

【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5月27日(2021.5.27)

【公表番号】特表2020-517711(P2020-517711A)

【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2019-558496(P2019-558496)

【国際特許分類】

C 07 D 471/04 (2006.01)
A 61 P 31/12 (2006.01)
A 61 P 31/14 (2006.01)
A 61 P 35/00 (2006.01)
A 61 P 37/08 (2006.01)
A 61 P 43/00 (2006.01)
A 61 K 31/5377 (2006.01)
A 61 K 31/553 (2006.01)
C 07 D 498/16 (2006.01)
A 61 K 31/4745 (2006.01)

【F I】

C 07 D 471/04 105 A
A 61 P 31/12
A 61 P 31/14
A 61 P 35/00
A 61 P 37/08
A 61 P 43/00 111
A 61 K 31/5377
A 61 K 31/553
C 07 D 471/04 105 C
C 07 D 498/16 C S P
A 61 K 31/4745

【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

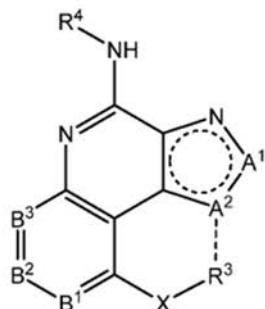
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下式の化合物である又は下式の化合物の塩である、化合物。

【化1】



(ただし、破線は結合があること又はないことを示し、

A¹は、CR¹、NR^{1A}、又はNであり、

A²は、CR²、NR^{2A}、O、又はSであり、

B¹は、CR⁵又はNであり、

B²は、CR⁶又はNであり、

B³は、CR⁷又はNであり、

R¹及びR²は、独立して、F、Cl、Br、I、NO₂、CN、R^a、-OR^a、-NR^aR^b、-NHCO_aR^a、-NH₂SO₂R^a、-OCOR^a、又は-SO₂R^aであり、

Xは、結合、O、NR^a、-CO-、-SO-、又は-SO₂-、-CONR^a、ヒドロカルビルであり、かつ、R³は、H又はC₁-₃オルガニルであり、又はX-R³は、F又はClであり、

R^{1A}、R^{2A}、R⁴、R^a、及びR^bは、独立して、H又はC₁-₃オルガニルであり、

R⁵、R⁶、及びR⁷は、独立して、F、Cl、Br、I、NO₂、CN、R^a、-OR^a、-NR^aR^b、-NHCO_aR^a、-NH₂SO₂R^a、-OCOR^a、-SO₂R^a、-SO₂NHR^a、又は-X¹-(C_mH_{2m}O₀₋₁)-Z-(C_nH_{2n+1})、-(C_mH_{2m}O₀₋₁)-Z-(C_nH_{2n+1})、-CO₂R^a、-CONR^aR^bであり、ただし、R⁵及びR⁶、又は、R⁶及びR⁷は、任意に、結合して環を形成してもよい。

(ただし、X¹は、結合、O、NR^a、-CO-、-SO-、又は-SO₂-であり、

Zは、結合、O、NH₂SO₂、又はNHCOであり、

mは、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、又は10であり、及び、

nは、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、

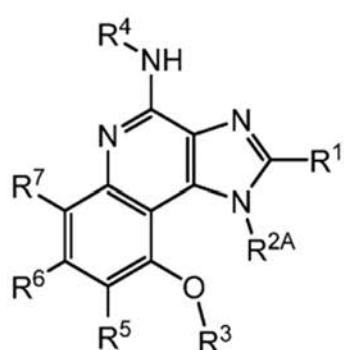
16、17、18、19、20、21、22、又は23であり、

R^a及びR^bは、独立して、H又是C₁-₆アルキルである。))

【請求項2】

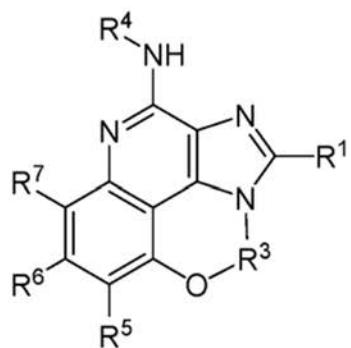
下式の化合物である又は下式の化合物の塩である、請求項1に記載の化合物。

【化2】



若しくは、

【化3】

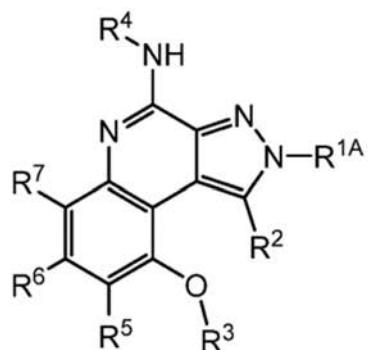


(ただし、R³はC₁-₃0オルガニルである。)

【請求項3】

下式の化合物である又は下式の化合物の塩である、請求項1に記載の化合物。

【化4】



(ただし、R⁴は、H、C₁-₃0非芳香族オルガニル、又は、N原子に直接に結合されていない芳香族基を含有するC₁-₃0芳香族オルガニルである。)

【請求項4】

R¹又はR^{1A}は、C₁-₁2の任意で置換されているアルキルである、請求項1から3のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項5】

R¹又はR^{1A}は、-C_rH_{2r+1}O又はそのエステルである(ただし、rは、1、2、3、4、5、6、7、8、9、又は10である。)、請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

R¹又はR^{1A}は、-C₃H₇Oである、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

R¹又はR^{1A}は、-CH₂OCH₂CH₃である、請求項6に記載の化合物。

【請求項8】

R²又はR^{2A}は、H又はC₁-₁2の任意で置換されているアルキルである、請求項1から7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項9】

R²又はR^{2A}は、C₁-₆アルキル又は-C_yH_{2y+1}O若しくはそのエステルである(ただし、yは、1、2、3、4、5、6、7、8、9、又は10である。)、請求項8に記載の化合物。

【請求項10】

R²又はR^{2A}は、CH₃である、請求項9に記載の化合物。

【請求項11】

R²又はR^{2A}は、Hである、請求項8に記載の化合物。

【請求項12】

R²又はR^{2A}は、C₄H₉である、請求項8に記載の化合物。

【請求項 1 3】

R^3 は、 $C_{1-3}O$ の任意で置換されているアルキルである、請求項 1 から 1 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 4】

R^3 は、 C_{1-10} アルキル又は $-C_wH_{2w+1}O$ 若しくはそのエステルである（ただし、 w は、1、2、3、4、5、6、7、8、9、又は 10 である。）、請求項 1 3 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

R^3 は、 $- (C_tH_{2t}O_{0-1}) - Ht$ である（ただし、 t は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、又は 10 であり、及び、 Ht は、任意で置換されている C_{3-6} ヘテロシクリルである。）、請求項 1 から 1 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 6】

R^3 は、 $- (C_uH_{2u}O_{0-1}) - Z - (C_vH_{2v+1})$ である（ただし、 Z は、結合、O、 $NHSO_2$ 、又は $NHCO$ であり、 u は、0、1、2、3、4、5、又は 6 であり、及び、 v は、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、又は 23 である。）、請求項 1 から 1 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 7】

R^3 は、 $- (C_uH_{2u}O_{0-1}) - NR^aR^b$ であり、及び、 u は、1、2、3、4、5、又は 6 である（ただし、 R^a 及び R^b は、独立して、H 又は C_{1-6} アルキルである。）、請求項 1 から 1 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 8】

R^3 は、 $C_5H_{11}O$ である、請求項 1 4 に記載の化合物。

【請求項 1 9】

R^3 は、 $-CH_2 - CH_2 - \underline{C}(CH_3)_2OH$ である、請求項 1 8 に記載の化合物。

【請求項 2 0】

R^3 は、 $-CH_2 - CH_2 - CH_2 - NH_2$ である、請求項 1 7 に記載の化合物。

【請求項 2 1】

R^4 は、H 又は C_{1-6} アルキルである、請求項 1 から 2 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 2】

R^4 は、H である、請求項 2 1 に記載の化合物。

【請求項 2 3】

R^5 は、 R^a 、F、Cl、 $-CO_2R^a$ 、 $-CONR^aR^b$ 、CN、 $-OR^a$ 、 $-NR^aR^b$ 、 $-OCOR^a$ 、又は $-SO_2R^a$ 、 $-SO_2NHR^a$ である（ただし、 R^a 及び R^b は、独立して、H 又は C_{1-6} アルキルである。）、請求項 1 から 2 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 4】

R^5 は、H である、請求項 2 3 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

R^5 は、 $- (C_mH_{2m}O_{0-1}) - Z - (C_nH_{2n+1})$ である（ただし、 Z は、結合、O、 $NHSO_2$ 、又は $NHCO$ であり、 m は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、又は 10 であり、及び、 n は、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、又は 23 である。）、請求項 1 から 2 0 に記載の化合物。

【請求項 2 6】

R^6 は、 R^a 、F、Cl、 $-CO_2R^a$ 、 $-CONR^aR^b$ 、CN、 $-OR^a$ 、 $-NR^aR^b$ 、 $-OCOR^a$ 、又は $-SO_2R^a$ 、 $-SO_2NHR^a$ である（ただし、 R^a 及び R^b は、独立して、H 又は C_{1-6} アルキルである。）、請求項 1 から 2 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 27】

R⁶は、Hである、請求項26に記載の化合物。

【請求項 28】

R⁶は、-(C_mH_{2m}O₀₋₁)-Z-(C_nH_{2n+1})である(ただし、Zは、結合、O、NH₂、又はNHC₁であり、mは、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、又は10であり、及び、nは、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、又は23である。)、請求項1から25のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 29】

R⁷は、R^a、F、Cl、-CO₂R^a、-CONR^aR^b、CN、-OR^a、-NR^aR^b、-OCOR^a、又は-SO₂R^a、-SO₂NHR^aである(ただし、R^a及びR^bは、独立して、H又はC₁₋₆アルキルである。)、請求項1から28のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 30】

R⁷は、Hである、請求項29に記載の化合物。

【請求項 31】

R⁷は、-(C_mH_{2m}O₀₋₁)-Z-(C_nH_{2n+1})である(ただし、Zは、結合、O、NH₂、又はNHC₁であり、mは、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、又は10であり、及び、nは、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、又は23である。)、請求項1から28のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 32】

R⁸は、H、OH、又はCH₃である、請求項1から31のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 33】

R⁸は、OHである、請求項32に記載の化合物。

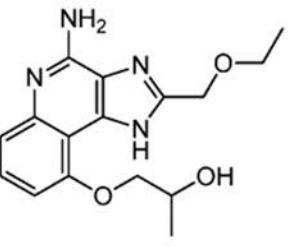
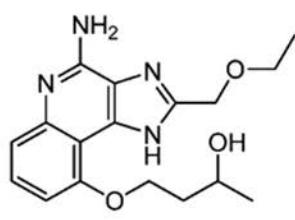
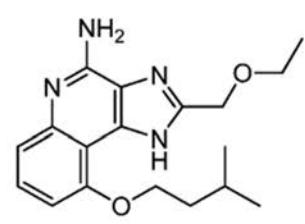
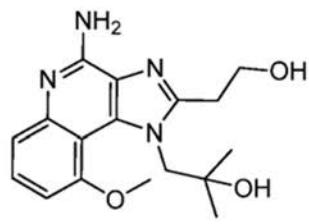
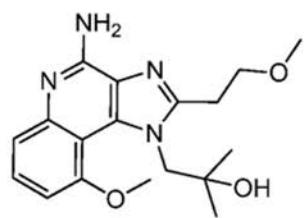
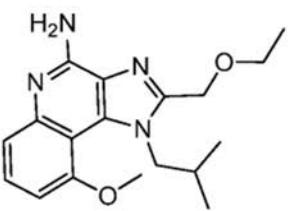
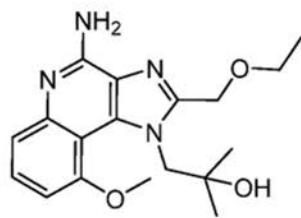
【請求項 34】

R⁸は、Hである、請求項32に記載の化合物。

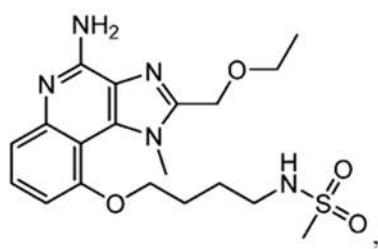
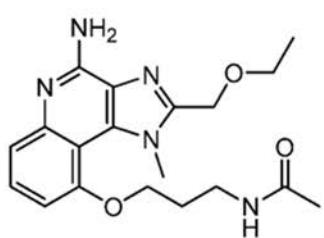
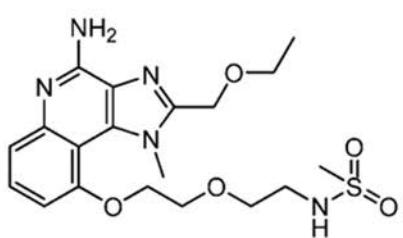
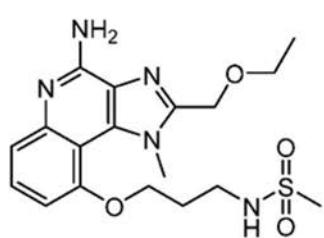
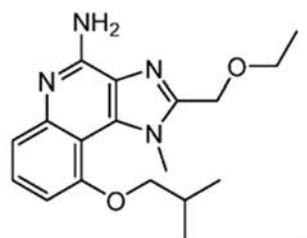
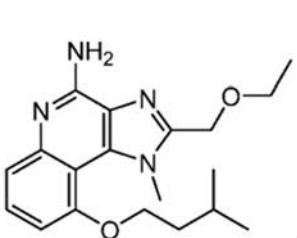
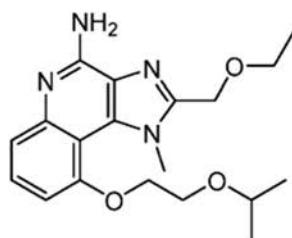
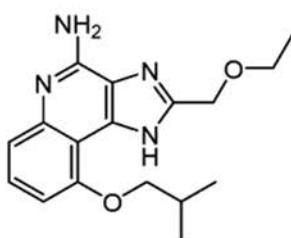
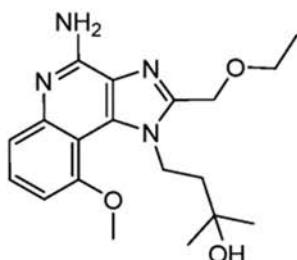
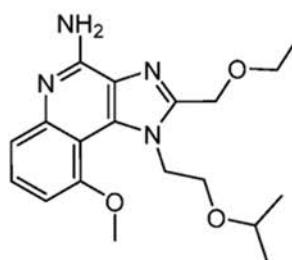
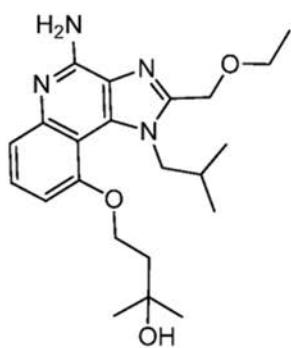
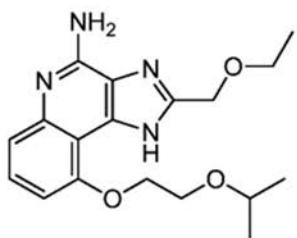
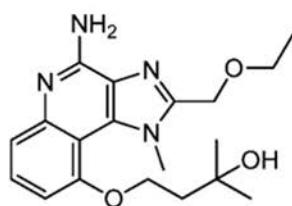
【請求項 35】

下式の化合物のいずれかである、又は、下式の化合物のいずれかの塩である、又は、-OH基を有する下式の化合物のいずれかのエステルである、化合物。

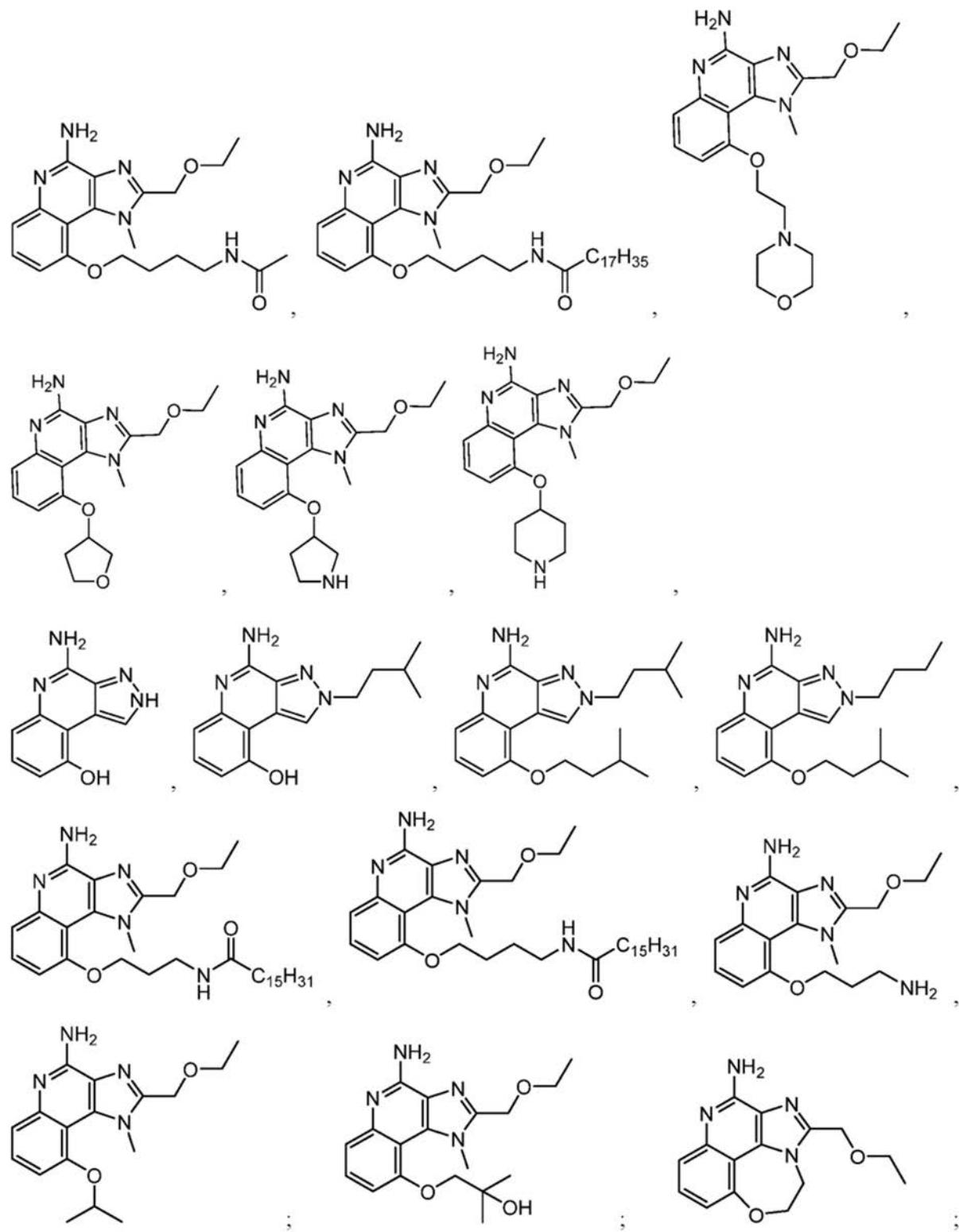
【化 5】



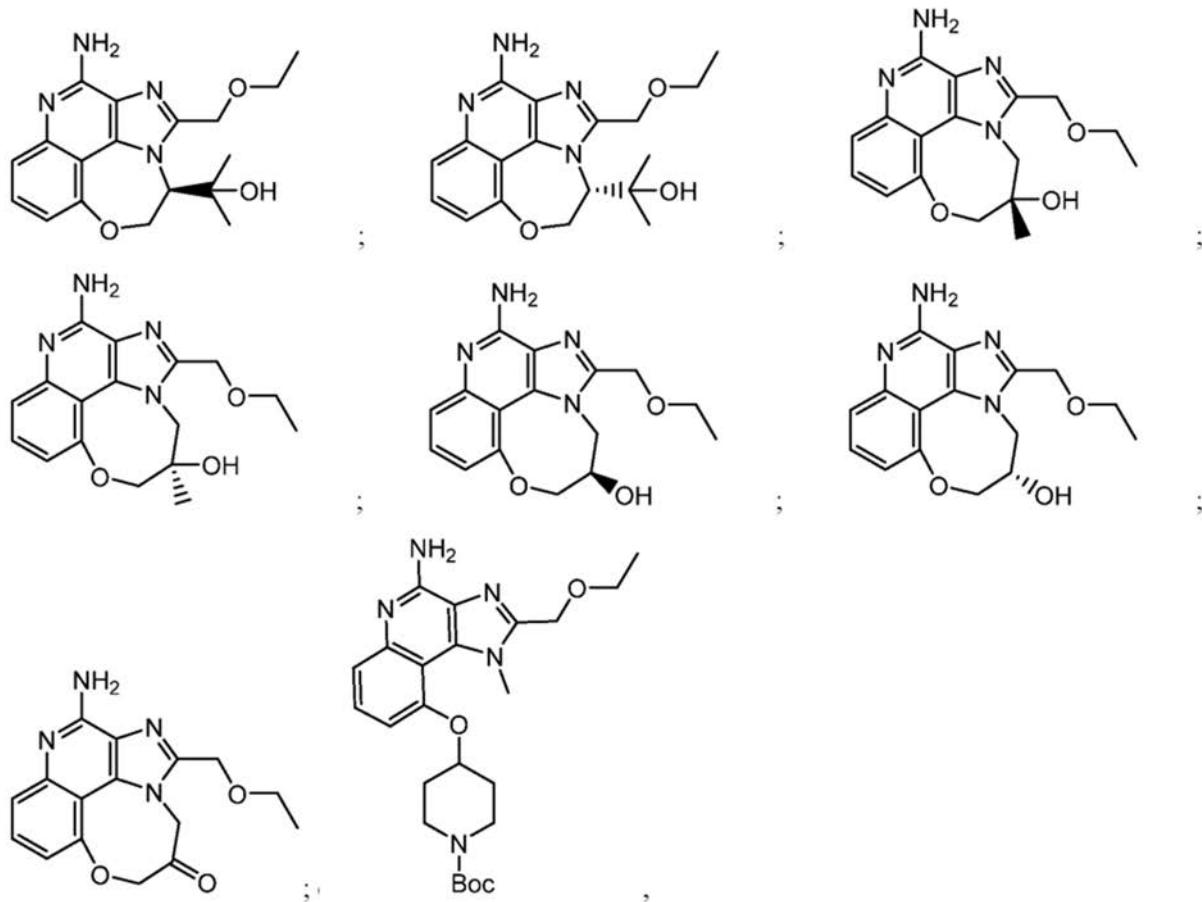
【化 6】



【化 7】



【化 8】



【請求項 3 6】

任意で置換されている 9 - メトキシ - 1 H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミンである化合物。

【請求項 3 7】

任意で置換されている 9 - メトキシ - 2 H - ピラゾロ [3 , 4 - c] キノリン - 4 - アミンである化合物。

【請求項 3 8】

任意で置換されている 1 - (4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 9 - メトキシ - 1 H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 1 - イル) - 2 - メチルプロパン - 2 - オール若しくはその塩、任意で置換されている 2 - (エトキシメチル) - 1 - イソブチル - 9 - メトキシ - 1 H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン若しくはその塩、任意で置換されている 1 - (4 - アミノ - 9 - メトキシ - 2 - (2 - メトキシエチル) - 1 H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 1 - イル) - 2 - メチルプロパン - 2 - オール若しくはその塩、任意で置換されている 1 - (4 - アミノ - 2 - (2 - ヒドロキシエチル) - 9 - メトキシ - 1 H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 1 - イル) - 2 - メチルプロパン - 2 - オール若しくはその塩、任意で置換されている 4 - ((4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 1 H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 9 - イル) オキシ) - 2 - メチルブタン - 2 - オール若しくはその塩、任意で置換されている 2 - (エトキシメチル) - 9 - (イソペンチルオキシ) - 1 H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン若しくはその塩、任意で置換されている 4 - ((4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 1 H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 9 - イル) オキシ) ブタン - 2 - オール若しくはその塩、任意で置換されている 1 - ((4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 1 H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 9 - イル) オキシ) プロパン - 2 - オール若しくはその塩、任意で置換されている 4 - ((4 - アミノ - 2 - (2 - メトキシエチル) - 1 H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 9 - イル) オキシ) - 2 - メチルブタン - 2 - オール若しくは

その塩、任意で置換されている 4 - ((4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 1 - メチル - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 9 - イル) オキシ) - 2 - メチルブタン - 2 - オール若しくはその塩、任意で置換されている 2 - (エトキシメチル) - 9 - (2 - イソプロポキシエトキシ) - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン若しくはその塩、任意で置換されている 4 - ((4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 1 - イソブチル - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 9 - イル) オキシ) - 2 - メチルブタン - 2 - オール若しくはその塩、任意で置換されている 2 - (エトキシメチル) - 1 - (2 - イソプロポキシエチル) - 9 - メトキシ - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン若しくはその塩、任意で置換されている 4 - ((4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 9 - メトキシ - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 1 - イル) - 2 - メチルブタン - 2 - オール若しくはその塩、任意で置換されている 2 - (エトキシメチル) - 9 - イソブロキシ - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン若しくはその塩、任意で置換されている 2 - (エトキシメチル) - 9 - (2 - イソプロポキシエトキシ) - 1 - メチル - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン若しくはその塩、任意で置換されている 2 - (エトキシメチル) - 9 - (イソペンチルオキシ) - 1 - メチル - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン若しくはその塩、任意で置換されている 2 - (エトキシメチル) - 9 - イソブロキシ - 1 - メチル - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 9 - イル) オキシ) プロピル) メタンスルホンアミド若しくはその塩、任意で置換されている N - ((4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 1 - メチル - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 9 - イル) オキシ) プロピル) メタンスルホンアミド若しくはその塩、任意で置換されている N - ((2 - (2 - ((4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 1 - メチル - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 9 - イル) オキシ) エトキシ) エチル) - メタンスルホンアミド若しくはその塩、任意で置換されている N - ((3 - ((4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 1 - メチル - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 9 - イル) オキシ) プロピル) アセトアミド若しくはその塩、任意で置換されている N - ((4 - ((4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 1 - メチル - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 9 - イル) オキシ) ブチル) メタンスルホンアミド若しくはその塩、任意で置換されている N - ((3 - ((4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 1 - メチル - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 9 - イル) オキシ) ブチル) プロピル) ステアルアミド若しくはその塩、任意で置換されている N - ((4 - ((4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 1 - メチル - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 9 - イル) オキシ) ブチル) アセトアミド若しくはその塩、任意で置換されている N - ((4 - ((4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 1 - メチル - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 9 - イル) オキシ) ブチル) プチル) ステアルアミド若しくはその塩、任意で置換されている 2 - (エトキシメチル) - 1 - メチル - 9 - (2 - モルホリノエトキシ) - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン若しくはその塩、任意で置換されている 2 - (エトキシメチル) - 1 - メチル - 9 - ((テトラヒドロフラン - 3 - イル) オキシ) - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン若しくはその塩、任意で置換されている 2 - (エトキシメチル) - 1 - メチル - 9 - (ピロリジン - 3 - イルオキシ) - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン若しくはその塩、任意で置換されている 2 - (エトキシメチル) - 1 - メチル - 9 - (ペベリジン - 4 - イルオキシ) - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン若しくはその塩、任意で置換されている N - ((3 - ((4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 1 - メチル - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 9 - イル) オキシ) プロピル) パルミトアミド若しくはその塩、任意で置換されている N - ((4 - ((4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 1 - メチル - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 9 - イル) オキシ) ブチル) パルミトアミド若しくはその塩、任意で置換されている 9 - ((3 - アミノプロポキシ) - 2 - (エトキシメチル) - 1 - メチル - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン若しくはその塩、任意で置換されている 2 - (エトキシメチル) - 9 - イソプロポキシ - 1 - メチル - 1H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン若しくはその塩、任意で置換されている 1 - ((4 - アミノ - 2 - (

エトキシメチル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 9 - イル) オキシ) - 2 - メチルプロパン - 2 - オール若しくはその塩、任意で置換されている 2 - (エトキシメチル) - 3 , 4 - ジヒドロ - 5 - オキサ - 1 , 2 a , 9 - トリアザナフト [2 , 1 , 8 - c d e] アズレン - 10 - アミン若しくはその塩、任意で置換されている (R) - 2 - (10 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 3 , 4 - ジヒドロ - 5 - オキサ - 1 , 2 a , 9 - トリアザナフト [2 , 1 , 8 - c d e] アズレン - 3 - イル) プロパン - 2 - オール若しくはその塩、任意で置換されている (S) - 2 - (10 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 3 , 4 - ジヒドロ - 5 - オキサ - 1 , 2 a , 9 - トリアザナフト [2 , 1 , 8 - c d e] アズレン - 3 - イル) プロパン - 2 - オール若しくはその塩、任意で置換されている (S) - 2 - アミノ - 12 - (エトキシメチル) - 6 - メチル - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - 3 , 4 - (アゼノメテノ) [1 , 5] オキサゾシノ [4 , 3 , 2 - d e] キノリン - 6 - オール若しくはその塩、任意で置換されている (R) - 2 - アミノ - 12 - (エトキシメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - 3 , 4 - (アゼノメテノ) [1 , 5] オキサゾシノ [4 , 3 , 2 - d e] キノリン - 6 - オール若しくはその塩、任意で置換されている (S) - 2 - アミノ - 12 - (エトキシメチル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - 3 , 4 - (アゼノメテノ) [1 , 5] オキサゾシノ [4 , 3 , 2 - d e] キノリン - 6 - オール若しくはその塩、任意で置換されている 2 - アミノ - 12 - (エトキシメチル) - 5 H - 3 , 4 - (アゼノメテノ) [1 , 5] オキサゾシノ [4 , 3 , 2 - d e] キノリン - 6 (7 H) - オン若しくはその塩、又は、任意で置換されている t e r t - ブチル 4 - ((4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾ [4 , 5 - c] キノリン - 9 - イル) オキシ) ピペリジン - 1 - カルボキシレート若しくはその塩である、請求項 3 6 に記載の化合物。

【請求項 3 9】

任意で置換されている 4 - アミノ - 2 H - ピラゾロ [3 , 4 - c] キノリン - 9 - オール若しくはその塩、任意で置換されている 4 - アミノ - 2 - イソペンチル - 2 H - ピラゾロ [3 , 4 - c] キノリン - 9 - オール若しくはその塩、任意で置換されている 2 - イソペンチル - 9 - (イソペンチルオキシ) - 2 H - ピラゾロ [3 , 4 - c] キノリン - 4 - アミン若しくはその塩、又は、任意で置換されている 2 - ブチル - 9 - (イソペンチルオキシ) - 2 H - ピラゾロ [3 , 4 - c] キノリン - 4 - アミン若しくはその塩である、請求項 3 7 に記載の化合物。

【請求項 4 0】

請求項 1 から 3 9 のいずれか 1 項に記載の化合物を含み、治療を必要とする哺乳類に投与することによりウイルス感染、がん、又はアレルギー性疾患を治療するための医薬組成物。

【請求項 4 1】

前記ウイルス感染が H C V 感染を含む、請求項 4 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 2】

請求項 1 から 3 9 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、哺乳類への投与に適した剤形。