

【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

30

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

【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】

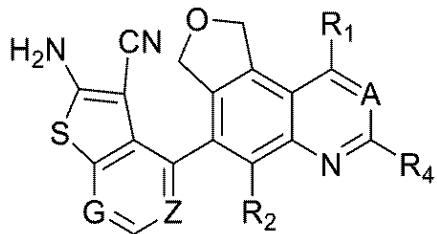
【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の式：

50

## 【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<sub>3c</sub>)-又は-N-であり、

Gが、-C(R<sub>3b</sub>)-又は-N-であり、

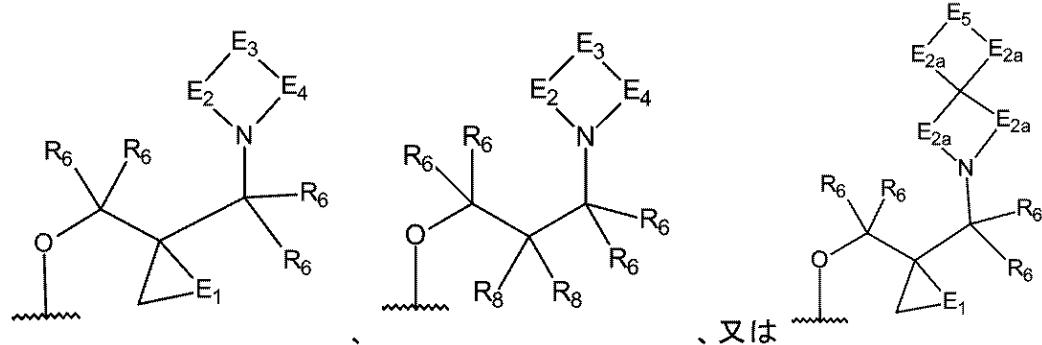
R<sub>1</sub>が、Hであり、

R<sub>2</sub>が、H、ハロゲン、又はメチルであり、

R<sub>3b</sub>、及びR<sub>3c</sub>が各々独立して、H、ハロゲン、又はメチルであり、

R<sub>4</sub>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<sub>4a</sub>及びR<sub>4b</sub>で置換されたアゼチジン、

i i . 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<sub>1~3</sub>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、ヒドロキシリル、-NR<sub>6a</sub>R<sub>6a</sub>、(1-メチルピペリジン-4-イル)オキシ、任意選択的に-NR<sub>6a</sub>R<sub>6a</sub>で置換されたC<sub>1~3</sub>アルコキシ、任意選択的に1つ以上のハロゲン、-NR<sub>6a</sub>R<sub>6a</sub>、若しくはヒドロキシリルで置換されたC<sub>1~3</sub>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<sub>1~3</sub>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、ヒドロキシリル、-CN、C<sub>1~3</sub>アルコキシ、-NR<sub>10</sub>R<sub>10</sub>、シクロプロピル、オキセタン、-CO-C<sub>1~3</sub>アルキル、又はヒドロキシリル、C<sub>1~3</sub>アルコキシ、-NR<sub>10</sub>R<sub>10</sub>、ハロゲン、若しくは-CF<sub>3</sub>で任意選択的に置換されたC<sub>1~3</sub>アルキルで任意選択的に置換され得るもの、又は

i i i . 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

10

20

30

40

50

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 - 1 H - ピロ口 [ 3 , 4 - b ] ピリジン、オクタヒドロ - 1 H - ピロ口 [ 3 , 2 - b ] ピリジン、オクタヒドロ - 6 H - ピロ口 [ 3 , 4 - b ] ピラジン、オクタヒドロピロ口 [ 1 , 2 - a ] ピラジン、オクタヒドロピロ口 [ 3 , 2 - b ] ピロール、オクタヒドロピロ口 [ 3 , 4 - b ] [ 1 , 4 ] オキサジン、オクタヒドロピロ口 [ 3 , 4 - b ] ピロール、オクタヒドロピロ口 [ 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、ヘキサヒドロ - 1 H - フロ [ 3 , 4 - b ] ピロール、オクタヒドロ - 1 H - ピロ口 [ 3 , 2 - b ] ピリジン、( 3 a s , 6 a s ) - テトラヒドロ - 1 H , 4 H - 3 a , 6 a - ( メタノオキシメタノ ) ピロ口 [ 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、- N R 6 a R 6 a 、又は - N R 6 a R 6 a 若しくはヒドロキシル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ているものであり、

R 4 a が、N R 4 c R 4 d 、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、C 1 ~ 3 アルコキシ、又は - N R 6 a R 6 a で任意選択的に置換され、

R 4 b が、H、ヒドロキシル、又は C 1 ~ 3 アルキルであり、

R 4 c が、独立して、シクロプロピル、又はオキセタンであり、

R 4 d が、独立して、C 1 ~ 3 アルキルであり、

各 R 6 a が、独立して、H 又は重水素であり、

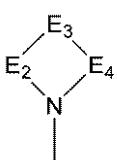
各 R 6 a が、独立して、H、トリジュウテロメチル、C 3 ~ 5 シクロアルキル、N - メチルピロリジン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、ビシクロ [ 1 . 1 . 1 ] ペンタン - 1 - イル、ビシクロ [ 1 . 1 . 1 ] ペンタン - 1 - オール、又は 1 つ以上の重水素、ヒドロキシル、メチル、メトキシ、ハロゲン、シクロプロピル、オキセタン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、- C O - N H M e 、若しくは - C O - N H 2 で任意選択的に置換された C 1 ~ 3 アルキルであり、前記 C 3 ~ 5 シクロアルキルが、1 つ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、

E 1 が、- O - C 1 ~ 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 C 1 ~ 3 アルキレンであり、

E 2 、及び E 4 が、各々独立して、1 つ以上のヒドロキシル、C 1 ~ 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 C 1 ~ 3 アルキレンであり、E 2 及び E 4 が、結合若しくは C 1 ~ 3 アルキレンによって任意選択的に架橋することができ、E 3 が、- O - 、- C R 7 R 7 - 、- N R 9 - 、若しくは、- C O - N R 6 a - であるか、又は

前記環

【化 3 】



が、ヘキサヒドロ - 1 H - フロ [ 3 , 4 - c ] ピロールであり、

各 E 2 a 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 C 1 ~ 3 ア

10

20

30

40

50

ルキレンであり、

$E_5$  が、 - O - 、 - C R<sub>7</sub> R<sub>7</sub> - 、又は - N R<sub>9</sub> - であり、

各 R<sub>7</sub> が、独立して、H、ハロゲン、CN、ヒドロキシル、C<sub>1</sub>~<sub>3</sub>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<sub>1</sub>~<sub>3</sub>アルキルであり、

各 R<sub>8</sub> が、独立して、C<sub>1</sub>~<sub>3</sub>アルキルであり、

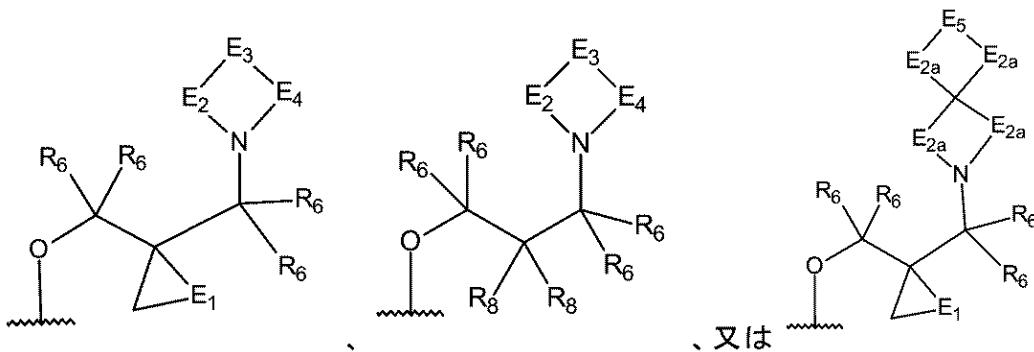
R<sub>9</sub> が、各々独立して、H、任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>~<sub>3</sub>アルキル又は-CO-C<sub>1</sub>~<sub>3</sub>アルキルであり、前記任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>~<sub>3</sub>アルキルが、1つ以上のハロゲンで任意選択的に置換され、

R<sub>10</sub> 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<sub>1</sub>~<sub>3</sub>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<sub>4</sub> が、N結合型環状アミン又は以下の式：

### 【化4】



の基であり、

前記N結合型環状アミンが、N結合型の、

i . R<sub>4a</sub> 及び R<sub>4b</sub> で置換されたアゼチジン、

i i . 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<sub>1</sub>~<sub>3</sub>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<sub>1</sub>~<sub>3</sub>アルコキシ、-NR<sub>6a</sub>R<sub>6a</sub>、アゼチジン、ピペラジン、モルホリン、C<sub>1</sub>~<sub>3</sub>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<sub>1</sub>~<sub>3</sub>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<sub>1</sub>~<sub>3</sub>アルキルが、1つ以上のハロゲン、-NR<sub>6a</sub>R<sub>6a</sub>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

i i i . 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 - 1 H - ピロロ [ 3 , 4 - b ] ピリジン、オクタヒドロ - 1 H - ピロロ [ 3 , 2 - b ] ピリジン、オクタヒドロ - 6 H - 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 . 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

10

20

30

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<sub>6a</sub>R<sub>6a</sub>若しくは-NR<sub>6a</sub>R<sub>6a</sub>で任意選択的に置換されたC<sub>1~3</sub>アルキルで任意選択的に置換されているものであり、

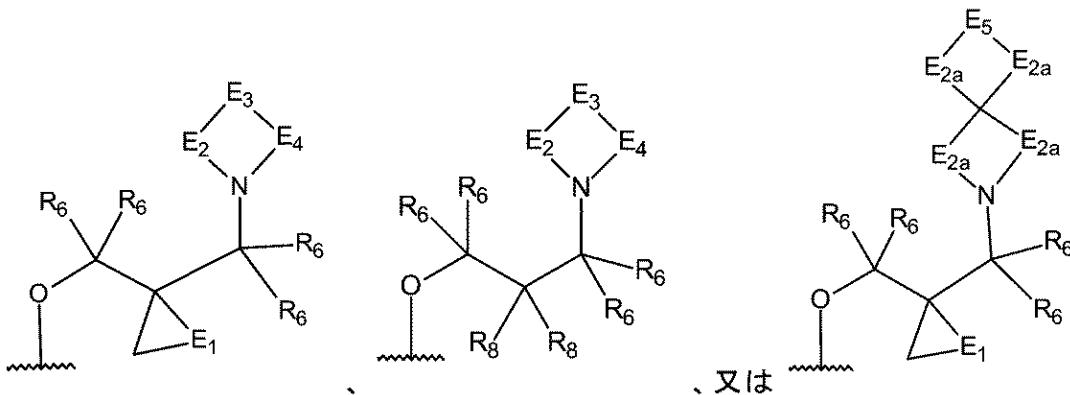
R<sub>4a</sub>が、NR<sub>4c</sub>R<sub>4d</sub>、シクロプロピル、アゼチジン、ピロリジン、ピペリジン、モルホリン又はイミダゾールであり、前記シクロプロピル、アゼチジン、ピロリジン、ピペリジン、又はモルホリンが、ハロゲン、ヒドロキシル、C<sub>1~3</sub>アルコキシ又は-NR<sub>6a</sub>R<sub>6a</sub>で任意選択的に置換され、

各R<sub>6a</sub>が、独立して、H、トリジュウテロメチル、C<sub>3~5</sub>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、ビシクロ[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-CO-NH<sub>2</sub>で任意選択的に置換されたC<sub>1~3</sub>アルキルであり、前記C<sub>3~5</sub>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<sub>4</sub>が、N結合型環状アミン又は以下の式：

### 【化5】



の基であり、

前記N結合型環状アミンが、N結合型の、

i . R<sub>4a</sub>及びR<sub>4b</sub>で置換されたアゼチジン、

i i . 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<sub>1~3</sub>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<sub>1~3</sub>アルコキシ、-NR<sub>6a</sub>R<sub>6a</sub>、アゼチジン、C<sub>1~3</sub>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<sub>1~3</sub>アルコキシで任意選択的に置換され、前記C<sub>1~3</sub>アルキルが、ハロゲン-NR<sub>6a</sub>R<sub>6a</sub>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

i i i . 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 - 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、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、テトラヒドロフロロ[3 , 4 - d]オキサゾール-2(3H)-オノン、(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

10

20

30

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<sub>6a</sub>R<sub>6a</sub>若しくは-NR<sub>6a</sub>R<sub>6a</sub>で任意選択的に置換されたC<sub>1~3</sub>アルキルで任意選択的に置換されているものであり、

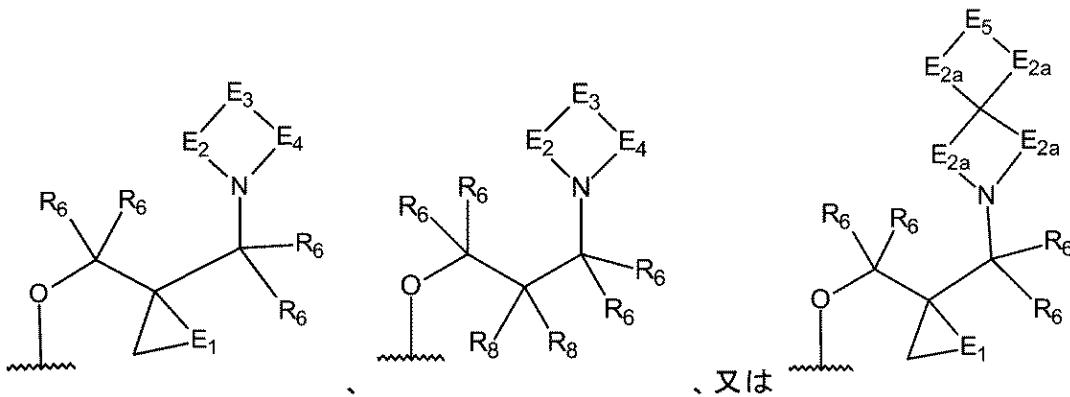
R<sub>4a</sub>が、NR<sub>4c</sub>R<sub>4d</sub>、シクロプロピル、アゼチジン、ピロリジン、ピペリジン、モルホリン、又はイミダゾールであり、前記シクロプロピル、アゼチジン、ピロリジン、ピペリジン、又はモルホリンが、ハロゲン、ヒドロキシリル、C<sub>1~3</sub>アルコキシ、又は-NR<sub>6a</sub>R<sub>6a</sub>で任意選択的に置換され、各R<sub>6a</sub>が、独立して、H、トリジュウテロメチル、C<sub>3~5</sub>シクロアルキル、又はヒドロキシリルで任意選択的に置換されたC<sub>1~3</sub>アルキルである、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】

10

R<sub>3b</sub>、及びR<sub>3c</sub>が、各々独立して、H又はハロゲンであり、R<sub>4</sub>が、N結合型環状アミン又は以下の式：

【化6】



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<sub>4a</sub>及びR<sub>4b</sub>で置換されたアゼチジン、

i i . 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<sub>1~3</sub>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、ヒドロキシリル、-NR<sub>6a</sub>R<sub>6a</sub>、イミダゾール若しくはC<sub>1~3</sub>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<sub>1~3</sub>アルキルが、-NR<sub>6a</sub>R<sub>6a</sub>若しくはヒドロキシリルで任意選択的に置換されているもの、又は

30

i i i . オクタヒドロピロ口[1,2-a]ピラジン、オクタヒドロピロ口[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<sub>1~3</sub>アルキルで任意選択的に置換されているもの、であり、

40

R<sub>4a</sub>が、NR<sub>4c</sub>R<sub>4d</sub>、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<sub>6a</sub>R<sub>6a</sub>で任意選択的に置換され、

40

R<sub>4b</sub>が、H、又はC<sub>1~3</sub>アルキルであり、

各R<sub>6a</sub>が、独立して、H又はC<sub>1~3</sub>アルキルであり、

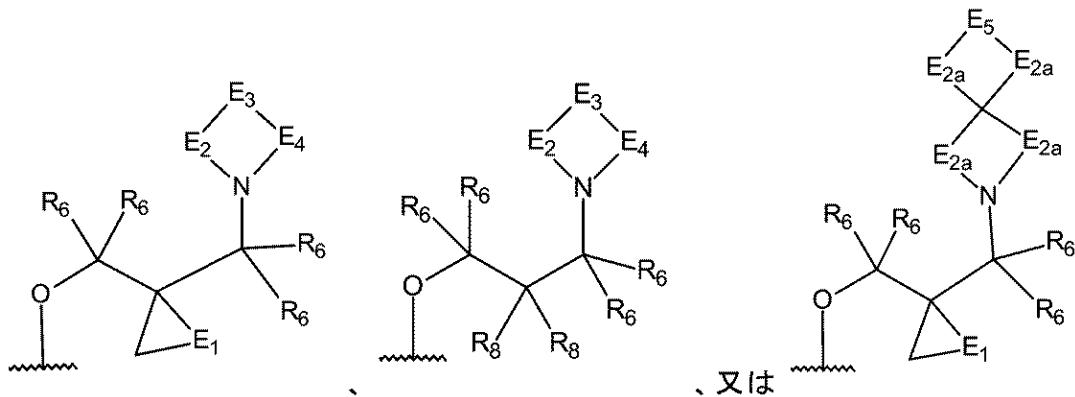
E<sub>2</sub>、及びE<sub>4</sub>が、各々独立して、1つ以上のヒドロキシリル又はハロゲンで任意選択的に置換されたC<sub>1~3</sub>アルキレンであり、E<sub>2</sub>及びE<sub>4</sub>が、結合又はC<sub>1~3</sub>アルキレンによって任意選択的に架橋されることができ、E<sub>3</sub>は、-O-、-CR<sub>7</sub>R<sub>7</sub>-、-NR<sub>9</sub>-、又は-CO-NR<sub>6a</sub>-である、請求項1に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項5】

R<sub>3b</sub>、及びR<sub>3c</sub>が、各々独立して、H又はハロゲンであり、R<sub>4</sub>が、以下の式：

50

## 【化7】



10

の基であり、

E<sub>1</sub>が、1つ以上のハロゲンで任意選択的に置換されたC<sub>1～3</sub>アルキレンであり、E<sub>2</sub>、及びE<sub>4</sub>が、各々独立して、1つ以上のヒドロキシリルで任意選択的に置換されたC<sub>1～3</sub>アルキレンであり、E<sub>2</sub>及びE<sub>4</sub>が、結合又はC<sub>1～3</sub>アルキレンによって任意選択的に架橋することができ、

E<sub>3</sub>が、-O-、-CR<sub>7</sub>R<sub>7</sub>-、-NR<sub>9</sub>-、又は-CO-NR<sub>6a</sub>-であり、各R<sub>6a</sub>が、独立して、H又はC<sub>1～3</sub>アルキルであり、各R<sub>7</sub>が、独立して、H、ハロゲン、ヒドロキシリル、C<sub>1～3</sub>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リルで任意選択的に置換されたC<sub>1～3</sub>アルキルであり、R<sub>9</sub>が、各々独立して、H、C<sub>1～3</sub>アルキル又は-CO-C<sub>1～3</sub>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<sub>3b</sub>)-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<sub>3b</sub>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<sub>3c</sub>)-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<sub>3c</sub>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。

40

## 【請求項12】

R<sub>3b</sub>、及びR<sub>3c</sub>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。

## 【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】

R<sub>2</sub>が、F又はC<sub>1</sub>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<sub>2</sub> 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。

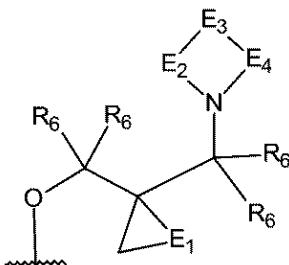
【請求項 17】

R<sub>2</sub> が、C<sub>1</sub> 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<sub>4</sub> が、

【化 8】



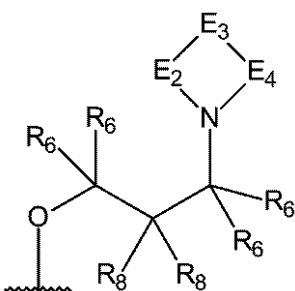
10

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<sub>4</sub> が、

【化 9】



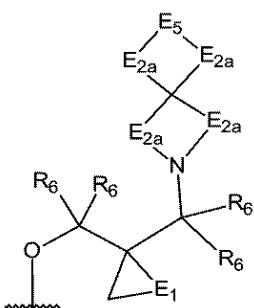
20

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<sub>4</sub> が、

【化 10】



30

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<sub>6</sub> 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<sub>4</sub> 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。

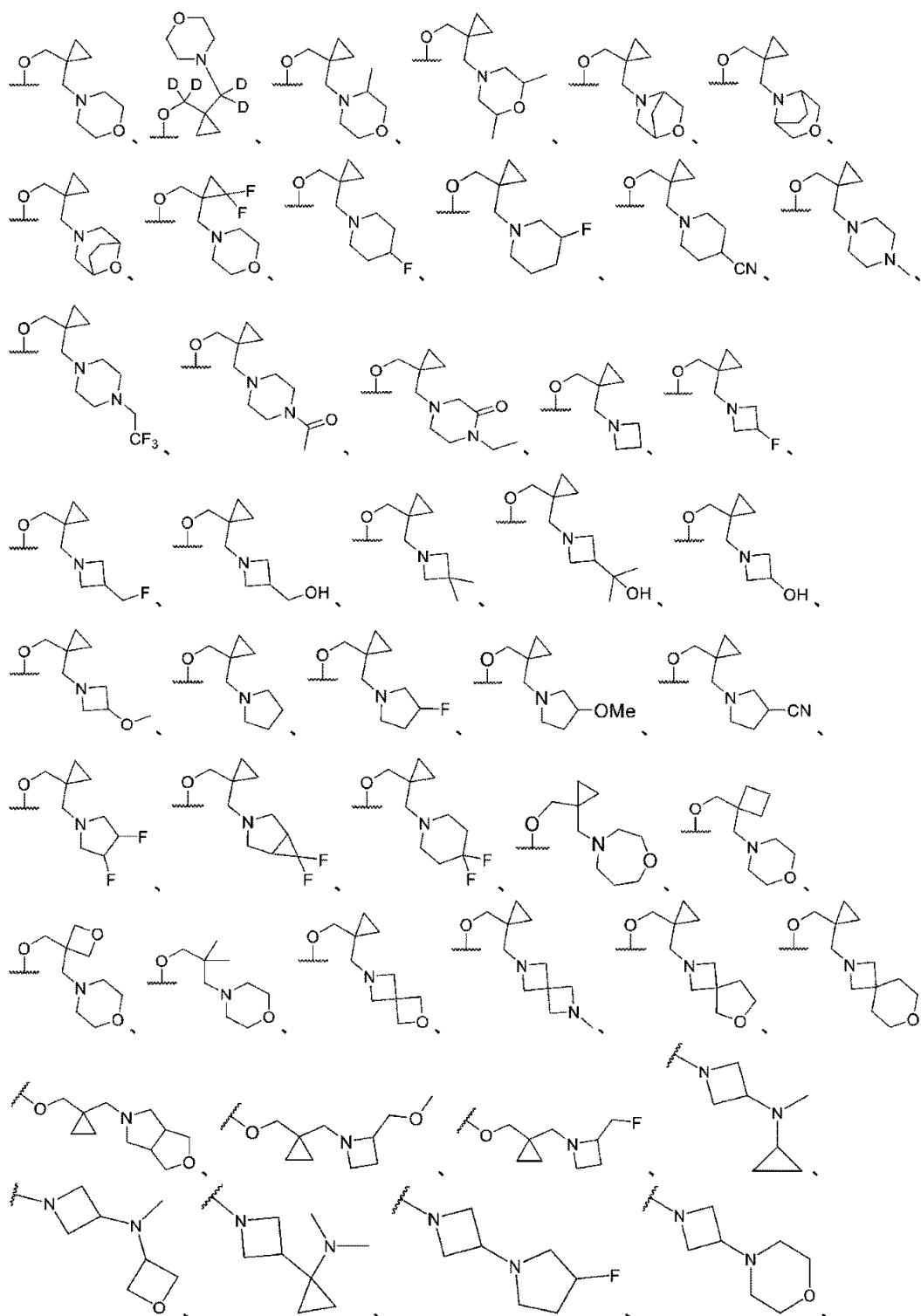
【請求項 23】

R<sub>4</sub> が、

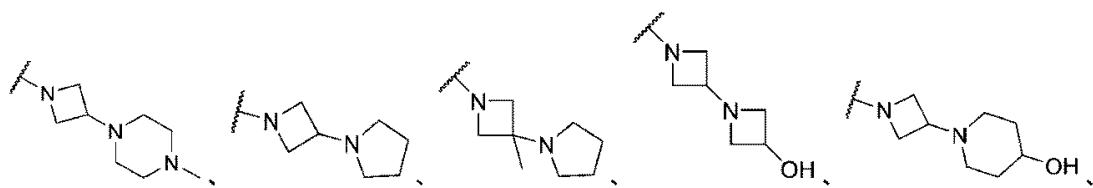
40

50

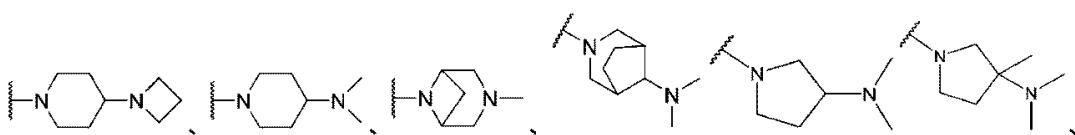
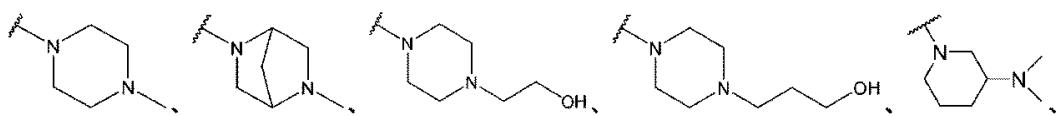
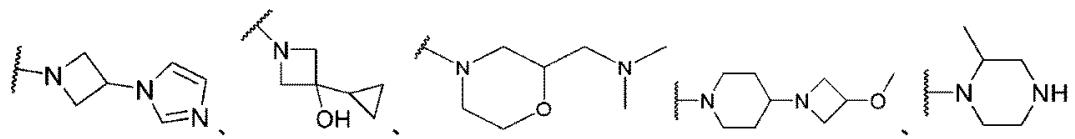
【化 11】



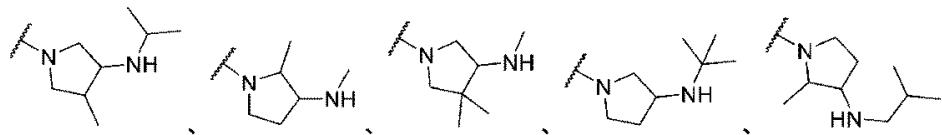
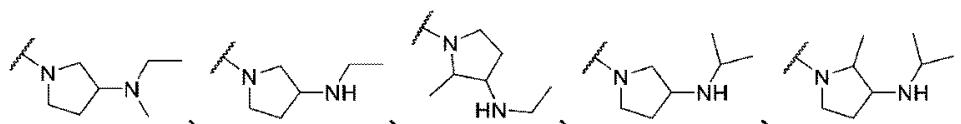
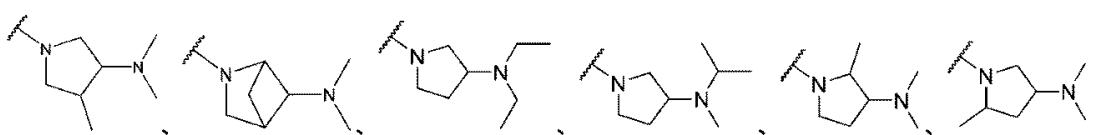
【化 1 2】



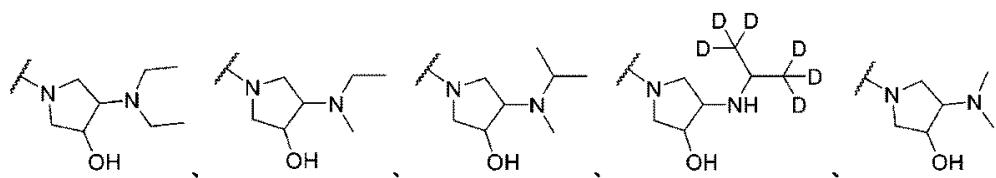
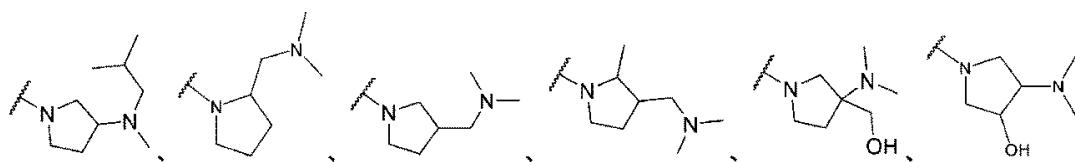
10



20

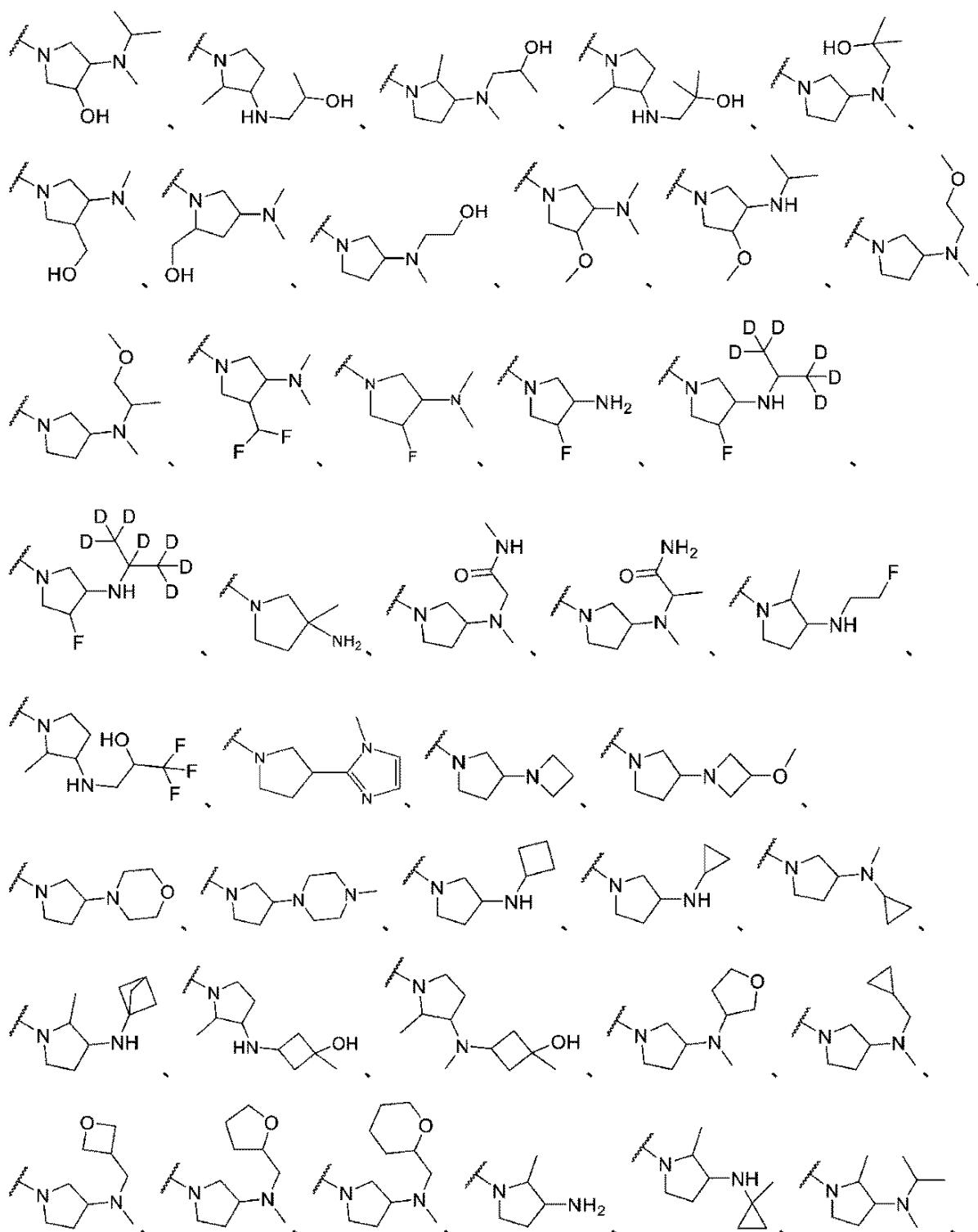


30

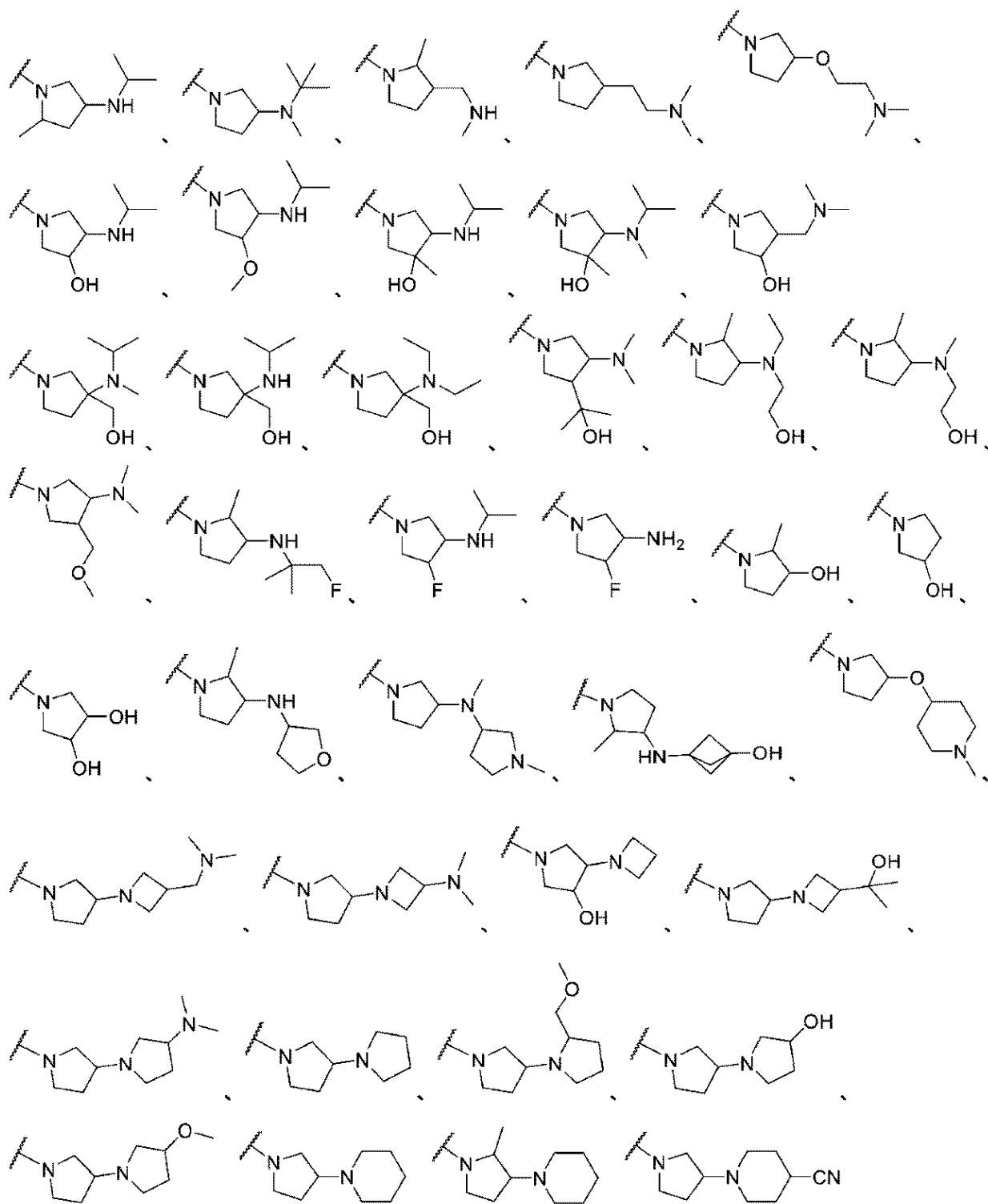


40

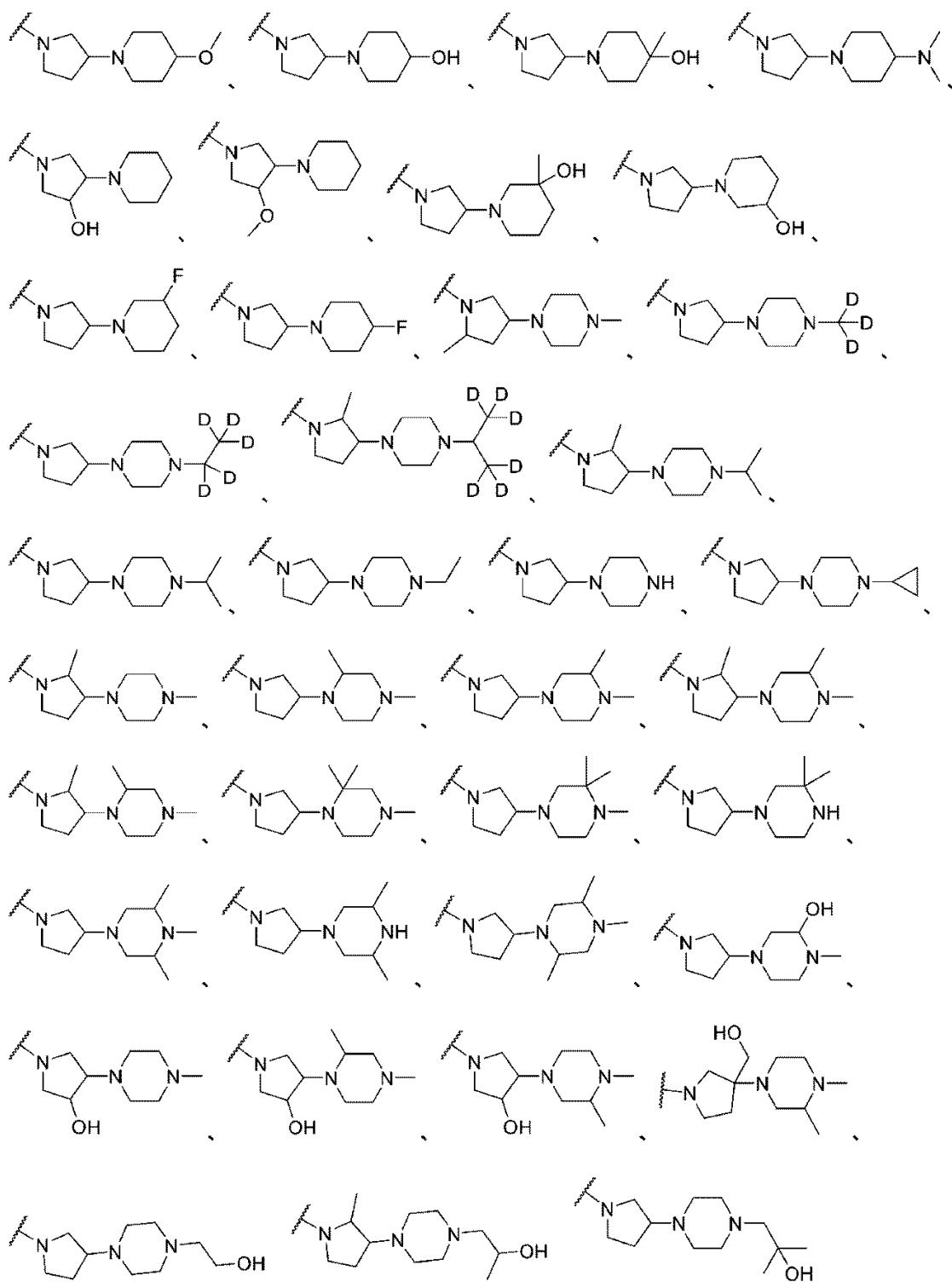
【化 13】



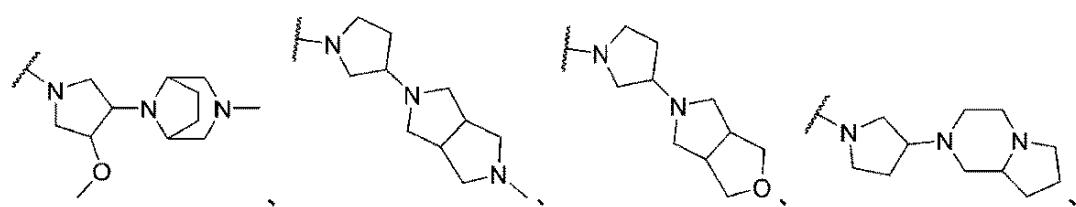
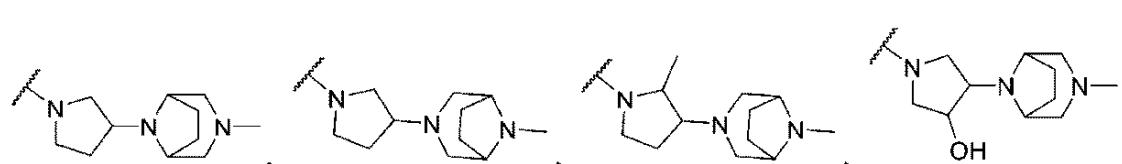
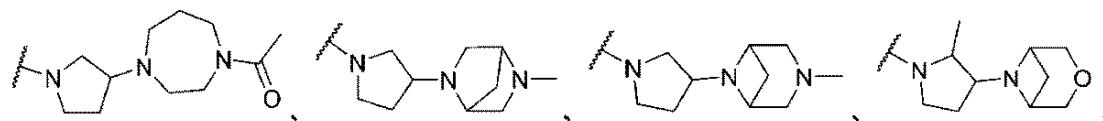
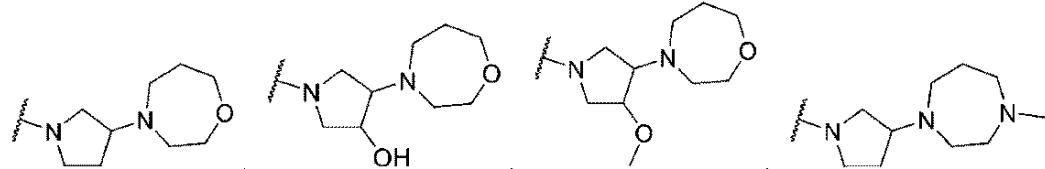
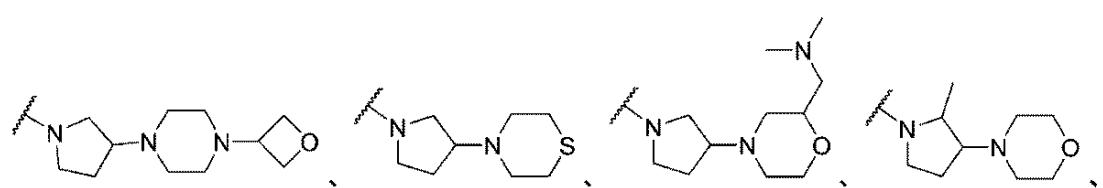
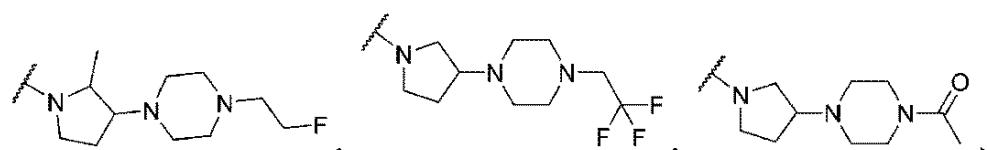
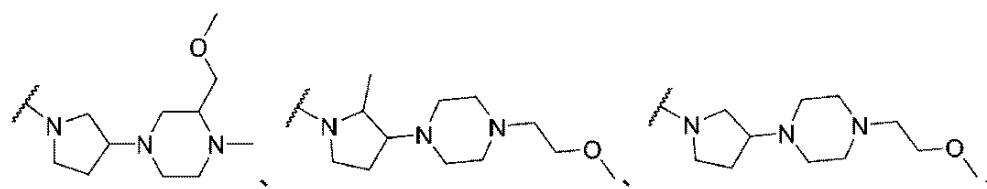
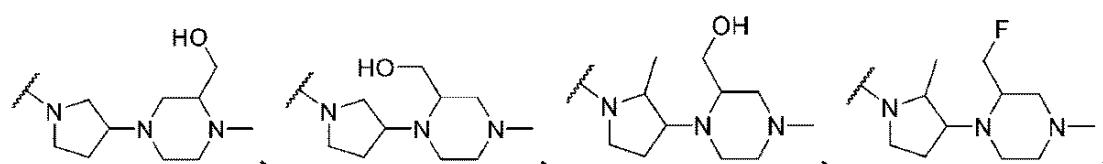
【化 14】



【化 15】



【化 16】



10

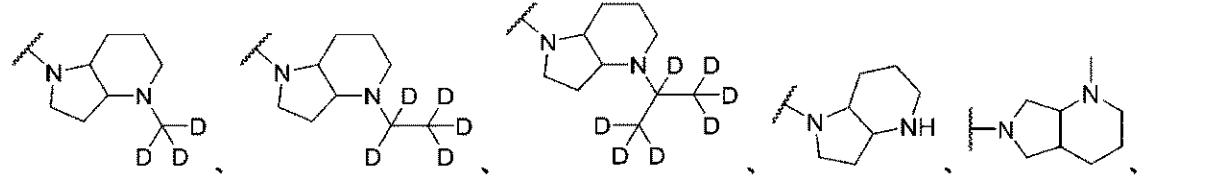
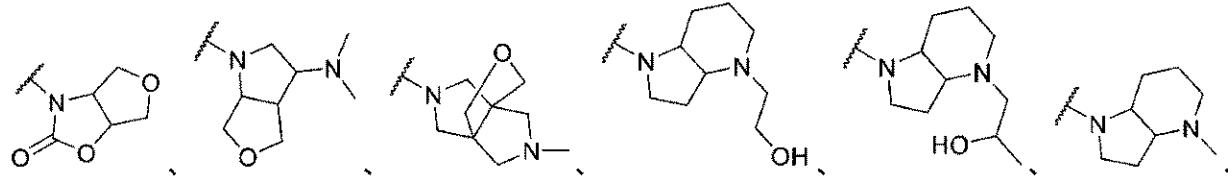
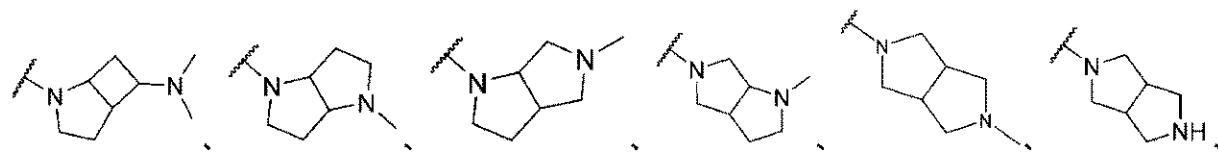
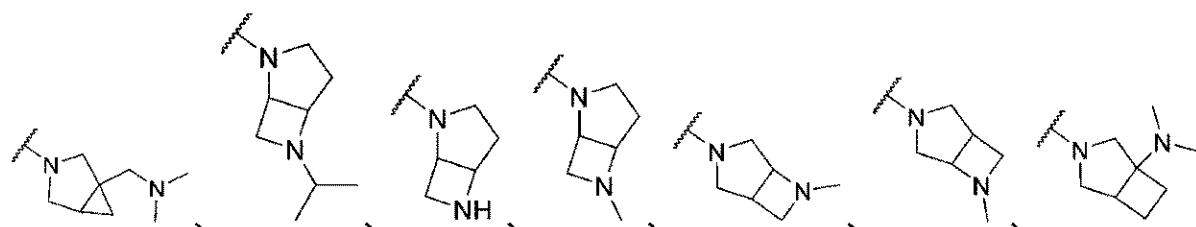
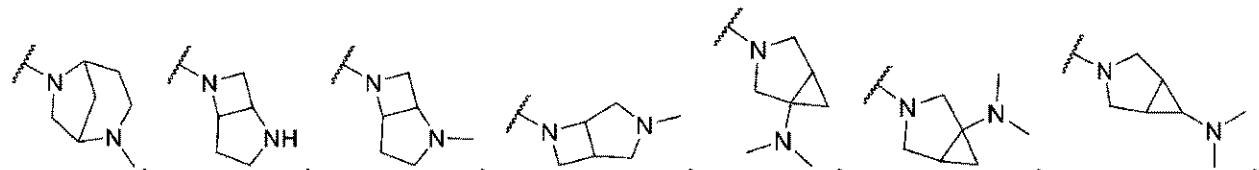
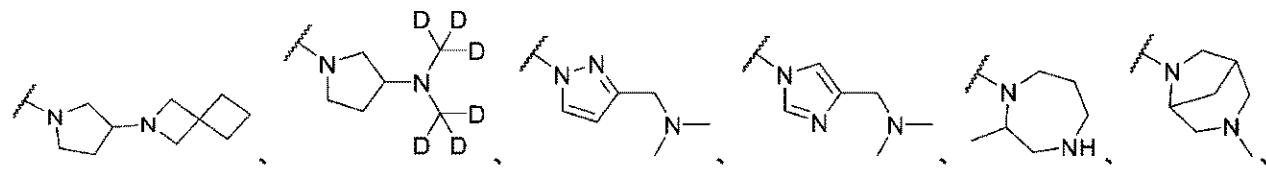
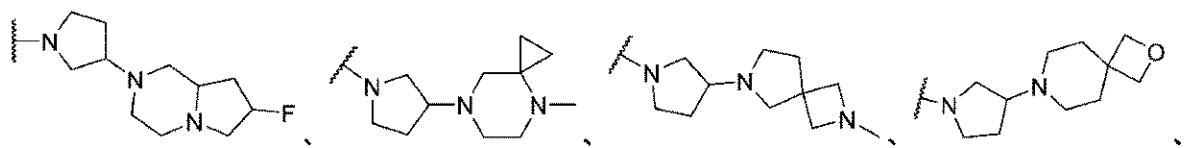
20

30

40

50

【化 17】



10

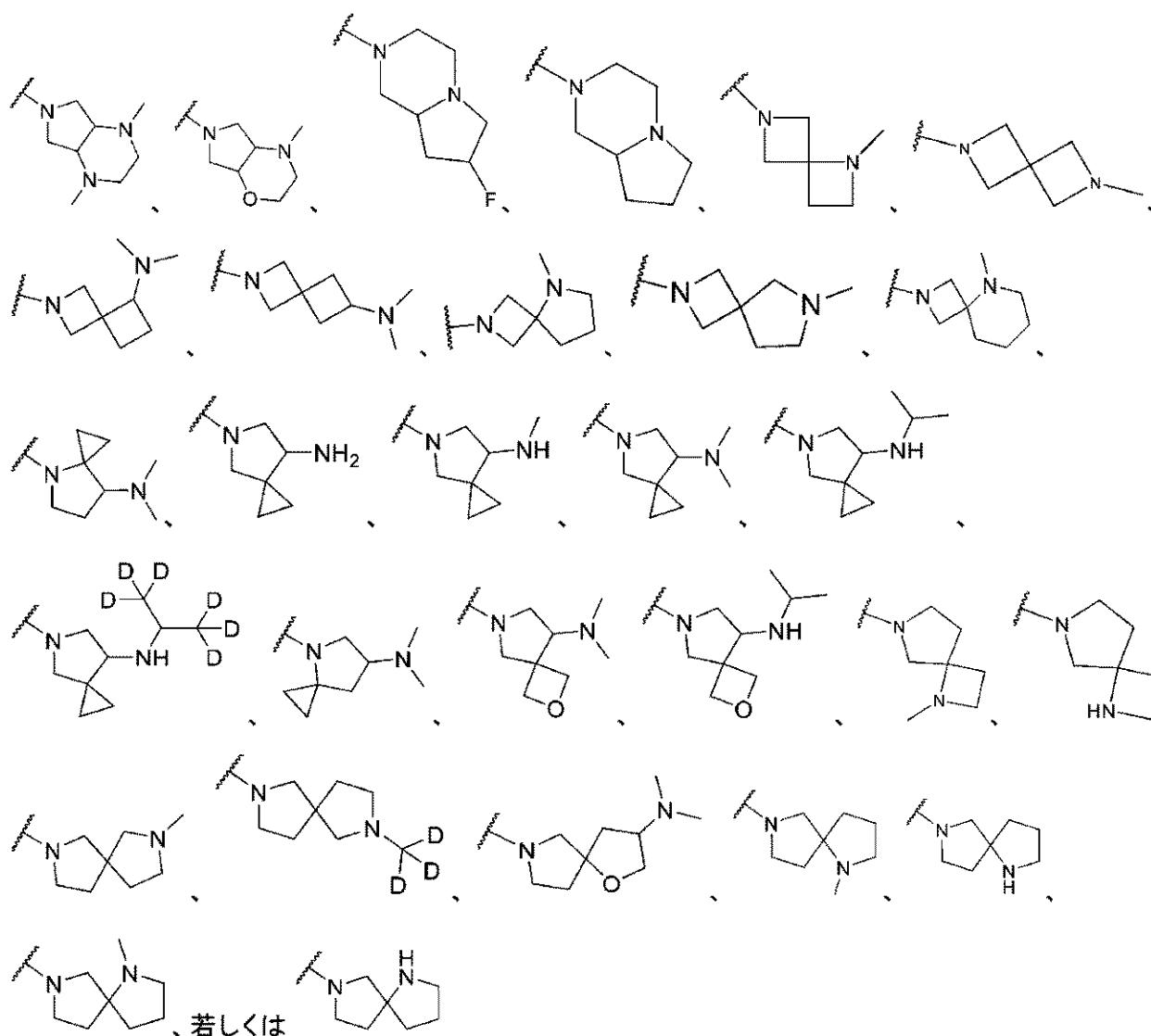
20

30

40

50

【化 18】



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 24】

R<sub>4</sub> が、

10

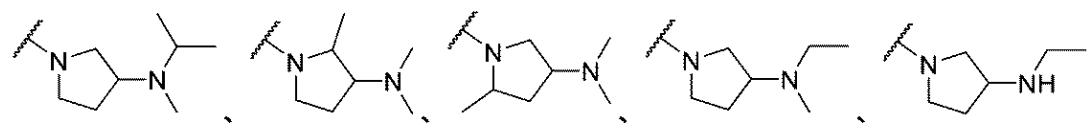
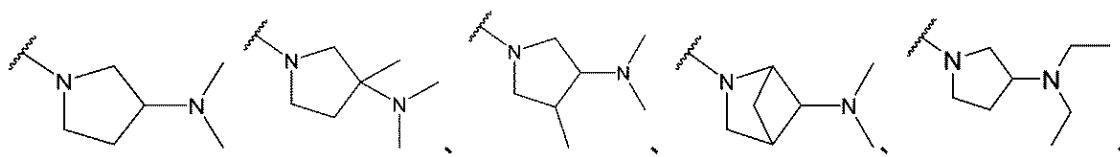
20

30

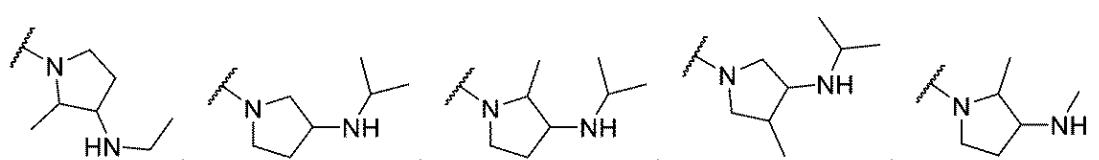
40

50

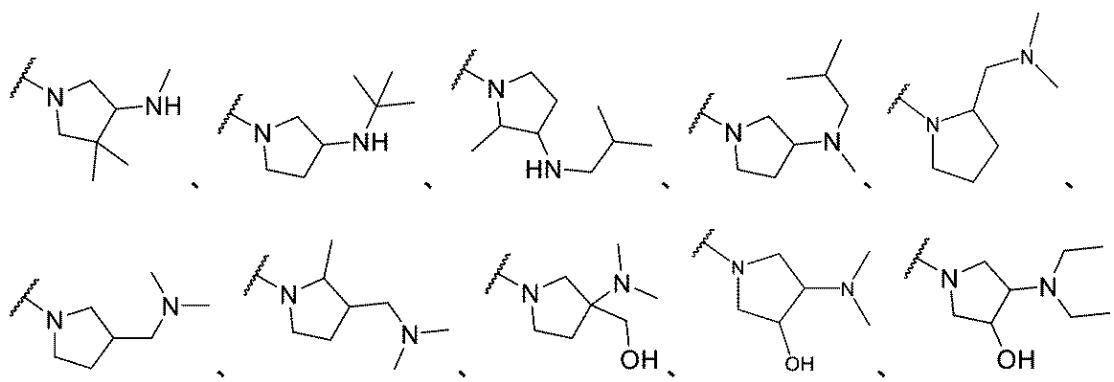
【化 19】



10



20

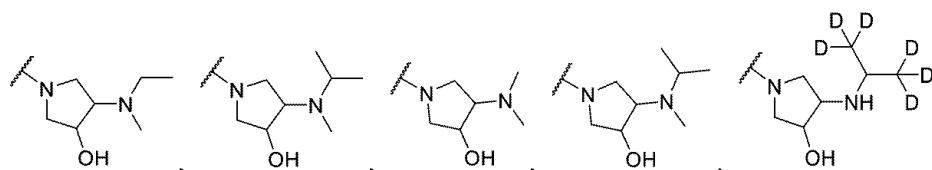


30

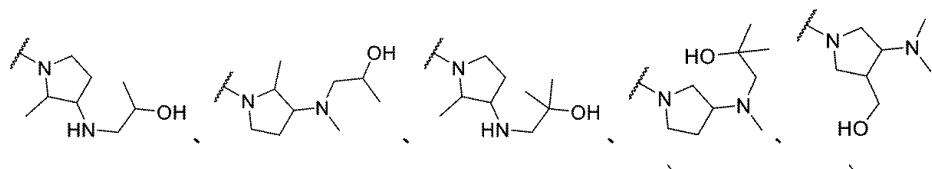
40

50

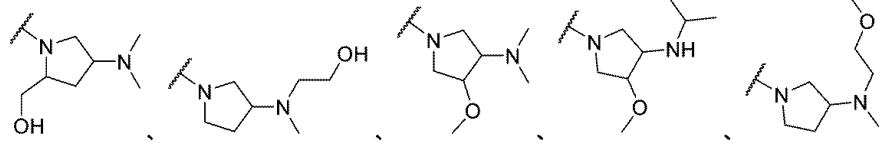
【化 2 0】



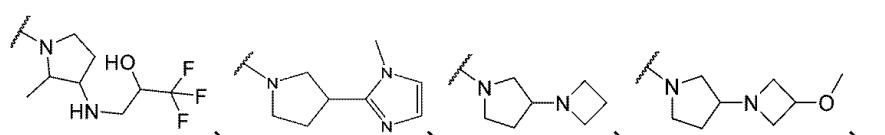
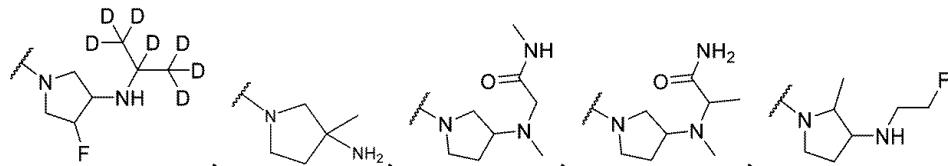
10



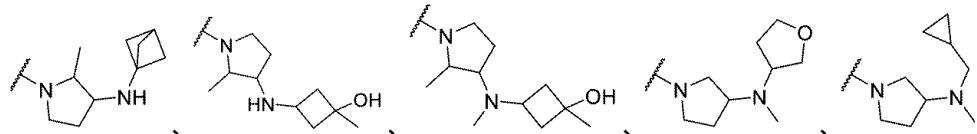
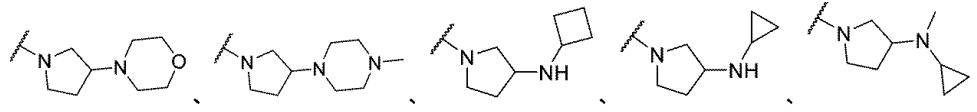
10



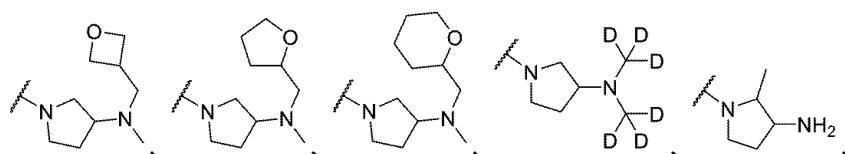
20



30

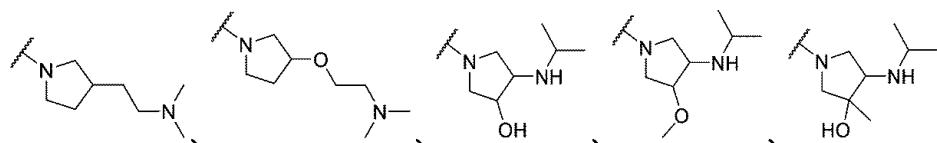
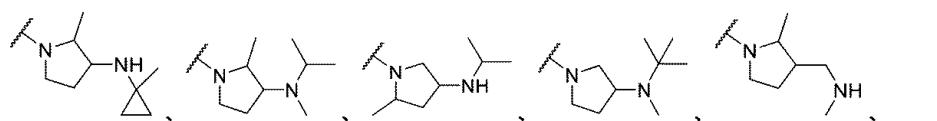


40

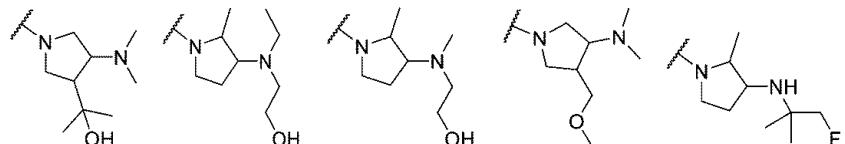
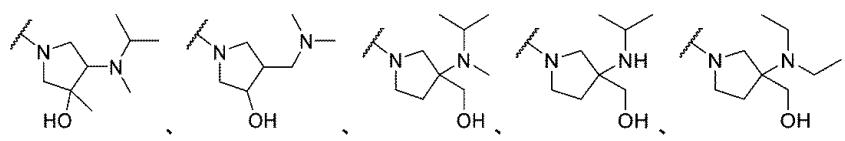


50

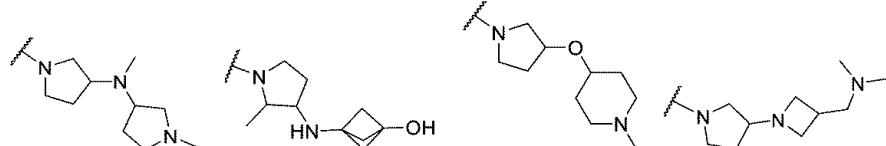
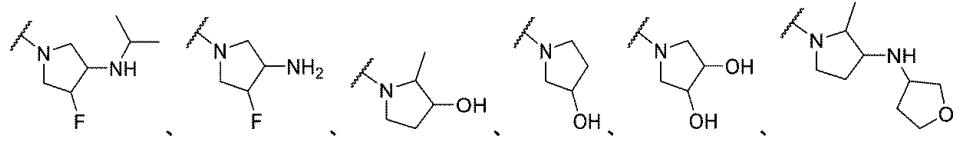
【化 2 1】



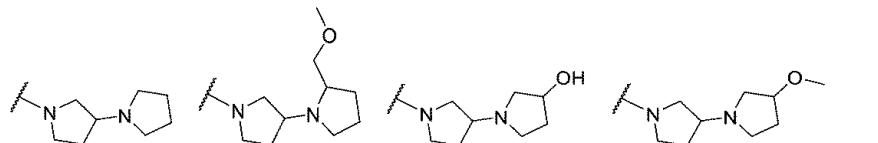
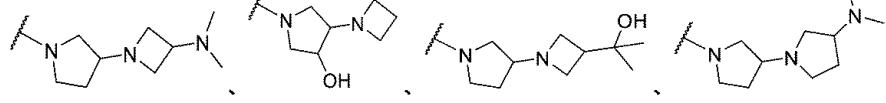
10



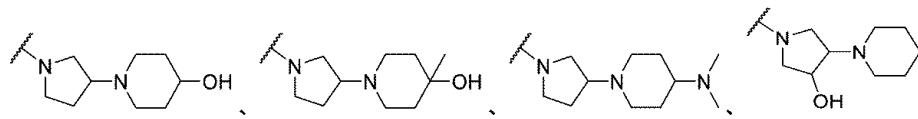
20



30

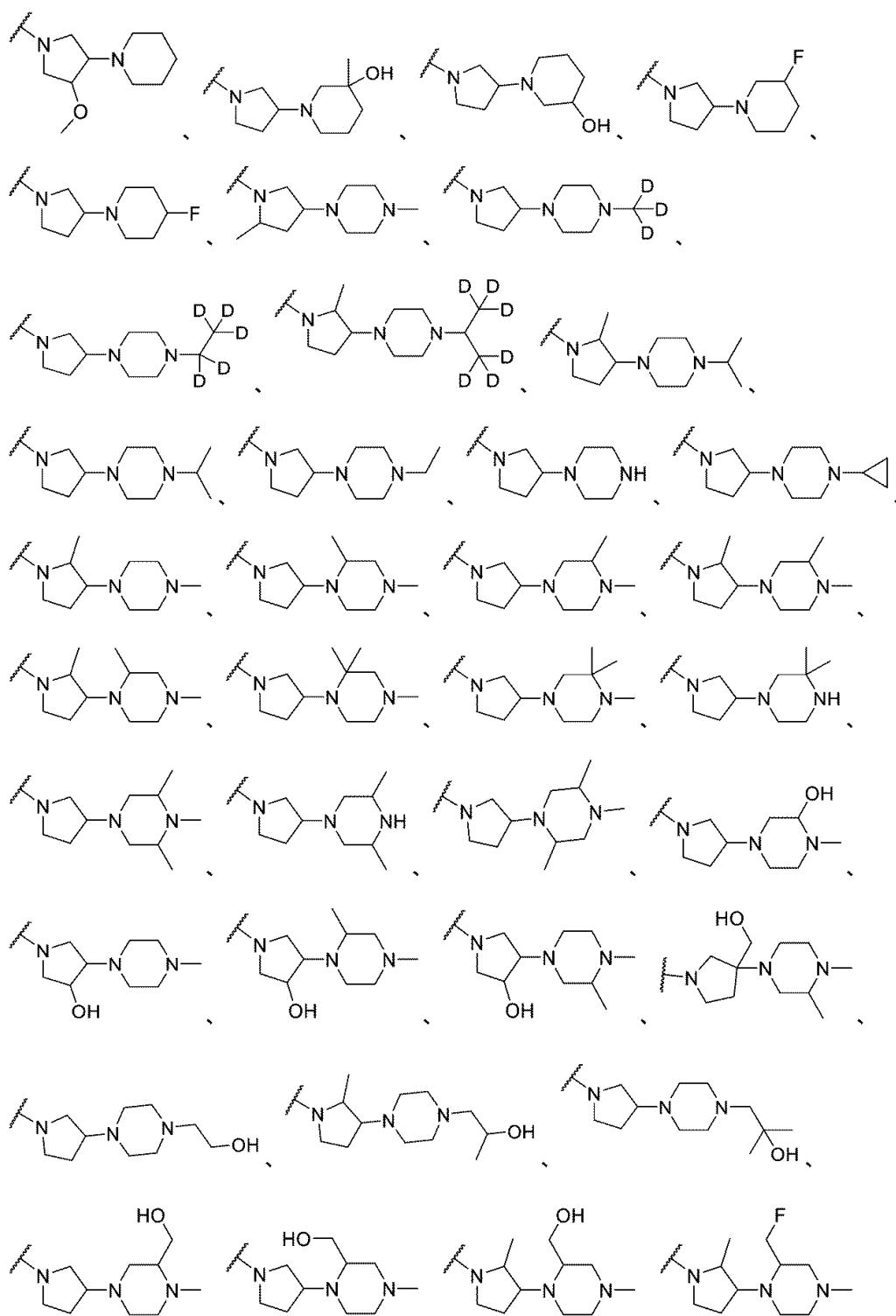


40

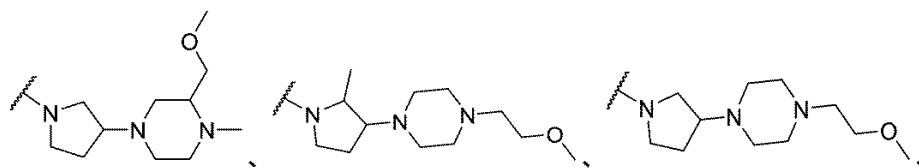


50

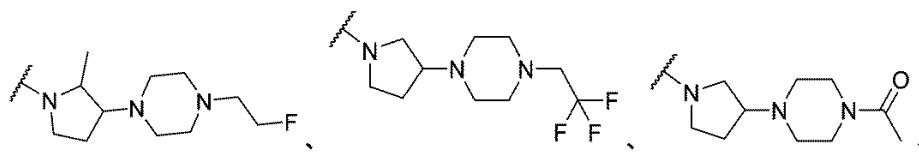
## 【化 2 2】



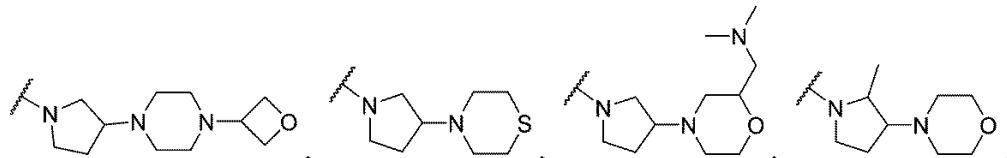
【化 2 3】



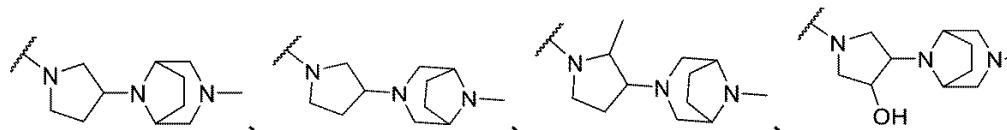
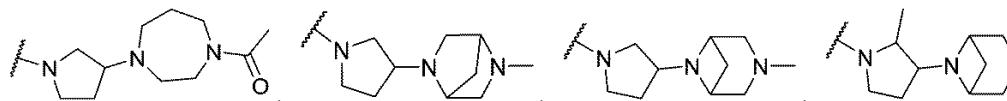
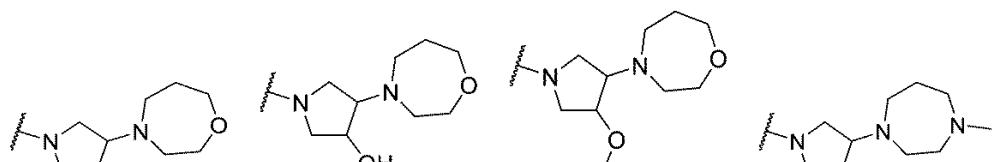
10



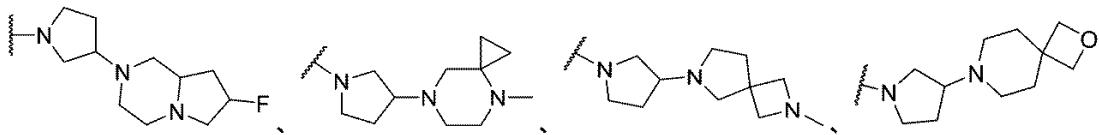
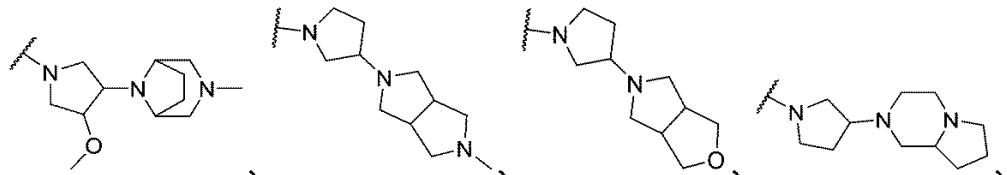
10



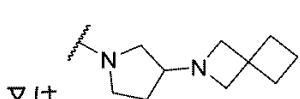
20



30



40



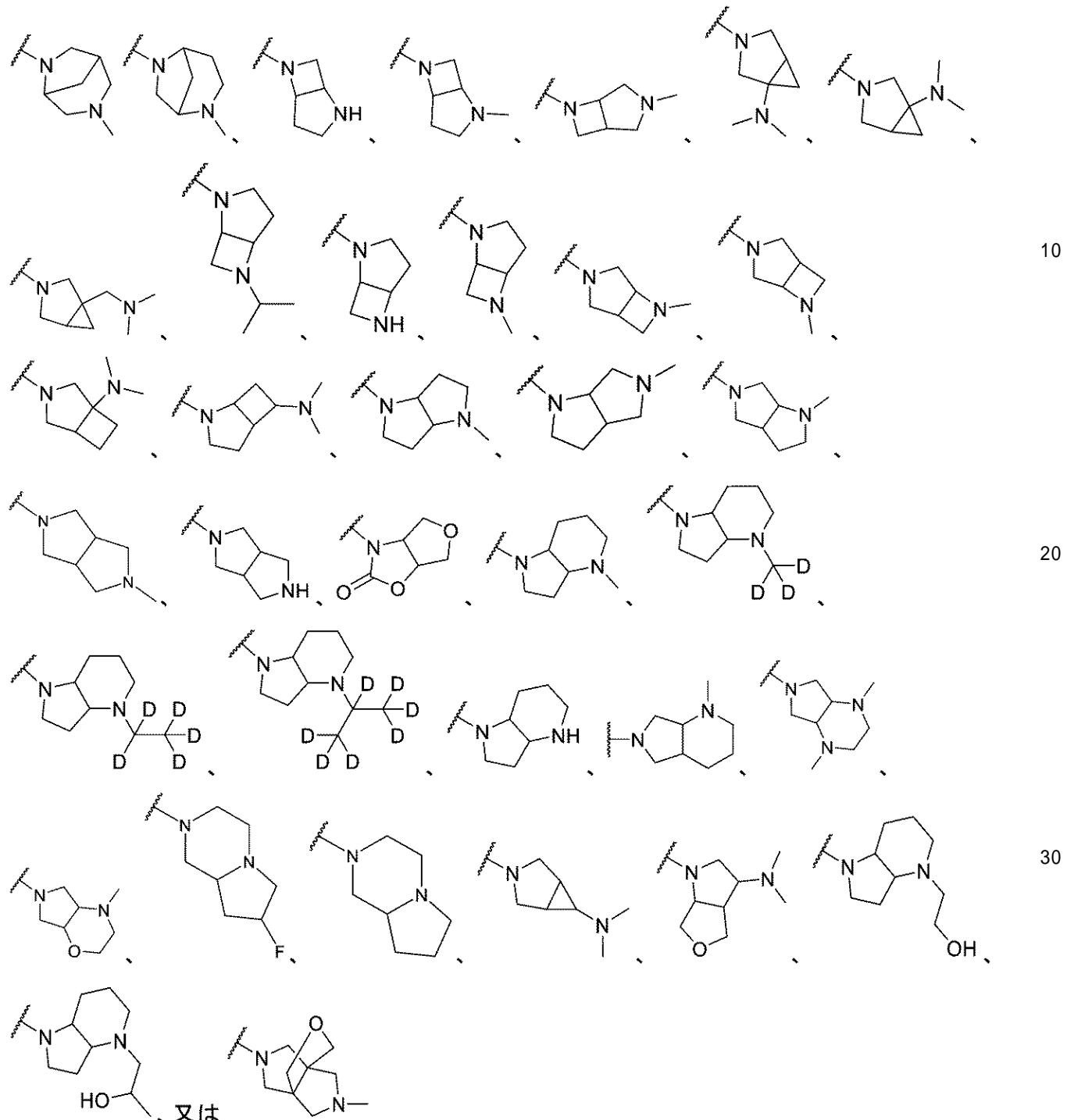
から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 2 5】

R<sub>4</sub> が、

50

【化 2 4】

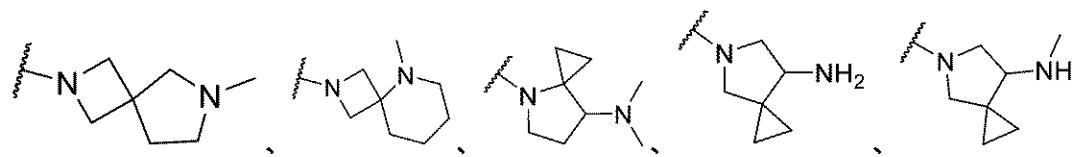
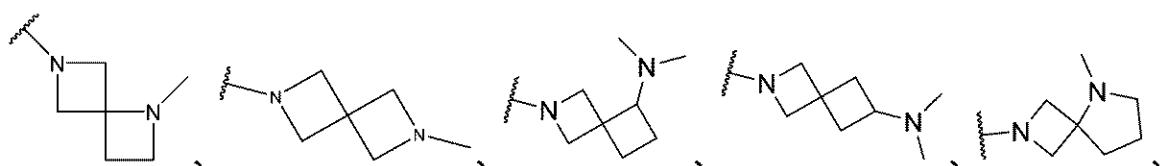


から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

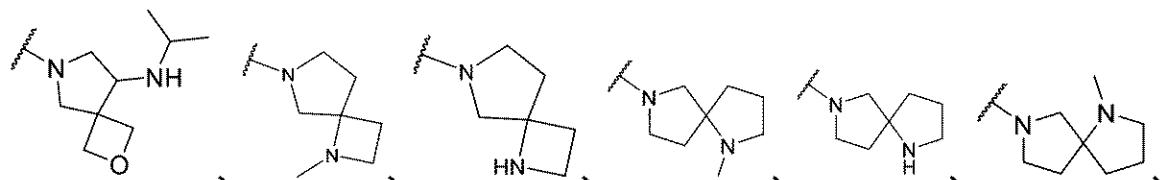
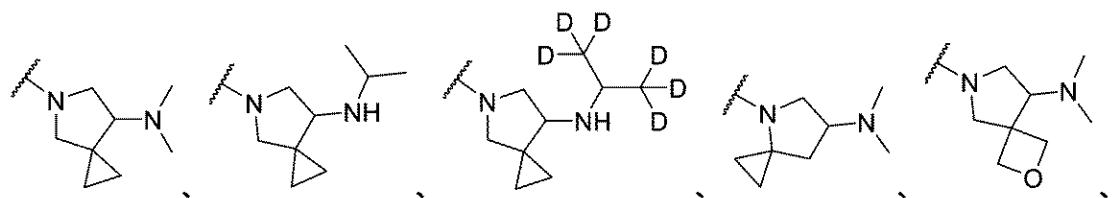
【請求項 2 6】

R<sub>4</sub> が、

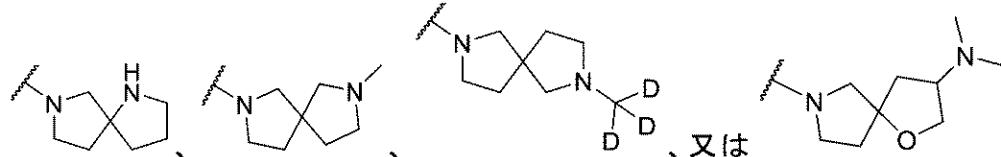
【化 2 5】



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 27】

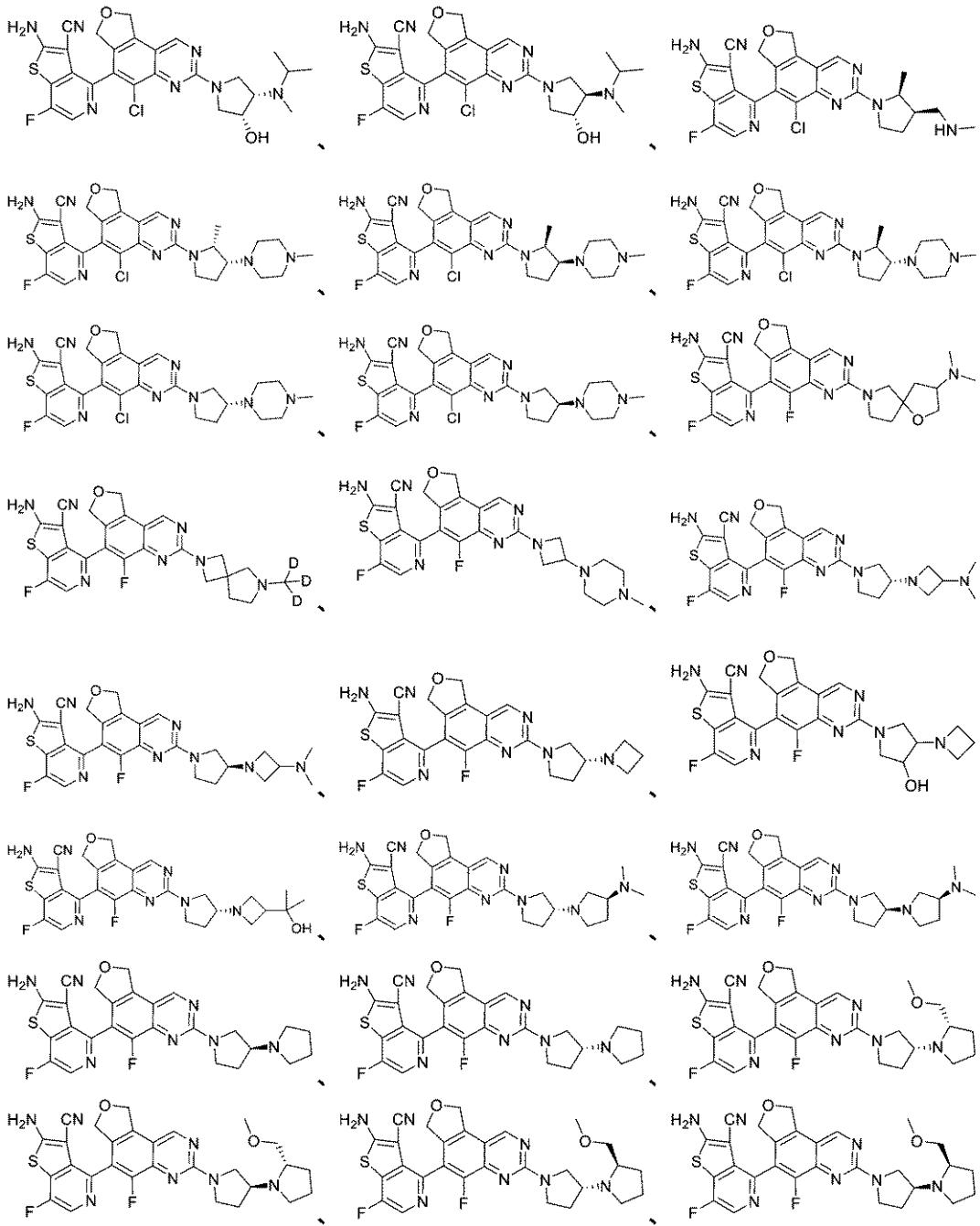
請求項 1 に記載の化合物であって、

30

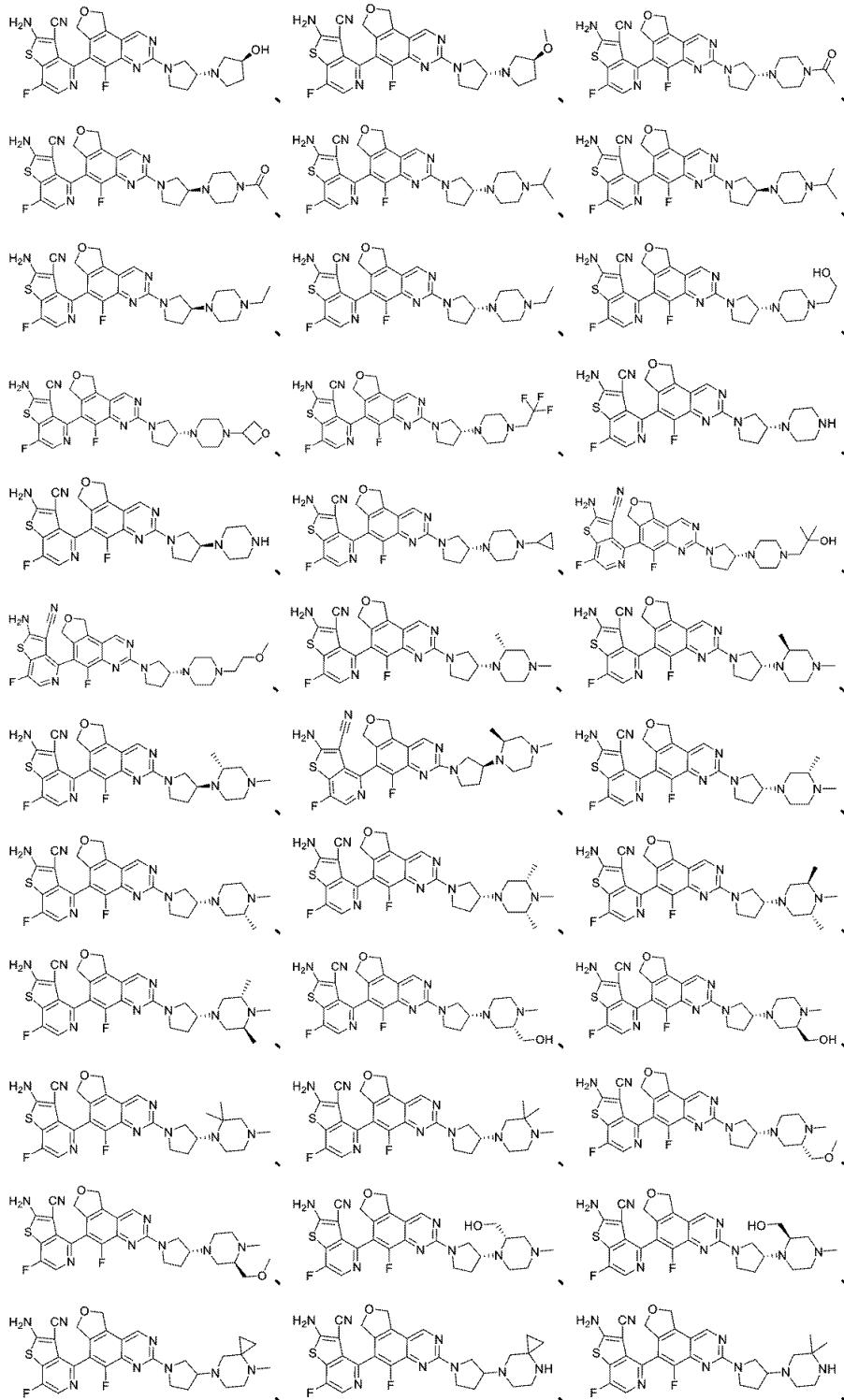
40

50

## 【化 2 6】



## 【化 27】



10

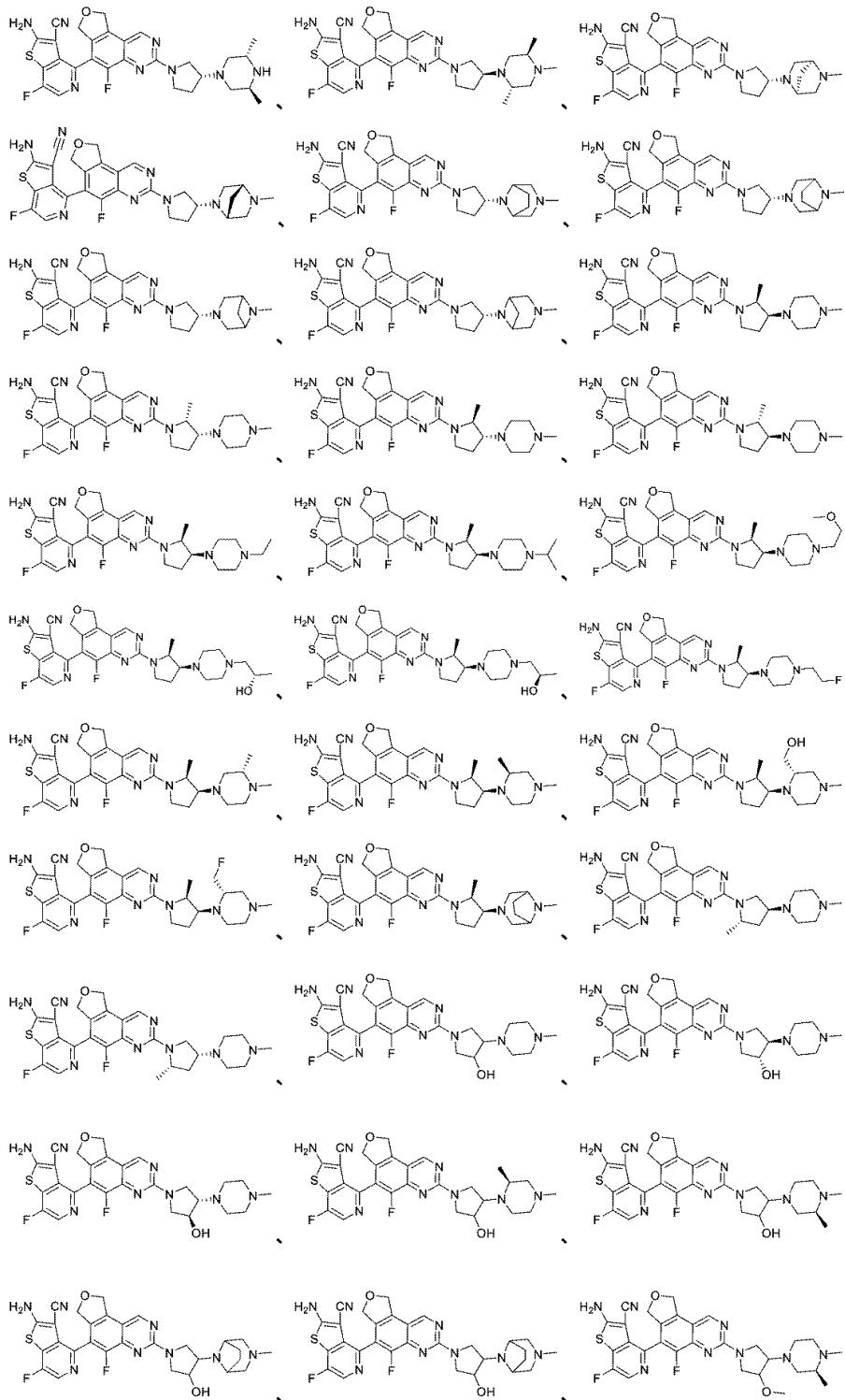
20

30

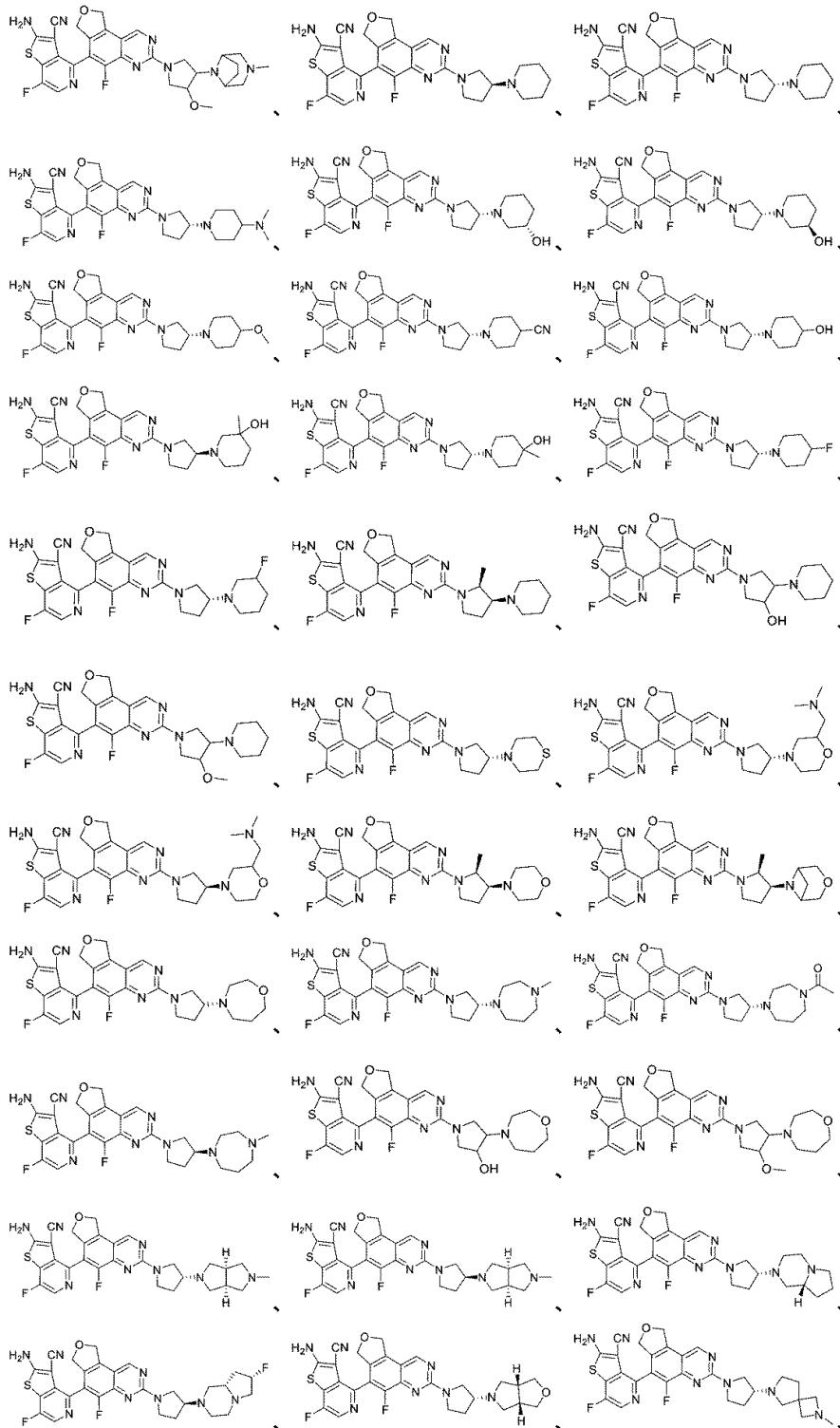
40

50

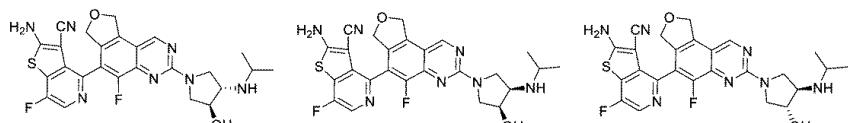
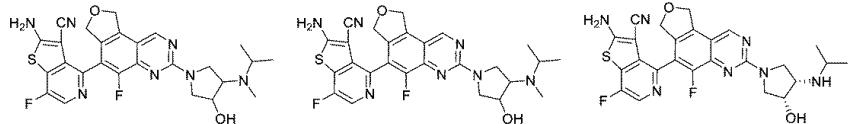
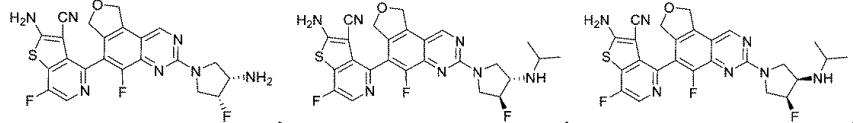
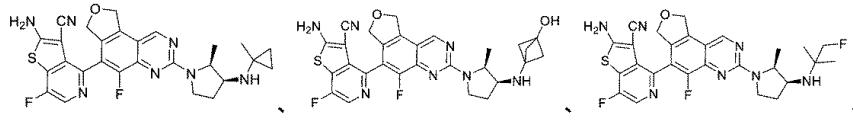
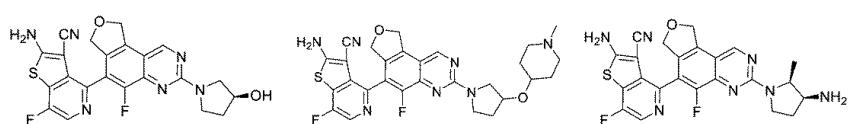
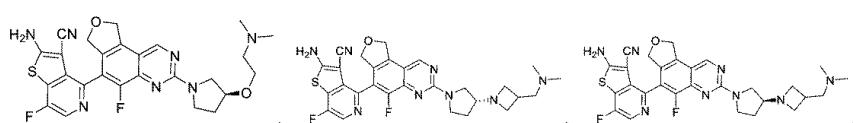
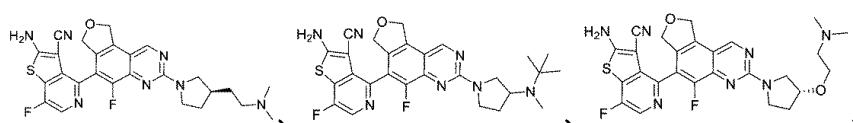
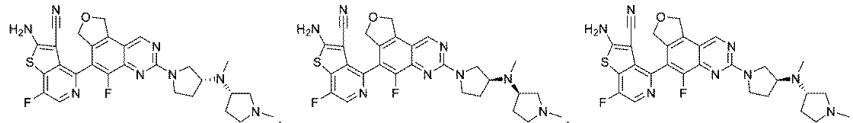
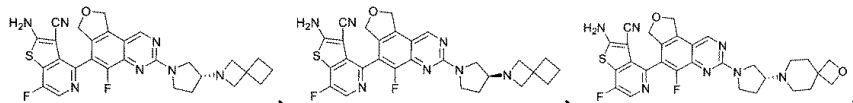
## 【化 2 8】



## 【化 2 9】



## 【化 3 0】



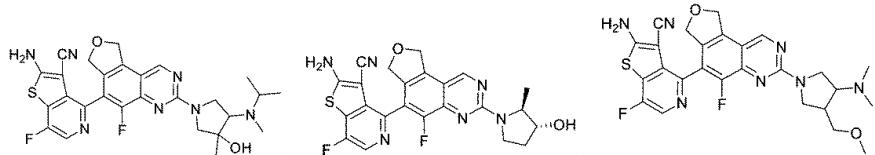
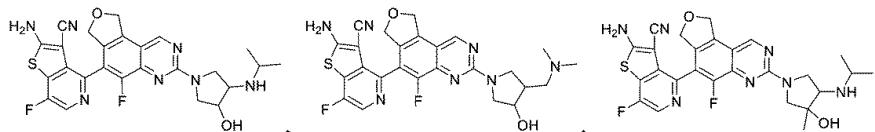
10

20

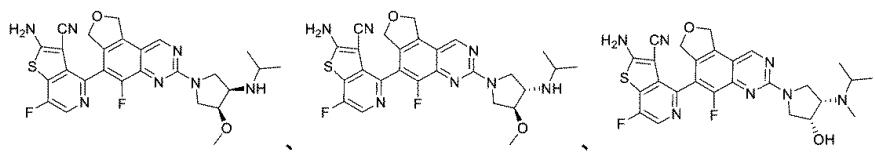
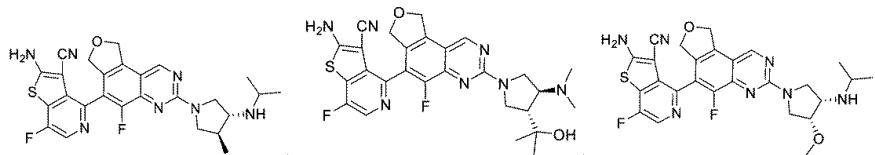
30

40

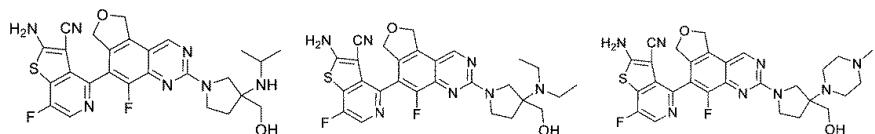
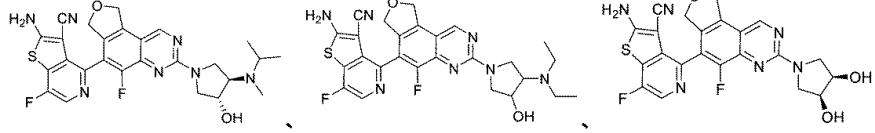
## 【化 3 1】



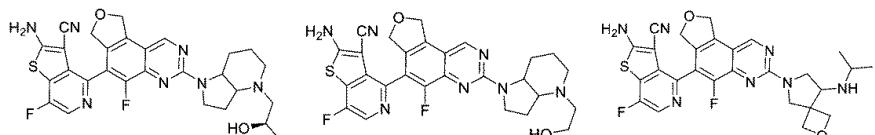
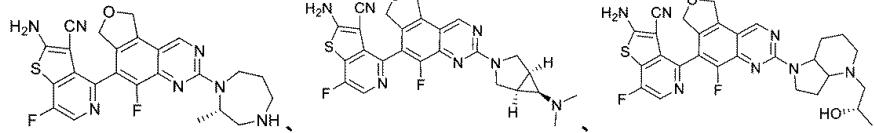
10



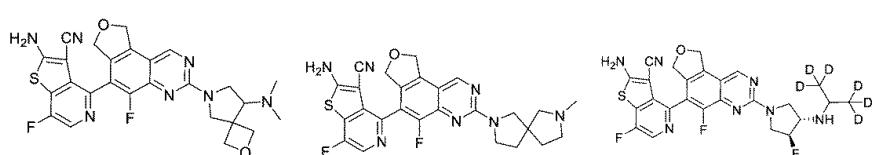
20



30

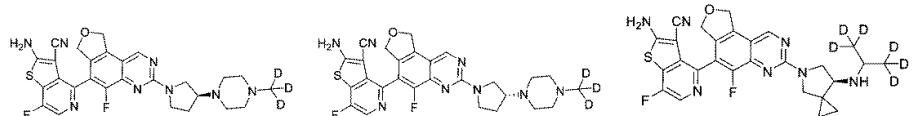
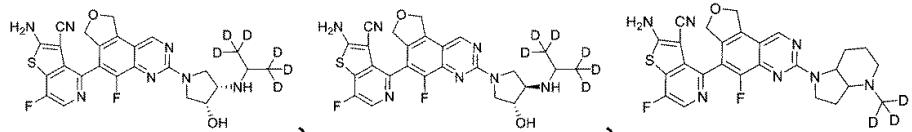


40

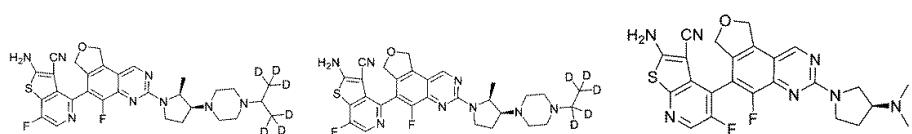
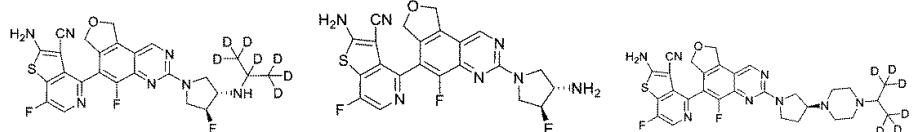


50

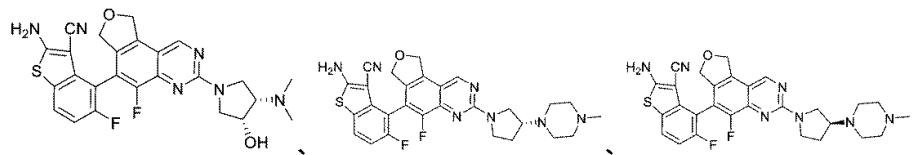
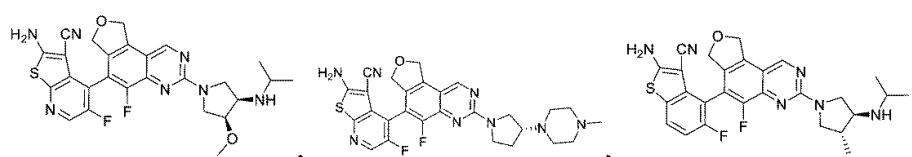
## 【化 3 2】



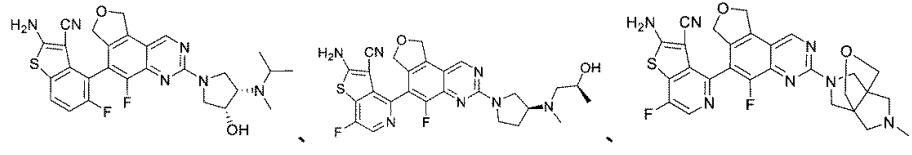
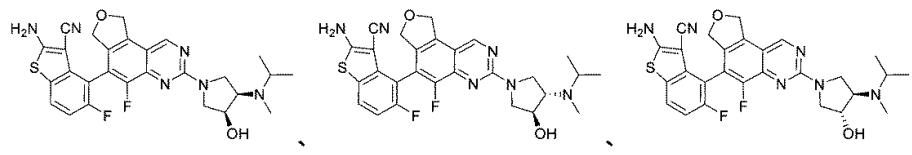
10



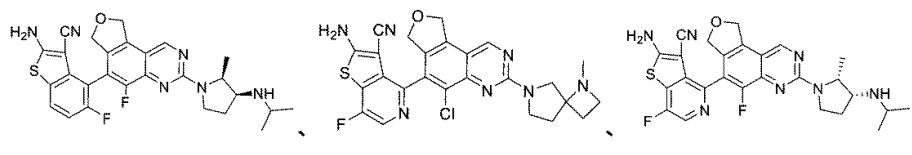
20



30

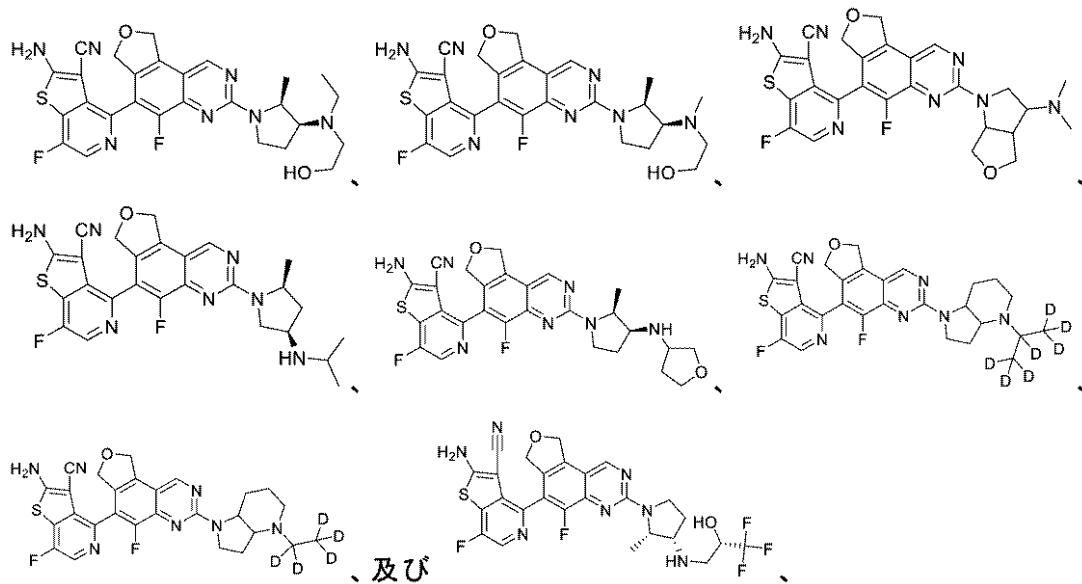


40



50

## 【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 2 8】

請求項 1 に記載の化合物であって、

10

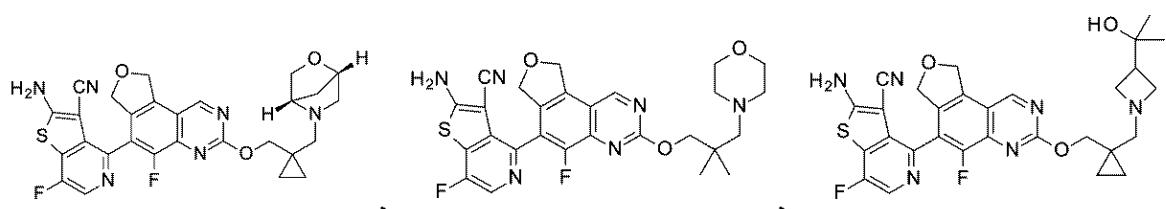
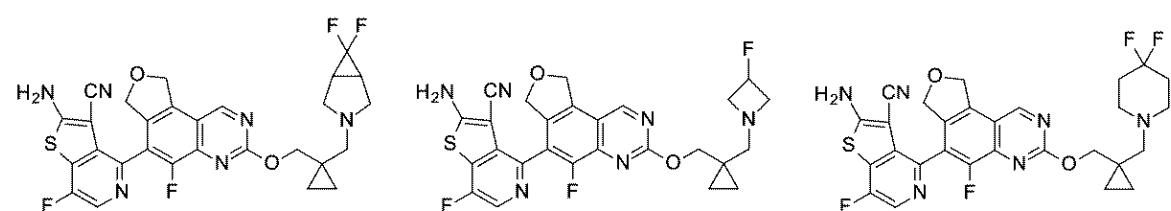
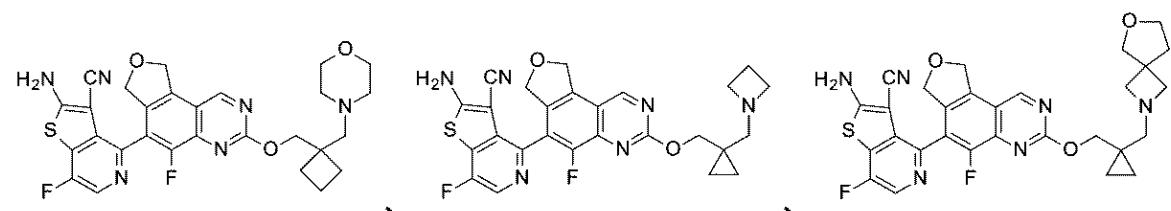
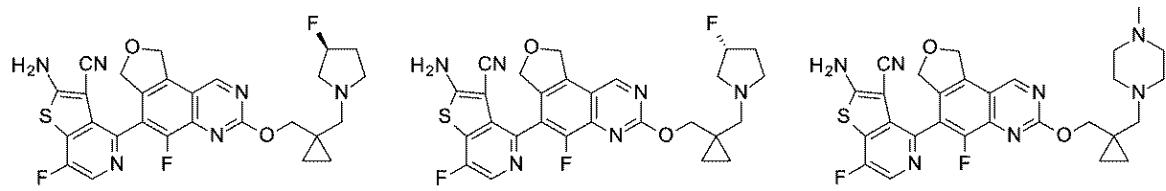
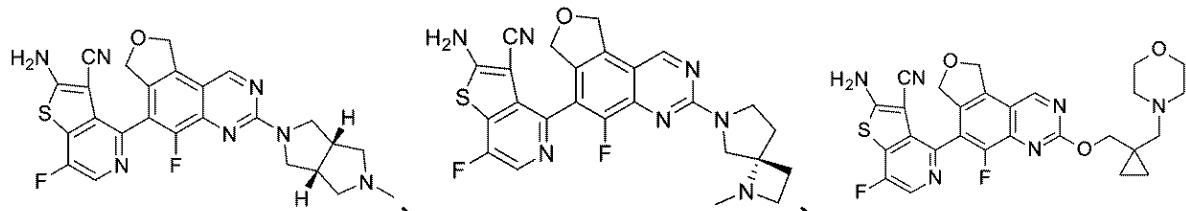
20

30

40

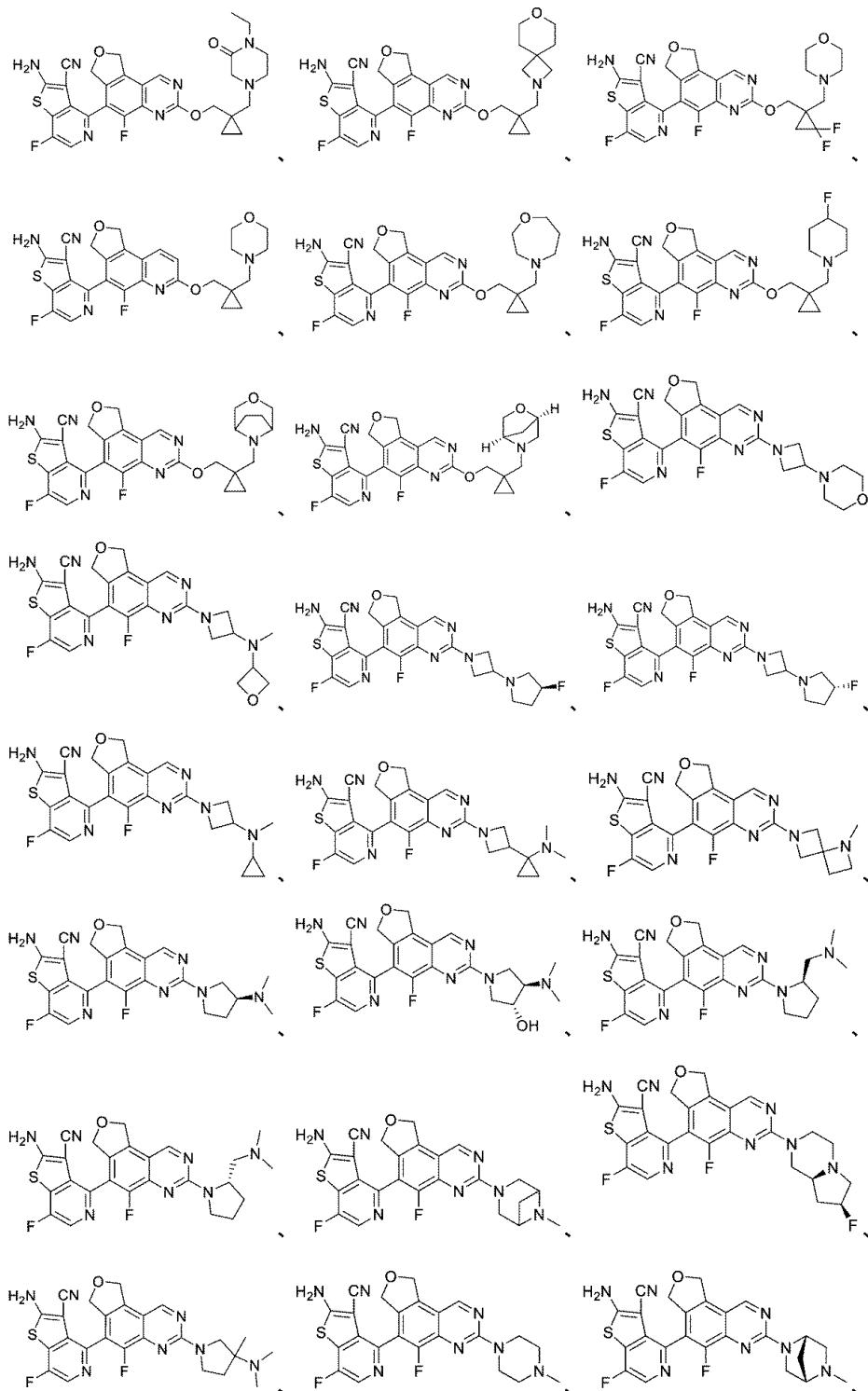
50

【化 3 4】

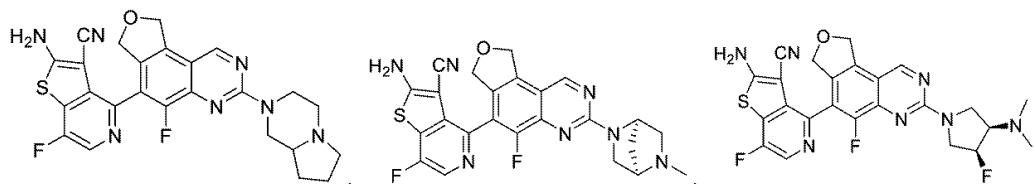


40

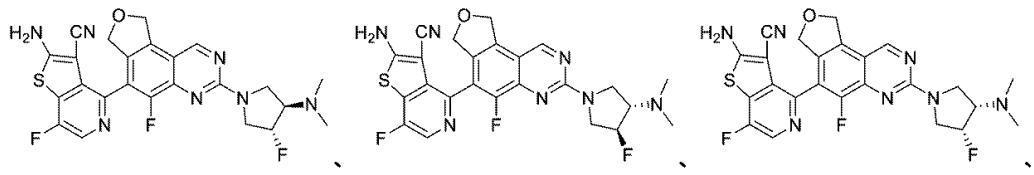
【化 3 5】



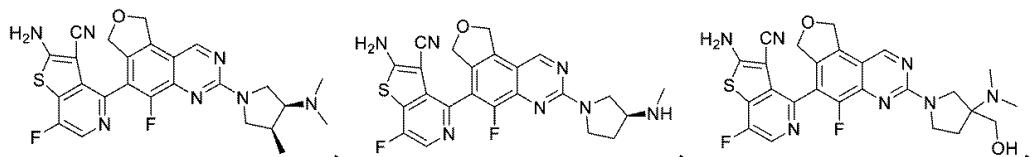
## 【化 3 6】



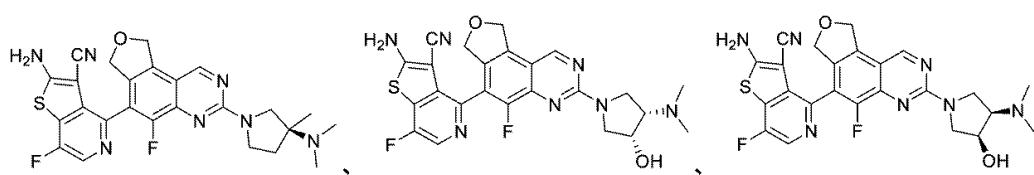
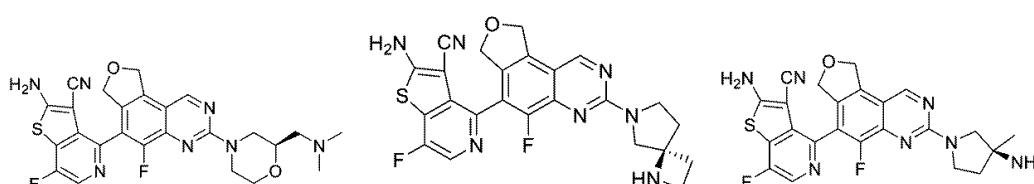
10



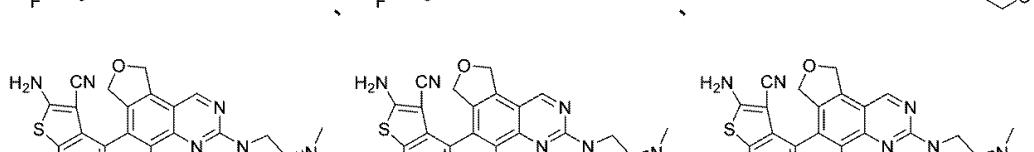
10



20



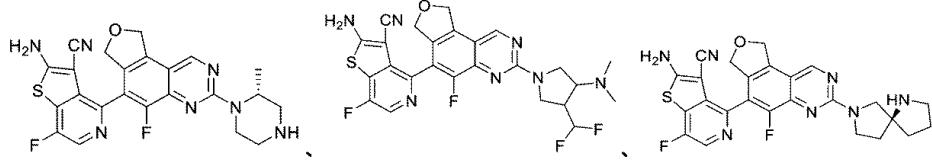
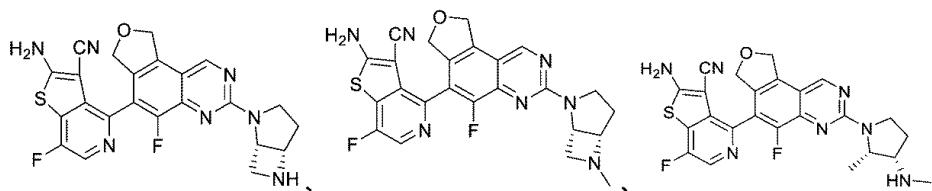
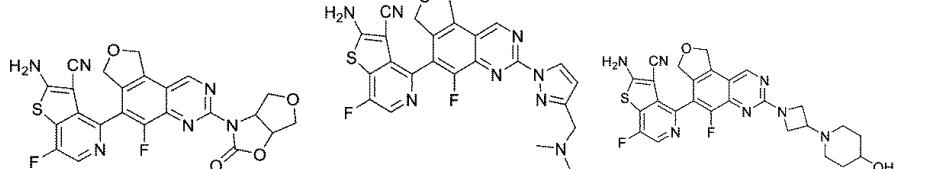
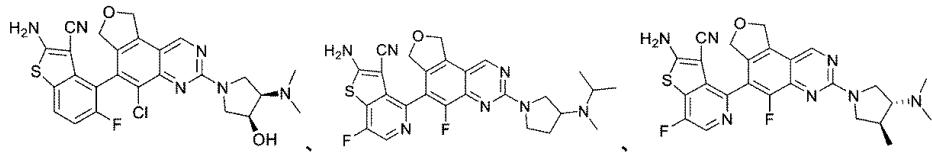
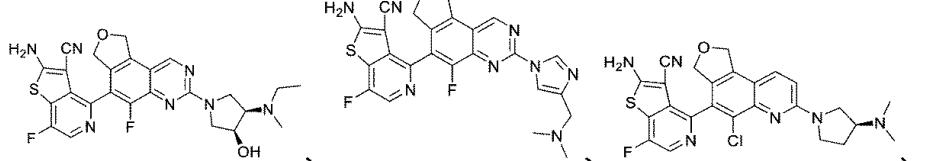
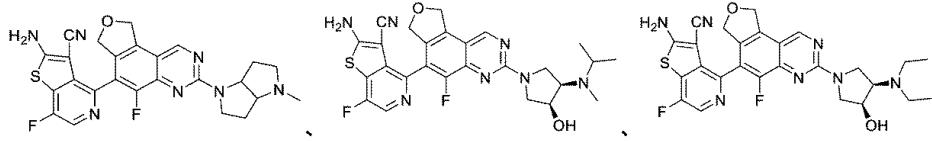
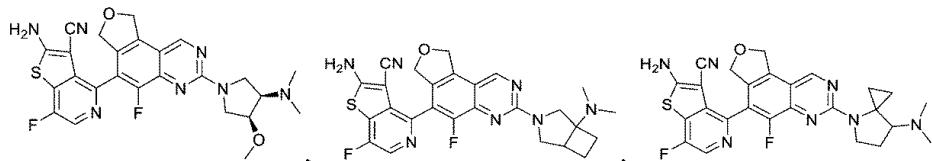
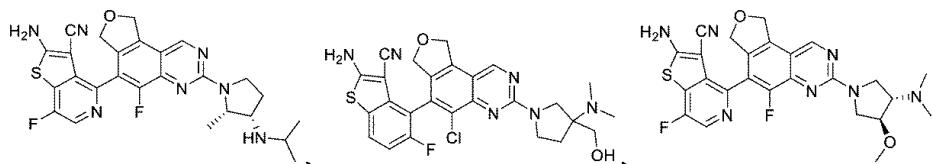
30



40

50

## 【化 3 7】



10

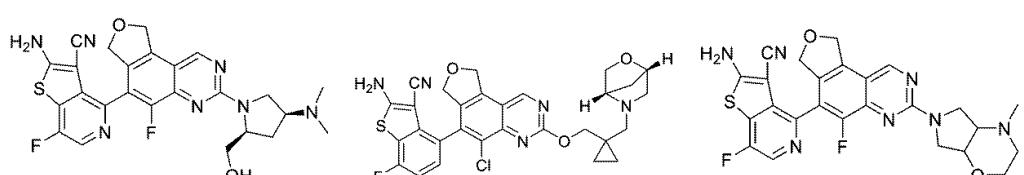
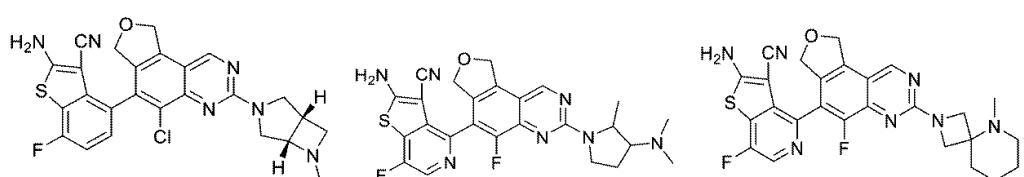
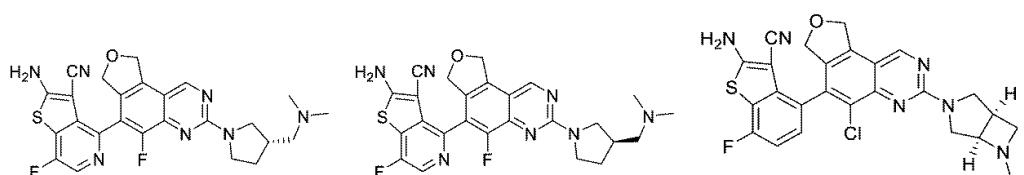
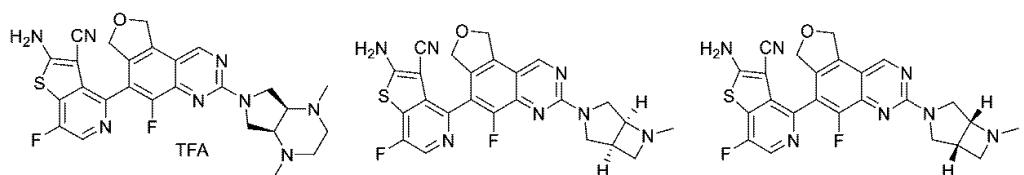
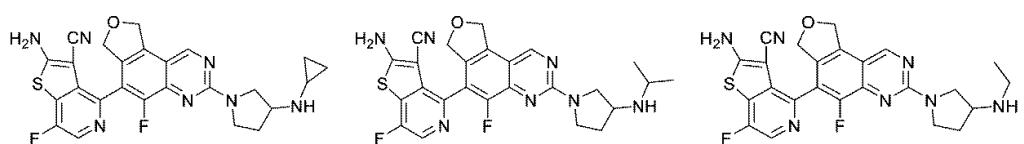
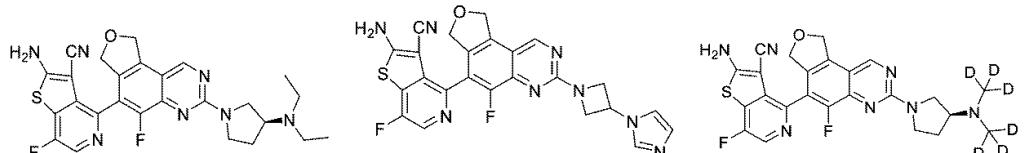
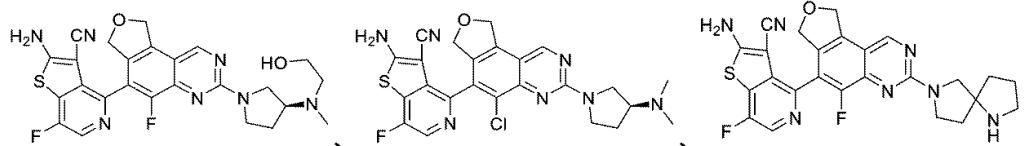
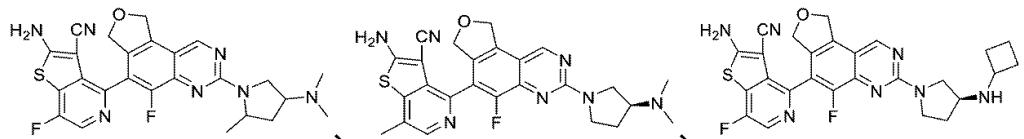
20

30

40

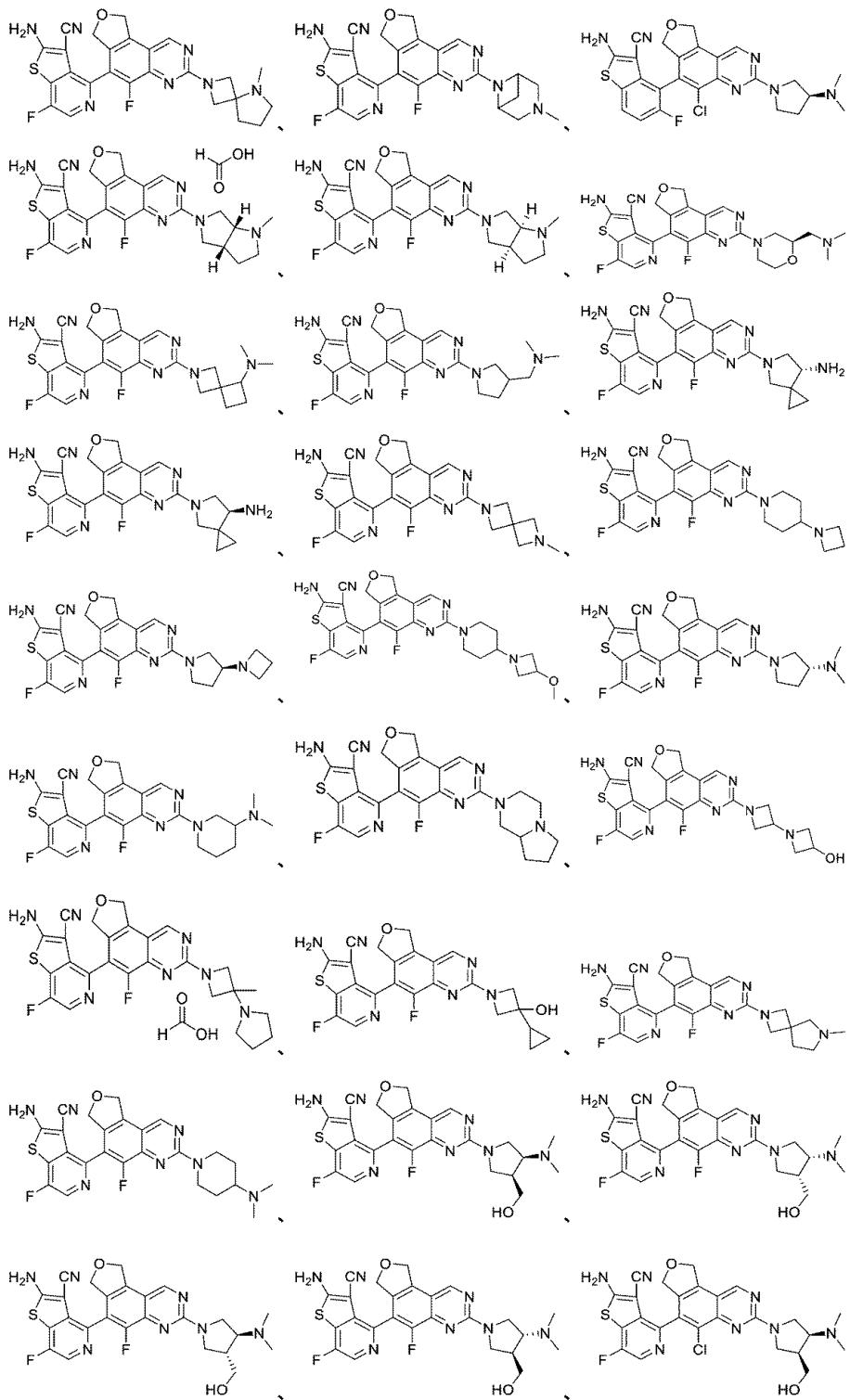
50

## 【化 3 8】

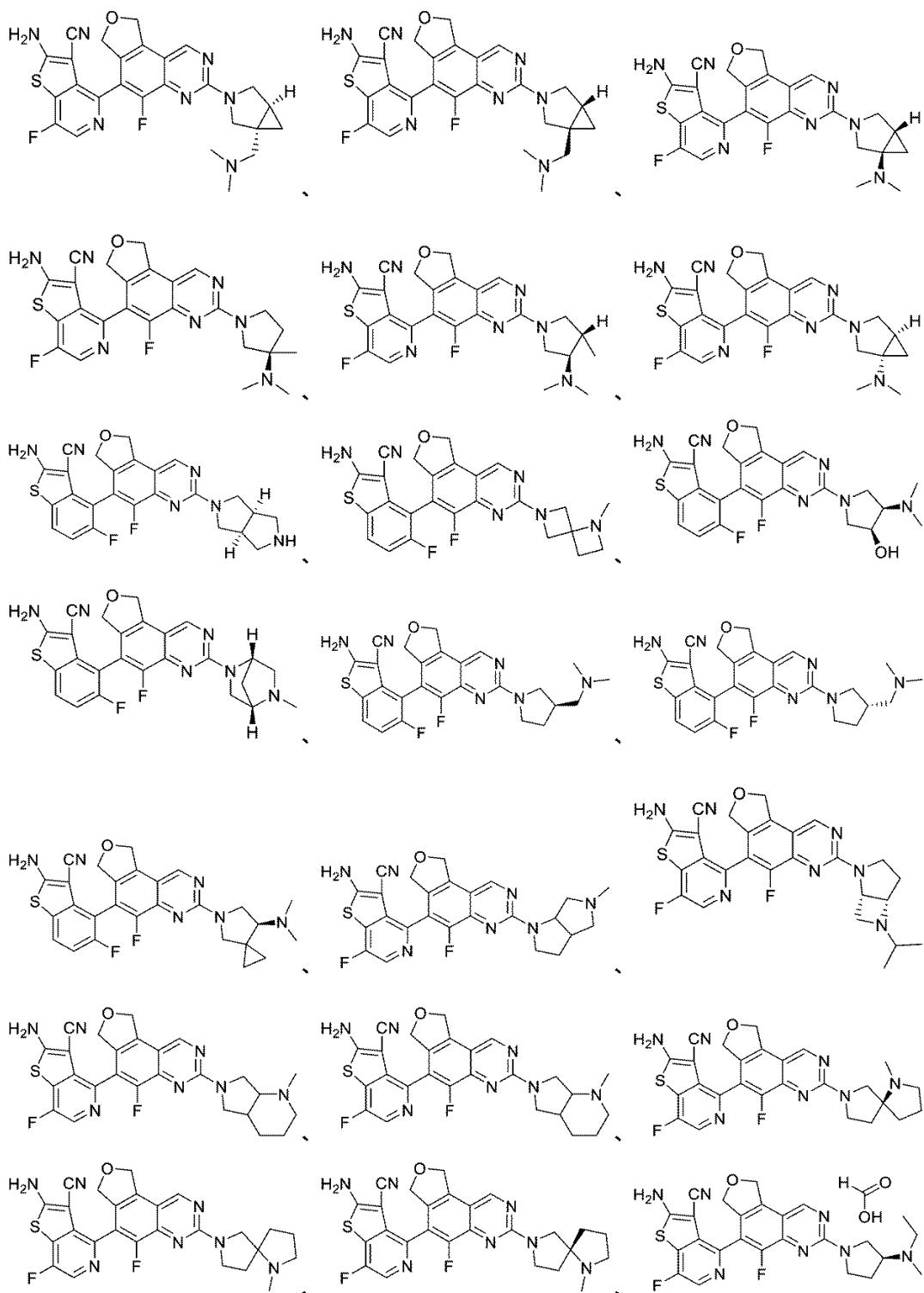


10  
20  
30  
40  
50

## 【化 3 9】



【化 4 0】



10

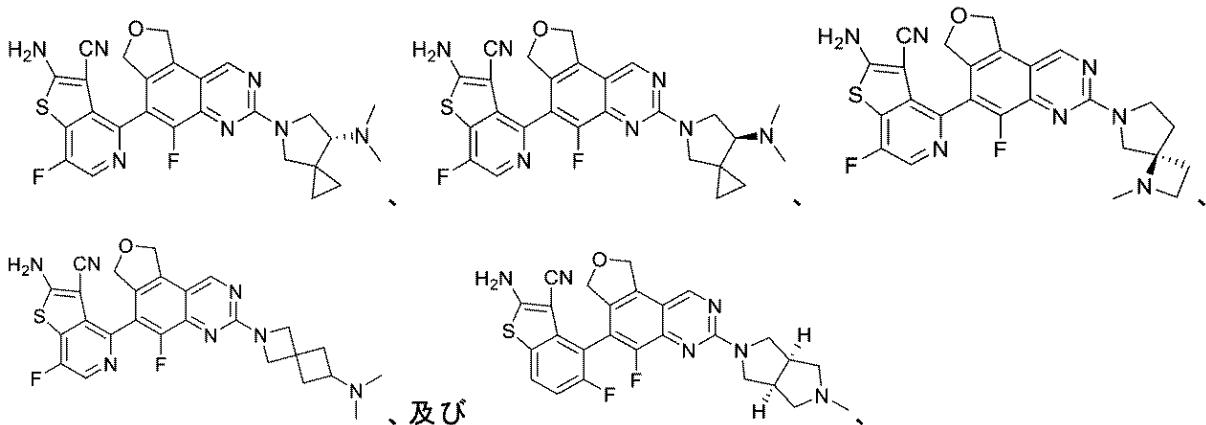
20

30

40

50

## 【化41】



10

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Kras G12C、G12D、及び／又はG12V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、Kras G12C、G12D、及び／又はG12V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、Kras G12C、G12D、及び／又はG12V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、PD-1阻害剤、PD-L1阻害剤、CDK4/CDK6阻害剤、EGFR阻害剤、ERK阻害剤、オーロラA阻害剤、SHP2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 3 9】

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3\_8に記載の薬学的組成物。

【請求項 4 0】

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3\_8に記載の薬学的組成物。

【請求項 4 1】

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3\_8に記載の薬学的組成物。

10

20

30

40

50