

【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 7 年 3 月 18 日(2025.3.18)

【公開番号】特開 2024-146897(P2024-146897A)

【公開日】令和 6 年 10 月 15 日(2024.10.15)

【年通号数】公開公報(特許)2024-192

【出願番号】特願 2024-55240(P2024-55240)

【国際特許分類】

C 07 D 519/00(2006.01)

10

A 61 P 35/00(2006.01)

A 61 K 31/5377(2006.01)

A 61 K 31/496(2006.01)

A 61 K 31/519(2006.01)

A 61 P 43/00(2006.01)

A 61 K 45/00(2006.01)

A 61 K 31/5386(2006.01)

A 61 K 31/553(2006.01)

A 61 K 31/5383(2006.01)

C 07 D 491/048(2006.01)

20

A 61 K 31/551(2006.01)

【F I】

C 07 D 519/00 3 0 1

A 61 P 35/00

A 61 K 31/5377

C 07 D 519/00 3 1 1

A 61 K 31/496

A 61 K 31/519

A 61 P 43/00 1 2 1

A 61 K 45/00 1 0 1

A 61 K 31/5386

C 07 D 519/00 C S P

A 61 K 31/553

A 61 K 31/5383

C 07 D 491/048

A 61 K 31/551

30

【手続補正書】

【提出日】令和 7 年 3 月 10 日(2025.3.10)

【手続補正 1】

40

【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

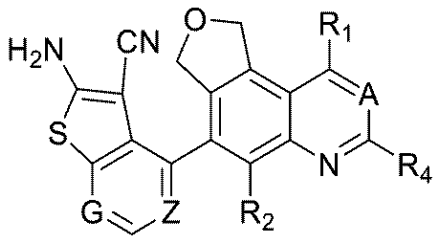
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

以下の式：

【化 1】



で示される化合物であって、

式中、

A が、 $-C(H)-$ 又は $-N-$ であり、

Z が、 $-C(R_{3c})-$ 又は $-N-$ であり、

G が、 $-C(R_{3b})-$ 又は $-N-$ であり、

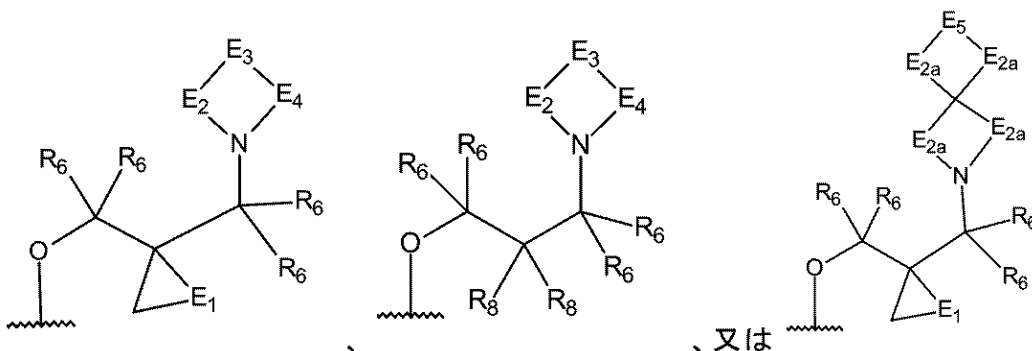
R_1 が、H であり、

R_2 が、H、ハロゲン、又はメチルであり、

R_{3b} 、及び R_{3c} が各々独立して、H、ハロゲン、又はメチルであり、

R_4 が、N 結合型環状アミン又は以下の式：

【化 2】



の基であり、

前記 N 結合型環状アミンが、N 結合型の、

i . R_{4a} 及び R_{4b} で置換されたアゼチジン、

ii . ピロリジン、ピペリジン、ピペラジン、モルホリン、ジアゼパン、イミダゾール、若しくはピラゾールであって、これらの各々が、 C_{1-3} アルキレンによって任意選択的に架橋され、これらの各々が、1つ以上のハロゲン、ヒドロキシル、 $-NR_{6a}R_{6a}$ 、(1-メチルピペリジン-4-イル)オキシ、任意選択的に $-NR_{6a}R_{6a}$ で置換された C_{1-3} アルコキシ、任意選択的に1つ以上のハロゲン、 $-NR_{6a}R_{6a}$ 、若しくはヒドロキシルで置換された C_{1-3} アルキル、任意選択的にメチルで置換されたイミダゾール、アゼチジン、ピペリジン、ピペラジン、モルホリン、オキサゼパン、若しくはジアゼパンから選択される単環式環、ヘキサヒドロ-1H-フロ[3,4-c]ピロール、オクタヒドロピロロ[3,4-c]ピロール、若しくはオクタヒドロピロロ[1,2-a]ピラジンから選択される二環、又は4,7-ジアザスピロ[2.5]オクタン、2-オキサ-7-アザスピロ[3.5]ノナン、2,6-ジアザスピロ[3.4]オクタン、若しくは2-アザスピロ[3.3]ヘプタンから選択されるスピロ環で任意選択的に置換され、前記単環式環が、 C_{1-3} アルキレンによって任意選択的に架橋され、1つ以上のハロゲン、ヒドロキシル、 $-CN$ 、 C_{1-3} アルコキシ、 $-NR_{10}R_{10}$ 、シクロプロピル、オキセタン、 $-CO-C_{1-3}$ アルキル、又はヒドロキシル、 C_{1-3} アルコキシ、 $-NR_{10}R_{10}$ 、ハロゲン、若しくは $-CF_3$ で任意選択的に置換された C_{1-3} アルキルで任意選択的に置換され得るもの、又は

iii . 2,6-ジアザビシクロ[3.2.0]ヘプタン、3,6-ジアザビシクロ[3.2.0]ヘプタン、3,6-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン、2,6-ジア

ザビシクロ[3.2.1]オクタン、3-アザビシクロ[3.1.0]ヘキサン、3-ア
 ザビシクロ[3.2.0]ヘプタン、2-アザビシクロ[3.2.0]ヘプタン、オクタ
 ヒドロ-1H-ピロロ[3,4-b]ピリジン、オクタヒドロ-1H-ピロロ[3,2-
 b]ピリジン、オクタヒドロ-6H-ピロロ[3,4-b]ピラジン、オクタヒドロピロ
 ロ[1,2-a]ピラジン、オクタヒドロピロロ[3,2-b]ピロール、オクタヒドロ
 ピロロ[3,4-b][1,4]オキサジン、オクタヒドロピロロ[3,4-b]ピロー
 ル、オクタヒドロピロロ[3,4-c]ピロール、テトラヒドロフロ[3,4-d]オキ
 サゾール-2(3H)-オン、ヘキサヒドロ-1H-フロ[3,4-b]ピロール、オク
 タヒドロ-1H-ピロロ[3,2-b]ピリジン、(3as,6as)-テトラヒドロ-
 1H,4H-3a,6a-(メタノオキシメタノ)ピロロ[3,4-c]ピロール、(R
)-1,7-ジアザスピロ[4.4]ノナン、(S)-1,7-ジアザスピロ[4.4]
 ノナン、1,6-ジアザスピロ[3.3]ヘプタン、1,6-ジアザスピロ[3.4]オク
 タン、2,5-ジアザスピロ[3.4]オクタン、2,5-ジアザスピロ[3.5]ノ
 ナン、2,6-ジアザスピロ[3.3]ヘプタン、2,6-ジアザスピロ[3.4]オク
 タン、2-アザスピロ[3.3]ヘプタン、4-アザスピロ[2.4]ヘプタン、5-ア
 ザスピロ[2.4]ヘプタンe、2-オキサ-6-アザスピロ[3.4]オクタン、2,
 7-ジアザスピロ[4.4]ノナン、2-オキサ-6-アザスピロ[3.4]オクタン、
 若しくは1-オキサ-7-アザスピロ[4.4]ノナンであって、これらの各々が、1つ
 以上のハロゲン、-NR_{6a}R_{6a}、又は-NR_{6a}R_{6a}若しくはヒドロキシルで任意選
 択的に置換されたC₁~₃アルキルで任意選択的に置換されているものであり、

R_{4a}が、NR_{4c}R_{4d}、シクロプロピル、アゼチジン、ピロリジン、ピペリジン、
 ピペラジン、モルホリン又はイミダゾールであり、前記シクロプロピル、アゼチジン、ピ
 ロリジン、ピペリジン、ピペラジン、又はモルホリンが、ハロゲン、ヒドロキシル、C₁
 ~₃アルコキシ、又は-NR_{6a}R_{6a}で任意選択的に置換され、

R_{4b}が、H、ヒドロキシル、又はC₁~₃アルキルであり、

R_{4c}が、独立して、シクロプロピル、又はオキセタンであり、

R_{4d}が、独立して、C₁~₃アルキルであり、

各R₆が、独立して、H又は重水素であり、

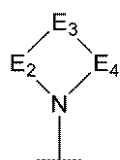
各R_{6a}が、独立して、H、トリジユウテロメチル、C₃~₅シクロアルキル、N-メ
 チルピロリジン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、ビシクロ[1.1.1]ペン
 タン-1-イル、ビシクロ[1.1.1]ペンタン-1-オール、又は1つ以上の重水
 素、ヒドロキシル、メチル、メトキシ、ハロゲン、シクロプロピル、オキセタン、テトラ
 ヒドロフラン、テトラヒドロピラン、-CO-NHMe、若しくは-CO-NH₂で任意
 選択的に置換されたC₁~₃アルキルであり、前記C₃~₅シクロアルキルが、1つ以上
 のヒドロキシル若しくはメチルで任意選択的に置換され、

E₁が、-O-C₁~₃アルキレン、又は1つ以上のハロゲンで任意選択的に置換され
 たC₁~₃アルキレンであり、

E₂、及びE₄が、各々独立して、1つ以上のヒドロキシル、C₁~₃アルコキシ若し
 くはハロゲンで任意選択的に置換されたC₁~₃アルキレンであり、E₂及びE₄が、結
 合若しくはC₁~₃アルキレンによって任意選択的に架橋されることができ、E₃が、-
 O-、-CR₇R₇-、-NR₉-、若しくは、-CO-NR_{6a}-であるか、又は

前記環

【化3】



が、ヘキサヒドロ-1H-フロ[3,4-c]ピロールであり、

各E_{2a}が、独立して、1つ以上のヒドロキシルで任意選択的に置換されたC₁~₃ア

ルキレンであり、

E_5 が、 $-O-$ 、 $-CR_7R_7-$ 、又は $-NR_9-$ であり、

各 R_7 が、独立して、 H 、ハロゲン、 CN 、ヒドロキシル、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、又は 1 つ以上のハロゲン若しくはヒドロキシルで任意選択的に置換された $C_1 \sim 3$ アルキルであり、

各 R_8 が、独立して、 $C_1 \sim 3$ アルキルであり、

R_9 が、各々独立して、 H 、任意選択的に置換された $C_1 \sim 3$ アルキル又は $-CO-C_1 \sim 3$ アルキルであり、前記任意選択的に置換された $C_1 \sim 3$ アルキルが、1 つ以上のハロゲンで任意選択的に置換され、

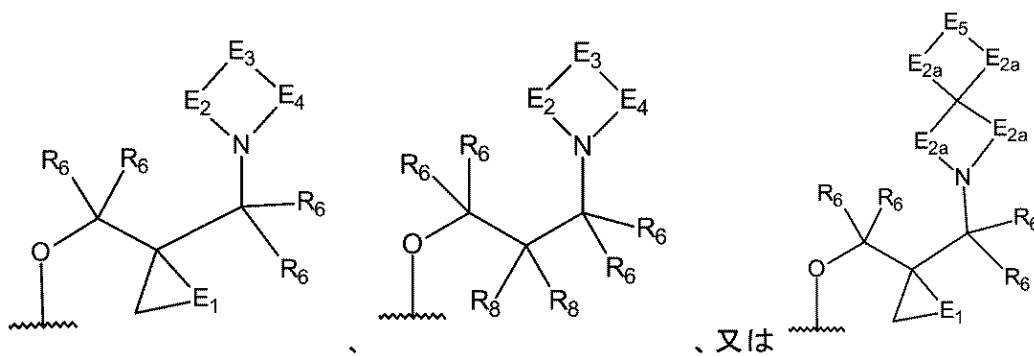
R_{10} が、 H 、若しくは 1 つ以上の重水素で任意選択的に置換された $C_1 \sim 3$ アルキルである、化合物、又はその薬学的に許容される塩。

10

【請求項 2】

R_4 が、 N 結合型環状アミン又は以下の式：

【化 4】



20

の基であり、

前記 N 結合型環状アミンが、 N 結合型の、

i . R_{4a} 及び R_{4b} で置換されたアゼチジン、

ii . ピロリジン、ピペリジン、ピペラジン、モルホリン、イミダゾール若しくはピラゾールであって、これらの各々が、 $C_1 \sim 3$ アルキレンによって任意選択的に架橋され、これらの各々が、1 つ以上のハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、 $-NR_{6a}$ R_{6a} 、アゼチジン、ピペラジン、モルホリン、 $C_1 \sim 3$ アルキル、若しくはメチルで任意選択的に置換されたイミダゾールで任意選択的に置換され、前記アゼチジンが、ヒドロキシル若しくは $C_1 \sim 3$ アルコキシで任意選択的に置換され、前記ピペラジンが、メチルで任意選択的に置換され、前記 $C_1 \sim 3$ アルキルが、1 つ以上のハロゲン、 $-NR_{6a}$ R_{6a} 若しくはヒドロキシルで任意選択的に置換されているもの、又は

30

iii . 2, 6 - ジアザビシクロ[3.2.0]ヘプタン、3, 6 - ジアザビシクロ[3.2.0]ヘプタン、3, 6 - ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン、2, 6 - ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン、3 - アザビシクロ[3.1.0]ヘキサン、3 - アザビシクロ[3.2.0]ヘプタン、2 - アザビシクロ[3.2.0]ヘプタン、オクタヒドロ - 1H - ピロロ[3, 4 - b]ピリジン、オクタヒドロ - 1H - ピロロ[3, 2 - b]ピリジン、オクタヒドロ - 6H - ピロロ[3, 4 - b]ピラジン、オクタヒドロピロロ[1, 2 - a]ピラジン、オクタヒドロピロロ[3, 2 - b]ピロール、オクタヒドロピロロ[3, 4 - b][1, 4]オキサジン、オクタヒドロピロロ[3, 4 - b]ピロール、オクタヒドロピロロ[3, 4 - c]ピロール、テトラヒドロフロ[3, 4 - d]オキサゾール - 2(3H) - オン、(R) - 1, 7 - ジアザスピロ[4.4]ノナン、(S) - 1, 7 - ジアザスピロ[4.4]ノナン、1, 6 - ジアザスピロ[3.3]ヘプタン、1, 6 - ジアザスピロ[3.4]オクタン、2, 5 - ジアザスピロ[3.4]オクタン、2, 5 - ジアザスピロ[3.5]ノナン、2, 6 - ジアザスピロ[3.3]ヘプタン、2, 6 - ジアザスピロ[3.4]オクタン、2 - アザスピロ[3.3]ヘプタン、4 - アザスピロ[2.4]ヘプタン、5 - アザスピロ[2.4]ヘプタン、若しくは 2 - オキサ -

40

50

6 - アザスピロ [3 . 4] オクタンであって、これらの各々が、1つ以上のハロゲン、 $-NR_{6a}R_{6a}$ 若しくは $-NR_{6a}R_{6a}$ で任意選択的に置換された $C_{1\sim 3}$ アルキルで任意選択的に置換されているものであり、

R_{4a} が、 $NR_{4c}R_{4d}$ 、シクロプロピル、アゼチジン、ピロリジン、ピペリジン、モルホリン又はイミダゾールであり、前記シクロプロピル、アゼチジン、ピロリジン、ピペリジン、又はモルホリンが、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_{1\sim 3}$ アルコキシ又は $-NR_{6a}R_{6a}$ で任意選択的に置換され、

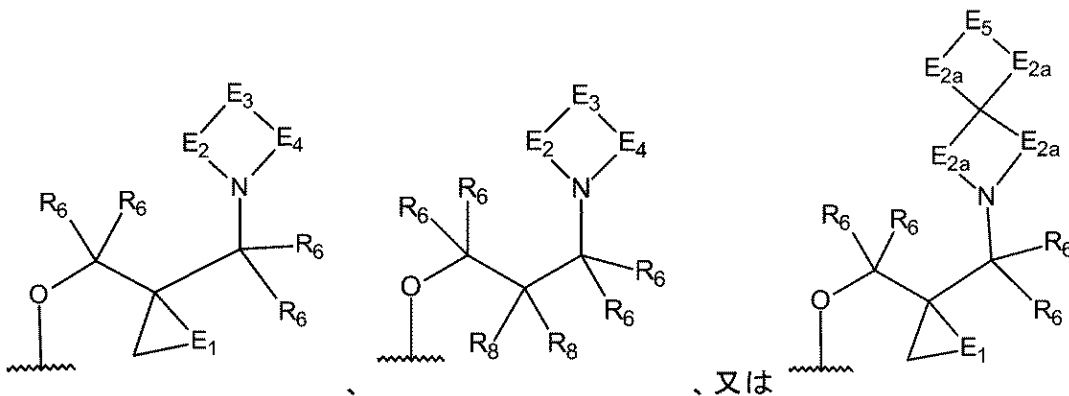
各 R_{6a} が、独立して、H、トリジェウテロメチル、 $C_{3\sim 5}$ シクロアルキル、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、ビスクロ [1 . 1 . 1] ペンタン - 1 - イル、又は1つ以上のヒドロキシル、メチル、メトキシ、ハロゲン、シクロプロピル、オキセタン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、 $-CO-NHMe$ 、若しくは $-CONH_2$ で任意選択的に置換された $C_{1\sim 3}$ アルキルであり、前記 $C_{3\sim 5}$ シクロアルキルが、1つ以上のヒドロキシル又はメチルで任意選択的に置換されている、請求項1に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

10

【請求項3】

R_4 が、N結合型環状アミン又は以下の式：

【化5】



20

の基であり、

前記N結合型環状アミンが、N結合型の、

30

i . R_{4a} 及び R_{4b} で置換されたアゼチジン、

ii . ピロリジン、ピペリジン、ピペラジン、モルホリン、イミダゾール若しくはピラゾールであって、これらの各々が、 $C_{1\sim 3}$ アルキレンによって任意選択的に架橋され、これらの各々が、1つ以上のハロゲン、ヒドロキシル、 $C_{1\sim 3}$ アルコキシ、 $-NR_{6a}R_{6a}$ 、アゼチジン、 $C_{1\sim 3}$ アルキル、若しくはメチルで任意選択的に置換されたイミダゾールで任意選択的に置換され、前記アゼチジンが、ヒドロキシル若しくは $C_{1\sim 3}$ アルコキシで任意選択的に置換され、前記 $C_{1\sim 3}$ アルキルが、ハロゲン $-NR_{6a}R_{6a}$ 若しくはヒドロキシルで任意選択的に置換されているもの、又は

iii . 2 , 6 - ジアザビスクロ [3 . 2 . 0] ヘプタン、3 , 6 - ジアザビスクロ [3 . 2 . 0] ヘプタン、3 - アザビスクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン、3 - アザビスクロ [3 . 2 . 0] ヘプタン、オクタヒドロ - 1H - ピロロ [3 , 4 - b] ピリジン、オクタヒドロ - 6 - ピロロ [3 , 4 - b] ピラジン、オクタヒドロピロロ [1 , 2 - a] ピラジン、オクタヒドロピロロ [3 , 2 - b] ピロール、オクタヒドロピロロ [3 , 4 - b] [1 , 4] オキサジン、オクタヒドロピロロ [3 , 4 - b] ピロール、オクタヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピロール、テトラヒドロフロ [3 , 4 - d] オキサゾール - 2 (3 H) - オン、(R) - 1 , 7 - ジアザスピロ [4 . 4] ノナン、(S) - 1 , 7 - ジアザスピロ [4 . 4] ノナン、1 , 6 - ジアザスピロ [3 . 3] ヘプタン、1 , 6 - ジアザスピロ [3 . 4] オクタン、2 , 5 - ジアザスピロ [3 . 4] オクタン、2 , 5 - ジアザスピロ [3 . 5] ノナン、2 , 6 - ジアザスピロ [3 . 3] ヘプタン、2 , 6 - ジアザスピロ [3 . 4] オクタン、2 - アザスピロ [3 . 3] ヘプタン、4 - アザスピロ [2 . 4] ヘプタン

40

50

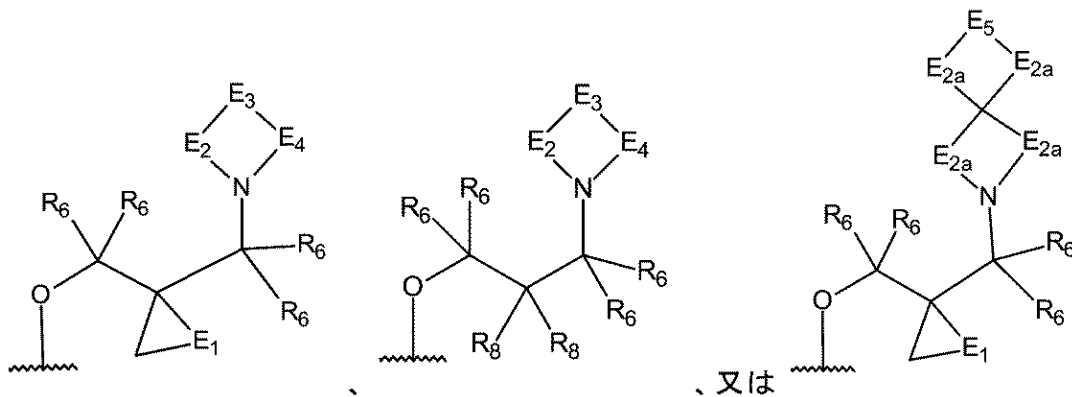
、若しくは5 - アザスピロ [2 . 4] ヘプタンであって、これらの各々が、1つ以上のハロゲン、 $-NR_{6a}R_{6a}$ 若しくは $-NR_{6a}R_{6a}$ で任意選択的に置換された $C_1 \sim 3$ アルキルで任意選択的に置換されているものであり、

R_{4a} が、 $NR_{4c}R_{4d}$ 、シクロプロピル、アゼチジン、ピロリジン、ピペリジン、モルホリン、又はイミダゾールであり、前記シクロプロピル、アゼチジン、ピロリジン、ピペリジン、又はモルホリンが、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、又は $-NR_{6a}R_{6a}$ で任意選択的に置換され、各 R_{6a} が、独立して、H、トリジユウテロメチル、 $C_3 \sim 5$ シクロアルキル、又はヒドロキシルで任意選択的に置換された $C_1 \sim 3$ アルキルである、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4】

R_{3b} 、及び R_{3c} が、各々独立して、H又はハロゲンであり、 R_4 が、N結合型環状アミン又は以下の式：

【化6】



の基であり、

前記N結合型環状アミンが、N結合型の、

i . R_{4a} 及び R_{4b} で置換されたアゼチジン、

ii . ピロリジン、ピペリジン、ピペラジン、若しくはモルホリンであって、これらの各々が、 $C_1 \sim 3$ アルキレンによって任意選択的に架橋され、これらの各々が、1つ以上のハロゲン、ヒドロキシル、 $-NR_{6a}R_{6a}$ 、イミダゾール若しくは $C_1 \sim 3$ アルキルで任意選択的に置換され、前記イミダゾールが、メチルで任意選択的に置換され、前記 $C_1 \sim 3$ アルキルが、 $-NR_{6a}R_{6a}$ 若しくはヒドロキシルで任意選択的に置換されているもの、又は

iii . オクタヒドロピロロ [1 , 2 - a] ピラジン、オクタヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピロール、1 , 6 - ジアザスピロ [3 . 3] ヘプタン、若しくは1 , 6 - ジアザスピロ [3 . 4] オクタンであって、これらの各々が、1つ以上のハロゲン、若しくは $C_1 \sim 3$ アルキルで任意選択的に置換されているもの、であり、

R_{4a} が、 $NR_{4c}R_{4d}$ 、シクロプロピル、アゼチジン、ピロリジン、モルホリンであり、前記シクロプロピル、アゼチジン、ピロリジン又はモルホリンが、ハロゲン、又は $-NR_{6a}R_{6a}$ で任意選択的に置換され、

R_{4b} が、H、又は $C_1 \sim 3$ アルキルであり、

各 R_{6a} が、独立して、H又は $C_1 \sim 3$ アルキルであり、

E_2 、及び E_4 が、各々独立して、1つ以上のヒドロキシル又はハロゲンで任意選択的に置換された $C_1 \sim 3$ アルキレンであり、 E_2 及び E_4 が、結合又は $C_1 \sim 3$ アルキレンによって任意選択的に架橋されることができ、 E_3 は、 $-O-$ 、 $-CR_7R_7-$ 、 $-NR_9-$ 、又は $-CO-NR_{6a}-$ である、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5】

R_{3b} 、及び R_{3c} が、各々独立して、H又はハロゲンであり、 R_4 が、以下の式：

10

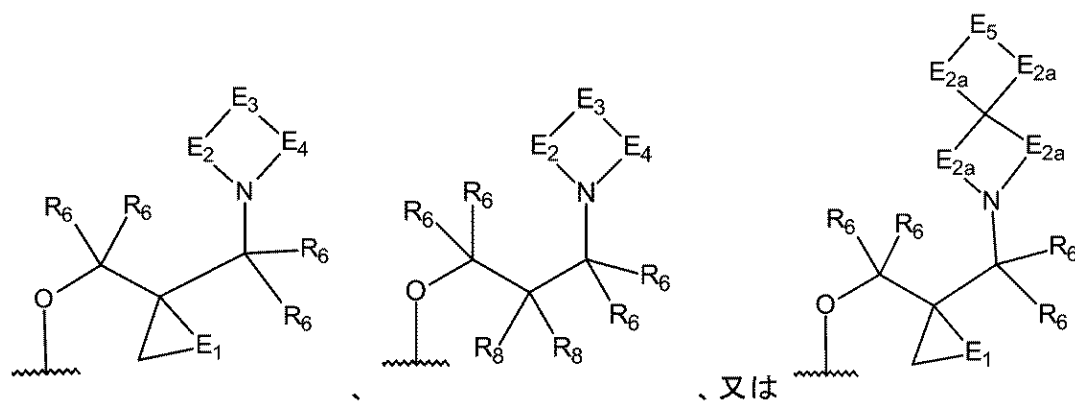
20

30

40

50

【化 7】



10

の基であり、

E₁が、1つ以上のハロゲンで任意選択的に置換されたC₁～3アルキレンであり、

E₂、及びE₄が、各々独立して、1つ以上のヒドロキシルで任意選択的に置換されたC₁～3アルキレンであり、E₂及びE₄が、結合又はC₁～3アルキレンによって任意選択的に架橋されることができ、

E₃が、-O-、-CR₇R₇-、-NR₉-、又は-CO-NR_{6a}-であり、

各R_{6a}が、独立して、H又はC₁～3アルキルであり、

各R₇が、独立して、H、ハロゲン、ヒドロキシル、C₁～3アルコキシ、又は1つ以上のハロゲン若しくはヒドロキシルで任意選択的に置換されたC₁～3アルキルであり、

R₉が、各々独立して、H、C₁～3アルキル又は-CO-C₁～3アルキルである、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。

20

【請求項6】

Gが、-N-である、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7】

Gが、-C(R_{3b})-である、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8】

R_{3b}が、Fである、請求項7に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

30

【請求項9】

Zが、-N-である、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10】

Zが、-C(R_{3c})-である、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11】

R_{3c}が、H又はFである、請求項10に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項12】

R_{3b}、及びR_{3c}が、各々独立して、H又はハロゲンである、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。

40

【請求項13】

Aが、-N-である、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14】

Aが、-C(H)-である、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15】

R₂が、F又はClである、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16】

50

R_2 が、Fである、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。

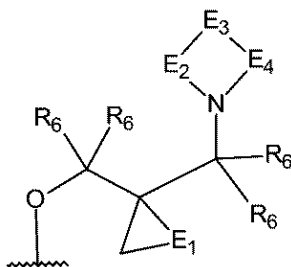
【請求項17】

R_2 が、C1である、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18】

R_4 が、

【化8】



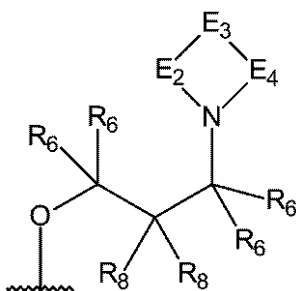
10

である、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19】

R_4 が、

【化9】



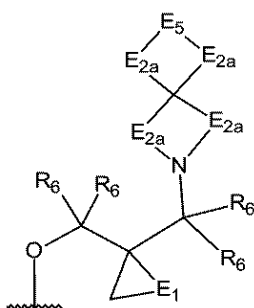
20

である、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20】

R_4 が、

【化10】



40

である、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21】

各 R_6 が、Hである、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22】

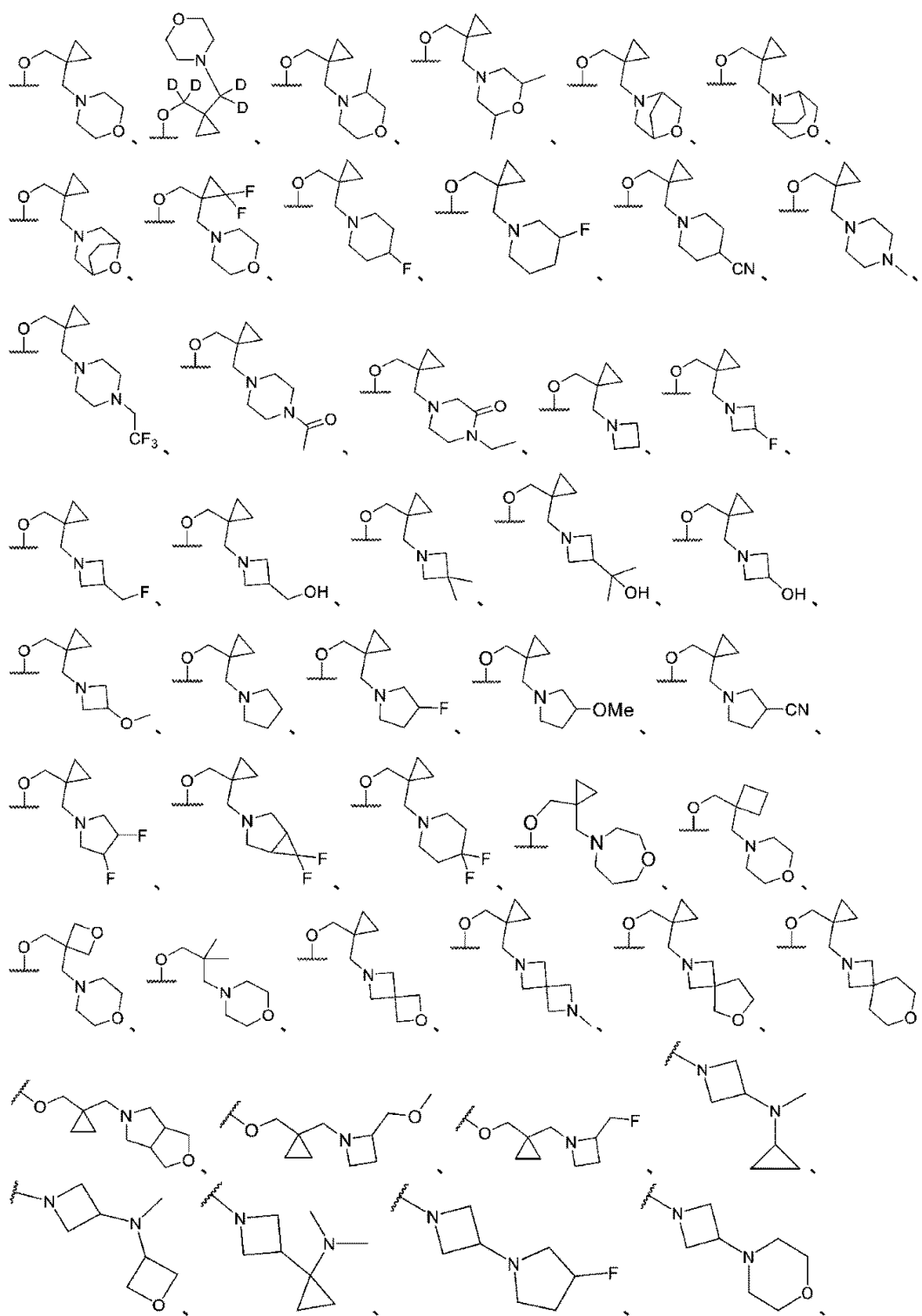
R_4 が、N結合型環状アミンである、請求項1に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項23】

R_4 が、

50

【化 1 1】



10

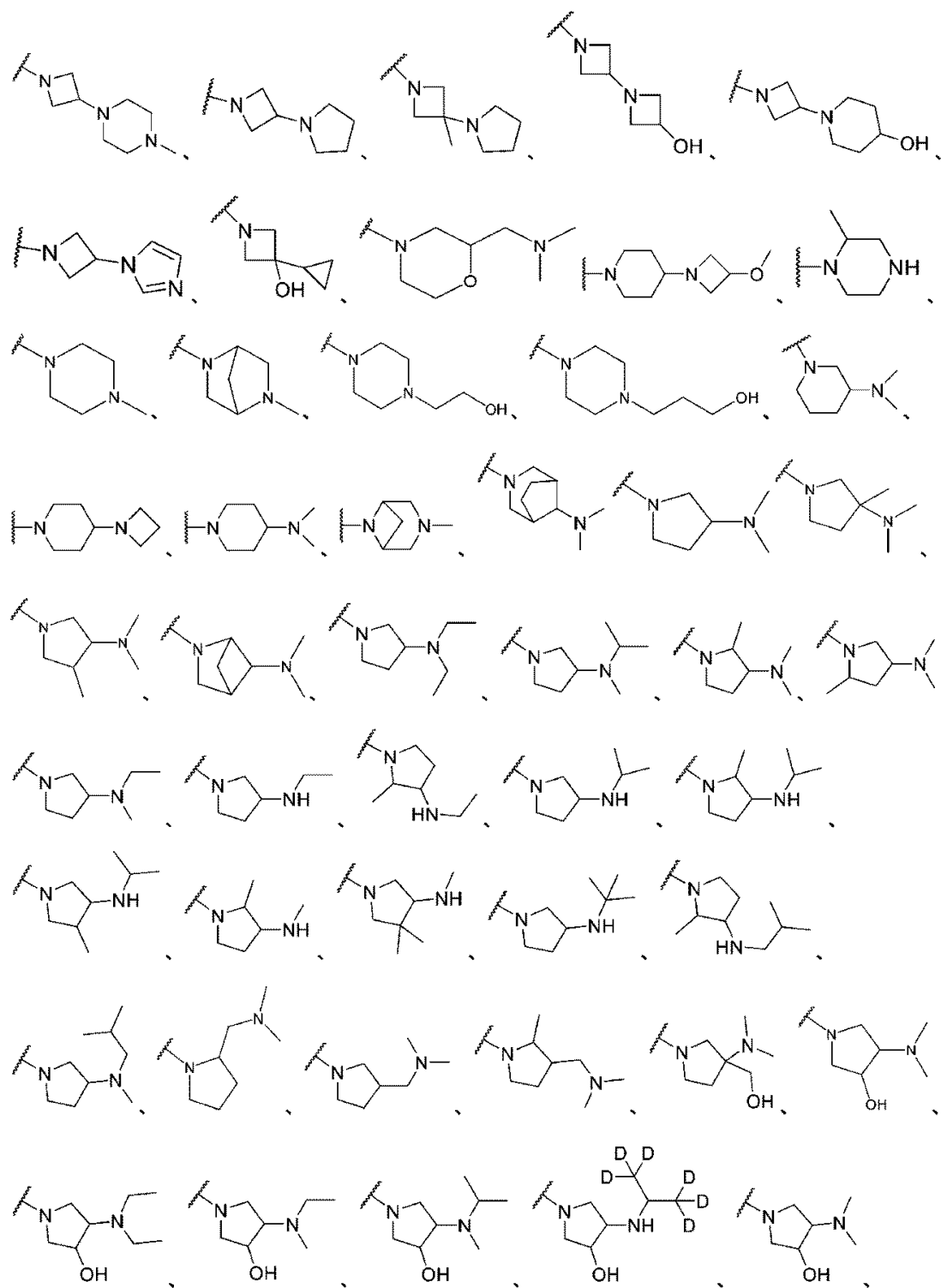
20

30

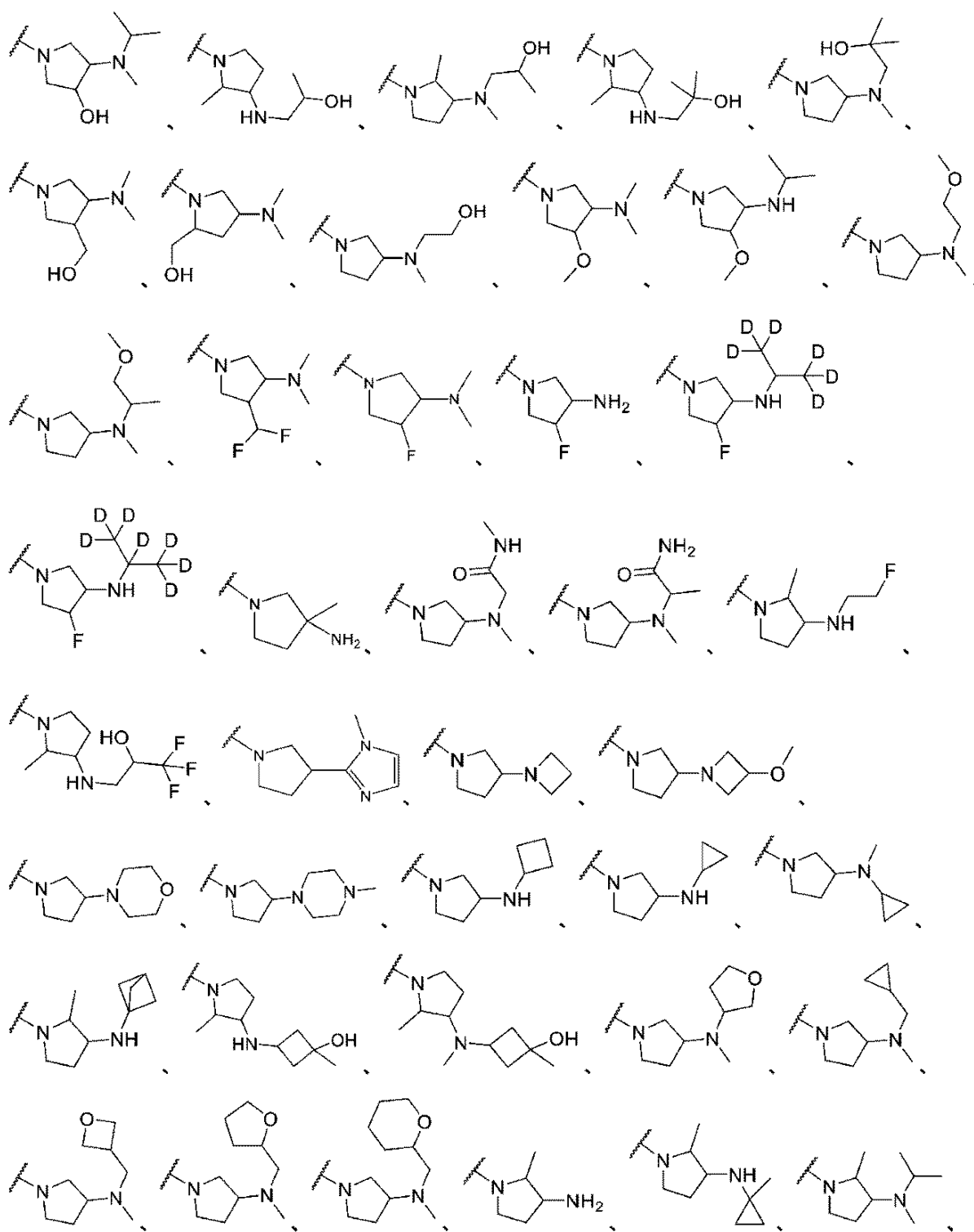
40

50

【化 1 2】



【化 1 3】



10

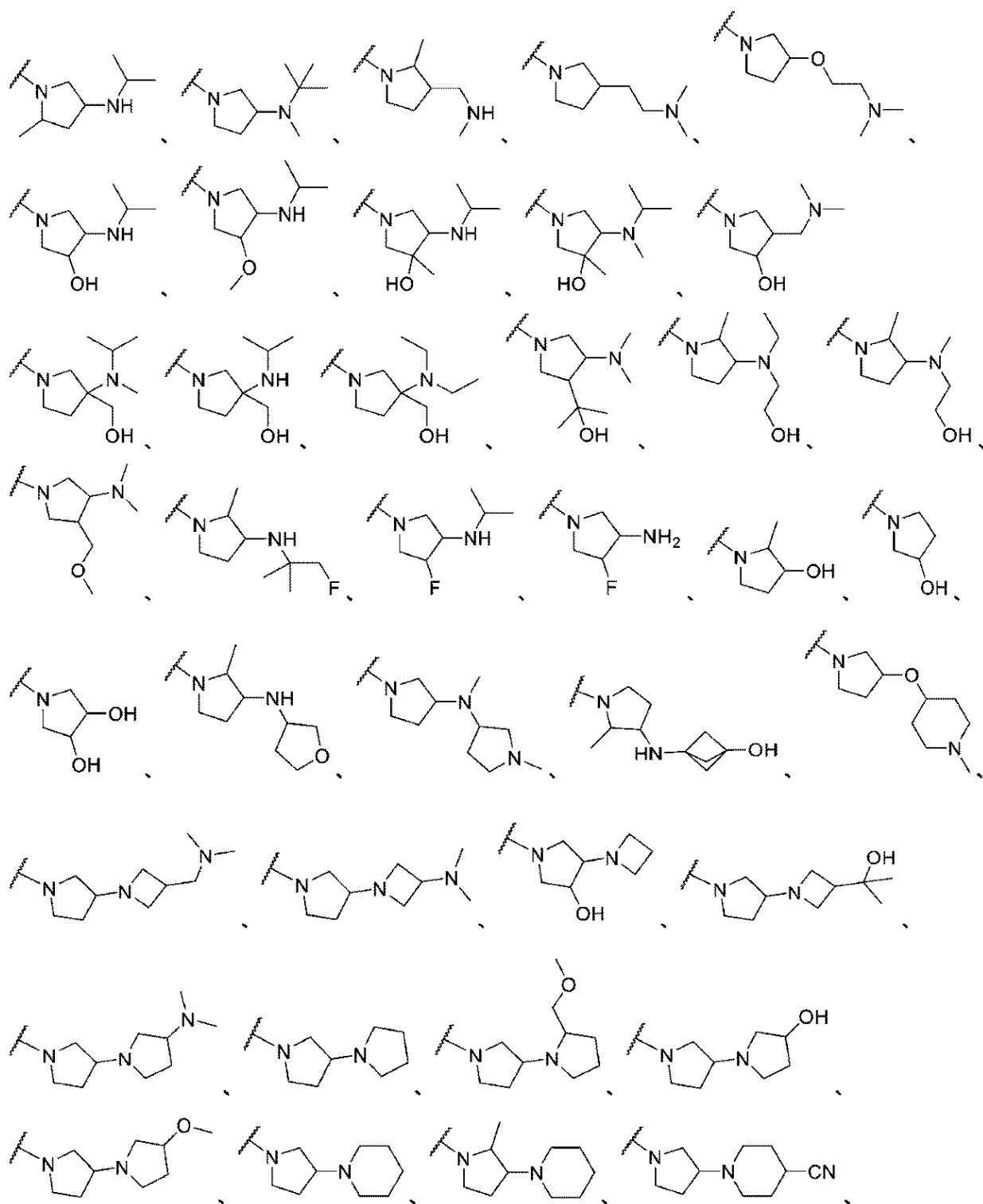
20

30

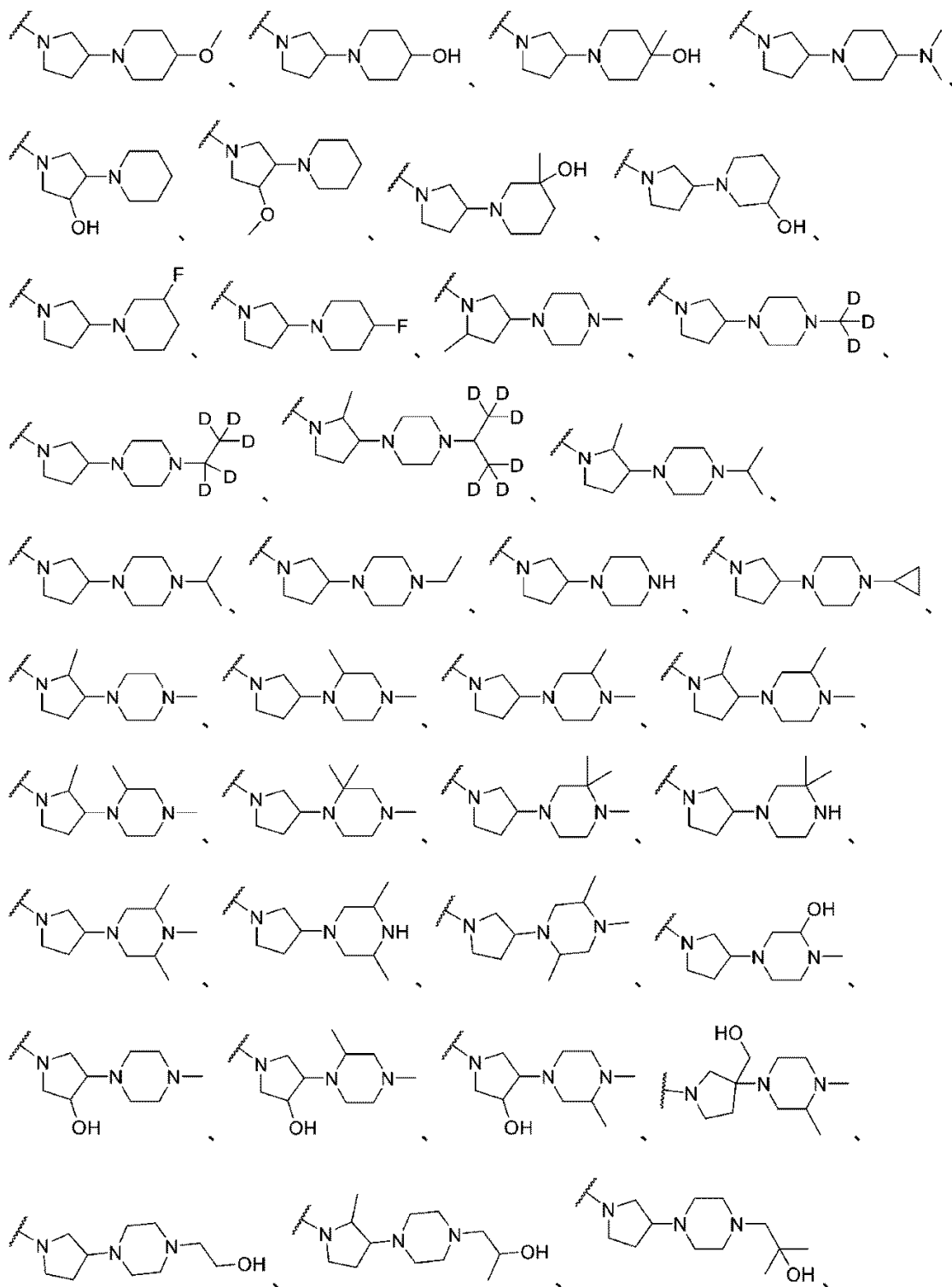
40

50

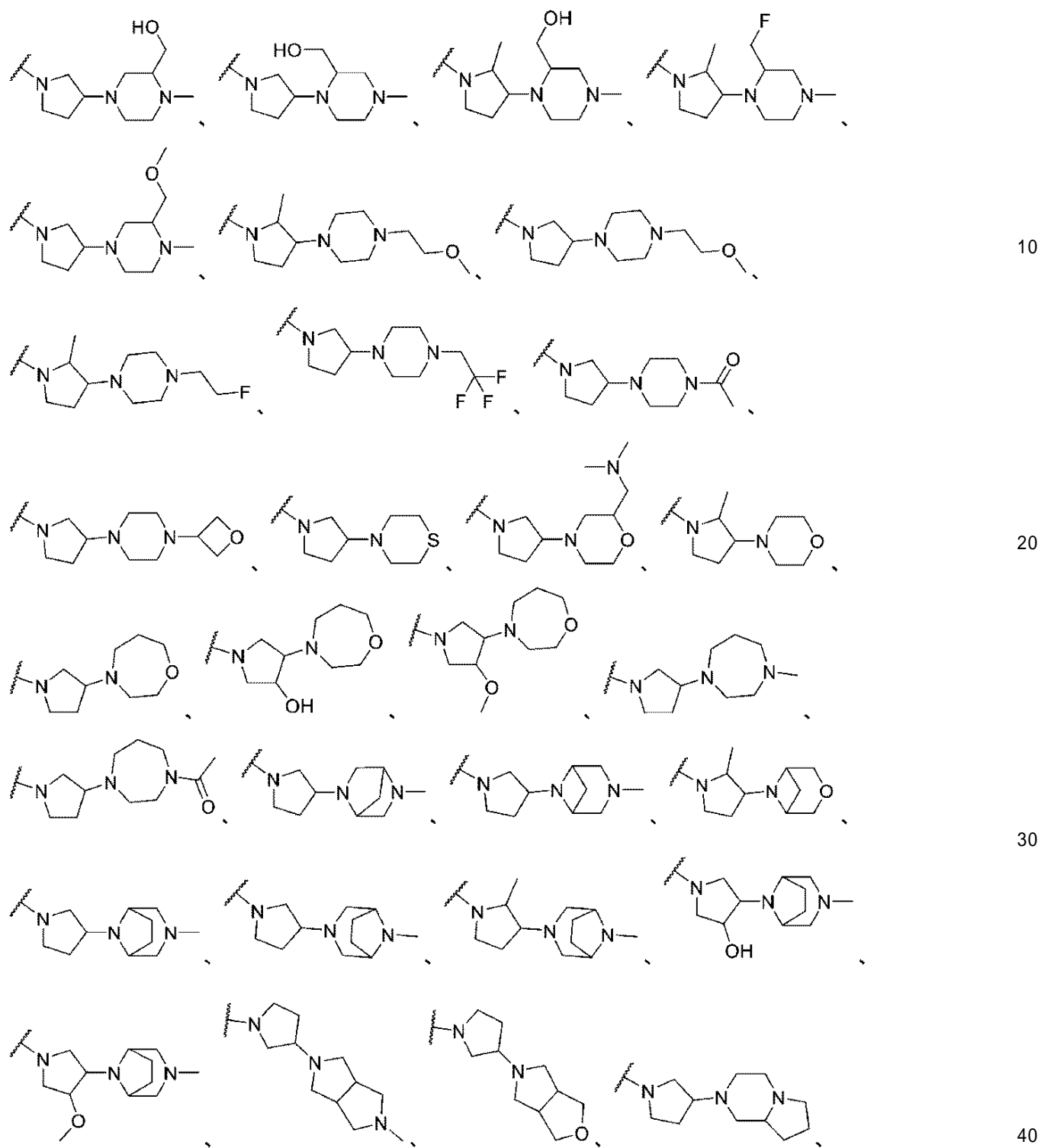
【化 1 4】



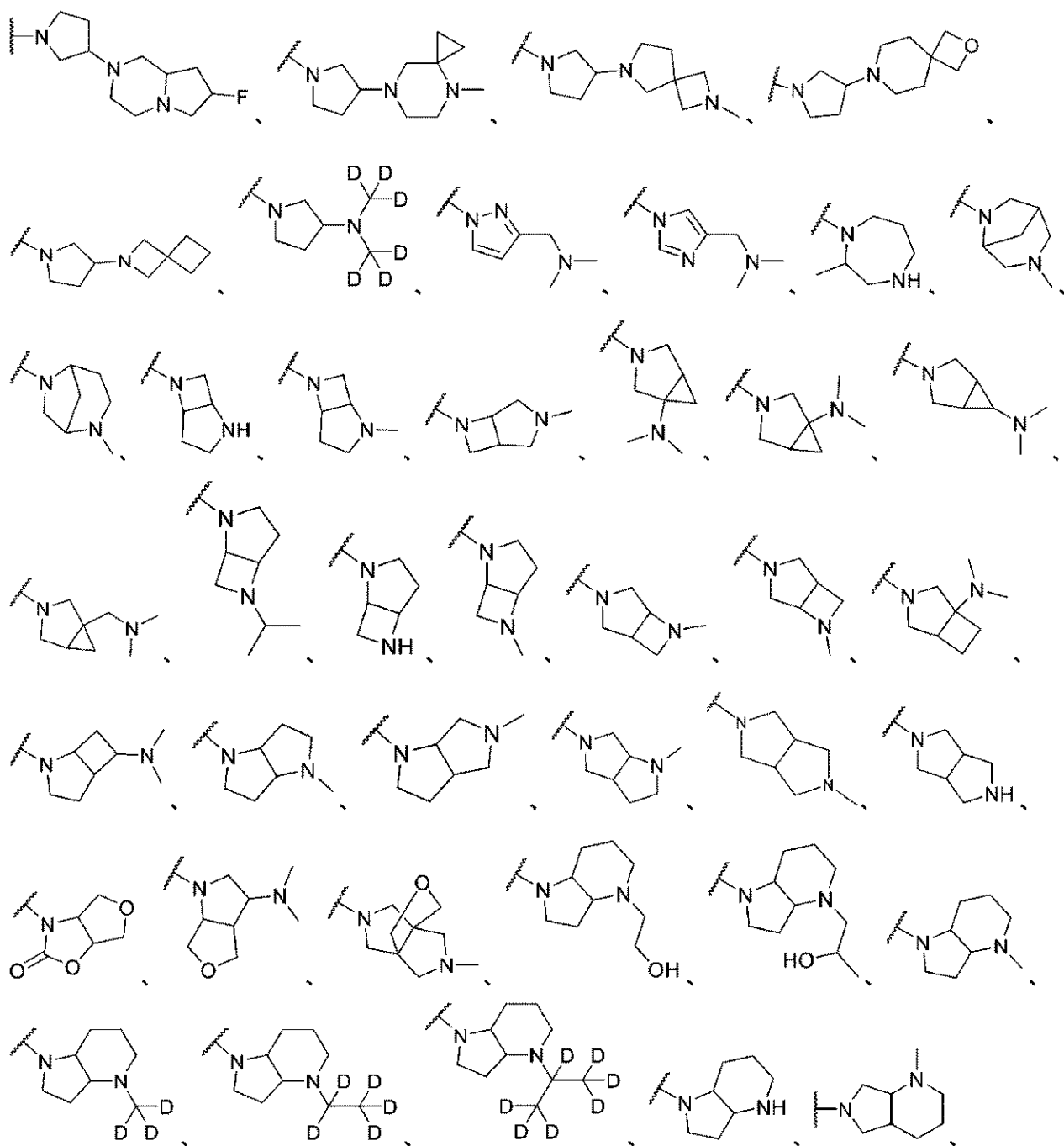
【化 15】



【化 1 6】



【化 17】



10

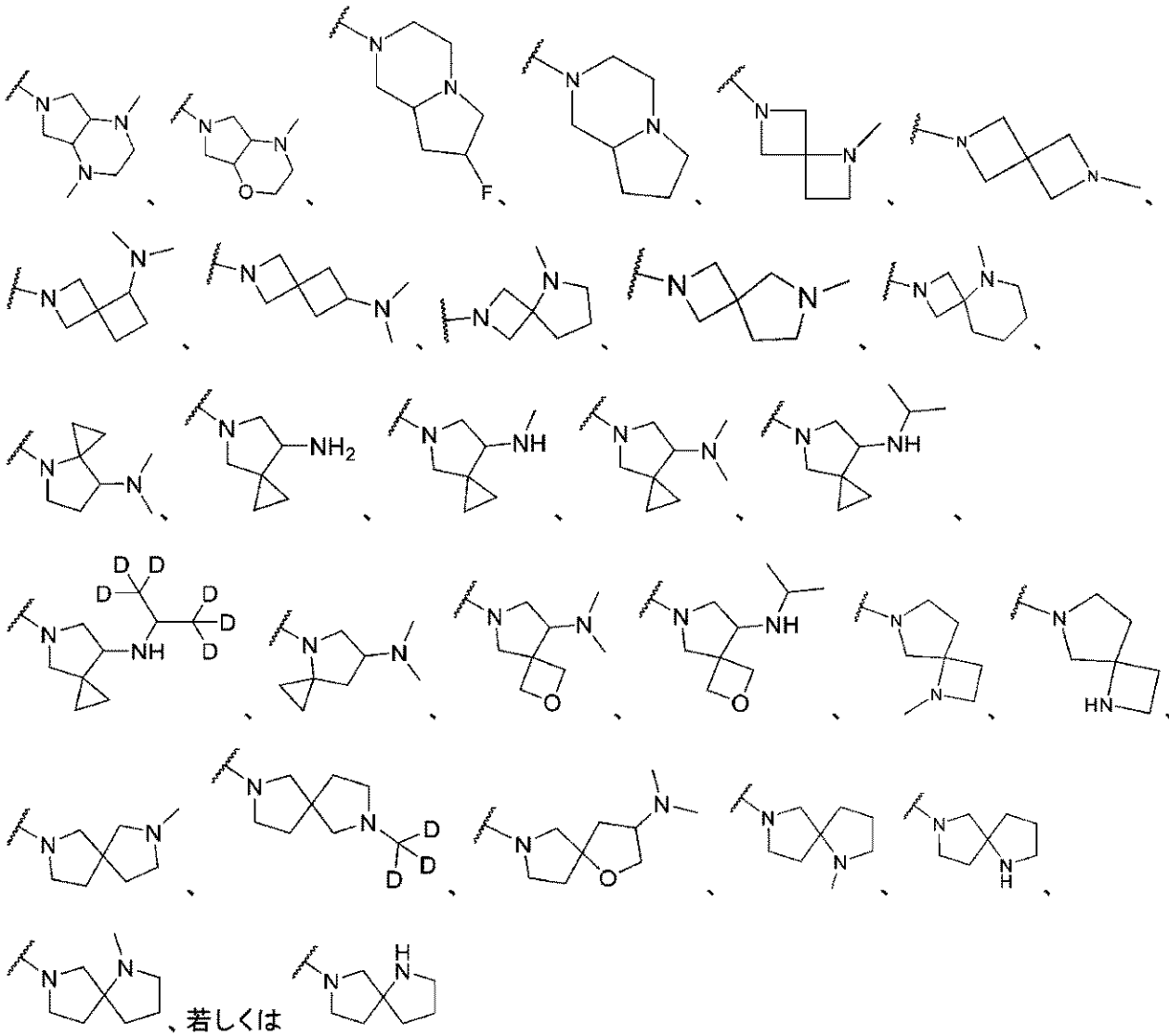
20

30

40

50

【化 1 8】

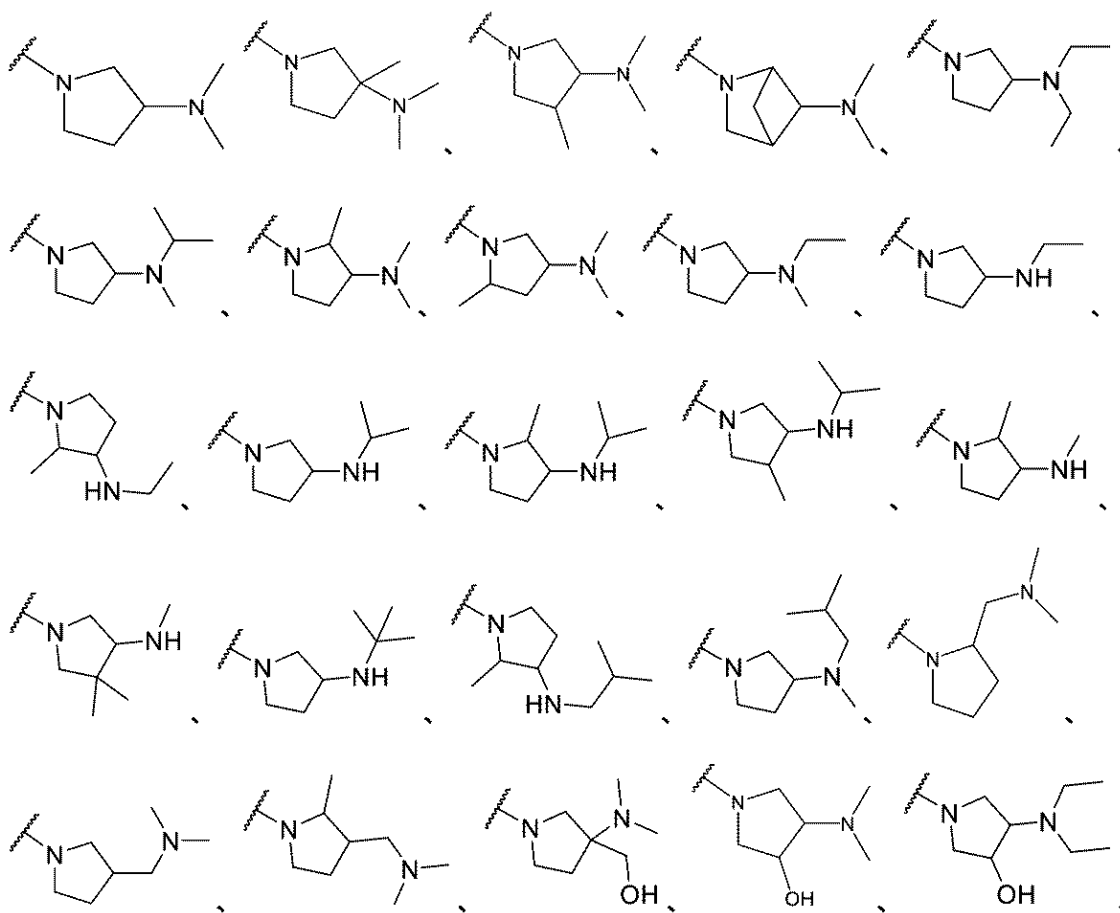


から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 2 4】

R₄ が、

【化 1 9】



10

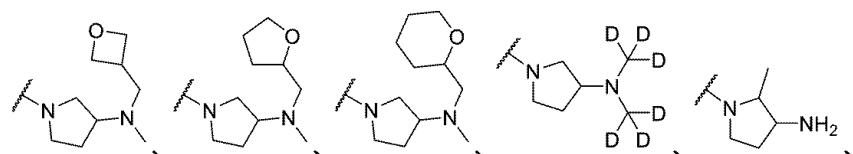
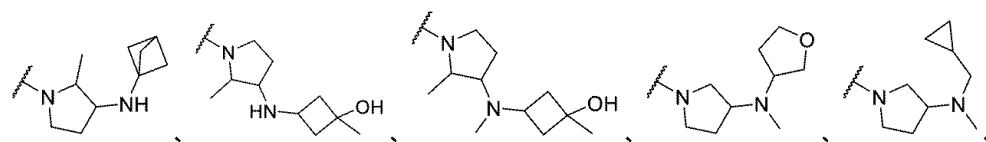
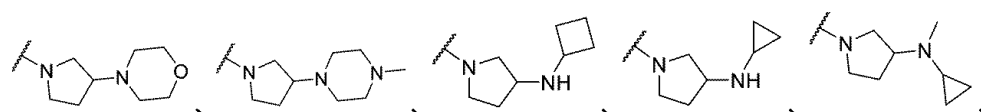
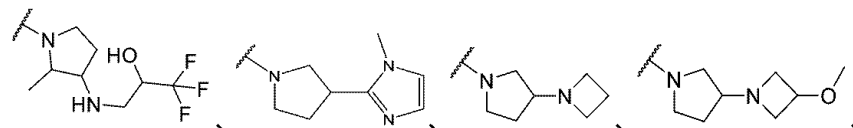
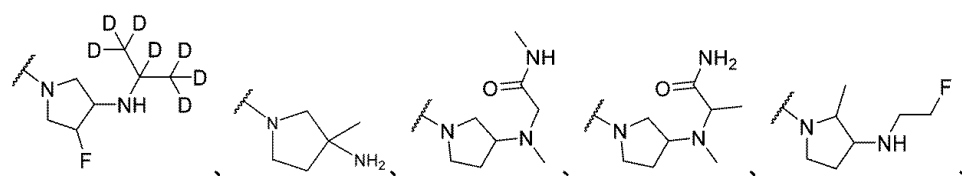
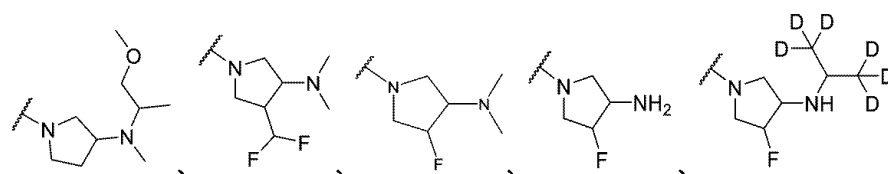
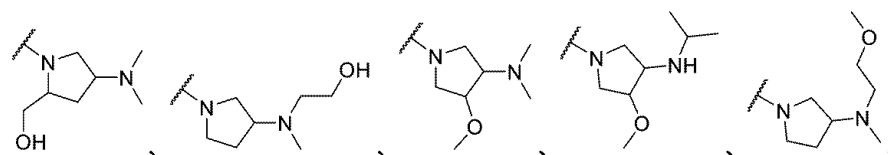
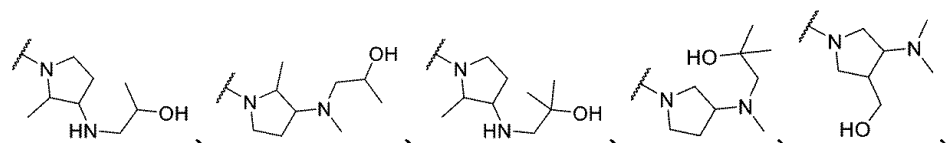
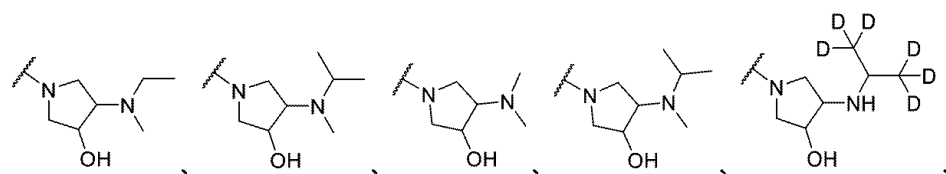
20

30

40

50

【化 2 0】



10

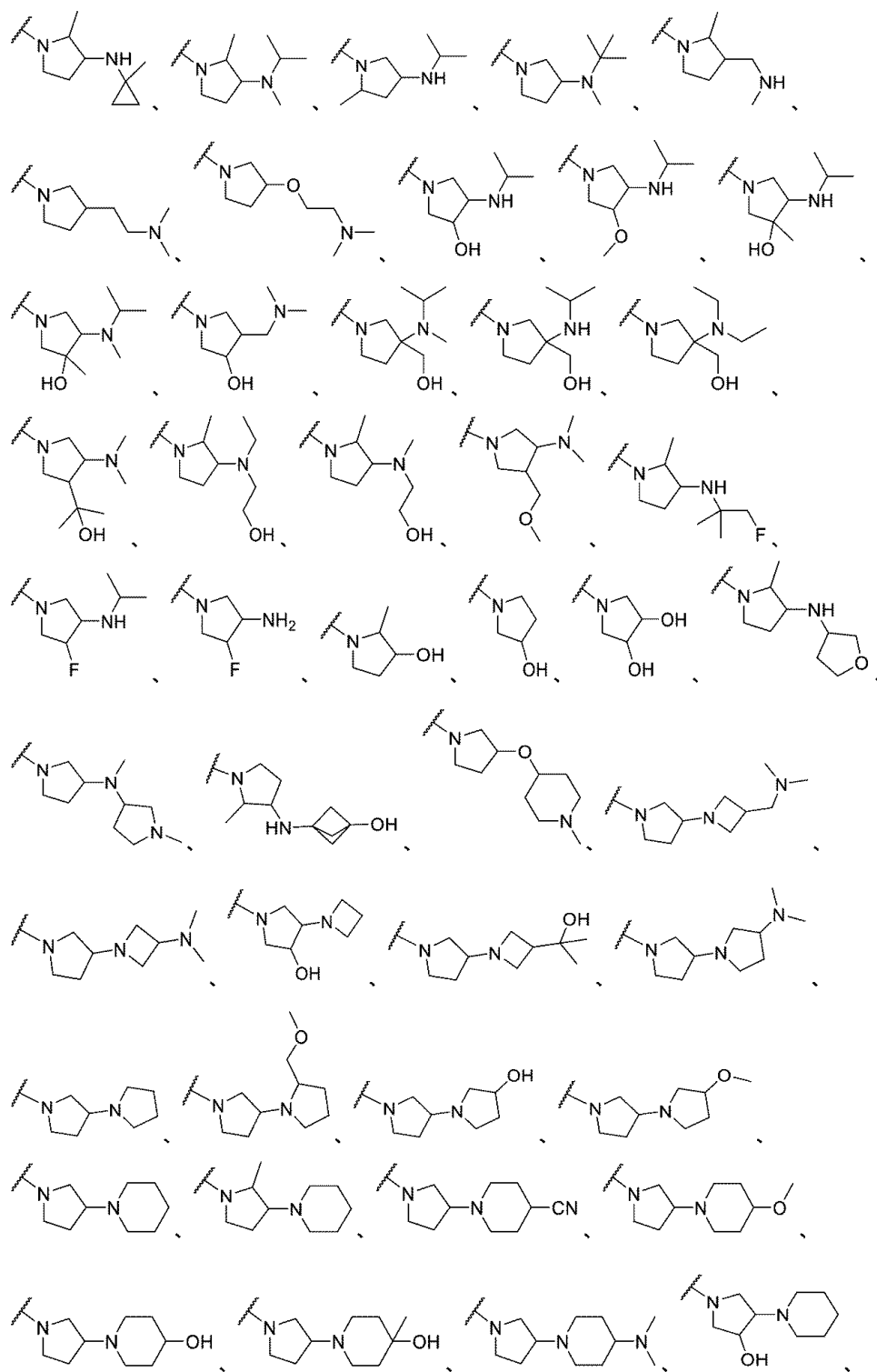
20

30

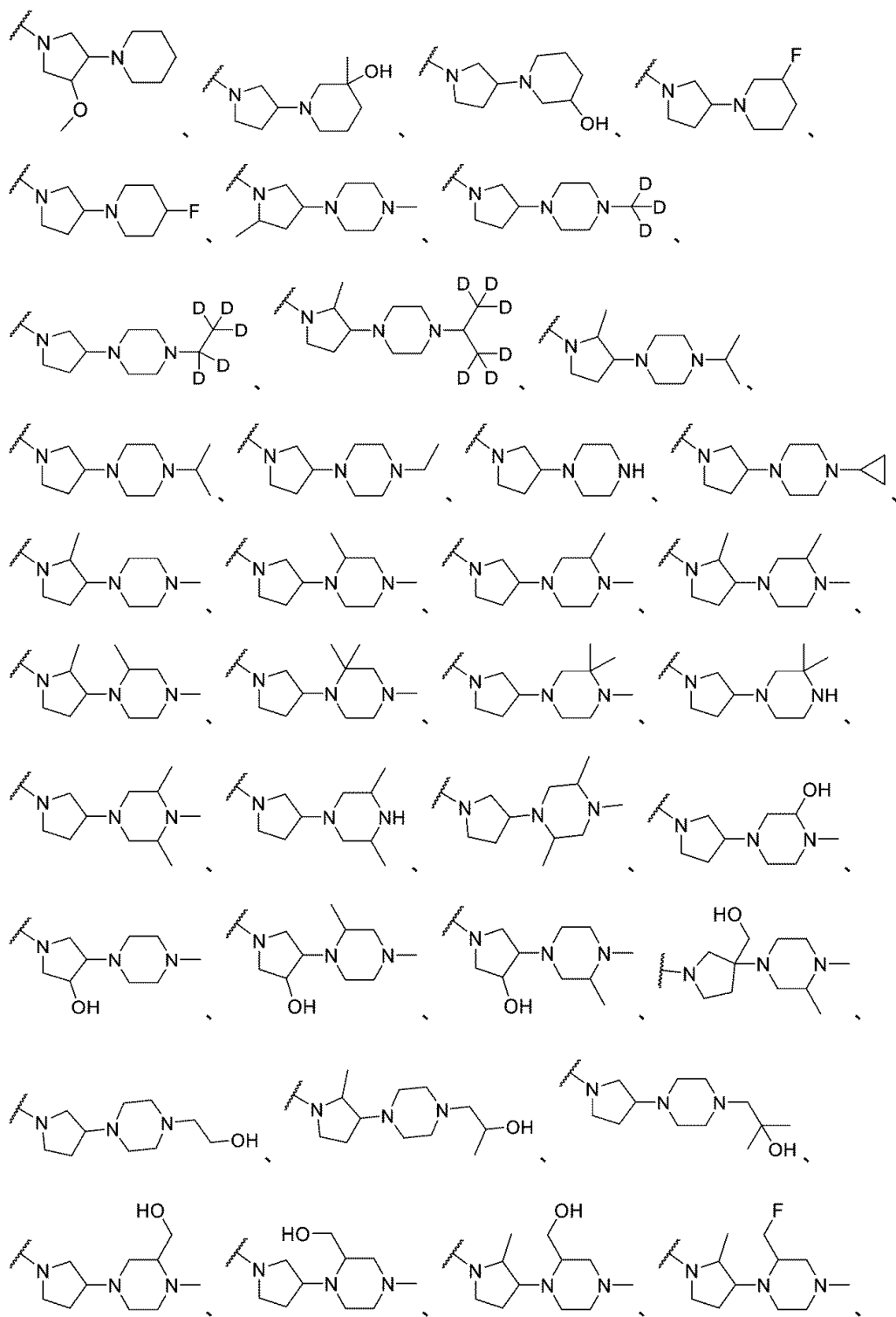
40

50

【化 2 1】



【化 2 2】



10

20

30

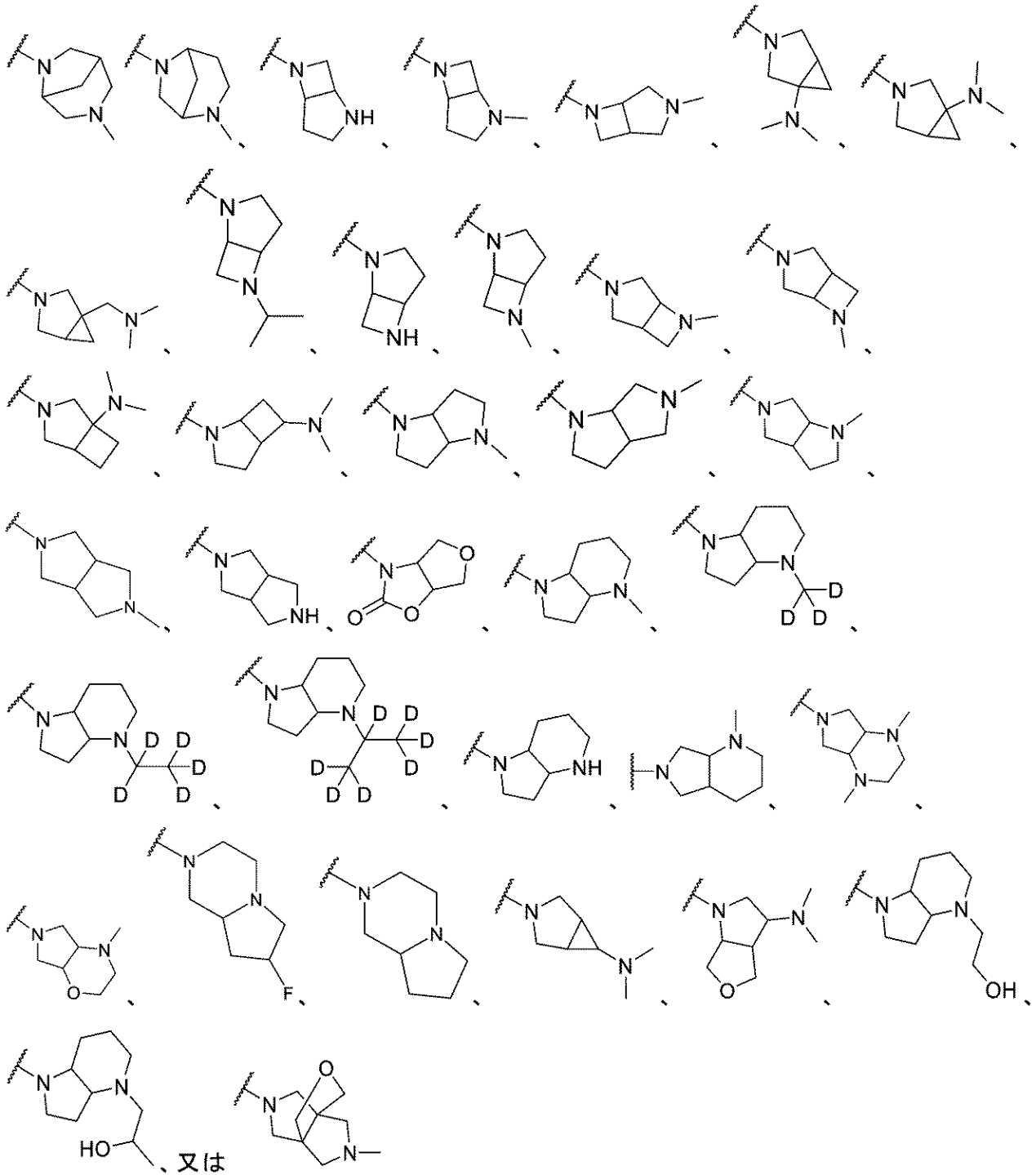
40

50

又ほ

R₄が、

【化 2 4】



10

20

30

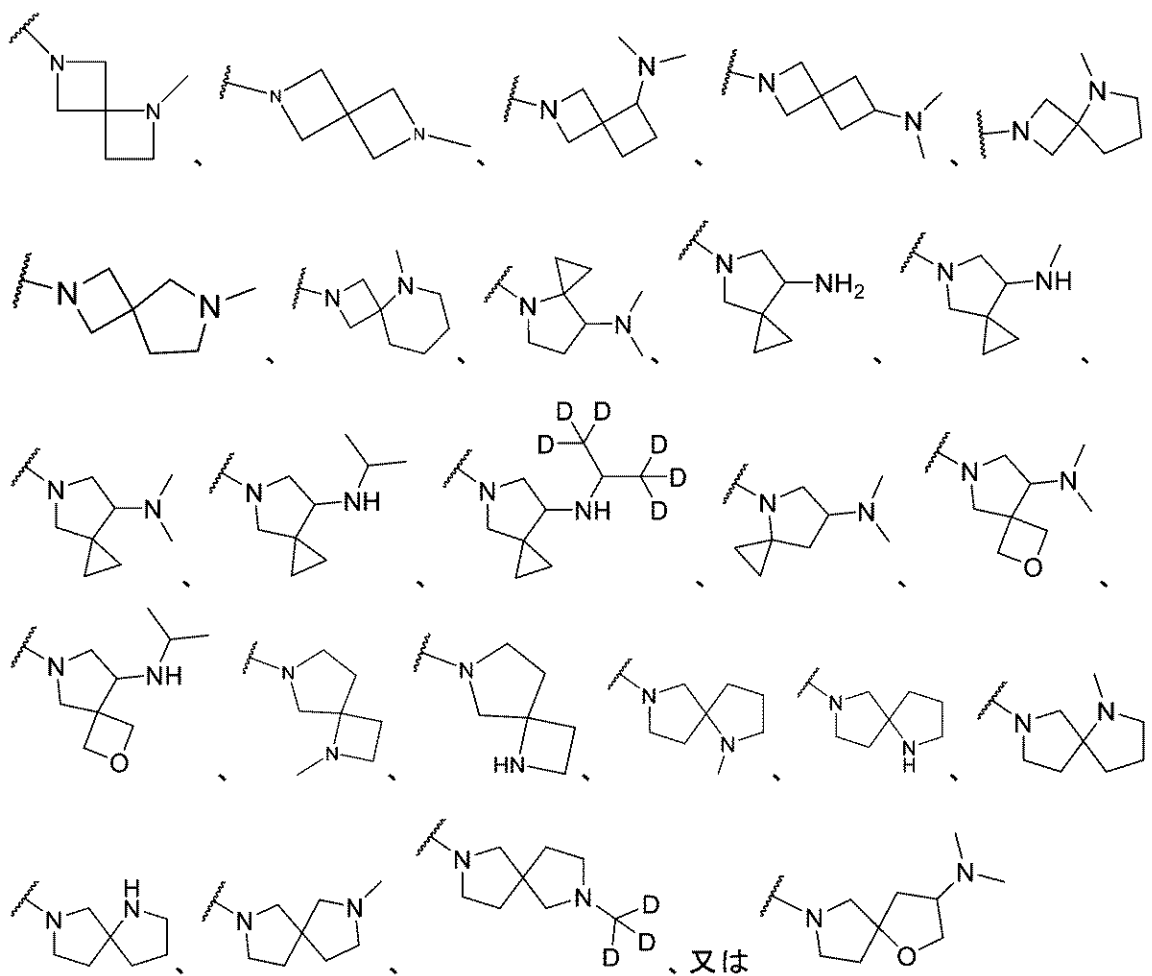
から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

40

【請求項 2 6】

R₄ が、

【化 2 5】



10

20

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される塩。

【請求項 2 7】

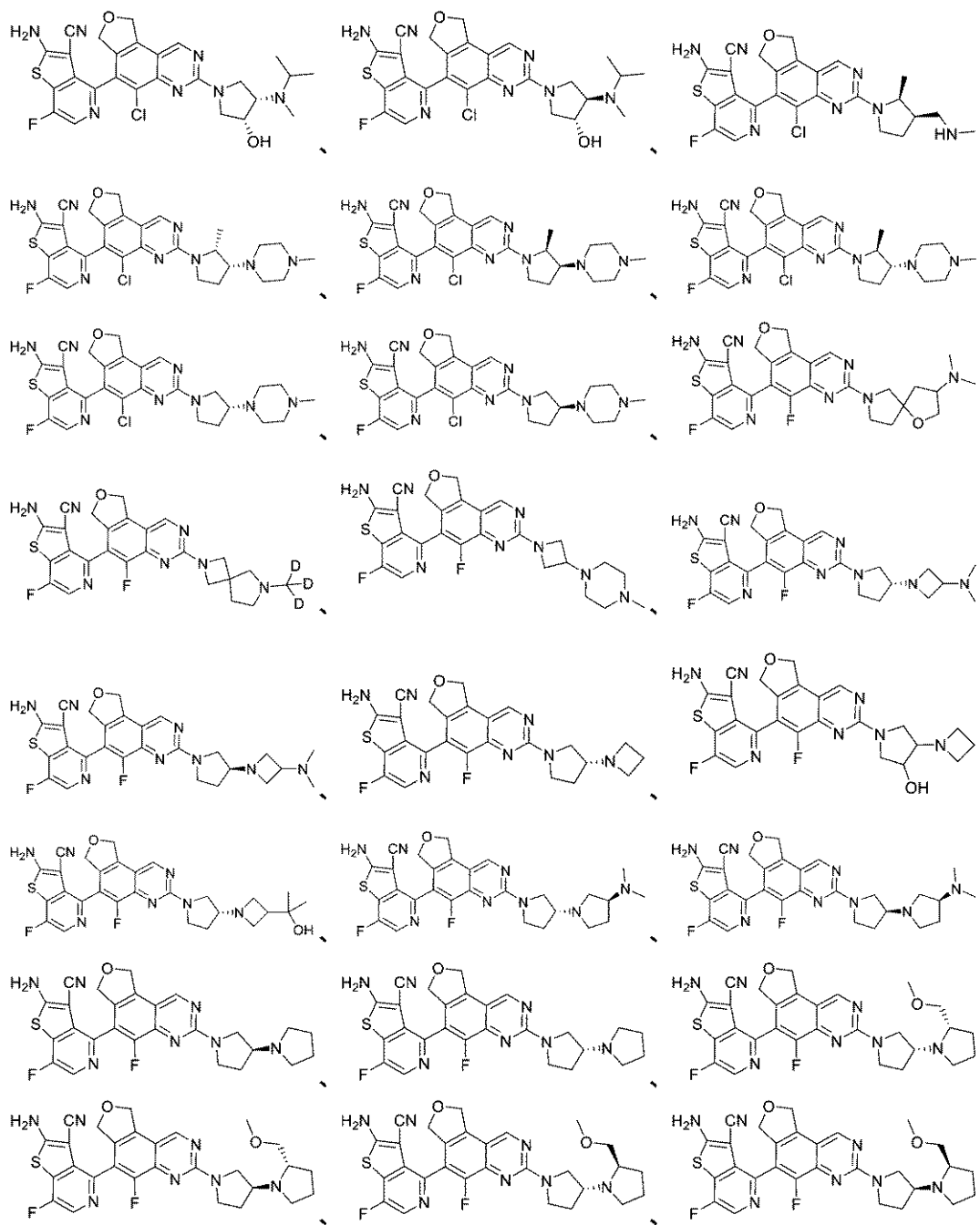
請求項 1 に記載の化合物であって、

30

40

50

【化 26】



10

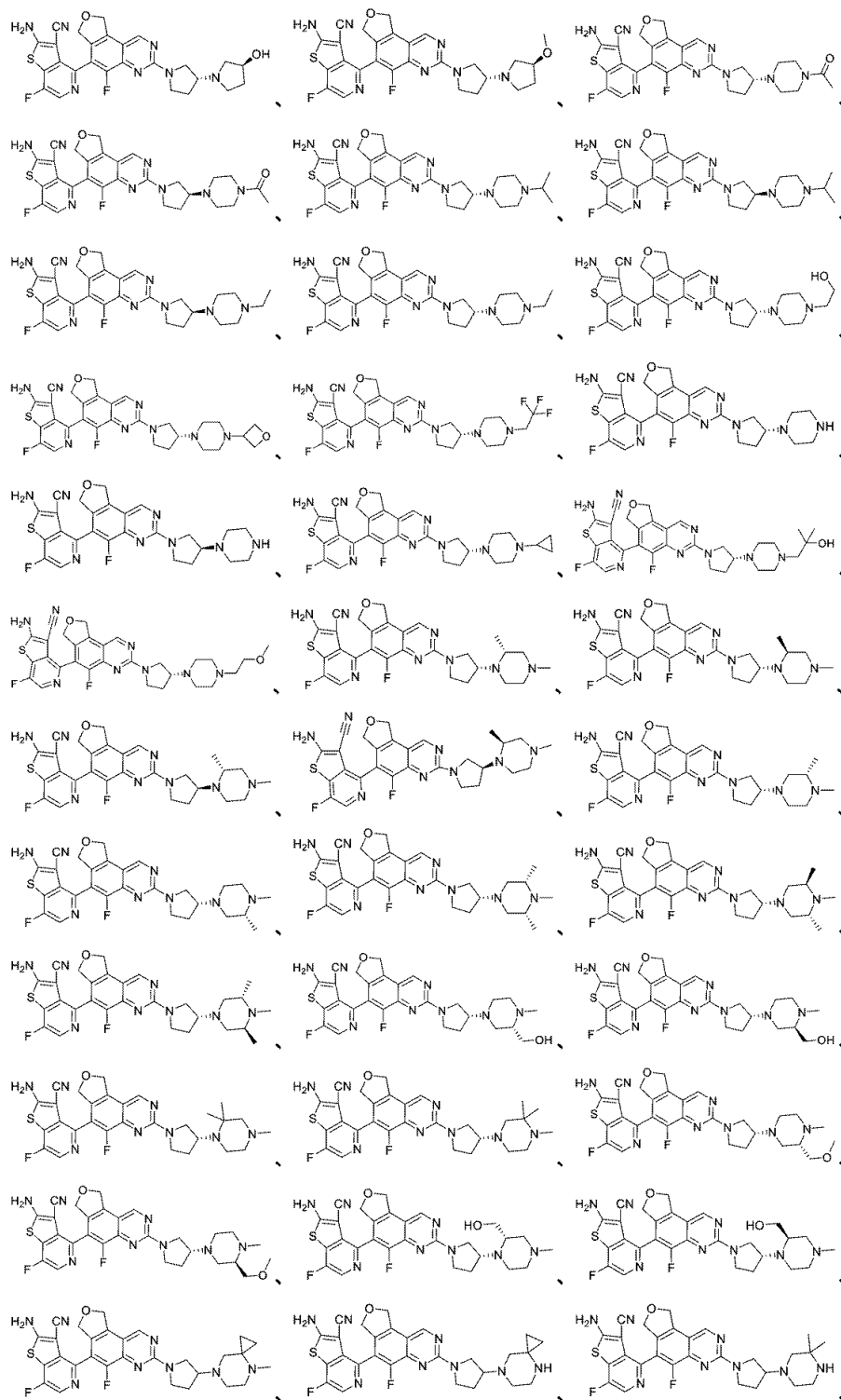
20

30

40

50

【化 27】



10

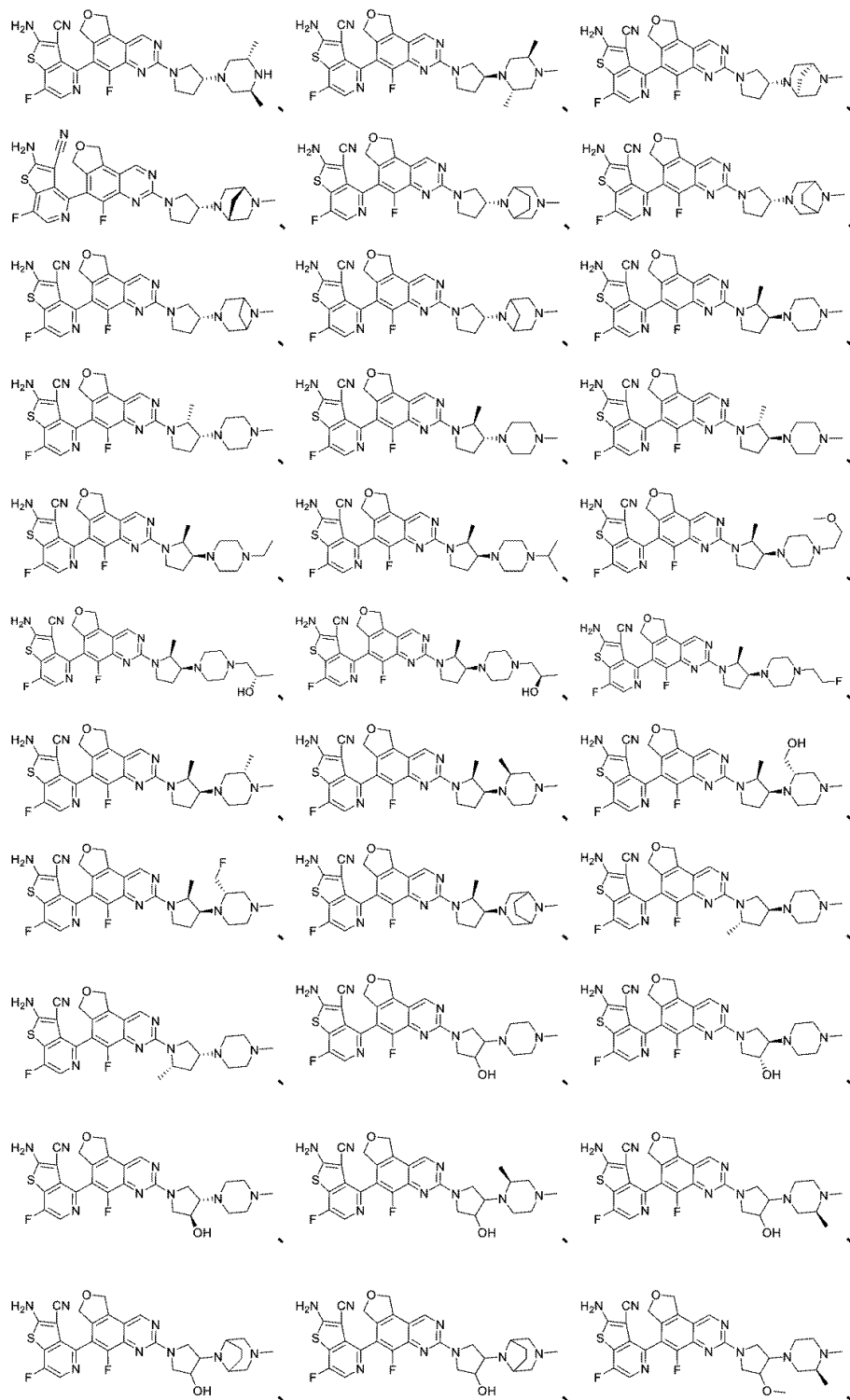
20

30

40

50

【化 28】



10

20

30

40

50

10



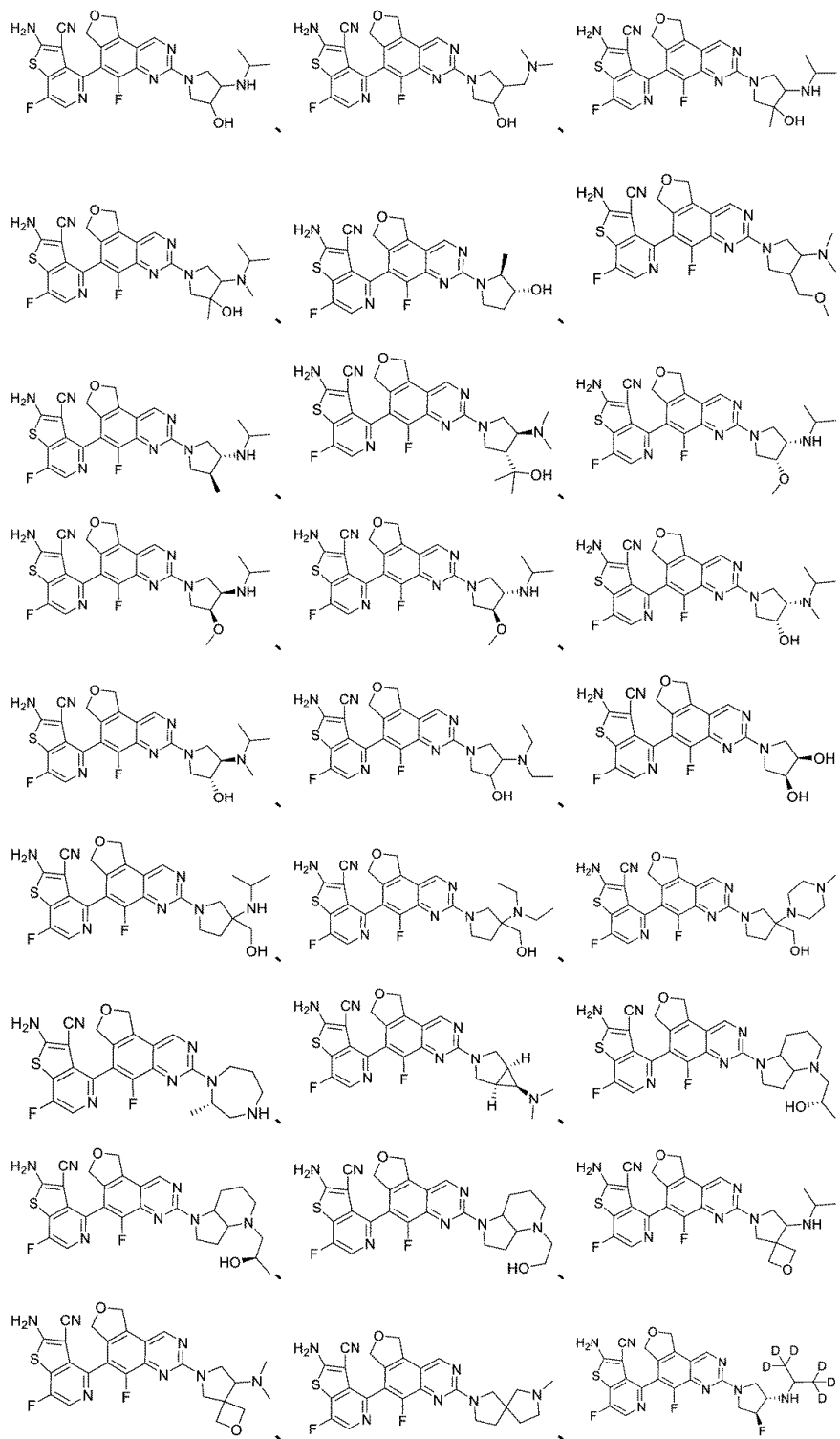
30

40

Figure 1 displays 18 novel thienopyridine derivatives, labeled 1a through 1r, arranged in a 6x3 grid. Each structure is a complex molecule featuring a central thienopyridine core. The substituents vary across the molecules, including amino groups (H₂N), cyano groups (CN), fluoro groups (F), and various heterocyclic rings such as pyrrolidine, piperidine, and morpholine. Stereochemistry is indicated with wedged and dashed bonds. The structures are labeled 1a through 1r.

40

【化 3 1】



10

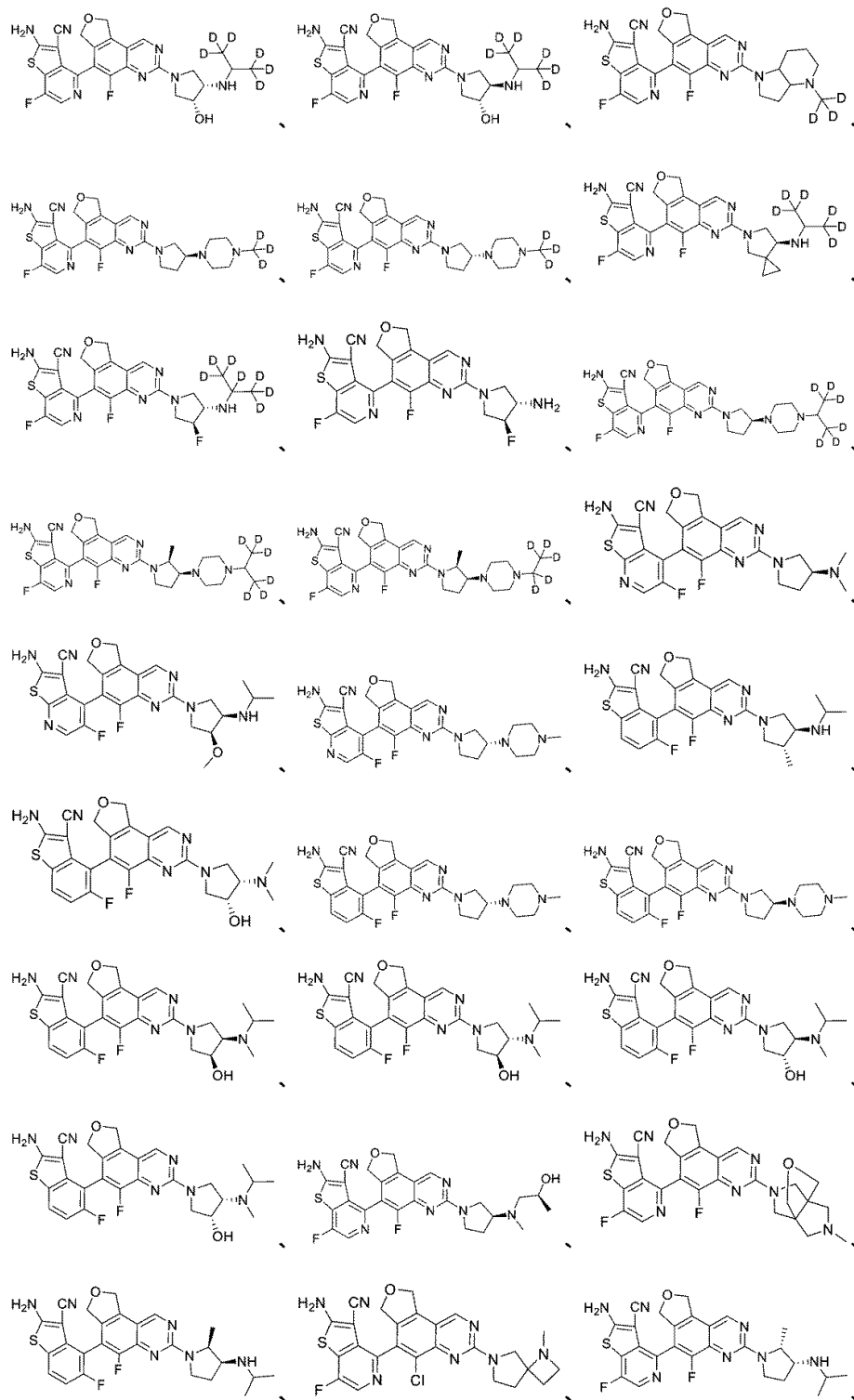
20

30

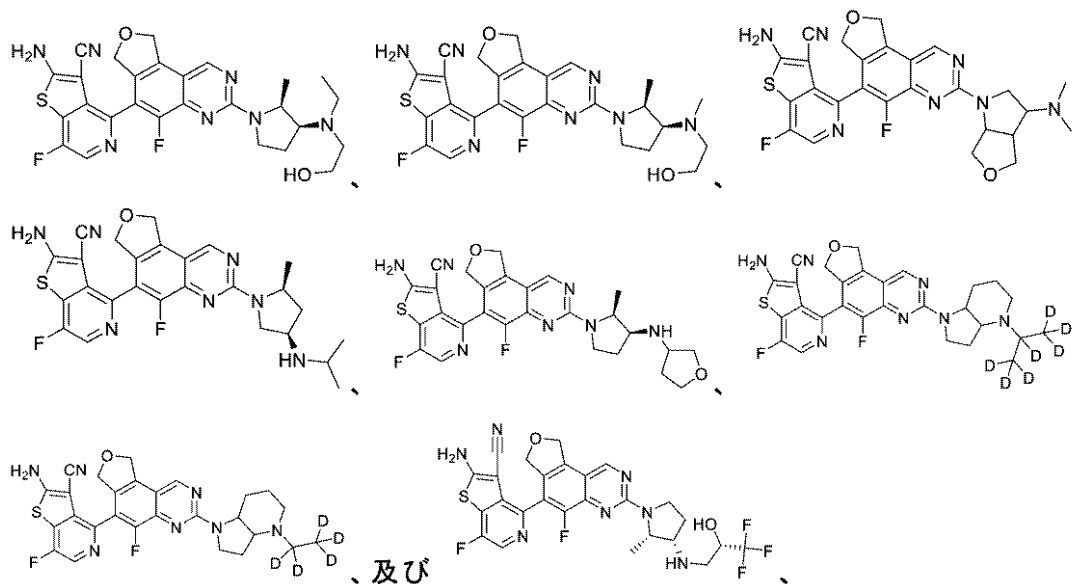
40

50

【化 3 2】



【化 3 3】



から選択される化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 28】

請求項 1 に記載の化合物であって、

10

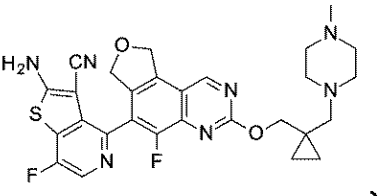
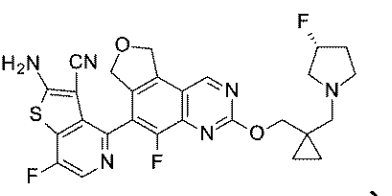
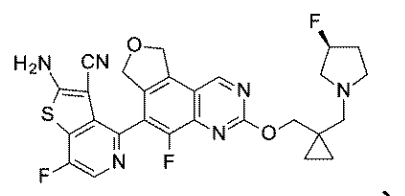
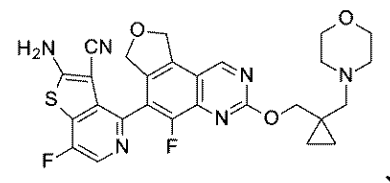
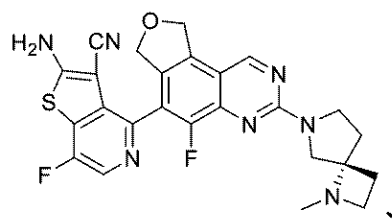
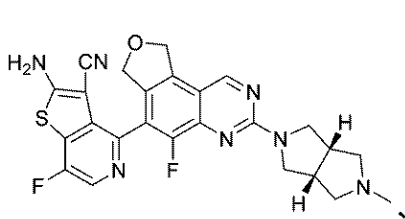
20

30

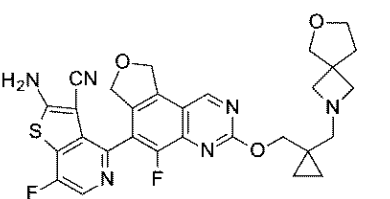
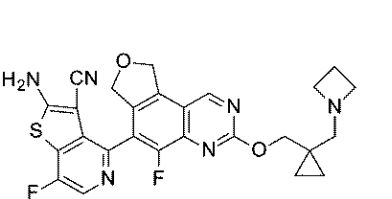
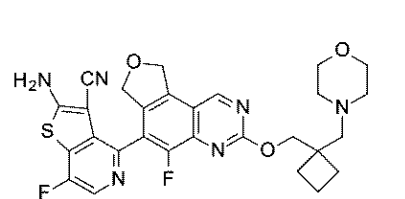
40

50

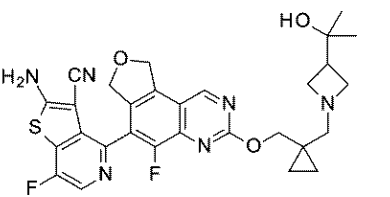
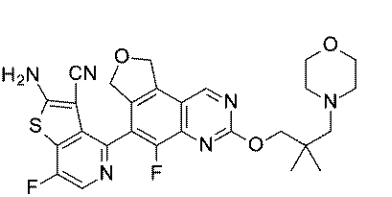
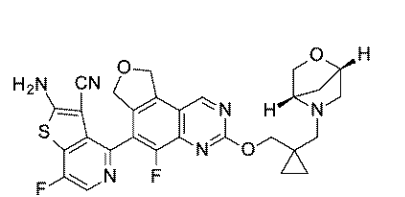
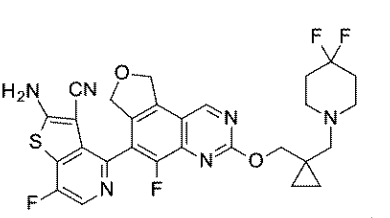
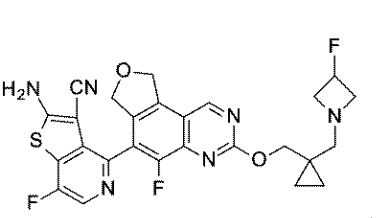
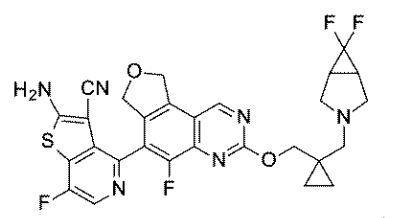
【化 3 4】



10



20

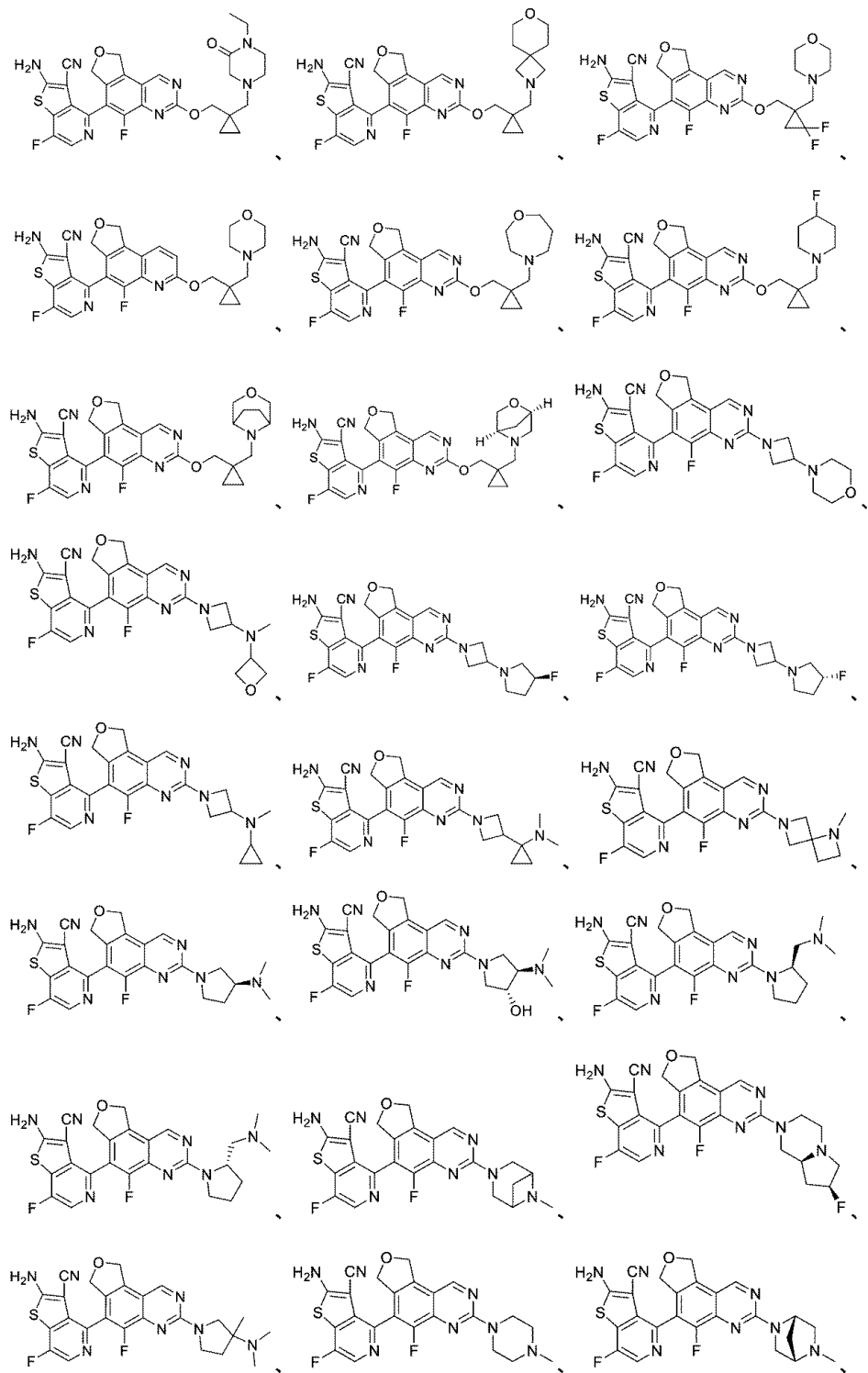


30

40

50

【化 3 5】



10

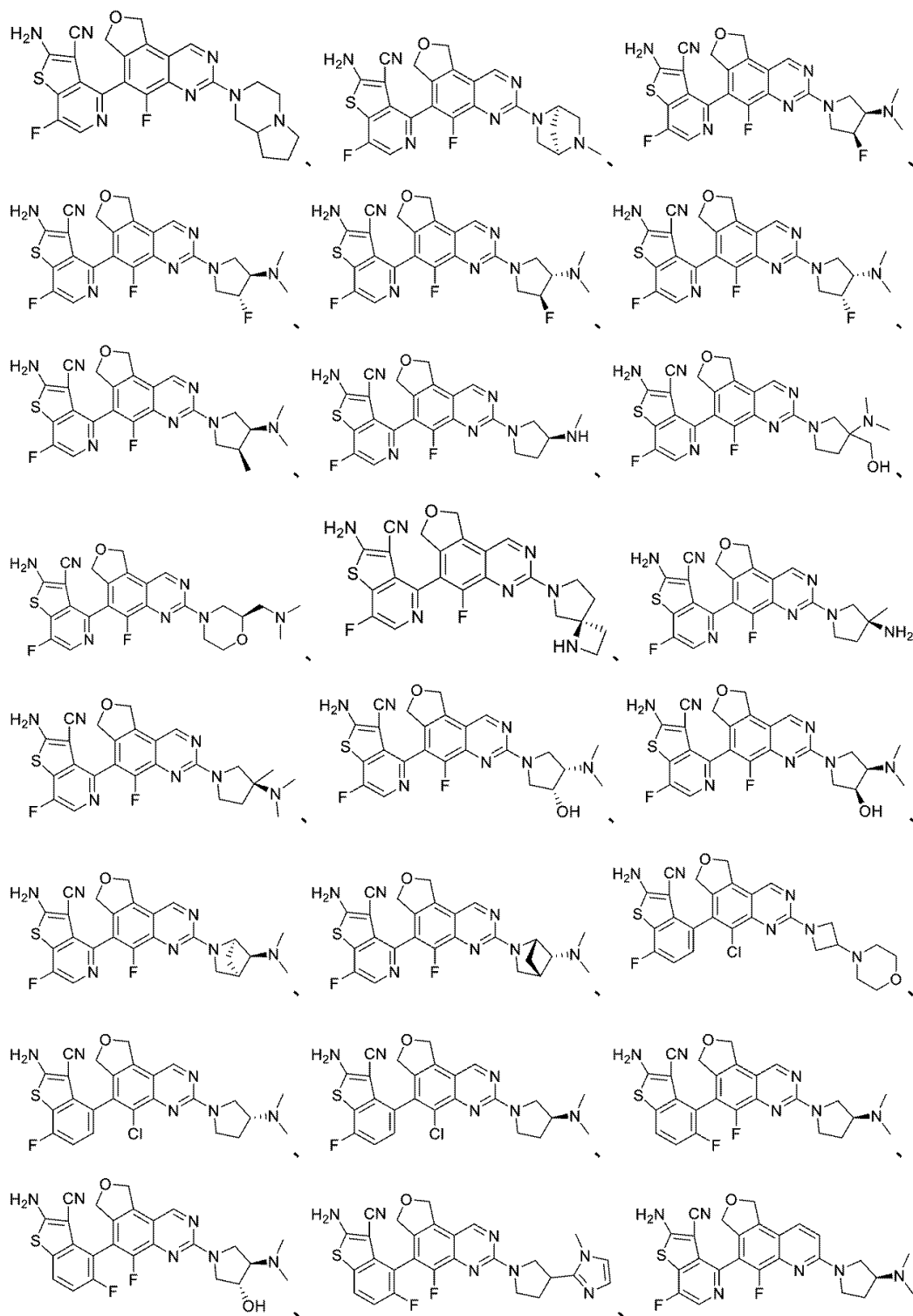
20

30

40

50

【化 3 6】



10

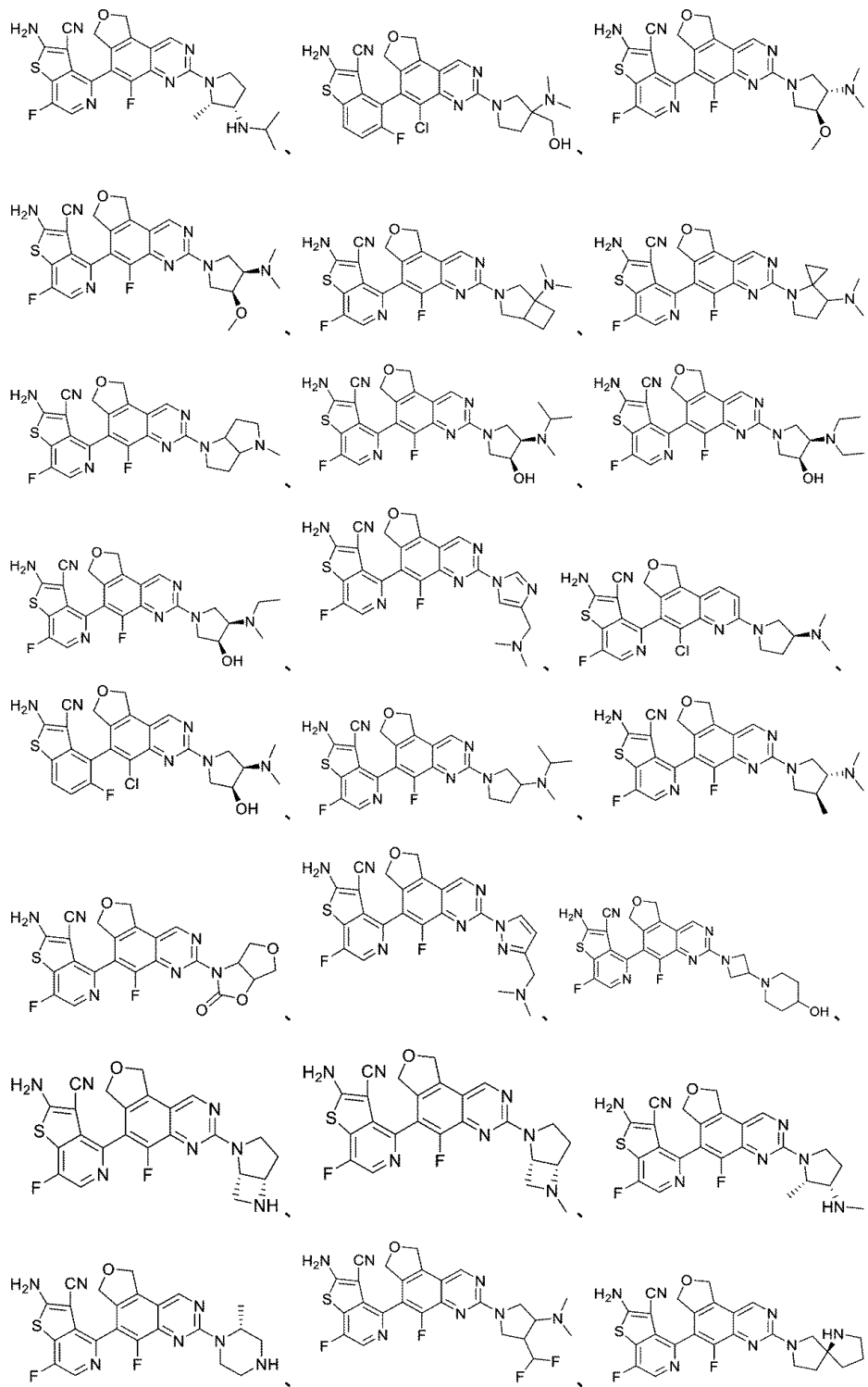
20

30

40

50

【化 3 7】



10

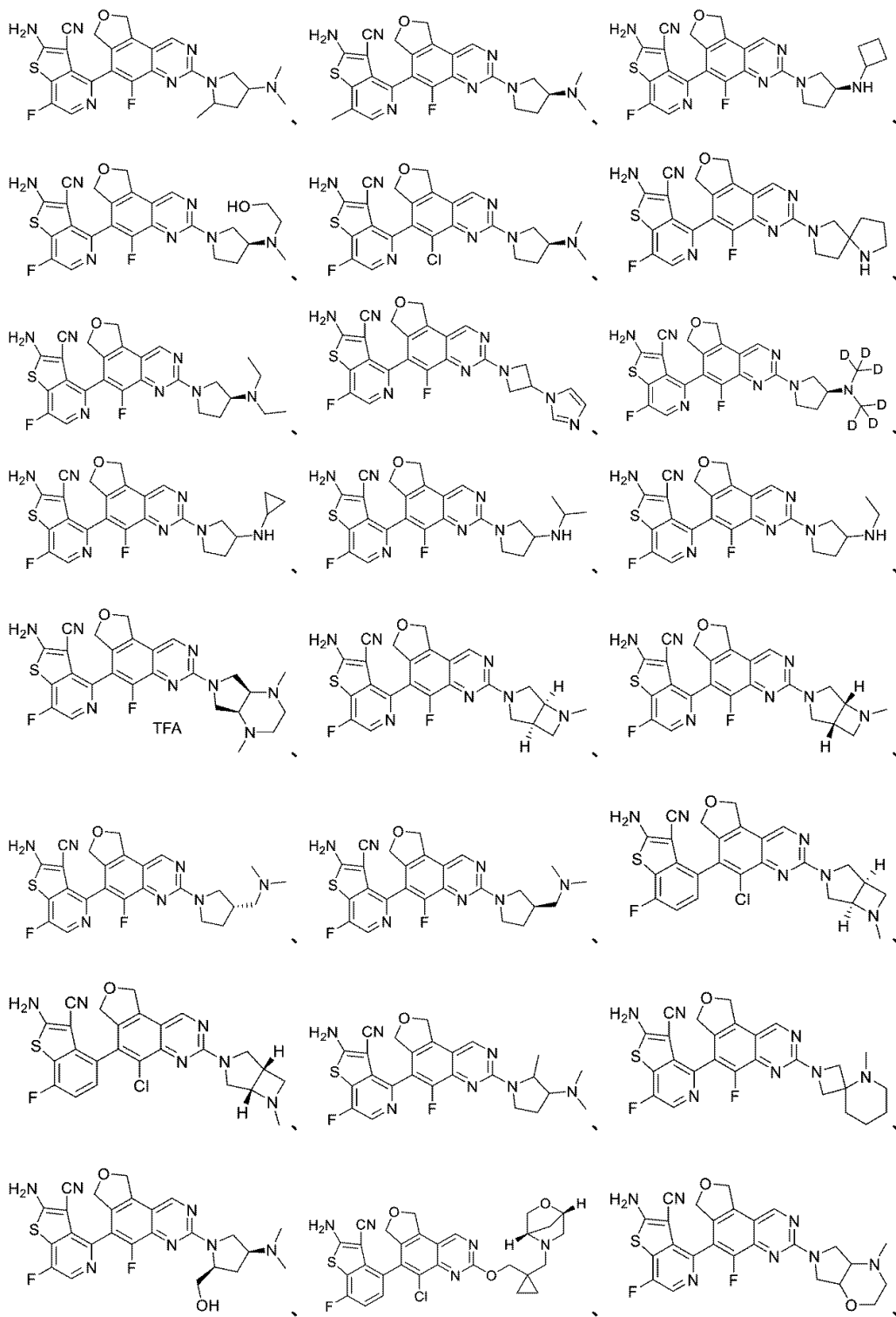
20

30

40

50

【化 3 8】



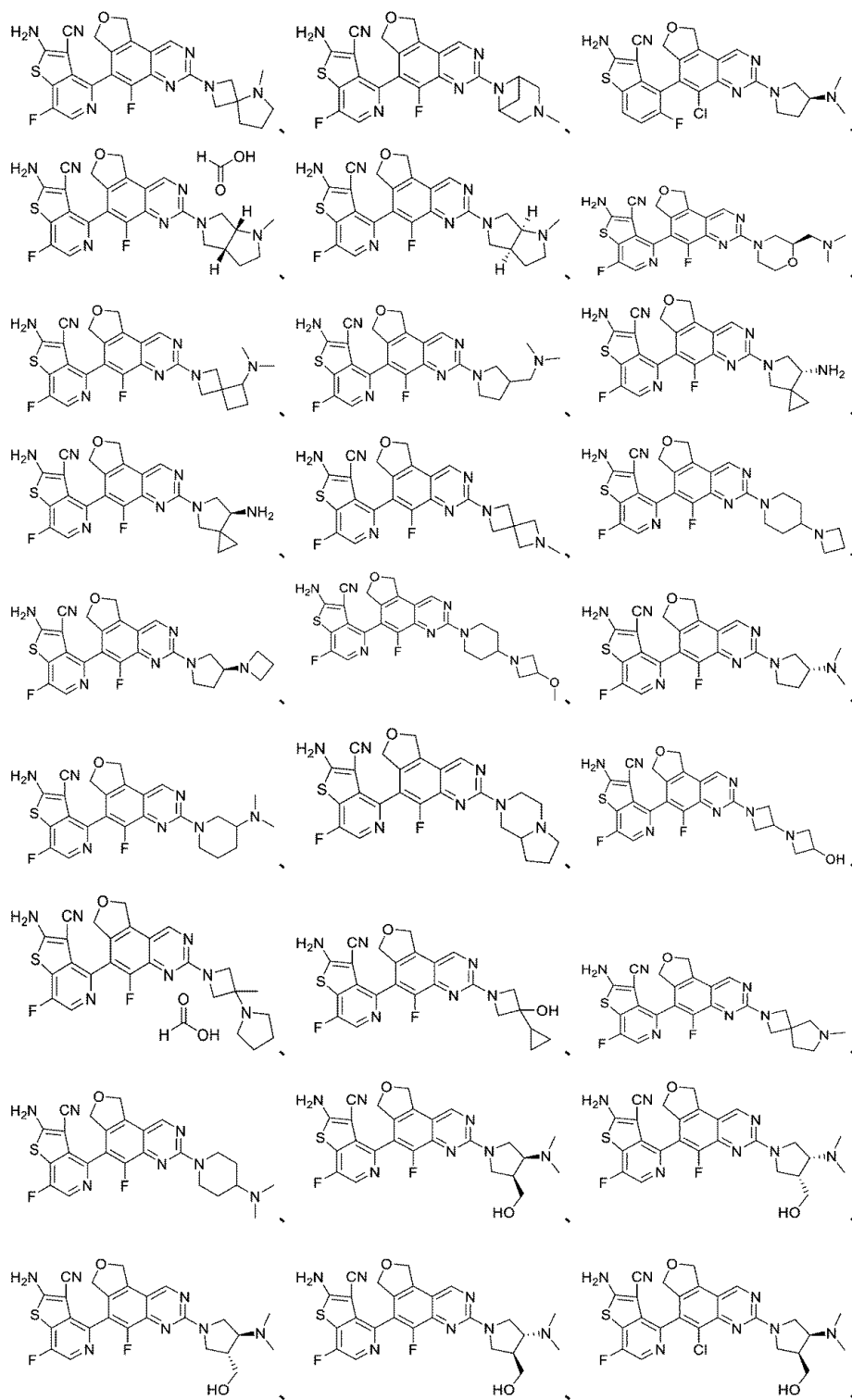
10

20

30

40

【化 3 9】



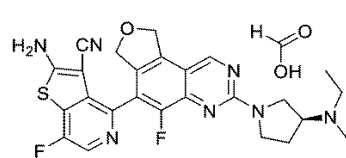
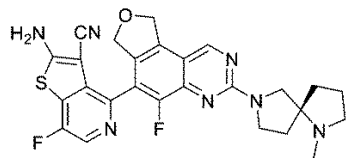
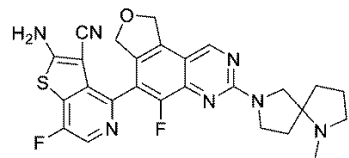
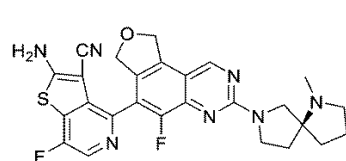
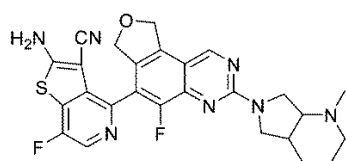
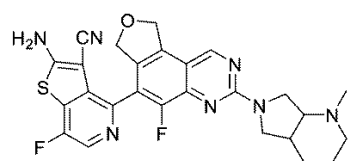
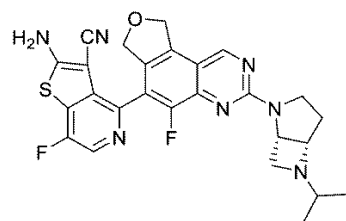
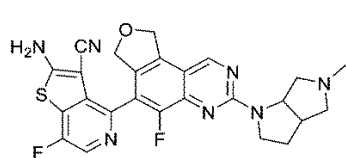
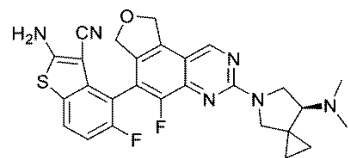
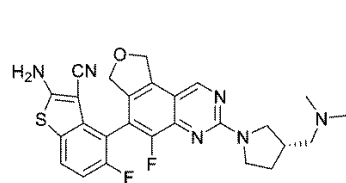
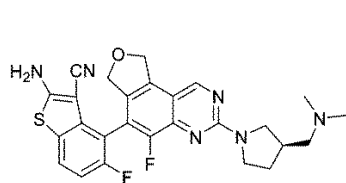
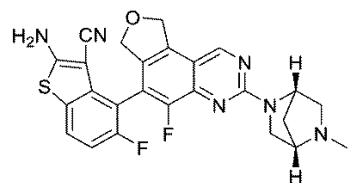
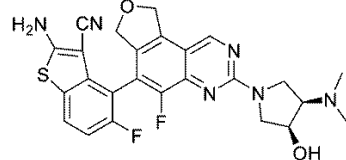
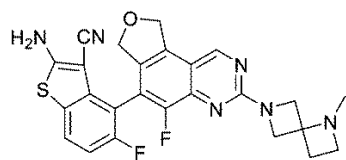
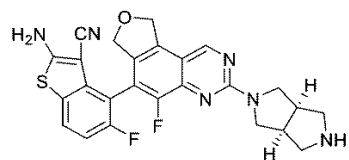
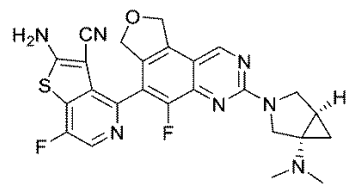
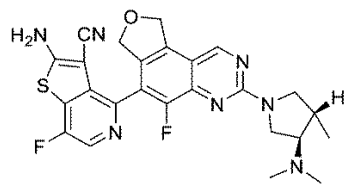
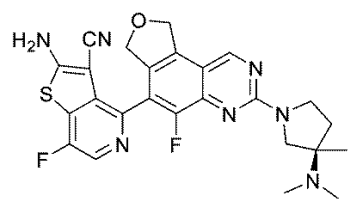
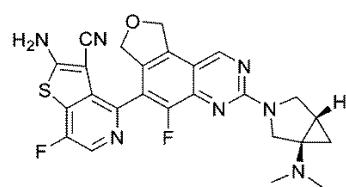
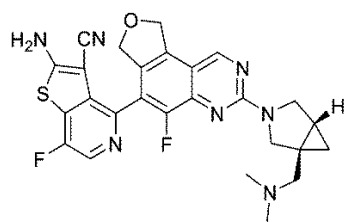
10

20

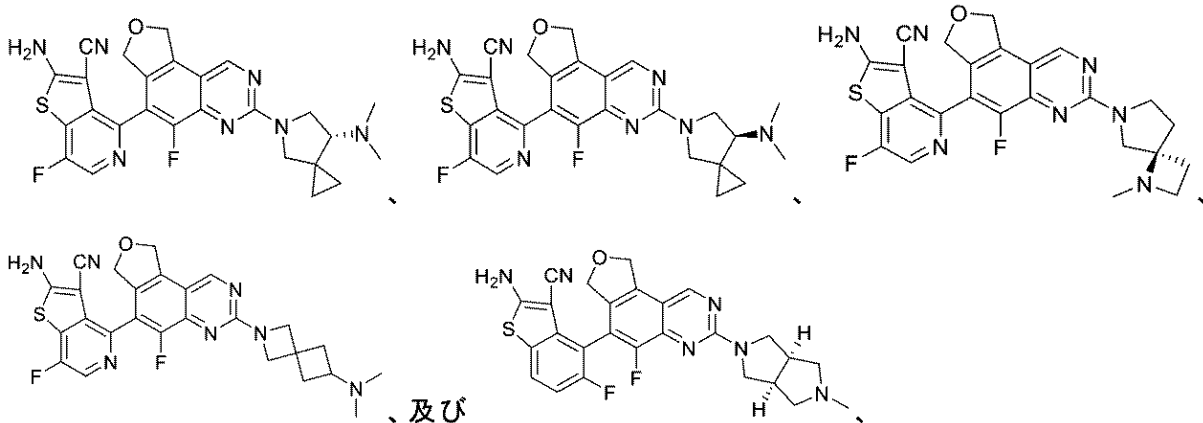
30

40

50

CN1C[C@H]2C[C@@H](C1)N(C)C2c1nc2c(nc3c2c(c4c3O[C@H]5C[C@@H](C4)C[C@H](C5)c6c(c1)nc(F)c6N)F)n(F)c7c(F)c(F)c(F)c7

【化 4 1】



から選択される化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 29】

請求項 1 ~ 28 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される担体、希釈剤、又は賦形剤とを含む、薬学的組成物。

【請求項 30】

請求項 29 に記載の薬学的組成物を含む、がんの患者を治療するための医薬であって、前記がんが、肺がん、膵臓がん、子宮頸がん、食道がん、子宮内膜がん、卵巣がん、胆管がん、及び結腸直腸がんから選択される、医薬。

20

【請求項 31】

請求項 1 ~ 28 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩を含む、がんの患者を治療するための医薬であって、前記がんが、肺がん、膵臓がん、子宮頸がん、食道がん、子宮内膜がん、卵巣がん、胆管がん、及び結腸直腸がんから選択される、医薬。

【請求項 32】

前記患者が、前記化合物又はその薬学的に許容される塩の投与前に K R a s G 1 2 C、G 1 2 D、及び / 又は G 1 2 V 変異体タンパク質を発現する 1 つ以上の細胞を有すると決定されたがんを有する、請求項 31 に記載の医薬。

30

【請求項 33】

1 つ以上の細胞が、K R a s G 1 2 C、G 1 2 D、及び / 又は G 1 2 V 変異体タンパク質を発現する、請求項 31 に記載の医薬。

【請求項 34】

請求項 1 ~ 28 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩を含む、K R a s G 1 2 C、G 1 2 D、及び / 又は G 1 2 V 変異を有するがんを有する患者を治療するための医薬。

【請求項 35】

前記がんが、肺がん、膵臓がん、子宮頸がん、食道がん、子宮内膜がん、変異卵巣がん、胆管がん、及び結腸直腸がんから選択される、請求項 34 に記載の医薬。

40

【請求項 36】

前記患者が、P D - 1 阻害剤、P D - L 1 阻害剤、C D K 4 / C D K 6 阻害剤、E G F R 阻害剤、E R K 阻害剤、オーロラ A 阻害剤、S H P 2 阻害剤、白金剤、及びペメトレキセドのうちの 1 つ以上、又はそれらの薬学的に許容される塩も投与される、請求項 31 に記載の医薬。

【請求項 37】

療法に使用するための、請求項 1 ~ 28 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩を含む、薬学的組成物。

【請求項 38】

がんの治療に使用するための、請求項 1 ~ 28 のいずれか一項に記載の化合物、又はそ

50

の薬学的に許容される塩を含む、薬学的組成物。

【請求項 39】

前記がんが、K R a s G 1 2 C、G 1 2 D、及び / 又は G 1 2 V 変異を有する、請求項 38 に記載の薬学的組成物。

【請求項 40】

前記がんが、肺がん、膵臓がん、子宮頸がん、食道がん、子宮内膜がん、卵巣がん、胆管がん、及び結腸直腸がんから選択される、請求項 38 に記載の薬学的組成物。

【請求項 41】

P D - 1 若しくは P D - L 1 阻害剤、C D K 4 / C D K 6 阻害剤、E G F R 阻害剤、E R K 阻害剤、オーロラ A 阻害剤、S H P 2 阻害剤、白金剤、及びペメトレキセドのうちの 1 つ以上、又はそれらの薬学的に許容される塩と同時に組み合わせて、別個に組み合わせて、又は順次組み合わせてがんの治療に使用するための、請求項 38 に記載の薬学的組成物。

10

20

30

40

50