

【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 07 D 401/14	(2006.01)
C 07 D 413/14	(2006.01)
C 07 D 417/14	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)
C 07 D 495/04	(2006.01)
A 61 K 31/517	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
A 61 K 31/662	(2006.01)
A 61 K 31/519	(2006.01)
A 61 K 31/52	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 37/02	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 27/02	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 17/02	(2006.01)
A 61 P 19/08	(2006.01)
A 61 P 1/18	(2006.01)
A 61 P 13/12	(2006.01)
A 61 P 1/00	(2006.01)
A 61 P 11/00	(2006.01)
A 61 P 35/02	(2006.01)
A 61 P 37/08	(2006.01)
A 61 P 11/06	(2006.01)
A 61 P 19/02	(2006.01)
C 07 D 403/12	(2006.01)
C 07 F 9/38	(2006.01)

【F I】

C 07 D 401/14	
C 07 D 413/14	C S P
C 07 D 417/14	
C 07 D 471/04	1 1 7 Z
C 07 D 495/04	1 0 5
A 61 K 31/517	
A 61 K 31/506	
A 61 K 31/662	
A 61 K 31/519	
A 61 K 31/52	
A 61 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

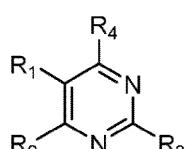
## 【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式(I)の化合物：

## 【化1】



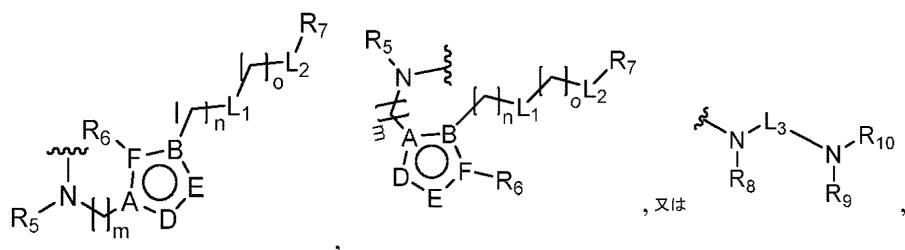
(I),

(式中、

R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>は各々独立してH、ハロ、NO<sub>2</sub>、CN、NH<sub>2</sub>、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>1～6</sub>アルコキシル、C<sub>3～10</sub>シクロアルキル、C<sub>1～10</sub>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<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>はそれらが結合する2つの炭素原子とともにC<sub>5～10</sub>シクロアルキル、C<sub>3～10</sub>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<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>1～6</sub>アルコキシル、C<sub>3～10</sub>シクロアルキル、C<sub>1～10</sub>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<sub>2</sub>、CN、NH<sub>2</sub>、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>1～6</sub>アルコキシル、アリール、ヘテロアリール又はC(O)OR<sub>a</sub>で置換されていてもよく、ここでR<sub>a</sub>はH、C<sub>1～10</sub>アルキル、C<sub>3～10</sub>シクロアルキル、C<sub>3～10</sub>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、

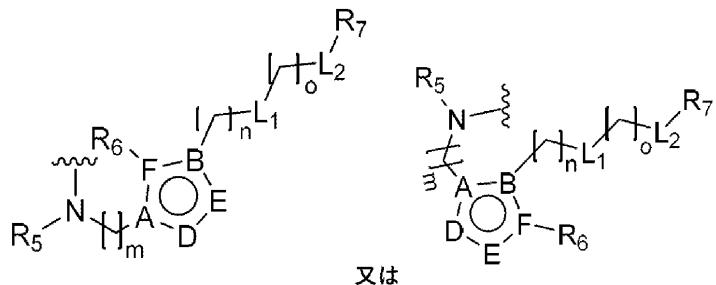
R<sub>3</sub>及びR<sub>4</sub>は各々独立して、

## 【化2】



であり、R<sub>3</sub>及びR<sub>4</sub>の少なくとも1つは

## 【化3】



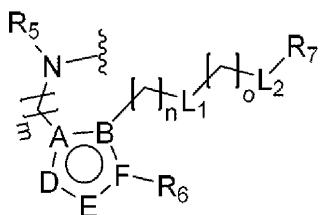
であり、

R<sub>5</sub>はH、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>3～10</sub>シクロアルキル、C<sub>1～10</sub>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、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>3～10</sub>シクロアルキル、C<sub>1～10</sub>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、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>1～6</sub>アルコキシリル、C<sub>3～10</sub>シクロアルキル、C<sub>1～10</sub>ヘテロシクロアルキル、アリールアルキル、アリール又はヘテロアリールで置換されていてもよく、

R<sub>6</sub>は次如、H、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>1～6</sub>アルコキシリル、C<sub>3～10</sub>シクロアルキル、C<sub>1～10</sub>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、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>1～6</sub>アルコキシリル、C<sub>3～10</sub>シクロアルキル、C<sub>1～10</sub>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C<sub>1～6</sub>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、

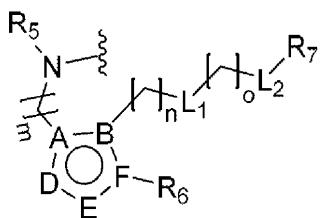
R<sub>7</sub>はH、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>1～6</sub>アルコキシリル、C<sub>3～10</sub>シクロアルキル、C<sub>1～10</sub>ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリールであり、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>1～6</sub>アルコキシリル、C<sub>3～10</sub>シクロアルキル、C<sub>1～10</sub>ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールは各々ヒドロキシ、ヒドロキシC<sub>1～6</sub>アルキル、ハロ、ニトロ、シアノ、アミノ、アミノC<sub>1～6</sub>アルキル、アミノC<sub>3～10</sub>シクロアルキル、アミノC<sub>1～10</sub>ヘテロシクロアルキル、C<sub>3～10</sub>シクロアルキル、C<sub>1～10</sub>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、

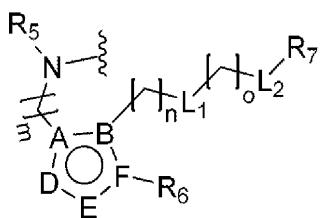
## 【化5】



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、

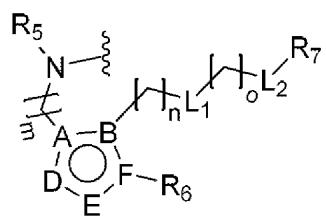
BがCであり、且つ、R<sub>3</sub>が

## 【化6】



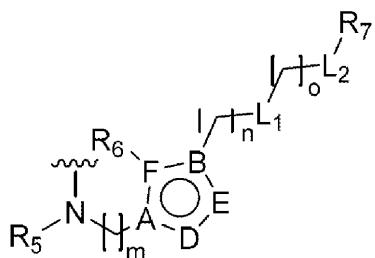
である場合は、D及びEの少なくとも1つはC、O又はSであり、  
BがNであり、且つ、R<sub>3</sub>が

## 【化7】



である場合は、DはNであり、

## 【化8】



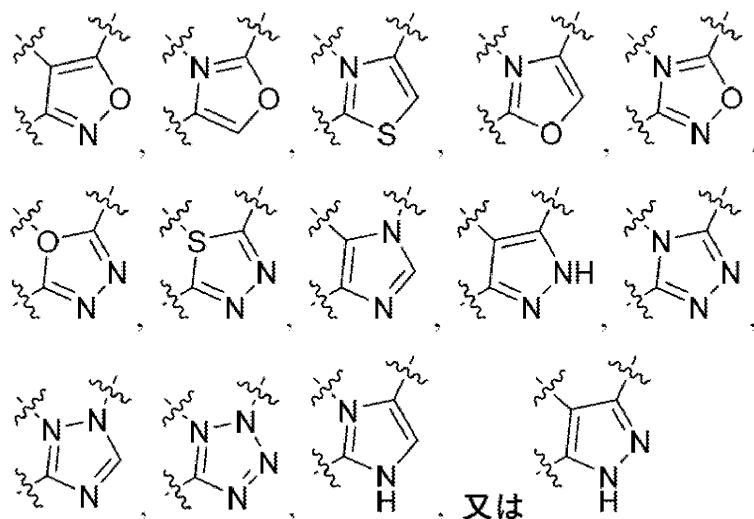
において

## 【化9】



が

## 【化10】



であり、

L<sub>1</sub>及びL<sub>2</sub>は各々独立してヘテロアリール、C<sub>1</sub>～<sub>10</sub>ヘテロシクロアルキル又はN R<sub>d</sub>であり、ここでR<sub>d</sub>はH又はC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>CHNH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>R<sub>e</sub>であり、R<sub>e</sub>はH、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～<sub>10</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～<sub>10</sub>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、

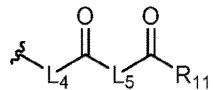
m、n及びoは各々独立して1、2、3、4、5又は6であり、

R<sub>8</sub>及びR<sub>9</sub>は各々独立してH、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～<sub>10</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～<sub>10</sub>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<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～<sub>10</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～<sub>10</sub>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<sub>f</sub>で置換されていてもよく、ここでR<sub>f</sub>はH、C<sub>1</sub>～<sub>10</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～<sub>20</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～<sub>20</sub>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<sub>8</sub>及びR<sub>9</sub>はそれらが結合する窒素原子とともにC<sub>3</sub>～<sub>10</sub>ヘテロシクロアルキルであり、

L<sub>3</sub>はC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルであるか、又はL<sub>3</sub>はR<sub>8</sub>若しくはR<sub>9</sub>及びそれらが結合する窒素原子とともにC<sub>4</sub>～<sub>10</sub>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<sub>10</sub>はH、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルコキシル、C<sub>3</sub>～<sub>10</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～<sub>10</sub>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<sub>4</sub>は欠如又はC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルアミノであり、L<sub>5</sub>はC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルアミノ又はジ-C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルアミノであり、R<sub>11</sub>はヒドロキシル又はC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルアミノであり、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルコキシル、C<sub>3</sub>～<sub>10</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～<sub>10</sub>ヘテロシクロアルキル、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルアミノ、ジ-C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>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<sub>12</sub>又はP(O)(OR<sub>13</sub>)<sub>2</sub>で置換されていてもよく、ここでR<sub>12</sub>及びR<sub>13</sub>は各々独立してH又はC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルである。

## 【請求項2】

R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>が各々独立してH又はC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項3】

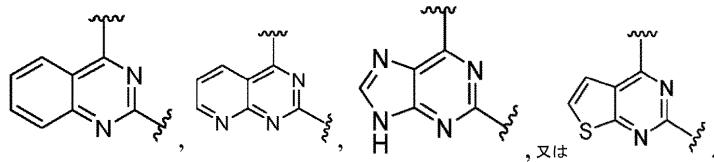
R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>が各々独立してH、NH<sub>2</sub>、又はC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル若しくはC(O)OR<sub>a</sub>でに置換されていてもよいC<sub>1</sub>～<sub>10</sub>ヘテロシクロアルキルであり、ここでR<sub>a</sub>はH又はC<sub>1</sub>～<sub>10</sub>アルキルである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項4】

$R_1$ 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1に記載の化合物。

【請求項5】

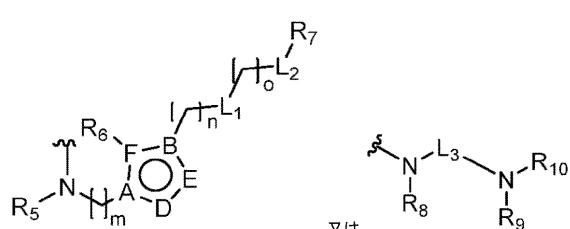
$R_1$ 及び $R_2$ が、それらが結合する2つの炭素原子とともに、  
【化12】



である、請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

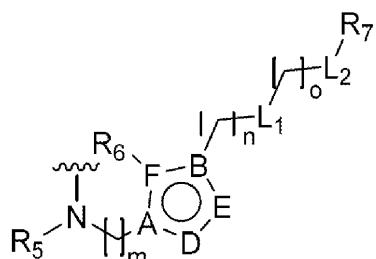
$R_3$ 及び $R_4$ が各々独立して、  
【化13】



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。

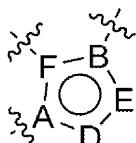
【請求項7】

【化14】



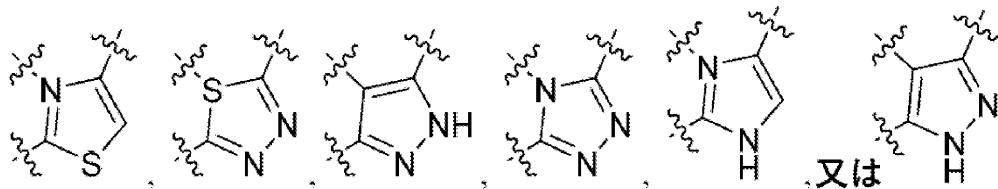
において

【化15】



が

【化16】



である、請求項6に記載の化合物。

【請求項8】

$R_1$ 及び $R_2$ が各々独立してH又は $C_1$ ~ $_6$ アルキルである、請求項6に記載の化合物。

【請求項9】

$R_1$ がHであり、 $R_2$ が $C_1$ ~ $_6$ アルキルである、請求項8に記載の化合物。

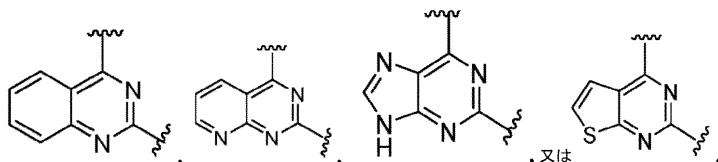
## 【請求項 10】

$R_1$ 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】

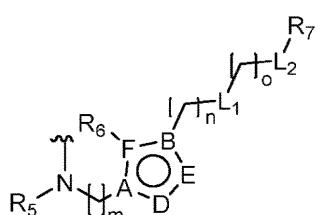


である、請求項10に記載の化合物。

## 【請求項 12】

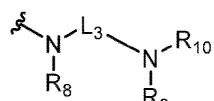
$R_3$ が、

## 【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NRd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C1~6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C1~6アルキルである、請求項13に記載の化合物。

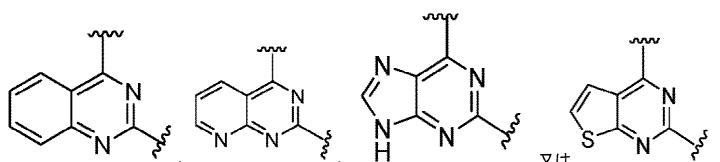
## 【請求項 15】

$R_1$ 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】

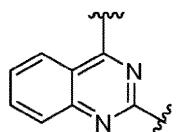


である、請求項15に記載の化合物。

## 【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、

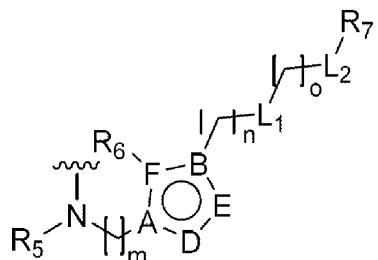
【化21】



である、請求項16に記載の化合物。

【請求項18】

【化22】



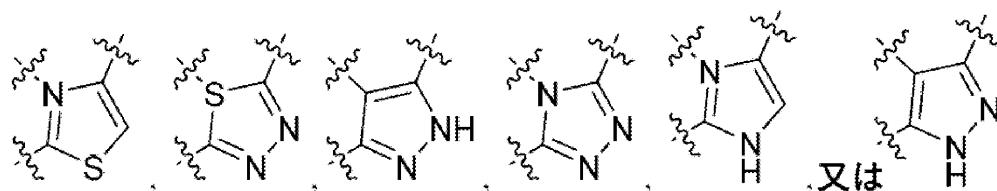
において

【化23】



が

【化24】



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。

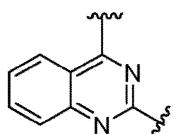
【請求項21】

$R_1$ 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、

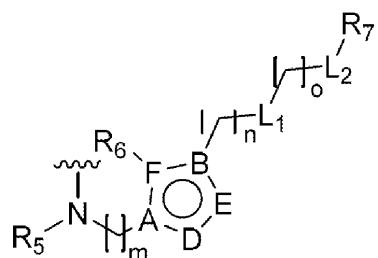
【化25】



である、請求項20に記載の化合物。

【請求項23】

【化26】



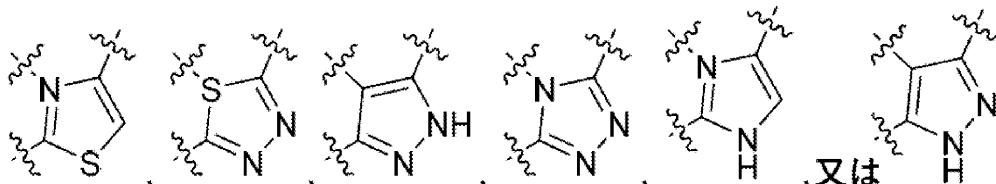
において

【化27】



が

【化28】

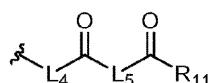


である、請求項22に記載の化合物。

【請求項24】

 $R_{10}$ がH又は

【化29】

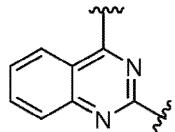


である、請求項20に記載の化合物。

【請求項25】

$R_1$ がHであり、且つ、 $R_2$ がC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキルであるか、又は  
 $R_1$ 及び $R_2$ が、それらが結合する2つの炭素原子とともに、

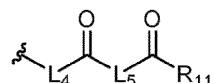
【化30】



であり、

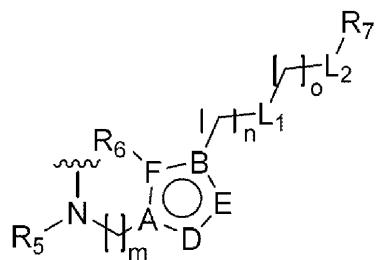
 $R_{10}$ が、

【化31】



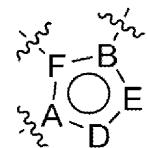
であり、

【化32】



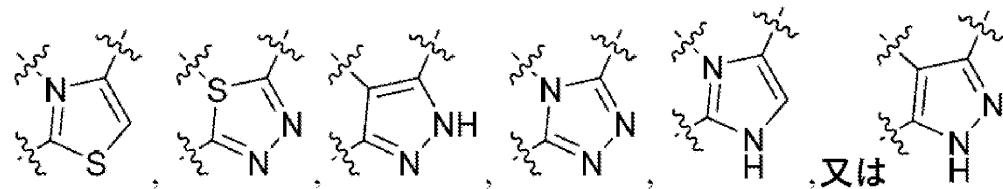
において

【化33】



が

【化34】

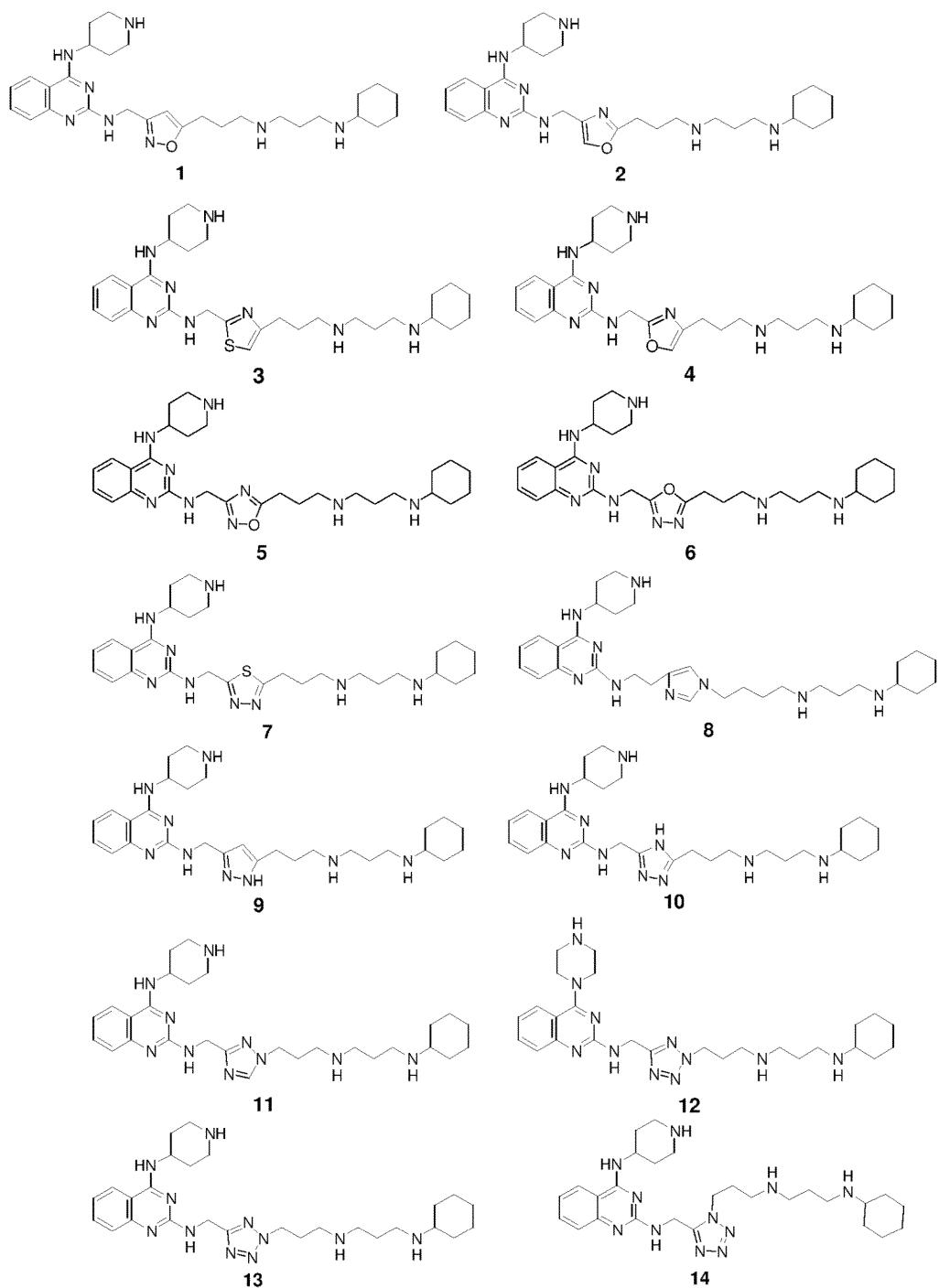


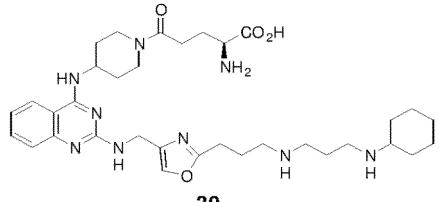
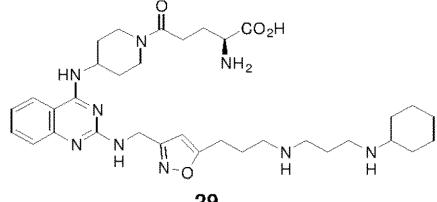
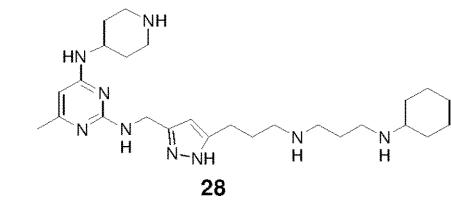
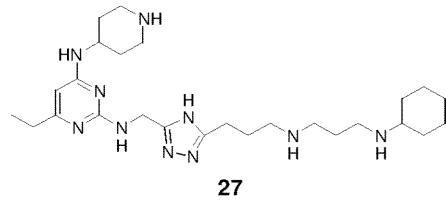
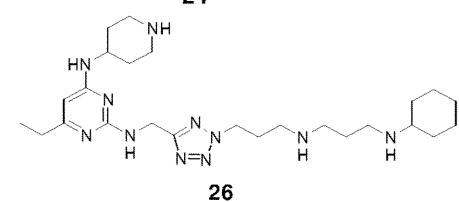
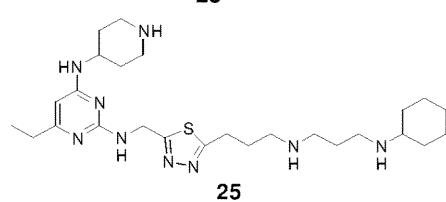
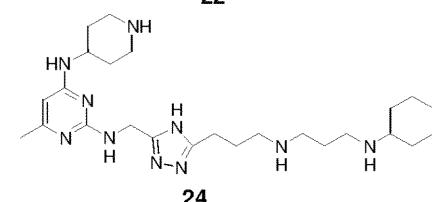
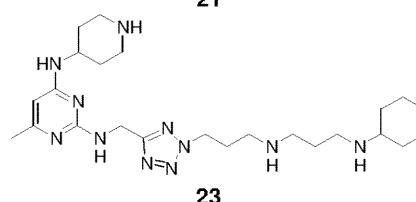
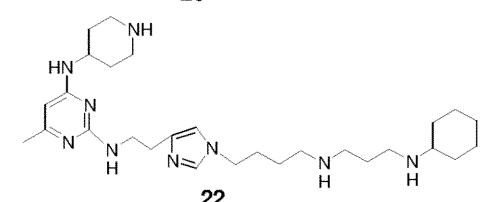
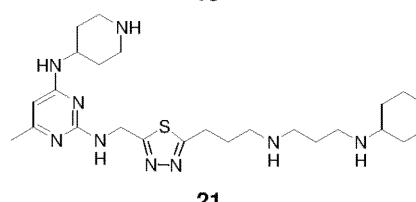
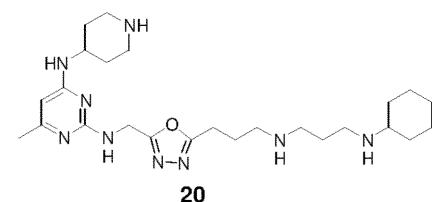
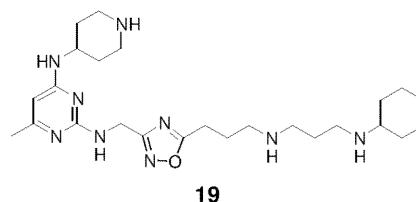
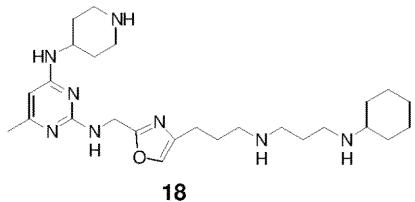
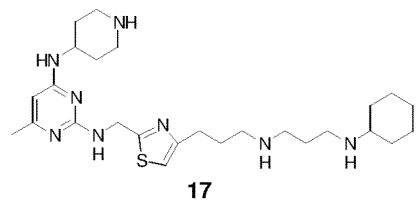
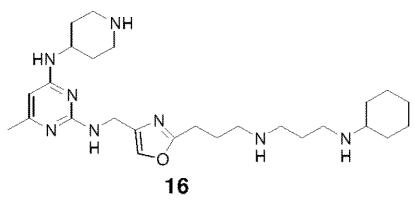
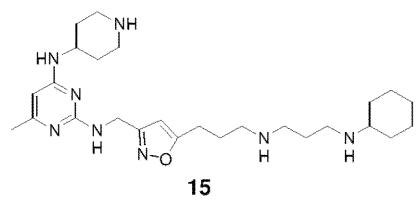
である、請求項24に記載の化合物。

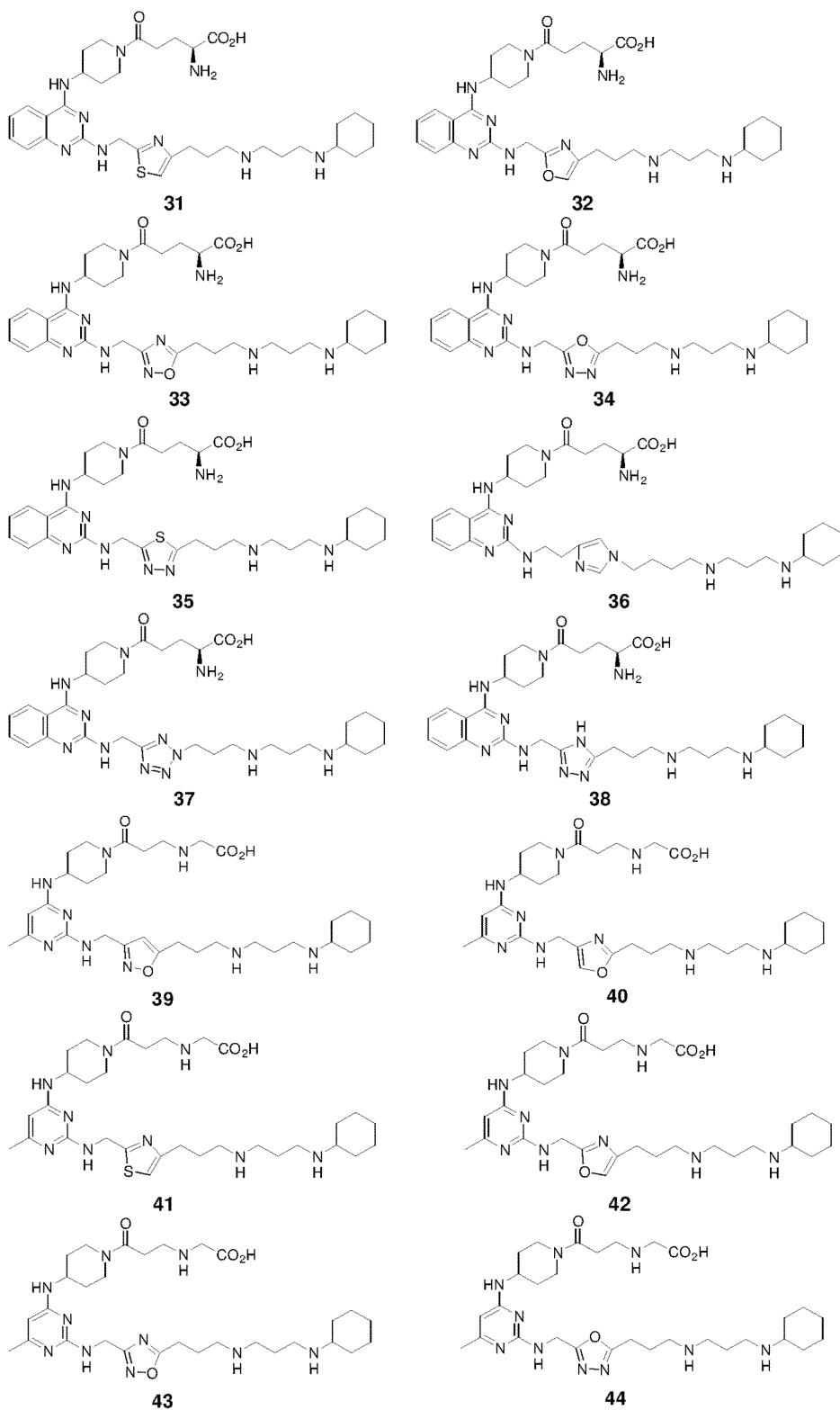
【請求項26】

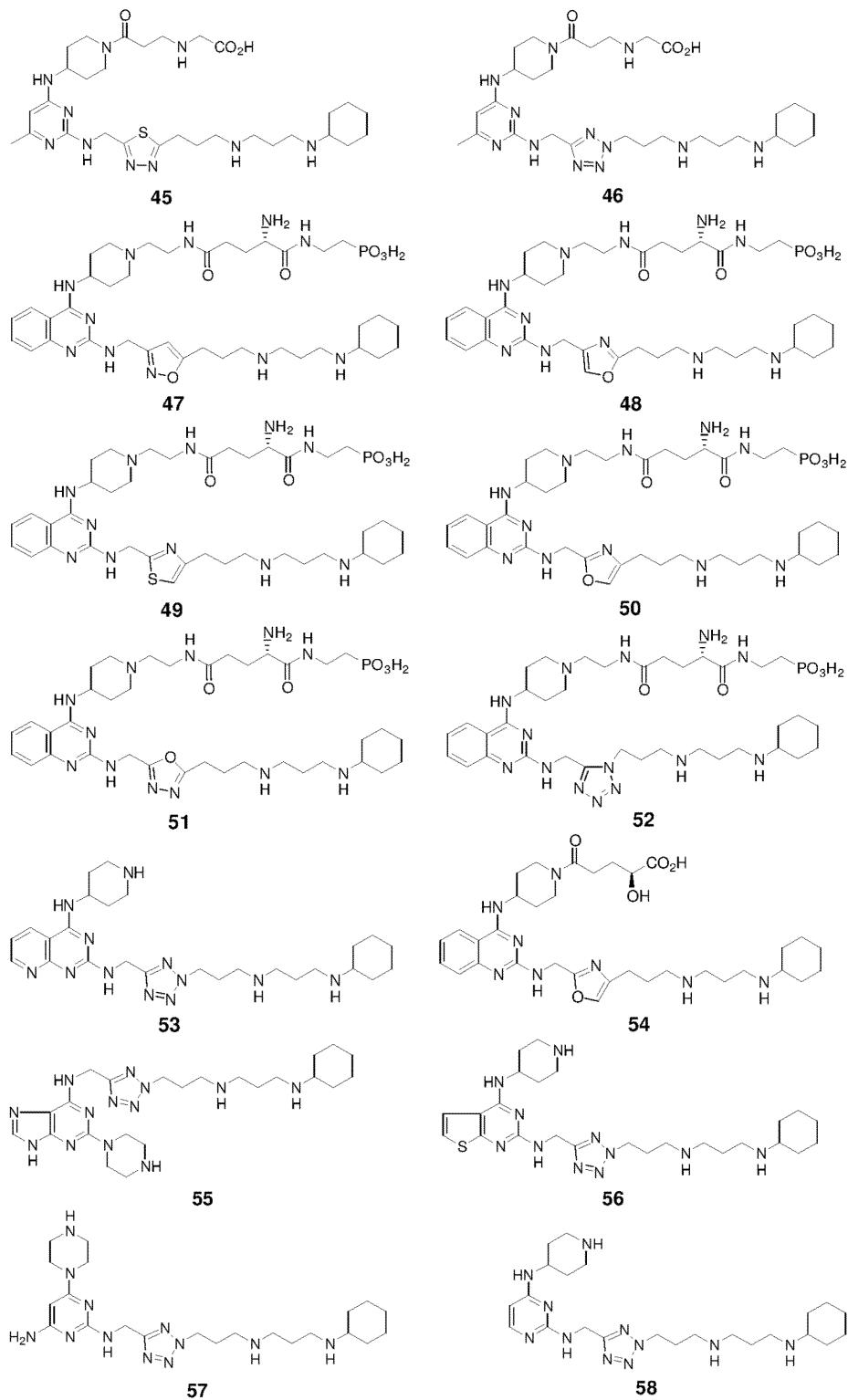
以下の化合物の1つである、請求項1に記載の化合物：

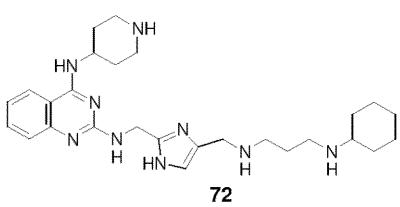
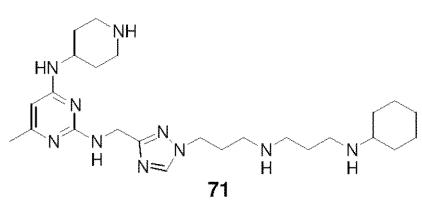
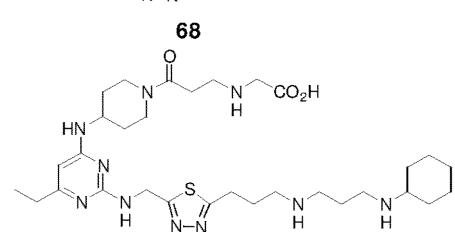
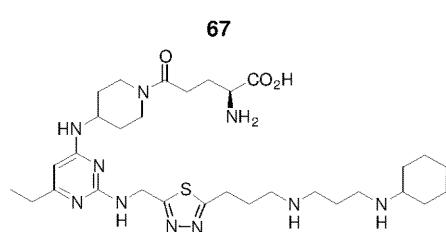
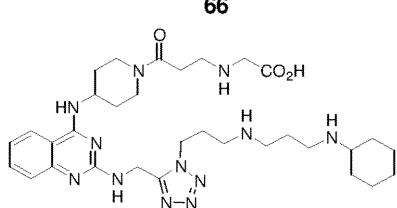
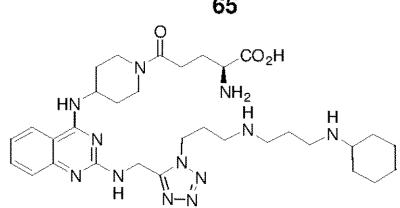
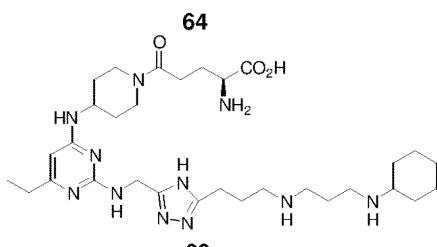
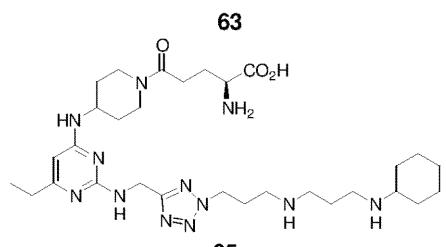
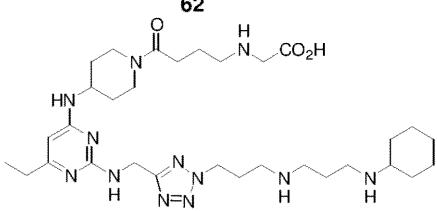
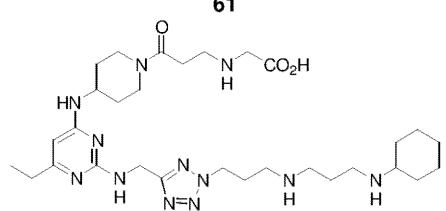
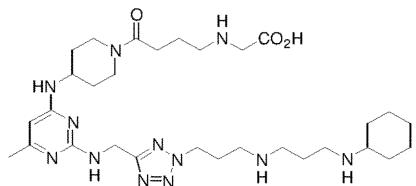
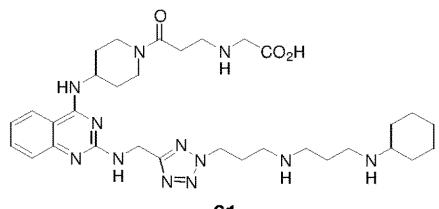
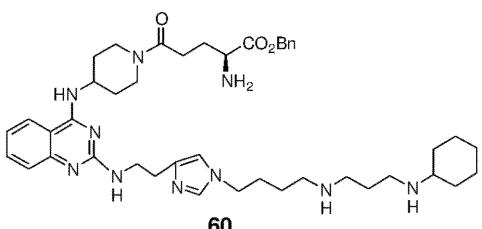
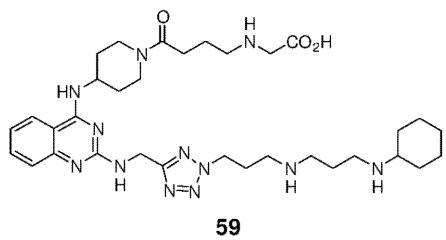
【化 3 5】

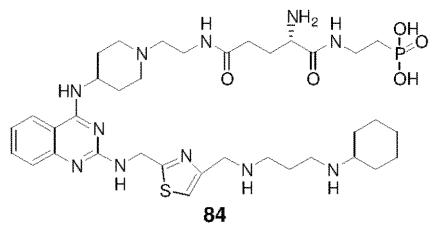
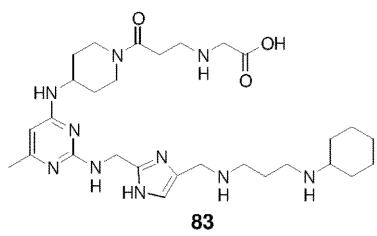
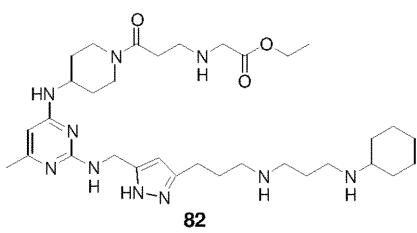
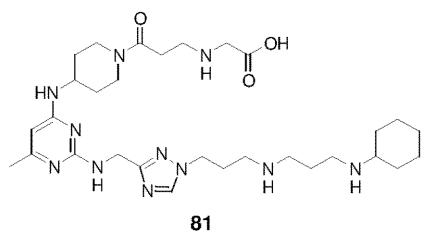
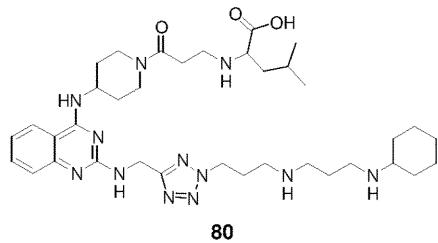
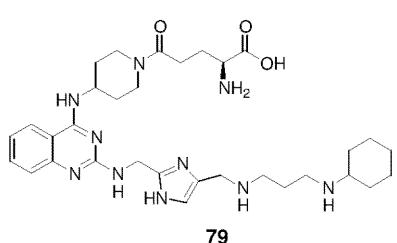
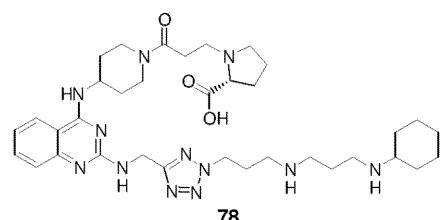
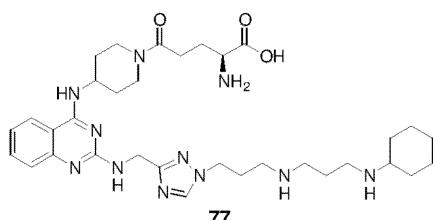
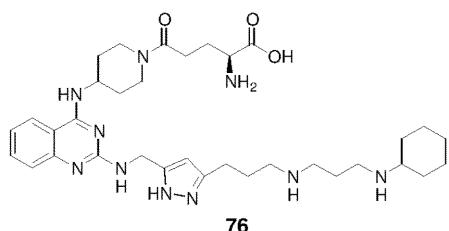
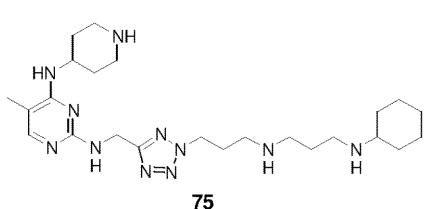
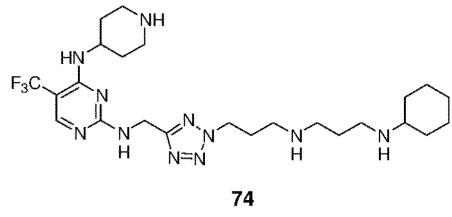
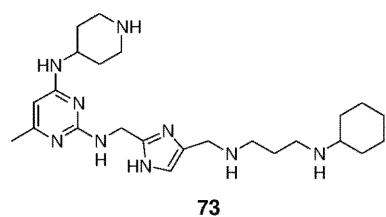


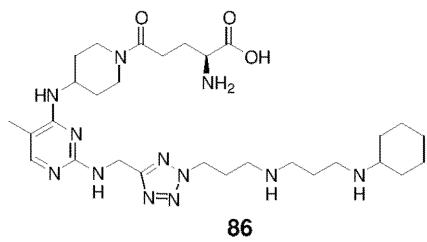
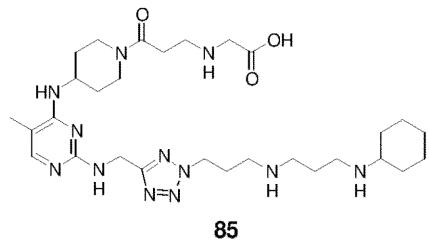








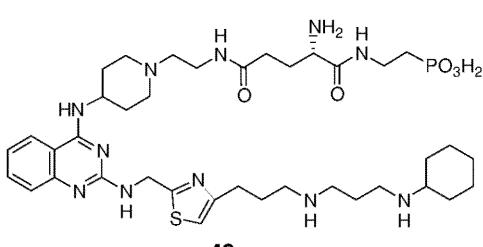
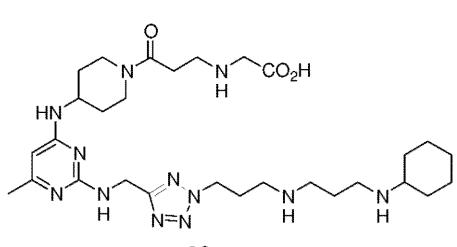
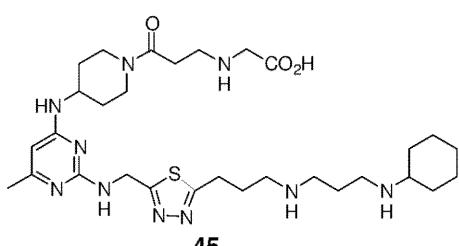
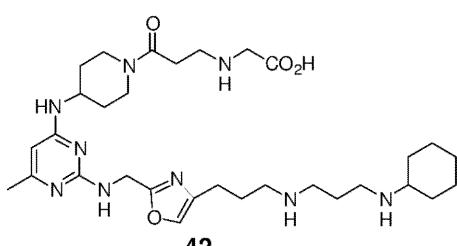
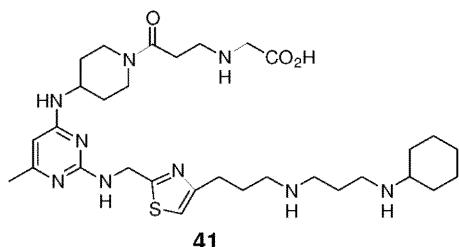
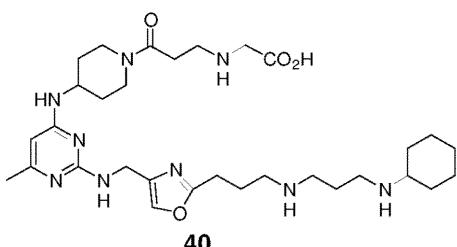
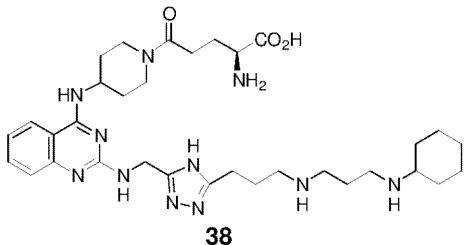
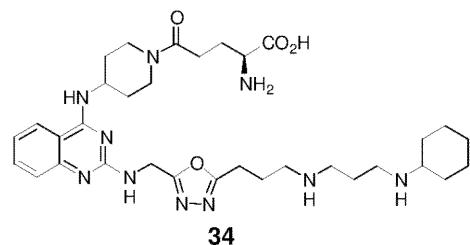
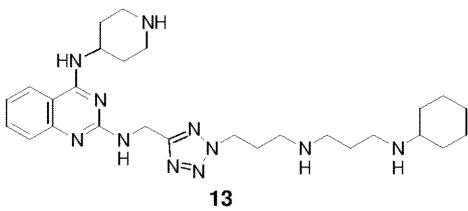
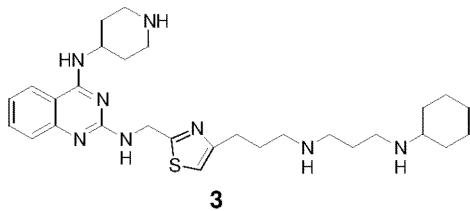


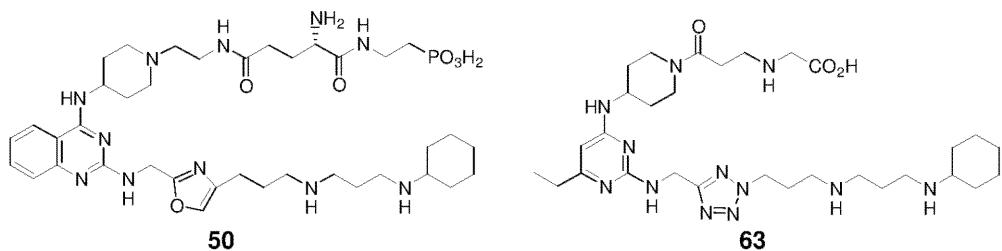


## 【請求項 27】

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】





## 【請求項 28】

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。

## 【請求項 29】

造血幹細胞 ( H S C ) 及び内皮前駆細胞 ( E P C ) 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。

## 【請求項 30】

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。

## 【請求項 31】

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。