

【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12月9日(2021.12.9)

【公表番号】特表2021-525270(P2021-525270A)

【公表日】令和3年9月24日(2021.9.24)

【年通号数】公開・登録公報2021-045

【出願番号】特願2020-565928(P2020-565928)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/14	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/28	(2006.01)
A 6 1 P 35/00	(2006.01)
A 6 1 P 35/02	(2006.01)
A 6 1 P 35/04	(2006.01)
A 6 1 P 19/02	(2006.01)
A 6 1 P 1/04	(2006.01)
A 6 1 P 37/06	(2006.01)
A 6 1 P 37/02	(2006.01)
A 6 1 P 11/00	(2006.01)
A 6 1 P 7/00	(2006.01)
A 6 1 P 9/10	(2006.01)
A 6 1 P 25/00	(2006.01)
A 6 1 P 3/10	(2006.01)
A 6 1 P 3/04	(2006.01)
A 6 1 P 3/06	(2006.01)
A 6 1 P 19/10	(2006.01)
A 6 1 P 19/08	(2006.01)
A 6 1 P 15/08	(2006.01)
A 6 1 P 25/04	(2006.01)
A 6 1 P 27/06	(2006.01)
A 6 1 P 25/16	(2006.01)
A 6 1 P 25/02	(2006.01)
A 6 1 P 25/14	(2006.01)
A 6 1 P 21/00	(2006.01)
A 6 1 K 45/00	(2006.01)
A 6 1 K 31/4709	(2006.01)
C 0 7 D 405/14	(2006.01)
C 0 7 D 401/12	(2006.01)
A 6 1 K 31/501	(2006.01)
C 0 7 D 413/14	(2006.01)
C 0 7 D 409/14	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 401/14	C S P
A 6 1 P 43/00	1 1 1
A 6 1 P 29/00	
A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 35/00	
A 6 1 P 35/02	

A 6 1 P	35/04	
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	7/00	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	3/06	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	19/08	
A 6 1 P	15/08	
A 6 1 P	25/04	
A 6 1 P	27/06	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/02	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 K	45/00	1 0 1
A 6 1 K	31/4709	
C 0 7 D	405/14	
C 0 7 D	401/12	
A 6 1 K	31/501	
C 0 7 D	413/14	
C 0 7 D	409/14	

## 【手続補正書】

【提出日】令和3年11月1日(2021.11.1)

## 【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

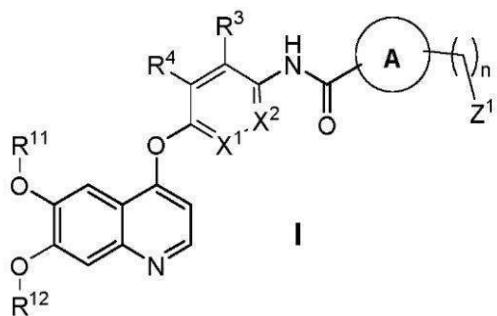
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

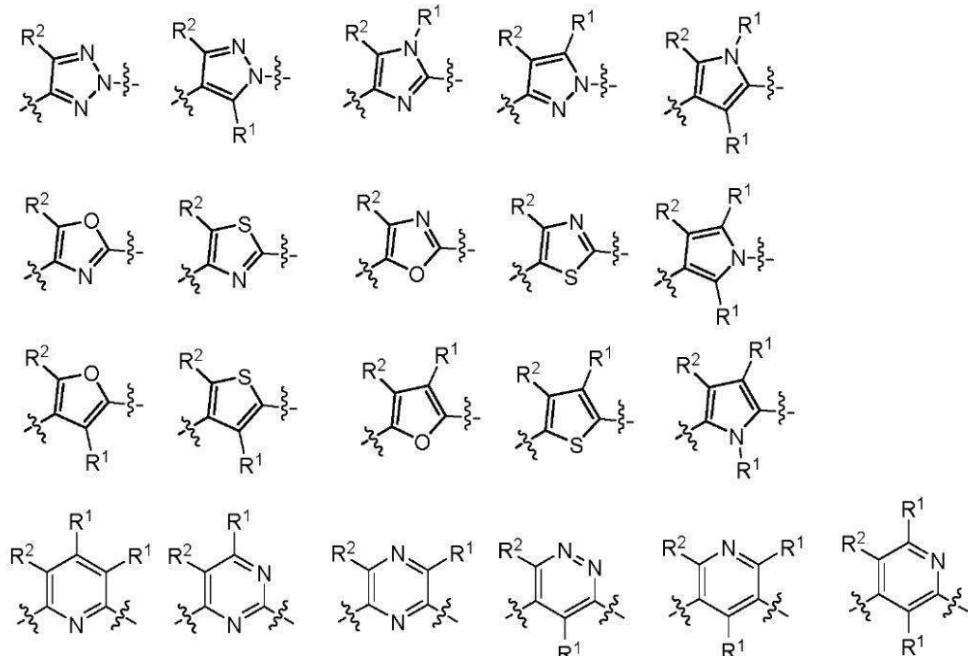
一般式I:

## 【化45】



を有する化合物、およびその薬学的に許容される塩であって、式中、  
 $X^1$  は、存在する各々において独立して、C R<sup>3</sup> およびNから選択され、  
 $X^2$  は、存在する各々において独立して、C R<sup>4</sup> およびNから選択され、  
n は、存在する各々において独立して、0、1 および 2 から選択され、  
A は、存在する各々において、以下のW基；  
【化46】

【化 4 6】



w 基

に示されているいずれかの構造から独立して選択され、

$R^1$  は、存在する各々において、水素； $C_1 \sim C_6$  アルキル； $OR^5$  および $NR^5R^6$  のうちの 1 つまたは 2 つで置換されている $C_1 \sim C_6$  アルキル； $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル； $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル；- ( $C = O$ )  $R^5$  からなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されており、

$R^2$  は、存在する各々において、 $C_1 \sim C_6$  アルキル； $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル； $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル； $-NR^7R^8$ ； $-OR^8$  からなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されており、

$R^3$  および  $R^4$  は、存在する各々において、水素；ハロゲン、例えば、Cl または F；C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキル；OR<sup>5</sup>；C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されており、

$R^5$  および  $R^6$  は、存在する各々において、水素； $C_1 \sim C_6$  アルキル； $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル； $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されており、

$R^7$  は、存在する各々において、水素； $C_1 \sim C_6$  アルキル； $OR^5$  および $NR^5R^6$  のうちの 1 つまたは 2 つで置換されている  $C_1 \sim C_6$  アルキル； $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル； $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されており、

$R^8$  は、存在する各々において、水素； $-CH(CH_3)_2$ ； $-C(CH_3)_3$ ； $C_3-C_{10}$  シクロアルキル； $C_3-C_{10}$  ヘテロシクロアルキル； $C_1-C_4$  ハロアルキル； $OR^5$  および  $NR^5R^6$  のうちの 1 つまたは 2 つで置換されている  $C_1-C_6$  アルキル；ならびに  $C_3-C_{10}$  シクロアルキル、 $C_3-C_{10}$  ヘテロシクロアルキルおよび  $C_1-C_6$

$C_4$  ハロアルキルのうちの 1 つまたは 2 つで置換されている  $C_1 \sim C_6$  アルキルからなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されており、

$Z^1$  は、存在する各々において、水素； $C_1 \sim C_6$  アルキル；(=O)、CN、OR<sup>5</sup> およびNR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> のうちの 1 つまたは 2 つで置換されている  $C_1 \sim C_6$  アルキル； $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル；ハロゲン、OR<sup>7</sup> およびNR<sup>9</sup>R<sup>10</sup> のうちの 1 つまたはいくつかで置換されている  $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル； $C_3 \sim C_{10}$  ヘテロシクロアルキル；ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキルおよび $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルのうちの 1 つまたはいくつかで置換されている  $C_3 \sim C_{10}$  ヘテロシクロアルキル； $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から独立して選択され、

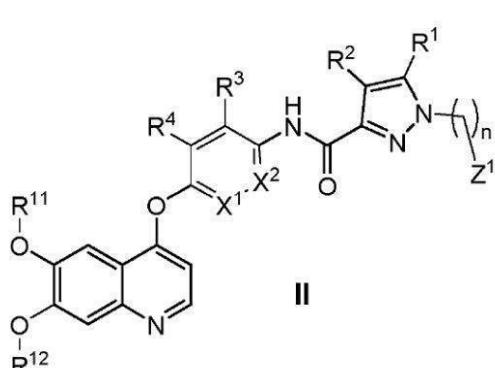
$R^9$  および  $R^{10}$  は、存在する各々において、水素； $C_1 \sim C_6$  アルキル； $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル； $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されており、

$R^{11}$  および  $R^{12}$  は、存在する各々において、 $C_1 \sim C_6$  アルキル； $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル； $C_3 \sim C_{10}$  ヘテロシクロアルキル； $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されている、化合物およびその薬学的に許容される塩。

### 【請求項 2】

一般式 II :

### 【化 4 7】

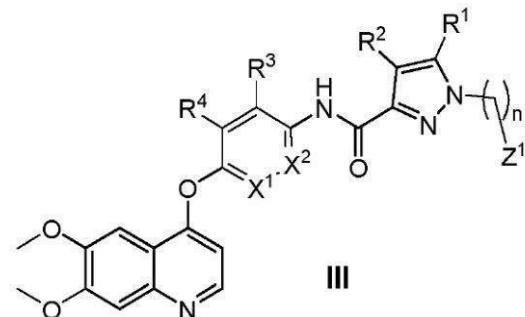


を有する請求項 1 に記載の化合物、およびその薬学的に許容される塩であって、式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $Z^1$ 、 $X^1$ 、 $X^2$  および  $n$  は請求項 1 で定義された通りである、請求項 1 に記載の化合物、およびその薬学的に許容される塩。

### 【請求項 3】

一般式 III :

### 【化 4 8】



を有する請求項 1 および 2 のいずれかに記載の化合物、およびその薬学的に許容される塩であって、式中、

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $Z^1$ 、 $X^1$ 、 $X^2$  および  $n$  は請求項 1 で定義された通りであり

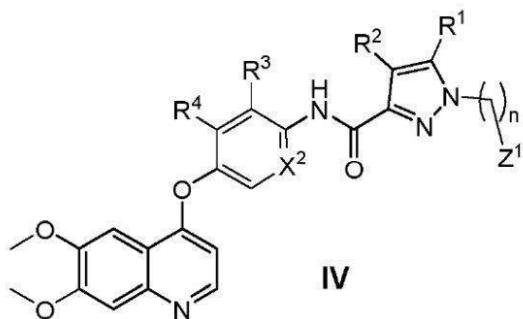
、  
好ましくは、

$R^3$  および  $R^4$  が、存在する各々において、水素；ハロゲン、例えば、C1またはF；必要に応じて置換されているC1～C3アルキルからなる群から独立して選択され、 $R^8$  は、存在する各々において、水素；-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>；-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>；C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルキル；C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル；OR<sup>5</sup> およびNR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>のうちの1つまたは2つで置換されているC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル；またはC<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルキルおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルのうちの1つまたは2つで置換されているC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルからなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されており、Z<sup>1</sup> が、存在する各々において、水素；C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル；OR<sup>5</sup> およびNR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>のうちの1つまたは2つで置換されているC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル；C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルキル；ハロゲン、OR<sup>7</sup> およびNR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>のうちの1つまたはいくつかで置換されているC<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルキル；C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルキル；ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルキルおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルのうちの1つまたはいくつかで置換されているC<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルキル；C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から独立して選択される、化合物およびその薬学的に許容される塩。

【請求項4】

一般式IV：

【化49】



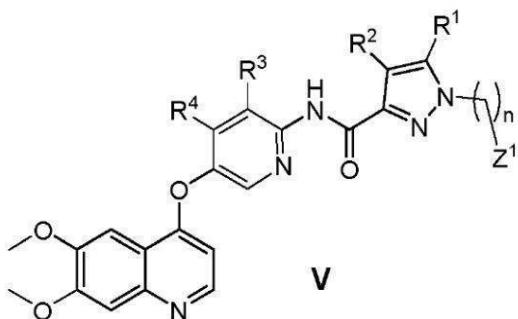
を有する、請求項1から3のいずれかに記載の化合物、およびその薬学的に許容される塩であって、式中、

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $Z^1$ 、 $X^2$  および  $n$  は、請求項1から3のいずれかに定義されている通りである、化合物およびその薬学的に許容される塩。

【請求項5】

一般式V：

【化50】



を有する、請求項1から4のいずれかに記載の化合物、およびその薬学的に許容される塩であって、式中、

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $Z^1$  および  $n$  は、請求項1から4のいずれかに定義されている通りであるり、

好ましくは、

$R^3$  および  $R^4$  が水素である、

化合物およびその薬学的に許容される塩。

【請求項 6】

$n = 0$  または 1 であり、 $Z^1$  が、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、特にメチル、エチル、プロピルまたはイソプロピル； $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル、特に  $C_3$  シクロアルキル； $C_3 \sim C_{10}$  ヘテロシクロアルキル； $OR^5$  および  $NR^5R^6$  のうちの 1 つまたは 2 つで置換されている  $C_1 \sim C_6$  アルキルから選択される、請求項 1 から 5 のいずれかに記載の化合物、およびその薬学的に許容される塩。

【請求項 7】

$R^2$  が  $OR^8$  であり、 $R^8$  が  $-CH(CH_3)_2$ ； $-C(CH_3)_3$ ； $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル； $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$  ヘテロシクロアルキルおよび  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルのうちの 1 もしくは 2 つで置換されている  $C_1 \sim C_6$  アルキル；または  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、特にトリフルオロメチル、ジフルオロメチル、フルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロエチル、フルオロエチル、トリフルオロプロピル、ジフルオロプロピル、フルオロプロピル、トリフルオロイソプロピル、ジフルオロイソプロピル、およびフルオロイソプロピルのうちの 1 つで置換されている  $C_1 \sim C_6$  アルキルから選択される、請求項 1 から 6 のいずれかに記載の化合物、およびその薬学的に許容される塩。

【請求項 8】

$n = 0$  または 1 であり、 $Z^1$  が、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、特にメチル、エチル、プロピルまたはイソプロピル； $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル、特に  $C_3$  シクロアルキル； $C_3 \sim C_{10}$  ヘテロシクロアルキル； $OR^5$  および  $NR^5R^6$  のうちの 1 つまたは 2 つで置換されている  $C_1 \sim C_6$  アルキルから選択され、 $R^5$  および  $R^6$  が、存在する各々において、水素； $C_1 \sim C_6$  アルキル； $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル； $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルからなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されており、

$R^2$  が  $OR^8$  であり、 $R^8$  が、 $-CH(CH_3)_2$ ； $-C(CH_3)_3$ ； $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル； $C_3 \sim C_{10}$  シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$  ヘテロシクロアルキルおよび  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルのうちの 1 つまたは 2 つで置換されている  $C_1 \sim C_6$  アルキル；または  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、特にトリフルオロメチル、ジフルオロメチル、フルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロエチル、フルオロエチル、トリフルオロプロピル、ジフルオロプロピル、フルオロプロピル、トリフルオロイソプロピル、ジフルオロイソプロピル、およびフルオロイソプロピルのうちの 1 つで置換されている  $C_1 \sim C_6$  アルキルから選択される。

請求項 6 および 7 のいずれかに記載の化合物、ならびにその薬学的に許容される塩。

【請求項 9】

$R^2$  が  $OR^8$  であり、 $R^8$  が、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、特にトリフルオロメチル、ジフルオロメチル、フルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロエチル、フルオロエチル、トリフルオロプロピル、ジフルオロプロピル、フルオロプロピル、トリフルオロイソプロピル、ジフルオロイソプロピル、およびフルオロイソプロピルのうちの 1 つ；または  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、特にトリフルオロメチル、ジフルオロメチル、フルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロエチル、フルオロエチル、トリフルオロプロピル、ジフルオロプロピル、フルオロプロピル、トリフルオロイソプロピル、ジフルオロイソプロピル、およびフルオロイソプロピルのうちの 1 つで置換されている  $C_1 \sim C_6$  アルキルから選択される、先行する請求項のいずれかに記載の化合物。

【請求項 10】

$n = 0$  または 1 であり、 $Z^1$  が、メチル；エチル；プロピル；イソプロピル； $C_3$  シクロアルキル； $C_4$  シクロアルキル；および  $C_5$  シクロアルキルから選択される、先行する請求項のいずれかに記載の化合物。

【請求項 11】

$n = 0$  または  $1$  であり、 $Z^1$  が、メチル；エチル；プロピル；イソプロピル； $C_3$  シクロアルキル； $C_4$  シクロアルキル；および  $C_5$  シクロアルキルから選択され、 $R^2$  が  $OR^8$  であり、 $R^8$  が、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、特にトリフルオロメチル、ジフルオロメチル、フルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロエチル、フルオロエチル、トリフルオロプロピル、ジフルオロプロピル、フルオロプロピル、トリフルオロイソプロピル、ジフルオロイソプロピル、およびフルオロイソプロピルのうちの 1 つ；または  $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、特にトリフルオロメチル、ジフルオロメチル、フルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロエチル、フルオロエチル、トリフルオロプロピル、ジフルオロプロピル、フルオロプロピル、トリフルオロイソプロピル、ジフルオロイソプロピル、およびフルオロイソプロピルのうちの 1 つで置換されている  $C_1 \sim C_6$  アルキルから選択される、請求項 9 および 10 のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 12】

これより以下に示されている構造のうちの 1 つを有する、先行する請求項のいずれかに記載の化合物。

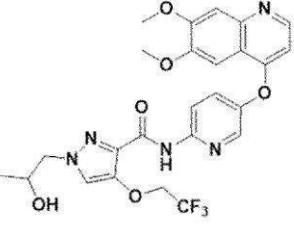
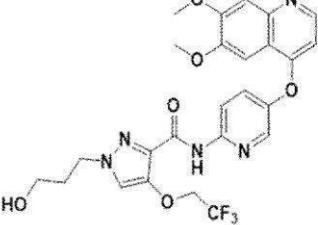
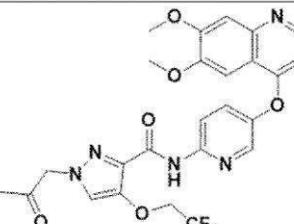
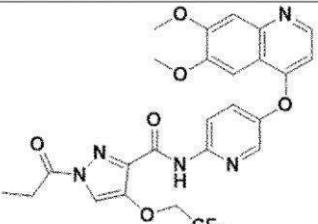
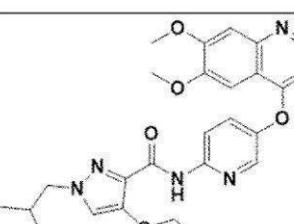
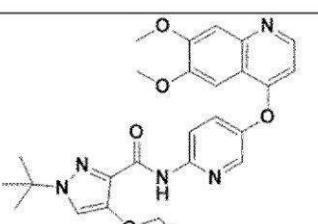
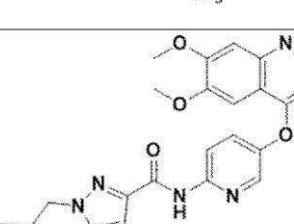
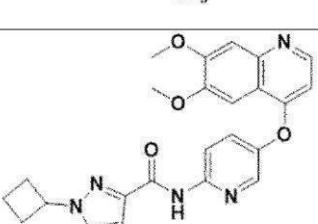
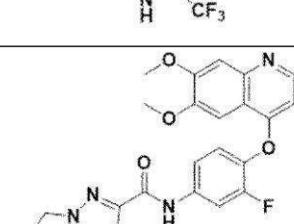
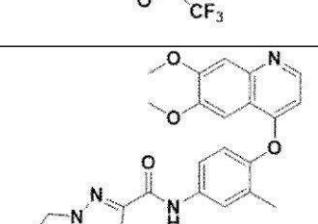
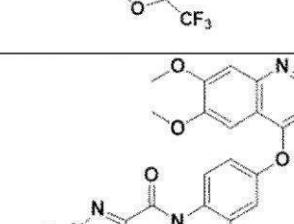
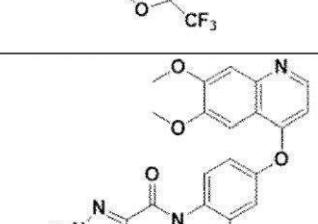
## 【化 51】

化合物番号	構造	化合物番号	構造
1		2	
3		4	

## 【化52】

5		6	
7		8	
9		10	
11		12	
13		14	
15		16	

## 【化53】

17		18	
19		20	
21		22	
23		24	
25		26	
27		28	

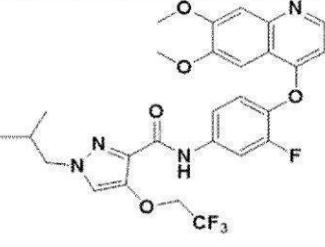
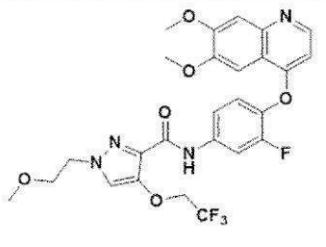
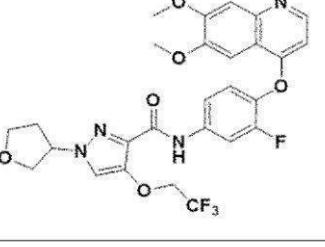
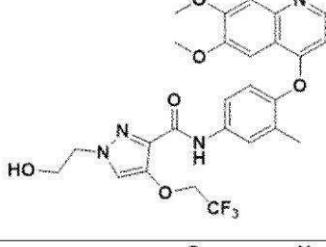
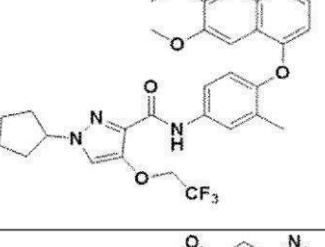
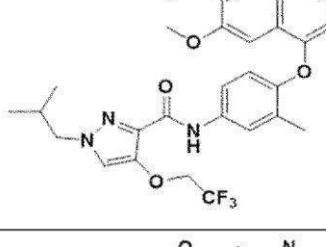
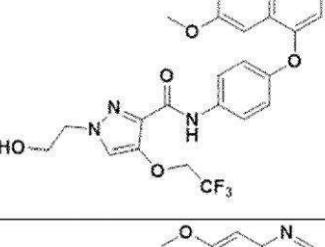
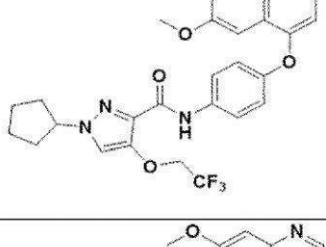
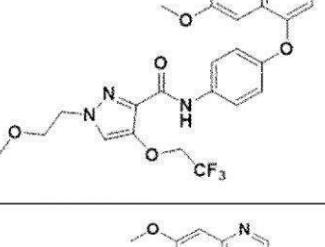
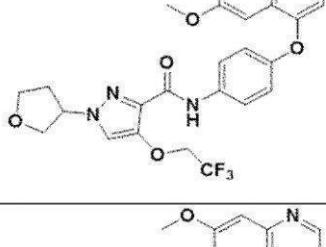
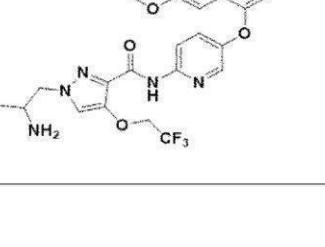
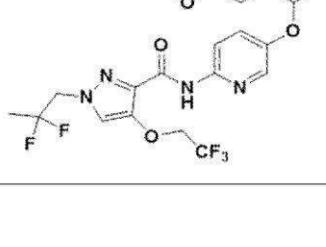
【化 5 4】

29		30	
31		32	
33		34	
35		36	
37		38	
39		40	

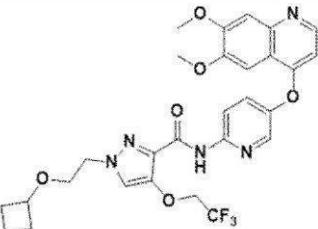
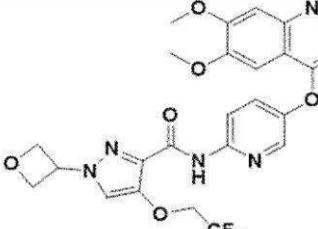
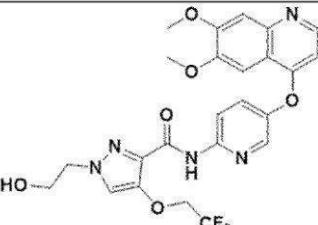
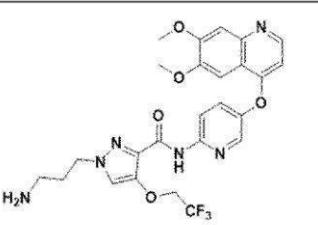
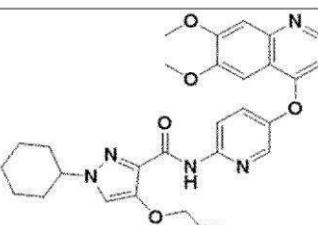
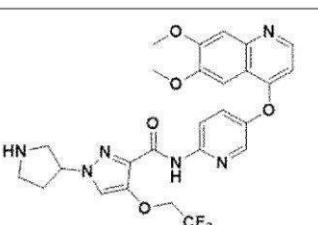
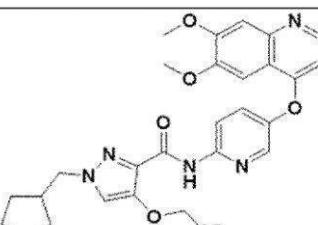
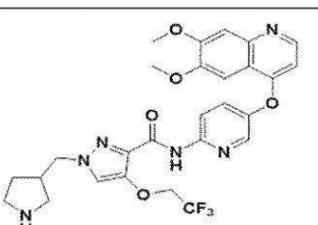
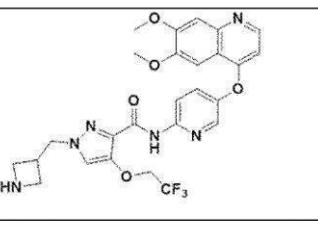
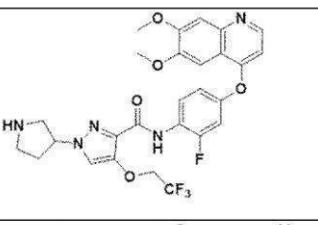
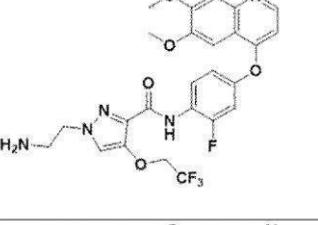
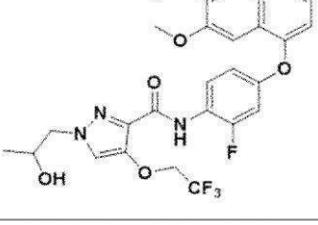
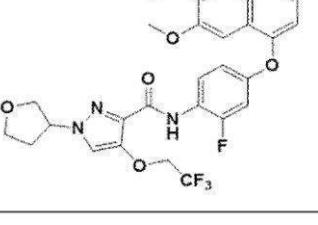
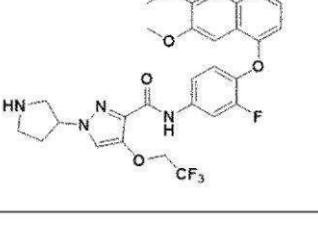
【化 5 5】

41		42	
43		44	
45		46	
47		48	
49		50	
51		52	

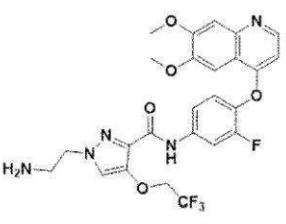
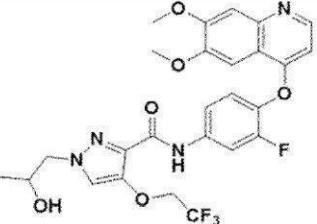
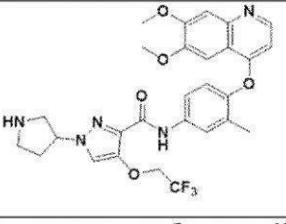
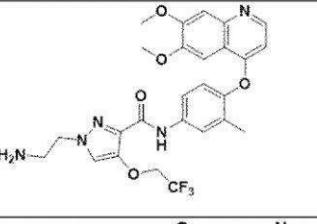
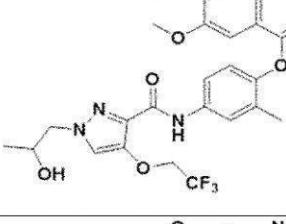
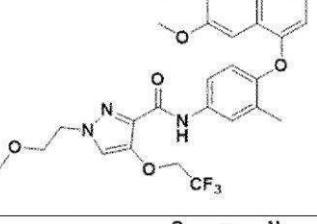
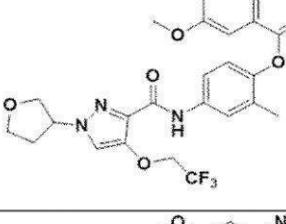
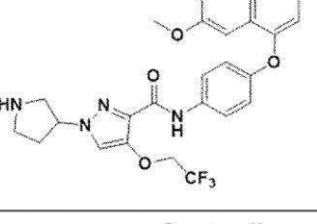
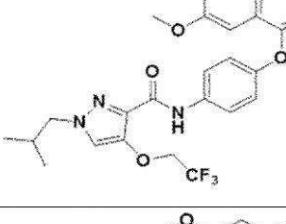
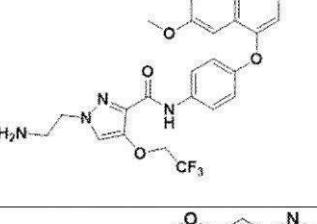
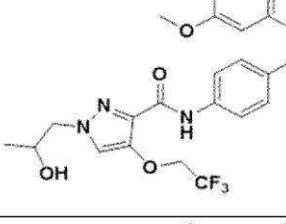
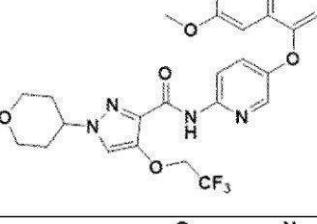
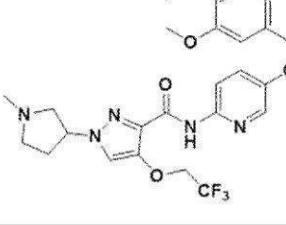
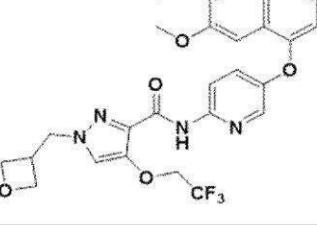
【化56】

53		54	
55		56	
57		58	
59		60	
61		62	
63		64	

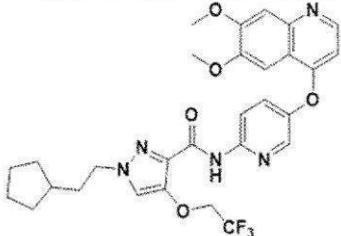
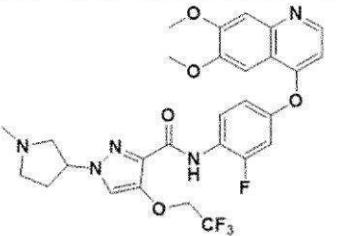
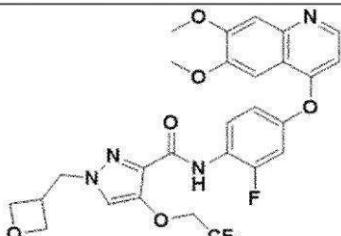
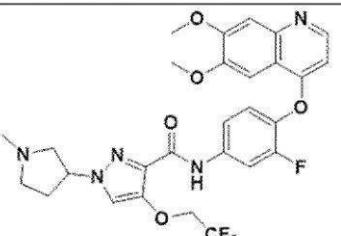
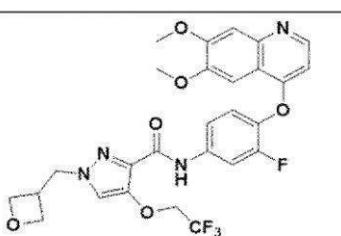
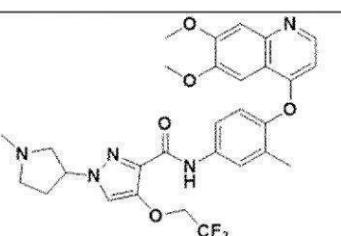
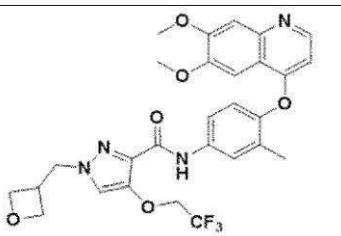
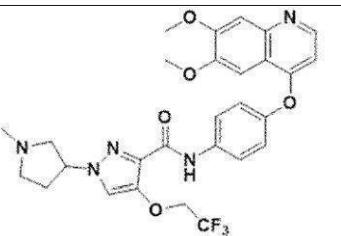
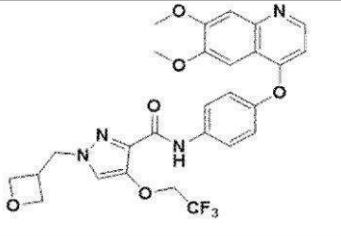
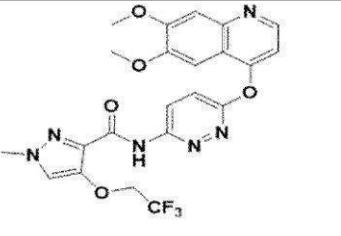
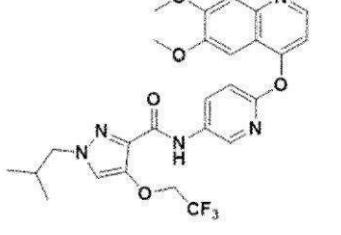
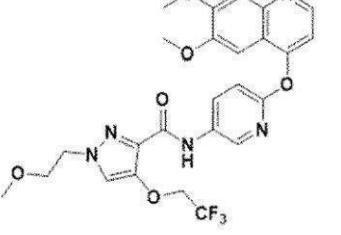
【化 5 7】

65		66	
67		68	
69		70	
71		72	
73		74	
75		76	
77		78	

## 【化 5 8】

79		80	
81		82	
83		84	
85		86	
87		88	
89		90	
91		92	

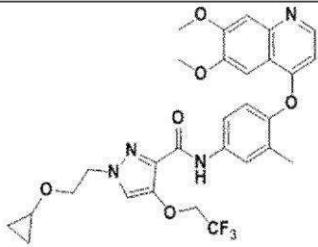
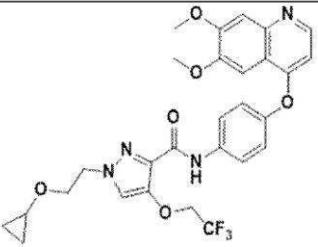
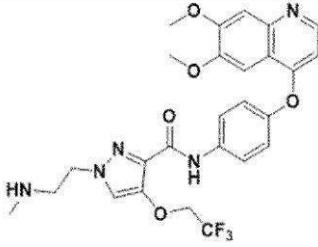
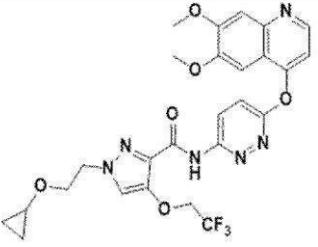
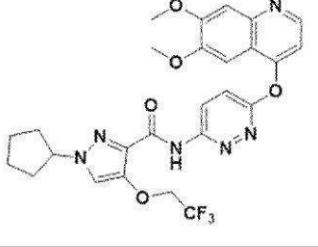
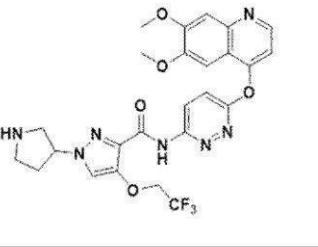
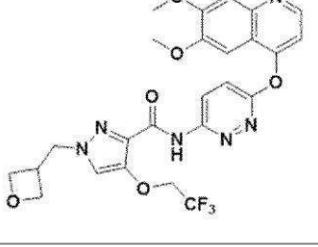
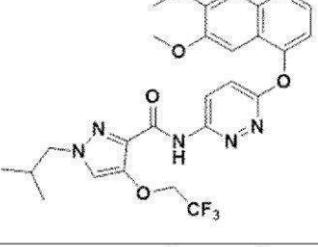
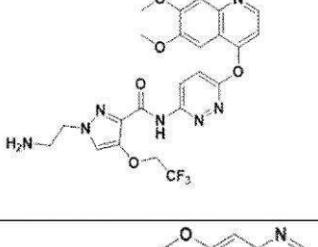
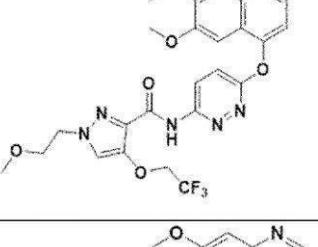
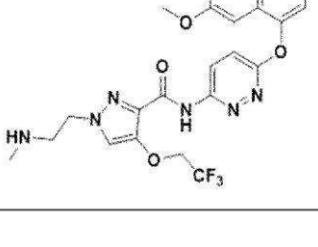
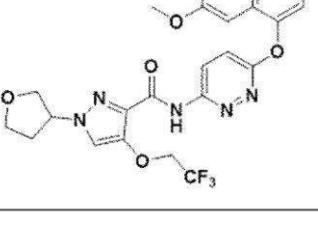
## 【化59】

93		94	
95		96	
97		98	
99		100	
101		102	
103		104	

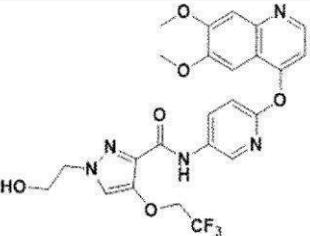
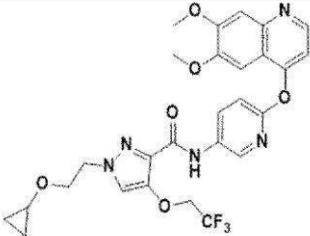
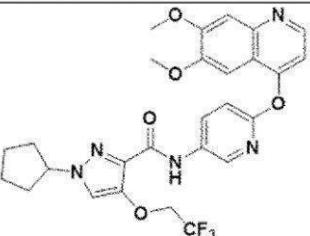
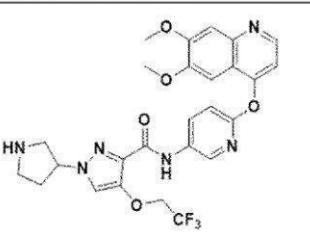
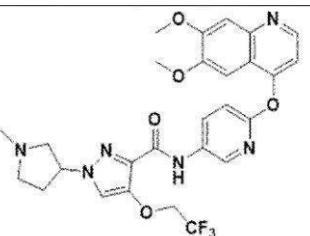
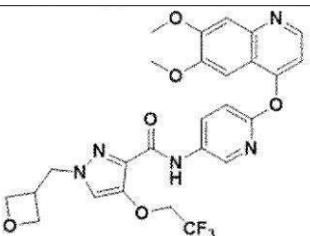
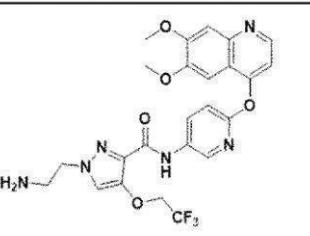
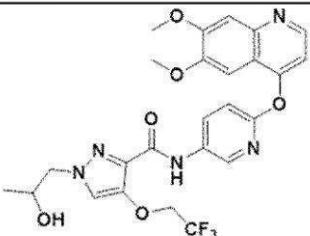
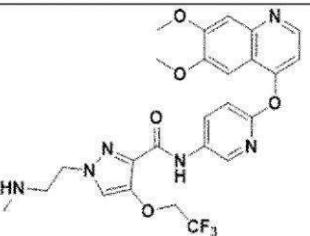
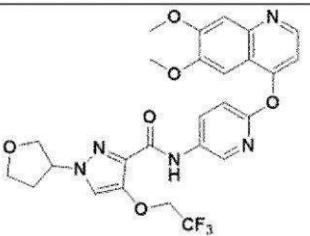
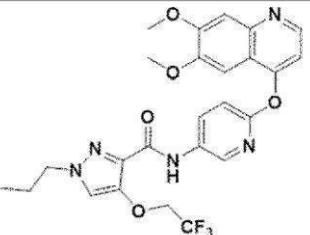
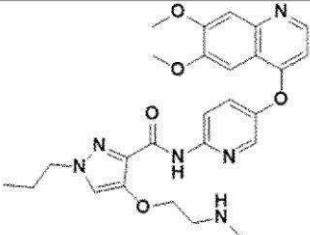
【化 6 0】

105		106	
107		108	
109		110	
111		112	
113		114	
115		116	

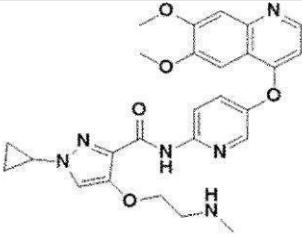
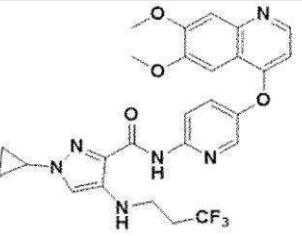
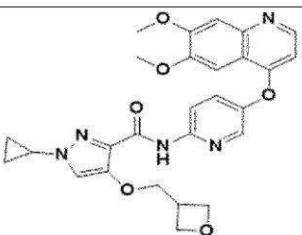
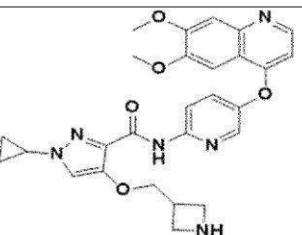
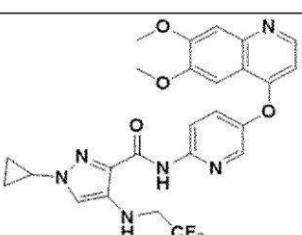
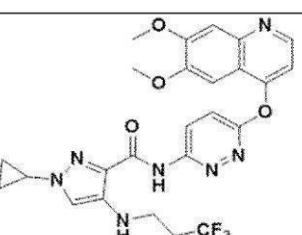
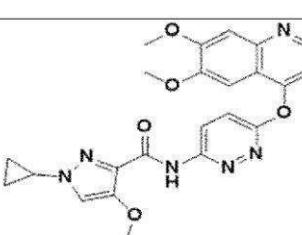
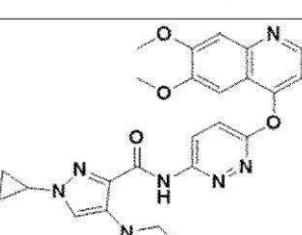
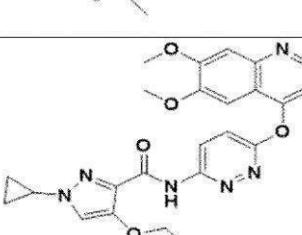
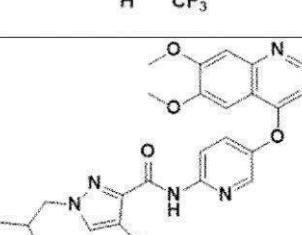
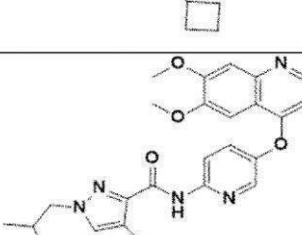
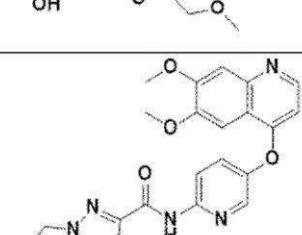
【化61】

117		118	
119		120	
121		122	
123		124	
125		126	
127		128	

## 【化 6 2】

129		130	
131		132	
133		134	
135		136	
137		138	
139		140	

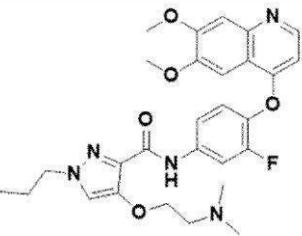
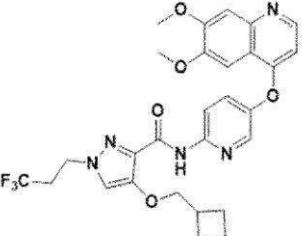
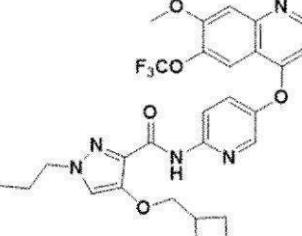
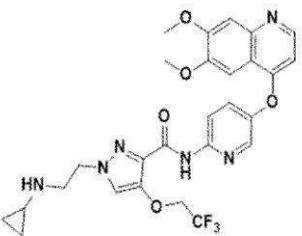
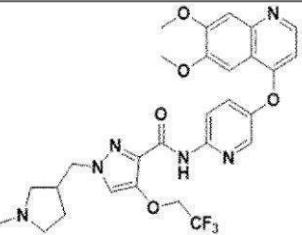
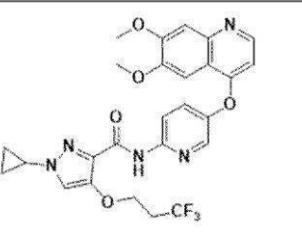
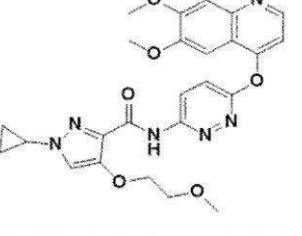
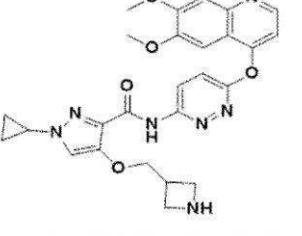
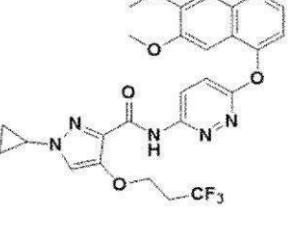
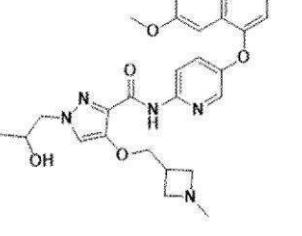
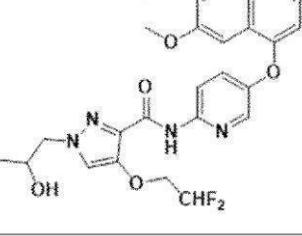
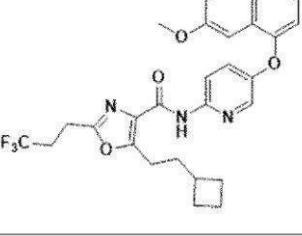
## 【化 6 3】

141		142	
143		144	
145		146	
147		148	
149		150	
151		152	

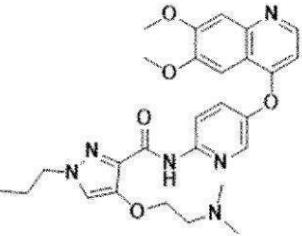
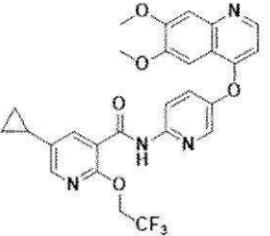
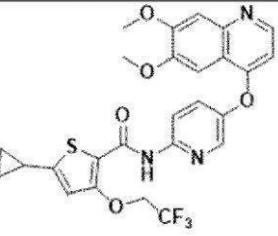
【化 6 4】

153		154	
155		156	
157		158	
159		160	
161		162	
163		164	

## 【化 6 5】

165		166	
167		168	
169		170	
171		172	
173		174	
175		176	

## 【化66】

177		178	
179			

## 【請求項13】

請求項1から12のいずれかに記載の少なくとも1つの化合物を、少なくとも1種の薬学的に許容される担体、賦形剤および／または希釈剤と一緒に含む、組成物。

## 【請求項14】

少なくとも1種の他の薬学的活性のある薬剤をさらに含む、請求項13に記載の組成物。

## 【請求項15】

薬学的活性のある薬剤としての使用のための、好ましくは障害を処置する方法における使用のための、請求項1から12のいずれかに記載の化合物を含む組成物または請求項13から14のいずれかに記載の組成物。

## 【請求項16】

A<sub>x</sub>1/MerおよびCSF1R受容体チロシンキナーゼに関連する、伴う、引き起こされるまたは誘発される障害、特にA<sub>x</sub>1/MerおよびCSF1R（コロニー刺激因子1受容体）に関連する、伴う、または引き起こされる、好ましくは前記A<sub>x</sub>1/Merの機能亢進および前記CSF1Rの機能亢進に関連する、伴う、または引き起こされる障害の処置における使用のための、請求項1から12のいずれかに記載の化合物を含む組成物または請求項13から14のいずれかに記載の組成物。

## 【請求項17】

前記障害が過剰増殖性障害、炎症性障害および神経変性障害から選択される、請求項15から16のいずれかに記載の使用のための組成物。

## 【請求項18】

前記過剰増殖性障害ががんであり、好ましくは、腺癌、聴神経腫瘍、急性リンパ芽球性白血病、急性骨髓性白血病、副腎皮質癌、AIDS関連がん、AIDS関連リンパ腫、肛門がん、虫垂がん、星状細胞腫、非定型奇形腫様／ラブドイド腫瘍、膨大部癌、基底細胞癌、胆管がん、膀胱がん、骨がん、骨肉腫および悪性線維性組織球腫、脳幹神経膠腫、脳腫瘍、中枢神経系非定型奇形腫様／ラブドイド腫瘍、頭蓋咽頭腫、上衣芽腫、上衣細胞腫、髄芽腫、髄上皮腫、中間型松果体実質腫瘍、テント上原始神経外胚葉性腫瘍および松果体芽腫、脳および脊髄腫瘍、乳がん、尿膜管腫瘍、バーキットリンパ腫、カルチノイド腫瘍、脈絡膜の黒色腫、消化器がん、中枢神経系リンパ腫、子宮頸がん、子宮体がん、脊索腫、慢性リンパ球性白血病、慢性骨髓性白血病、慢性骨髓増殖性障害、結腸がん、直腸結腸がん、皮膚T細胞リンパ腫、類腱腫、菌状息肉腫、子宮内膜がん、食道がん、感覚神経芽腫、ユーリング肉腫ファミリー腫瘍、頭蓋外胚細胞腫瘍、性腺外胚細胞腫瘍、肝外胆管がん、耳腫瘍、眼内黒色腫、網膜芽腫、胆嚢がん、胃がん、消化管カルチノイド腫瘍、消化管間質腫瘍、消化管間質細胞腫瘍、婦人科の腫瘍、卵巣胚細胞腫瘍、妊娠性絨毛腫瘍、神経膠腫、胆嚢癌、有毛細胞白血病、頭頸部がん、心臓がん、肝細胞がん、組織球症、下

咽頭がん、血液系新生物、島細胞腫瘍（内分泌性腺癌）、腎細胞がん、腎臓がん、ランゲルハンス細胞組織球症、喉頭がん、白血病、唇および口腔がん、肝臓がん、肺がん、非小細胞肺がん、小腸の腫瘍、小細胞肺がん、ホジキンリンパ腫、非ホジキンリンパ腫、原発性中枢神経系リンパ腫、マクログロブリン血症、骨の悪性線維性組織球腫および骨肉腫、黒色腫、メルケル細胞癌、中皮腫、原発不明の転移性頸部扁平上皮がん、スピナリオムス、多発性内分泌腺腫瘍症候群、骨髄異形成症候群、骨髄異形成／骨髄増殖性新生物、骨髄性白血病、多発性骨髄腫、骨髄増殖性障害、鼻腔および副鼻腔がん、鼻咽頭がん、神経芽細胞腫、口腔がん、中咽頭がん、骨肉腫および骨の悪性線維性組織球腫、卵巣がん、卵巣上皮がん、卵巣低悪性度腫瘍、乏突起膠腫、形質細胞腫、腺癌がん、乳頭腫症、副甲状腺がん、陰茎がん、咽頭がん、下垂体腫瘍、形質細胞新生物／多発性骨髄腫、胸膜肺芽腫、前立腺がん、直腸がん、腎細胞がん、移行性細胞がん、呼吸器がん、横紋筋肉腫、唾液腺がん、肉腫、皮膚精巣がん、ユーリング肉腫、カポジ肉腫、子宮肉腫、非黒色腫皮膚がん、黒色腫皮膚がん、皮膚癌、小腸がん、軟部組織肉腫、扁平上皮癌、扁平頸部がん、胃がん、軟組織腫瘍、精巣がん、咽喉がん、胸腺腫および胸腺癌、甲状腺がん、腎孟および尿管の移行性細胞がん、栄養膜腫瘍、睾丸がん妊娠性がん、泌尿器腫瘍、尿管および腎孟がん、尿道がん、尿路上皮癌、子宮がん、腫瘍がん、外陰がん、ワルデンシュトトレームマクログロブリン血症およびウィルムス腫瘍、身体の潜在空隙に滲出を引き起こす腫瘍、胸水、心嚢液貯留、腹膜滲出、別名腹水、巨細胞腫（GCT）、骨のGCT、色素性綿毛結節性滑膜炎（PVNS）、腱滑膜巨細胞腫（TGCT）、腱鞘のTGCT（TGCT-TS）から選択されるがんである、請求項17に記載の使用のための組成物。

#### 【請求項19】

前記炎症性障害が、骨関節炎、炎症性腸症候群、移植片拒絶反応、全身性エリテマトーデス、潰瘍性大腸炎、クローン病、慢性閉塞性肺疾患、肺気腫、川崎病、血球貪食症候群（マクロファージ活性化症候群）、多中心性細網組織球症、アテローム性動脈硬化症、一次性進行型多発性硬化症、tenosy I型糖尿病、II型糖尿病、インスリン抵抗性、高血糖、肥満、脂肪分解、過好酸球増加症、骨粗鬆症、骨折の危険性の増加、パジェット病、高カルシウム血症、感染症媒介性骨溶解（例えば骨髄炎）、人工関節周囲のまたは磨耗粉媒介性骨溶解、子宮内膜症、炎症性疼痛、慢性疼痛、および骨痛から選択される、請求項17に記載の使用のための組成物。

#### 【請求項20】

前記神経変性障害が、Binswanger型認知症、前脳胞症、小頭症、脳性麻痺、先天性水頭症、腹水、進行性核上性麻痺、縁内障、ウィルソン病、アルツハイマー病および他の認知症、パーキンソン病（PD）およびPD関連障害、多発梗塞性認知症、前頭側頭認知症、仮性認知症、プリオノ病、運動ニューロン疾患、ハンチントン病、脊髄小脳失調症、ならびに脊髄性筋萎縮症から選択される、請求項17に記載の使用のための組成物。

#### 【請求項21】

前記使用が、別の薬学的活性のある薬物または療法、特に放射線療法、化学療法剤、標的薬物および免疫チェックポイント阻害剤薬物と組み合わされる、請求項15から20のいずれかに記載の使用のための組成物。

#### 【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0091

【補正方法】変更

【補正の内容】

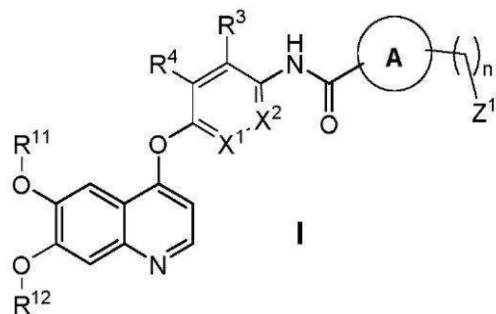
【0091】

表8は、これらの構造および対応する特徴の点から化合物1～179を要約している。  
本発明の実施形態において、例えば以下の項目が提供される。

（項目1）

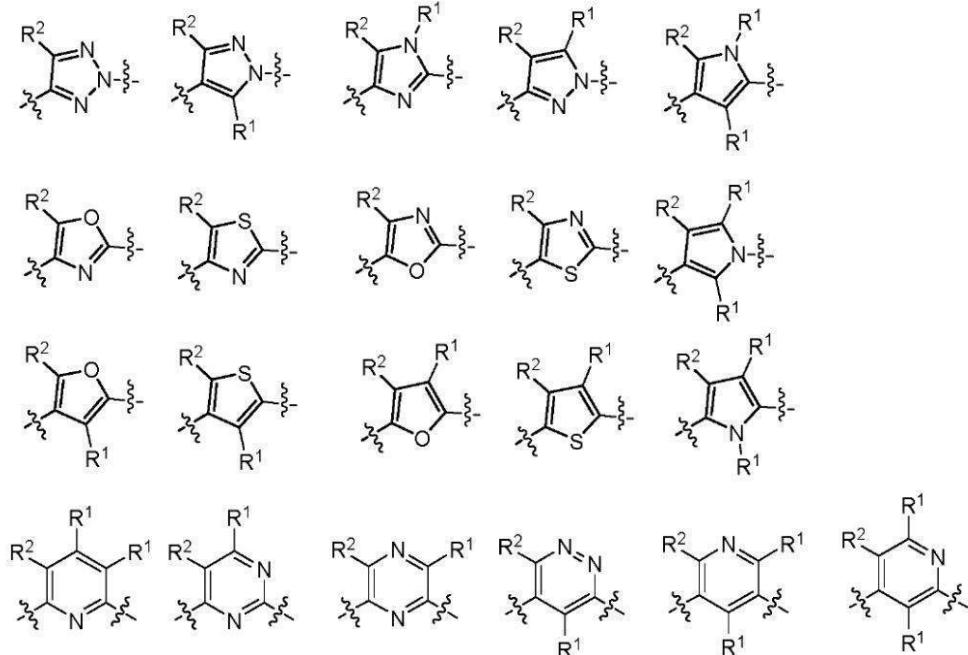
一般式 I :

【化45】



を有する化合物、およびその薬学的に許容される塩であって、式中、  
X<sup>1</sup>は、存在する各々において独立して、C R<sup>3</sup> およびNから選択され、  
X<sup>2</sup>は、存在する各々において独立して、C R<sup>4</sup> およびNから選択され、  
nは、存在する各々において独立して、0、1および2から選択され、  
Aは、存在する各々において、以下のW基；

【化46】



W 基

に示されているいずれかの構造から独立して選択され、

R<sup>1</sup>は、存在する各々において、水素；C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル；OR<sup>5</sup> およびNR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>のうちの1つまたは2つで置換されているC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル；C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルキル；C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル；-(C=O)R<sup>5</sup>からなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されており、

R<sup>2</sup>は、存在する各々において、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル；C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルキル；C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル；-NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>；-OR<sup>8</sup>からなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されており、

R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は、存在する各々において、水素；ハロゲン、例えば、ClまたはF；C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル；OR<sup>5</sup>；C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されており、

R<sup>5</sup> および R<sup>6</sup> は、存在する各々において、水素；C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub> アルキル；C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub> シクロアルキル；C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されており、

R<sup>7</sup> は、存在する各々において、水素；C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub> アルキル；OR<sup>5</sup> および NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> のうちの 1 つまたは 2 つで置換されている C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub> アルキル；C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub> シクロアルキル；C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されており、

R<sup>8</sup> は、存在する各々において、水素；-CH(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>；-C(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>3</sub>；C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub> シクロアルキル；C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub> ヘテロシクロアルキル；C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> ハロアルキル；OR<sup>5</sup> および NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> のうちの 1 つまたは 2 つで置換されている C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub> アルキル；ならびに C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub> シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub> ヘテロシクロアルキルおよび C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> ハロアルキルのうちの 1 つまたは 2 つで置換されている C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub> アルキルからなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されており、

Z<sup>1</sup> は、存在する各々において、水素；C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub> アルキル；(=O)、CN、OR<sup>5</sup> および NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> のうちの 1 つまたは 2 つで置換されている C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub> アルキル；C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub> シクロアルキル；ハロゲン、OR<sup>7</sup> および NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup> のうちの 1 つまたはいくつかで置換されている C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub> シクロアルキル；C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub> ヘテロシクロアルキル；ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub> シクロアルキルおよび C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> ハロアルキルのうちの 1 つまたはいくつかで置換されている C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub> ヘテロシクロアルキル；C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から独立して選択され、

R<sup>9</sup> および R<sup>10</sup> は、存在する各々において、水素；C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub> アルキル；C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub> シクロアルキル；C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されており、

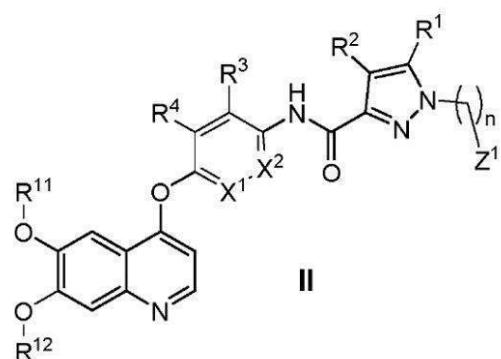
R<sup>11</sup> および R<sup>12</sup> は、存在する各々において、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub> アルキル；C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub> シクロアルキル；C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub> ヘテロシクロアルキル；C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されている、

化合物およびその薬学的に許容される塩。

(項目 2)

一般式 II :

【化47】

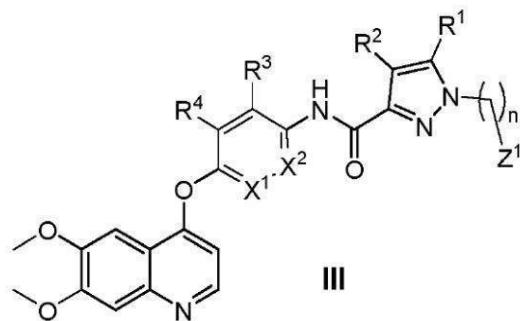


を有する項目 1 に記載の化合物、およびその薬学的に許容される塩であって、式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、Z<sup>1</sup>、X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup> および n は項目 1 で定義された通りである、項目 1 に記載の化合物、およびその薬学的に許容される塩。

(項目 3)

一般式 III :

## 【化48】



を有する項目1および2のいずれかに記載の化合物、およびその薬学的に許容される塩であって、式中、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、Z<sup>1</sup>、X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>およびnは項目1で定義された通りであり、好ましくは、

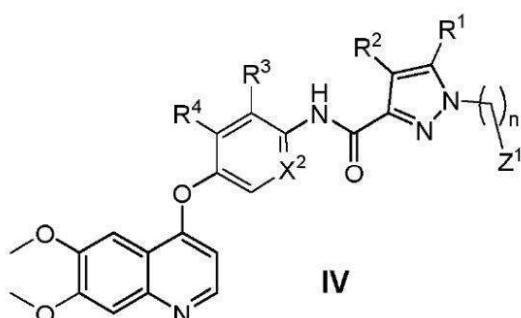
R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>が、存在する各々において、水素；ハロゲン、例えば、C<sub>1</sub>またはF；必要に応じて置換されているC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルからなる群から独立して選択され、

R<sup>8</sup>は、存在する各々において、水素；-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>；-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>；C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルキル；C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル；OR<sup>5</sup>およびNR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>のうちの1つまたは2つで置換されているC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル；またはC<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルキルおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルのうちの1つまたは2つで置換されているC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルからなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されており、Z<sup>1</sup>が、存在する各々において、水素；C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル；OR<sup>5</sup>およびNR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>のうちの1つまたは2つで置換されているC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル；C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルキル；ハロゲン、OR<sup>7</sup>およびNR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>のうちの1つまたはいくつかで置換されているC<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルキル；C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルキル；ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>シクロアルキルおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルのうちの1つまたはいくつかで置換されているC<sub>3</sub>～C<sub>10</sub>ヘテロシクロアルキル；C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から独立して選択される、化合物およびその薬学的に許容される塩。

(項目4)

一般式IV：

## 【化49】



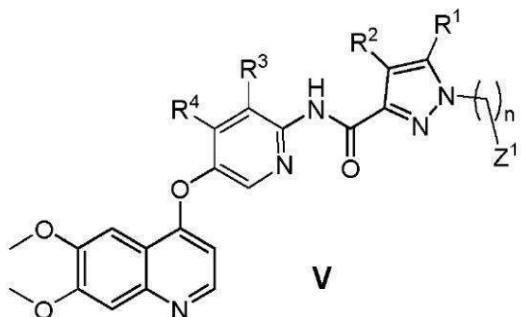
を有する、項目1から3のいずれかに記載の化合物、およびその薬学的に許容される塩であって、式中、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、Z<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>およびnは、項目1から3のいずれかに定義されている通りである、化合物およびその薬学的に許容される塩。

(項目5)

一般式V：

【化 5 0】



を有する、項目 1 から 4 のいずれかに記載の化合物、およびその薬学的に許容される塩であつて、式中、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、Z<sup>1</sup> および n は、項目 1 から 4 のいずれかに定義されている通りであるり、

好ましくは、

R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> が水素である、

化合物およびその薬学的に許容される塩。

(項目 6 )

n = 0 または 1 であり、Z<sup>1</sup> が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、特にメチル、エチル、プロピルまたはイソプロピル；C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルキル、特にC<sub>3</sub> シクロアルキル；C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ヘテロシクロアルキル；OR<sup>5</sup> およびNR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> のうちの 1 つまたは 2 つで置換されているC<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルから選択される、項目 1 から 5 のいずれかに記載の化合物、およびその薬学的に許容される塩。

(項目 7 )

R<sup>2</sup> がOR<sup>8</sup> であり、R<sup>8</sup> が -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>；-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>；C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキル；C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ヘテロシクロアルキルおよびC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルのうちの 1 もしくは 2 つで置換されているC<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル；またはC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキル、特にトリフルオロメチル、ジフルオロメチル、フルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロエチル、フルオロエチル、トリフルオロプロピル、ジフルオロプロピル、フルオロプロピル、トリフルオロイソプロピル、ジフルオロイソプロピル、およびフルオロイソプロピルのうちの 1 つで置換されているC<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルから選択される、項目 1 から 6 のいずれかに記載の化合物、およびその薬学的に許容される塩。

(項目 8 )

n = 0 または 1 であり、Z<sup>1</sup> が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、特にメチル、エチル、プロピルまたはイソプロピル；C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルキル、特にC<sub>3</sub> シクロアルキル；C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ヘテロシクロアルキル；OR<sup>5</sup> およびNR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> のうちの 1 つまたは 2 つで置換されているC<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルから選択され、R<sup>5</sup> およびR<sup>6</sup> が、存在する各々において、水素；C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル；C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルキル；C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルからなる群から独立して選択され、これらのいずれもが必要に応じて置換されており、

R<sup>2</sup> がOR<sup>8</sup> であり、R<sup>8</sup> が、-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>；-C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>；C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキル；C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> シクロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>10</sub> ヘテロシクロアルキルおよびC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルのうちの 1 つまたは 2 つで置換されているC<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル；またはC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキル、特にトリフルオロメチル、ジフルオロメチル、フルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロエチル、フルオロエチル、トリフルオロプロピル、ジフルオロプロピル、フルオロプロピル、トリフルオロイソプロピル、ジフルオロイソプロピル、およびフルオロイソプロピルのうちの 1 つで置換されているC<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルから選択される、

項目 6 および 7 のいずれかに記載の化合物、ならびにその薬学的に許容される塩。

## (項目 9 )

$R^2$  が  $O R^8$  であり、 $R^8$  が、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、特にトリフルオロメチル、ジフルオロメチル、フルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロエチル、フルオロエチル、トリフルオロプロピル、ジフルオロプロピル、フルオロプロピル、トリフルオロイソプロピル、ジフルオロイソプロピル、およびフルオロイソプロピルのうちの 1 つ；または $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、特にトリフルオロメチル、ジフルオロメチル、フルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロエチル、フルオロエチル、トリフルオロプロピル、ジフルオロプロピル、フルオロプロピル、トリフルオロイソプロピル、ジフルオロイソプロピル、およびフルオロイソプロピルのうちの 1 つで置換されている $C_1 \sim C_6$  アルキルから選択される、先行する項目のいずれかに記載の化合物。

## (項目 10 )

$n = 0$  または 1 であり、 $Z^1$  が、メチル；エチル；プロピル；イソプロピル； $C_3$  シクロアルキル； $C_4$  シクロアルキル；および $C_5$  シクロアルキルから選択される、先行する項目のいずれかに記載の化合物。

## (項目 11 )

$n = 0$  または 1 であり、 $Z^1$  が、メチル；エチル；プロピル；イソプロピル； $C_3$  シクロアルキル； $C_4$  シクロアルキル；および $C_5$  シクロアルキルから選択され、 $R^2$  が  $O R^8$  であり、 $R^8$  が、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、特にトリフルオロメチル、ジフルオロメチル、フルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロエチル、フルオロエチル、トリフルオロプロピル、ジフルオロプロピル、フルオロプロピル、トリフルオロイソプロピル、ジフルオロイソプロピル、およびフルオロイソプロピルのうちの 1 つ；または $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、特にトリフルオロメチル、ジフルオロメチル、フルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロエチル、フルオロエチル、トリフルオロプロピル、ジフルオロプロピル、フルオロプロピル、トリフルオロイソプロピル、ジフルオロイソプロピル、およびフルオロイソプロピルのうちの 1 つで置換されている $C_1 \sim C_6$  アルキルから選択される、項目 9 および 10 のいずれかに記載の化合物。

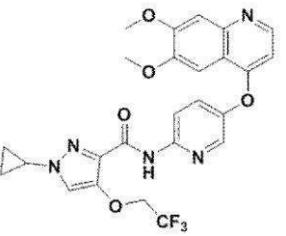
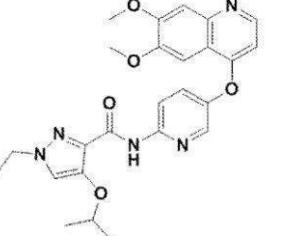
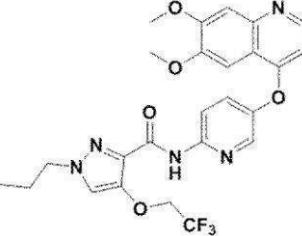
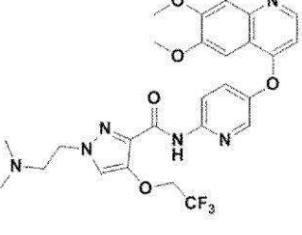
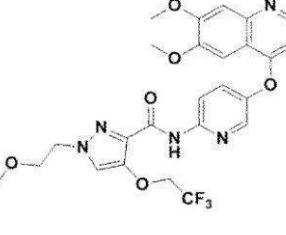
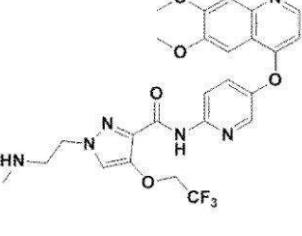
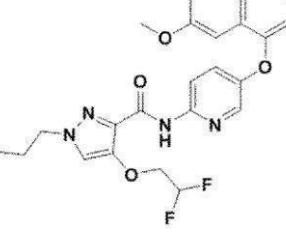
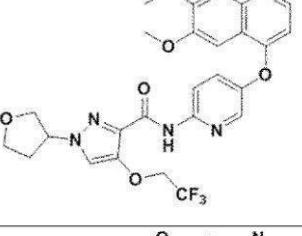
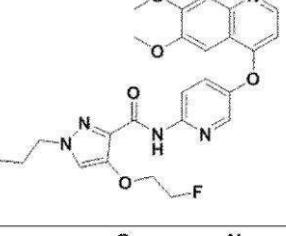
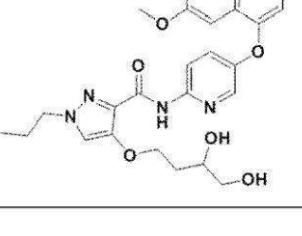
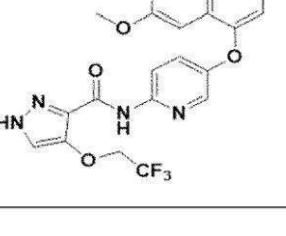
## (項目 12 )

これより以下に示されている構造のうちの 1 つを有する、先行する項目のいずれかに記載の化合物。

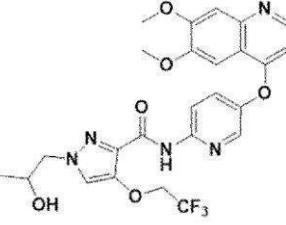
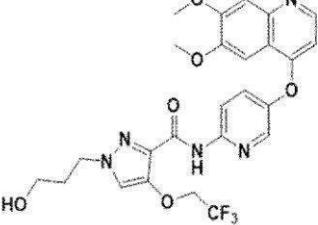
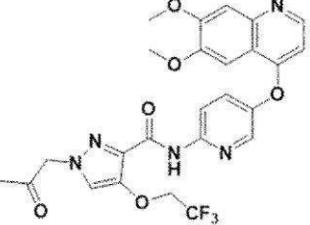
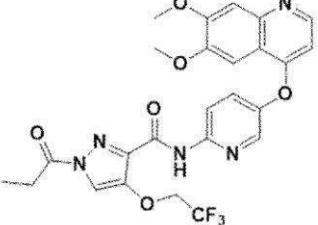
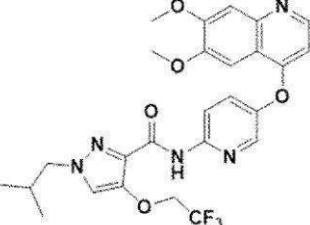
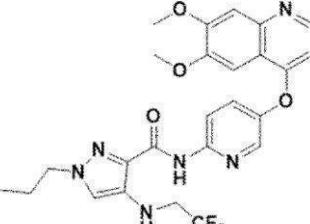
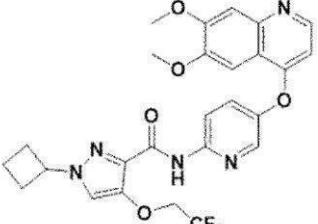
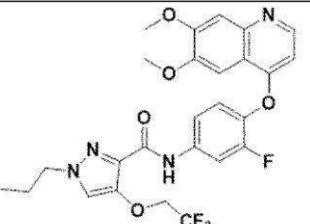
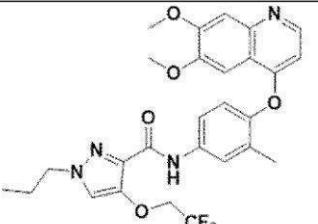
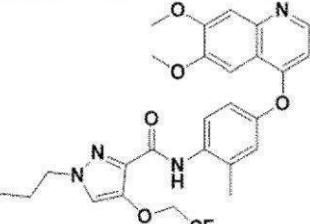
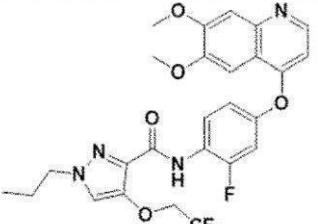
## 【化 5 1】

化合物番号	構造	化合物番号	構造
1		2	
3		4	

## 【化 5 2】

5		6	
7		8	
9		10	
11		12	
13		14	
15		16	

## 【化53】

17		18	
19		20	
21		22	
23		24	
25		26	
27		28	

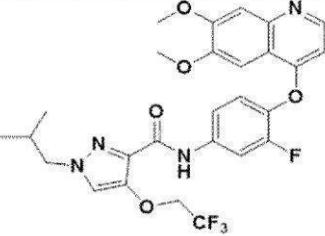
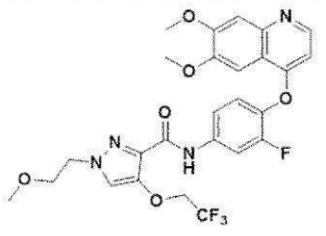
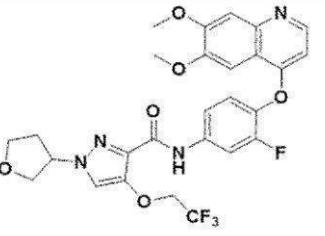
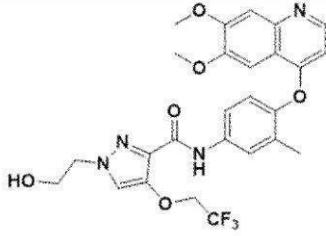
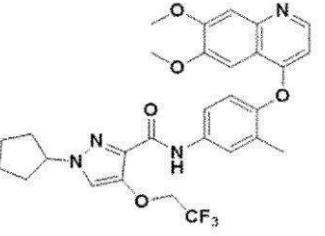
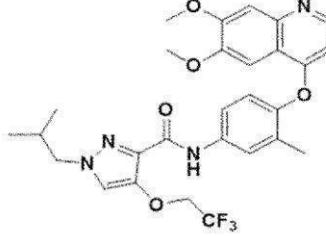
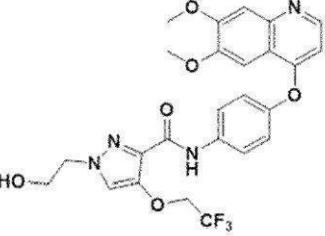
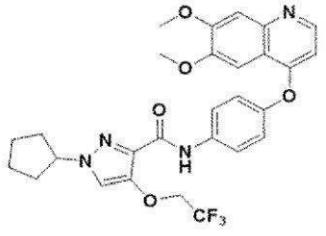
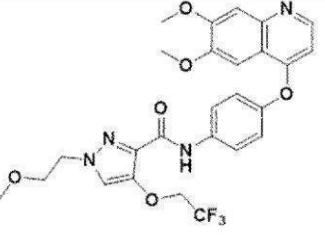
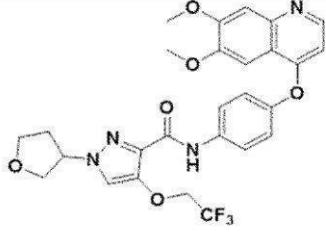
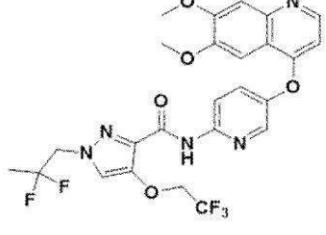
【化 5 4】

29		30	
31		32	
33		34	
35		36	
37		38	
39		40	

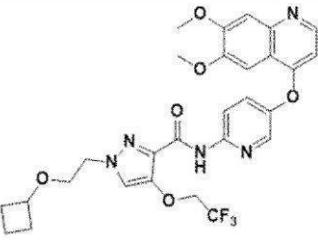
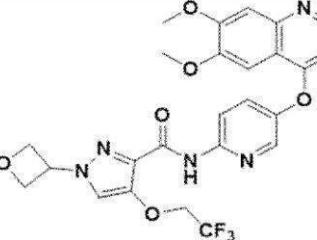
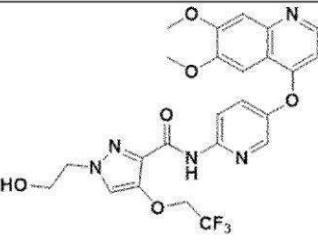
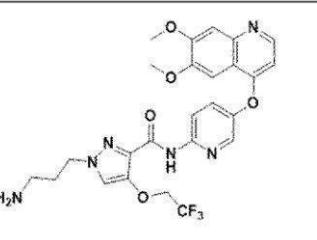
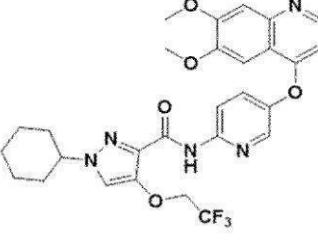
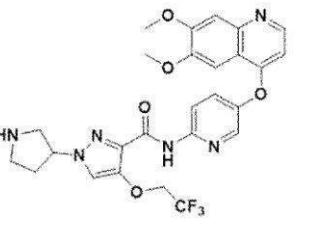
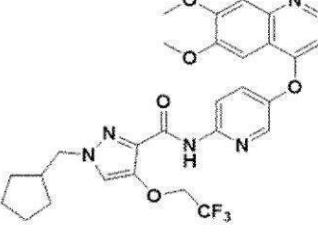
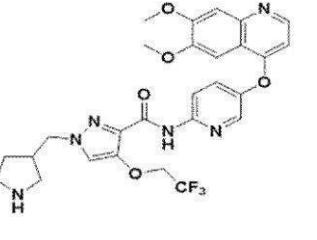
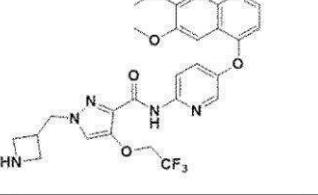
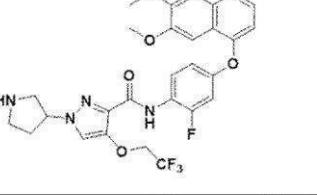
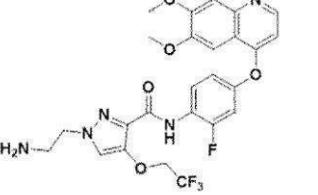
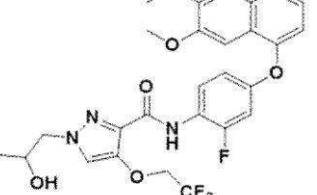
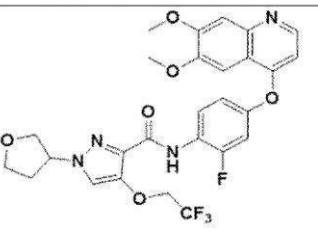
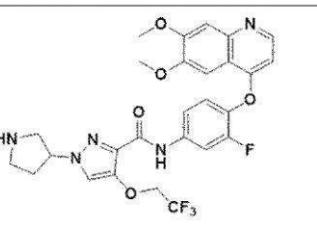
【化 5 5】

41		42	
43		44	
45		46	
47		48	
49		50	
51		52	

【化56】

53		54	
55		56	
57		58	
59		60	
61		62	
63		64	

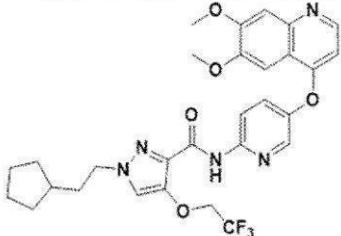
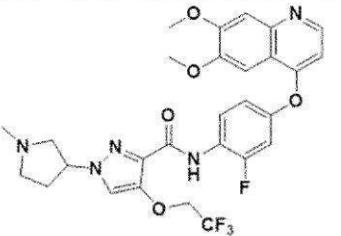
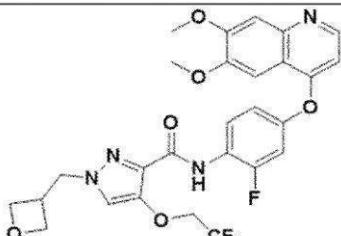
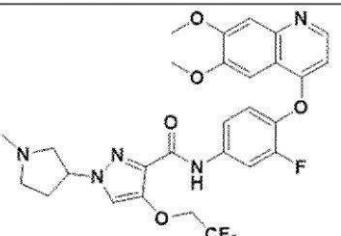
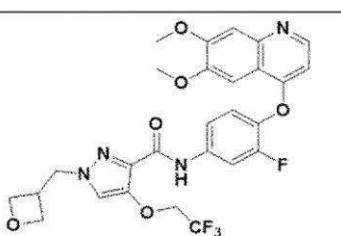
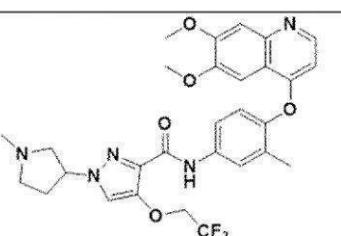
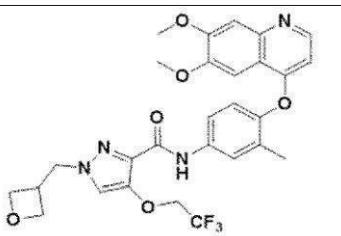
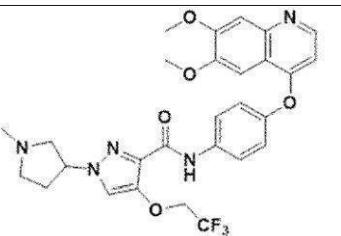
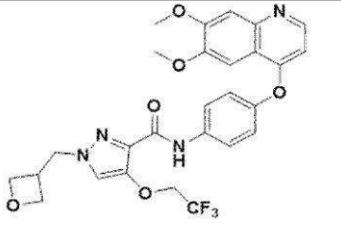
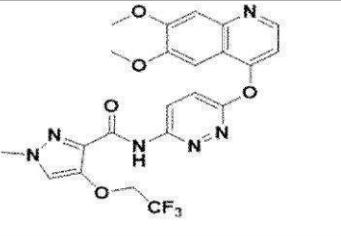
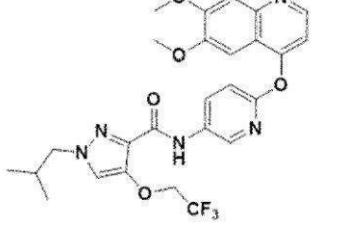
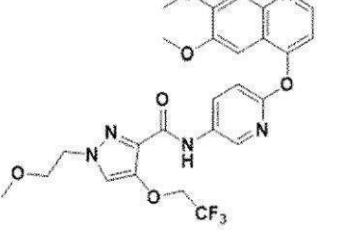
【化 5 7】

65		66	
67		68	
69		70	
71		72	
73		74	
75		76	
77		78	

## 【化 5 8】

79		80	
81		82	
83		84	
85		86	
87		88	
89		90	
91		92	

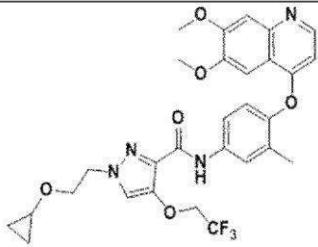
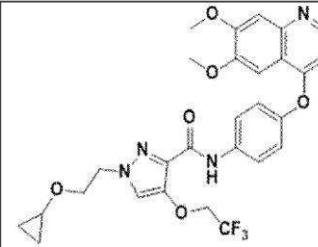
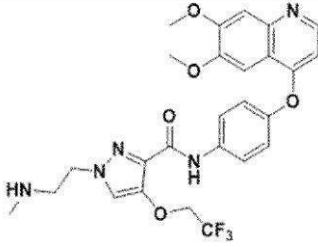
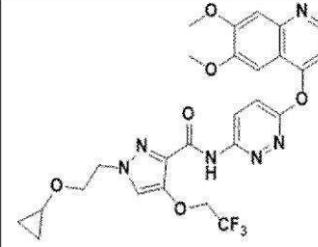
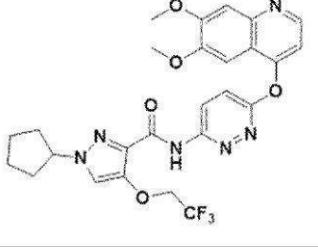
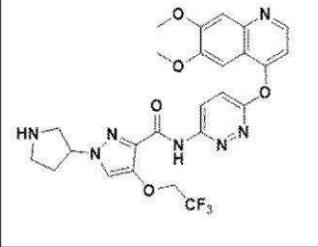
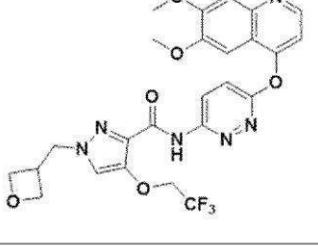
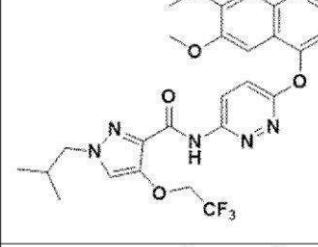
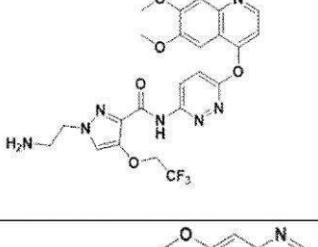
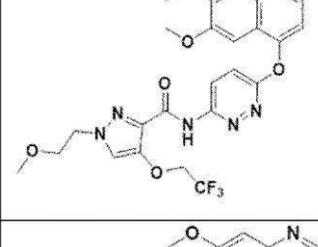
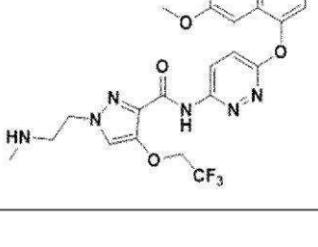
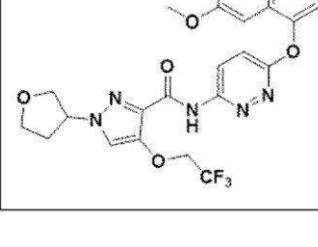
## 【化 5 9】

93		94	
95		96	
97		98	
99		100	
101		102	
103		104	

【化 6 0】

105		106	
107		108	
109		110	
111		112	
113		114	
115		116	

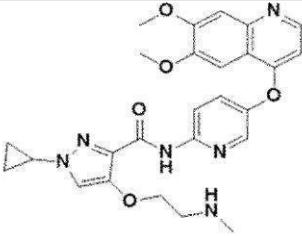
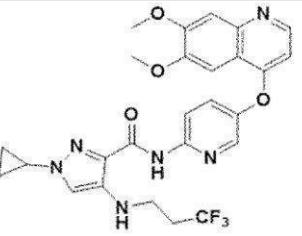
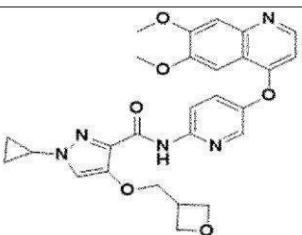
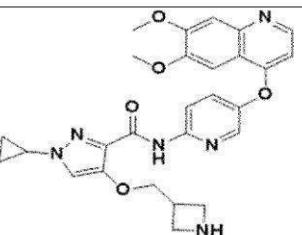
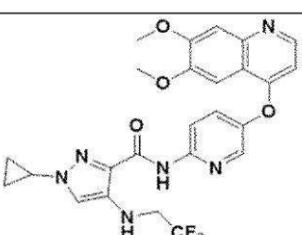
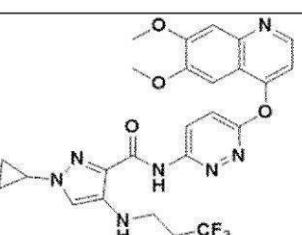
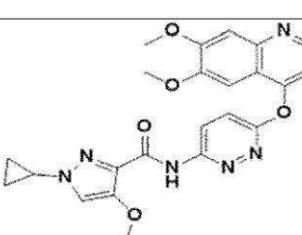
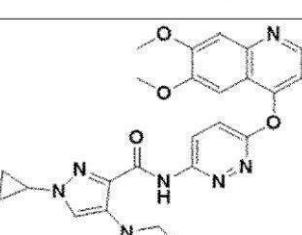
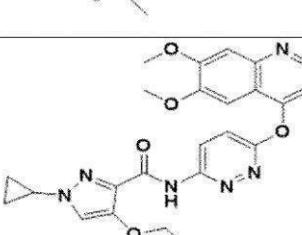
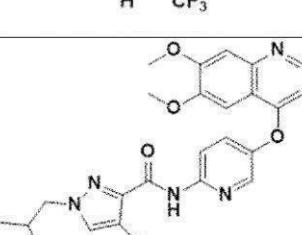
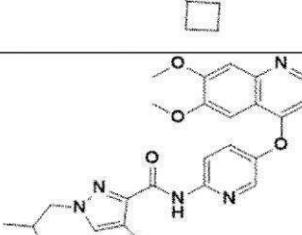
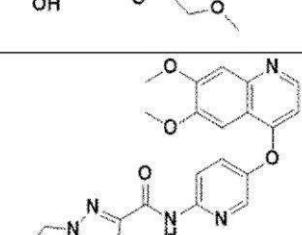
【化61】

117		118	
119		120	
121		122	
123		124	
125		126	
127		128	

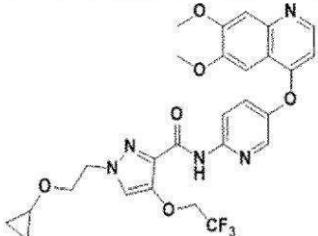
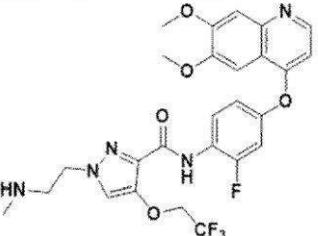
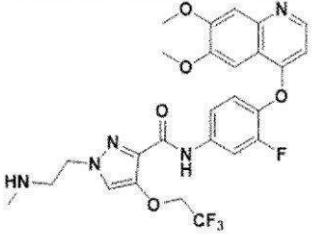
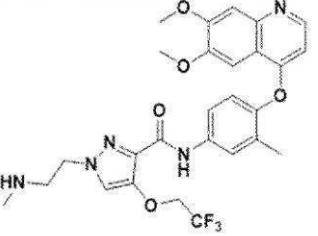
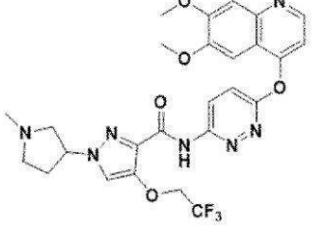
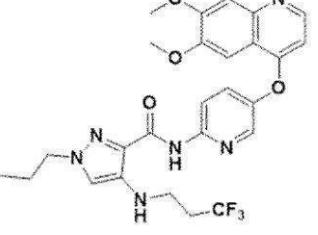
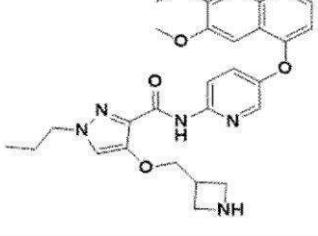
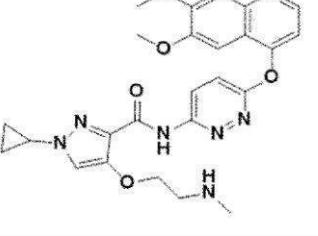
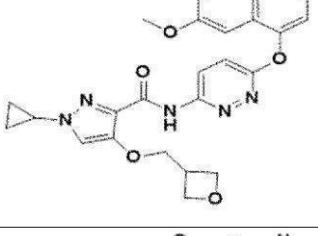
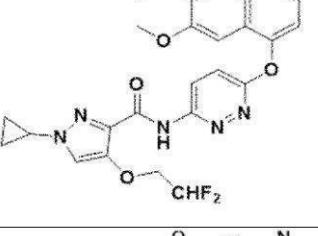
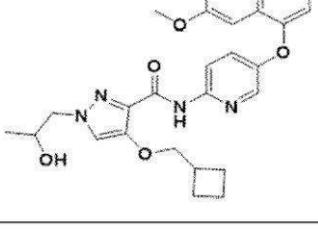
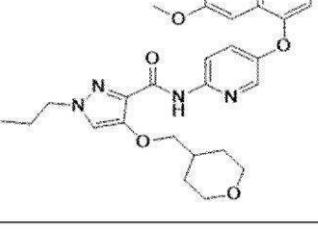
## 【化 6 2】

129		130	
131		132	
133		134	
135		136	
137		138	
139		140	

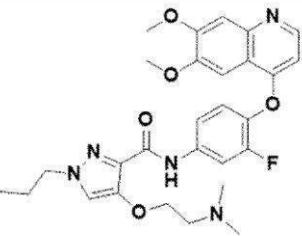
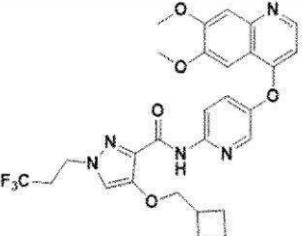
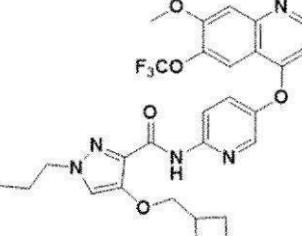
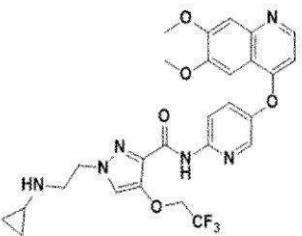
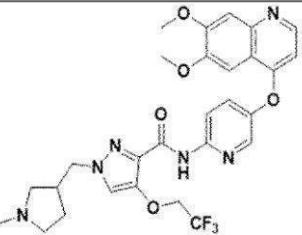
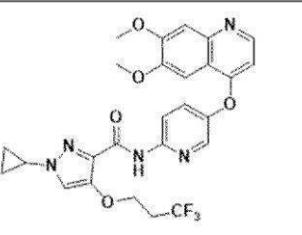
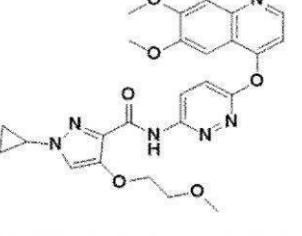
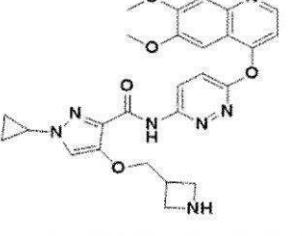
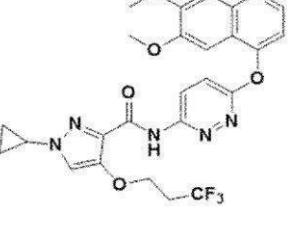
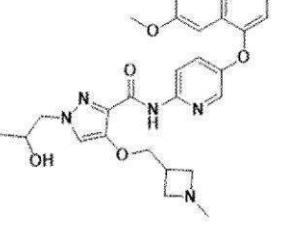
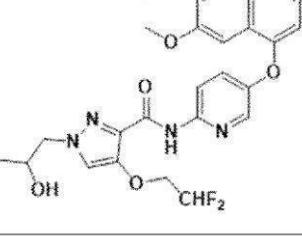
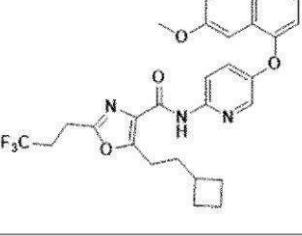
## 【化 6 3】

141		142	
143		144	
145		146	
147		148	
149		150	
151		152	

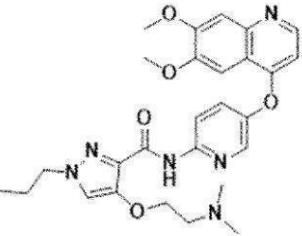
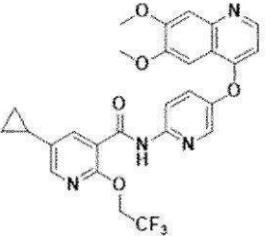
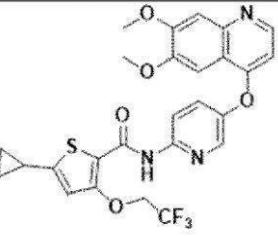
【化 6 4】

153		154	
155		156	
157		158	
159		160	
161		162	
163		164	

## 【化 6 5】

165		166	
167		168	
169		170	
171		172	
173		174	
175		176	

## 【化66】

177		178	
179			

## (項目13)

項目1から12のいずれかに記載の少なくとも1つの化合物を、少なくとも1種の薬学的に許容される担体、賦形剤および/または希釈剤と一緒に含む、組成物。

## (項目14)

少なくとも1種の他の薬学的活性のある薬剤をさらに含む、項目13に記載の組成物。

## (項目15)

薬学的活性のある薬剤としての使用のための、好ましくは障害を処置する方法における使用のための、項目1から12のいずれかに記載の化合物または項目13から14のいずれかに記載の組成物。

## (項目16)

Ax1/MerおよびCSF1R受容体チロシンキナーゼに関連する、伴う、引き起こされるまたは誘発される障害、特にAx1/MerおよびCSF1R(コロニー刺激因子1受容体)に関連する、伴う、または引き起こされる、好ましくは前記Ax1/Merの機能亢進および前記CSF1Rの機能亢進に関連する、伴う、または引き起こされる障害の処置における使用のための、項目1から12のいずれかに記載の化合物または項目13から14のいずれかに記載の組成物。

## (項目17)

前記障害が過剰増殖性障害、炎症性障害および神経変性障害から選択される、項目15から16のいずれかに記載の使用のための化合物または組成物。

## (項目18)

前記過剰増殖性障害ががんであり、好ましくは、腺癌、聴神経腫瘍、急性リンパ芽球性白血病、急性骨髓性白血病、副腎皮質癌、AIDS関連がん、AIDS関連リンパ腫、肛門がん、虫垂がん、星状細胞腫、非定型奇形腫様/ラブドトイド腫瘍、膨大部癌、基底細胞癌、胆管がん、膀胱がん、骨がん、骨肉腫および悪性線維性組織球腫、脳幹神経膠腫、脳腫瘍、中枢神経系非定型奇形腫様/ラブドトイド腫瘍、頭蓋咽頭腫、上衣芽腫、上衣細胞腫、髄芽腫、髄上皮腫、中間型松果体実質腫瘍、テント上原始神経外胚葉性腫瘍および松果体芽腫、脳および脊髄腫瘍、乳がん、尿膜管腫瘍、バーキットリンパ腫、カルチノイド腫瘍、脈絡膜の黒色腫、消化器がん、中枢神経系リンパ腫、子宮頸がん、子宮体がん、脊索腫、慢性リンパ球性白血病、慢性骨髓性白血病、慢性骨髓増殖性障害、結腸がん、直腸結腸がん、皮膚T細胞リンパ腫、類腫瘍、菌状息肉腫、子宮内膜がん、食道がん、感覚神経芽腫、ユーリング肉腫ファミリー腫瘍、頭蓋外胚細胞腫瘍、性腺外胚細胞腫瘍、肝外胆管がん、耳腫瘍、眼内黒色腫、網膜芽腫、胆囊がん、胃がん、消化管カルチノイド腫瘍、消化管間質腫瘍、消化管間質細胞腫瘍、婦人科の腫瘍、卵巣胚細胞腫瘍、妊娠性絨毛腫瘍、神経膠腫、胆囊癌、有毛細胞白血病、頭頸部がん、心臓がん、肝細胞がん、組織球症、下

咽頭がん、血液系新生物、島細胞腫瘍（内分泌性臓器）、腎細胞がん、腎臓がん、ラングルハンス細胞組織球症、喉頭がん、白血病、唇および口腔がん、肝臓がん、肺がん、非小細胞肺がん、小腸の腫瘍、小細胞肺がん、ホジキンリンパ腫、非ホジキンリンパ腫、原発性中枢神経系リンパ腫、マクログロブリン血症、骨の悪性線維性組織球腫および骨肉腫、黒色腫、メルケル細胞癌、中皮腫、原発不明の転移性扁平上皮がん、スピナリオムス、多発性内分泌腺腫瘍症候群、骨髄異形成症候群、骨髄異形成／骨髄増殖性新生物、骨髄性白血病、多発性骨髄腫、骨髄増殖性障害、鼻腔および副鼻腔がん、鼻咽頭がん、神経芽細胞腫、口腔がん、中咽頭がん、骨肉腫および骨の悪性線維性組織球腫、卵巣がん、卵巣上皮がん、卵巣低悪性度腫瘍、乏突起膠腫、形質細胞腫、臍膜がん、乳頭腫症、副甲状腺がん、陰茎がん、咽頭がん、下垂体腫瘍、形質細胞新生物／多発性骨髄腫、胸膜肺芽腫、前立腺がん、直腸がん、腎細胞がん、移行性細胞がん、呼吸器がん、横紋筋肉腫、唾液腺がん、肉腫、皮膚精巣がん、ユーリング肉腫、カポジ肉腫、子宮肉腫、非黒色腫皮膚がん、黒色腫皮膚がん、皮膚癌、小腸がん、軟部組織肉腫、扁平上皮癌、扁平頸部がん、胃がん、軟組織腫瘍、精巣がん、咽喉がん、胸腺腫および胸腺癌、甲状腺がん、腎孟および尿管の移行性細胞がん、栄養膜腫瘍、睾丸がん妊娠性がん、泌尿器腫瘍、尿管および腎孟がん、尿道がん、尿路上皮癌、子宮がん、腫瘍がん、外陰がん、ワルデンシュトライムマクログロブリン血症およびウィルムス腫瘍、身体の潜在空隙に滲出を引き起こす腫瘍、胸水、心嚢液貯留、腹膜滲出、別名腹水、巨細胞腫（GCT）、骨のGCT、色素性綿毛結節性滑膜炎（PVNS）、腱滑膜巨細胞腫（TGCT）、腱鞘のTGCT（TGCT-TS）から選択されるがんである、項目17に記載の使用のための化合物または組成物。

（項目19）

前記炎症性障害が、骨関節炎、炎症性腸症候群、移植片拒絶反応、全身性エリテマトーデス、潰瘍性大腸炎、クローン病、慢性閉塞性肺疾患、肺気腫、川崎病、血球貪食症候群（マクロファージ活性化症候群）、多中心性細網組織球症、アテローム性動脈硬化症、一次性進行型多発性硬化症、tenosy I型糖尿病、II型糖尿病、インスリン抵抗性、高血糖、肥満、脂肪分解、過好酸球増加症、骨粗鬆症、骨折の危険性の増加、パジェット病、高カルシウム血症、感染症媒介性骨溶解（例えば骨髄炎）、人工関節周囲のまたは磨耗粉媒介性骨溶解、子宮内膜症、炎症性疼痛、慢性疼痛、および骨痛から選択される、項目17に記載の使用のための化合物または組成物。

（項目20）

前記神経変性障害が、Binswanger型認知症、前脳胞症、小頭症、脳性麻痺、先天性水頭症、腹水、進行性核上性麻痺、縁内障、ウィルソン病、アルツハイマー病および他の認知症、パーキンソン病（PD）およびPD関連障害、多発梗塞性認知症、前頭側頭認知症、仮性認知症、プリオン病、運動ニューロン疾患、ハンチントン病、脊髄小脳失調症、ならびに脊髄性筋萎縮症から選択される、項目17に記載の使用のための化合物または組成物。

（項目21）

前記使用が、別の薬学的活性のある薬物または療法、特に放射線療法、化学療法剤、標的薬物および免疫チェックポイント阻害剤薬物と組み合わされる、項目15から20のいずれかに記載の使用のための化合物または組成物。

（項目22）

過剰増殖性障害、炎症性障害および／または神経変性障害から選択される疾患の処置の方法であって、項目1から12のいずれかに記載の化合物、または項目13から14のいずれかに記載の組成物を、それを必要とする患者に投与することを含む、方法。