

【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 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/7068 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 38/07 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 1 8 Z

C 0 7 D 471/04 C S P

A 6 1 K 31/7068

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 K 31/519

A 6 1 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

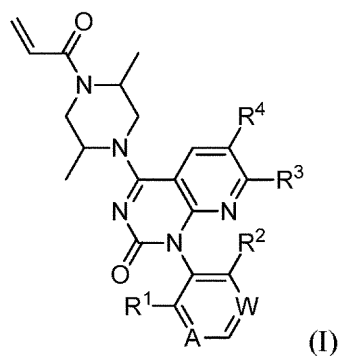
【補正の内容】

【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 CH であり；

W は、独立して、N 又は CH であり；

A 及び W の一方又は両方は、N であり；

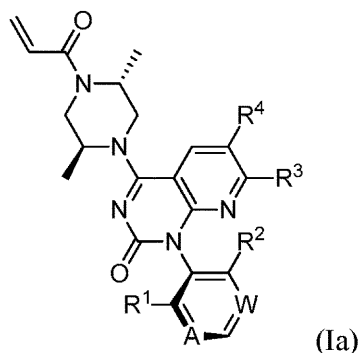
R^1 及び R^2 は、独立して、分岐状又は直鎖状 C_{1-6} アルキルであり；
 R^3 は、1つ又は2つの R^5 置換基によって置換されたフェニルであり；
 R^5 は、独立して、1つ以上のハロ、 $-OH$ 又は NH_2 から選択され；
 R^4 は、ハロである）

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 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^1 は、 $CH(CH_3)_2$ 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^2 は、 CH_3 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^5 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^5 は、 $-OH$ である、請求項 1 ～ 6 のいずれか一項 に記載の化合物。

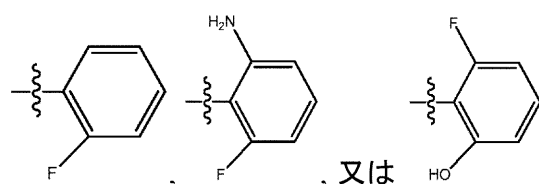
【請求項 9】

R^5 は、 $-NH_2$ 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^3 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。

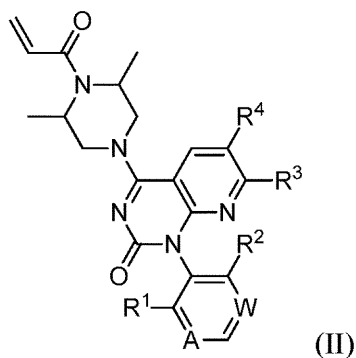
【請求項 11】

R^4 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 CH であり；

W は、独立して、N 又は CH であり；

A 及び W の一方又は両方は、N であり；

R¹ 及び R² は、独立して、分岐状又は直鎖状 C₁ - 6 アルキルであり；

R³ は、1 つ又は 2 つの R⁵ 置換基によって置換されたフェニルであり；

R⁵ は、独立して、1 つ以上のハロ、-OH 又は NH₂ から選択され；及び

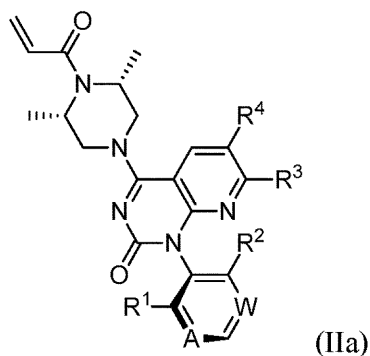
R⁴ は、ハロである)

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 13】

式 (IIa)

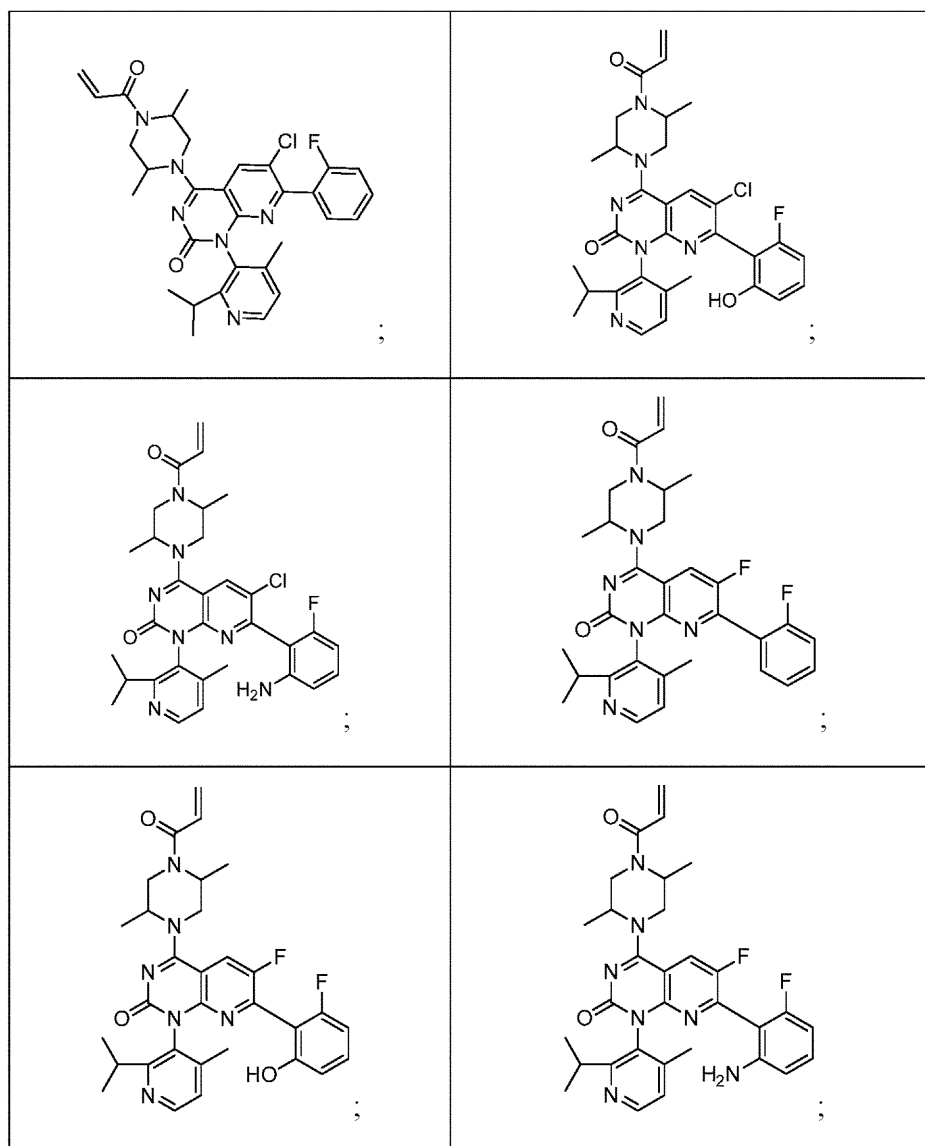
【化 5】



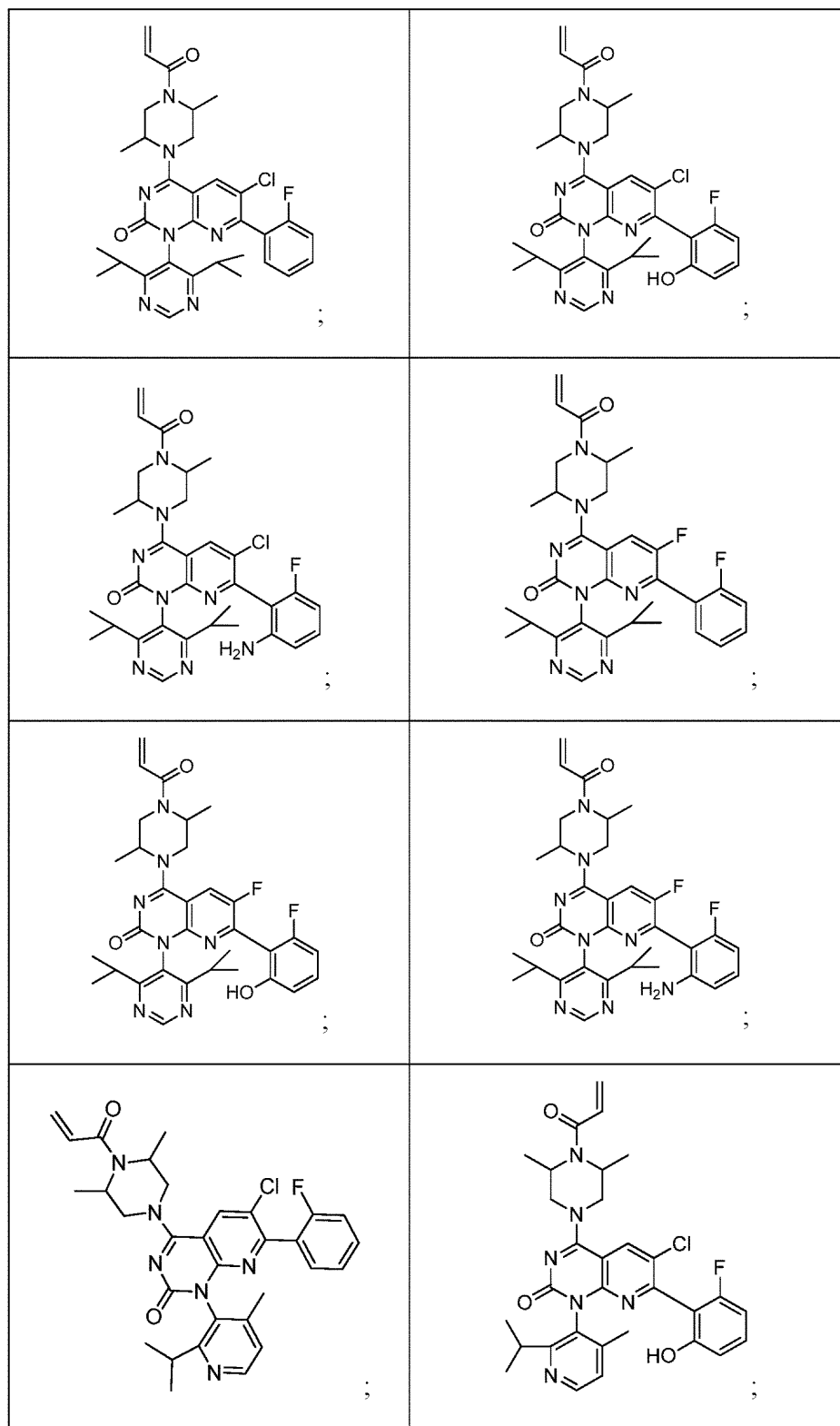
の構造を有する、請求項 12 に記載の化合物又はその立体異性体、その薬学的に許容される塩、前記その立体異性体の薬学的に許容される塩。

【請求項 14】

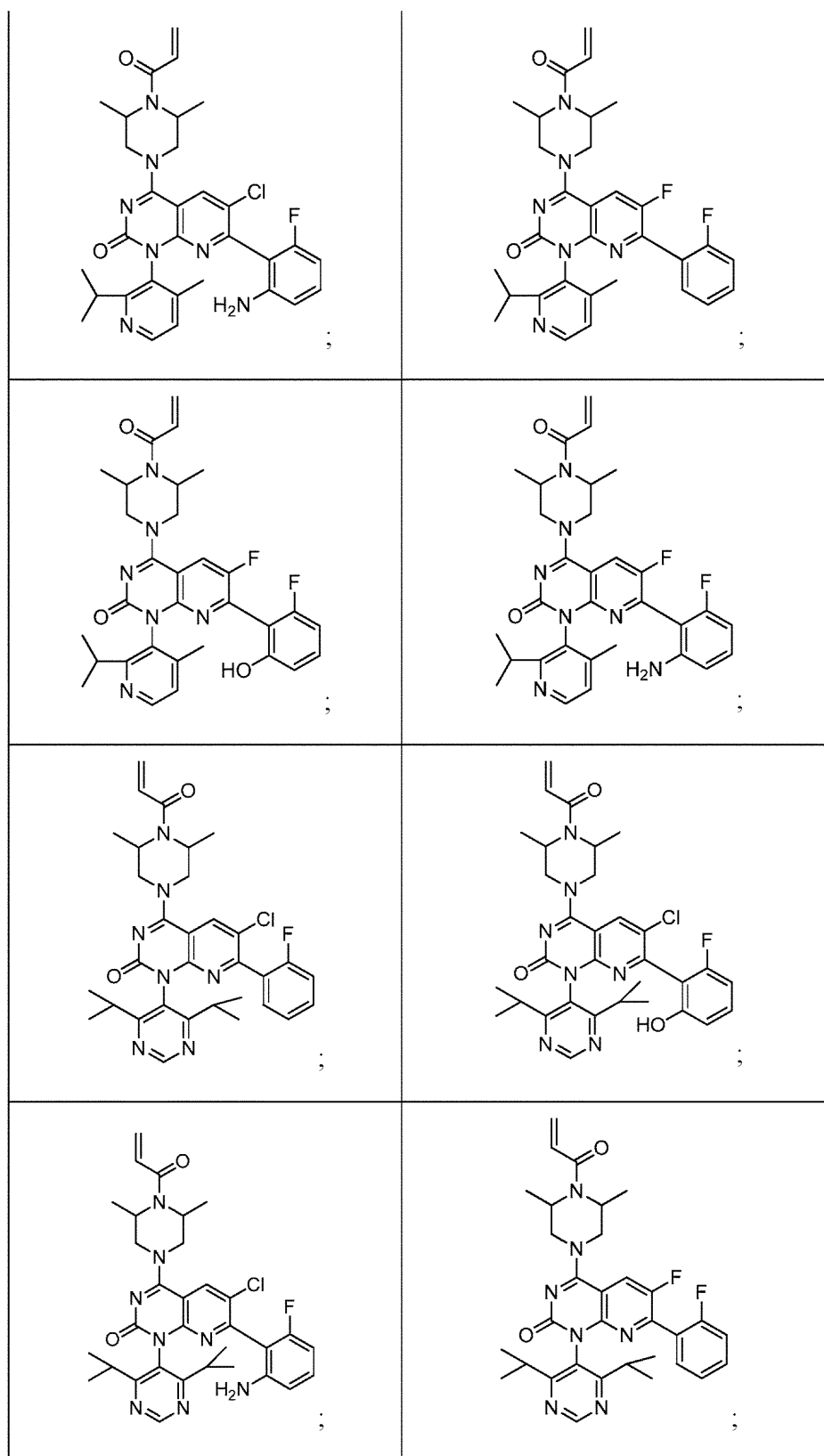
【化 6】



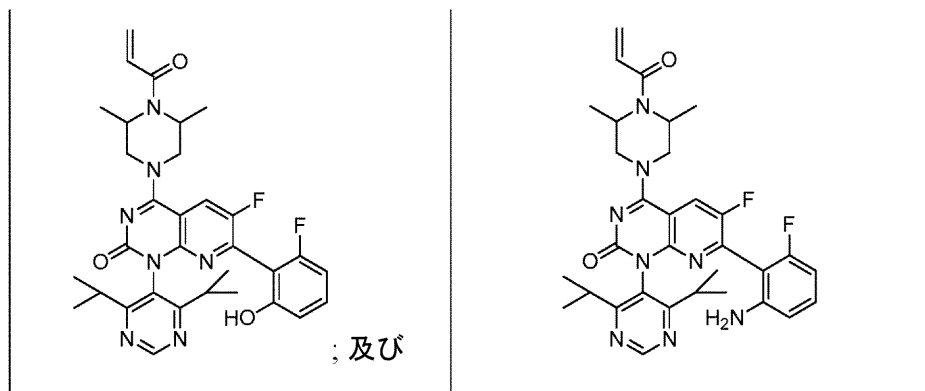
【化 7】



【化 8】



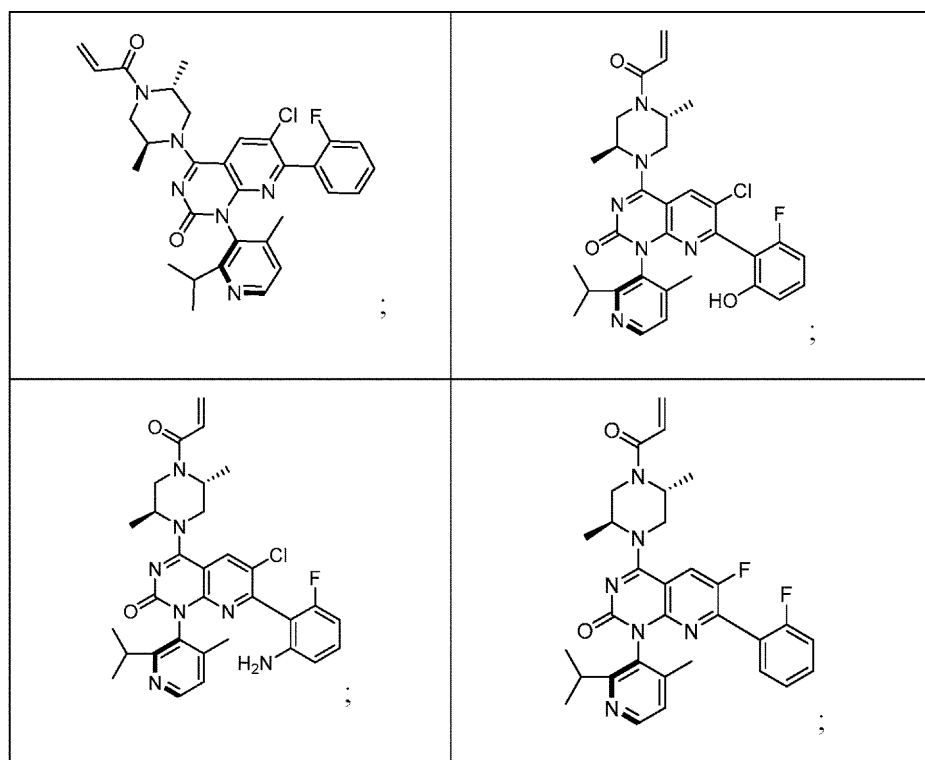
【化 9】



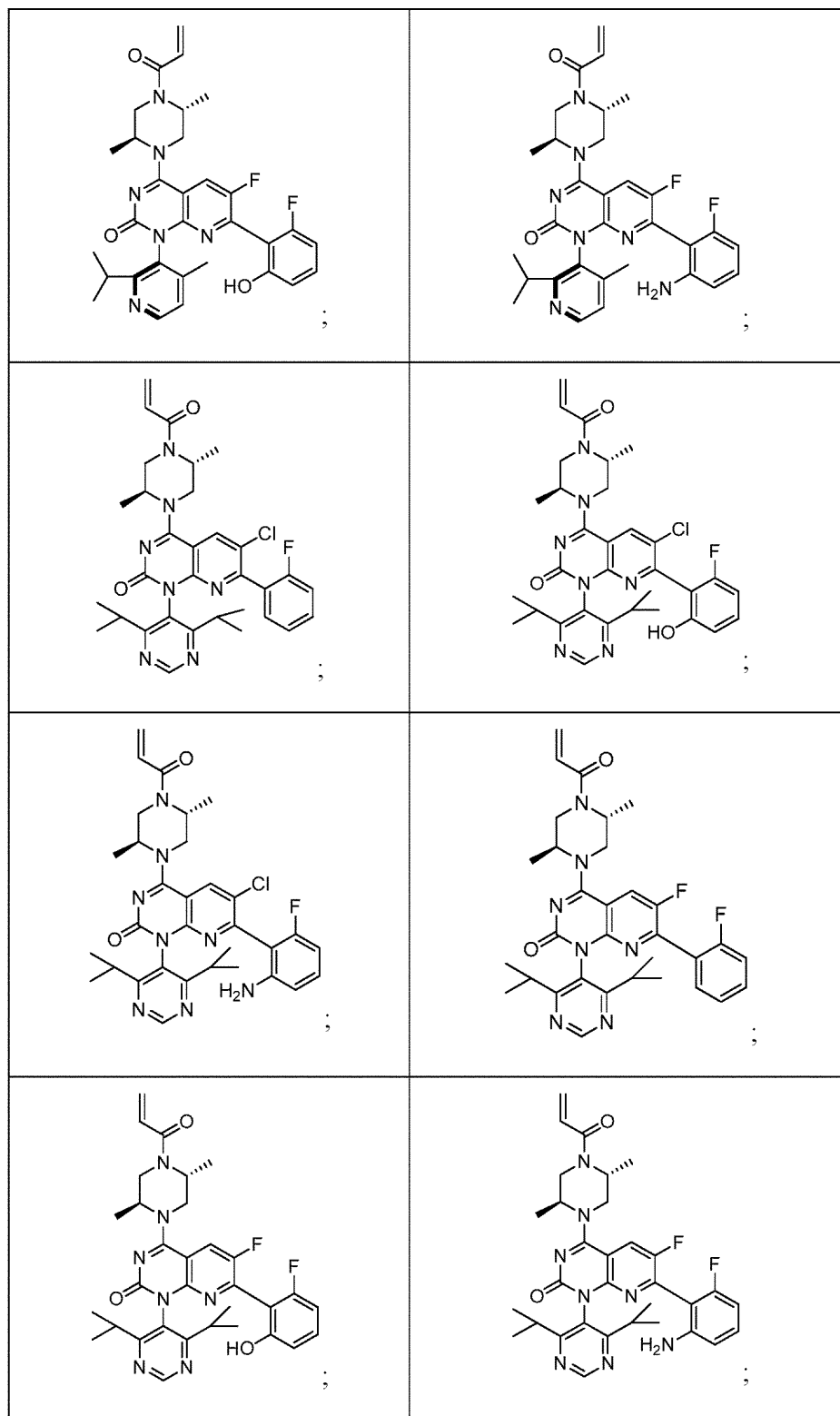
から選択される構造を有する請求項 1 又は 1 2 の化合物又はその立体異性体、そのアトロプ異性体、その薬学的に許容される塩、前記その立体異性体の薬学的に許容される塩若しくは前記そのアトロプ異性体の薬学的に許容される塩。

【請求項 1 5】

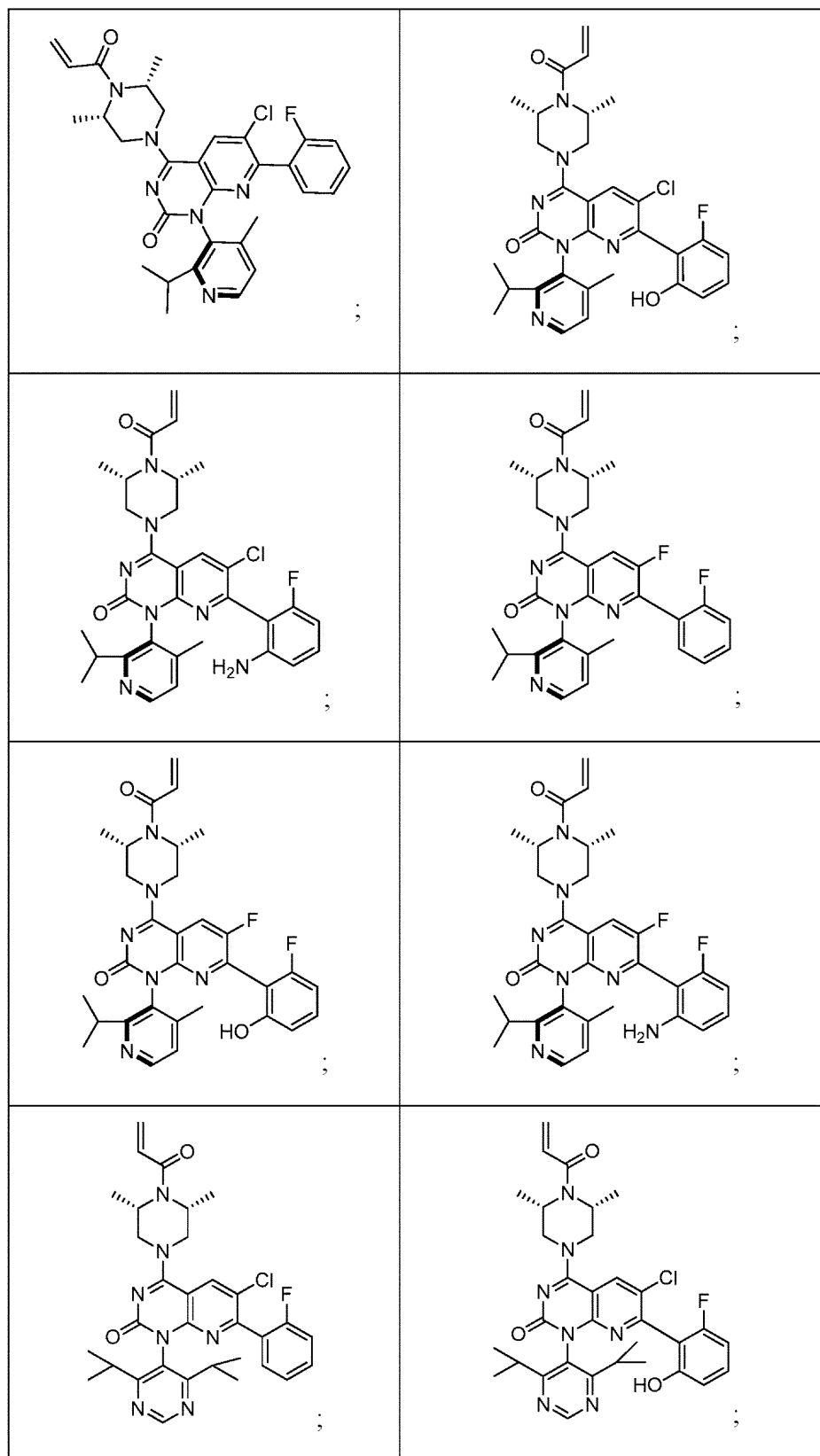
【化 1 0】



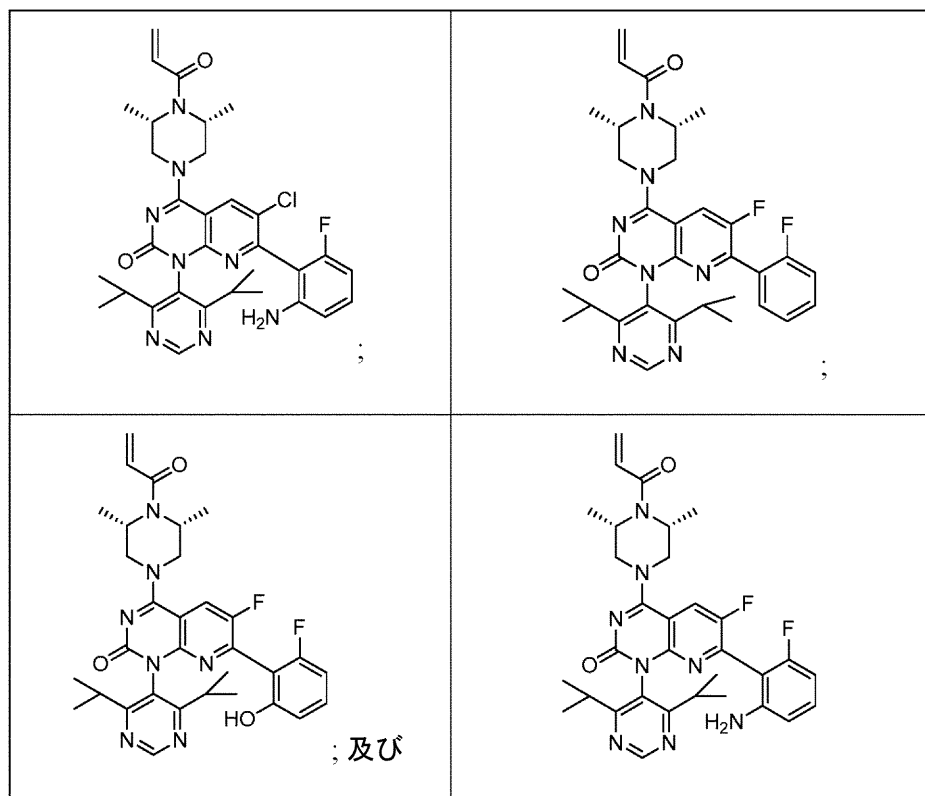
【化 1 1】



【化 1 2】



【化 1 3】

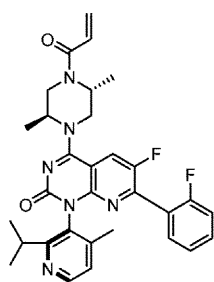


から選択される構造を有する請求項 1 又は 1 2 の化合物又は薬学的に許容される塩。

【請求項 1 6】

構造

【化 1 4】

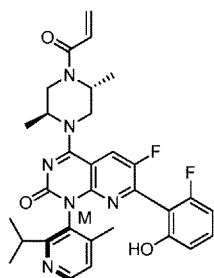


を有する、請求項 1 5 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 7】

構造

【化 1 5】

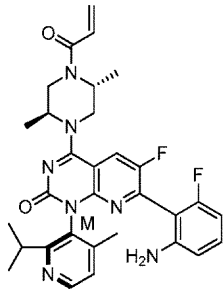


を有する、請求項 15 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 18】

構造

【化 16】



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 19】

請求項 1 ~ 18 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 20】

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 ~ 18 のいずれか一項に記載の化合物又は 請求項 19 の医薬組成物 と接触させることを含む方法。

【請求項 21】

がんを治療するための、請求項 19 に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

前記がんは、非小細胞肺癌、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 21 に記載の 医薬組成物。

【請求項 23】

前記がんは、非小細胞肺癌である、請求項 21 に記載の医薬組成物。

【請求項 24】

前記がんは、大腸がんである、請求項 21 に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

前記がんは、膵臓がんである、請求項 21 に記載の医薬組成物。

【請求項 26】

前記がんは、K R A S G 1 2 C 変異を有する、請求項 21 ~ 25 のいずれか一項に記載の 医薬組成物。

【請求項 27】

がんを治療するための医薬の製造のための、請求項 1 ~ 18 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 28】

前記がんは、非小細胞肺癌、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 27 に記載の 使用。

【請求項 29】

前記がんは、非小細胞肺癌である、請求項 27 に記載の使用。

【請求項 30】

前記がんは、大腸がんである、請求項 27 に記載の使用。

【請求項 31】

前記がんは、膵臓がんである、請求項 27 に記載の使用。

【請求項 32】

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。