

【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 1 0 5 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 1 1 1

A 61 K 31/5377

A 61 K 31/553

C 07 D 471/04 1 0 5 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

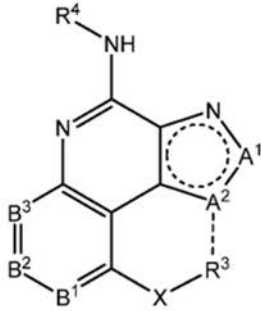
【補正の内容】

【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、C R¹、N R^{1A}、又はNであり、

A² は、C R²、N R^{2A}、O、又はSであり、

B¹ は、C R⁵ 又はNであり、

B² は、C R⁶ 又はNであり、

B³ は、C R⁷ 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、-NHCOR^a、-NH SO₂ R^a、-OCOR^a、又は -SO₂ R^a であり、

X は、結合、O、N R^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 C₁₋₃₀ 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 C₁₋₃₀ 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、-NHCOR^a、-NH SO₂ R^a、-OCOR^a、-SO₂ R^a、-SO₂ NHR^a、又は -X¹ - (C_mH_{2m}O₀₋₁) - Z - (C_nH_{2n+1})、-(C_mH_{2m}O₀₋₁) - Z - (C_nH_{2n+1})、-CO₂ R^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いてもよい。

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

Z は、結合、O、NH SO₂、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、

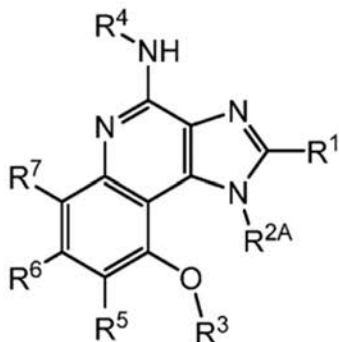
n は、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、又は 23 であり、

R^a 及び R^b は、独立して、H 又は C₁₋₆ アルキルである。))

【請求項 2】

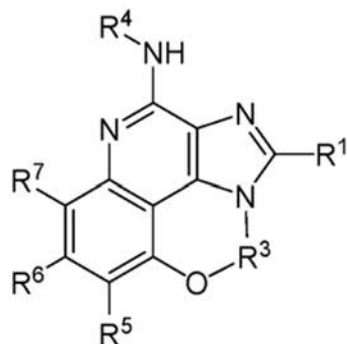
下式の化合物である又は下式の化合物の塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【化 2】



若しくは、

【化 3】

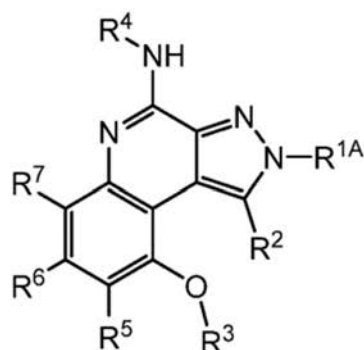


(ただし、 R^3 は C_{1-30} オルガニルである。)

【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、 R^4 は、 H 、 C_{1-30} 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 C_{1-30} 芳香族オルガニルである。)

【請求項 4】

R^1 又は R^{1A} は、 C_{1-12} 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】

R^1 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】

R^1 又は R^{1A} は、 $-C_3H_7O$ である、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

R^1 又は R^{1A} は、 $-CH_2OCH_2CH_3$ である、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

R^2 又は R^{2A} は、 H 又は C_{1-12} 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】

R^2 又は R^{2A} は、 C_{1-6} 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】

R^2 又は R^{2A} は、 CH_3 である、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

R^2 又は R^{2A} は、 H である、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 12】

R^2 又は R^{2A} は、 C_4H_9 である、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 13】

R^3 は、 C_{1-30} の任意で置換されているアルキルである、請求項 1 から 12 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 14】

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 13 に記載の化合物。

【請求項 15】

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 13 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 16】

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 13 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 17】

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 13 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 18】

R^3 は、 $C_5H_{11}O$ である、請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 19】

R^3 は、 $-CH_2-CH_2-\underline{C(CH_3)_2}OH$ である、請求項 18 に記載の化合物。

【請求項 20】

R^3 は、 $-CH_2-CH_2-CH_2-NH_2$ である、請求項 17 に記載の化合物。

【請求項 21】

R^4 は、 H 又は C_{1-6} アルキルである、請求項 1 から 20 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 22】

R^4 は、 H である、請求項 21 に記載の化合物。

【請求項 23】

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 22 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 24】

R^5 は、 H である、請求項 23 に記載の化合物。

【請求項 25】

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 20 に記載の化合物。

【請求項 26】

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 25 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 27】

R^6 は、H である、請求項 26 に記載の化合物。

【請求項 28】

R^6 は、 $-(C_m H_{2m} O_{0-1})-Z-(C_n H_{2n+1})$ 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 25 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 29】

R^7 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 28 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 30】

R^7 は、H である、請求項 29 に記載の化合物。

【請求項 31】

R^7 は、 $-(C_m H_{2m} O_{0-1})-Z-(C_n H_{2n+1})$ 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 28 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 32】

R^8 は、H、OH、又は CH_3 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】

R^8 は、OH である、請求項 32 に記載の化合物。

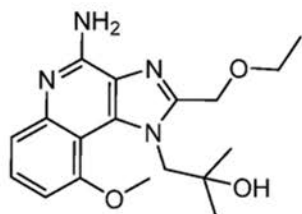
【請求項 34】

R^8 は、H である、請求項 32 に記載の化合物。

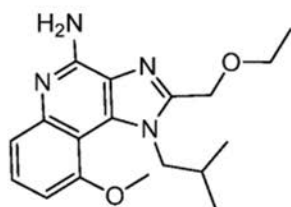
【請求項 35】

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。

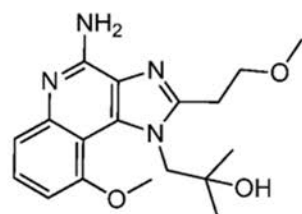
【化 5】



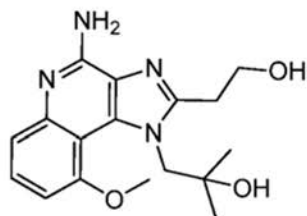
,



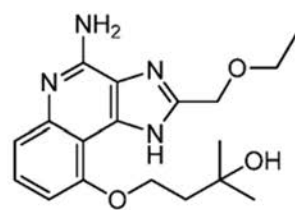
,



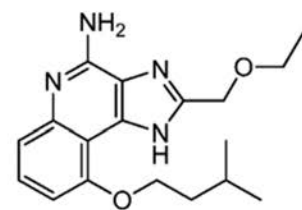
,



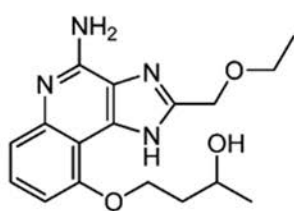
,



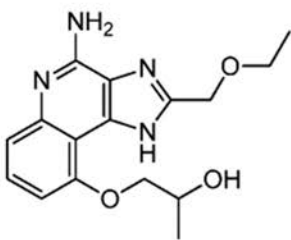
,



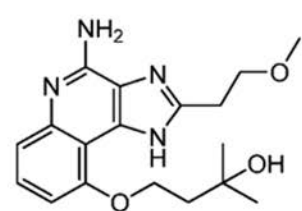
,



,

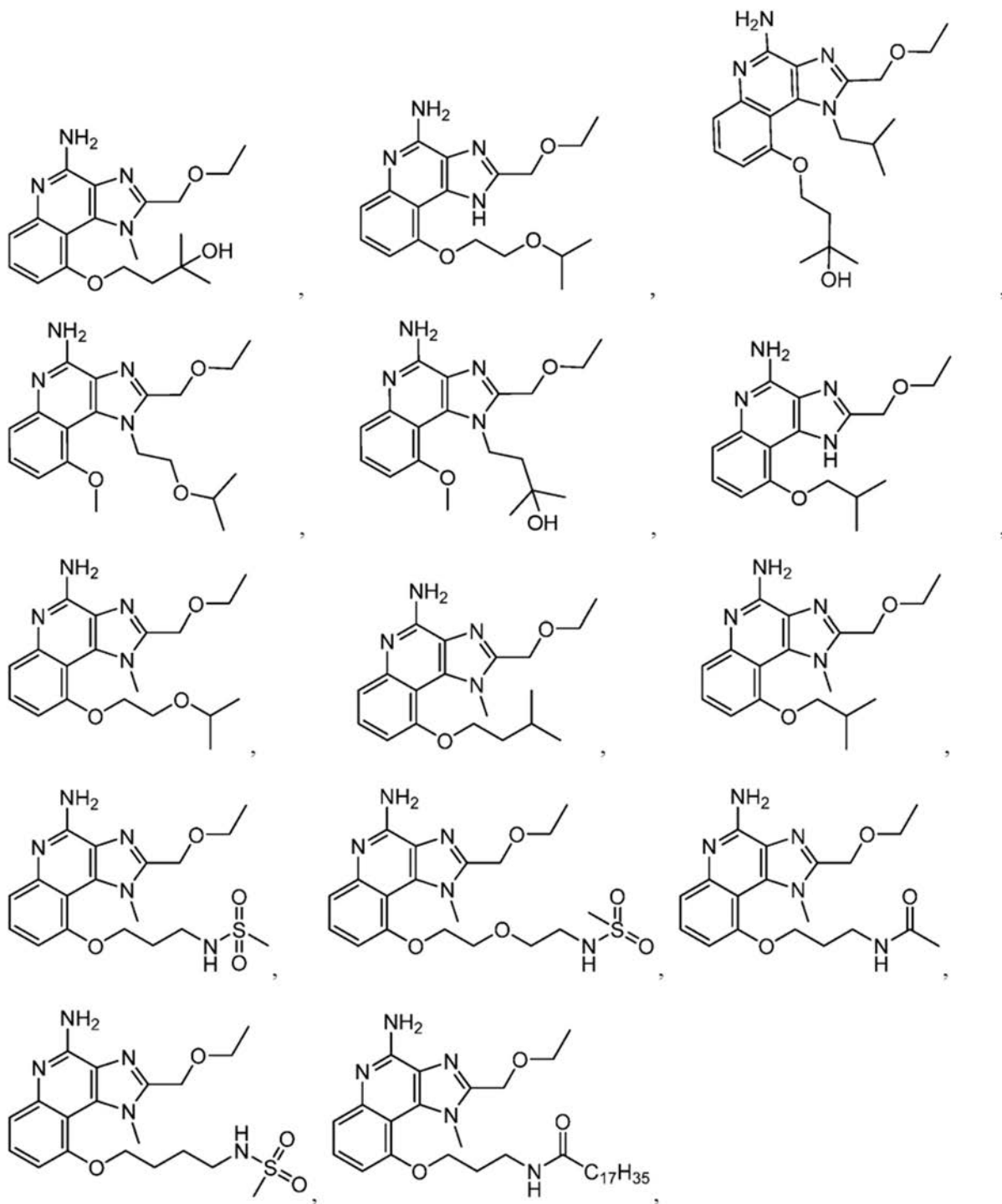


,

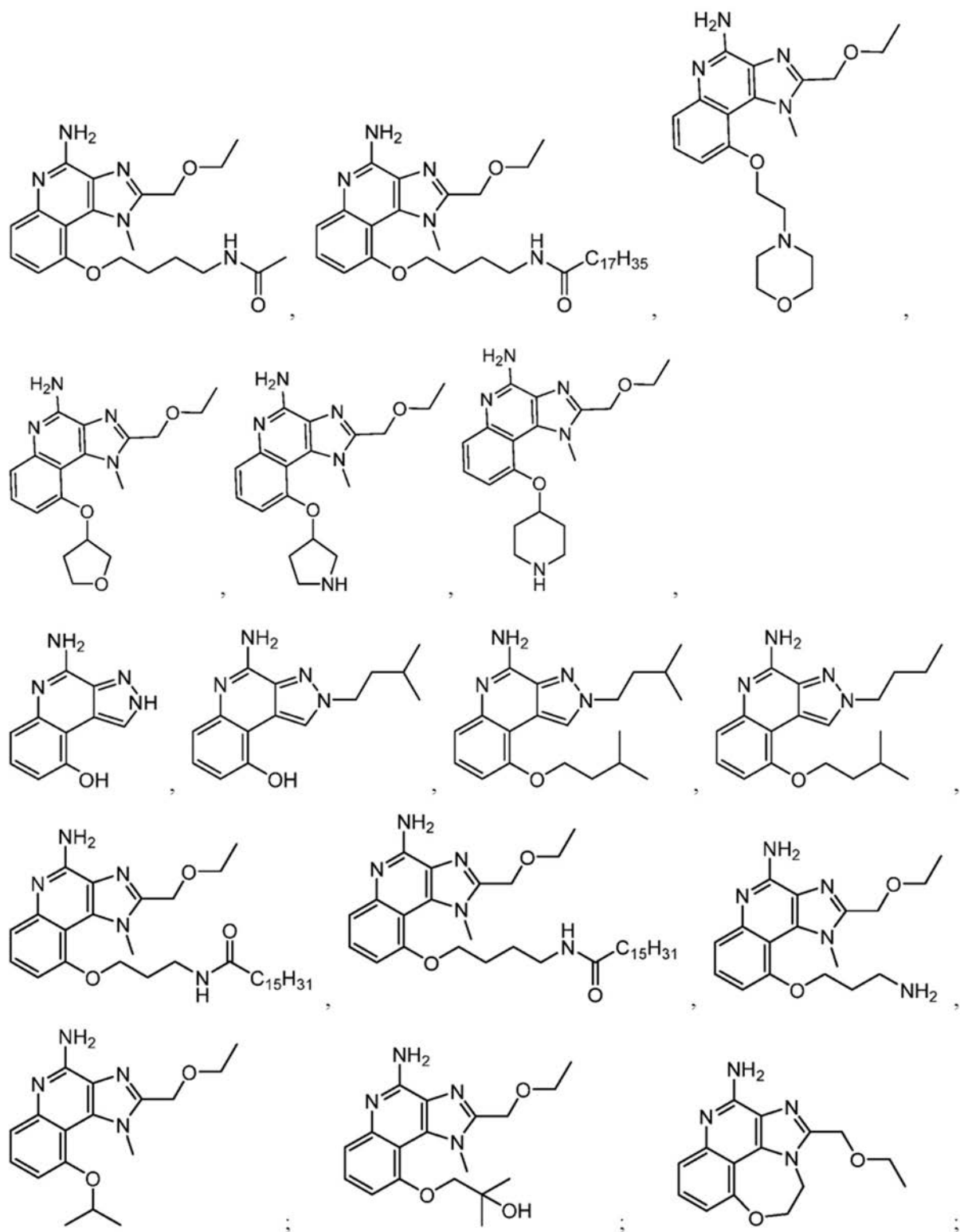


,

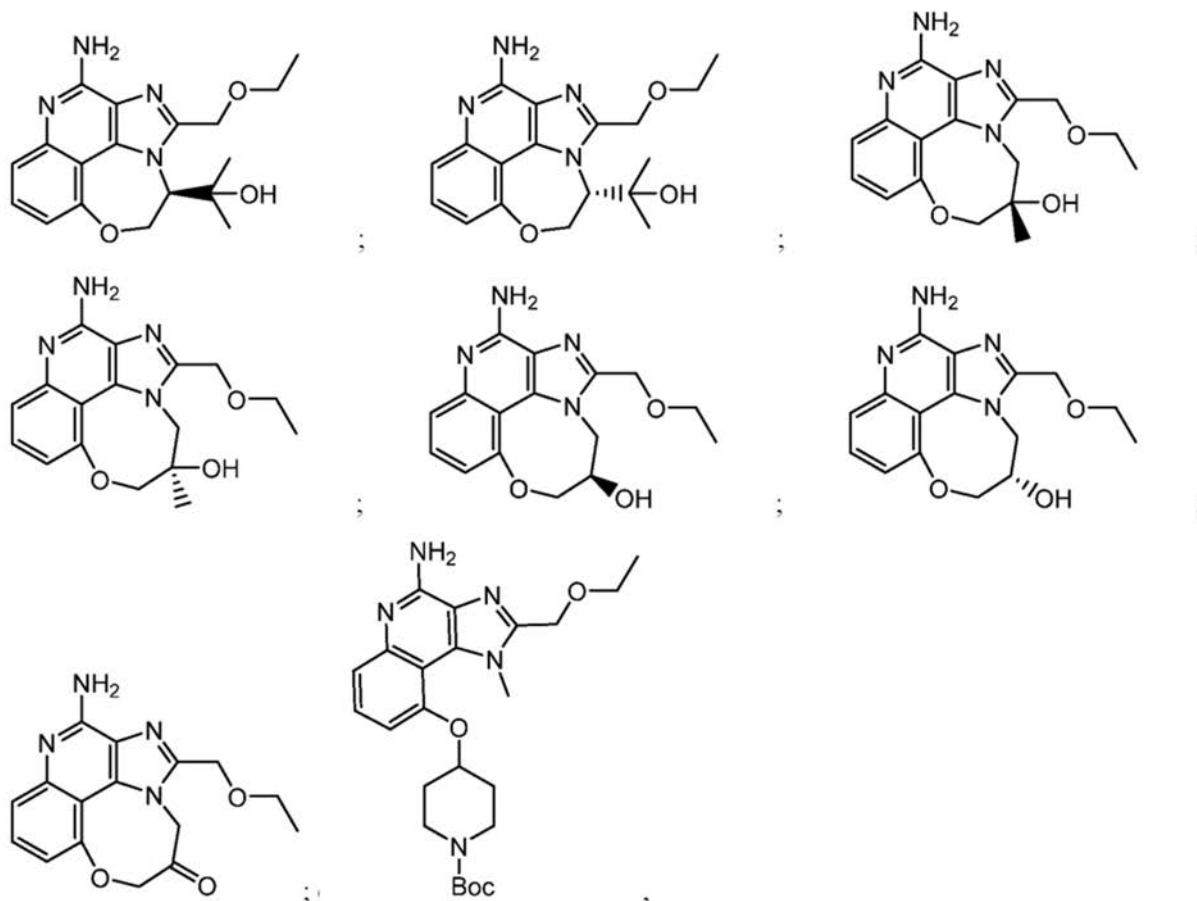
【化 6】



【化 7】



【化 8】



【請求項 36】

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 37】

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 38】

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

[illegible]

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 - 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 36 に記載の化合物。

【請求項 39】

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 37 に記載の化合物。

【請求項 40】

請求項 1 から 39 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、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 41】

前記ウイルス感染が H C V 感染を含む、請求項 40 に記載の医薬組成物。

【請求項 42】

請求項 1 から 39 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。