

【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 9 月 30 日 (2021.9.30)

【公表番号】特表 2020-531423 (P2020-531423A)

【公表日】令和 2 年 11 月 5 日 (2020.11.5)

【年通号数】公開・登録公報 2020-045

【出願番号】特願 2020-508394 (P2020-508394)

【国際特許分類】

C 07D 221/16 (2006.01)

C 07D 401/12 (2006.01)

C 07D 405/14 (2006.01)

A 61K 31/473 (2006.01)

A 61K 31/4741 (2006.01)

C 07D 491/056 (2006.01)

C 07D 401/14 (2006.01)

C 07D 471/04 (2006.01)

C 07D 491/044 (2006.01)

C 07D 413/12 (2006.01)

C 07D 453/02 (2006.01)

C 07D 471/08 (2006.01)

A 61K 31/55 (2006.01)

C 07D 417/12 (2006.01)

A 61P 7/06 (2006.01)

A 61P 35/02 (2006.01)

A 61P 35/00 (2006.01)

A 61P 37/02 (2006.01)

A 61P 37/04 (2006.01)

A 61P 9/10 (2006.01)

A 61P 19/02 (2006.01)

A 61P 25/00 (2006.01)

A 61P 21/04 (2006.01)

A 61P 1/04 (2006.01)

A 61P 17/06 (2006.01)

A 61P 17/02 (2006.01)

A 61P 17/00 (2006.01)

A 61P 1/16 (2006.01)

A 61P 9/00 (2006.01)

【F I】

C 07D 221/16 C S P

C 07D 401/12

C 07D 405/14

A 61K 31/473

A 61K 31/4741

C 07D 491/056

C 07D 401/14

C 07D 471/04 1 1 2 Z

C 07D 491/044

C 07D 413/12

C 07D 471/04 1 0 4 Z

C 0 7 D 453/02
 C 0 7 D 471/08
 A 6 1 K 31/55
 C 0 7 D 417/12
 A 6 1 P 7/06
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 37/04
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 21/04
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 17/02
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 1/16
 A 6 1 P 9/00

【手続補正書】

【提出日】令和3年8月12日(2021.8.12)

【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

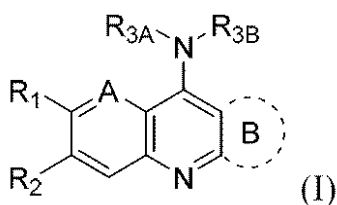
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



[式中、 R_1 は、アルコキシ（場合により、重水素である 1 個以上の R_A で置換されていてもよい）であり、 R_2 は、ハロゲン、シアノ、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、シクロアルキル（場合により 1 個以上のヒドロキシで置換されていてもよい）、シクロアルコキシ、シアノアルコキシ、アルコキシ（場合により、重水素、ヒドロキシ、アルコキシまたは（ヒドロキシ）アルコキシから独立して選択される 1 個以上の R_A で置換されていてもよい）、ハロアルコキシまたはアミノスルホニル（場合により 1 個以上のアルキルで置換されていてもよい）であるか；または R_1 と R_2 は、それらが結合している原子とともに、単環式ヘテロシクリル基を形成し；

A は C H または N であり；

R_{3A} は、

(a) ヘテロシクリル；

(b) ヘテロシクリルアルキル；

(c) スピロヘテロシクロアミノ (場合により、アルキル、アリール (場合により、ハロゲンおよびアルキルから独立して選択される 1 個以上の R_D で置換されていてもよい) およびアルコキシカルボニルから独立して選択される 1 個以上の R_B で置換されていてもよい) ;

(d) シクロアルキルアルキル (場合により、アミノおよびアルキルアミノから独立して選択される 1 個以上の R_C で置換されていてもよい) ;

(e) ヘテロアラルキル (場合により、アルキルで置換されていてもよい) ;

(f) アルキル (場合により、アルキルアミノで置換されていてもよい) ; または

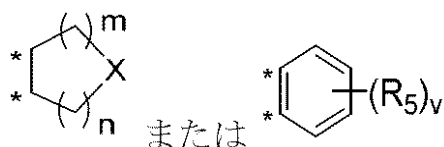
(g) 水素であり ;

ここで、(a) および (b) のヘテロシクリル環は、以下の、ハロゲン、ヒドロキシ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、シクロアルキル、シアノアルキル、アラルキル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、シクロアルキルアルキル、アルキル (場合により (i) 少なくとも 1 つのハロゲンと少なくとも 1 つのヒドロキシまたは (ii) アルコキシで置換されていてもよい)、アルキルカルボニル (場合により、ヒドロキシまたはベンジルオキシで置換されていてもよい)、アルキルスルホニル、ヘテロアリール (場合により、ハロゲン、アルキル、シアノ、ヒドロキシから独立して選択される 1 個以上の R_F で置換されていてもよい)、ヘテロアラルキル (場合により、ハロゲン、アルキル、シアノ、ヒドロキシから独立して選択される 1 個以上の R_G で置換されていてもよい)、ヘテロシクリル (場合により、アルキル、シアノ、ヒドロキシから独立して選択される 1 個以上の R_H で置換されていてもよい) およびアリール (場合により、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、シアノ、ヒドロキシから独立して選択される 1 個以上の R_I で置換されていてもよい) から独立して選択される 1 個以上の R_E で置換されていてもよく ;

R_{3B} は、水素、アルキル、または $-(C=O)NH_2$ であり ;

環 B は

【化 2】



(式中、アスタリスクは、式 (I) のピリジニル環への結合点を示す) であり ;

m および n は独立して 1、2、3 または 4 であり、 $m+n$ の合計は 2、3、4 または 5 であり ;

X は $CR_{4A}R_{4B}$ 、 NR_{4C} または O であり ;

R_{4A} 、 R_{4B} 、 R_{4C} は独立して、水素またはアルキルであり ;

各 R_5 は独立してアルキルであり ; および

v は 0、1、2、3、または 4 である]

で示される化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

A が CH である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

A が N である、請求項 1 に記載の化合物。

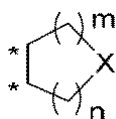
【請求項 4】

R_{3B} が水素である、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 5】

環 B が、

【化 3】



である、請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 6】

X が $C R_{4A} R_{4B}$ である、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

R_{4A} および R_{4B} がそれぞれ水素である、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

m が 1 であり、n が 1 である、請求項 5 ~ 7 のいずれかに記載の化合物。

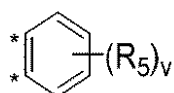
【請求項 9】

m が 2 であり、n が 1 である、請求項 5 ~ 7 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 10】

環 B が、

【化 4】



である、請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 11】

R_1 がメトキシである、請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 12】

R_1 および R_2 がそれぞれメトキシである、請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 13】

R_1 がメトキシであり、 R_2 が、アルコキシである 1 個以上の R_A で置換されたアルコキシである、請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 14】

R_1 がメトキシであり、 R_2 が、ヒドロキシである R_A でモノ置換されたアルコキシである、請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 15】

R_{3A} がヘテロアラルキル（場合によりアルキルで置換されている）である、請求項 1 ~ 14 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 16】

R_{3A} がシクロアルキルアルキルである（場合により、アミノまたはアルキルアミノから独立して選択される 1 個以上の R_C で置換されていてもよい）、請求項 1 ~ 14 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 17】

R_{3A} がスピロヘテロシクロアミノ（場合により、アルキル、アリール（場合により、ハロゲンおよびアルキルから独立して選択される 1 個以上の R_D で置換されていてもよい）およびアルコキシカルボニルから独立して選択される 1 個以上の R_B で置換されていてもよい）である、請求項 1 ~ 14 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 18】

R_{3A} が、場合により、以下の、ハロゲン、ヒドロキシ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、シクロアルキル、シアノアルキル、アラルキル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、シクロアルキルアルキル、アルキル（場合により（i）少なくとも 1 つのハロゲンと少なくとも 1 つのヒドロキシまたは（ii）アルコキシで置換されていてもよい）、アルキルカルボニル（場合により、ヒドロキシまたはベンジルオキシで置換されていてもよい）である、請求項 1 ~ 14 のいずれかに記載の化合物。

もよい)、アルキルスルホニル、ヘテロアリール(場合により、ハロゲン、アルキル、シアノ、ヒドロキシから独立して選択される1以上の R_F で置換されていてもよい)、ヘテロアラルキル(場合により、ハロゲン、アルキル、シアノ、ヒドロキシから独立して選択される1以上の R_G で置換されていてもよい)、ヘテロシクリル(場合により、アルキル、シアノ、ヒドロキシから独立して選択される1以上の R_H で置換されていてもよい)およびアリール(場合により、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、シアノ、ヒドロキシから独立して選択される1以上の R_I で置換されていてもよい)から独立して選択される1以上の R_E で置換されていてもよいヘテロシクリルである、請求項1~14のいずれかに記載の化合物。

【請求項19】

R_{3A} が、独立して非置換アルキルである1、2、3または4個の R_E で置換されたヘテロシクリルである、請求項18に記載の化合物。

【請求項20】

R_{3A} が、ヘテロアリール(場合により、ハロゲン、シアノおよびアルキルから独立して選択される1個以上の R_F で置換されていてもよい)である1個以上の R_E で独立して置換されたヘテロシクリルである、請求項18の化合物。

【請求項21】

R_{3A} が、ヘテロシクリル(場合により、アルキル、シアノおよびヒドロキシから独立して選択される1個以上の R_H で置換されていてもよい)である1個以上の R_E で独立に置換されたヘテロシクリルである、請求項18に記載の化合物。

【請求項22】

R_{3A} が、アリール(場合により、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、シアノおよびヒドロキシから独立して選択される1個以上の R_I で置換されていてもよい)である1個以上の R_E で独立に置換されたヘテロシクリルである、請求項18に記載の化合物。

【請求項23】

R_{3A} が、場合により、以下の、ハロゲン、ヒドロキシ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、シクロアルキル、シアノアルキル、アラルキル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、シクロアルキルアルキル、アルキル、アルキルカルボニル(場合により、ヒドロキシまたはベンジルオキシで置換されていてもよい)、アルキルスルホニル、ヘテロアリール(場合により、ハロゲン、アルキル、シアノおよびヒドロキシから独立して選択される1個以上の R_F で置換されていてもよい)、ヘテロアラルキル(場合により、ハロゲン、アルキル、シアノおよびヒドロキシから独立して選択される1個以上の R_G で置換されていてもよい)、ヘテロシクリル(場合により、アルキル、シアノおよびヒドロキシから独立して選択される1個以上の R_H で置換されていてもよい)およびアリール(場合により、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、シアノおよびヒドロキシから独立して選択される1個以上の R_I で置換されていてもよい)から独立して選択される1個以上の R_E で置換されていてもよい、ヘテロシクリルアルキルである、請求項1~14のいずれかに記載の化合物。

【請求項24】

R_{3A} が、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール(場合により、ハロゲンから独立して選択される1個または2個の R_F で置換されていてもよい)およびアリール(場合により、ハロゲンから独立して選択される1個以上の R_I で置換されていてもよい)から独立して選択される1個または2個の R_E で置換されたヘテロシクリルアルキルである、請求項23に記載の化合物。

【請求項25】

R_{3A} が、場合によりアルキルアミノで置換されているアルキルである、請求項1~14のいずれかに記載の化合物。

【請求項26】

R_{3A} がメチルまたはイソプロピルである、請求項25に記載の化合物。

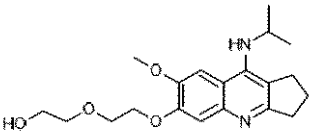
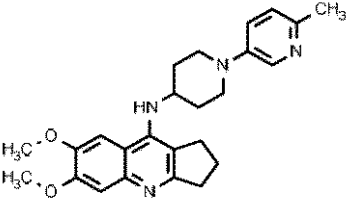
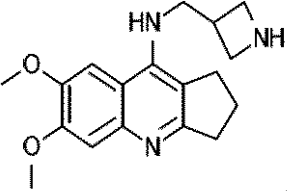
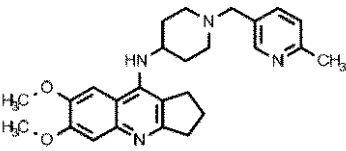
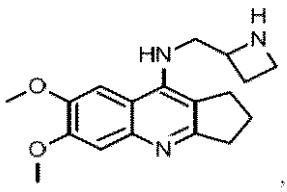
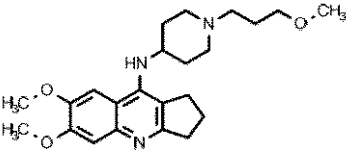
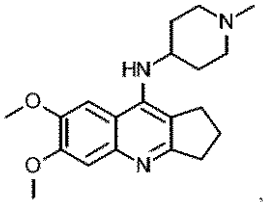
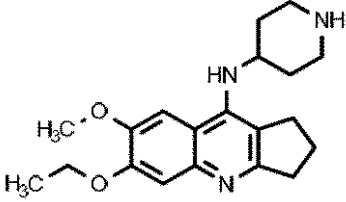
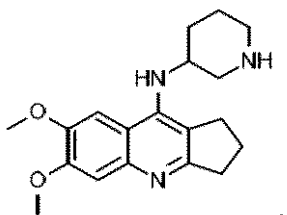
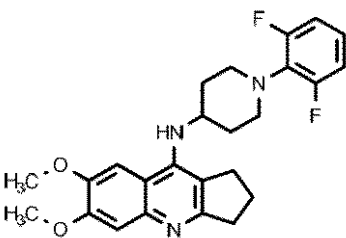
【請求項 27】

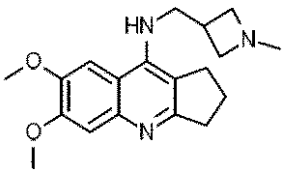
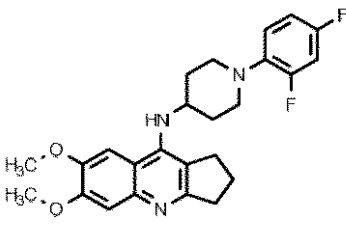
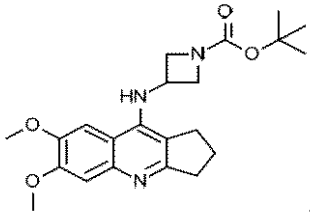
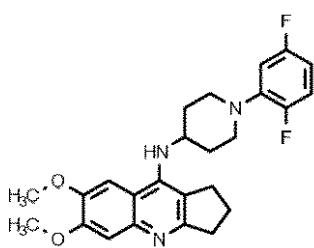
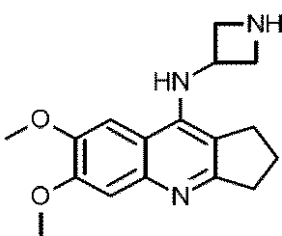
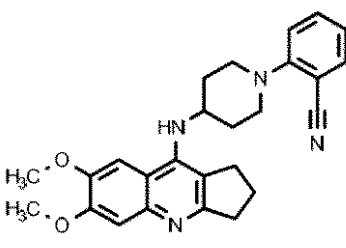
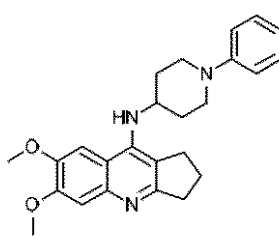
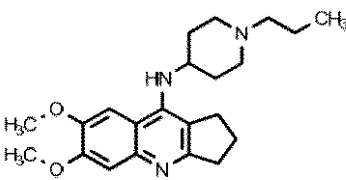
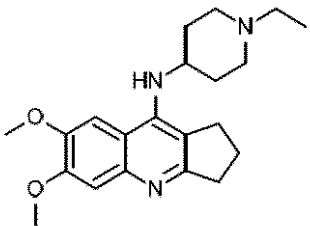
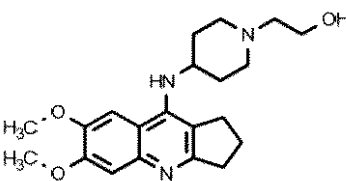
R_{3A} がアルキルアミノで置換されたアルキルである、請求項 25 に記載の化合物。

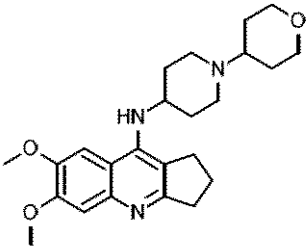
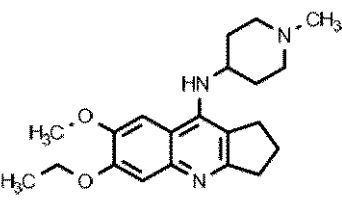
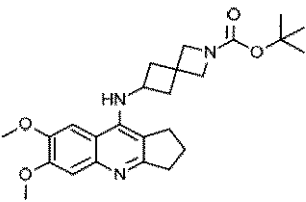
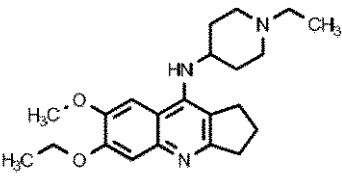
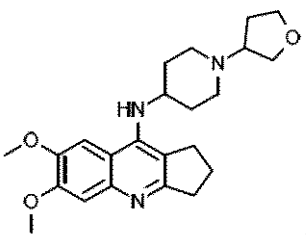
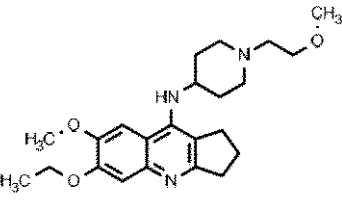
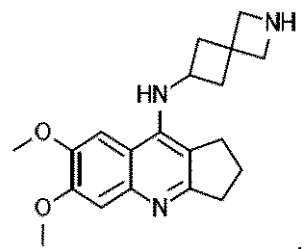
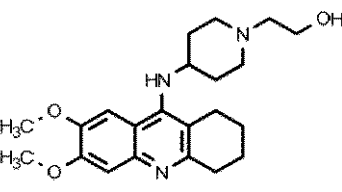
【請求項 28】

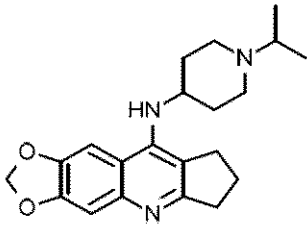
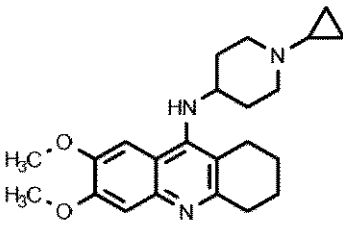
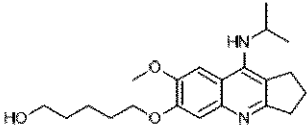
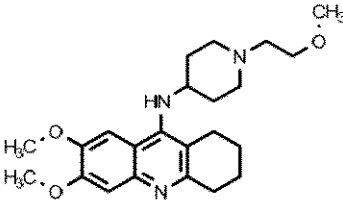
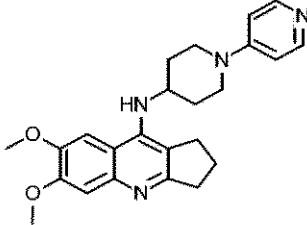
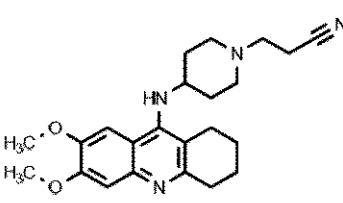
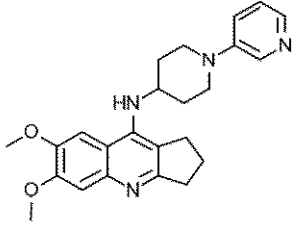
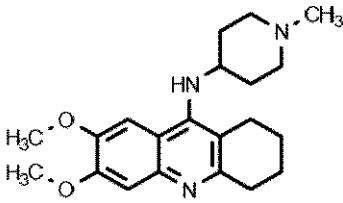
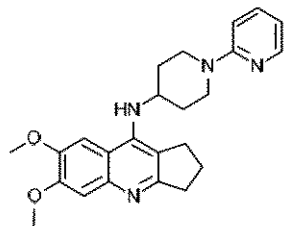
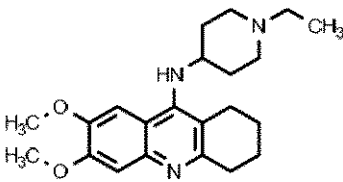
以下からなる群から選択される化合物である、請求項 1 に記載の化合物。

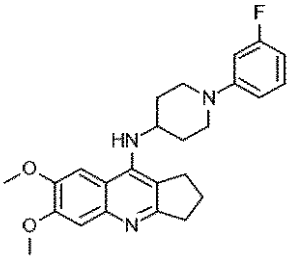
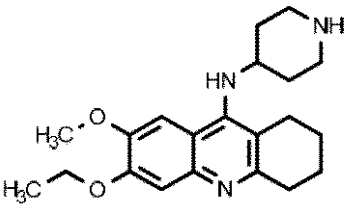
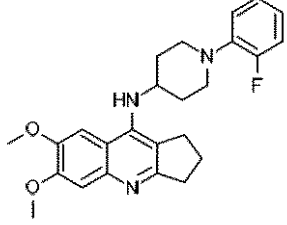
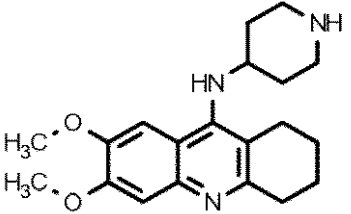
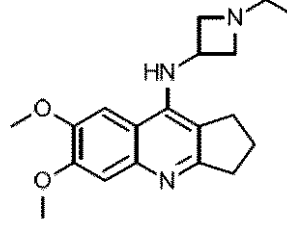
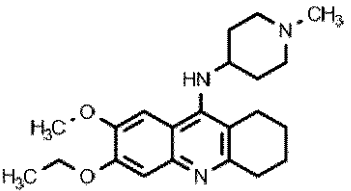
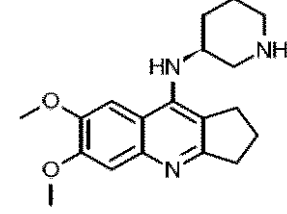
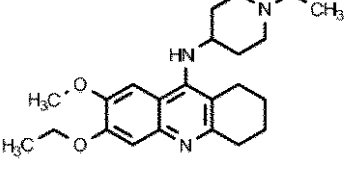
番号	構造	番号	構造
1		70	
2		71	
3		72	
4		73	
5		74	

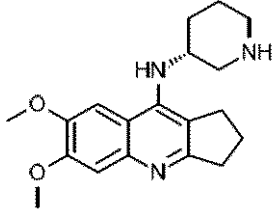
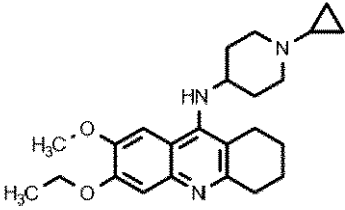
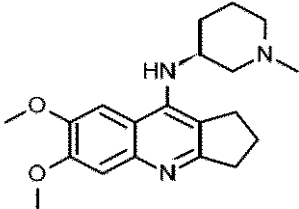
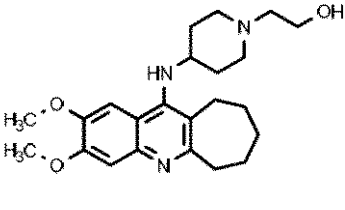
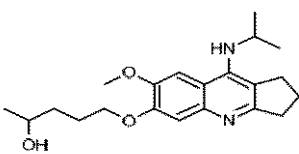
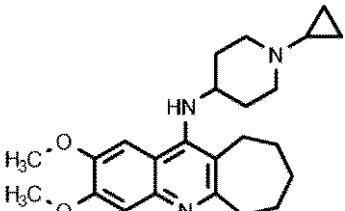
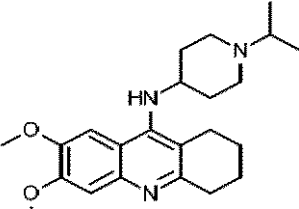
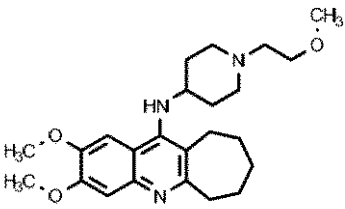
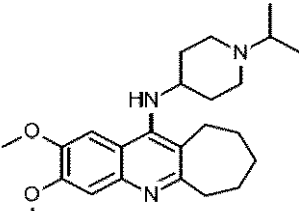
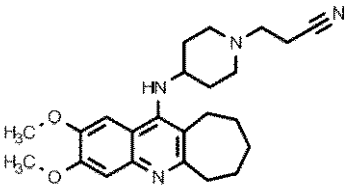
6		75	
7		76	
8		77	
9		78	
10		79	

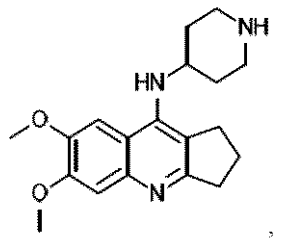
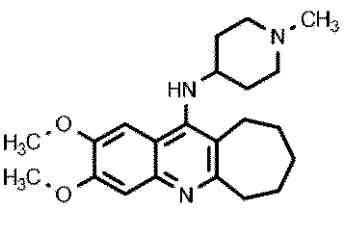
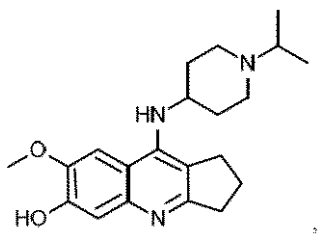
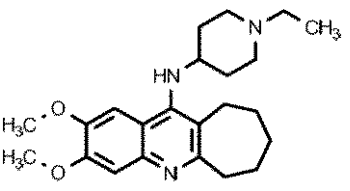
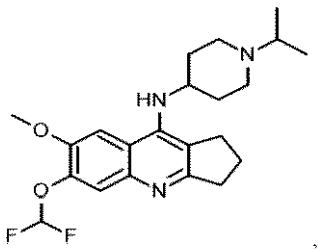
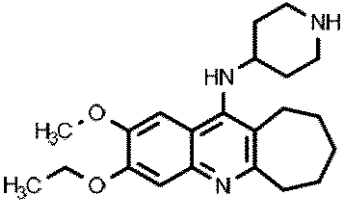
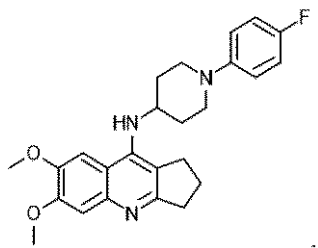
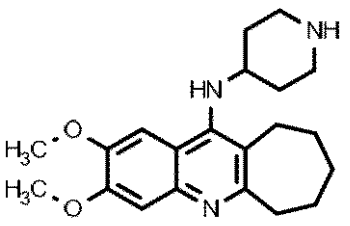
11		80	
12		81	
13		82	
14		83	
15		84	

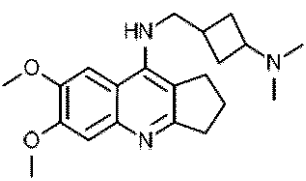
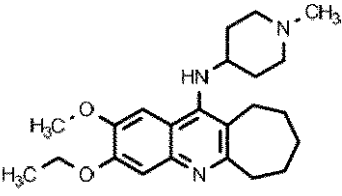
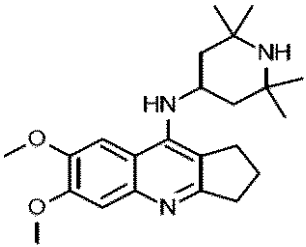
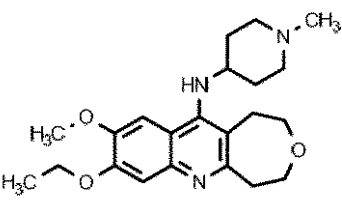
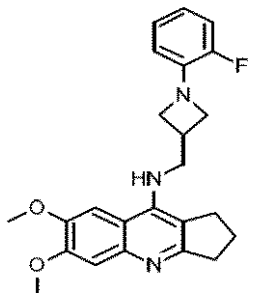
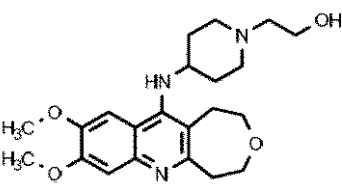
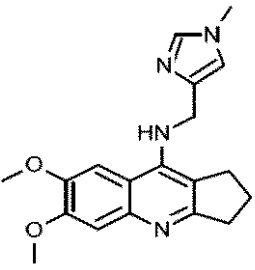
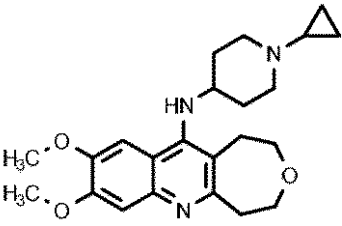
16		85	
17		86	
18		87	
19		88	

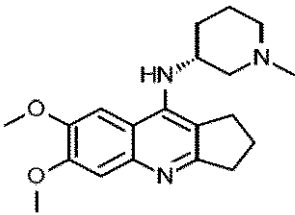
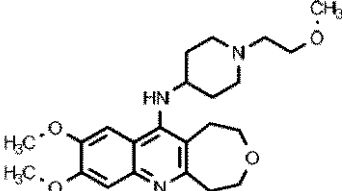
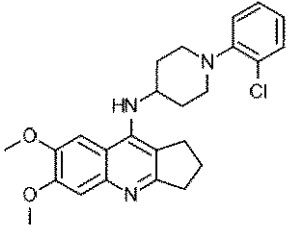
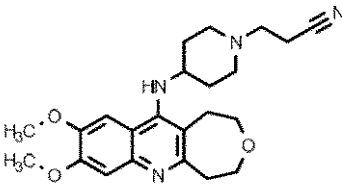
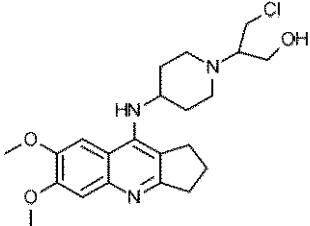
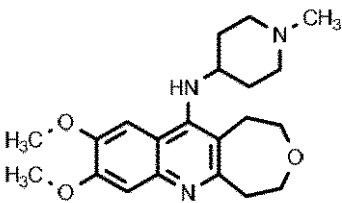
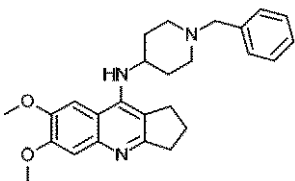
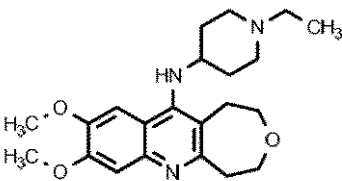
20		89	
21		90	
22		91	
23		92	
24		93	

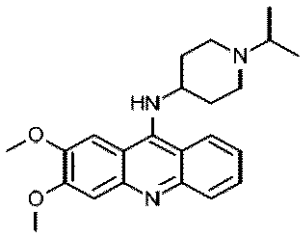
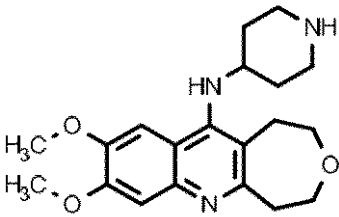
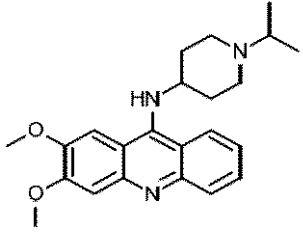
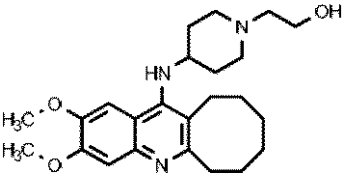
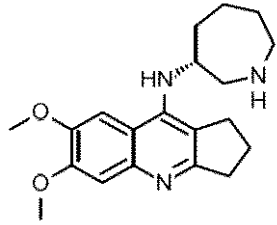
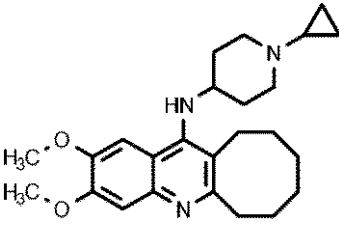
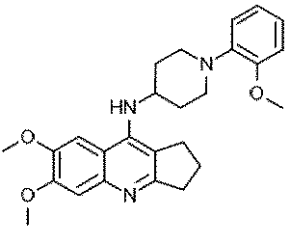
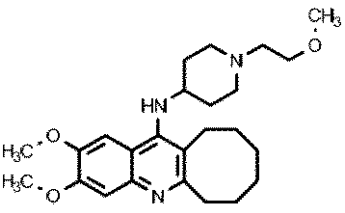
25		94	
26		95	
27		96	
28		97	

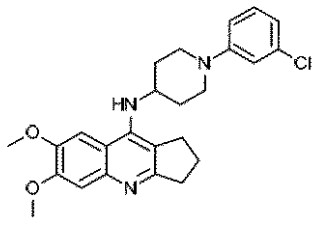
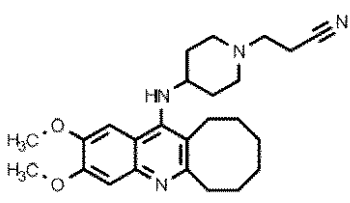
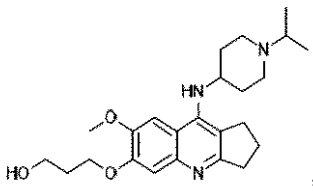
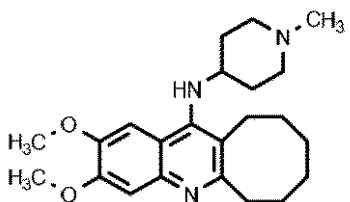
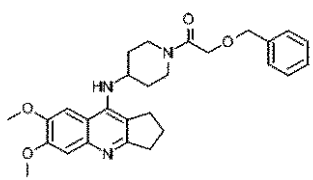
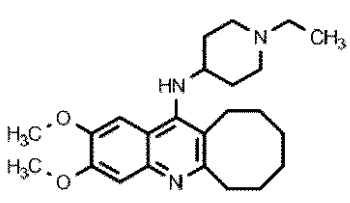
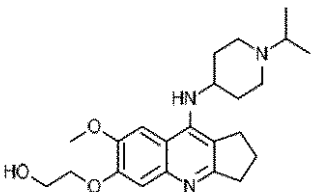
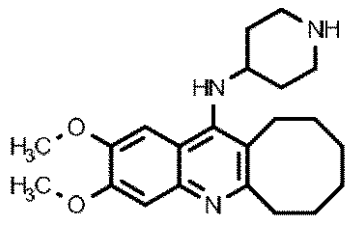
29		98	
30		99	
31		100	
32		101	
33		102	

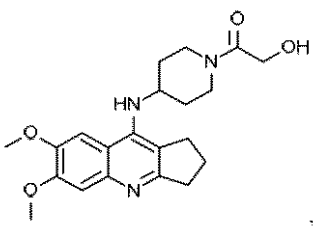
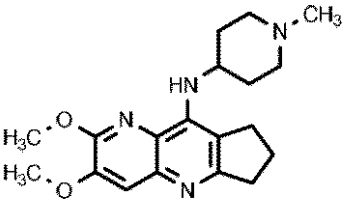
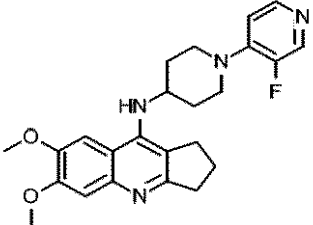
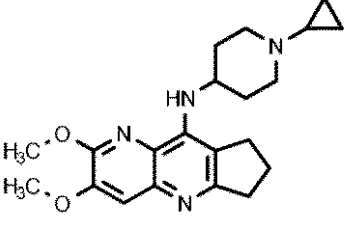
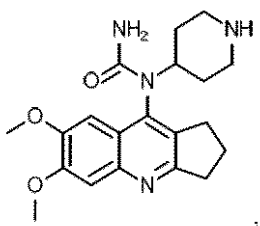
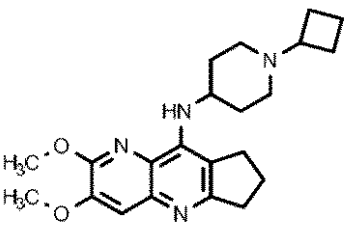
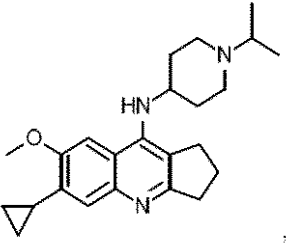
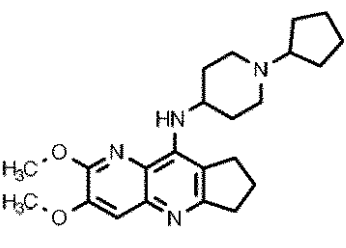
34		103	
35		104	
36		105	
37		106	

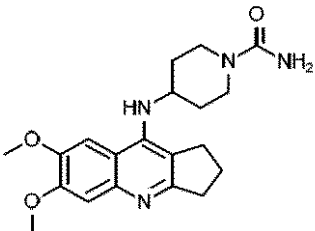
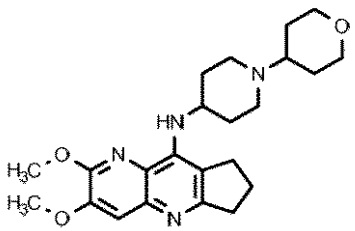
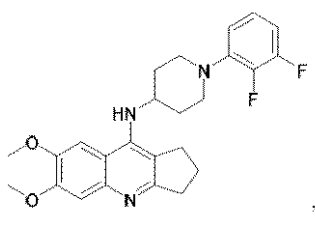
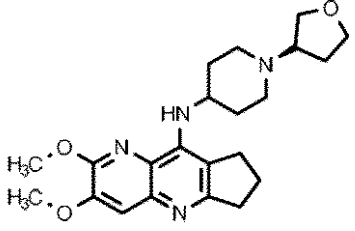
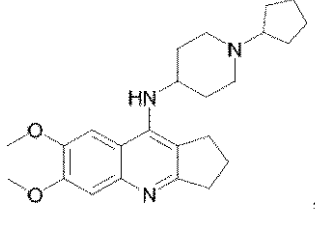
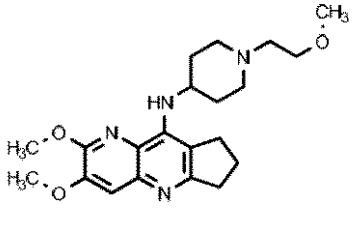
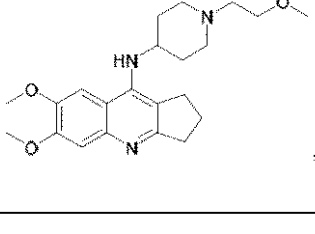
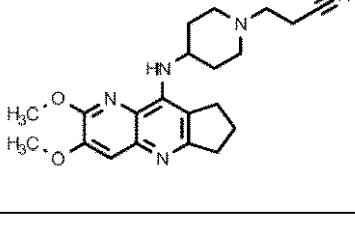
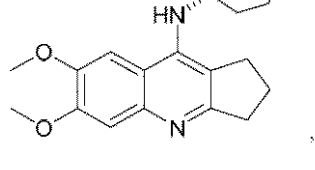
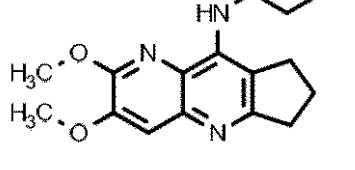
38		107	
39		108	
40		109	
41		110	

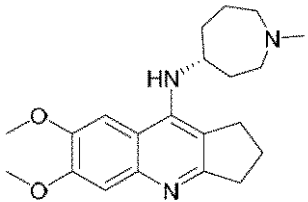
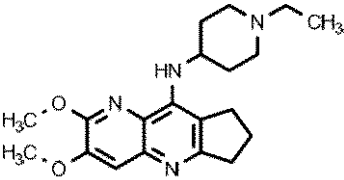
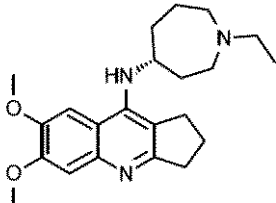
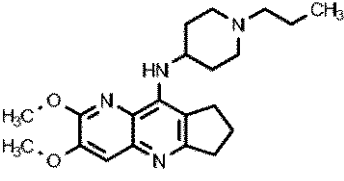
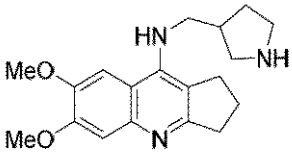
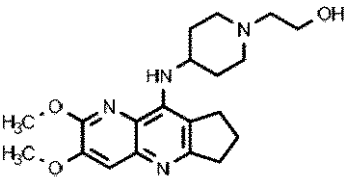
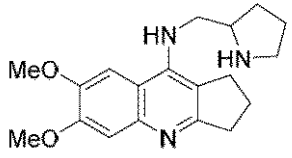
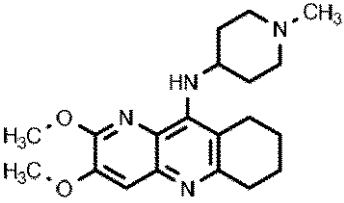
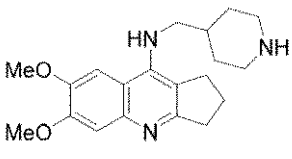
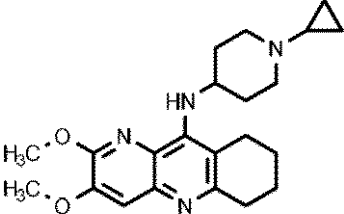
42		111	
43		112	
44		113	
45		114	

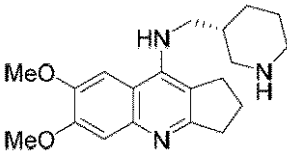
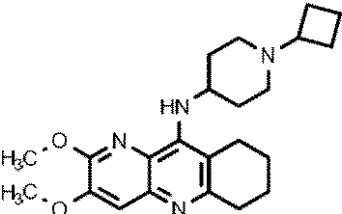
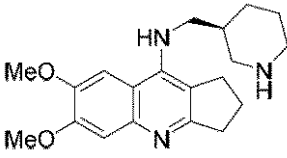
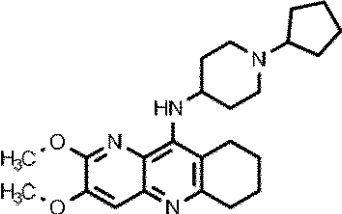
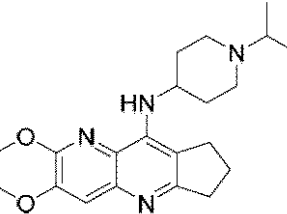
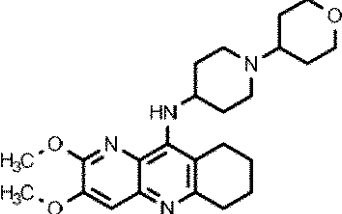
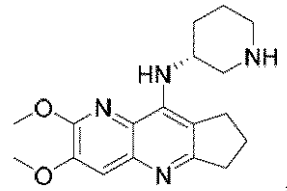
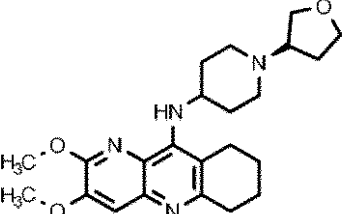
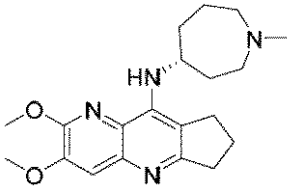
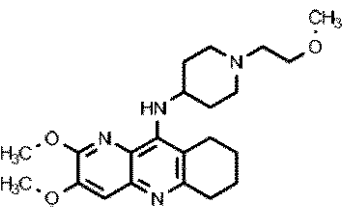
46		115	
47		116	
48		117	
49		118	

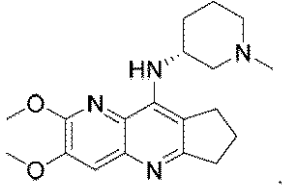
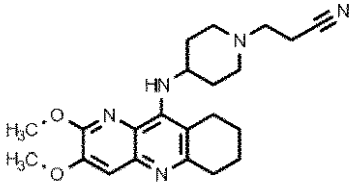
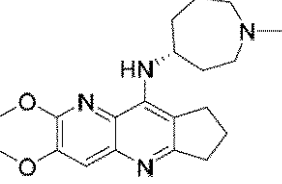
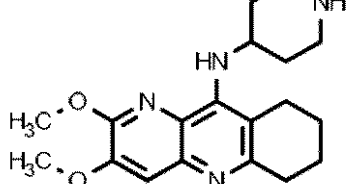
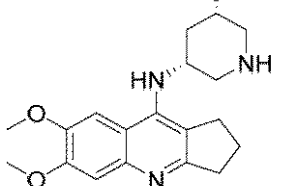
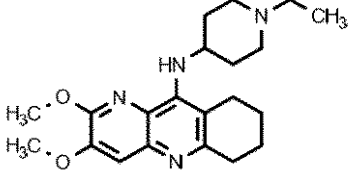
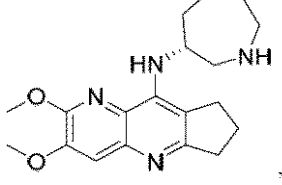
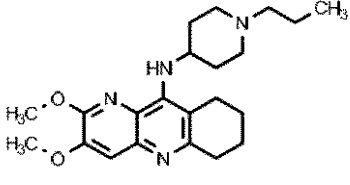
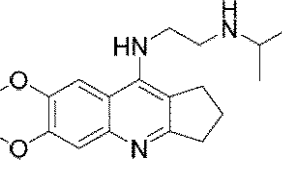
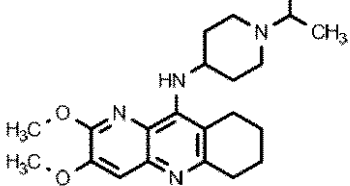
50		119	
51		120	
52		121	
53		122	

54		123	
55		124	
56		125	
57		126	

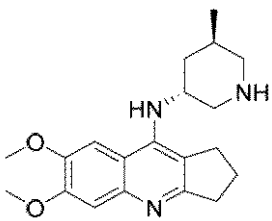
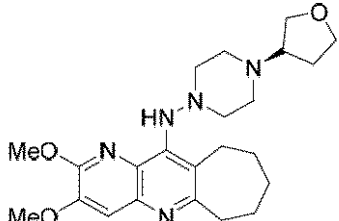
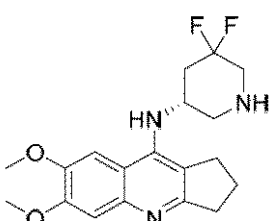
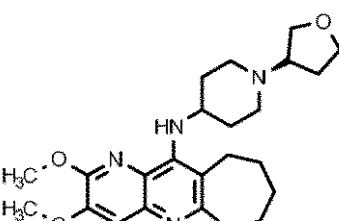
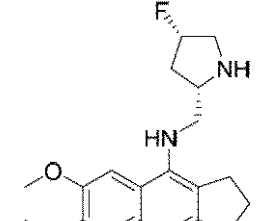
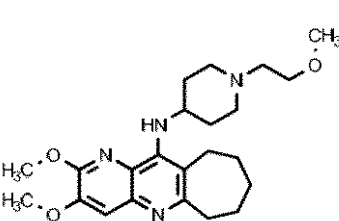
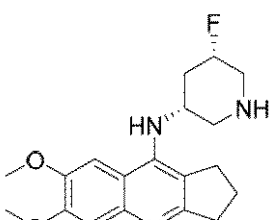
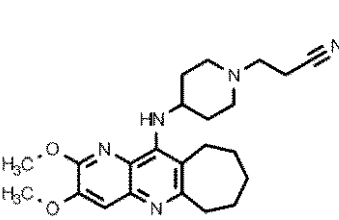
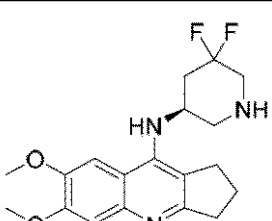
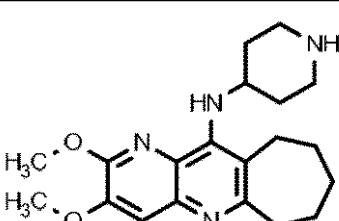
58		127	
59		128	
60		129	
61		130	
62		131	

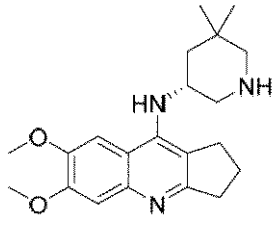
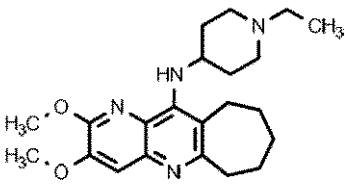
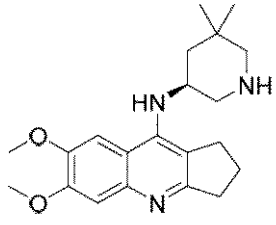
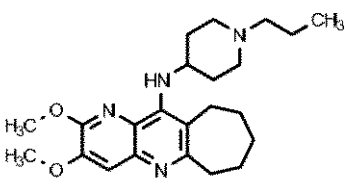
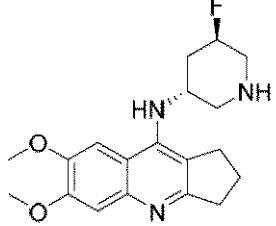
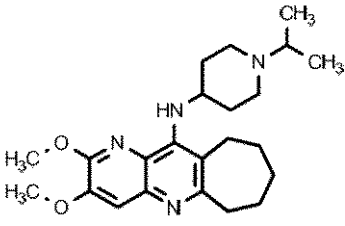
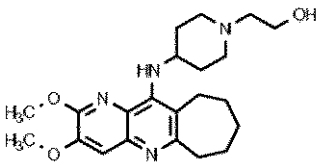
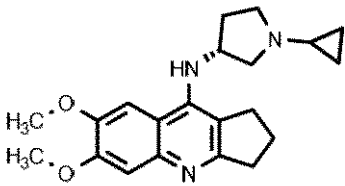
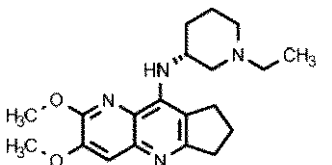
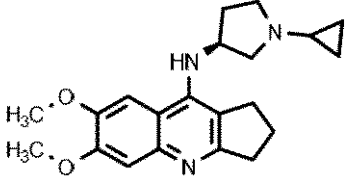
63		132	
64		133	
65		135	
66		136	
67		137	

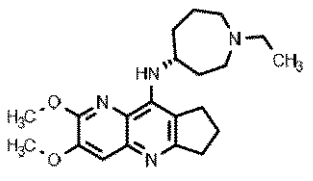
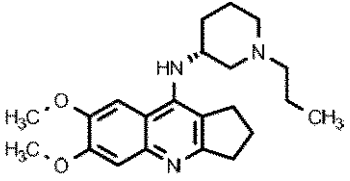
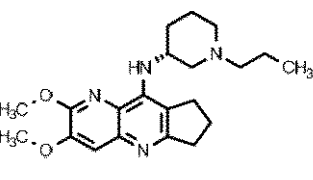
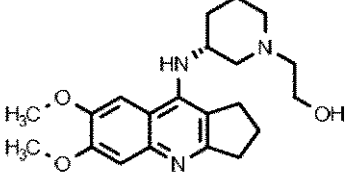
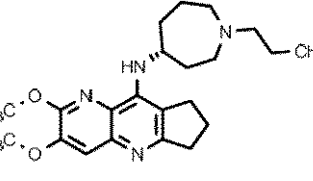
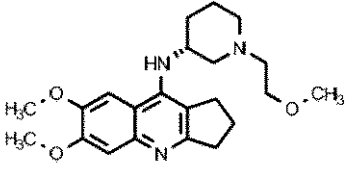
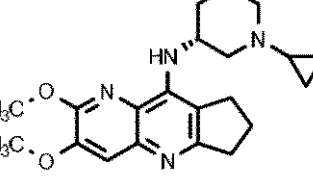
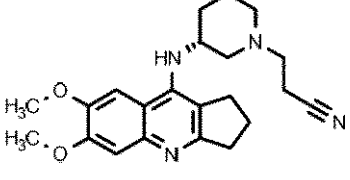
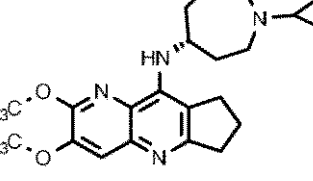
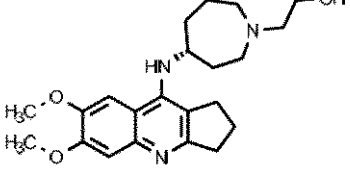
68		138	
69		139	
134		140	
149		141	
163		142	

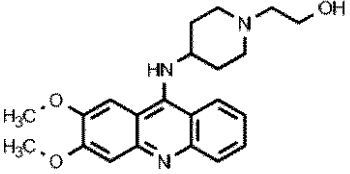
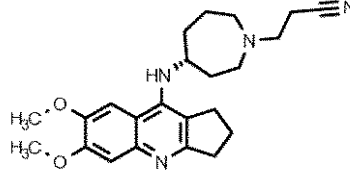
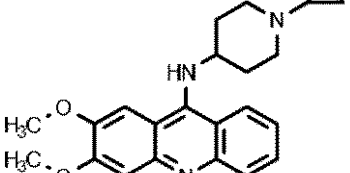
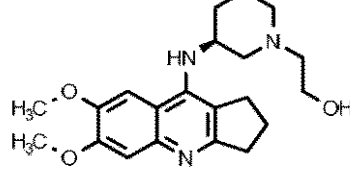
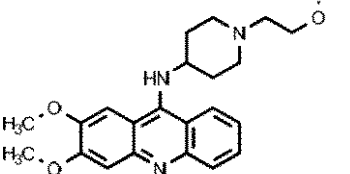
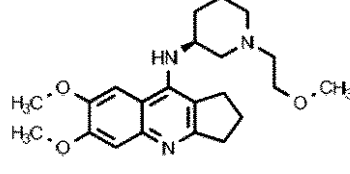
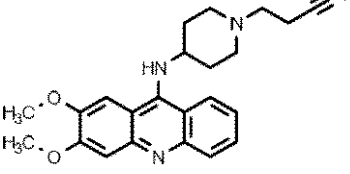
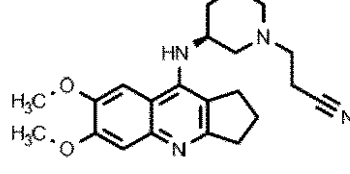
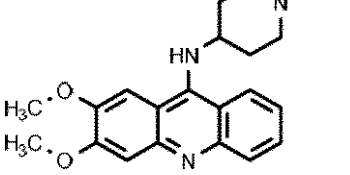
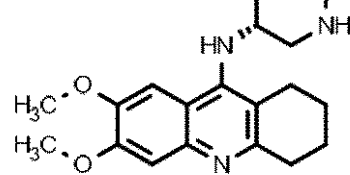
164		143	
165		144	
286		145	
402		146	
403		147	

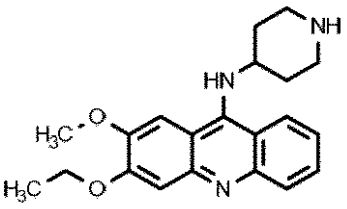
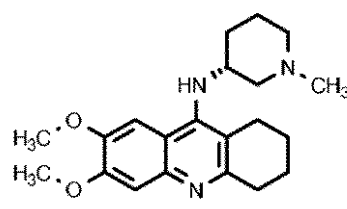
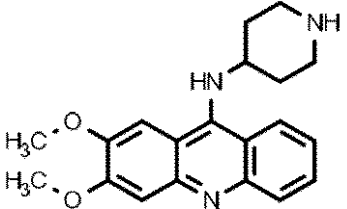
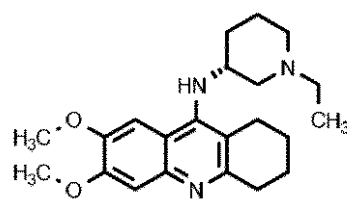
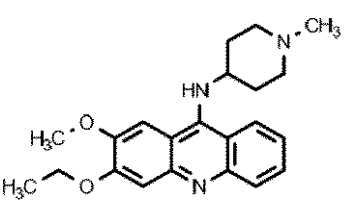
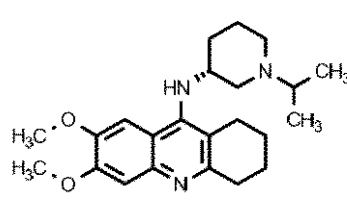
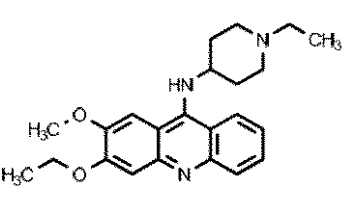
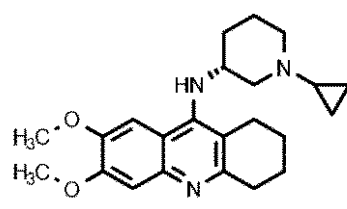
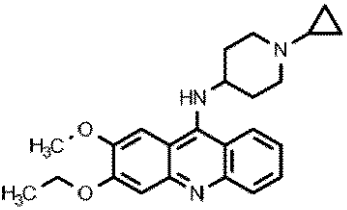
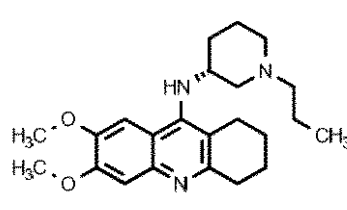
404		148	
405		150	
406		151	
407		152	
408		153	

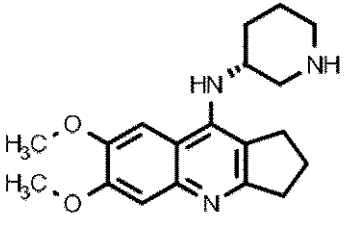
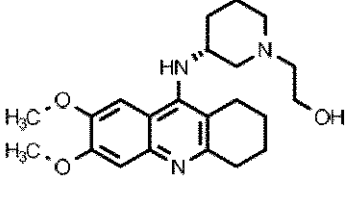
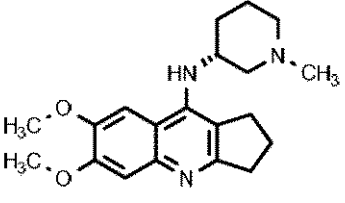
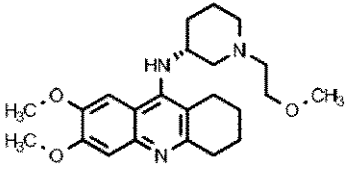
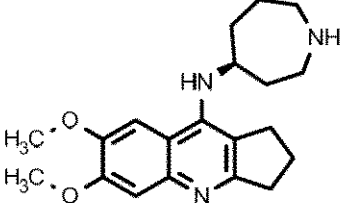
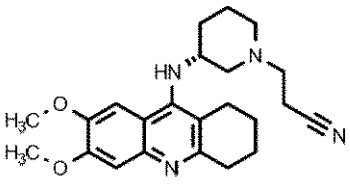
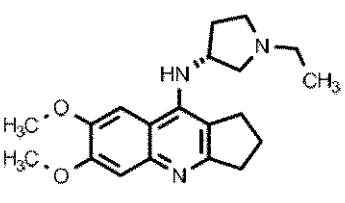
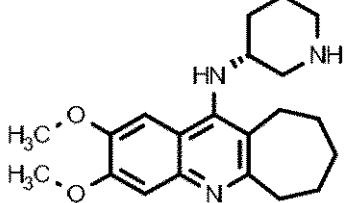
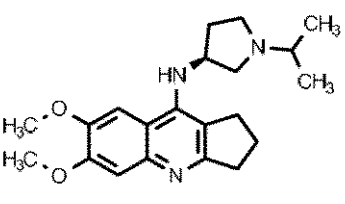
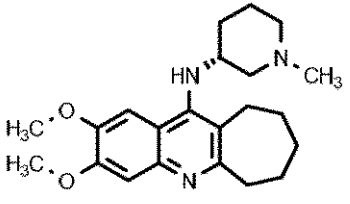
409		154	
410		155	
411		156	
412		157	
413		158	

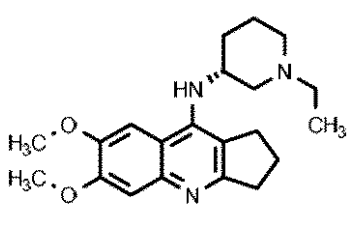
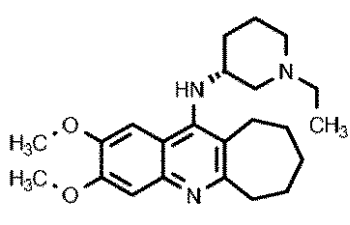
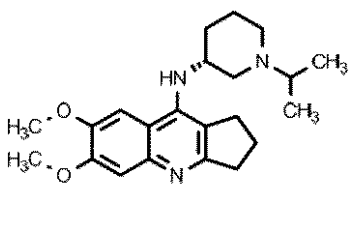
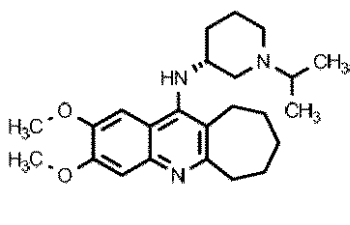
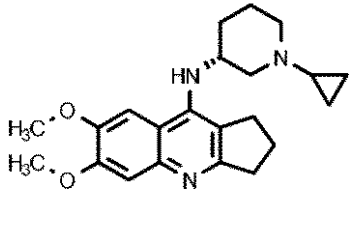
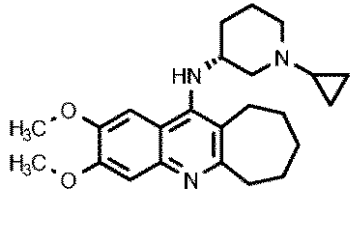
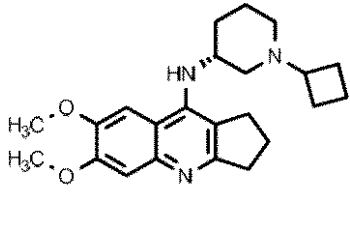
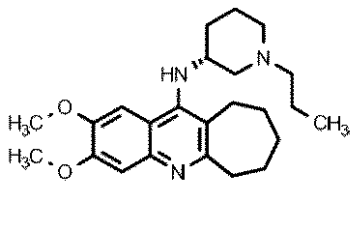
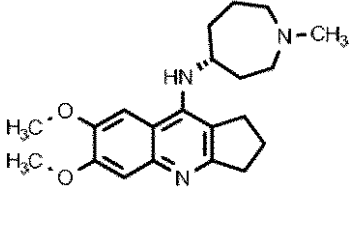
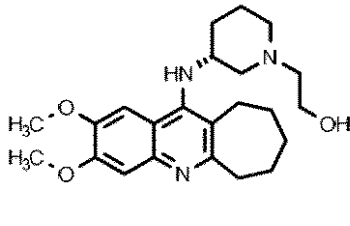
414		159	
415		160	
416		161	
162		201	
166		202	

167		203	
168		204	
169		205	
170		206	
171		207	

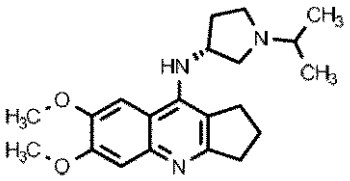
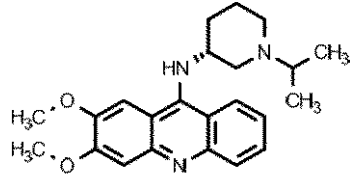
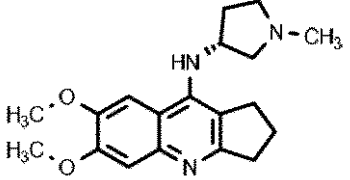
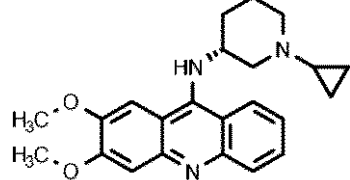
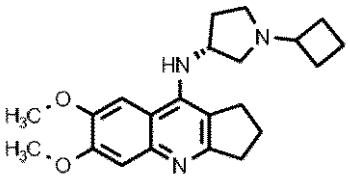
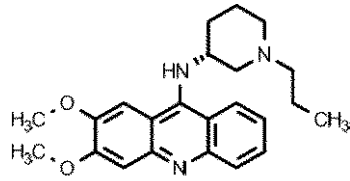
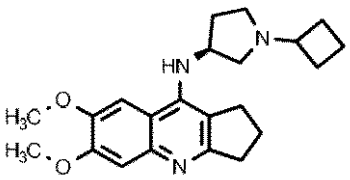
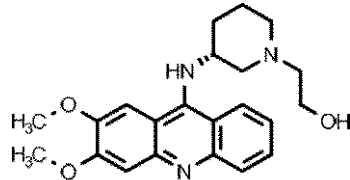
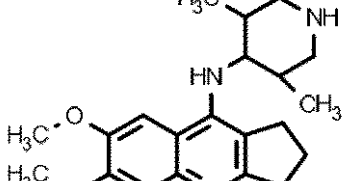
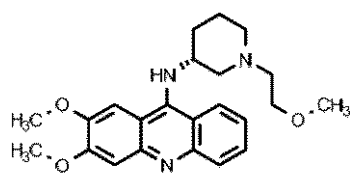
172		208	
173		209	
174		210	
175		211	
176		212	

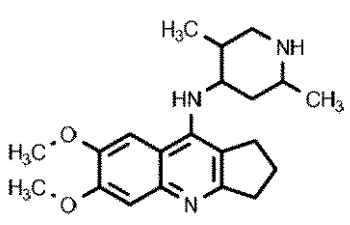
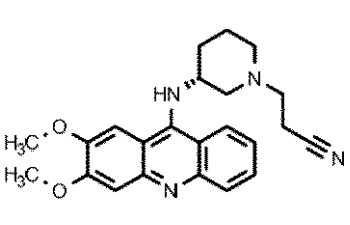
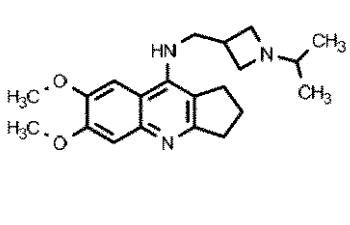
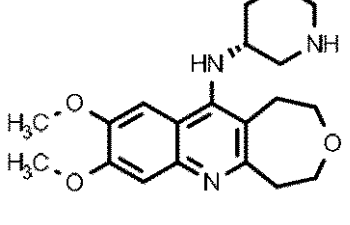
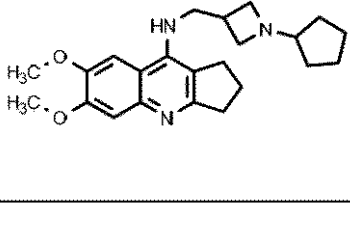
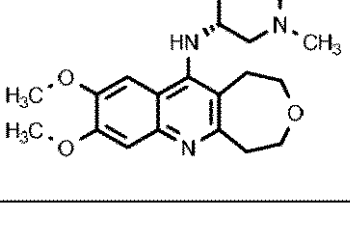
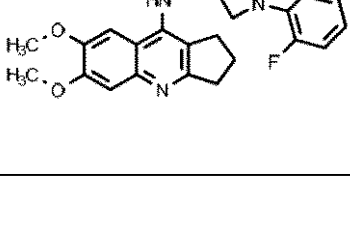
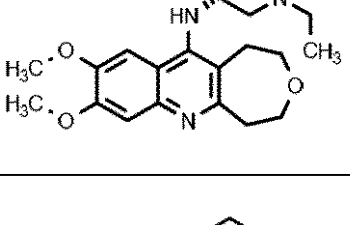
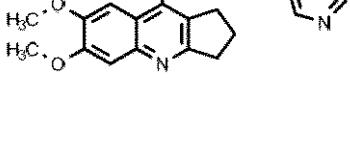
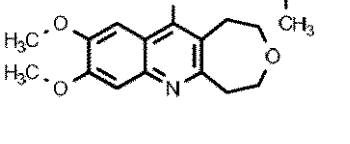
177		213	
178		214	
179		215	
180		216	
181		217	

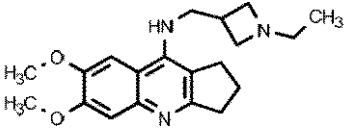
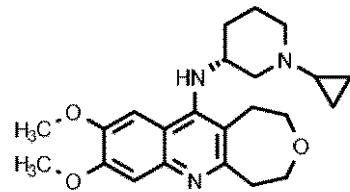
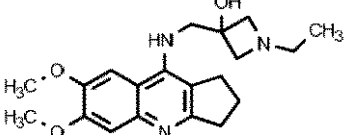
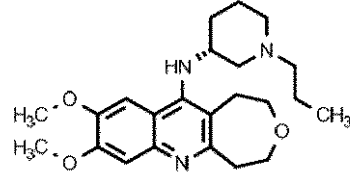
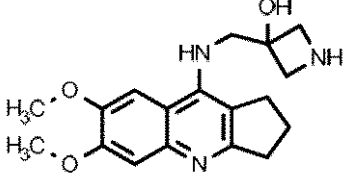
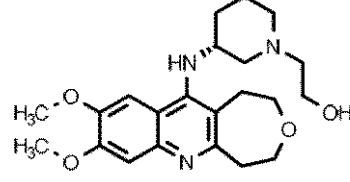
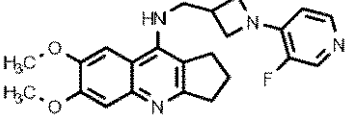
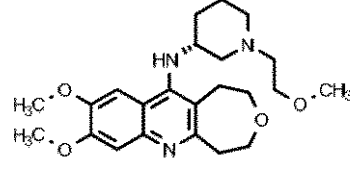
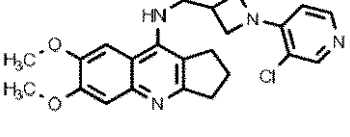
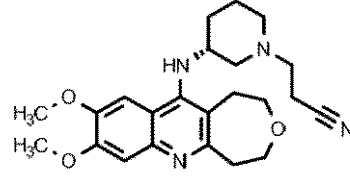
182		218	
183		219	
184		220	
185		221	
186		222	

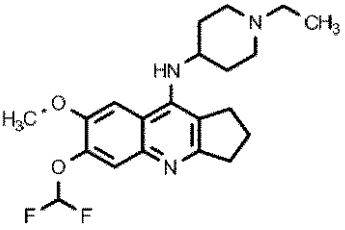
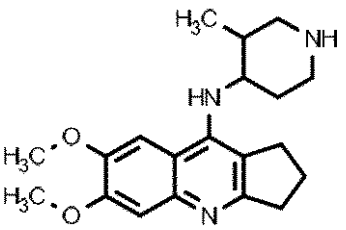
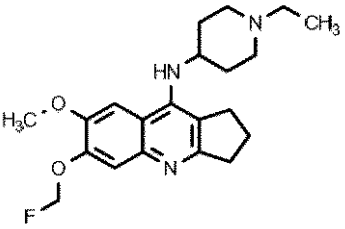
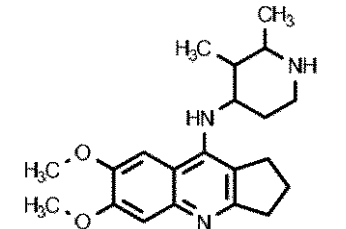
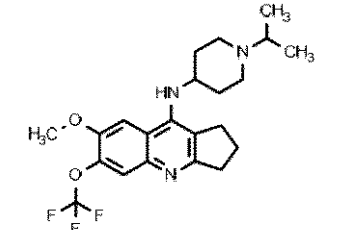
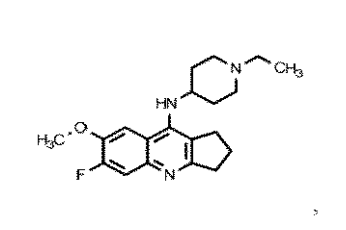
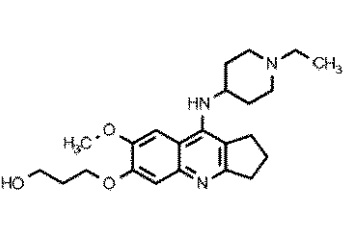
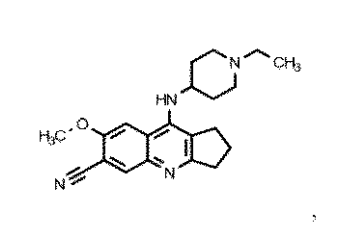
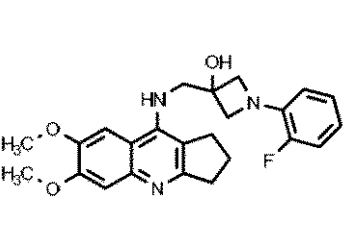
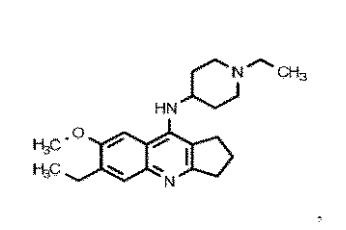
187		223	
188		224	
189		225	
190		226	
191		228	

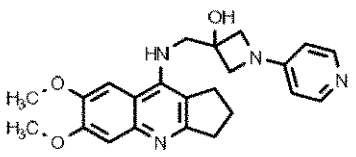
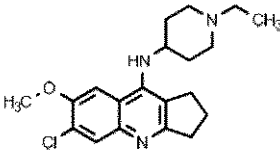
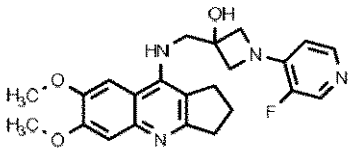
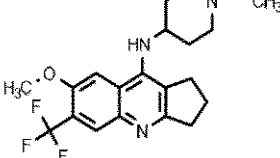
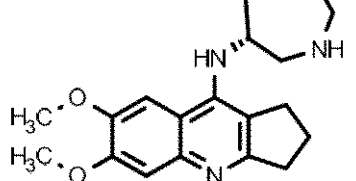
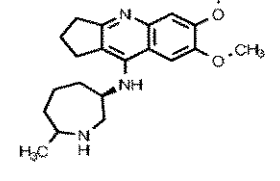
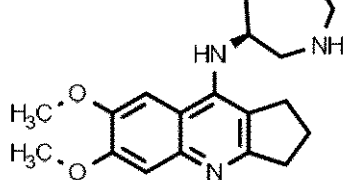
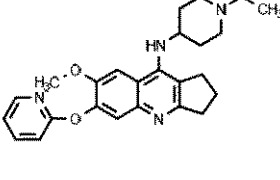
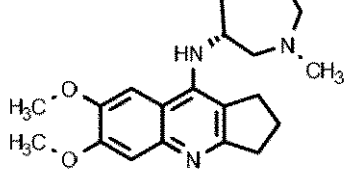
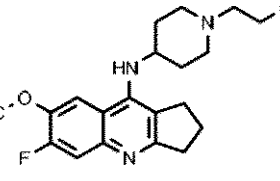
192		229	
193		230	
194		231	
195		232	
196		233	

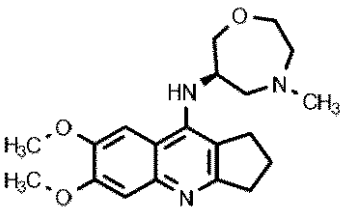
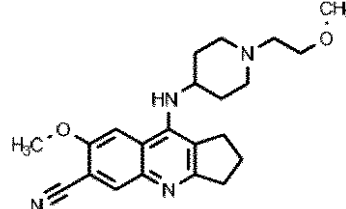
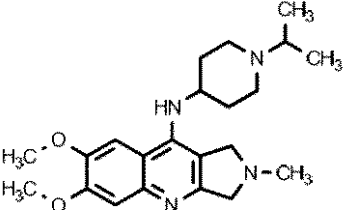
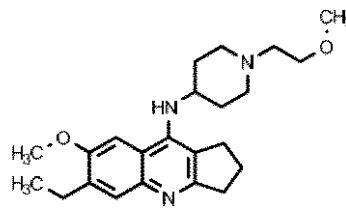
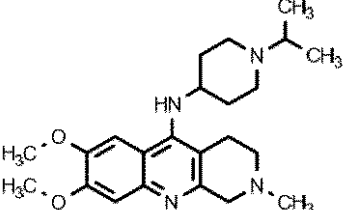
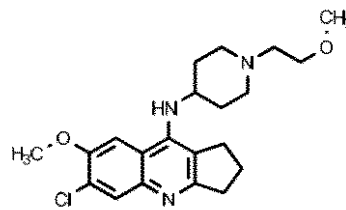
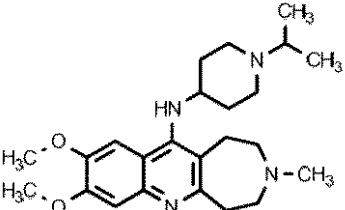
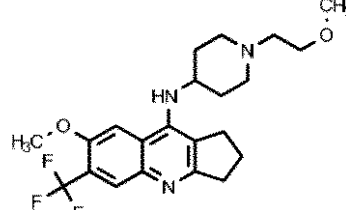
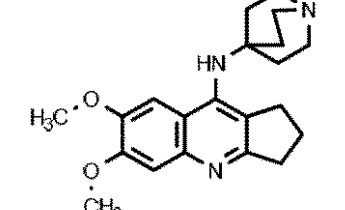
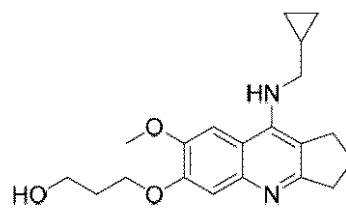
197		234	
198		235	
199		236	
200		237	
251		238	

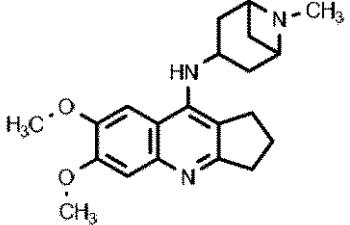
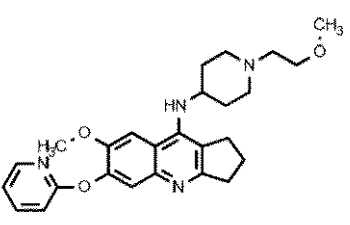
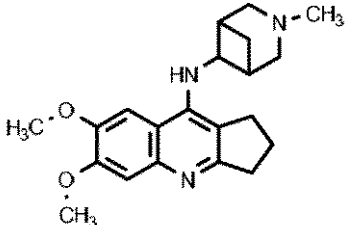
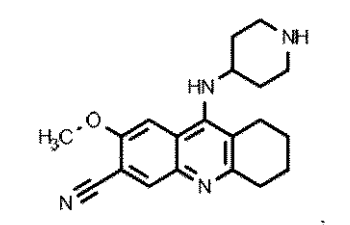
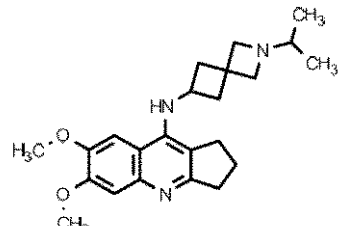
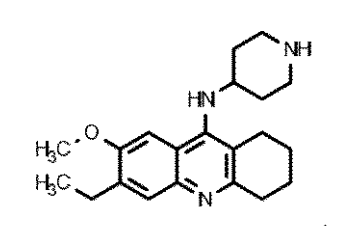
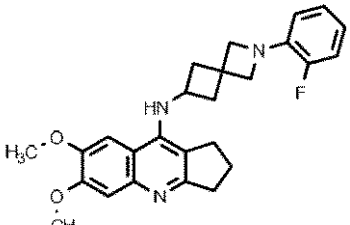
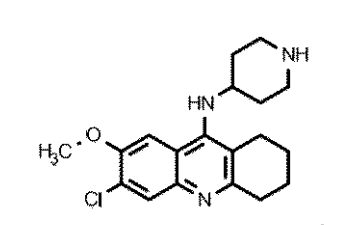
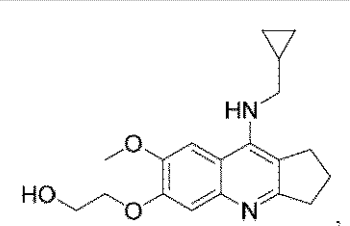
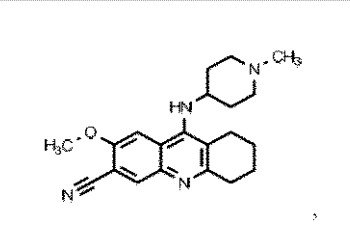
252		239	
253		240	
254		241	
255		242	
256		243	

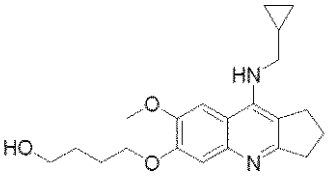
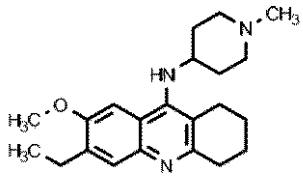
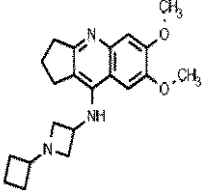
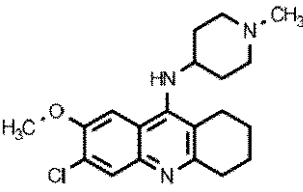
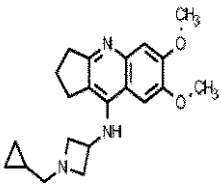
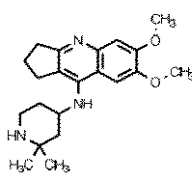
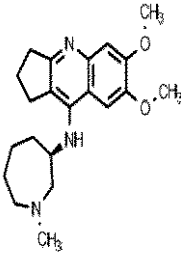
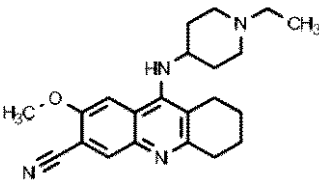
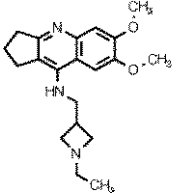
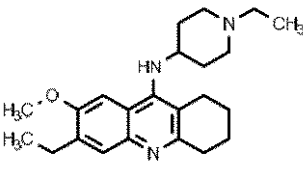
257		244	
258		245	
259		246	
260		247	
261		248	

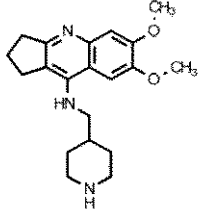
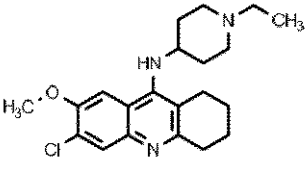
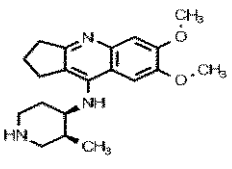
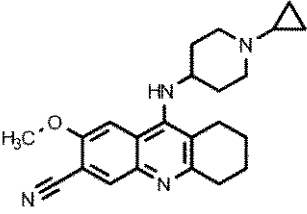
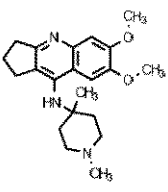
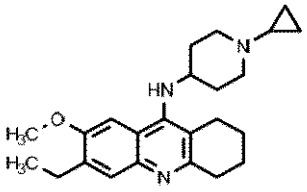
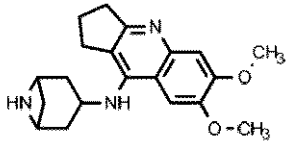
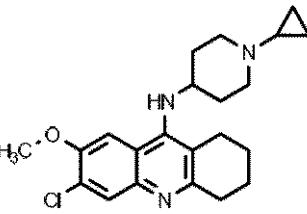
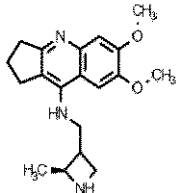
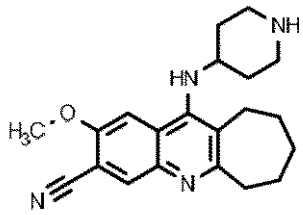
262		249	
263		250	
264		316	
265		317	
266		318	

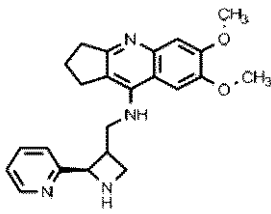
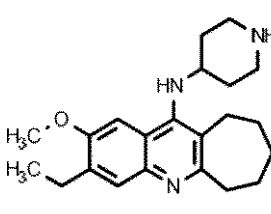
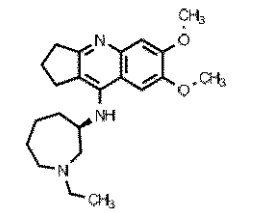
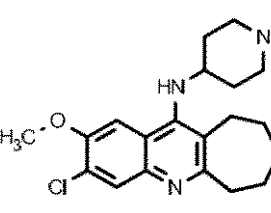
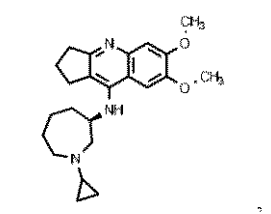
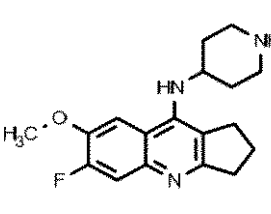
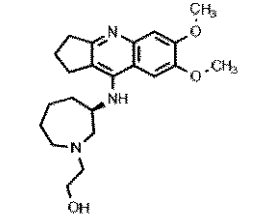
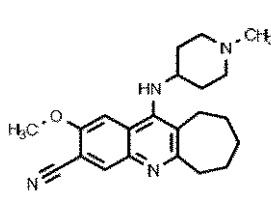
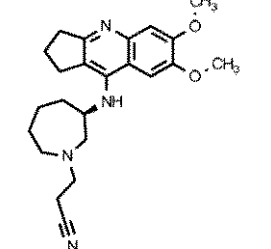
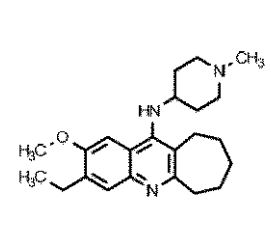
267		319	
268		320	
269		290	
270		322	
271		323	

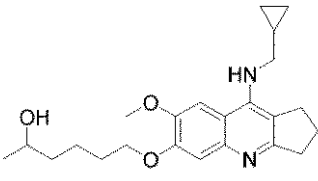
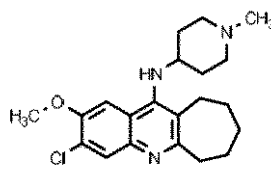
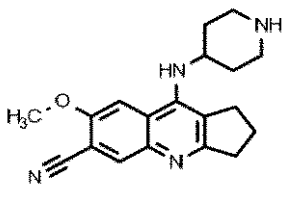
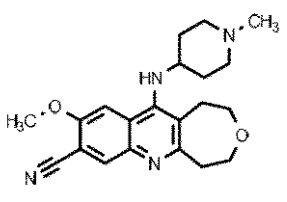
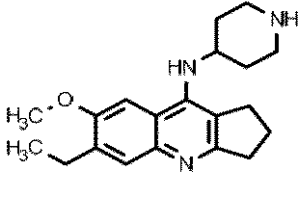
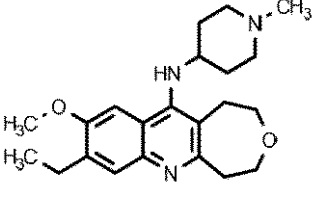
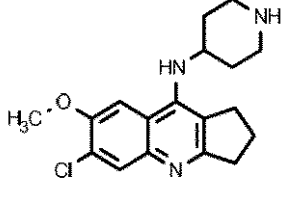
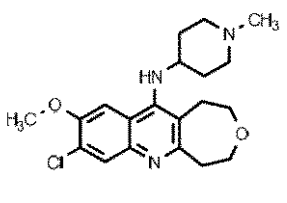
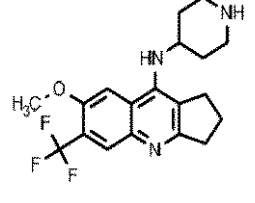
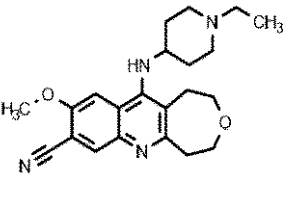
272		324	
273		325	
274		326	
275		327	
276		281	

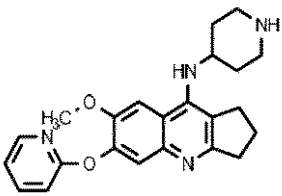
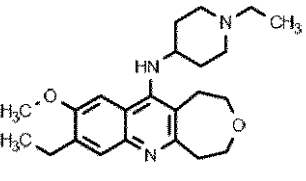
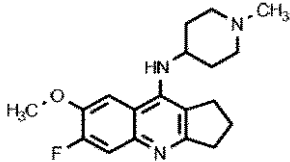
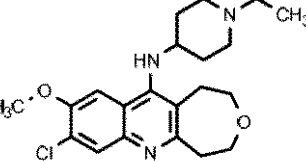
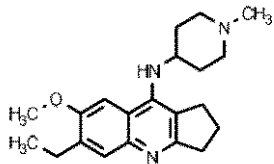
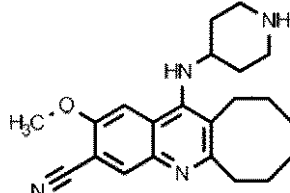
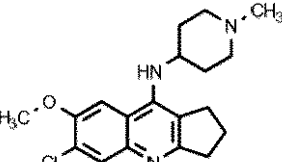
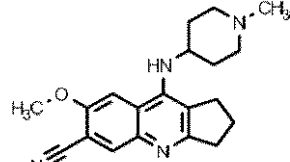
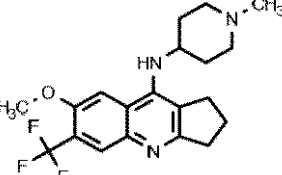
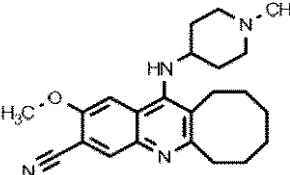
277		329	
278		330	
279		331	
280		332	
282		334	

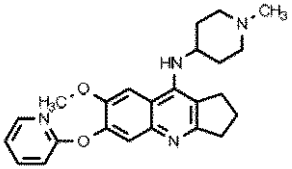
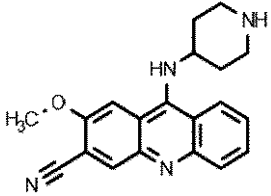
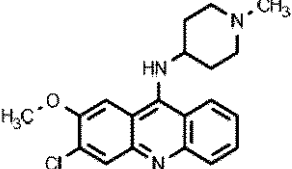
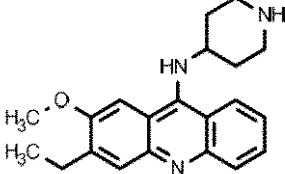
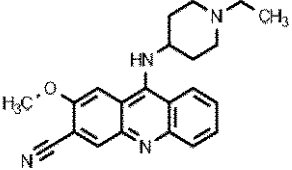
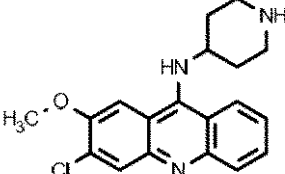
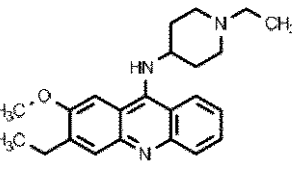
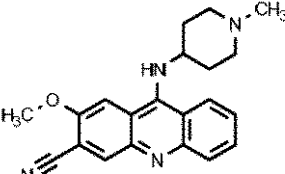
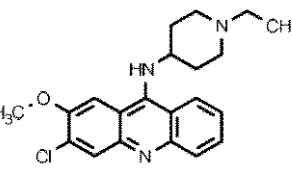
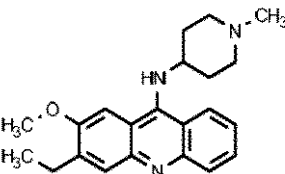
283		335	
284		336	
285		294	
287		338	
288		339	

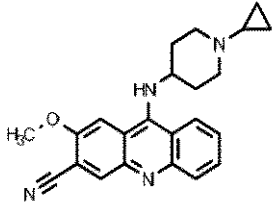
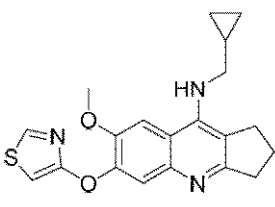
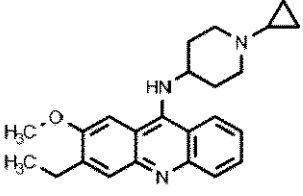
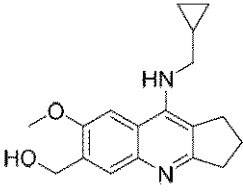
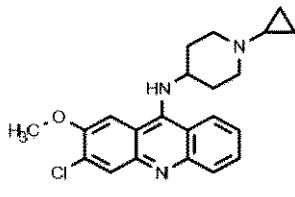
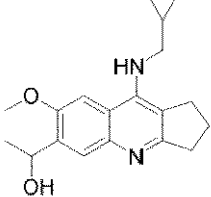
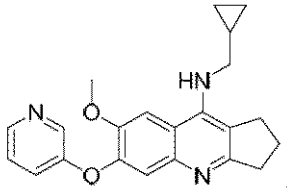
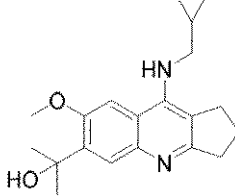
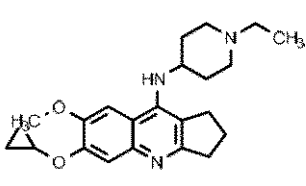
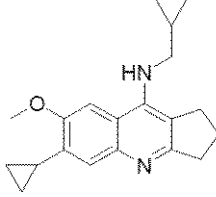
289		340	
291		342	
292		343	
293		344	
295		346	

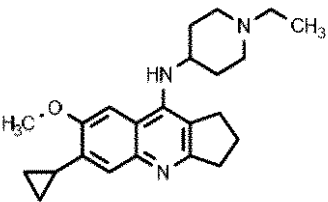
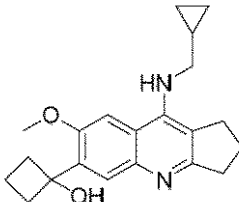
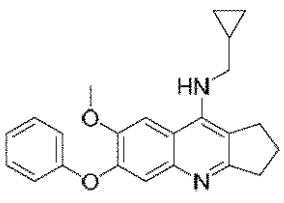
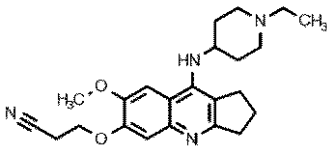
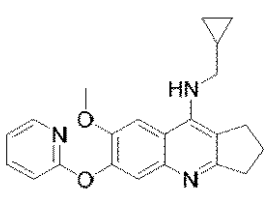
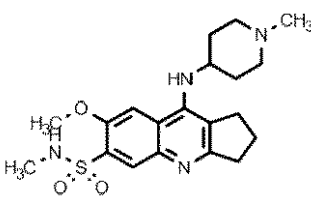
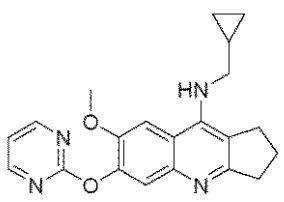
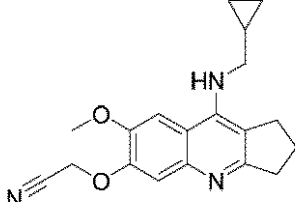
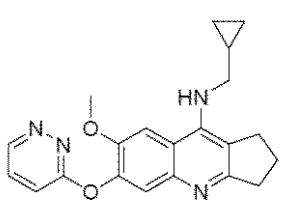
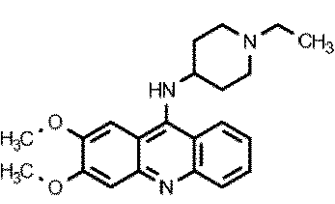
296		347	
297		348	
298		302	
299		350	
300		351	

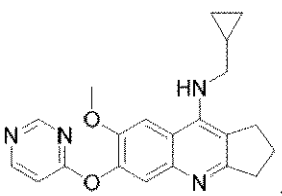
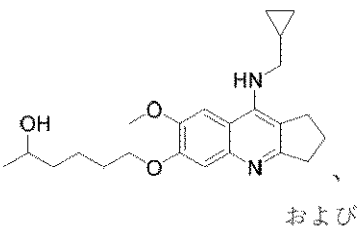
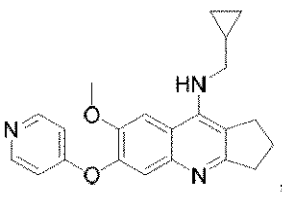
301		352	
303		354	
304		355	
305		356	
306		358	

308		359	
309		360	
311		362	
312		310	
313		364	

315		366	
372		367	
374		368	
375		370	
376		371	

378		391	
379		392	
380		393	
390		394	
382		395	

383		396	
384		397	
385		398	
386		399	
387		400	

388		401	
389			

【請求項 29】

請求項 1 ～ 28 のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、および薬学的に許容される添加剤を含む医薬組成物。

【請求項 30】

G 9 a を阻害する方法において使用するための、請求項 29 に記載の医薬組成物であって、該方法が、G 9 a を含む細胞を治療有効量の請求項 29 に記載の医薬組成物と接触させ、それにより G 9 a の活性を阻害することを含む、医薬組成物。

【請求項 31】

細胞が癌細胞である、請求項 30 に記載の医薬組成物。

【請求項 32】

ヘモグロビン症を改善および / または治療する方法において使用するための、請求項 29 に記載の医薬組成物であって、該方法が、治療有効量の請求項 29 に記載の医薬組成物を、それを必要とする対象に投与することを含む、医薬組成物。

【請求項 33】

ヘモグロビン症が鎌状赤血球症またはベータサラセミアである、請求項 32 に記載の方法。

【請求項 34】

癌を改善および / または治療する方法において使用するための、請求項 29 に記載の医薬組成物であって、該方法が、治療有効量の請求項 29 に記載の医薬組成物を、それを必要とする対象に投与することを含み、癌が以下から選択される、医薬組成物：

結腸直腸癌、骨肉腫癌、急性リンパ芽球性白血病（ALL）。急性骨髄性白血病（AML）；副腎皮質癌、カポジ肉腫（軟部組織肉腫）；エイズ関連リンパ腫（リンパ腫）；原発性 CNS リンパ腫；肛門がん；消化管カルチノイド腫瘍；星細胞腫；非定型奇形腫様 / ラブドイド腫瘍；皮膚の基底細胞癌；胆管がん；膀胱がん；骨がん（ユーイング肉腫、骨肉腫、悪性線維性組織球腫を含む）；脳腫瘍；乳がん；気管支腫瘍；パーキットリンパ腫；心臓腫瘍；胚性腫瘍（脳腫瘍）；胚細胞腫瘍（脳腫瘍）；原発性 CNS リンパ腫；子宮頸癌；胆管癌；脊索腫；慢性リンパ性白血病（CLL）；慢性骨髄性白血病（CML）；慢性骨髄増殖性腫瘍；頭蓋咽頭腫（脳がん）；皮膚 T 細胞リンパ腫；非浸潤性乳管がん（DCIS）；子宮内膜がん（子宮がん）；上衣腫（脳腫瘍）；食道がん；骨芽細胞腫；ユーイング肉腫（骨がん）；頭蓋外胚細胞腫瘍；性腺外胚細胞腫瘍；眼がん；眼内黒色腫；網膜芽細胞腫；卵管がん；骨の線維性組織球腫；胆嚢がん；胃（胃）胃腸間質腫瘍（GIST）（軟部肉腫）；CNS 胚細胞腫瘍（脳腫瘍）；頭蓋外胚細胞腫瘍；性腺外胚細胞腫瘍；卵巣胚細胞腫瘍；精巣腫瘍；妊娠性絨毛性疾患；有毛細胞白血病；頭頸部がん；肝細胞（肝臓）がん；組織球症、ランゲルハンス細胞；ホジキンリンパ腫；下咽頭がん（頭頸部がん）；眼内黒色腫；膵島細胞腫瘍、膵神経内分泌腫瘍；腎臓（腎細胞）がん；ランゲル

ハンス細胞組織球症；喉頭がん（頭頸部がん）；白血病；口唇がんおよび口腔がん（頭頸部がん）；肺がん（非小細胞および小細胞）；リンパ腫；男性の乳がん；黒色腫；メルケル細胞がん（皮膚がん）；中皮腫、悪性中皮腫；原発不明の転移性扁平上皮性頸部がん（頭頸部がん）、NUT遺伝子が関与する正中線癌；口のがん（頭頸部がん）；複数の内分泌腫瘍の症候群；多発性骨髄腫／血漿細胞腫瘍；菌状息肉腫（リンパ腫）；骨髄異形成症候群、骨髄異形成／骨髄増殖性腫瘍；鼻腔および副鼻腔がん（頭頸部がん）；上咽頭がん（頭頸部がん）；上咽頭がん－神経芽腫；非ホジキンリンパ腫；口腔がん；口唇がんおよび口腔がんおよび中咽頭がん（頭頸部がん）；卵巣がん；膵臓がん；乳頭腫症；傍神経節腫；副鼻腔がんおよび鼻腔がん（頭頸部がん）、副甲状腺がん；陰茎がん；咽頭がん（頭頸部がん）；褐色細胞腫；下垂体腫瘍；胸膜肺芽腫；原発性CNSリンパ腫；原発性腹膜がん；前立腺がん；直腸がん；横紋筋肉腫（軟部肉腫）；唾液腺がん（頭頸部がん）；唾液腺腫瘍；血管腫瘍（軟部肉腫）；子宮肉腫；セザリー症候群（リンパ腫）；小腸がん；扁平上皮がん；皮膚ガン；原発不明の転移性扁平上皮性頸部がん（頭頸部がん）、皮膚T細胞リンパ腫；喉のがん（頭頸部がん）；上咽頭がん；中咽頭がん；下咽頭がん；胸腺腫および胸腺がん；甲状腺癌；尿道がん；膣がん；血管腫瘍（軟組織肉腫）；外陰がん；骨髄異形成症候群（MDS）；およびウィルムス腫瘍。

【請求項 35】

癌が以下：骨髄異形成症候群（MDS）；急性骨髄性白血病（AML）；卵巣がん；結腸がん；および非小細胞肺がん（NSCLC）から選択される、請求項 34 に記載の医薬組成物。

【請求項 36】

自己免疫疾患または炎症性疾患を改善および／または治療する方法において使用するための、請求項 29 に記載の医薬組成物であって、該方法が、治療有効量の請求項 29 に記載の医薬組成物を、それを必要とする対象に投与することを含み、自己免疫疾患または炎症性疾患が以下から選択される、医薬組成物：関節炎、アテローム性動脈硬化症、多発性硬化症、重症筋無力症、クローン病、移植片対宿主病、乾癬、肉芽腫性大腸炎、リンパ球大腸炎、膠原性大腸炎、潰瘍性大腸炎、セリアック病、表皮水疱性障害、全身性エリテマトーデス、円板状エリテマトーデス、皮膚ループス、皮膚筋炎、多発性筋炎、シェーグレン症候群、原発性胆汁性肝硬変、活動性慢性肝炎、慢性疲労症候群および血管炎。

【請求項 37】

自己免疫疾患または炎症性疾患が、クローン病、関節リウマチ、全身性エリテマトーデス、全身性硬化症、原発性胆汁性肝硬変および移植片対宿主病から選択される、請求項 36 に記載の医薬組成物。

【請求項 38】

GLPの活性を阻害する方法において使用するための、請求項 29 に記載の医薬組成物であって、該方法が、GLPを含む細胞を有効量の請求項 29 に記載の医薬組成物と接触させ、それによってGLPの活性を阻害することを含む、医薬組成物。

【請求項 39】

胎児ヘモグロビン（HbF）タンパク質レベルを増大させる方法において使用するための、請求項 29 に記載の医薬組成物であって、該方法が、ヘモグロビンの産生障害を特徴とする細胞を有効量の請求項 29 に記載の医薬組成物と接触させ、それによって胎児ヘモグロビン（HbF）タンパク質レベルを増加させることを含む、医薬組成物。

【請求項 40】

ヘモグロビンS分子の重合を阻害する方法において使用するための、請求項 29 に記載の医薬組成物であって、該方法が、ヘモグロビンSの変異を有することを特徴とする細胞を有効量の請求項 29 に記載の医薬組成物と接触させ、それによりヘモグロビンS分子の重合を阻害することを含む、医薬組成物。

【請求項 41】

対象におけるG9a活性を阻害する方法において使用するための、請求項 29 に記載の医薬組成物であって、該方法が、胎児ヘモグロビンによって治療可能な疾患を患っている

対象に有効量の請求項 2 9 に記載の医薬組成物を投与することを含む、医薬組成物。

【請求項 4 2】

対象における G L P 活性を阻害する方法において使用するための、請求項 2 9 に記載の医薬組成物であって、該方法が、胎児ヘモグロビンによって治療可能な疾患を患っている対象に有効量の請求項 2 9 に記載の医薬組成物を投与することを含む、医薬組成物。

【請求項 4 3】

胎児ヘモグロビンで治療可能な疾患に罹患している対象に有効量の請求項 2 9 に記載の医薬組成物を投与することを含む疾患の治療方法において使用するための、請求項 2 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 4】

- グロビンの産生障害を特徴とする疾患の治療方法において使用するための、請求項 2 9 に記載の医薬組成物であって、該方法が、 - グロビンの産生障害を特徴とする対象に有効量の請求項 2 9 に記載の医薬組成物を投与することを含む、医薬組成物。

【請求項 4 5】

疾患がベータサラセミアである、請求項 4 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 6】

重合したヘモグロビン S 分子の濃度増加を特徴とする疾患の治療方法において使用するための、請求項 2 9 に記載の医薬組成物であって、該方法が、重合したヘモグロビン S 分子の濃度増加を特徴とする疾患に罹患している対象に有効量の請求項 2 9 に記載の医薬組成物を投与することを含む、医薬組成物。

【請求項 4 7】

疾患が鎌状赤血球症である、請求項 4 6 に記載の医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 3 2 5

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 3 2 5】

【表 18】

404		(3R)-N-[2,3-ジメトキシ-6H,7H,8H-シクロペンタ[b]1,5-ナフチリジン-9-イル]-1-メチルアゼパン-3-アミン	357.5
405		(3R)-N-[6,7-ジ(2H3)メトキシ-1H,2H,3H-シクロペンタ[b]キノリン-9-イル]ピペリジン-3-アミン	334
406		(3R)-N-[6,7-ジ(2H3)エトキシ-1H,2H,3H-シクロペンタ[b]キノリン-9-イル]ピペリジン-3-アミン	356.1
407		(3R)-N-{6-エトキシ-7-メトキシ-1H,2H,3H-シクロペンタ[b]キノリン-9-イル}ピペリジン-3-アミン	341.9
408		(3S,5R)-N-{6,7-ジメトキシ-1H,2H,3H-シクロペンタ[b]キノリン-9-イル}-5-メチルピペリジン-3-アミン	342.2