎症の治療及び／又は免疫系の活動の抑制を、それを必要としている対象において行う方法であって、前記対象に、治療有効量の、請求項１～１６のいずれか一項に記載の化合物又はその塩若しくは溶媒和物、及びコルチコステロイドを投与することを含む方法；又は
（ｘ）コルチコステロイド依存性若しくはコルチコイド抵抗性又はコルチコステロイドに対する不応性若しくは不耐性を経験している対象において、グルココルチコイド非感受性を処置するか、コルチコステロイド感受性を回復させるか、グルココルチコイド感受性を増強するか、又は前記グルココルチコイド非感受性を逆転させる方法であって、１つ以上のグルココルチコイド非感受性関連病態を示す前記対象に、請求項１～１６のいずれか一項に記載の化合物又はその塩若しくは溶媒和物とコルチコステロイドとを組み合わせて含む医薬組成物を投与することを含み、前記グルココルチコイド非感受性関連病態が、ステロイドでの治療で、疾患の制御を達成できないか、又は、コルチコステロイドに対して、効果がないか、不耐性若しくは依存性であるか、及びそれらの組み合わせである、免疫－炎症障害／疾患である、方法；
に使用するための医薬組成物であって、
前記医薬組成物が、請求項１～１６のいずれか一項に記載の化合物又はその塩若しくは溶媒和物を含む、医薬組成物。