

【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 1 年 11 月 21 日 (2019.11.21)

【公表番号】特表 2018-529671 (P2018-529671A)

【公表日】平成 30 年 10 月 11 日 (2018.10.11)

【年通号数】公開・登録公報 2018-039

【出願番号】特願 2018-511491 (P2018-511491)

【国際特許分類】

C 07 H 19/10 (2006.01)

A 61 K 31/7072 (2006.01)

A 61 P 31/14 (2006.01)

【F I】

C 07 H 19/10 C S P

A 61 K 31/7072

A 61 P 31/14

【手続補正書】

【提出日】令和 1 年 10 月 4 日 (2019.10.4)

【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】

(S) - イソプロピル 2 - (((S) - (((2R, 3R, 4S, 5R) - 4 - ブロモ - 5 - (2, 4 - ジオキソ - 3, 4 - ジヒドロピリミジン - 1 (2H) - イル) - 4 - フルオロ - 3 - ヒドロキシテトラヒドロフラン - 2 - イル) メトキシ) (フェノキシ) ホスホリル) アミノ) プロパノエート、または該化合物の医薬として許容される塩。

【請求項 2】

エチル 2 - (((((2R, 3R, 4R, 5R) - 4 - ブロモ - 4 - クロロ - 5 - (2, 4 - ジオキソ - 3, 4 - ジヒドロピリミジン - 1 (2H) - イル) - 3 - ヒドロキシテトラヒドロフラン - 2 - イル) メトキシ) (フェノキシ) ホスホリル) アミノ) - 2 - メチルプロパノエート、または該化合物の医薬として許容される塩。

【請求項 3】

エチル 2 - (((R) - (((2R, 3R, 4R, 5R) - 4 - ブロモ - 4 - クロロ - 5 - (2, 4 - ジオキソ - 3, 4 - ジヒドロピリミジン - 1 (2H) - イル) - 3 - ヒドロキシテトラヒドロフラン - 2 - イル) メトキシ) (フェノキシ) ホスホリル) アミノ) - 2 - メチルプロパノエート、または該化合物の医薬として許容される塩。

【請求項 4】

エチル 2 - (((S) - (((2R, 3R, 4R, 5R) - 4 - ブロモ - 4 - クロロ - 5 - (2, 4 - ジオキソ - 3, 4 - ジヒドロピリミジン - 1 (2H) - イル) - 3 - ヒドロキシテトラヒドロフラン - 2 - イル) メトキシ) (フェノキシ) ホスホリル) アミノ) - 2 - メチルプロパノエート、または該化合物の医薬として許容される塩。

【請求項 5】

エチル 2 - (((S) - (((2R, 3R, 4S, 5R) - 4 - ブロモ - 5 - (2, 4 - ジオキソ - 3, 4 - ジヒドロピリミジン - 1 (2H) - イル) - 4 - フルオロ - 3 - ヒドロキシテトラヒドロフラン - 2 - イル) メトキシ) (フェノキシ) ホスホリル) アミノ) - 2 - メチルプロパノエート、または該化合物の医薬として許容される塩。

【請求項 6】

請求項 1 の化合物または塩を H C V 患者に投与することを含む、H C V の治療方法。

【請求項 7】

請求項 2 の化合物または塩を H C V 患者に投与することを含む、H C V の治療方法。

【請求項 8】

請求項 3 の化合物または塩を H C V 患者に投与することを含む、H C V の治療方法。

【請求項 9】

請求項 4 の化合物または塩を H C V 患者に投与することを含む、H C V の治療方法。

【請求項 10】

請求項 5 の化合物または塩を H C V 患者に投与することを含む、H C V の治療方法。

【請求項 11】

請求項 1 の化合物または塩を含む医薬組成物。

【請求項 12】

請求項 2 の化合物または塩を含む医薬組成物。

【請求項 13】

請求項 3 の化合物または塩を含む医薬組成物。

【請求項 14】

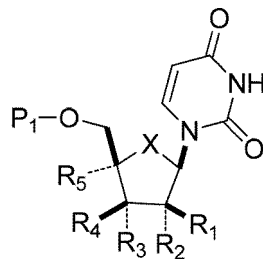
請求項 4 の化合物または塩を含む医薬組成物。

【請求項 15】

請求項 5 の化合物または塩を含む医薬組成物。

【請求項 16】

式 V I I :



式 V I I "

の化合物またはその医薬として許容される塩

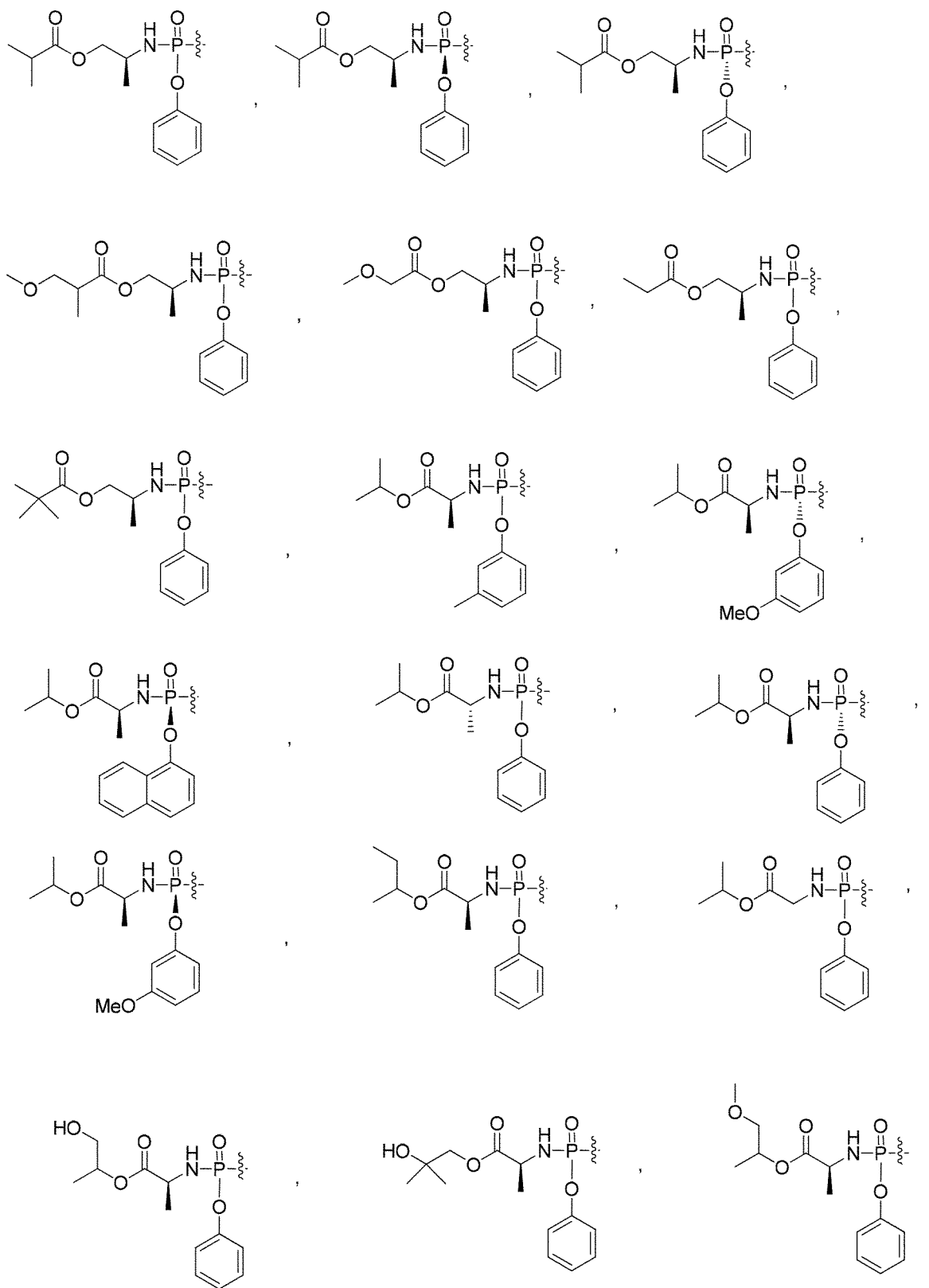
(式中、

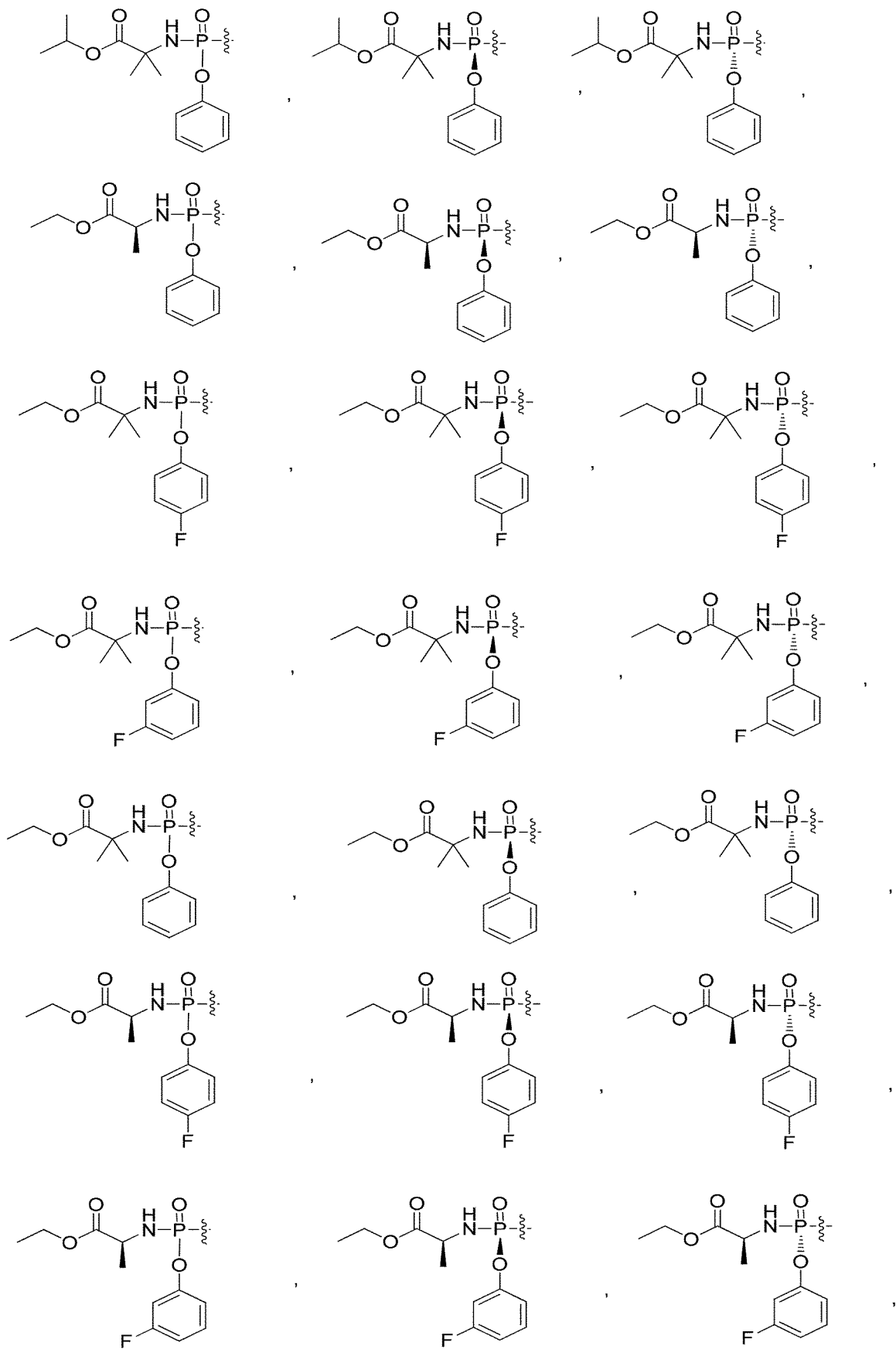
X は、O および $C = CH_2$ からなる群から選択され；

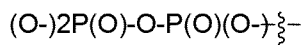
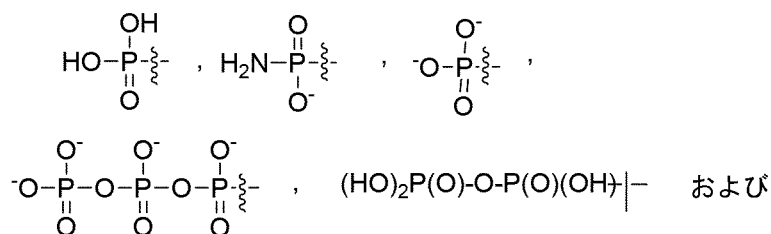
R_1 および R_2 は、F、Cl、Br、 CH_3 、 CHF_2 および CCH からなる群から独立して選択され；

R_3 、 R_4 および R_5 は、H、D、F、 N_3 、 OCH_3 、CN、OH、1H-テトラゾール-5-イル、2H-テトラゾール-2-イル、1H-テトラゾール-1-イル、1H-イミダゾール-1-イル、1H-イミダゾール-2-イルおよび1H-イミダゾール-5-イルからなる群から独立して選択され；

P_1 は、







からなる群から選択される)。

【請求項 17】

R_1 が Br であり、および R_2 が F であるか、または R_1 が Cl であり、および R_2 が F である、請求項 16 に記載の化合物またはその医薬として許容される塩。

【請求項 18】

R_1 が Br であり、および R_2 が F である、請求項 16 に記載の化合物またはその医薬として許容される塩。

【請求項 19】

R_3 が OH であり、および R_4 が H である、請求項 16 に記載の化合物またはその医薬として許容される塩。

【請求項 20】

R_3 が OH である、請求項 16 に記載の化合物またはその医薬として許容される塩。

【請求項 21】

X が O である、請求項 16 に記載の化合物またはその医薬として許容される塩。

【請求項 22】

R_5 が、H、D、F、 N_3 、 OCH_3 、CN、OH、1H-テトラゾール-5-イル、2H-テトラゾール-2-イル、1H-テトラゾール-1-イル、1H-イミダゾール-1-イル、1H-イミダゾール-2-イルおよび1H-イミダゾール-5-イルからなる群から選択される、請求項 16 に記載の化合物またはその医薬として許容される塩。

【請求項 23】

(S)-イソプロピル 2-((S)-((2R, 3R, 4R, 5R)-4-ブromo-4-クロロ-5-(2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロピリミジン-1(2H)-イル)-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メトキシ)(フェノキシ)ホスホリル)アミノ)プロパノエート、

(S)-イソプロピル 2-((S)-((2R, 3R, 4S, 5R)-4-ブromo-5-(2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロピリミジン-1(2H)-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メトキシ)(フェノキシ)ホスホリル)アミノ)プロパノエート、

エチル 2-((R)-((2R, 3R, 4S, 5R)-4-ブromo-5-(2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロピリミジン-1(2H)-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシテトラヒドロフラン-2-イル)メトキシ)(フェノキシ)ホスホリル)アミノ)-2-メチルプロパノエート、

エチル 2-(((2R, 3R, 4R, 5R)-5-(2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロピリミジン-1(2H)-イル)-4-フルオロ-3-ヒドロキシ-4-メチルテトラヒドロフラン-2-イル)メトキシ)(フェノキシ)ホスホリル)アミノ)-2-メチルプロパノエート、

エチル 2-(((2R, 3R, 4R, 5R)-4-クロロ-5-(2, 4-ジオキソ-3, 4-ジヒドロピリミジン-1(2H)-イル)-3-ヒドロキシ-4-メチルテトラヒドロフラン-2-イル)メトキシ)(フェノキシ)ホスホリル)アミノ)-2-メチルプロパノエート、

エチル 2 - (((((2 R , 3 R , 5 R) - 4 , 4 - ジクロロ - 5 - (2 , 4 - ジオキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 1 (2 H) - イル) - 3 - ヒドロキシテトラヒドロフラン - 2 - イル) メトキシ) (フェノキシ) ホスホリル) アミノ) - 2 - メチルプロパノエート、および

(S) - イソプロピル 2 - (((S) - (((2 R , 3 R , 4 S , 5 R) - 4 - ブロモ - 4 - クロロ - 5 - (2 , 4 - ジオキソ - 3 , 4 - ジヒドロピリミジン - 1 (2 H) - イル) - 3 - ヒドロキシテトラヒドロフラン - 2 - イル) メトキシ) (フェノキシ) ホスホリル) アミノ) プロパノエート

からなる群から選択される、請求項 16 に記載の化合物またはその医薬として許容される塩。

【請求項 24】

請求項 16 の化合物または塩を、C 型肝炎ウイルスに感染している患者に投与することを含む、HCV の治療方法。

【請求項 25】

請求項 22 の化合物または塩を、C 型肝炎ウイルスに感染している患者に投与することを含む、HCV の治療方法。

【請求項 26】

請求項 16 の化合物または塩を含む医薬組成物。

【請求項 27】

請求項 23 の化合物または塩を含む医薬組成物。