

【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6年8月14日(2024.8.14)

【国際公開番号】WO2022/032026

【公表番号】特表2023-538517(P2023-538517A)

【公表日】令和5年9月8日(2023.9.8)

【年通号数】公開公報(特許)2023-170

【出願番号】特願2023-507866(P2023-507866)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 3 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 1 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 3 5 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 5 4 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 9 8 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 3 8 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 9 9 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 0 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 5 1 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 4 7 / 5 4 ( 2 0 1 7 . 0 1 )

【 F I 】

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 4 1

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 P 1 1 / 0 0

A 6 1 P 3 5 / 0 4

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 6 A

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 C S P

A 6 1 K 3 1 / 4 5 4 5

A 6 1 K 3 1 / 4 9 8 5

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 3 1 1

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 3 0 1

A 6 1 K 3 1 / 5 3 8 6

A 6 1 K 3 1 / 4 9 9 5

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7

A 6 1 K 3 1 / 5 0 6

A 6 1 K 3 1 / 5 5 1

A 6 1 K 4 7 / 5 4

【手続補正書】

【提出日】令和6年8月5日(2024.8.5)

【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】

10

20

30

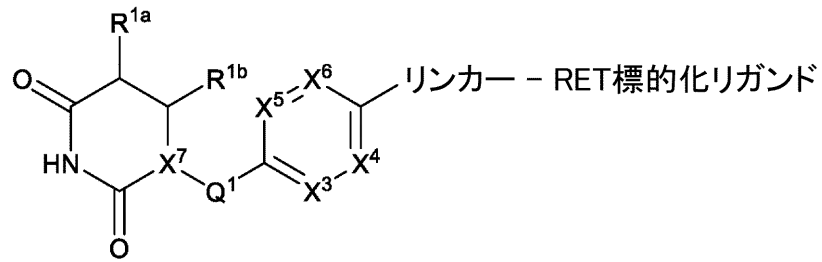
40

50

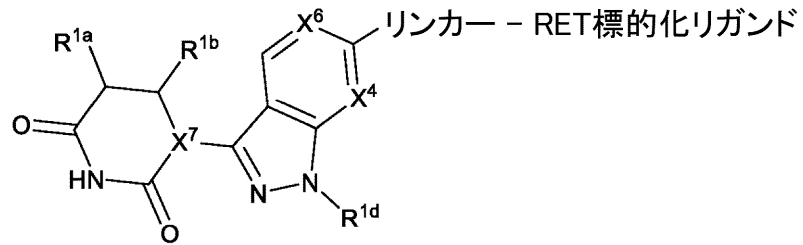
【請求項 1】

式：

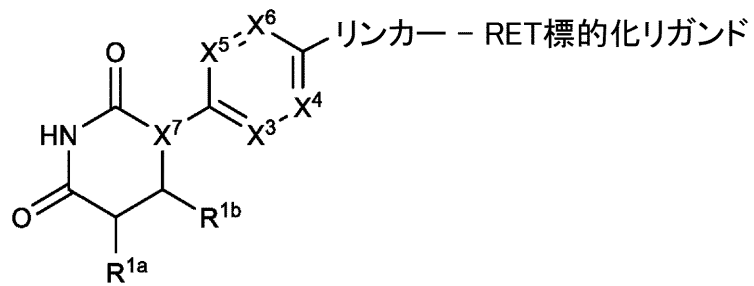
【化 1】



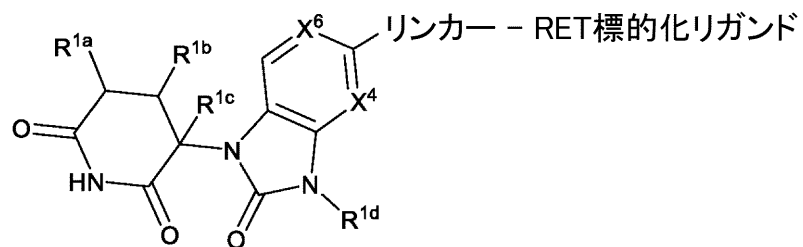
10



20

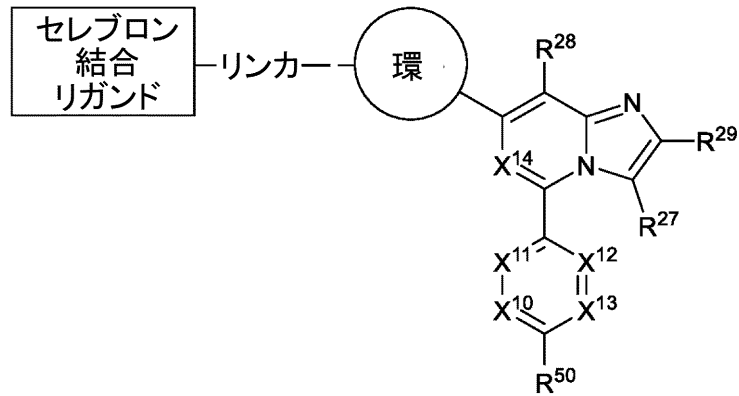
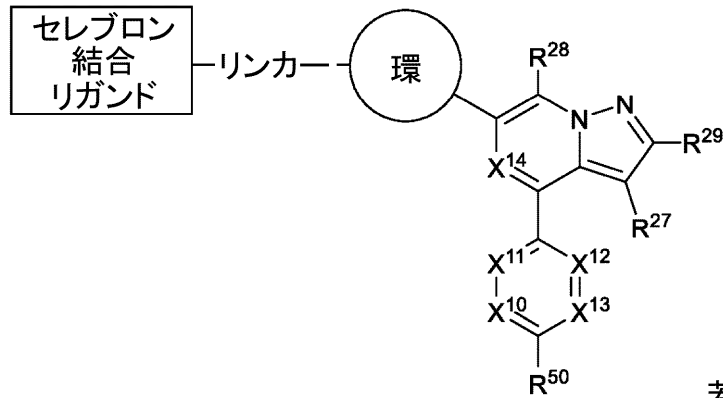
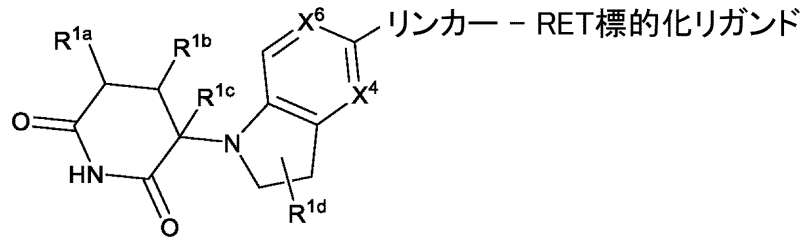


30



40

50



(式中、

$X^3$ 、 $X^4$ 、 $X^5$ 及び $X^6$ はN、CH及び $CR^3$ からなる群から選択され、ここで $X^3$ 、 $X^4$ 、 $X^5$ 及び $X^6$ の3つ以下がNであり、

$X^7$ はN又は $CR^{1c}$ であり、

$Q^1$ は $-NR^6-$ 、 $-CH_2-$ 又は $-O-$ であり、ここで $X^7$ がNである場合、 $Q^1$ は $CH_2$ であり、

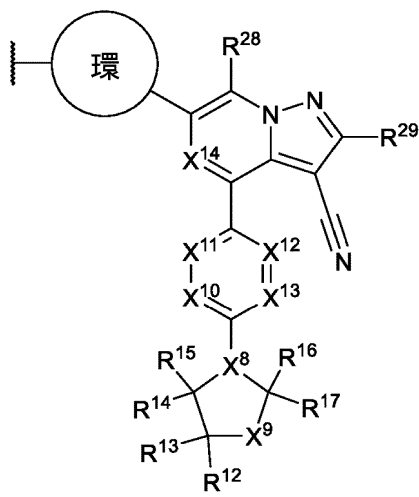
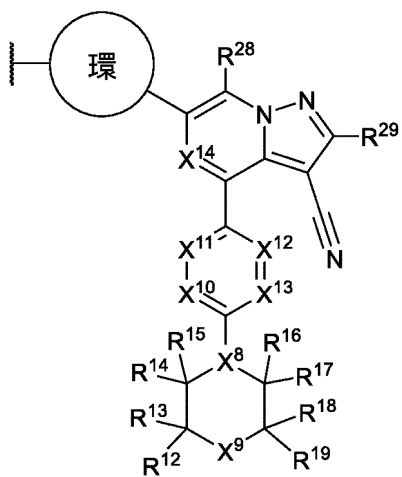
$R^{1a}$ 、 $R^{1b}$ 、 $R^{1c}$ 及び $R^{1d}$ は、各々独立して水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル若しくはシクロアルキルであるか、又は、

$R^{1a}$ 及び $R^{1c}$ が結合して1原子若しくは2原子の架橋を形成し、

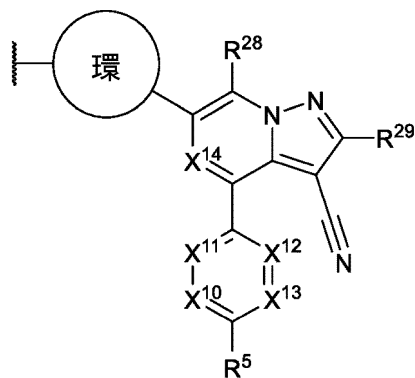
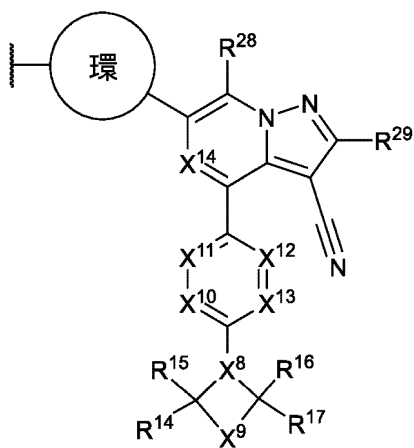
$R^3$ は、いずれの場合にも独立して水素、ヒドロキシル、アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、シクロアルキル、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素からなる群から選択され、

RET標的化リガンドは、

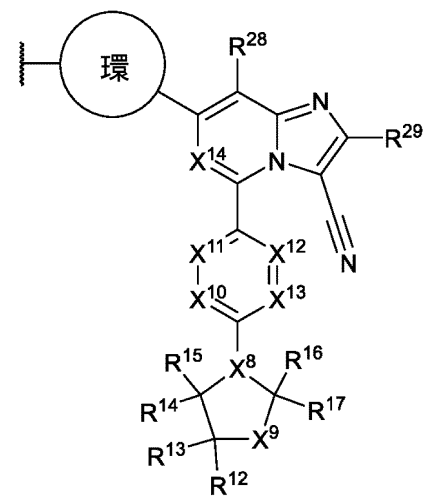
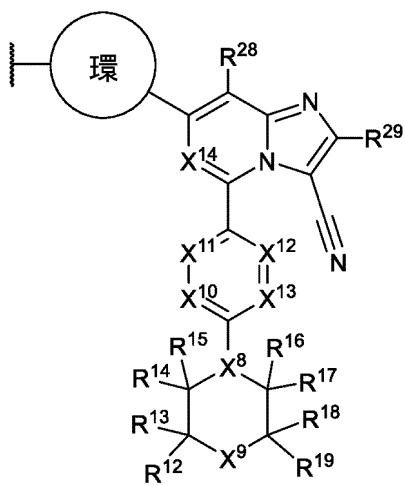
【化 2】



10



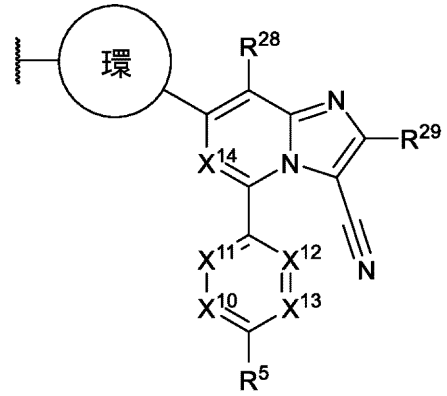
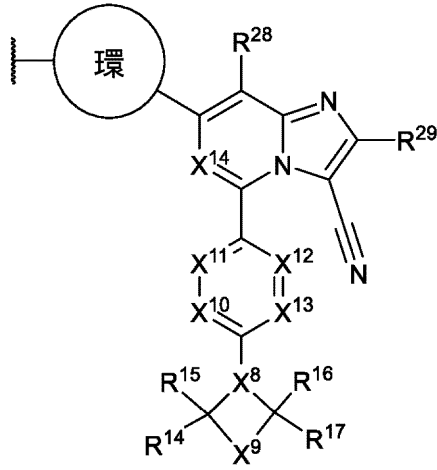
20



30

40

50



及び

10

【化3】



20

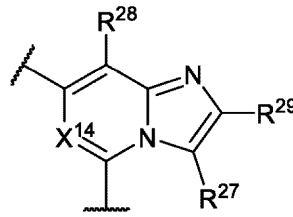
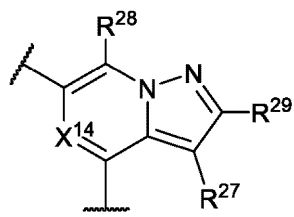
はヘテロアリアル、複素環、アリール又はシクロアルキルであり、その各々が R<sup>9</sup> から独立して選択される 0、1つ、2つ、3つ又は4つの置換基で任意に置換され、ここで、

【化4】

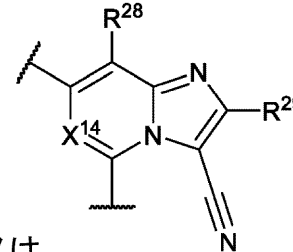
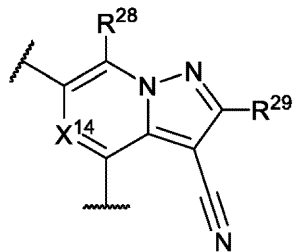


はリンカーと、

【化5】



30



40

、又は

とに直接結合し、

X<sup>8</sup> は N 又は C R<sup>4</sup> であり、

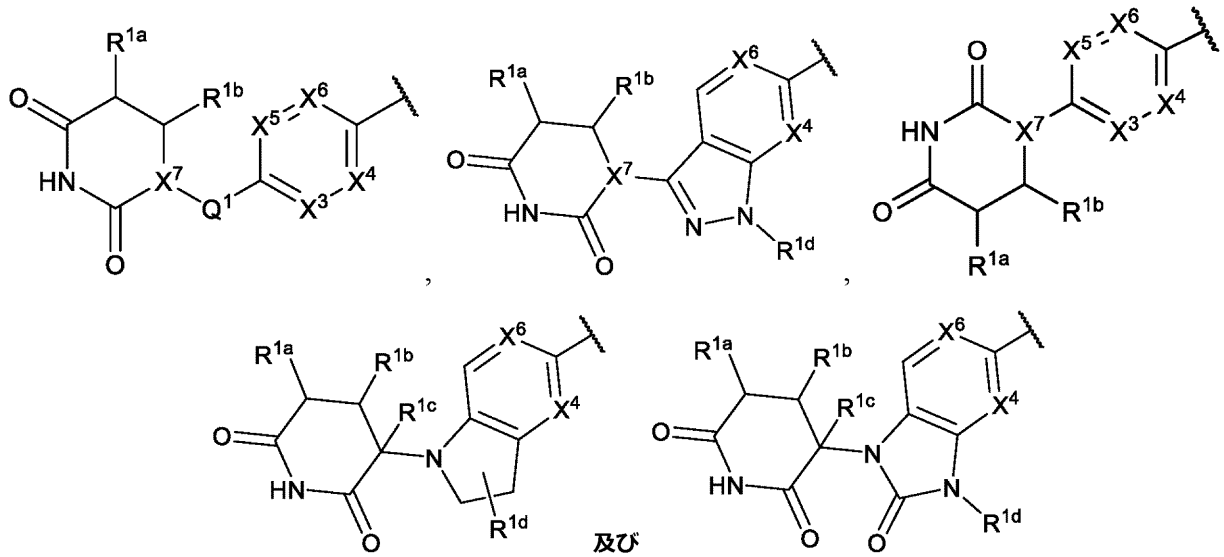
X<sup>9</sup> は N R<sup>4</sup>、C R<sup>4</sup> R<sup>11</sup> 又は O であり、

X<sup>10</sup>、X<sup>11</sup>、X<sup>12</sup> 及び X<sup>13</sup> は N、CH 及び CR からなる群から選択され、ここで X<sup>10</sup>、X<sup>11</sup>、X<sup>12</sup> 及び X<sup>13</sup> の3つ以下が N であり、

X<sup>14</sup> は C R<sup>27</sup> 又は N であり、

50

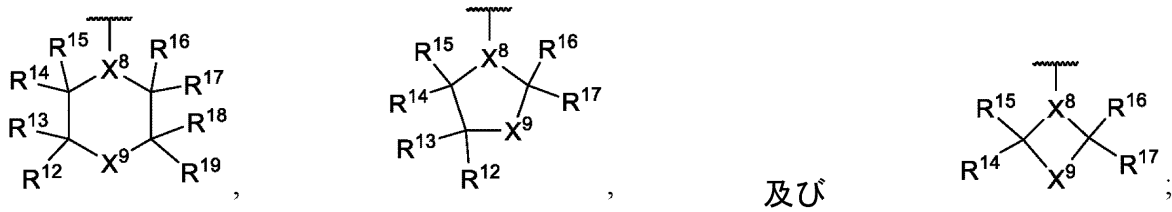
セレブロン結合リガンドは、  
【化6】



10

からなる群から選択され、  
R<sup>50</sup>はR<sup>5</sup>及びR<sup>51</sup>からなる群から選択され、  
R<sup>51</sup>は、  
【化7】

20



30

からなる群から選択され、  
各R<sup>4</sup>は独立して水素、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、複素環、  
-アルキル-ヘテロアリール、-アルキル-アリール、-アルキル-複素環、-C(O)R<sup>5</sup>、  
-アルキル-C(O)R<sup>5</sup>、-OC(O)R<sup>5</sup>及び-NR<sup>6</sup>C(O)R<sup>5</sup>からなる群から選択され、このC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルキニル、  
C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、複素環、  
-アルキル-ヘテロアリール、-アルキル-アリール及び-アルキル-複素環基の各々がR<sup>8</sup>から独立して選択される0、1つ、2つ又は3つの置換基で任意に置換され、  
R<sup>5</sup>は水素、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、複素環、二環、  
-アルキル-ヘテロアリール、-アルキル-アリール、-アルキル-複素環、-OR<sup>6</sup>又は-NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>であり、このC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルキニル、  
C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、複素環、  
-アルキル-ヘテロアリール、-アルキル-アリール及び-アルキル-複素環基の各々がR<sup>9</sup>から独立して選択される0、1つ、2つ又は3つの置換基で任意に置換され、  
R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は、いずれの場合にも独立して水素、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>4</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、複素環、  
-アルキル-ヘテロアリール、-アルキル-アリール及び-アルキル-複素環からなる群から選択され、水素以外のこのR<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>基の各々がR<sup>10</sup>から独立して選択される0、1つ、2つ又は3つの置換基で任意に置換され、

40

50

$R^8$  は、いずれの場合にも独立して水素、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、ハロゲン、 $-OR^6$ 、 $-NR^6R^7$ 、 $-OC(O)R^5$ 、 $-NR^6C(O)R^5$ 、 $-C(O)R^5$  及び  $-アルキル-C(O)R^5$  からなる群から選択され、

$R^9$  は、いずれの場合にも独立して水素、アリーール、 $-アルキル-アリーール$ 、ヘテロアリーール、アルキル-ヘテロアリーール、複素環、アルキル-複素環、シクロアルキル、 $-アルキル-シクロアルキル$ 、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、ハロゲン、 $-OR^6$ 、 $-NR^6R^7$ 、 $-C(O)OR^6$ 、 $-C(O)NR^6R^7$ 、 $-アルキル-C(O)OR^6$  及び  $-アルキル-C(O)NR^6R^7$  からなる群から選択され、このアリーール、 $-アルキル-アリーール$ 、ヘテロアリーール、 $-アルキル-ヘテロアリーール$ 、複素環、 $-アルキル-複素環$ 、 $-アルキル-シクロアルキル$  及び  $-シクロアルキル$  基の各々が  $-S(O)_2$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、ハロゲン、 $-OR^6$ 、 $-NR^6R^7$ 、 $-C(O)OR^6$ 、 $-C(O)NR^6R^7$ 、 $-アルキル-C(O)OR^6$  及び  $-アルキル-C(O)NR^6R^7$  からなる群から選択される 0、1 つ、2 つ又は 3 つの置換基で任意に置換され、

$R^{10}$  は、いずれの場合にも独立して  $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_2 \sim C_4$  アルケニル、 $C_2 \sim C_4$  アルキニル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリーール、アリーール、複素環、 $-アルキル-ヘテロアリーール$ 、 $-アルキル-アリーール$ 、ハロゲン及び  $-アルキル-複素環$  からなる群から選択され、

$R^{11}$  は水素、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_2 \sim C_4$  アルケニル、 $C_2 \sim C_4$  アルキニル、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリーール、アリーール、複素環、 $-アルキル-ヘテロアリーール$ 、 $-アルキル-アリーール$ 、 $-アルキル-複素環$ 、 $-アルキル-OR^6$ 、 $-OC(O)R^6$ 、 $-OR^6$ 、 $-アルキル-NR^6R^7$ 、 $-NR^6C(O)R^7$  又は  $-NR^6R^7$  であり、

$R$ 、 $R^{27}$ 、 $R^{28}$  及び  $R^{29}$  は、いずれの場合にも独立して水素、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $-OR^6$ 、 $-NR^6R^7$ 、 $-C(O)OR^6$  及び  $-C(O)NR^6R^7$  からなる群から選択され、

$R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$ 、 $R^{16}$ 、 $R^{17}$ 、 $R^{18}$  及び  $R^{19}$  は、いずれの場合にも独立して水素、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルキル及びハロゲンからなる群から選択されるか、又は、

$R^{12}$  及び  $R^{13}$  が結合してカルボニル若しくは 3 員～6 員のスピロ環を形成するか、又は、

$R^{14}$  及び  $R^{15}$  が結合してカルボニル若しくは 3 員～6 員のスピロ環を形成するか、又は、

$R^{16}$  及び  $R^{17}$  が結合してカルボニル若しくは 3 員～6 員のスピロ環を形成するか、又は、

$R^{18}$  及び  $R^{19}$  が結合してカルボニル若しくは 3 員～6 員のスピロ環を形成するか、又は、

$R^{12}$  及び  $R^{14}$  が結合して 3 員～6 員の縮合環を形成するか、又は、

$R^{12}$  及び  $R^{16}$  が結合して 3 員～6 員の縮合環を形成するか、又は、

$R^{16}$  及び  $R^{18}$  が結合して 3 員～6 員の縮合環を形成するか、又は、

$R^{12}$  及び  $R^{17}$  が結合して 1 原子若しくは 2 原子の架橋を形成するか、又は、

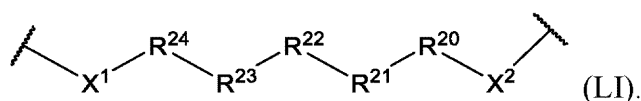
$R^{12}$  及び  $R^{19}$  が結合して 1 原子若しくは 2 原子の架橋を形成するか、又は、

$R^{14}$  及び  $R^{17}$  が結合して 1 原子若しくは 2 原子の架橋を形成するか、又は、

$R^{14}$  及び  $R^{19}$  が結合して 1 原子若しくは 2 原子の架橋を形成し、

リンカーは、式：

【化 8】



10

20

30

40

50

の二価連結基であり、

ここで、

$X^1$  及び  $X^2$  は、いずれの場合にも独立して結合、複素環、 $NR^2$ 、 $C(R^2)_2$ 、 $O$ 、 $C(O)$  及び  $S$  からなる群から選択され、

$R^2$  は、いずれの場合にも独立して水素、アルキル、脂肪族、ヘテロ脂肪族、複素環、アリール、ヘテロアリール、 $-C(O)H$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)$ アルキル、 $-C(O)O$ アルキル、 $-C(O)$ (脂肪族、アリール、ヘテロ脂肪族又はヘテロアリール)、 $-C(O)O$ (脂肪族、アリール、ヘテロ脂肪族又はヘテロアリール)、アルケン及びアルキンからなる群から選択され、

$R^{20}$ 、 $R^{21}$ 、 $R^{22}$ 、 $R^{23}$  及び  $R^{24}$  は、いずれの場合にも独立して結合、アルキル、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-OC(O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-C(O)NR^2-$ 、 $-NR^2C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NR^2-$ 、 $-C(R^{40}R^{40})-$ 、 $-P(O)(OR^{26})O-$ 、 $-P(O)(OR^{26})-$ 、二環、アルケン、アルキン、ハロアルキル、アルコキシ、アリール、複素環、脂肪族、ヘテロ脂肪族、ヘテロアリール、乳酸、グリコール酸及び炭素環からなる群から選択され、その各々が  $R^{40}$  から独立して選択される1つ、2つ、3つ又は4つの置換基で任意に置換され、 $R^{26}$  は、いずれの場合にも独立して水素、アルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルケン、アルキン、アリール、ヘテロアリール、複素環、脂肪族及びヘテロ脂肪族からなる群から選択され、

$R^{40}$  は、いずれの場合にも独立して水素、アルキル、アルケン、アルキン、フルオロ、ブロモ、クロロ、ヒドロキシル、アルコキシ、アジド、アミノ、シアノ、 $-NH$ (脂肪族)、 $-N$ (脂肪族) $_2$ 、 $-NH SO_2$ (脂肪族)、 $-N$ (脂肪族) $SO_2$ アルキル、 $-NH SO_2$ (アリール、ヘテロアリール又は複素環)、 $-N$ (アルキル) $SO_2$ (アリール、ヘテロアリール又は複素環)、 $-NH SO_2$ アルケニル、 $-N$ (アルキル) $SO_2$ アルケニル、 $-NH SO_2$ アルキニル、 $-N$ (アルキル) $SO_2$ アルキニル、ハロアルキル、脂肪族、ヘテロ脂肪族、アリール、ヘテロアリール、複素環及びシクロアルキルからなる群から選択される)の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項2】

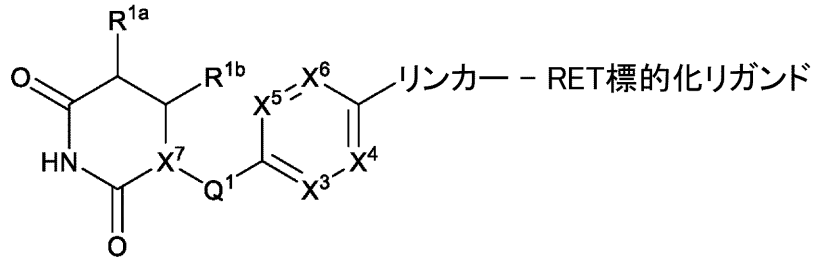
前記化合物が式：

30

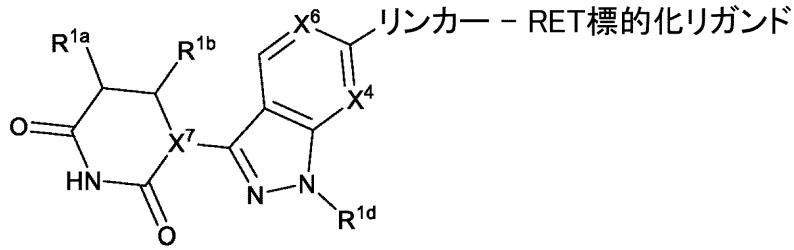
40

50

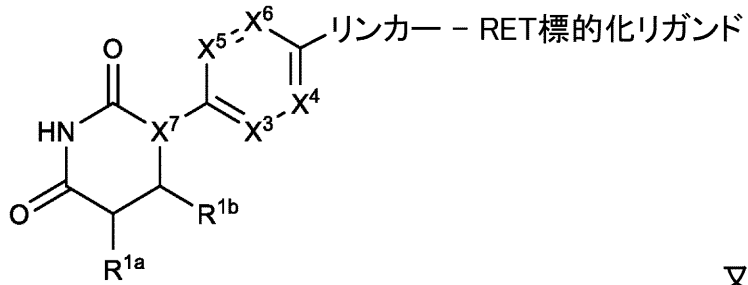
【化 9】



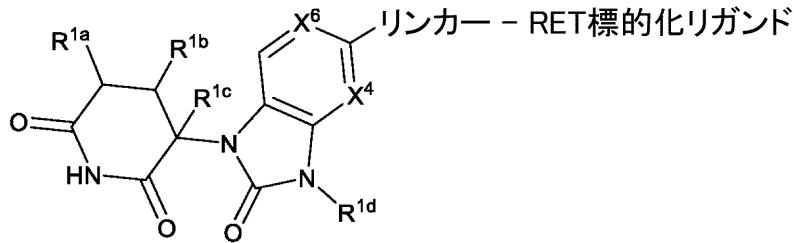
10



20



又は



30

の化合物であり、

【化 10】



40

がヘテロアリアル、複素環又は炭素環であり、その各々が R<sup>9</sup> から独立して選択される 0、1つ、2つ、3つ又は4つの置換基で任意に置換され、ここで、

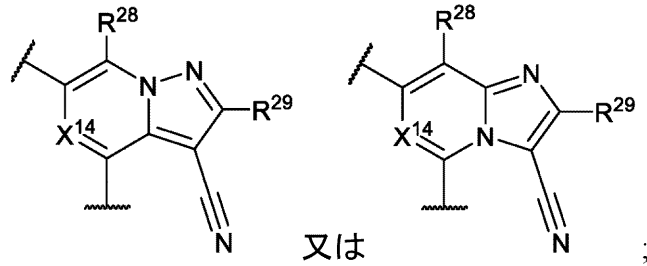
【化 11】



がリンカーと、

50

## 【化 1 2】



とに直接結合し、

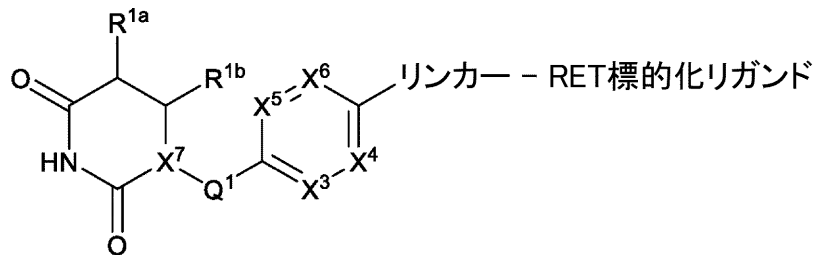
$R^9$  がいずれの場合にも独立して水素、アリール、ヘテロアリール、複素環、シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、ハロゲン、 $-OR^6$ 、 $-NR^6R^7$ 、 $-C(O)OR^6$ 、 $-C(O)NR^6R^7$ 、 $-アルキル-C(O)OR^6$  及び  $-アルキル-C(O)NR^6R^7$  からなる群から選択され、このアリール、ヘテロアリール、複素環及びシクロアルキル基の各々が  $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、ハロゲン、 $-OR^6$ 、 $-NR^6R^7$ 、 $-C(O)OR^6$ 、 $-C(O)NR^6R^7$ 、 $-アルキル-C(O)OR^6$  及び  $-アルキル-C(O)NR^6R^7$  から選択される0、1つ、2つ又は3つの置換基で任意に置換され、

$R^{10}$  がいずれの場合にも独立して  $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、複素環、 $-アルキル-ヘテロアリール$ 、 $-アルキル-アリール$  及び  $-アルキル-複素環$  からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項3】

前記化合物が式：

## 【化 1 3】



の化合物である、請求項1又は2に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項4】

$Q^1$  がNHである、請求項3に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

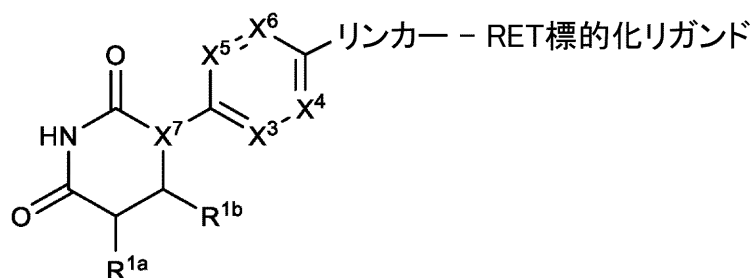
## 【請求項5】

$Q^1$  がNCH<sub>3</sub>である、請求項3に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項6】

前記化合物が式：

## 【化 1 4】



10

20

30

40

50

の化合物である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 7】

X<sup>7</sup> が N である、請求項 6 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 8】

X<sup>3</sup> が C H である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 9】

X<sup>3</sup> が C R<sup>3</sup> である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 10】

X<sup>5</sup> が C H である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

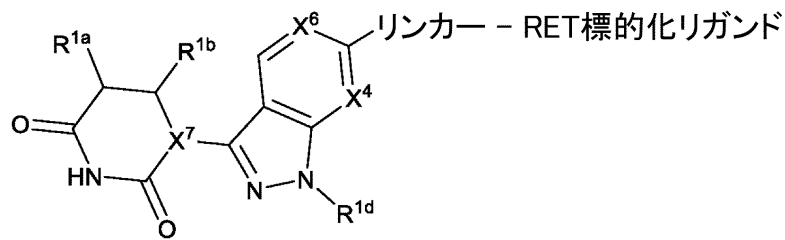
【請求項 11】

X<sup>5</sup> が C R<sup>3</sup> である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 12】

前記化合物が式：

【化 15】



10

20

の化合物である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

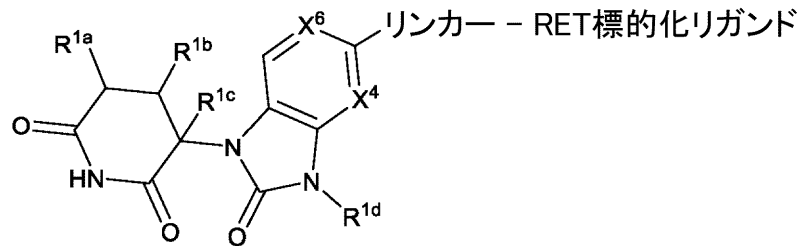
【請求項 13】

X<sup>7</sup> が C R<sup>1c</sup> である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 14】

前記化合物が式：

【化 16】



30

の化合物である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 15】

X<sup>4</sup> が C R<sup>3</sup> である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

40

【請求項 16】

X<sup>4</sup> が C F 又は C H である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 17】

X<sup>6</sup> が C H である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 18】

X<sup>6</sup> が C R<sup>3</sup> である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 19】

R<sup>1a</sup>、R<sup>1b</sup> 及び R<sup>1c</sup> が独立して水素である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

50

【請求項 20】

R<sup>1c</sup>がC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルである、請求項1又は2に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

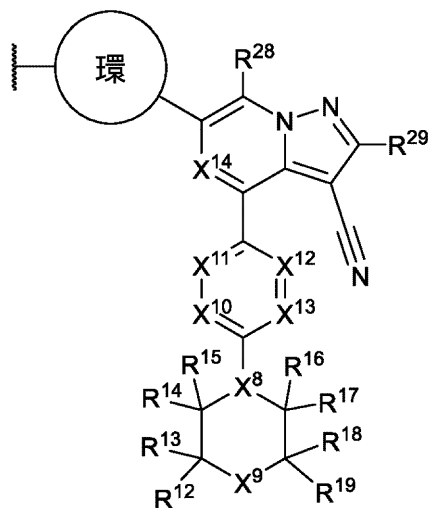
【請求項 21】

R<sup>1d</sup>が水素である、請求項1又は2に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 22】

前記RET標的化リガンドが、

【化17】



10

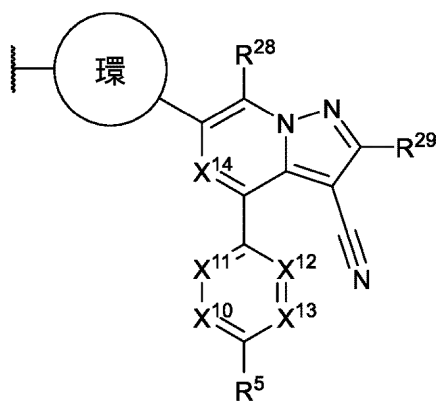
20

である、請求項1又は2に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 23】

前記RET標的化リガンドが、

【化18】



30

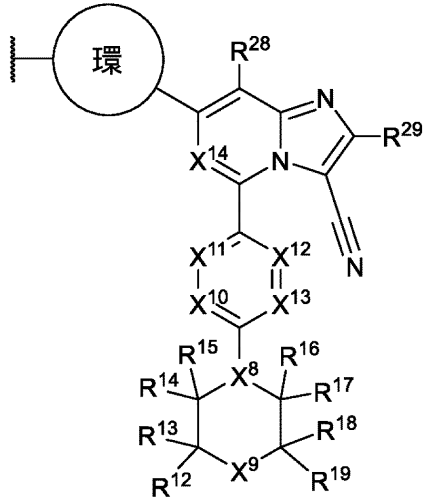
である、請求項1又は2に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 24】

前記RET標的化リガンドが、

40

【化 1 9】



10

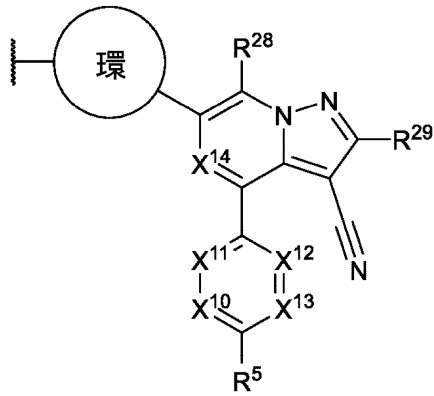
である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 5】

前記 R E T 標的化リガンドが、

【化 2 0】

20



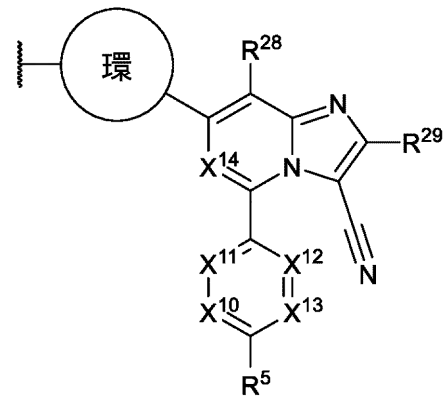
30

である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 6】

前記 R E T 標的化リガンドが、

【化 2 1】



40

である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 7】

50

【化 2 2】



がヘテロアールである、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 8】

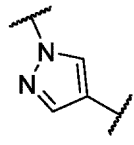
【化 2 3】



10

が、

【化 2 4】



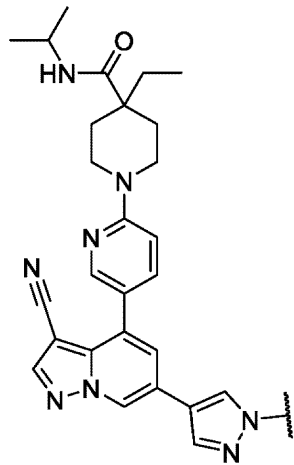
20

である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2 9】

前記 R E T 標的化リガンドが、

【化 2 5】



30

である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

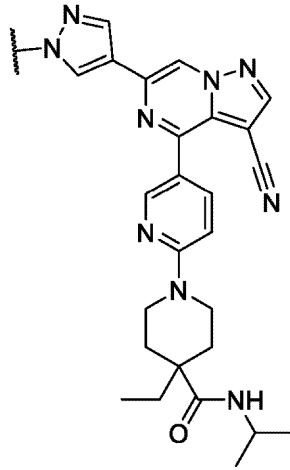
【請求項 3 0】

前記 R E T 標的化リガンドが、

40

50

## 【化 2 6】



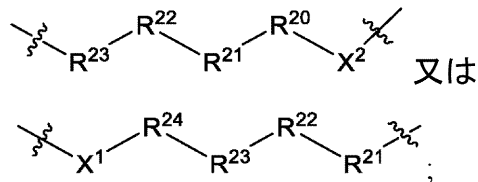
10

である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 3 1】

リンカーが式：

## 【化 2 7】



20

のリンカーである、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 3 2】

$X^1$  が結合、複素環、 $NR^2$  又は  $C(O)$  である、請求項 3 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 3 3】

$X^2$  が結合、複素環、 $NR^2$  又は  $C(O)$  である、請求項 3 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

30

## 【請求項 3 4】

$R^{20}$  が結合、 $CH_2$ 、複素環又はアリールである、請求項 3 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 3 5】

$R^{20}$  が二環である、請求項 3 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 3 6】

$R^{21}$  が結合、 $CH_2$ 、複素環又はアリールである、請求項 3 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

40

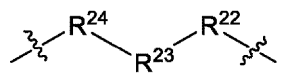
## 【請求項 3 7】

$R^{21}$  が二環である、請求項 3 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 3 8】

リンカーが式：

## 【化 2 8】



のリンカーである、請求項 3 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 3 9】

50

$R^{22}$  が結合、 $CH_2$ 、複素環又はアリールである、請求項 3 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

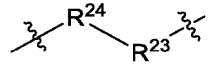
【請求項 4 0】

$R^{22}$  が二環である、請求項 3 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4 1】

リンカーが式：

【化 2 9】



10

のリンカーである、請求項 3 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4 2】

$R^{23}$  が結合、 $CH_2$ 、複素環又はアリールである、請求項 3 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

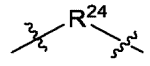
【請求項 4 3】

$R^{23}$  が二環である、請求項 3 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4 4】

リンカーが式：

【化 3 0】



20

のリンカーである、請求項 3 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4 5】

$R^{24}$  が結合、 $CH_2$ 、複素環又はアリールである、請求項 3 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4 6】

$R^{24}$  が二環である、請求項 3 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4 7】

$R^{24}$  が  $C(O)$  である、請求項 3 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

30

【請求項 4 8】

表 1 A から選択される化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

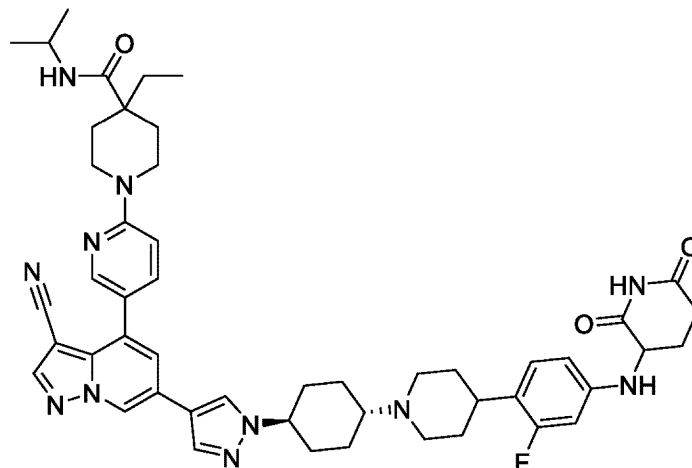
【請求項 4 9】

表 1 B から選択される化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5 0】

構造：

【化 3 1】



40

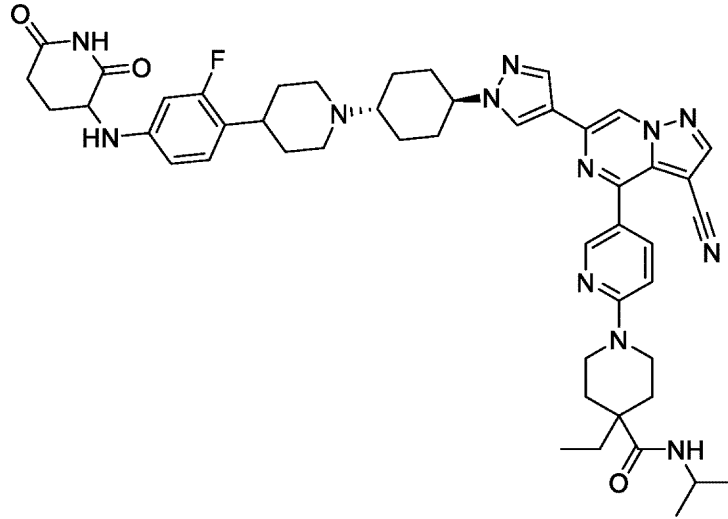
50

の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5 1】

構造：

【化 3 2】



10

の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

20

【請求項 5 2】

ヒト患者における R E T 媒介性障害を治療するための医薬組成物であって、請求項 1 ~ 5 1 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩と、薬学的に許容可能な賦形剤とを含む、医薬組成物。

【請求項 5 3】

前記 R E T 媒介性障害が癌である、請求項 5 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 4】

前記癌が非小細胞肺癌である、請求項 5 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 5】

前記癌が脳に転移している、請求項 5 3 に記載の医薬組成物。

30

【請求項 5 6】

前記癌が突然変異体 R E T によって媒介される、請求項 5 3 ~ 5 5 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 5 7】

前記癌が再発性又は難治性の癌である、請求項 5 3 ~ 5 5 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 5 8】

前記癌が再発性又は難治性の癌である、請求項 5 6 に記載の医薬組成物。

40

50