

【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 3 年 1 月 14 日 (2021.1.14)

【公表番号】特表 2020-506879 (P2020-506879A)

【公表日】令和 2 年 3 月 5 日 (2020.3.5)

【年通号数】公開・登録公報 2020-009

【出願番号】特願 2019-531279 (P2019-531279)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/662 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/52 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 F 9/38 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 413/14 C S P

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D 471/04 1 1 7 Z

C 0 7 D 495/04 1 0 5

A 6 1 K 31/517

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/662

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/52

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	43/00	1 0 7
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	19/08	
A 6 1 P	1/18	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	1/00	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
C 0 7 D	403/12	
C 0 7 F	9/38	C

【手続補正書】

【提出日】令和2年11月27日(2020.11.27)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

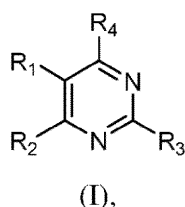
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物：

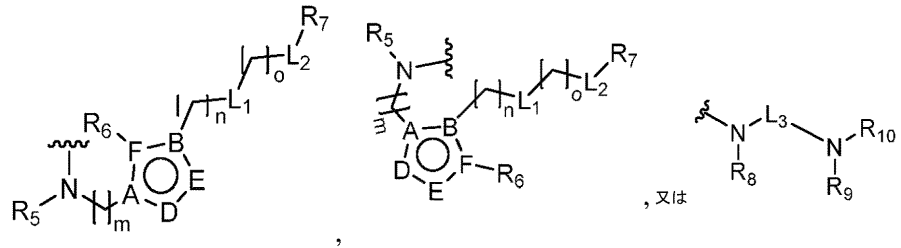
【化 1】



(式中、

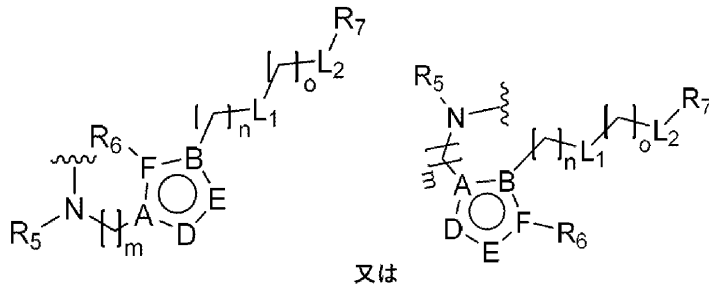
R_1 及び R_2 は各々独立して H、ハロ、 NO_2 、 CN 、 NH_2 、 $\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim 6$ アルコキシル、 $\text{C}_3 \sim 10$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim 10$ ヘテロシクロアルキル、アリール若しくはヘテロアリールであるか、又は R_1 及び R_2 はそれらが結合する 2 つの炭素原子とともに $\text{C}_5 \sim 10$ シクロアルキル、 $\text{C}_3 \sim 10$ ヘテロシクロアルキル、アリール若しくはヘテロアリールであり、 $\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim 6$ アルコキシル、 $\text{C}_3 \sim 10$ シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim 10$ ヘテロシクロアルキル、 $\text{C}_5 \sim 10$ シクロアルキル、 $\text{C}_3 \sim 10$ ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールは各々ハロ、 NO_2 、 CN 、 NH_2 、 $\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim 6$ アルコキシル、アリール、ヘテロアリール又は $\text{C}(\text{O})\text{OR}_a$ で置換されていてもよく、ここで R_a は H、 $\text{C}_1 \sim 10$ アルキル、 $\text{C}_3 \sim 10$ シクロアルキル、 $\text{C}_3 \sim 10$ ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリールであり、 R_3 及び R_4 は各々独立して、

【化 2】



であり、R₃及びR₄の少なくとも1つは

【化 3】



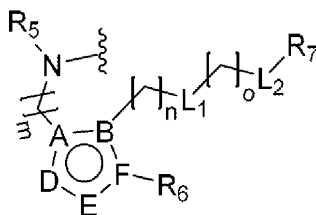
であり、

R₅はH、C₁~₆アルキル、C₃~₁₀シクロアルキル、C₁~₁₀ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール又はヘテロアリールであり、C₁~₆アルキル、C₃~₁₀シクロアルキル、C₁~₁₀ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アリール及びヘテロアリールは各々ハロ、ニトロ、シアノ、アミノ、C₁~₆アルキル、C₁~₆アルコキシル、C₃~₁₀シクロアルキル、C₁~₁₀ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリールで置換されていてもよく、

R₆は欠如、H、C₁~₆アルキル、C₁~₆アルコキシル、C₃~₁₀シクロアルキル、C₁~₁₀ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリールであり、C₁~₆アルキル、C₁~₆アルコキシル、C₃~₁₀シクロアルキル、C₁~₁₀ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールは各々ヒドロキシ、ヒドロキシC₁~₆アルキル、ハロ、ニトロ、シアノ又はアミノで置換されていてもよく、

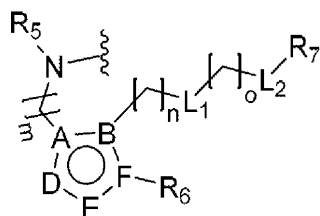
R₇はH、C₁~₆アルキル、C₁~₆アルコキシル、C₃~₁₀シクロアルキル、C₁~₁₀ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリールであり、C₁~₆アルキル、C₁~₆アルコキシル、C₃~₁₀シクロアルキル、C₁~₁₀ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールは各々ヒドロキシ、ヒドロキシC₁~₆アルキル、ハロ、ニトロ、シアノ、アミノ、アミノC₁~₆アルキル、アミノC₃~₁₀シクロアルキル、アミノC₁~₁₀ヘテロシクロアルキル、C₃~₁₀シクロアルキル、C₁~₁₀ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリールで置換されていてもよく、

【化 4】



において、A及びBは各々独立してC又はNであり、

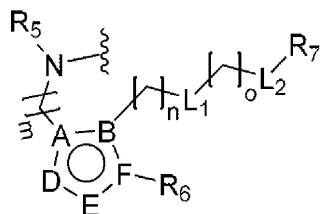
【化 5】



において、D、E 及び F は各々独立して C、N、O 又は S であり、
ここで、

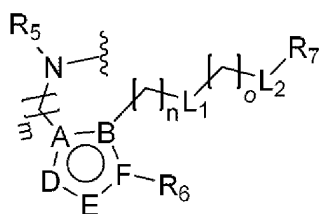
B が C であり、且つ、 R_3 が

【化 6】



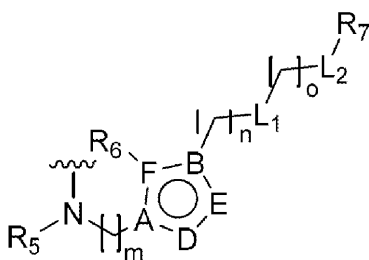
である場合は、D 及び E の少なくとも 1 つは C、O 又は S であり、
B が N であり、且つ、 R_3 が

【化 7】



である場合は、D は N であり、

【化 8】



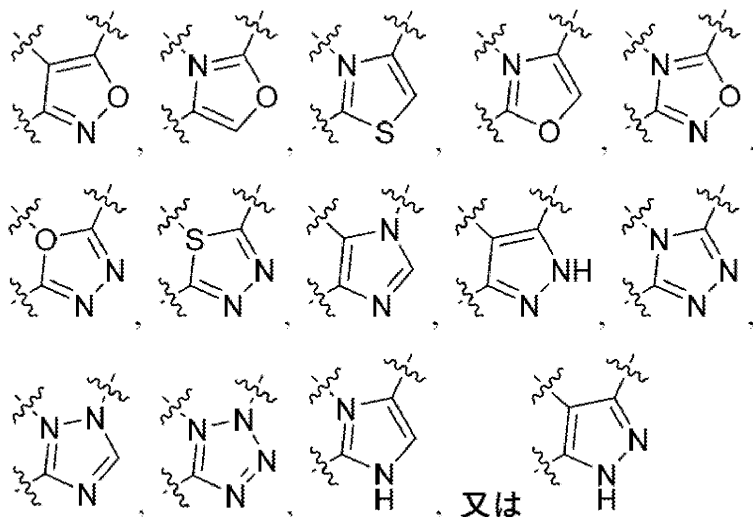
において

【化 9】



が

【化 10】



であり、

L_1 及び L_2 は各々独立してヘテロアリール、 $C_1 \sim 10$ ヘテロシクロアルキル又は NR_d であり、ここで R_d は H 又は $C(O)(CH_2)_2CHNH_2CO_2R_e$ であり、 R_e は H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、 $C_3 \sim 10$ ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリールであり、

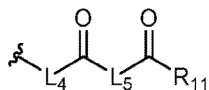
m 、 n 及び o は各々独立して 1、2、3、4、5 又は 6 であり、

R_8 及び R_9 は各々独立して H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、 $C_1 \sim 10$ ヘテロシクロアルキル、アリール若しくはヘテロアリールであり、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、 $C_1 \sim 10$ ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールは各々 $C(O)OR_f$ で置換されていてもよく、ここで R_f は H、 $C_1 \sim 10$ アルキル、 $C_3 \sim 20$ シクロアルキル、 $C_3 \sim 20$ ヘテロシクロアルキル、アリール若しくはヘテロアリールであるか、又は R_8 及び R_9 はそれらが結合する窒素原子とともに $C_3 \sim 10$ ヘテロシクロアルキルであり、

L_3 は $C_1 \sim 6$ アルキルであるか、又は L_3 は R_8 若しくは R_9 及びそれらが結合する窒素原子とともに $C_4 \sim 10$ ヘテロシクロアルキル若しくはヘテロアリールであり、

R_{10} は H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシル、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、 $C_1 \sim 10$ ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール又は、

【化 11】



であり、ここで L_4 は欠如又は $C_1 \sim 6$ アルキルアミノであり、 L_5 は $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルキルアミノ又はジ- $C_1 \sim 6$ アルキルアミノであり、 R_{11} はヒドロキシル又は $C_1 \sim 6$ アルキルアミノであり、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ アルコキシル、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、 $C_1 \sim 10$ ヘテロシクロアルキル、 $C_1 \sim 6$ アルキルアミノ、ジ- $C_1 \sim 6$ アルキルアミノ、アリール及びヘテロアリールは各々ヒドロキシル、アミノ、 $C(O)OR_{12}$ 又は $P(O)(OR_{13})_2$ で置換されていてもよく、ここで R_{12} 及び R_{13} は各々独立して H 又は $C_1 \sim 6$ アルキルである)。

【請求項 2】

R_1 及び R_2 が各々独立して H 又は $C_1 \sim 6$ アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

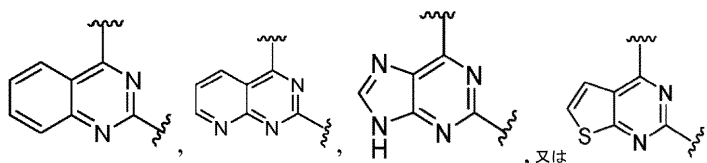
【請求項 3】

R_1 及び R_2 が各々独立して H、 NH_2 、又は $C_1 \sim 6$ アルキル若しくは $C(O)OR_a$ で置換されていてもよい $C_1 \sim 10$ ヘテロシクロアルキルであり、ここで R_a は H 又は $C_1 \sim 10$ アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

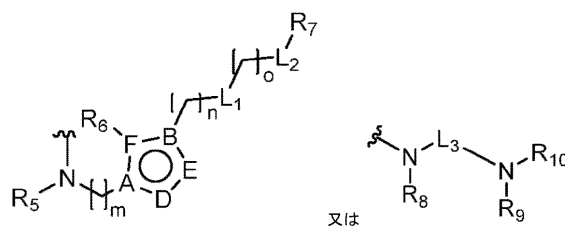
【請求項 5】

【化 1 2】



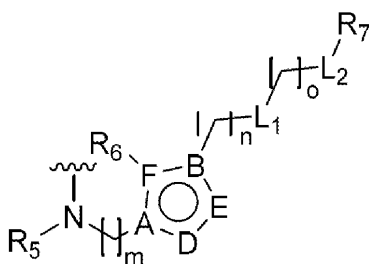
【請求項 6】

【化 1 3】



【請求項7】

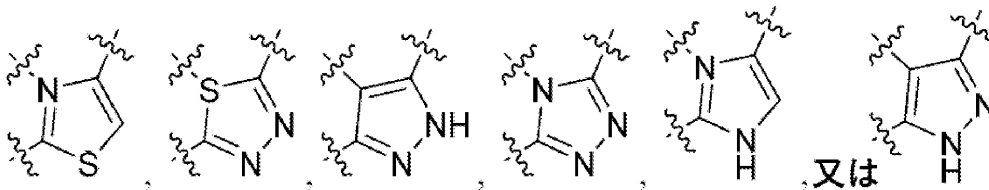
【化 1 4】



【化 1 5】



【化 1 6】



【請求項 8】

【請求項 9】

R₁がHであり、R₂がC₁~₆アルキルである、請求項8に記載の化合物。

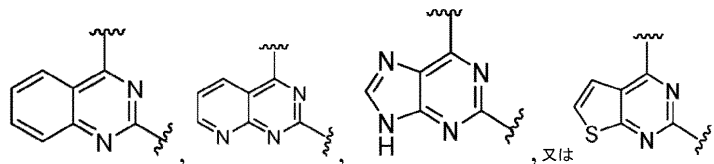
【請求項 10】

R_1 及び R_2 が、それらが結合する 2 つの炭素原子とともにアリール又はヘテロアリールである、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 11】

R_1 及び R_2 が、それらが結合する 2 つの炭素原子とともに、

【化 17】

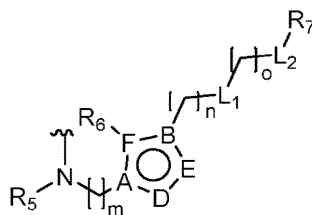


である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

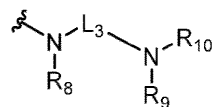
R_3 が、

【化 18】



であり、 R_4 が、

【化 19】



であり、ここで R_5 は H であり、 R_6 は欠如し、 m 、 n 及び o は各々独立して 1、2、3 又は 4 であり、 L_1 及び L_2 は各々 NR_d である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 13】

R_1 及び R_2 が各々独立して H 又は $C_1 \sim 6$ アルキルである、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 14】

R_1 が H であり、 R_2 が $C_1 \sim 6$ アルキルである、請求項 13 に記載の化合物。

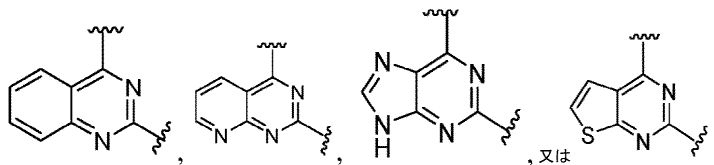
【請求項 15】

R_1 及び R_2 が、それらが結合する 2 つの炭素原子とともにアリール又はヘテロアリールである、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 16】

R_1 及び R_2 が、それらが結合する 2 つの炭素原子とともに、

【化 20】

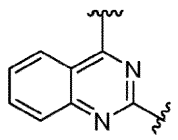


である、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 17】

R_1 及び R_2 が、それらが結合する 2 つの炭素原子とともに、

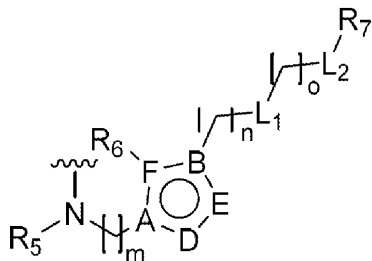
【化 2 1】



である、請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 18】

【化 2 2】



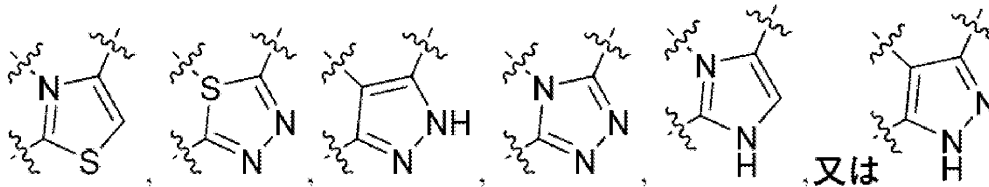
において

【化 2 3】



が

【化 2 4】



である、請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 19】

L_3 が R_8 又は R_9 及びそれらが結合する窒素原子とともに $C_4 \sim 10$ ヘテロシクロアルキルである、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 20】

R_8 が H であり、 L_3 が R_9 及びそれらが結合する窒素原子とともに $C_4 \sim 10$ ヘテロシクロアルキルである、請求項 19 に記載の化合物。

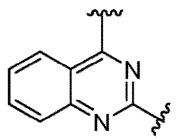
【請求項 21】

R_1 が H であり、 R_2 が $C_1 \sim 6$ アルキルである、請求項 20 に記載の化合物。

【請求項 22】

R_1 及び R_2 が、それらが結合する 2 つの炭素原子とともに、

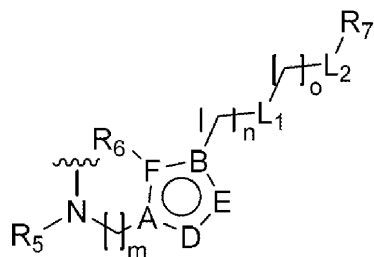
【化 2 5】



である、請求項 20 に記載の化合物。

【請求項 23】

【化 2 6】



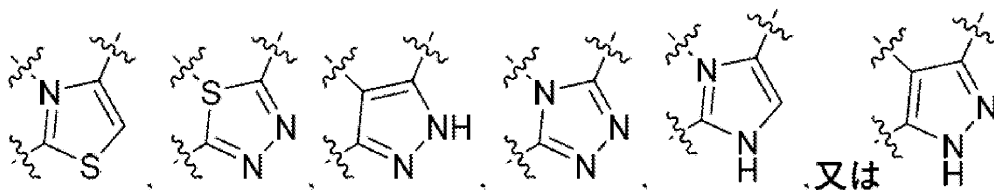
において

【化 2 7】



が

【化 2 8】

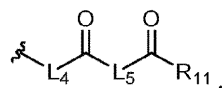


である、請求項 2 2 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

R₁₀ が H 又は

【化 2 9】

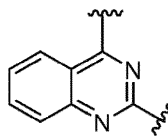


である、請求項 2 0 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

R₁ が H であり、且つ、R₂ が C₁ ~ 6 アルキルであるか、又は
R₁ 及び R₂ が、それらが結合する 2 つの炭素原子とともに、

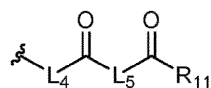
【化 3 0】



であり、

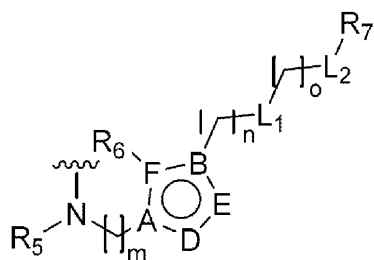
R₁₀ が、

【化 3 1】



であり、

【化 3 2】



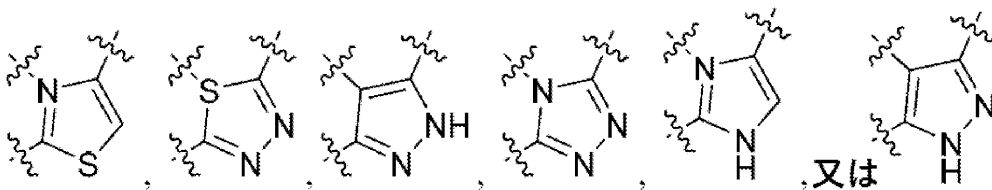
において

【化 3 3】



が

【化 3 4】

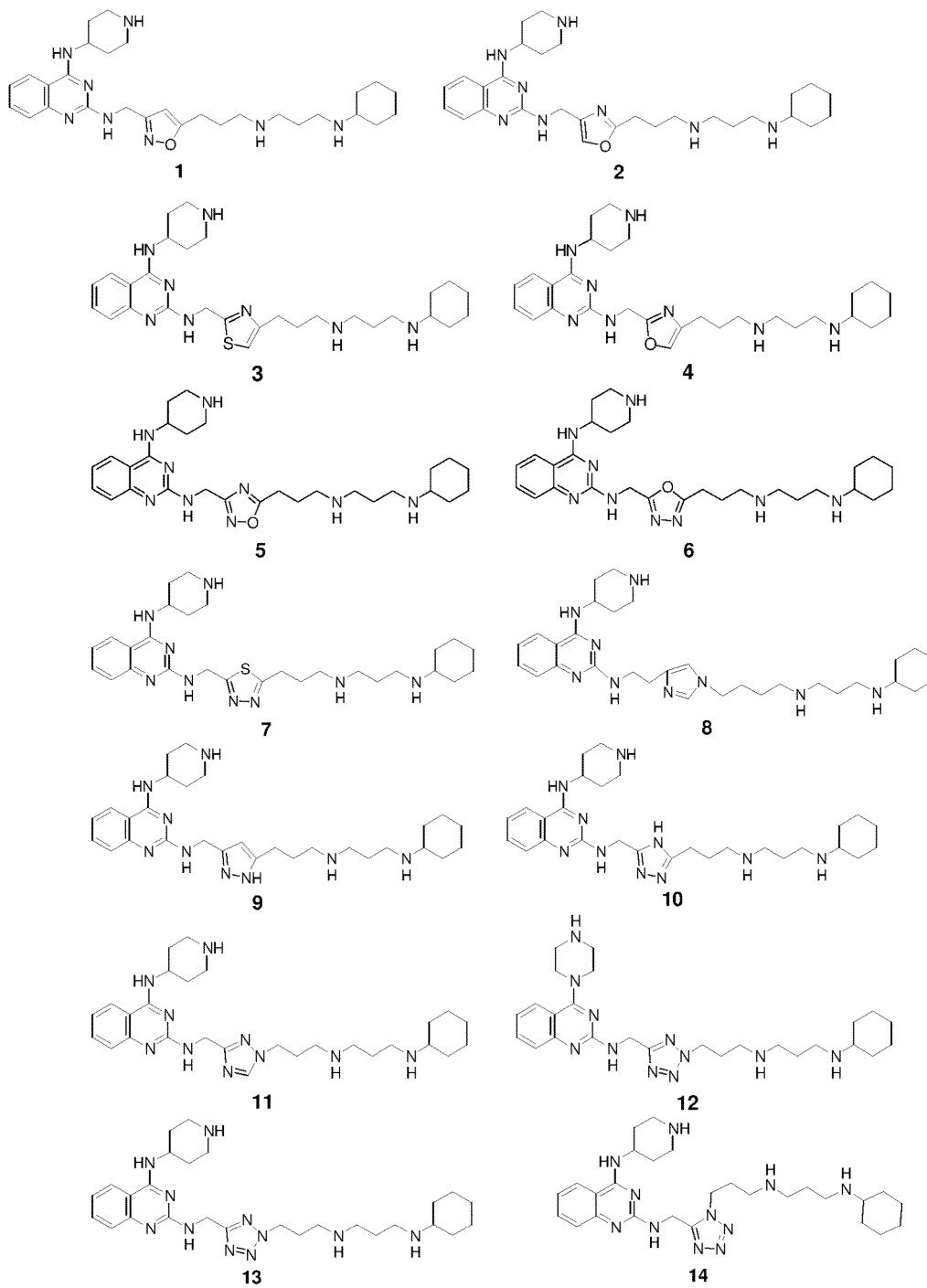


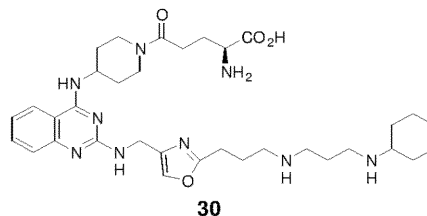
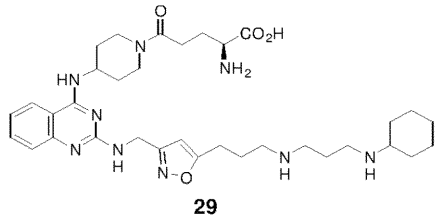
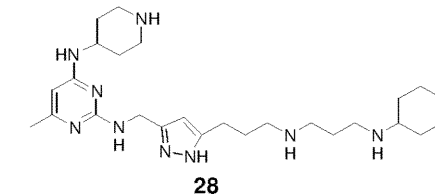
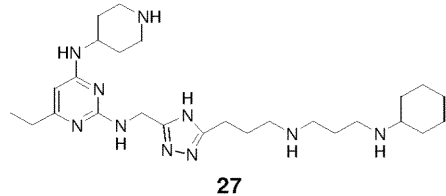
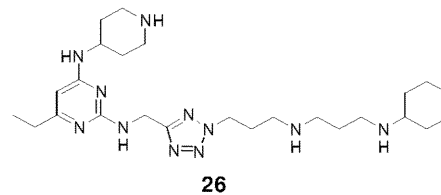
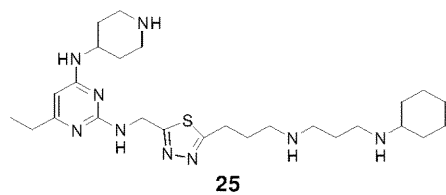
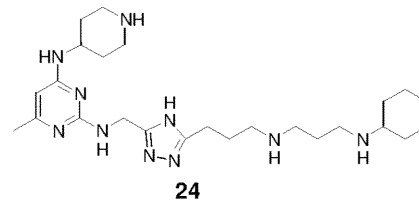
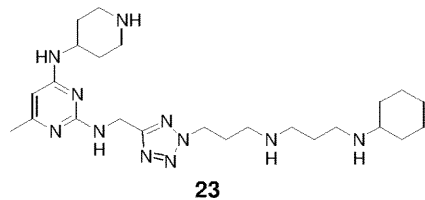
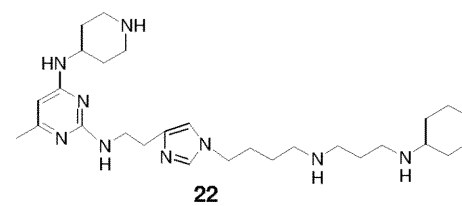
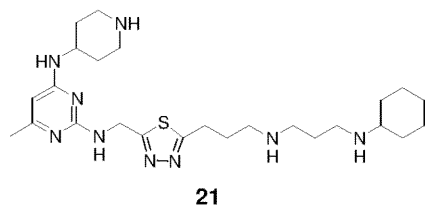
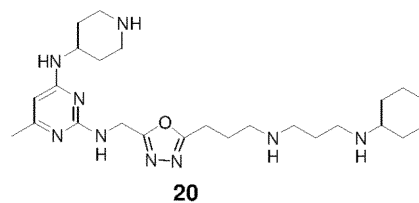
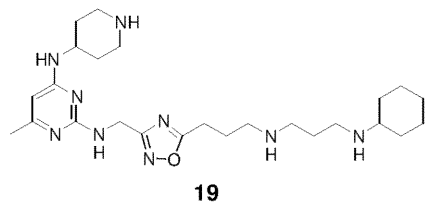
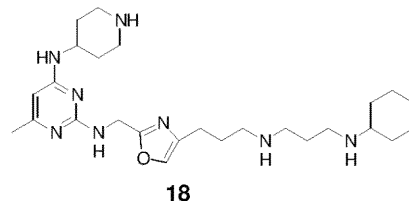
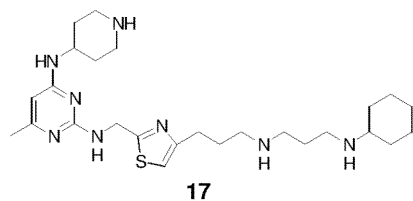
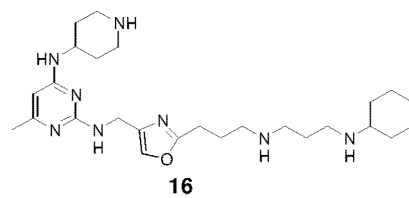
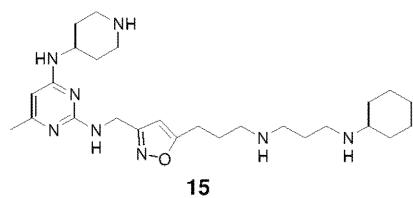
である、請求項 2 4 に記載の化合物。

【請求項 2 6】

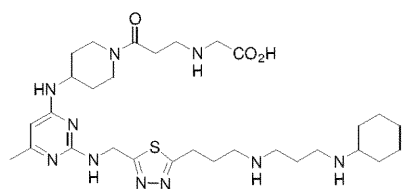
以下の化合物の 1 つである、請求項 1 に記載の化合物：

【化 3 5】

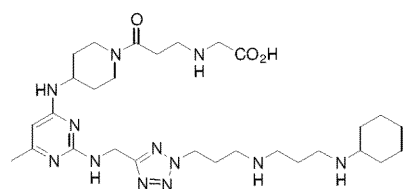




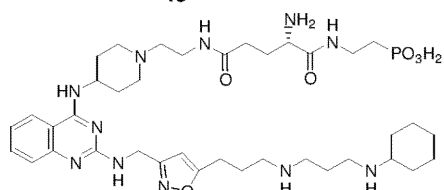




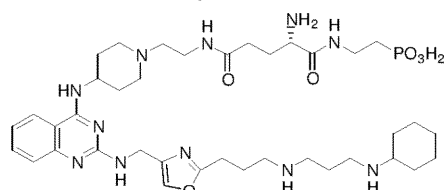
45



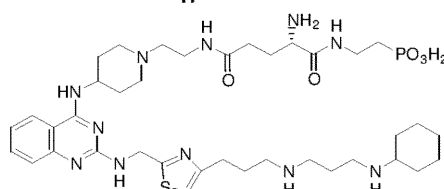
46



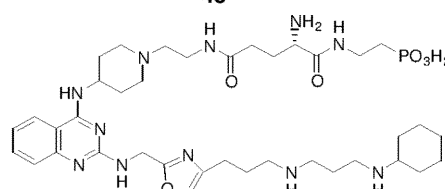
47



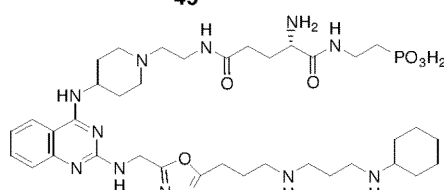
48



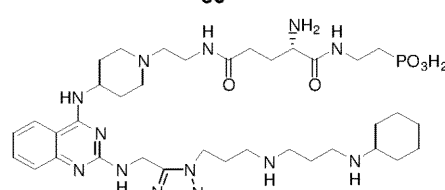
49



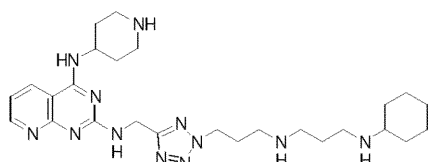
50



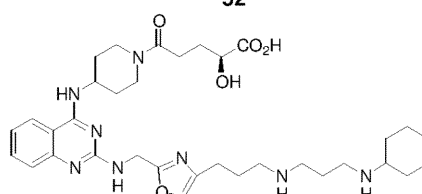
51



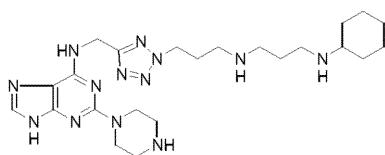
52



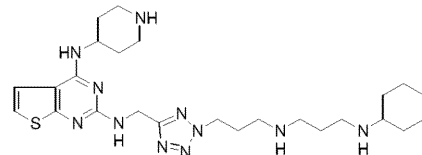
53



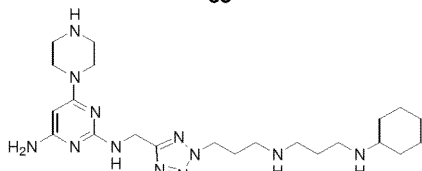
54



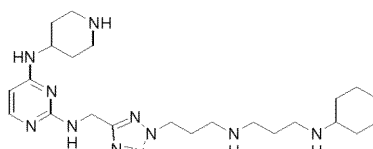
55



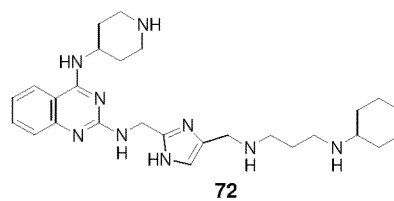
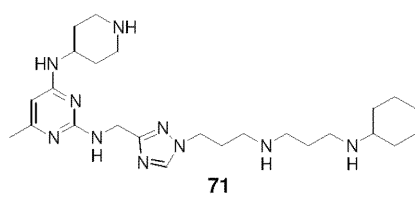
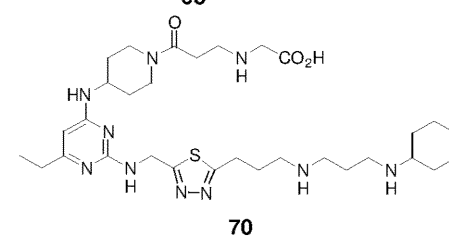
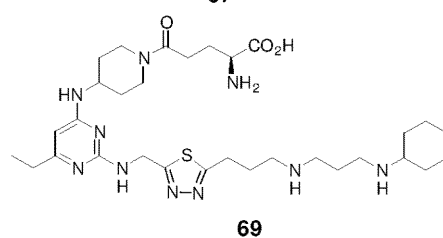
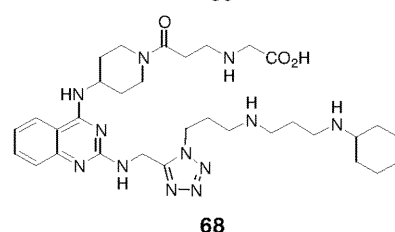
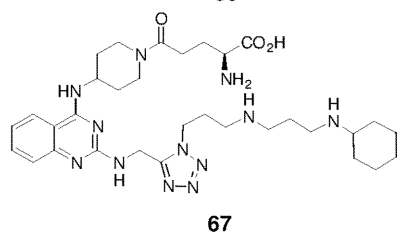
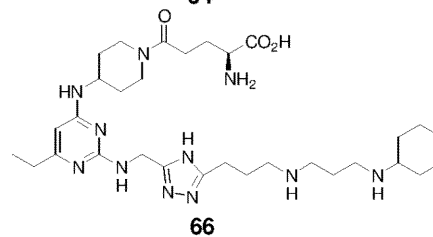
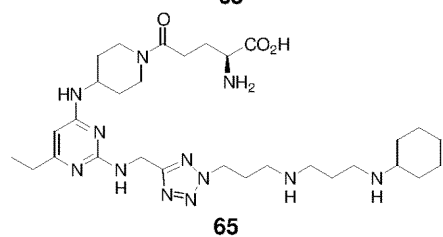
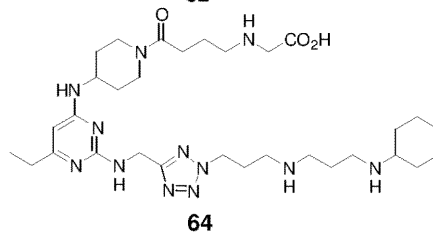
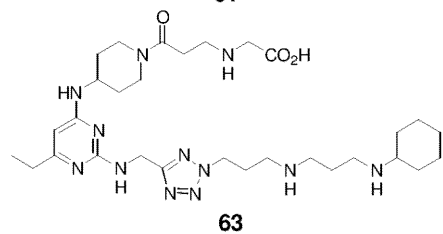
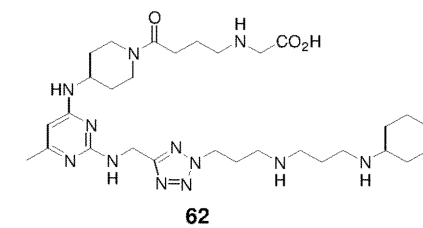
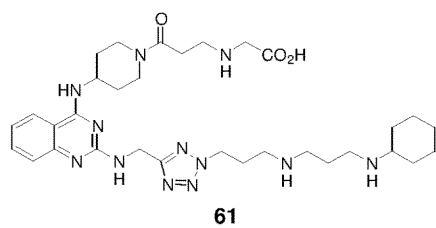
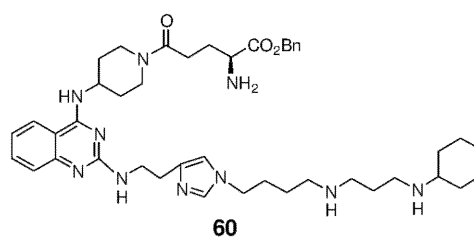
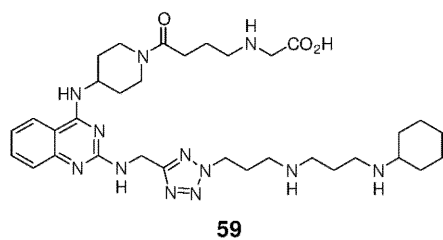
56

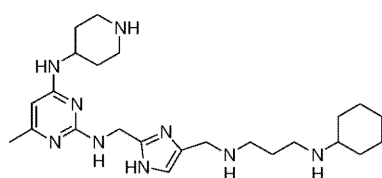


57

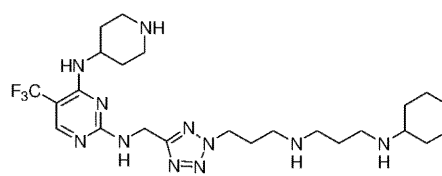


58

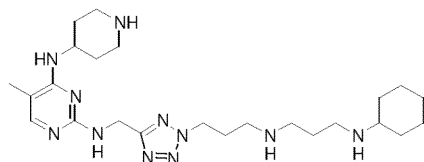




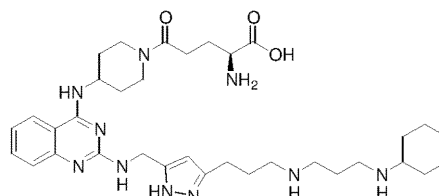
73



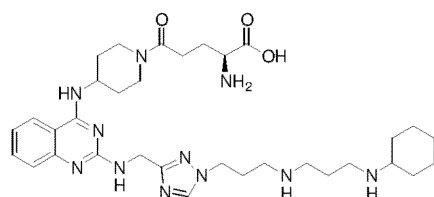
74



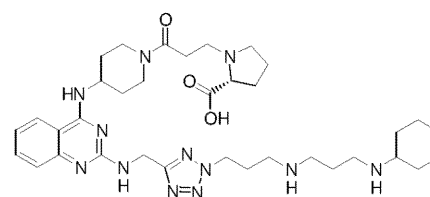
75



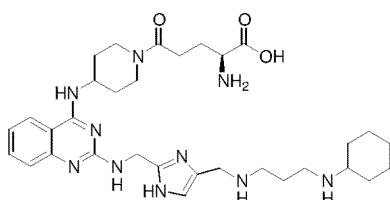
76



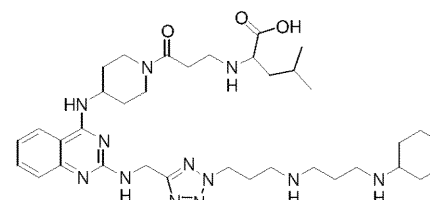
77



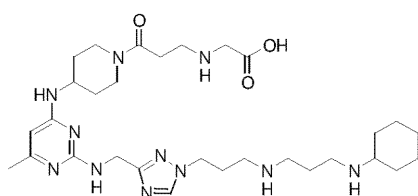
78



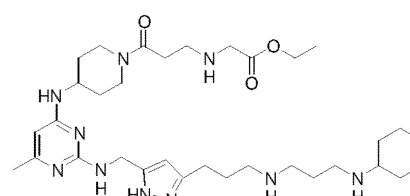
79



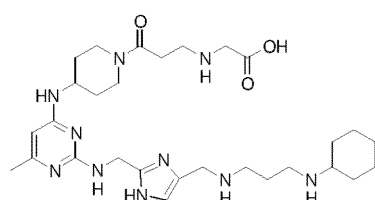
80



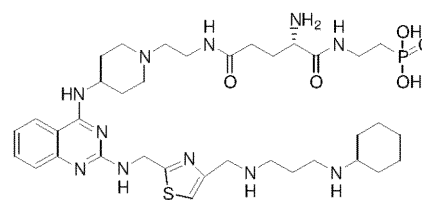
81



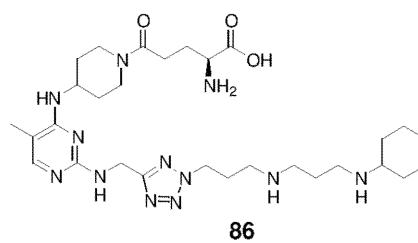
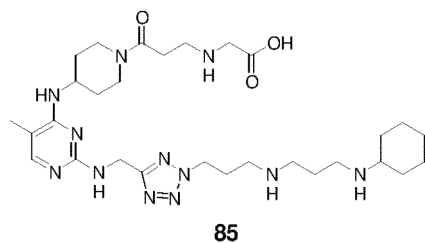
82



83



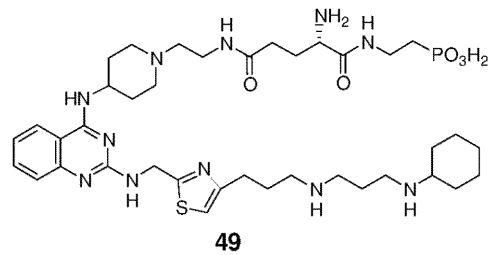
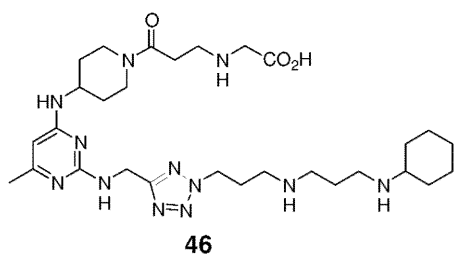
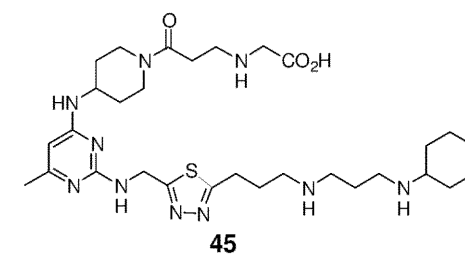
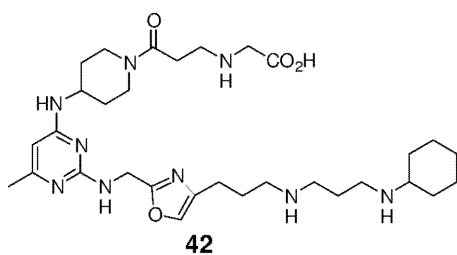
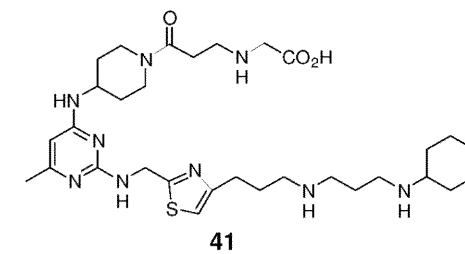
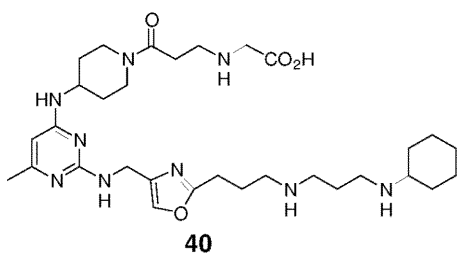
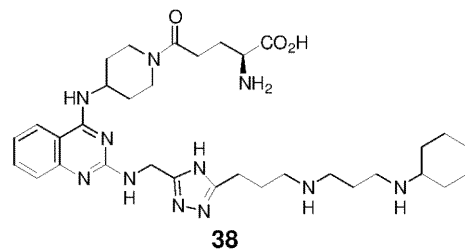
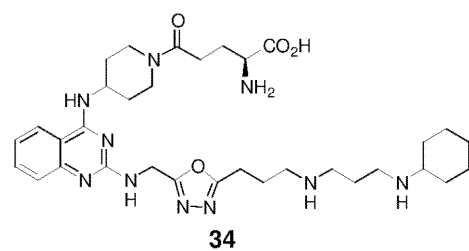
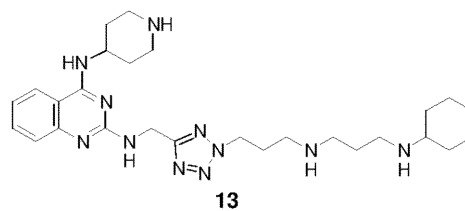
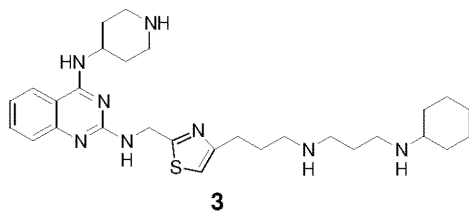
84



【請求項 27】

以下の化合物の 1 つである、請求項 1 に記載の化合物：

【化 36】





63

請求項 1 に記載の化合物と、その薬学的に許容可能な担体とを含む医薬組成物。

造血幹細胞（HSC）及び内皮前駆細胞（EPC）を末梢循環中に動員するための医薬組成物であって、請求項１に記載の化合物を含む、医薬組成物。

肝細胞癌、関節リウマチ、腎損傷、心筋梗塞又は軽度外傷性脳損傷を治療するための医薬組成物であって、請求項 1 に記載の化合物を含む、医薬組成物。

肝細胞癌を治療するための医薬組成物であって、請求項 1 に記載の化合物を含む、医薬組成物。