

【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2年5月28日(2020.5.28)

【公表番号】特表2020-511542(P2020-511542A)  
 【公表日】令和2年4月16日(2020.4.16)  
 【年通号数】公開・登録公報2020-015  
 【出願番号】特願2020-500788(P2020-500788)  
 【国際特許分類】

C 0 7 D 495/04 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/519 (2006.01)  
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 495/04 1 0 5 Z  
 C 0 7 D 495/04 C S P  
 A 6 1 K 31/519  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】令和1年9月19日(2019.9.19)

【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

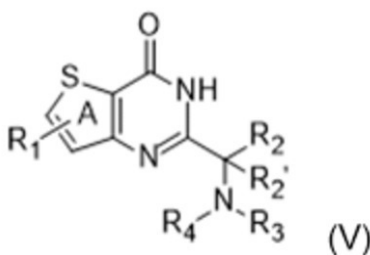
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(V)で表される化合物、又はその薬学上許容される塩。

【化1】



〔式中、R<sub>1</sub>は、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピラゾール及びピリミジニルから選択される芳香族又は非芳香族の置換基を表す。〕

R<sub>1</sub>は、A環上の任意の可能な位置に存在しうる。

A環上に、同一又は異なる2つのR<sub>1</sub>があってもよい。

R<sub>1</sub>は、F、C<sub>1</sub>、N、O及びSから選択される1つ又は複数のヘテロ原子を有していてもよい。

R<sub>1</sub>が芳香環を含む場合、芳香環は環上にN、O及びSから選択される1つ又は複数のヘテロ原子を有していてもよい。

R<sub>1</sub>が芳香環を含む場合、芳香環はC<sub>1</sub> - 6炭化水素基で置換されていてもよい。

R<sub>2</sub>は、C<sub>1</sub> - 20炭化水素を有する脂肪族置換基又はHを表す。

R<sub>2</sub>'は、C<sub>1</sub> - 20炭化水素を有する脂肪族置換基又はHを表す。

R<sub>2</sub>及びR<sub>2</sub>'は、同一であるか又は異なってもよい。

$R_2$  又は  $R_2'$  が H 原子である場合を含めて、 $R_2$  が  $R_2'$  と異なる場合、 $R_2$  及び  $R_2'$  に結合する C 原子上にキラル中心が含まれ、キラル中心の配置は (S) 又は (R) のいずれかであってよい。

$R_3$  は、 $C_{1-20}$  炭化水素を有する脂肪族置換基又は H を表す。

$R_4$  は、 $C_{1-20}$  炭化水素を有する脂肪族置換基又は H を表す。

$R_2$ 、 $R_2'$ 、 $R_3$  及び  $R_4$  は、F、Cl、N、O 及び S から選択される 1 つ又は複数のヘテロ原子を有していてもよい。

$R_2$  及び  $R_2'$  が結合して、3 ~ 8 員環を形成してもよい。

$R_3$  及び  $R_4$  が結合して、3 ~ 8 員環を形成してもよい。

$R_2$  又は  $R_2'$  が  $R_3$  に結合して、3 ~ 8 員環を形成してもよい。

$R_2$  又は  $R_2'$  が  $R_4$  に結合して、3 ~ 8 員環を形成してもよい。]

【請求項 2】

$R_1$  が ピリジルである、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学上許容される塩。

【請求項 3】

$R_1$  が、F 及び Cl から選択される 1 つ又は複数のヘテロ原子置換を有していてもよい、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学上許容される塩。

【請求項 4】

$R_1$  が 芳香環を含む場合、芳香環は Me、Et 及び  $CF_3$  から選択される  $C_{1-6}$  炭化水素基で置換されていてもよい、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学上許容される塩。

【請求項 5】

$R_2$  が、Me、Et、iPr、Pr、サイクPrの置換基のうちの 1 つであり、 $R_2'$  が H である、請求項 4 に記載の化合物又はその薬学上許容される塩。

【請求項 6】

$R_2$  及び  $R_2'$  が結合する炭素原子が (S) 配置を有する、請求項 5 に記載の化合物又はその薬学上許容される塩。

【請求項 7】

$R_3$  及び  $R_4$  が両方とも H である、請求項 5 に記載の化合物、又はその薬学上許容される塩。

【請求項 8】

以下のいずれかの化合物である、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学上許容される塩

- ：
- (S) - 2 - (1 - アミノプロピル) - 6 - (2 - フルオロピリジン - 4 - イル) チエノ [3, 2 - d] ピリミジン - 4 (3H) - オン (化合物 13 a)、
  - (S) - 2 - (1 - アミノ - 2 - メチルプロピル) - 6 - (2 - クロロピリジン - 4 - イル) チエノ [3, 2 - d] ピリミジン - 4 (3H) - オン (化合物 7 a)、
  - (S) - 2 - (1 - アミノ - 2 - メチルプロピル) - 6 - (ピペラジン - 1 - イル) チエノ [3, 2 - d] ピリミジン - 4 (3H) - オン (化合物 67)、
  - (S) - 2 - (1 - アミノ - 2 - メチルプロピル) - 6 - (1H - ピラゾール - 3 - イル) チエノ [3, 2 - d] ピリミジン - 4 (3H) - オン (化合物 7 c)、
  - (S) - 2 - (1 - アミノ - 2 - メチルプロピル) - 6 - (2 - メチルピリジン - 4 - イル) チエノ [3, 2 - d] ピリミジン - 4 (3H) - オン (化合物 7 b)、
  - (S) - 2 - (1 - アミノ - 2 - メチルプロピル) - 6 - (2, 5 - ジフルオロピリジン - 4 - イル) チエノ [3, 2 - d] ピリミジン - 4 (3H) - オン (化合物 7 d)、
  - (S) - 2 - (1 - アミノ - 2 - メチルプロピル) - 6 - (イソキサゾール - 4 - イル) チエノ [3, 2 - d] ピリミジン - 4 (3H) - オン (化合物 7 e)、
  - (S) - 2 - (1 - アミノプロピル) - 6 - (3 - フルオロピリジン - 4 - イル) チエノ [3, 2 - d] ピリミジン - 4 (3H) - オン (化合物 13 b)、
  - (S) - 2 - (1 - アミノエチル) - 6 - (3 - フルオロピリジン - 4 - イル) チエノ [3, 2 - d] ピリミジン - 4 (3H) - オン (化合物 21)、
  - (S) - 2 - (アミノ (シクロプロピル) メチル) - 6 - (3 - フルオロピリジン - 4

-イル)チエノ[3, 2-d]ピリミジン-4(3H)-オン(化合物25)、  
(S)-6-(2-フルオロピリジン-4-イル)-2-(2-メチル-1-(メチル  
アミノ)プロピル)チエノ[3, 2-d]ピリミジン-4(3H)-オン(化合物35)

、  
2-(2-アミノプロパン-2-イル)-6-(2-フルオロピリジン-4-イル)チ  
エノ[3, 2-d]ピリミジン-4(3H)-オン(化合物39)、

(S)-2-(1-アミノ-2-メチルプロピル)-6-(1H-イミダゾール-4-  
イル)チエノ[3, 2-d]ピリミジン-4(3H)-オン(化合物45)、

(S)-2-(1-アミノ-2-メチルプロピル)-6-(ピリダジン-4-イル)チ  
エノ[3, 2-d]ピリミジン-4(3H)-オン(化合物49)、

(S)-2-(1-アミノ-2-メチルプロピル)-6-(ピリミジン-4-イル)チ  
エノ[3, 2-d]ピリミジン-4(3H)-オン(化合物53)、

(S)-2-(1-アミノ-2-メチルプロピル)-6-(2H-1, 2, 3-トリア  
ゾール-4-イル)チエノ[3, 2-d]ピリミジン-4(3H)-オン(化合物58)

、又は

(S)-2-(1-アミノ-2-メチルプロピル)-6-(1H-ピロール-3-イル  
)チエノ[3, 2-d]ピリミジン-4(3H)-オン(化合物65)。

**【請求項9】**

有効量の請求項1~8の化合物を対象に投与することを含む、CDC7関連疾患を治療する方法。

**【請求項10】**

薬学上許容される担体又は希釈剤、及び請求項1~8のいずれかに記載の化合物又はその薬学上許容される塩を含む医薬組成物。