

【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 6 月 10 日 (2021.6.10)

【公表番号】特表 2020-517600 (P2020-517600A)

【公表日】令和 2 年 6 月 18 日 (2020.6.18)

【年通号数】公開・登録公報 2020-024

【出願番号】特願 2019-556175 (P2019-556175)

【国際特許分類】

C 0 7 D 305/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/4192 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 405/06 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 305/12

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 31/4192

C 0 7 D 405/14 C S P

C 0 7 D 405/06

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 4 月 19 日 (2021.4.19)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

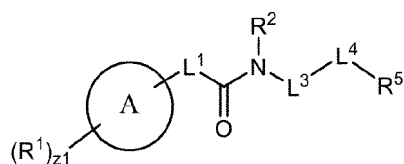
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

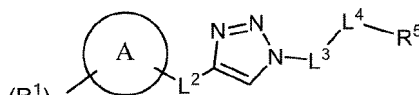
【請求項 1】

式：

【化 1】



( I )、もしくは

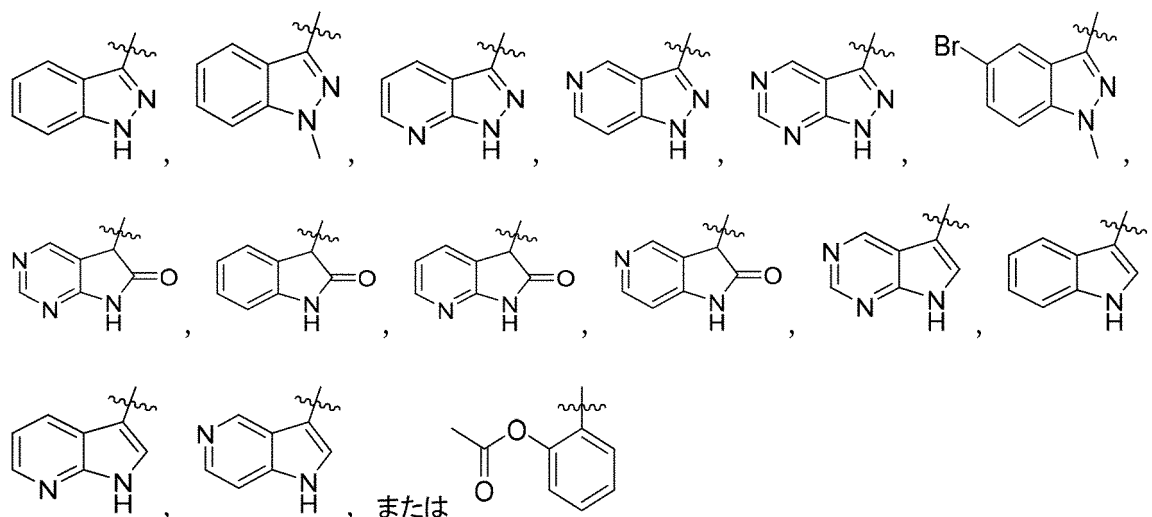


( I I )

を有する化合物、またはその薬学的に許容される塩であって、式中、

環 A が、フェニル、インドリル、インダゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾオキサゾリル、アザインドリル、プリニル、インドリル、ピラジニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、

## 【化 2】



であり、

$R^1$  が独立して、ハロゲン、 $-CX^1_3$ 、 $-CHX^1_2$ 、 $-CH_2X^1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n-1}R^{1D}$ 、 $-SO_{v-1}NR^{1A}R^{1B}$ 、 $-NHN R^{1A}R^{1B}$ 、 $-ONR^{1A}R^{1B}$ 、 $-NHC(=O)NHN R^{1A}R^{1B}$ 、 $-NHC(=O)NR^{1A}R^{1B}$ 、 $-N(O)_m$ 、 $-NR^{1A}R^{1B}$ 、 $-C(O)R^{1C}$ 、 $-C(O)-OR^{1C}$ 、 $-C(O)NR^{1A}R^{1B}$ 、 $-OR^{1D}$ 、 $-NR^{1A}SO_2R^{1D}$ 、 $-NR^{1A}C(O)R^{1C}$ 、 $-NR^{1A}C(O)OR^{1C}$ 、 $-NR^{1A}OR^{1C}$ 、 $-OCX^1_3$ 、 $-OCHX^1_2$ 、 $-OCH_2X^1$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換ヘテロアルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、または置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルであり、

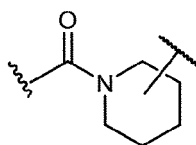
あるいは、2つの隣接した $R^1$ 置換基が任意選択で、連結して、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく、

$z$  が、0～4の整数であり、

$R^2$  が独立して、水素、 $-CX^2_3$ 、 $-CHX^2_2$ 、 $-CH_2X^2$ 、 $-C(O)R^{2A}$ 、 $-C(O)OR^{2A}$ 、 $-C(O)NR^{2A}R^{2B}$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換ヘテロアルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

$L^1$  が、結合、置換もしくは非置換アルキレン、置換もしくは非置換シクロアルキレン、または

## 【化 3】



であり、

ここで、環 A がフェニルであるときは、 $L^1$  が、結合、置換もしくは非置換アルキレン、または置換もしくは非置換シクロアルキレンであり、

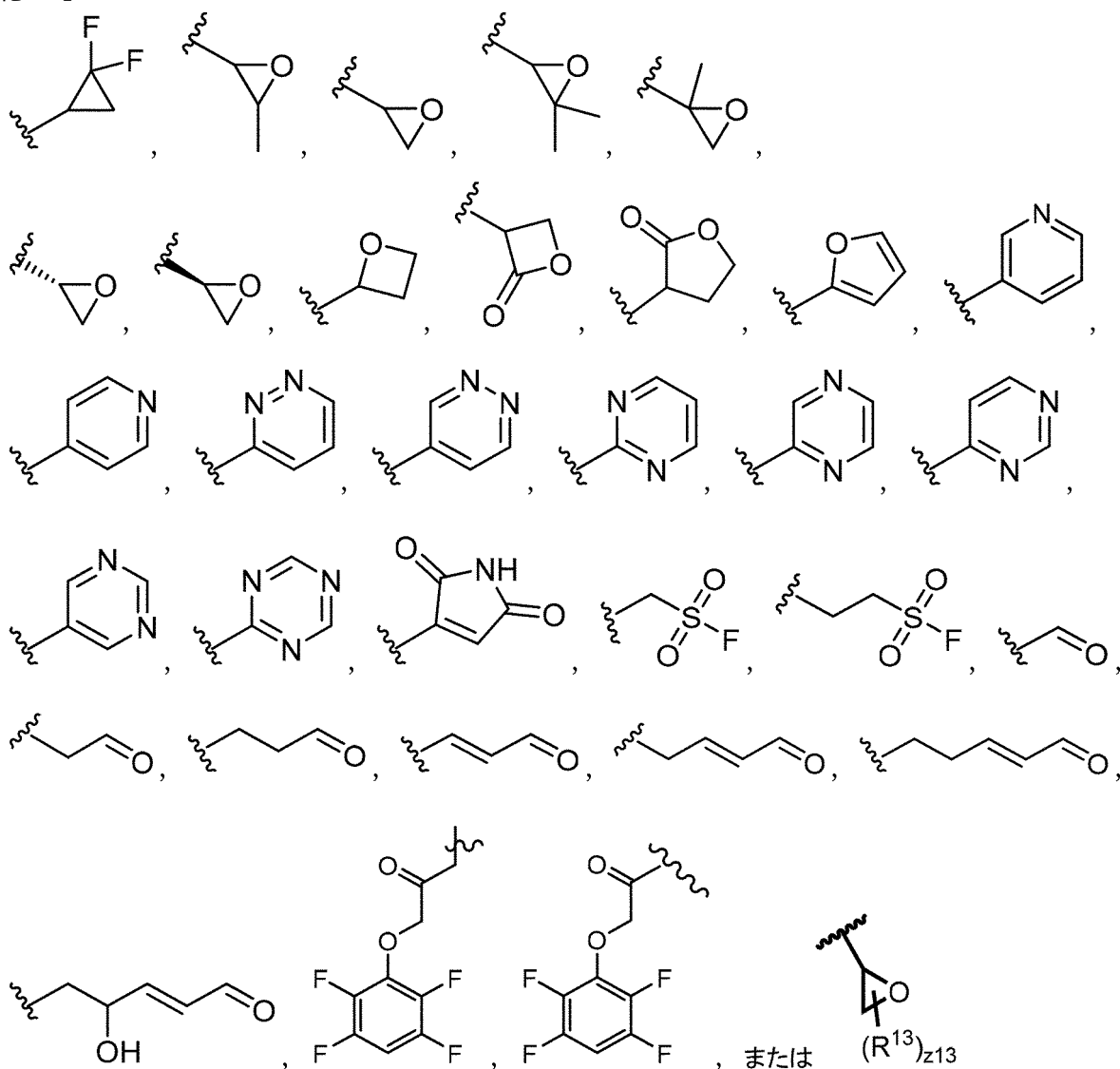
$L^2$  が、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)NH-$ 、または $-C(O)NHCH_2-$ であり、

$L^3$  が、結合、 $-S(O)_2-$ 、 $-N(R^3)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)N(R^3)-$ 、 $-N(R^3)C(O)-$ 、 $-N(R^3)C(O)NH-$ 、 $-NHC(O)N(R^3)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-OC(O)-$ 、置換もしくは非置換アルキレ

$R^3$  が独立して、水素、 $-CX^3_3$ 、 $-CHX^3_2$ 、 $-CH_2X^3$ 、 $-C(O)R^3A$ 、 $-C(O)OR^3A$ 、 $-C(O)NR^3AR^3B$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換ヘテロアルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

$R^4$  が独立して、水素、 $-CX^4_3$ 、 $-CHX^4_2$ 、 $-CH_2X^4$ 、 $-C(O)R^4_A$ 、 $-C(O)OR^4_A$ 、 $-C(O)NR^4_AR^4_B$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換ヘテロアルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

【化 4】



であり、ここで、 $R^{1\ 3}$  は、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキルであり、および  $z\ 1\ 3$  は、 $0 \sim 3$  の整数であり、

各  $R^{1\ A}$ 、 $R^{1\ B}$ 、 $R^{1\ C}$ 、 $R^{1\ D}$ 、 $R^{2\ A}$ 、 $R^{2\ B}$ 、 $R^{3\ A}$ 、 $R^{3\ B}$ 、 $R^{4\ A}$ 、及び  $R^{4\ B}$  が独立して、水素、 $-CX_3$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CHX_2$ 、 $-CH_2X$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換ヘテロアルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

同じ窒素原子に結合した  $R^{1\ A}$  及び  $R^{1\ B}$  置換基が任意選択で、連結して、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく、

同じ窒素原子に結合した  $R^{2\ A}$  及び  $R^{2\ B}$  置換基が任意選択で、連結して、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく、

同じ窒素原子に結合した  $R^{3\ A}$  及び  $R^{3\ B}$  置換基が任意選択で、連結して、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく、

同じ窒素原子に結合した  $R^{4\ A}$  及び  $R^{4\ B}$  置換基が任意選択で、連結して、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく、

各  $X$ 、 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$ 、及び  $X^4$  が独立して、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、または  $-I$  であり、

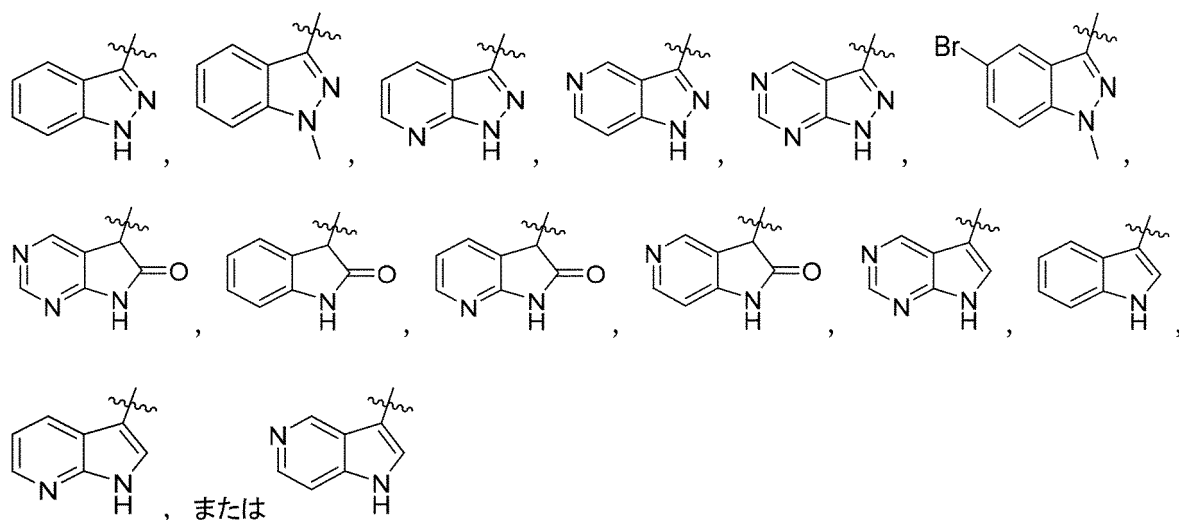
$n\ 1$  が独立して、 $0 \sim 4$  の整数であり、

$m\ 1$  及び  $v\ 1$  が独立して、 $1$  または  $2$  である、前記化合物、またはその薬学的に許容される塩。

#### 【請求項 2】

環 A が、インドリニル、インダゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾオキサゾリル、アザインドリル、プリニル、インドリル、ピラジニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、

#### 【化 5】



であり、

$R^1$  が独立して、ハロゲン、 $-CX^1_3$ 、 $-CHX^1_2$ 、 $-CH_2X^1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n\ 1}$ 、 $R^{1\ D}$ 、 $-SO_{v\ 1}NR^{1\ A}R^{1\ B}$ 、 $-NHN R^{1\ A}R^{1\ B}$ 、 $-ONR^{1\ A}R^{1\ B}$ 、 $-NHC=(O)NHN R^{1\ A}R^{1\ B}$ 、 $-NHC(O)NR^{1\ A}R^{1\ B}$ 、 $-N(O)_m$

$_1$ 、 $-NR^{1A}R^{1B}$ 、 $-C(O)R^{1C}$ 、 $-C(O)-OR^{1C}$ 、 $-C(O)NR^{1A}R^{1B}$ 、 $-OR^{1D}$ 、 $-NR^{1A}SO_2R^{1D}$ 、 $-NR^{1A}C(O)R^{1C}$ 、 $-NR^{1A}C(O)OR^{1C}$ 、 $-NR^{1A}OR^{1C}$ 、 $-OCX^1_3$ 、 $-OCHX^1_2$ 、 $-OCH_2X^1$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換ヘテロアルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、または置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルであり、

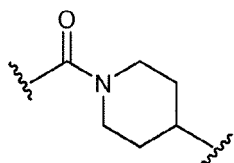
あるいは、2つの隣接した $R^1$ 置換基が任意選択で、連結して、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく、

$z_1$ が、0～4の整数であり、

$R^2$ が独立して、水素、 $-CX^2_3$ 、 $-CHX^2_2$ 、 $-CH_2X^2$ 、 $-C(O)R^{2A}$ 、 $-C(O)OR^{2A}$ 、 $-C(O)NR^{2A}R^{2B}$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換ヘテロアルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

$L^1$ が、結合、置換もしくは非置換アルキレン、置換もしくは非置換シクロアルキレン、または

【化6】



であり、

$L^2$ が、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)NH-$ 、または $-C(O)NHCH_2-$ であり、

$L^3$ が、結合、 $-S(O)_2-$ 、 $-N(R^3)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)N(R^3)-$ 、 $-N(R^3)C(O)-$ 、 $-N(R^3)C(O)NH-$ 、 $-NH C(O)N(R^3)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-OC(O)-$ 、置換もしくは非置換アルキレン、置換もしくは非置換ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換シクロアルキレン、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

$R^3$ が独立して、水素、 $-CX^3_3$ 、 $-CHX^3_2$ 、 $-CH_2X^3$ 、 $-C(O)R^{3A}$ 、 $-C(O)OR^{3A}$ 、 $-C(O)NR^{3A}R^{3B}$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換ヘテロアルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

$L^4$ が、結合、 $-S(O)_2-$ 、 $-N(R^4)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)C(O)-$ 、 $-N(R^4)C(O)NH-$ 、 $-NH C(O)N(R^4)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-OC(O)-$ 、置換もしくは非置換アルキレン、置換もしくは非置換ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換シクロアルキレン、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

$R^4$ が独立して、水素、 $-CX^4_3$ 、 $-CHX^4_2$ 、 $-CH_2X^4$ 、 $-C(O)R^{4A}$ 、 $-C(O)OR^{4A}$ 、 $-C(O)NR^{4A}R^{4B}$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換ヘテロアルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

各 $R^{1A}$ 、 $R^{1B}$ 、 $R^{1C}$ 、 $R^{1D}$ 、 $R^{2A}$ 、 $R^{2B}$ 、 $R^{3A}$ 、 $R^{3B}$ 、 $R^{4A}$ 、及び $R^{4B}$ が独立して、水素、 $-CX_3$ 、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CHX_2$ 、 $-CH_2X$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換ヘテロアルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロアリール、置換もしくは非置換ヘテロシクロアリール、置換もしくは非置換ヘテロシクロアリールであり、

非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

同じ窒素原子に結合した  $R^{1A}$  及び  $R^{1B}$  置換基が任意選択で、連結して、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく、

同じ窒素原子に結合した  $R^{2A}$  及び  $R^{2B}$  置換基が任意選択で、連結して、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく、

同じ窒素原子に結合した  $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  置換基が任意選択で、連結して、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく、

同じ窒素原子に結合した  $R^{4A}$  及び  $R^{4B}$  置換基が任意選択で、連結して、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく、

各  $X$ 、 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$ 、及び  $X^4$  が独立して、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、または  $-I$  であり、

$n_1$  が独立して、0～4の整数であり、

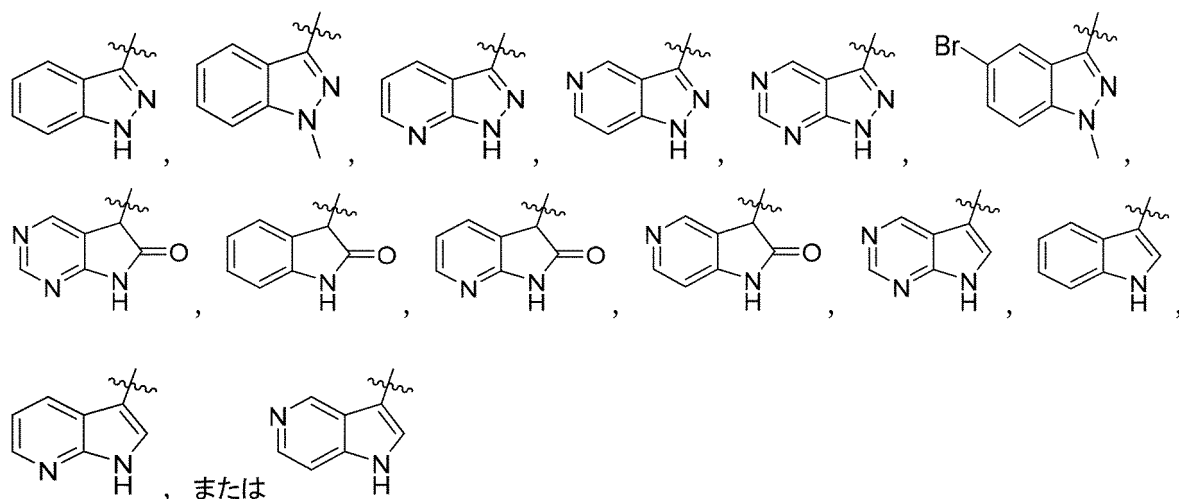
$m_1$  及び  $v_1$  が独立して、1または2である、請求項1に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項3】

前記化合物が、式(I)の化合物であり、式中、

環Aが、インドリニル、インダゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾオキサゾリル、アザインドリル、プリニル、インドリル、ピラジニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、

【化7】



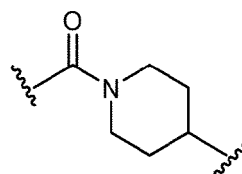
であり、

$R^1$  が独立して、ハロゲン、 $-CX^1_3$ 、 $-CHX^1_2$ 、 $-CH_2X^1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n_1}$ 、 $R^{1D}$ 、 $-SO_{v_1}NR^{1A}R^{1B}$ 、 $-ONR^{1A}R^{1B}$ 、 $-N(O)_{m_1}$ 、 $-NR^{1A}R^{1B}$ 、 $-OR^{1D}$ 、 $-OCX^1_3$ 、 $-OCHX^1_2$ 、 $-OCH_2X^1$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、または置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルであり、

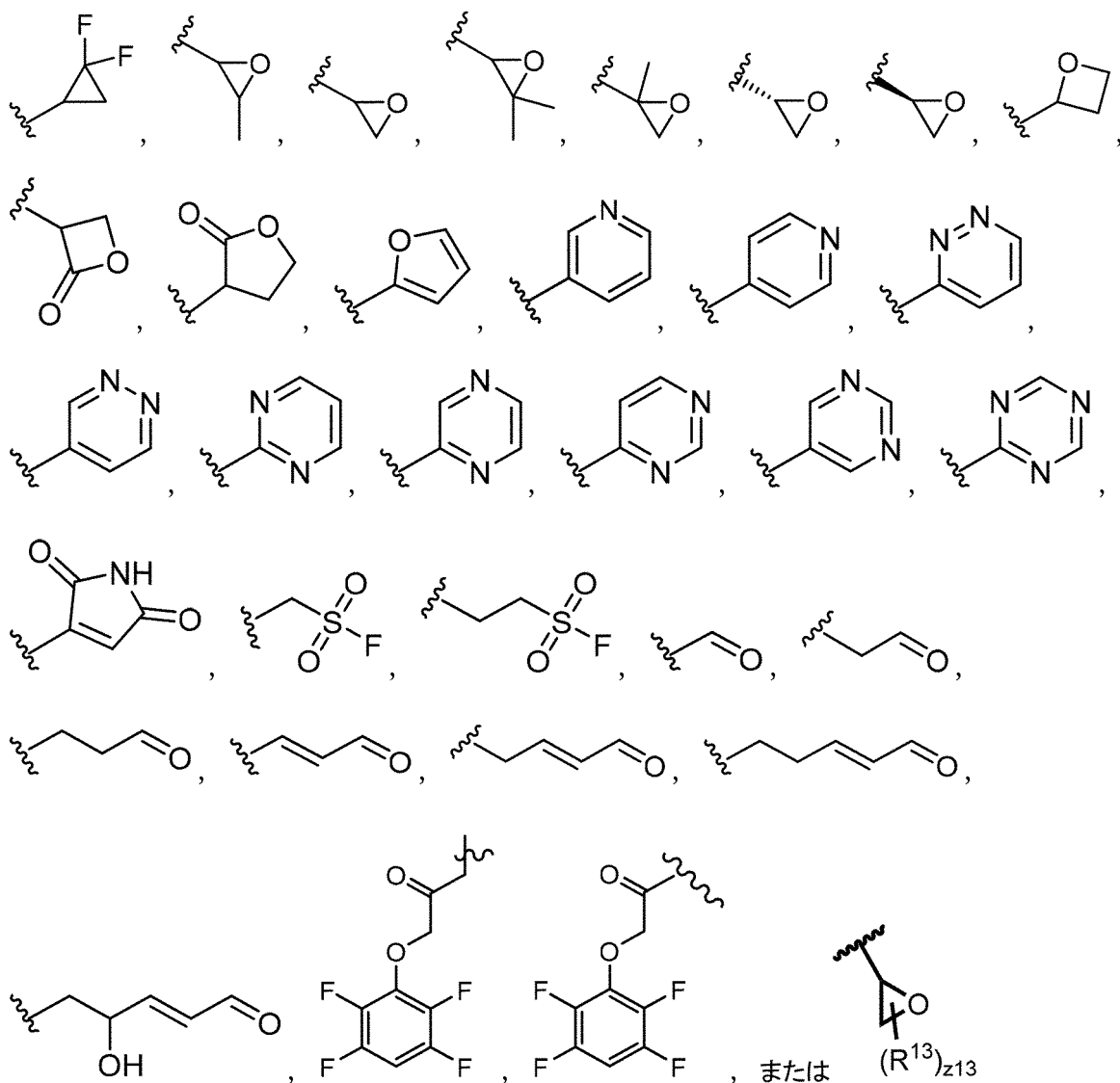
あるいは、2つの隣接した  $R^1$  置換基が任意選択で、連結して、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく、

$z_1$  が、0～4の整数であり、

L<sup>1</sup> が、結合、置換もしくは非置換アルキレン、または【化 8】



【化 9】



であり、ここで、 $R^{1-3}$  は、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキルであり、および  $z^{1-3}$  は、0 ~ 3 の整数であり、

各  $R^{1A}$ 、 $R^{1B}$ 、 $R^{1C}$ 、及び  $R^{1D}$  が独立して、水素、 $-CX_3$ 、 $-CHX_2$ 、 $-CH_2X$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

各  $X$ 、 $X^1$ 、及び  $X^2$  が独立して、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、または  $-I$  であり、

$n_1$  が独立して、0～4の整数であり、

$m_1$  及び  $v_1$  が独立して、1または2である、請求項1に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項4】

環Aが、フェニルであり、

$R^1$  が独立して、ハロゲン、 $-CX^1_3$ 、 $-CHX^1_2$ 、 $-CH_2X^1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n_1}R^{1D}$ 、 $-SO_{v_1}NR^{1A}R^{1B}$ 、 $-NHN R^{1A}R^{1B}$ 、 $-ONR^{1A}R^{1B}$ 、 $-NHC=(O)NHN R^{1A}R^{1B}$ 、 $-NHC(O)NR^{1A}R^{1B}$ 、 $-N(O)_m$ 、 $-NR^{1A}R^{1B}$ 、 $-C(O)R^{1C}$ 、 $-C(O)-OR^{1C}$ 、 $-C(O)NR^{1A}R^{1B}$ 、 $-OR^{1D}$ 、 $-NR^{1A}SO_2R^{1D}$ 、 $-NR^{1A}C(O)R^{1C}$ 、 $-NR^{1A}C(O)OR^{1C}$ 、 $-NR^{1A}OR^{1C}$ 、 $-OCX^1_3$ 、 $-OCHX^1_2$ 、 $-OCH_2X^1$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換ヘテロアルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、または置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルであり、

あるいは、2つの隣接した  $R^1$  置換基が任意選択で、連結して、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく、

$z_1$  が、0～4の整数であり、

$R^2$  が独立して、水素、 $-CX^2_3$ 、 $-CHX^2_2$ 、 $-CH_2X^2$ 、 $-C(O)R^{2A}$ 、 $-C(O)OR^{2A}$ 、 $-C(O)NR^{2A}R^{2B}$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換ヘテロアルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

$L^1$  が、結合、置換もしくは非置換アルキレン、または置換もしくは非置換シクロアルキレンであり、

$L^2$  が、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)NH-$ 、または  $-C(O)NHCH_2-$  であり、

$L^3$  が、結合、 $-S(O)_2-$ 、 $-N(R^3)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)N(R^3)-$ 、 $-N(R^3)C(O)-$ 、 $-N(R^3)C(O)NH-$ 、 $-NHC(O)N(R^3)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-OC(O)-$ 、置換もしくは非置換アルキレン、置換もしくは非置換ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換シクロアルキレン、置換もしくは非置換アリーレン、または置換もしくは非置換ヘテロアリーレンであり、

$R^3$  が独立して、水素、 $-CX^3_3$ 、 $-CHX^3_2$ 、 $-CH_2X^3$ 、 $-C(O)R^{3A}$ 、 $-C(O)OR^{3A}$ 、 $-C(O)NR^{3A}R^{3B}$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換ヘテロアルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

$L^4$  が、結合、 $-S(O)_2-$ 、 $-N(R^4)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)N(R^4)-$ 、 $-N(R^4)C(O)-$ 、 $-N(R^4)C(O)NH-$ 、 $-NHC(O)N(R^4)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-OC(O)-$ 、置換もしくは非置換アルキレン、置換もしくは非置換ヘテロアルキレン、置換もしくは非置換シクロアルキレン、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキレン、置換もしくは非置換アリーレン、または置換もしくは非置換ヘテロアリーレンであり、

$R^4$  が独立して、水素、 $-CX^4_3$ 、 $-CHX^4_2$ 、 $-CH_2X^4$ 、 $-C(O)R^{4A}$ 、 $-C(O)OR^{4A}$ 、 $-C(O)NR^{4A}R^{4B}$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換ヘテロアルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテ



ロアリアルであり、

各  $R^{1A}$ 、 $R^{1B}$ 、 $R^{1C}$ 、及び  $R^{1D}$  が独立して、水素、 $-CX_3$ 、 $-CHX_2$ 、 $-CH_2X$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

同じ窒素原子に結合した  $R^{1A}$  及び  $R^{1B}$  置換基が任意選択で、連結して、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく、

同じ窒素原子に結合した  $R^{2A}$  及び  $R^{2B}$  置換基が任意選択で、連結して、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく、

同じ窒素原子に結合した  $R^{3A}$  及び  $R^{3B}$  置換基が任意選択で、連結して、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく、

同じ窒素原子に結合した  $R^{4A}$  及び  $R^{4B}$  置換基が任意選択で、連結して、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルまたは置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく、

各  $X$ 、 $X^1$ 、及び  $X^2$  が独立して、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、または  $-I$  であり、

$n_1$  が独立して、 $0 \sim 4$  の整数であり、

$m_1$  及び  $v_1$  が独立して、 $1$  または  $2$  である、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 5】

環 A が、フェニルであり、

$R^1$  が独立して、ハロゲン、 $-CX^1_3$ 、 $-CHX^1_2$ 、 $-CH_2X^1$ 、 $-CN$ 、 $-SO_{n_1}R^{1D}$ 、 $-SO_{v_1}NR^{1A}R^{1B}$ 、 $-ONR^{1A}R^{1B}$ 、 $-N(O)_{m_1}$ 、 $-NR^{1A}R^{1B}$ 、 $-OR^{1D}$ 、 $-OCX^1_3$ 、 $-OCHX^1_2$ 、 $-OCH_2X^1$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、または置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルであり、

$z_1$  が、 $0 \sim 4$  の整数であり、

$R^2$  が独立して、水素、 $-CX^2_3$ 、 $-CHX^2_2$ 、 $-CH_2X^2$ 、または置換もしくは非置換アルキルであり、

$L^1$  が、結合、または置換もしくは非置換アルキレンであり、

$L^2$  が、 $-S(O)_2-$ 、 $-C(O)NH-$ 、または  $-C(O)NHCH_2-$  であり、

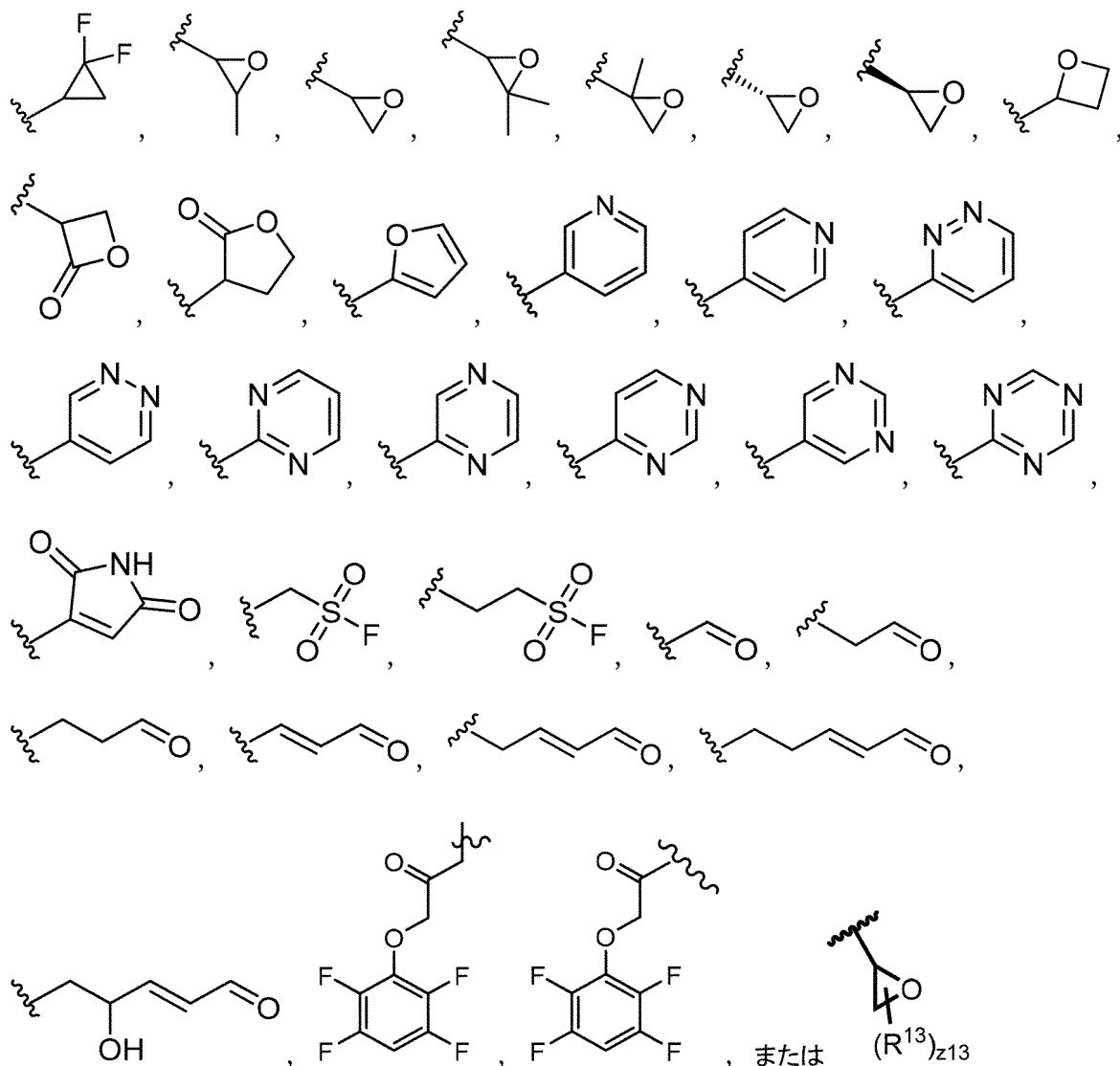
$L^3$  が、結合または置換もしくは非置換アルキレンであり、

$L^4$  が、結合、 $-O-$ 、 $-N(R^4)-$ 、または  $-C(O)-$  であり、

$R^4$  が、水素または置換もしくは非置換アルキルであり、

$R^5$  が独立して、

## 【化 10】



であり、ここで、 $R^{1-3}$ は、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキルであり、および $z_{1-3}$ は、0～3の整数であり、

各 $R^{1A}$ 、 $R^{1B}$ 、 $R^{1C}$ 、及び $R^{1D}$ が独立して、水素、 $-CX_3$ 、 $-CHX_2$ 、 $-CH_2X$ 、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

各 $X$ 、 $X^1$ 、及び $X^2$ が独立して、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、または $-I$ であり、

$n_1$ が独立して、0～4の整数であり、

$m_1$ 及び $v_1$ が独立して、1または2である、請求項1に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

## 【請求項6】

$L^1$ が非置換アルキレンである、請求項1に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

## 【請求項7】

$L^1$ が、シクロアルキルで置換されたアルキレンである、請求項1に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

## 【請求項8】

$L^1$ が結合である、請求項1に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 9】

$L^2$  が  $-S(O)_2-$  または  $-C(O)NHCH_2-$  である、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 10】

各  $R^1$  が独立して、ハロゲン、 $-OR^{1D}$ 、 $-NR^{1A}R^{1B}$ 、 $-CN$ 、または置換もしくは非置換アルキルであり、式中、各  $R^{1A}$ 、 $R^{1B}$ 、及び  $R^{1D}$  が独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換シクロアルキル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールである、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

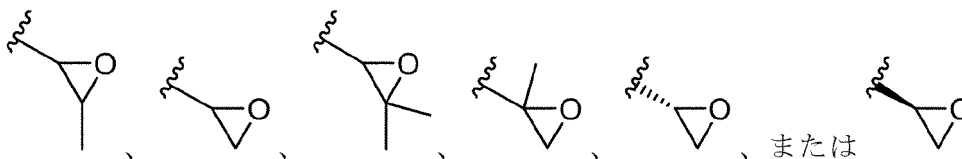
## 【請求項 11】

各  $R^1$  が独立して、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-CX^1_3$ 、 $-CHX^1_2$ 、 $-CH_2X^1$ 、 $-OCX^1_3$ 、 $-OCHX^1_2$ 、 $-OCH_2X^1$ 、 $-OR^{1D}$ 、または  $-NR^{1A}R^{1B}$  であり、式中、各  $R^{1A}$ 、 $R^{1B}$ 、及び  $R^{1D}$  が独立して、水素、置換もしくは非置換アルキル、または置換もしくは非置換アリールである、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 12】

$R^5$  が、

## 【化 11】



である、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 13】

環 A がインドリルである、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 14】

$L^3$  が、置換もしくは非置換  $C_1 \sim C_8$  アルキレンである、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

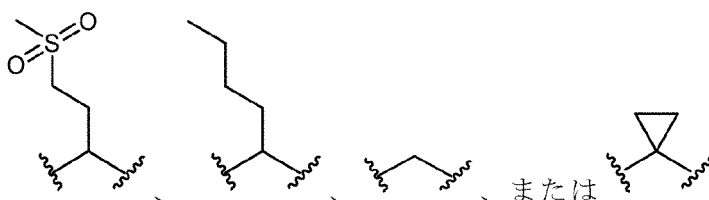
## 【請求項 15】

$L^3$  が非置換メチレンである、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 16】

$L^3$  が、

## 【化 12】

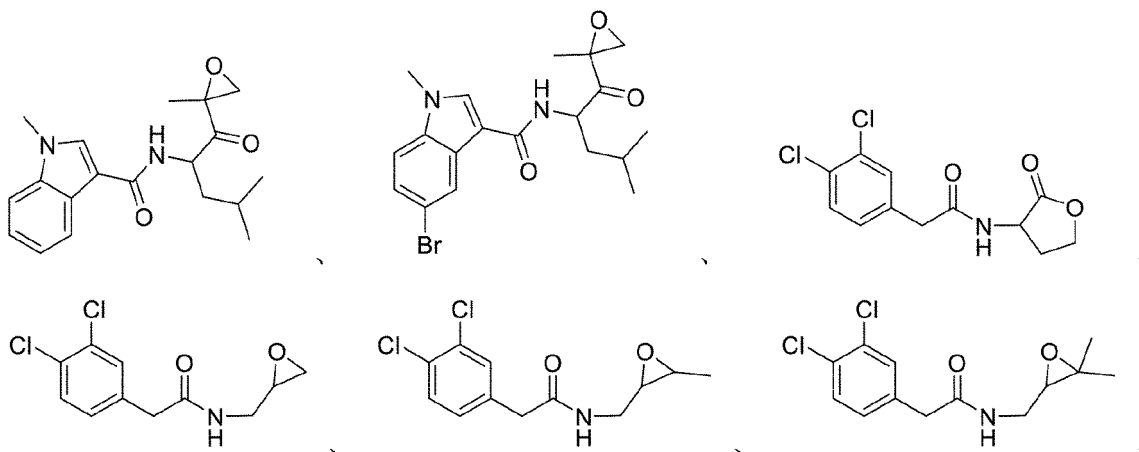


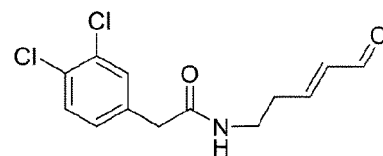
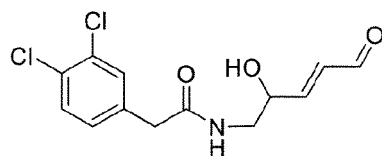
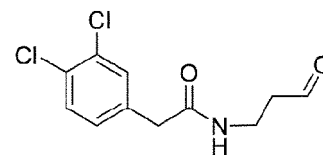
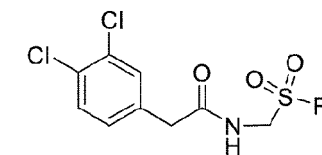
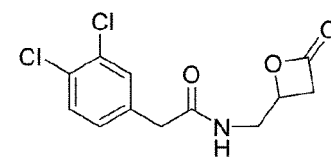
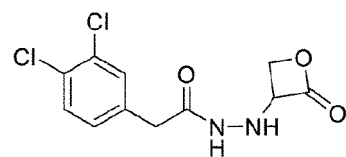
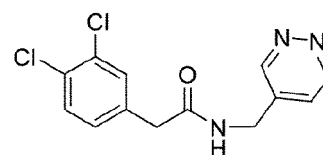
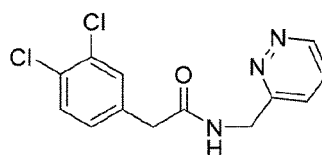
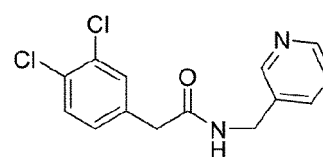
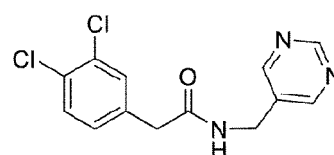
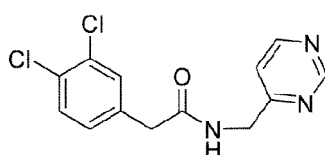
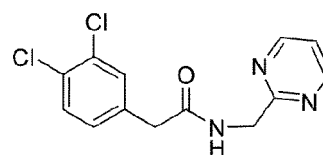
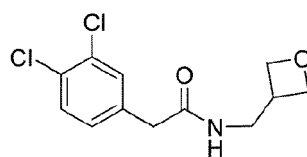
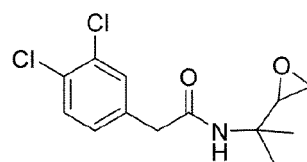
である、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

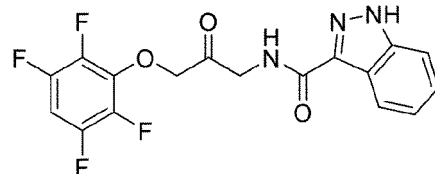
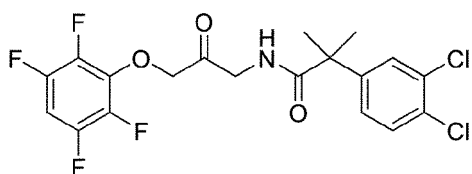
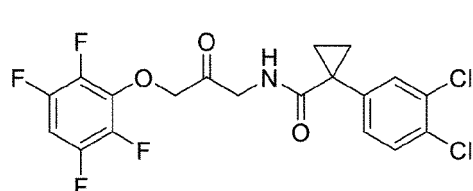
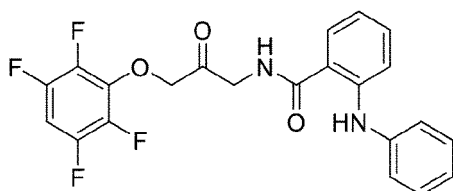
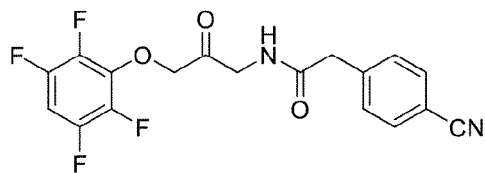
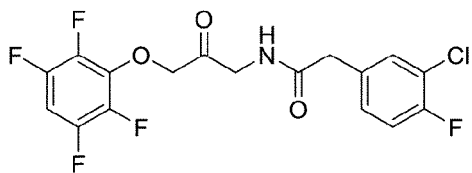
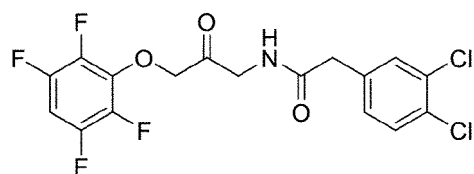
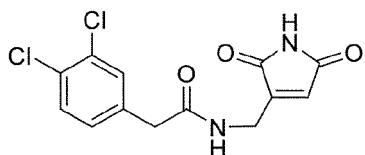
## 【請求項 17】

前記化合物が、

## 【化 1 3】







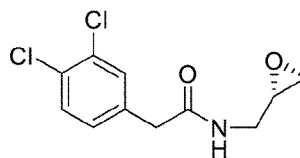
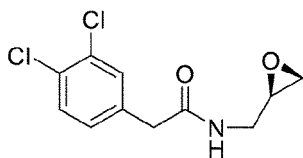
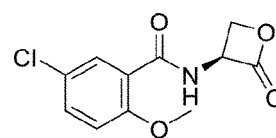
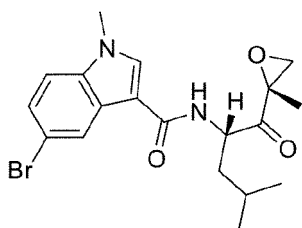
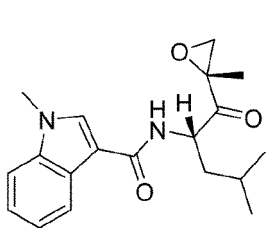
、もしくは

、またはこれらのうちのいずれかの薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 18】

前記化合物が、

【化 14】



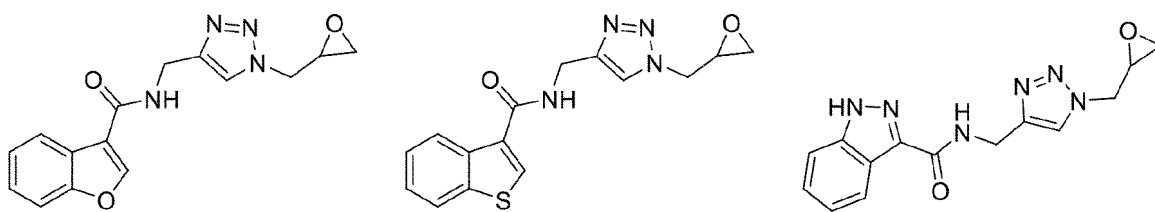
、もしくは

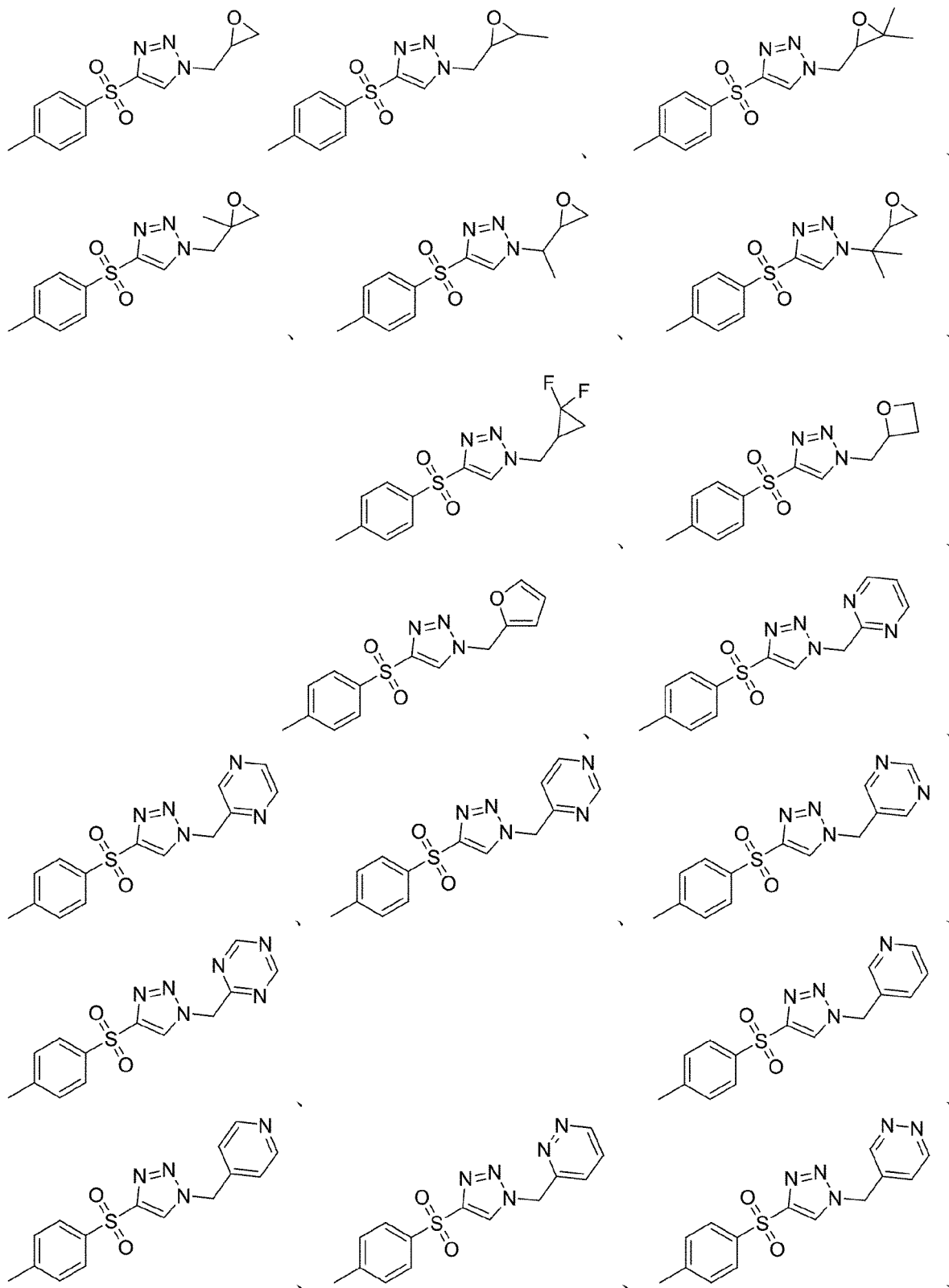
、またはこれらのうちのいずれかの薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 19】

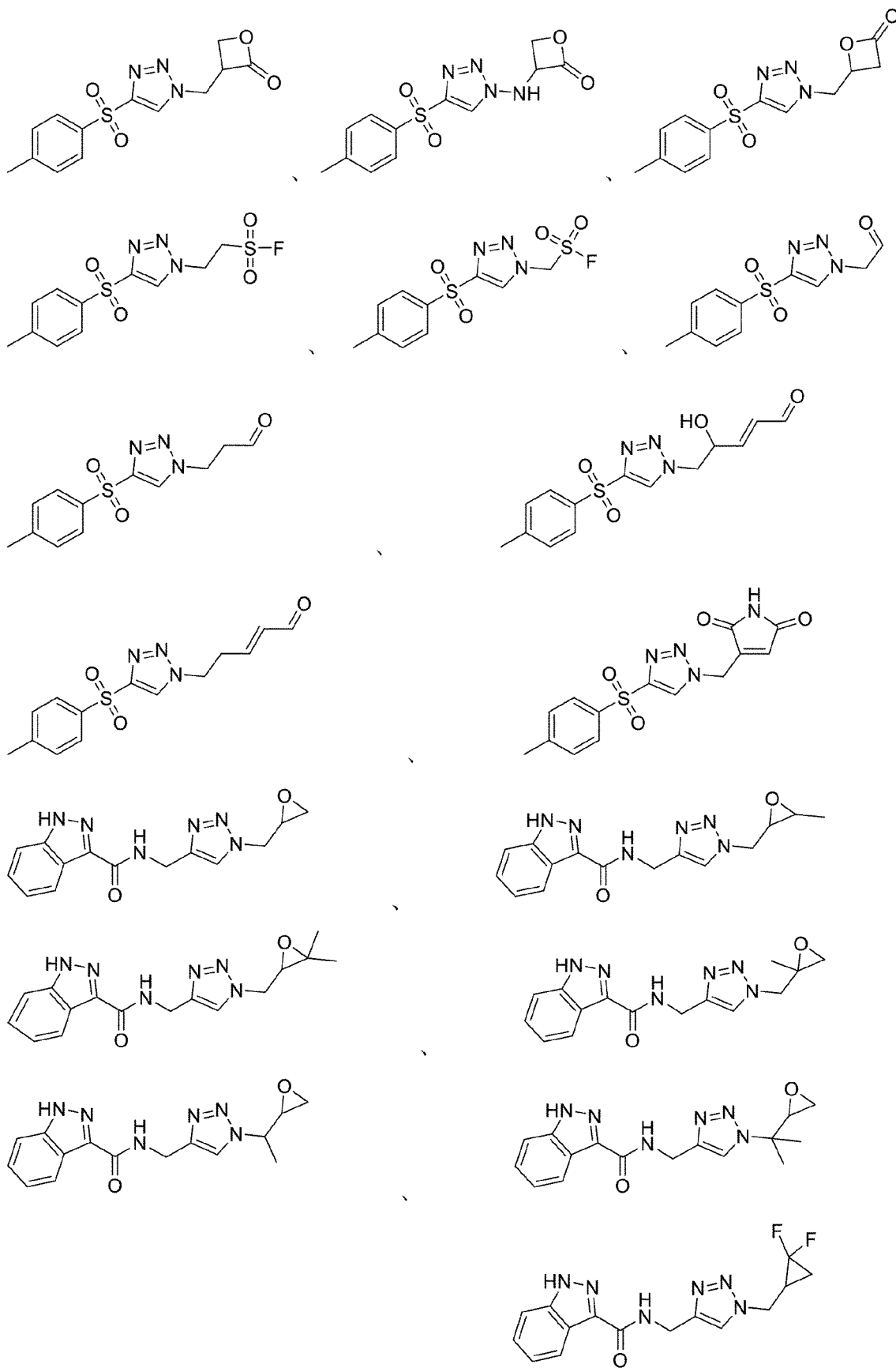
前記化合物が、

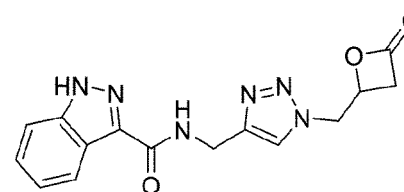
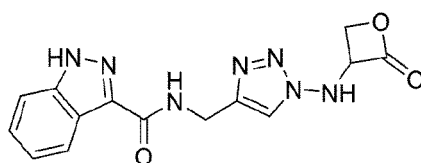
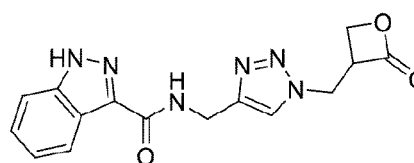
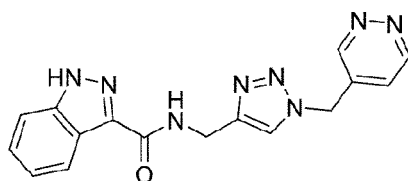
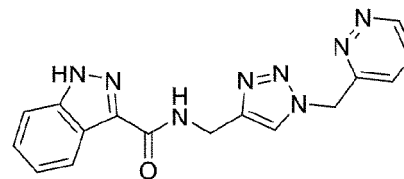
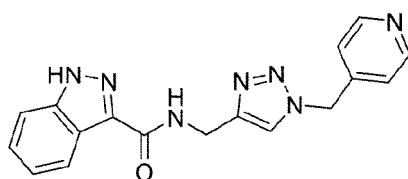
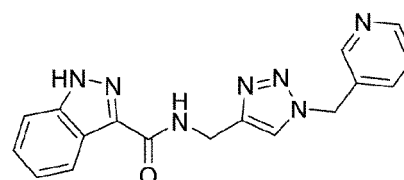
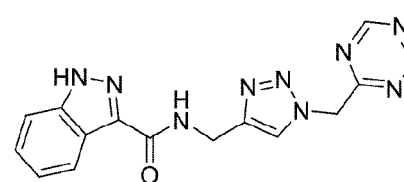
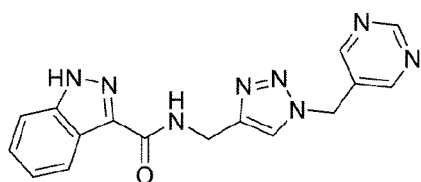
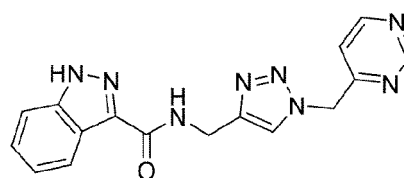
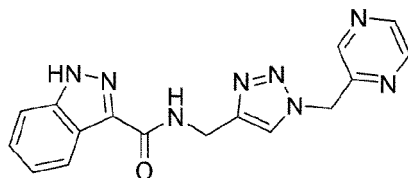
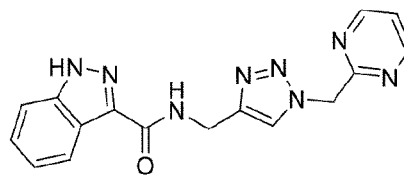
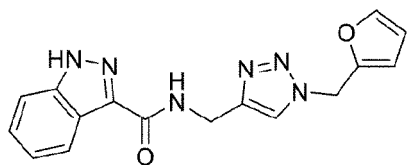
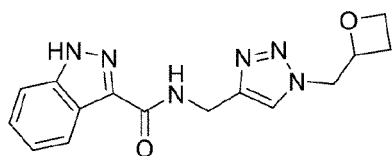
【化 1 5】

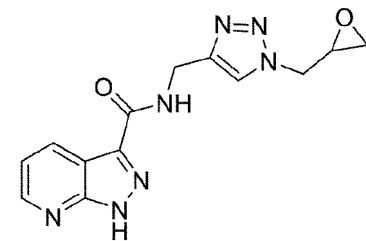
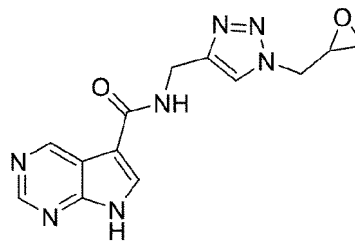
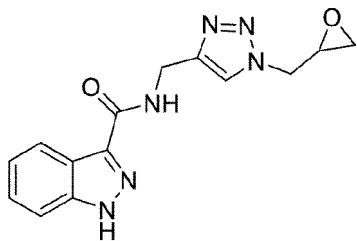
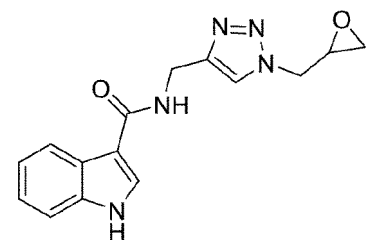
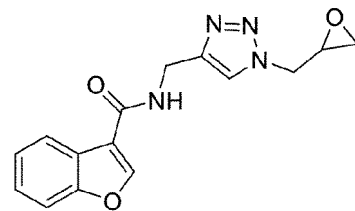
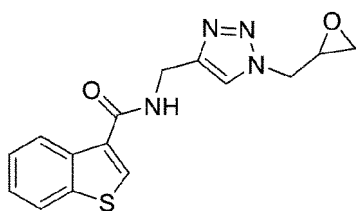
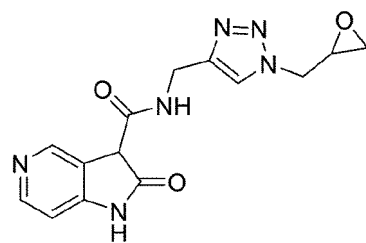
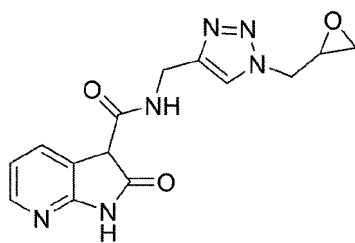
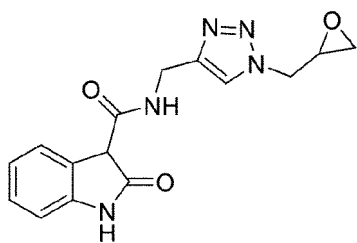
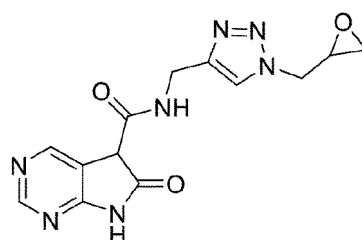
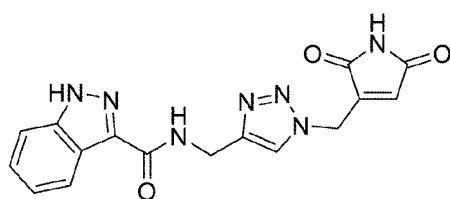
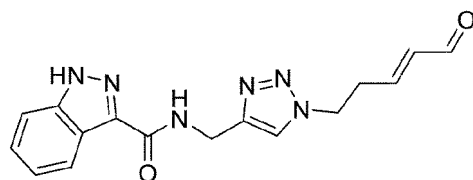
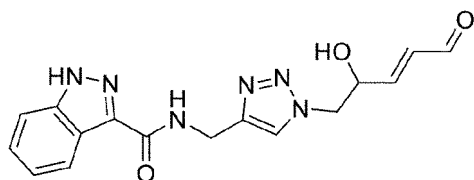
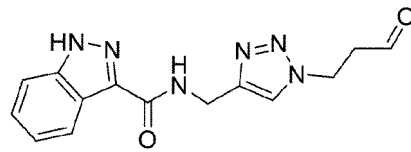
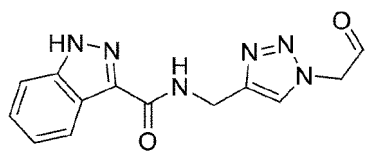
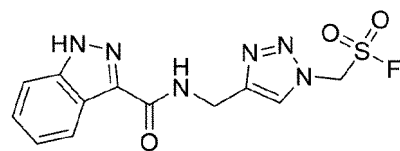
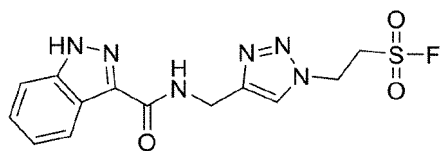








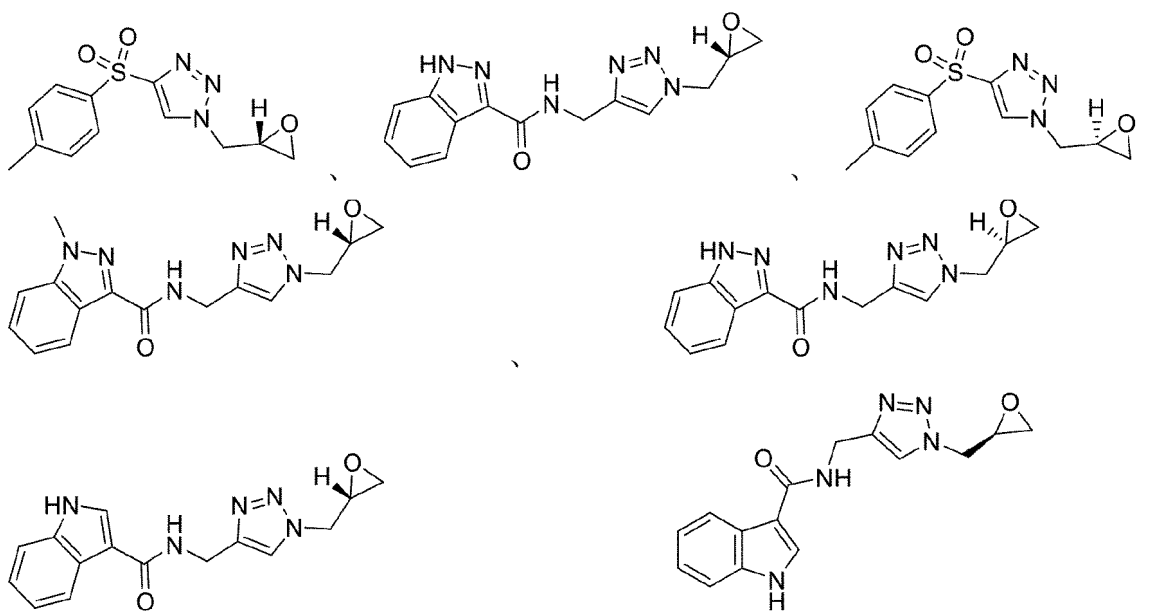


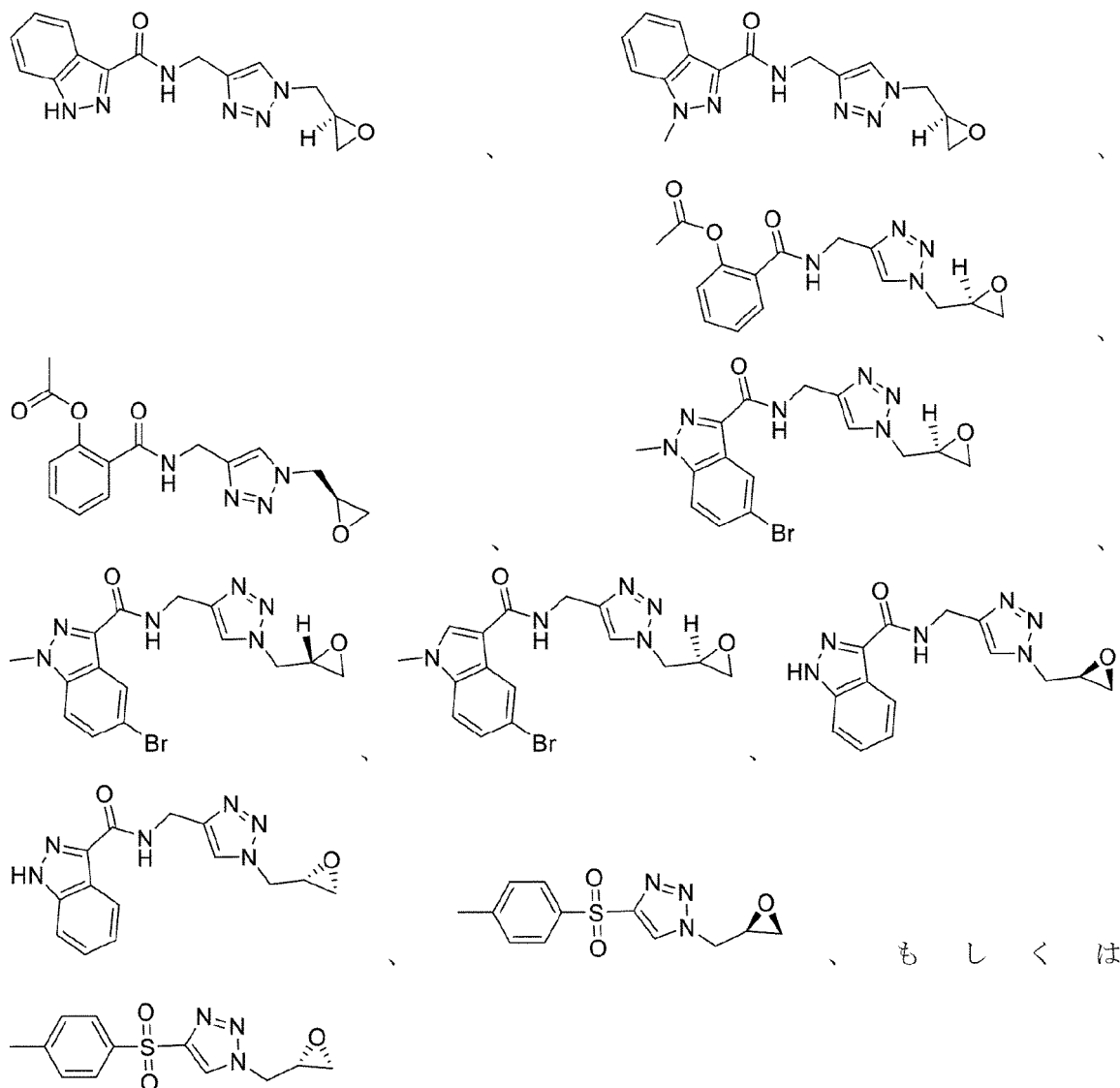




【請求項 20】

【化 1 6】





、 も し く は

、またはこれらのうちのいずれかの薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 1】

請求項 1 ～ 2 0 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される賦形剤とを含む薬学的組成物。

【請求項 2 2】

K - R a s タンパク質のレベルを低減するための、請求項 1 ～ 2 0 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩を含む、医薬組成物。

【請求項 2 3】

K - R a s タンパク質の活性レベルを低減するための、請求項 1 ～ 2 0 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩を含む、医薬組成物。

【請求項 2 4】

前記 K - R a s タンパク質が、ヒト K - R a s 4 A またはヒト K - R a s 4 B である、請求項 2 2 または 2 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

障害を治療するための、請求項 1 ～ 2 0 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩を含む、医薬組成物。

【請求項 2 6】

前記障害ががんである、請求項 2 5 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 27】

前記がんが、膵臓がん、肺がん、結腸直腸がん、視経路グリオーマ、横紋筋肉腫、神経芽細胞腫、若年性骨髄単球性白血病、悪性末梢神経鞘腫瘍、消化管間質腫瘍、ソマトスタチン産生腫瘍、褐色細胞腫、または乳がんである、請求項 26 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 28】

前記障害が、神経線維腫症 1 型、ヌーナン症候群、心臓・顔・皮膚症候群、またはレジウス症候群である、請求項 25 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 29】

前記障害が、K - R a s の変異に関連する、請求項 25 に記載の医薬組成物。