

【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10月14日(2021.10.14)

【公表番号】特表2020-533277(P2020-533277A)

【公表日】令和2年11月19日(2020.11.19)

【年通号数】公開・登録公報2020-047

【出願番号】特願2020-508026(P2020-508026)

【国際特許分類】

C 07 D 471/04 (2006.01)

A 61 K 31/7068 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 K 31/519 (2006.01)

A 61 K 38/07 (2006.01)

【F I】

C 07 D 471/04 1 1 8 Z

C 07 D 471/04 C S P

A 61 K 31/7068

A 61 P 35/00

A 61 P 43/00 1 2 1

A 61 P 43/00 1 0 5

A 61 K 31/519

A 61 K 38/07

【手続補正書】

【提出日】令和3年9月6日(2021.9.6)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

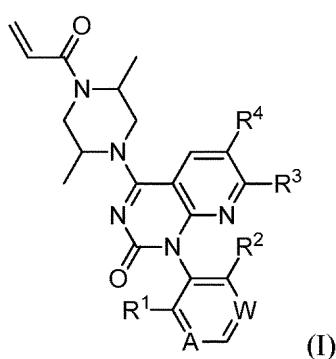
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



(式中、

Aは、独立して、N又はC Hであり；

Wは、独立して、N又はC Hであり；

A及びWの一方又は両方は、Nであり；

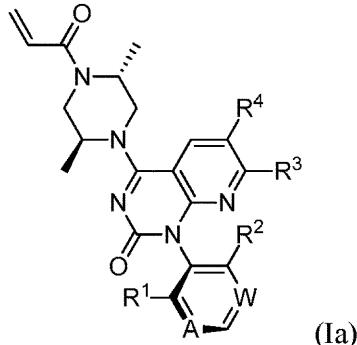
R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> は、独立して、分岐状又は直鎖状 C<sub>1</sub> ~ <sub>6</sub> アルキルであり；  
R<sup>3</sup> は、1つ又は2つの R<sup>5</sup> 置換基によって置換されたフェニルであり；  
R<sup>5</sup> は、独立して、1つ以上のハロ、-OH 又は NH<sub>2</sub> から選択され；  
R<sup>4</sup> は、ハロである）

の構造を有する化合物又はその立体異性体、そのアトロブ異性体、その薬学的に許容される塩、前記その立体異性体の薬学的に許容される塩若しくは前記そのアトロブ異性体の薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

式（I a）

【化 2】



の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 3】

A は、N である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

W は、CH である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 5】

R<sup>1</sup> は、CH (CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> である、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

R<sup>2</sup> は、CH<sub>3</sub> である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

R<sup>5</sup> は、F である、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8】

R<sup>5</sup> は、-OH である、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物。

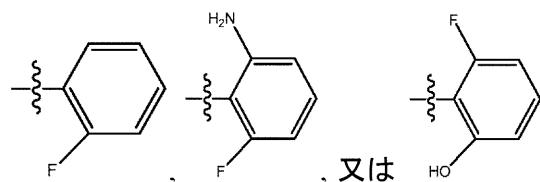
【請求項 9】

R<sup>5</sup> は、-NH<sub>2</sub> である、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

R<sup>3</sup> は、

【化 3】



である、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物。

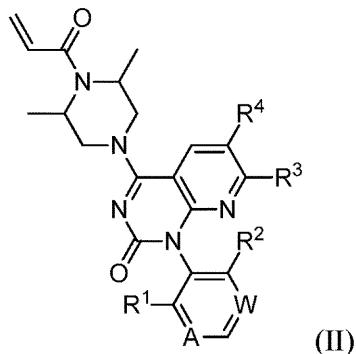
【請求項 11】

R<sup>4</sup> は、F である、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 12】

式（I I）

## 【化4】



(式中、

Aは、独立して、N又はC Hであり；

Wは、独立して、N又はC Hであり；

A及びWの一方又は両方は、Nであり；

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は、独立して、分岐状又は直鎖状C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキルであり；

R<sup>3</sup>は、1つ又は2つのR<sup>5</sup>置換基によって置換されたフェニルであり；

R<sup>5</sup>は、独立して、1つ以上のハロ、-OH又はNH<sub>2</sub>から選択され；及び

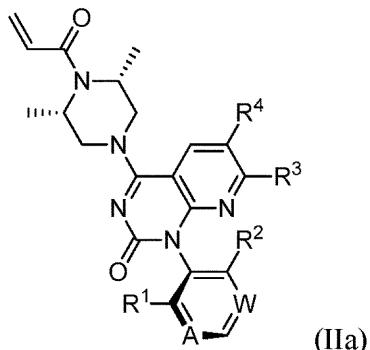
R<sup>4</sup>は、ハロである)

の構造を有する化合物又はその立体異性体、そのアトロブ異性体、その薬学的に許容される塩、前記その立体異性体の薬学的に許容される塩若しくは前記そのアトロブ異性体の薬学的に許容される塩。

## 【請求項13】

式(I I a)

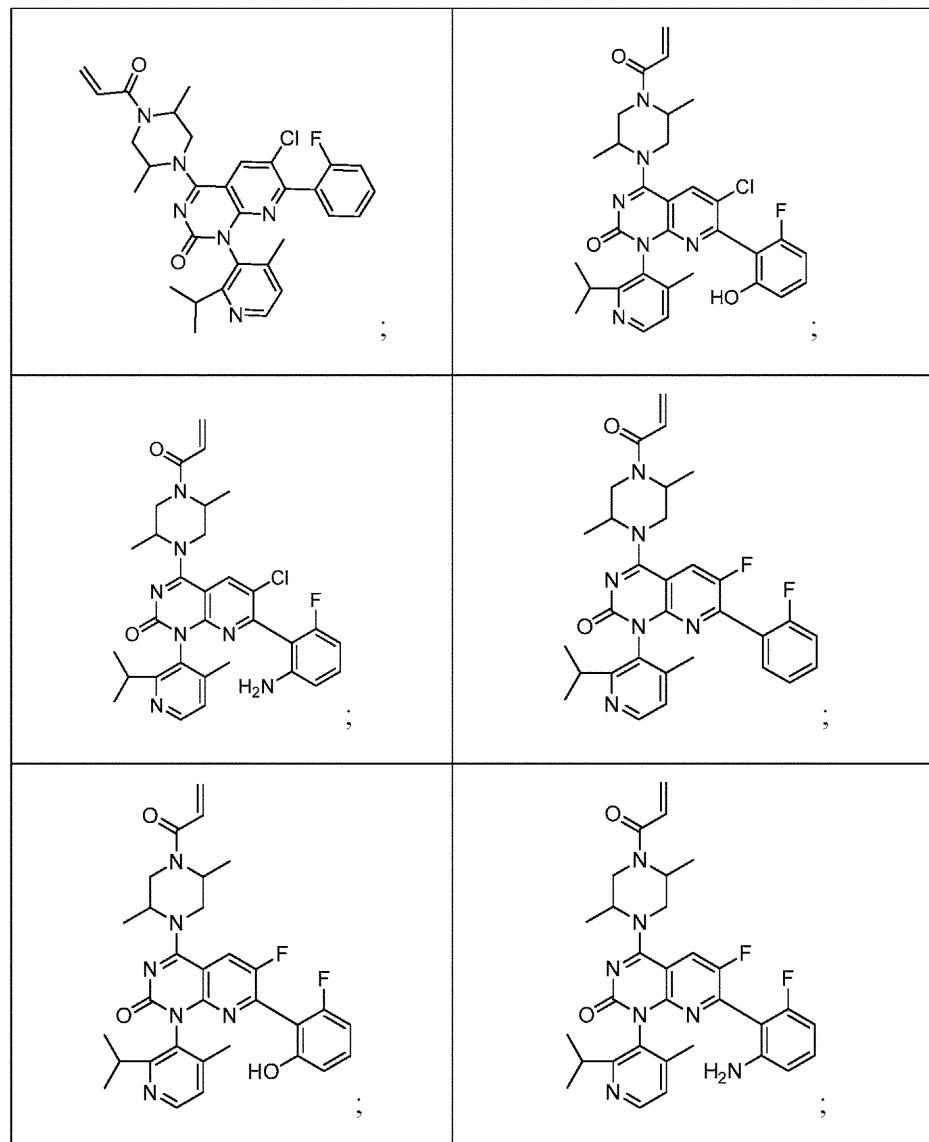
## 【化5】



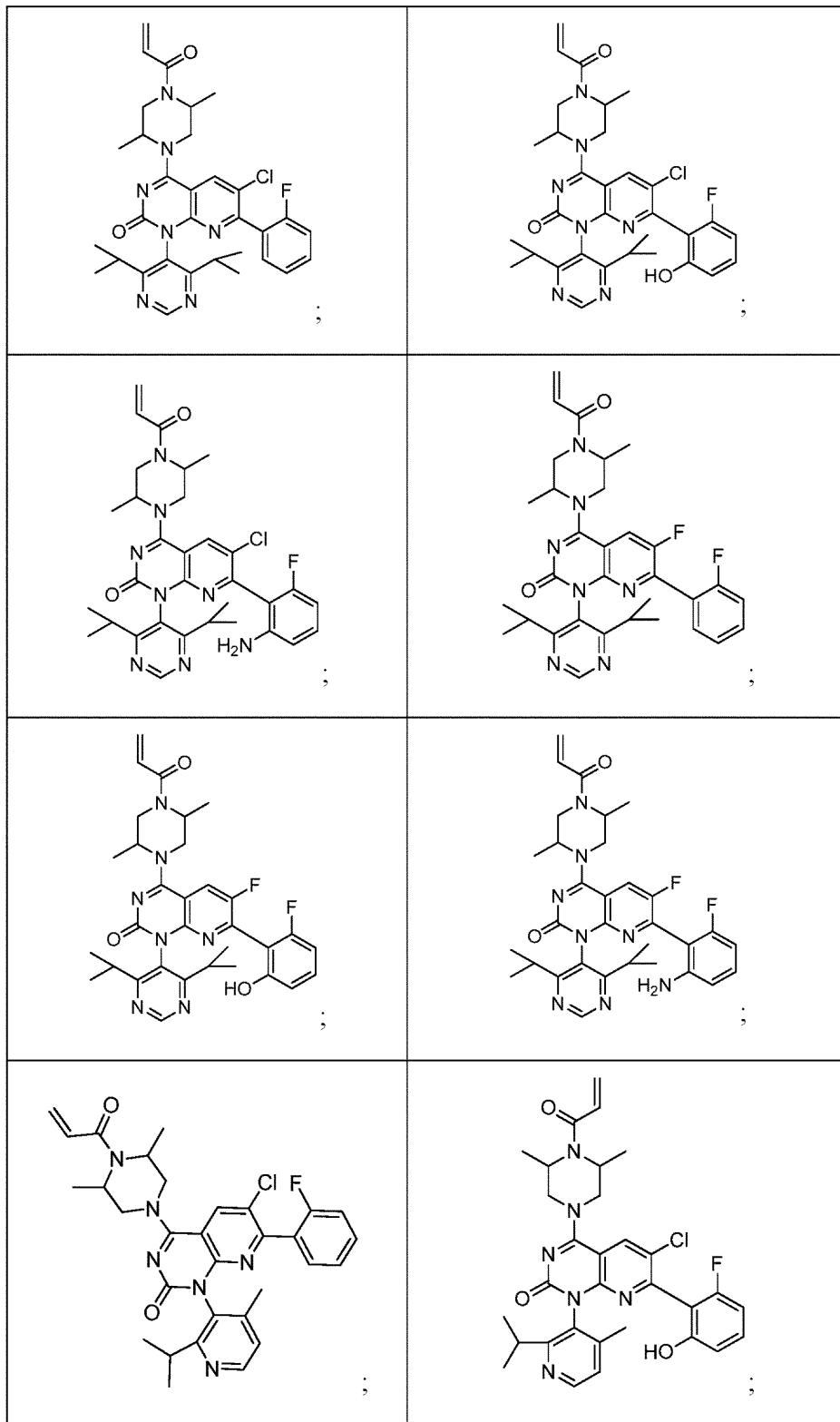
の構造を有する、請求項12に記載の化合物又はその立体異性体、その薬学的に許容される塩、前記その立体異性体の薬学的に許容される塩。

## 【請求項14】

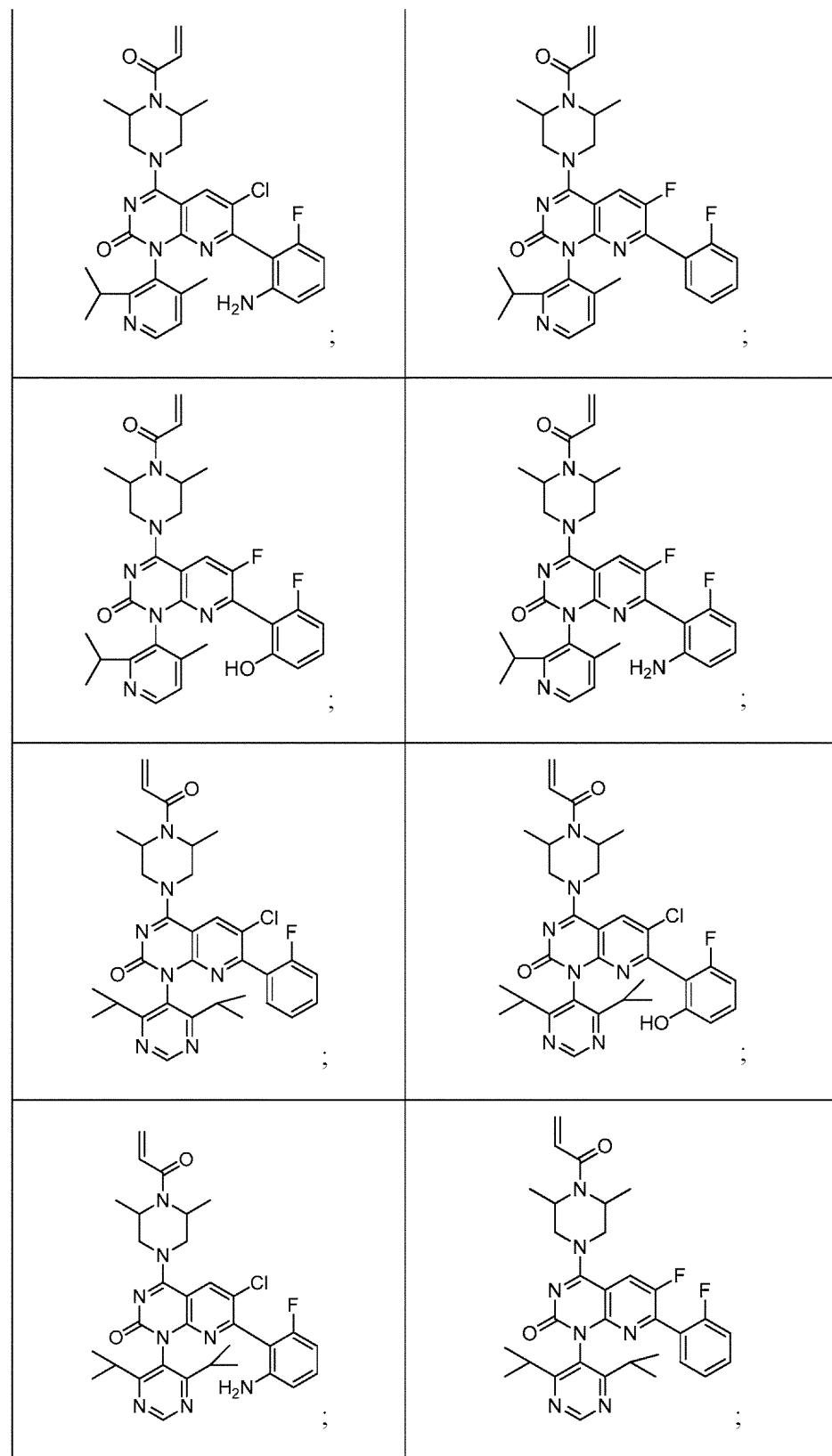
【化 6】



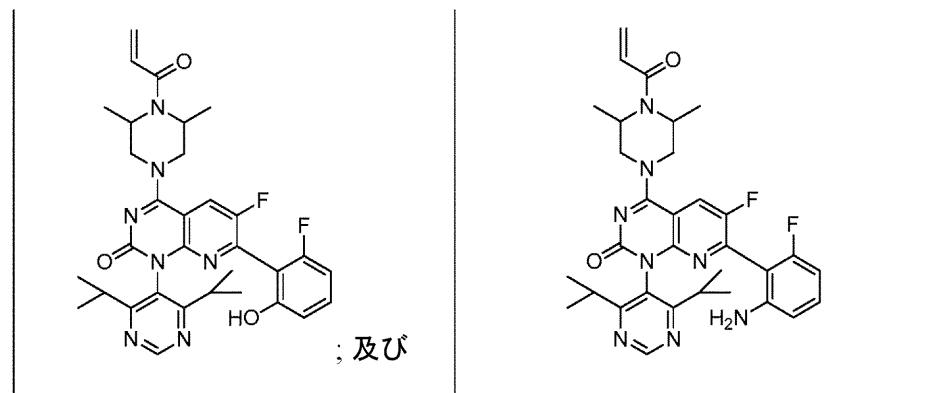
【化 7】



【化 8】



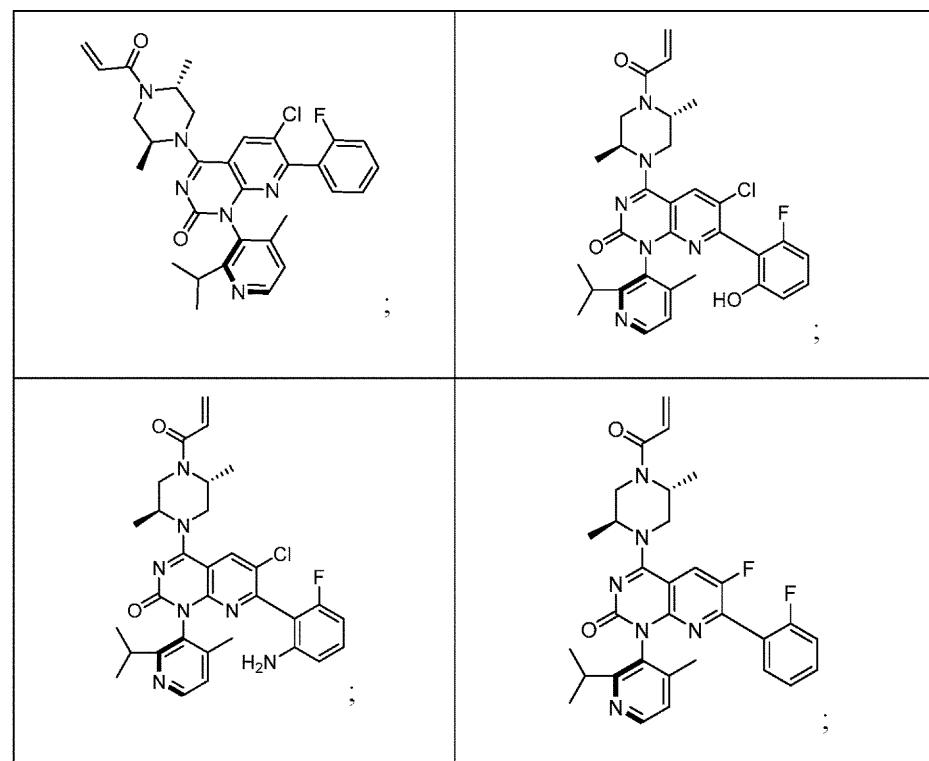
【化9】



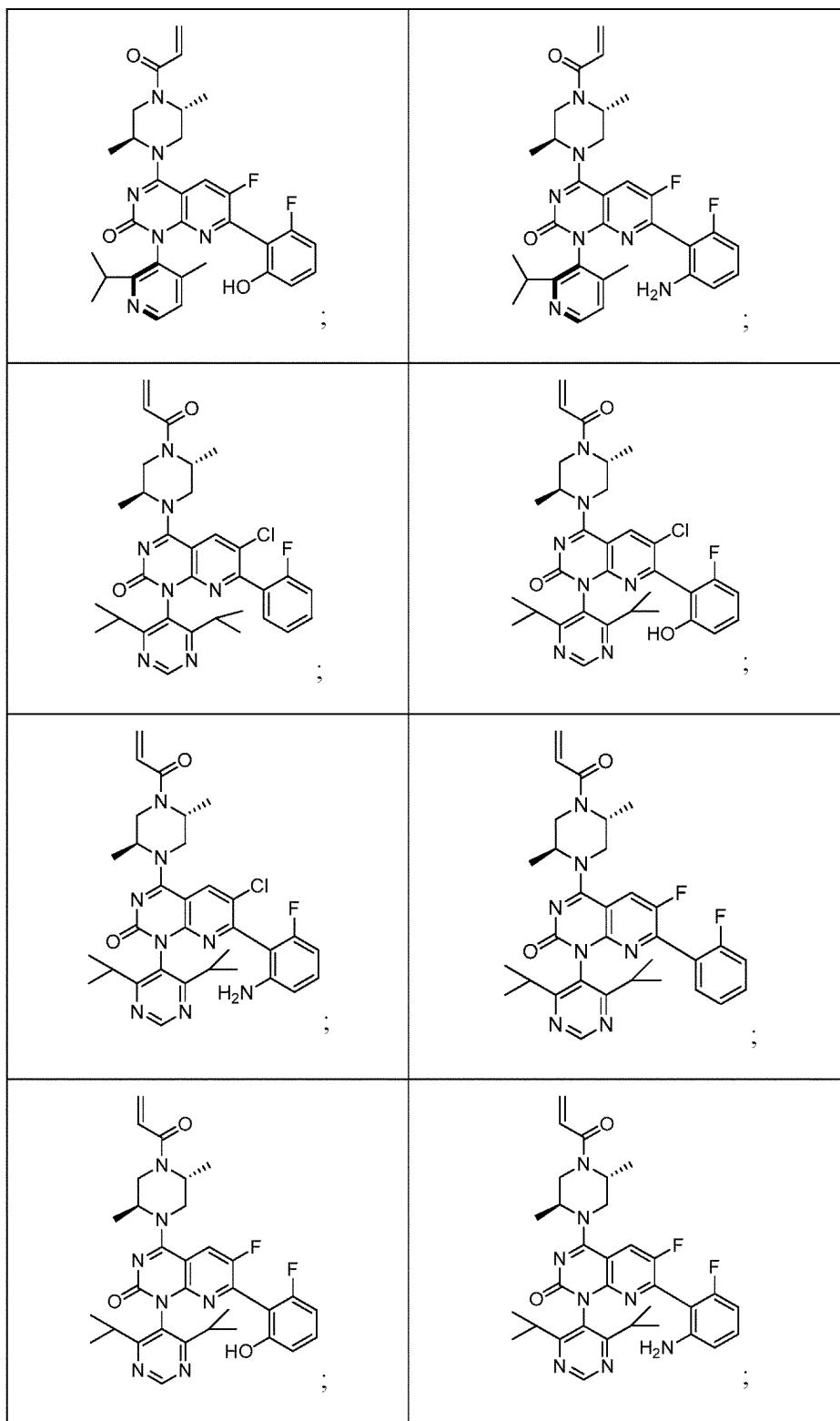
から選択される構造を有する請求項1又は12の化合物又はその立体異性体、そのアトロプ異性体、その薬学的に許容される塩、前記その立体異性体の薬学的に許容される塩若しくは前記そのアトロプ異性体の薬学的に許容される塩。

【請求項15】

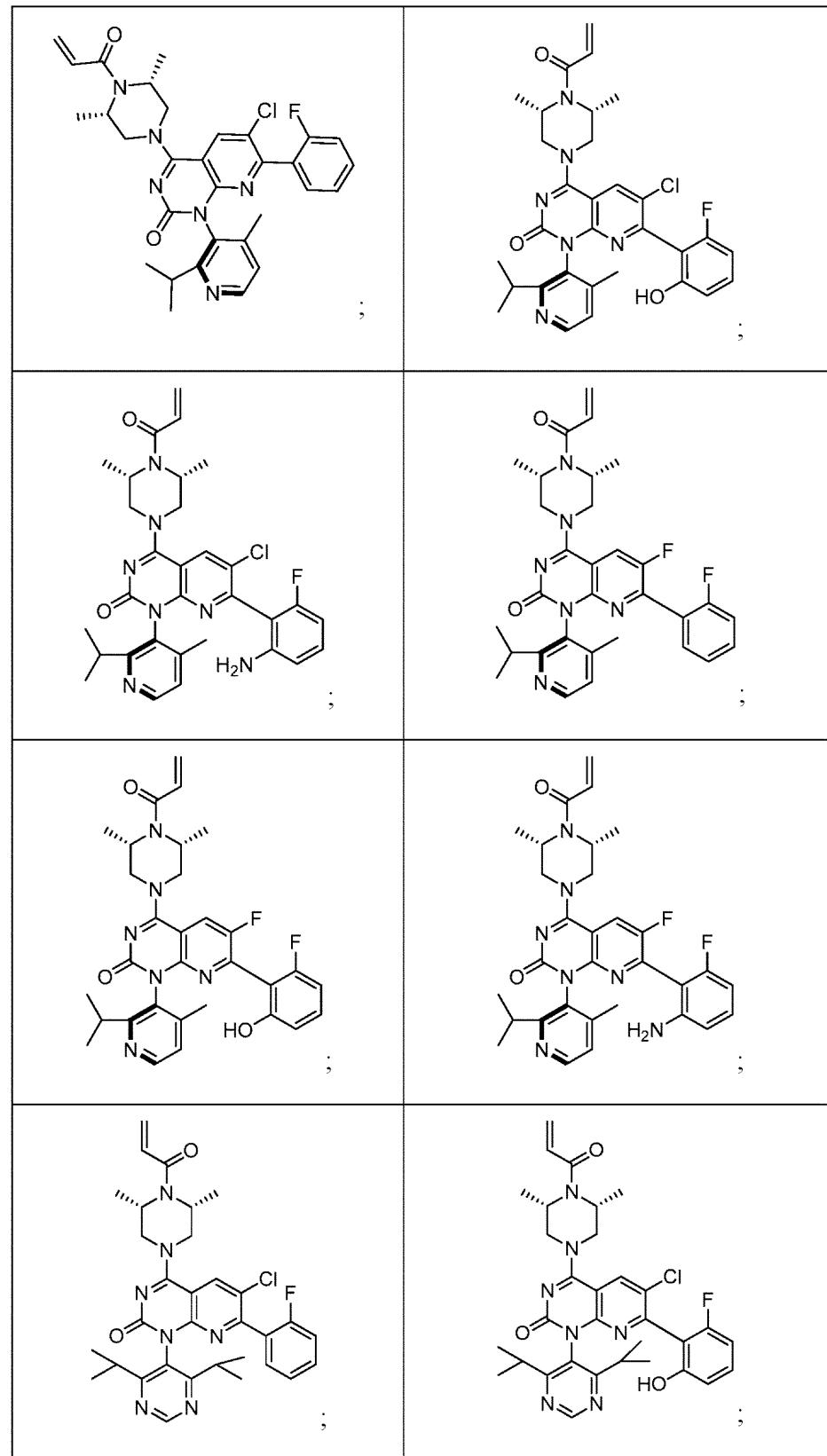
【化10】



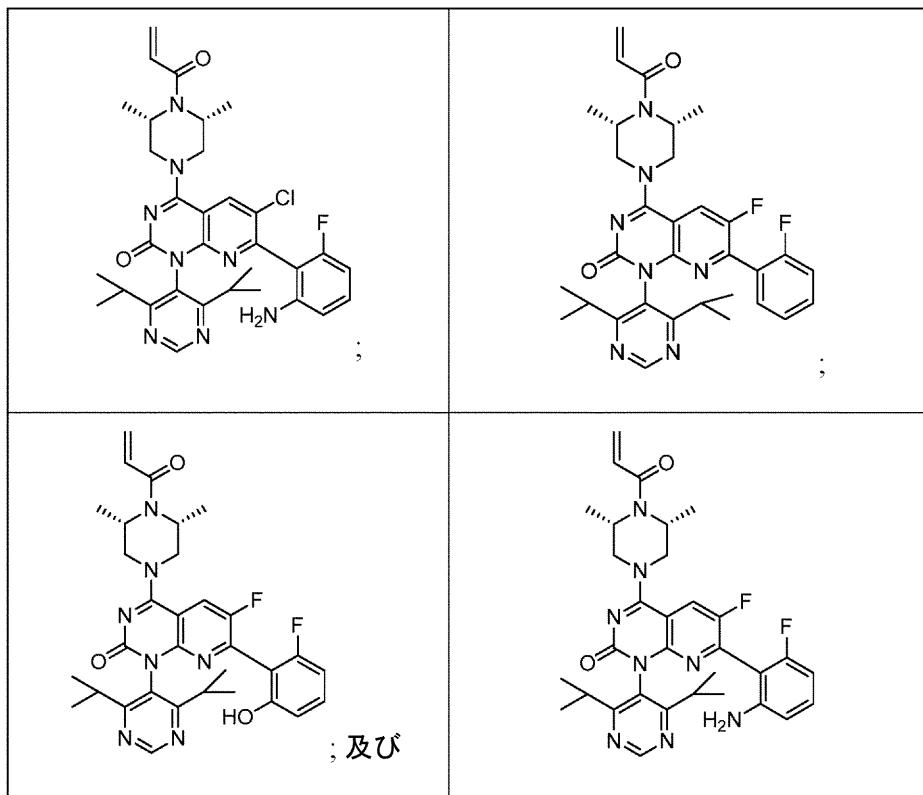
【化 11】



【化 1 2】



【化13】

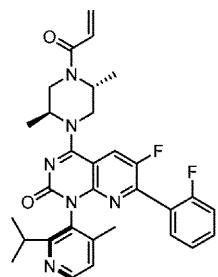


から選択される構造を有する請求項1又は12の化合物又は薬学的に許容される塩。

【請求項16】

構造

【化14】

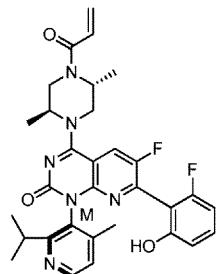


を有する、請求項15に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項17】

構造

【化15】

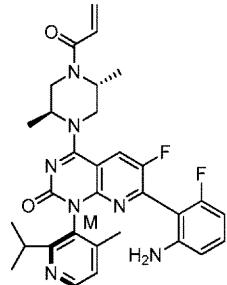


を有する、請求項1\_5に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1\_8】

構造

【化 1\_6】



を有する、請求項1\_5に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1\_9】

請求項1 ~ 1\_8のいずれか一項に記載の化合物及び薬学的に許容される賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 2\_0】

細胞中の K R A S G 1 2 C を阻害するイン・ビトロ方法であって、前記細胞を、請求項1 ~ 1\_8のいずれか一項に記載の化合物又は請求項1\_9の医薬組成物と接觸させることを含む方法。

【請求項 2\_1】

がんを治療するための、請求項 1\_9 に記載の医薬組成物。

【請求項 2\_2】

前記がんは、非小細胞肺がん、大腸がん、膵臓がん、虫垂がん、子宮内膜がん、食道がん、胃がん、小腸がん、鼻腔がん、副鼻腔がん、胆管がん、皮膚がん又は眼内黒色腫である、請求項2\_1に記載の医薬組成物。

【請求項 2\_3】

前記がんは、非小細胞肺がんである、請求項2\_1に記載の医薬組成物。

【請求項 2\_4】

前記がんは、大腸がんである、請求項2\_1に記載の医薬組成物。

【請求項 2\_5】

前記がんは、膵臓がんである、請求項2\_1に記載の医薬組成物。

【請求項 2\_6】

前記がんは、K R A S G 1 2 C 変異を有する、請求項2\_1 ~ 2\_5のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 2\_7】

がんを治療するための医薬の製造のための、請求項 1 ~ 1\_8 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 2\_8】

前記がんは、非小細胞肺がん、結腸がん、膵臓がん、虫垂がん、子宮内膜がん、食道がん、胃がん、小腸がん、鼻腔がん、副鼻腔がん、胆管がん、皮膚がんまたは眼内黒色腫である、請求項2\_7に記載の使用。

【請求項 2\_9】

前記がんは、非小細胞肺がんである、請求項2\_7に記載の使用。

【請求項 3\_0】

前記がんは、大腸がんである、請求項2\_7に記載の使用。

【請求項 3\_1】

前記がんは、膵臓がんである、請求項2\_7に記載の使用。

【請求項 3\_2】

前記がんは、K R A S G 1 2 C 変異を有する、請求項 2 7 ~ 3 1 のいずれか一項に記載の使用。