

【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】平成20年3月27日(2008.3.27)

【公表番号】特表2007-536240(P2007-536240A)

【公表日】平成19年12月13日(2007.12.13)

【年通号数】公開・登録公報2007-048

【出願番号】特願2007-511484(P2007-511484)

【国際特許分類】

C 0 7 C 271/22 (2006.01)

C 0 7 C 237/22 (2006.01)

A 6 1 K 31/27 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/341 (2006.01)

C 0 7 D 307/71 (2006.01)

A 6 1 K 31/165 (2006.01)

A 6 1 K 31/4402 (2006.01)

C 0 7 D 213/70 (2006.01)

A 6 1 K 31/353 (2006.01)

C 0 7 D 311/58 (2006.01)

C 1 2 N 9/99 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 271/22 C S P

C 0 7 C 237/22

A 6 1 K 31/27

A 6 1 K 37/02

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 31/341

C 0 7 D 307/71

A 6 1 K 31/165

A 6 1 K 31/4402

C 0 7 D 213/70

A 6 1 K 31/353

C 0 7 D 311/58

C 1 2 N 9/99

【手続補正書】

【提出日】平成20年2月4日(2008.2.4)

【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

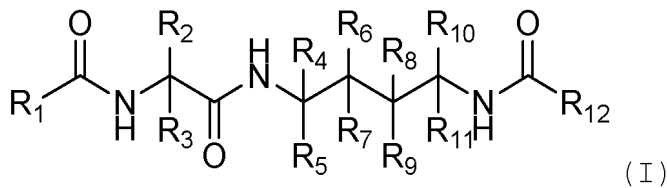
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



式 (I) 中、 R_1 は H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、または OR_a であり；

R_2 、 R_3 、 R_4 および R_{10} の各々は、独立して、H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、またはアリールであり；

R_5 および R_{11} の各々は、独立して、アリールで置換されたアルキルであり；

R_6 、 R_7 、 R_8 、および R_9 の各々は、独立して、H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、または OR_b であり；ならびに

R_{12} は OR_c 、 $NHC(O)R_c$ 、または $NHC(O)OR_c$ で置換された $C_1 - C_{10}$ アルキルであり；

ここで、 R_a 、 R_b 、および R_c の各々は、独立して、H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、またはアリールである；

の化合物、またはそれらの塩、プロドラッグ、もしくは溶媒和物の有効量を含む、コロナウイルス感染治療剤組成物。

【請求項 2】

R_1 が $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、または OR_a であり； R_2 、 R_3 、 R_4 および R_{10} の各々が、独立して、H または $C_1 - C_{10}$ アルキルであり；ならびに R_6 、 R_7 、 R_8 、および R_9 の各々が、独立して、H または OR_b である、請求項 1 に記載の 組成物。

【請求項 3】

R_5 および R_{11} の各々がフェニルで置換されたアルキルである、請求項 2 に記載の 組成物。

【請求項 4】

R_2 がイソプロピルである、請求項 3 に記載の 組成物。

【請求項 5】

R_6 、 R_7 、 R_8 、および R_9 の各々は、独立して、H または OH である、請求項 4 に記載の 組成物。

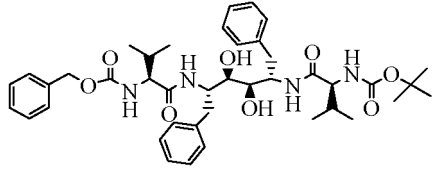
【請求項 6】

R_1 が $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、 OR 、 SR 、または $NHC(O)OR$ で置換された $C_1 - C_{10}$ アルキルであり； R は H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、またはアリールである、請求項 5 に記載の 組成物。

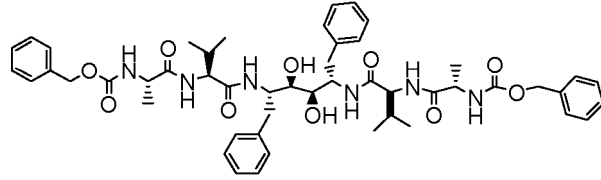
【請求項 7】

前記化合物が 下記化合物 1、2、および 25 - 35 のうちの 1 つである、請求項 6 に記載の組成物。

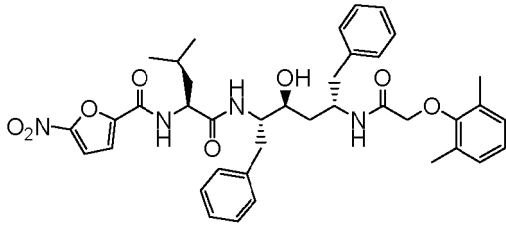
【化 2】



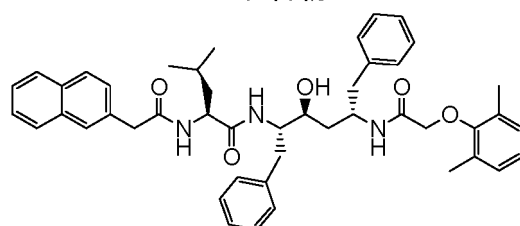
化合物1



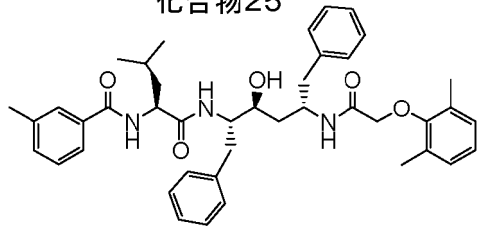
化合物2



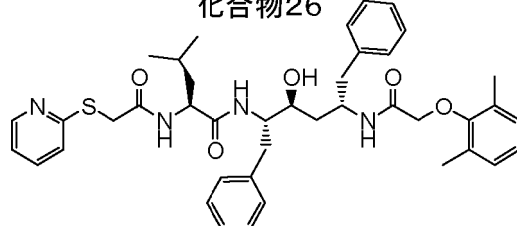
化合物25



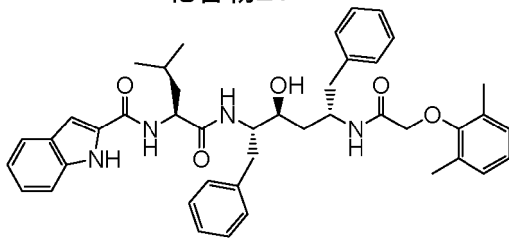
化合物26



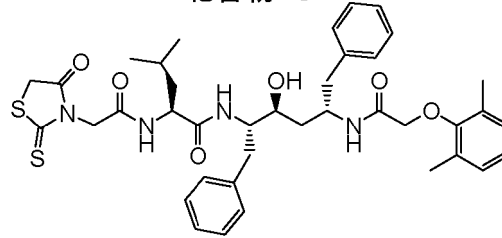
化合物27



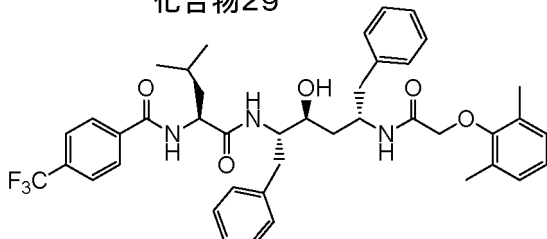
化合物28



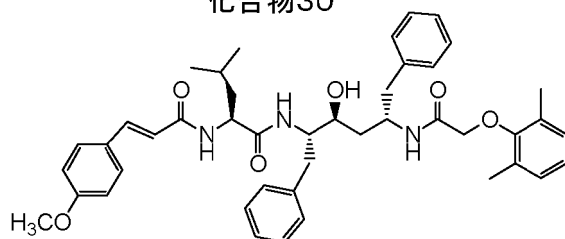
化合物29



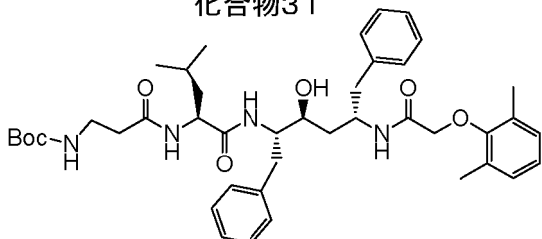
化合物30



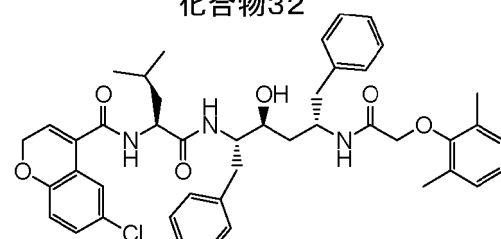
化合物31



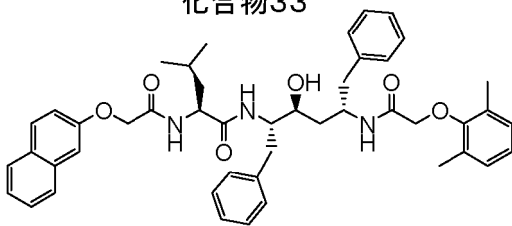
化合物32



化合物33



化合物34



化合物35

【請求項 8】

前記化合物が化合物 2 である、請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 9】

前記コロナウイルスが重症急性呼吸器症候群ウイルスである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 10】

R_1 が $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、または OR_a であり； R_2 、 R_3 、 R_4 および R_{10} の各々は、独立して、H または $C_1 - C_{10}$ アルキルであり；ならびに R_6 、 R_7 、 R_8 、および R_9 の各々は、独立して、H または OR_b である、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 11】

R_5 および R_{11} の各々がフェニルで置換されたアルキルである、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】

R_2 がイソプロピルである、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 13】

R_6 、 R_7 、 R_8 、および R_9 の各々が、独立して、H または OH である、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 14】

R_1 が $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、OR、SR、または $NHC(O)OR$ で置換された $C_1 - C_{10}$ アルキルであり；R は H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、またはアリールである、請求項 13 に記載の組成物。

【請求項 15】

前記化合物が化合物 1、2、および 25 - 35 のうちの 1 つである、請求項 14 に記載の組成物。

【請求項 16】

前記化合物が化合物 2 である、請求項 15 に記載の組成物。

【請求項 17】

前記組成物が、ヒト免疫不全ウイルス治療剤組成物でもある、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 18】

前記化合物が化合物 2 である、請求項 17 に記載の組成物。

【請求項 19】

前記組成物が、ヒト免疫不全ウイルス治療剤組成物でもある、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 20】

前記化合物が化合物 2 である、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 21】

前記組成物が、ネコ免疫不全ウイルス治療剤組成物でもある、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 22】

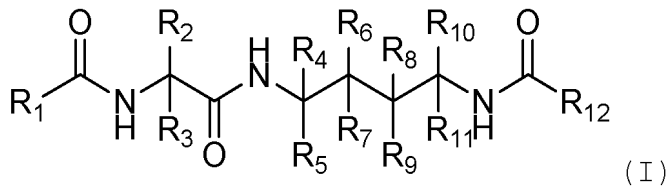
前記化合物が化合物 2 である、請求項 21 に記載の組成物。

【請求項 23】

容器；

式 (I)：

【化3】



式 (I) 中、 R_1 は H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、または OR_a であり；

R_2 、 R_3 、 R_4 および R_{10} の各々は、独立して、H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、またはアリールであり；

R_5 および R_{11} の各々は、独立して、アリールで置換されたアルキルであり；

R_6 、 R_7 、 R_8 、および R_9 の各々は、独立して、H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、または OR_b であり；ならびに

R_{12} は OR_c 、 $NHC(O)R_c$ 、または $NHC(O)OR_c$ で置換された $C_1 - C_{10}$ アルキルであり；

ここで、 R_a 、 R_b 、および R_c の各々は、独立して、H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、またはアリールである：の化合物またはそれらの塩；および

容器およびコロナウイルスの感染治療を目的とした化合物投与の表示に関連する説明文を含むパッケージ製品。

【請求項24】

前記コロナウイルスが重症急性呼吸器症候群ウイルスである、請求項23に記載のパッケージ製品。

【請求項25】

前記説明文がさらにヒト免疫不全ウイルスの感染治療用の化合物の投与を指示する、請求項23に記載のパッケージ製品。

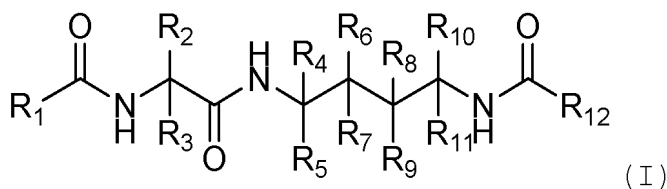
【請求項26】

前記説明文がさらにネコ免疫不全ウイルスの感染治療用の化合物の投与を指示する、請求項23に記載のパッケージ製品。

【請求項27】

式 (I)：

【化4】



式 (I) 中、 R_1 は H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、または OR_a であり；

R_2 、 R_3 、 R_4 および R_{10} の各々は、独立して、H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、またはアリールであり；

R_5 および R_{11} の各々は、独立して、アリールで置換されたアルキルであり；

R_6 、 R_7 、 R_8 、および R_9 の各々は、独立して、H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、または OR_b であり；

ならびに R_{12} は OR_c 、 $NHC(O)R_c$ 、または $NHC(O)OR_c$ で置換された $C_1 - C_{10}$ アルキルであり；

ここで、 R_a 、 R_b 、および R_c の各々は、独立して、 H 、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、またはアリールである；

の化合物、またはそれらの塩、プロドラッグ、もしくは溶媒和物の有効量を含む、コロナウイルスプロテアーゼ阻害剤組成物。

【請求項 28】

前記コロナウイルスプロテアーゼが重症急性呼吸器症候群ウイルスプロテアーゼである、請求項 27 に記載の組成物。

【請求項 29】

前記組成物が、ヒト免疫不全ウイルスプロテアーゼ阻害剤組成物でもある、請求項 28 に記載の組成物。

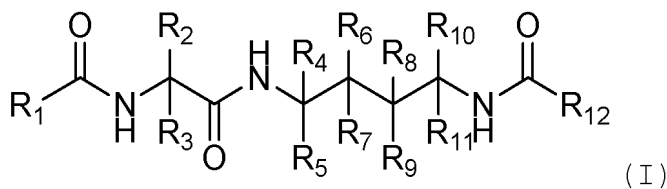
【請求項 30】

前記組成物が、ネコ免疫不全ウイルスプロテアーゼ阻害剤組成物でもある、請求項 29 に記載の組成物。

【請求項 31】

式 (I)：

【化 5】



式 (I) 中、 R_1 は H 、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、 OR_a 、または $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、 OR_a 、もしくは SR_a で置換された $C_1 - C_{10}$ アルキルであり；

R_2 、 R_3 、 R_4 および R_{10} の各々は、独立して、 H 、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、またはアリールであり；

R_5 および R_{11} の各々は、アリールで置換されたアルキルであり；

R_6 、 R_7 、 R_8 、および R_9 の各々は、独立して、 H 、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、または OR_b であり；ならびに

R_{12} は OR_c 、 $NHC(O)R_c$ 、または $NHC(O)OR_c$ で置換された $C_1 - C_{10}$ アルキルであり；

ここで、 R_a 、 R_b 、および R_c の各々は、独立して、 H 、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、またはアリールである；

の化合物またはそれらの塩。

【請求項 32】

R_1 が $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、アリール、 OR_a 、または $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、アリール、 OR_a 、もしくは SR_a で置換された $C_1 - C_{10}$ アルキルであり； R_2 、 R_3 、 R_4 および R_{10} の各々が、独立して、 H または $C_1 - C_{10}$ アルキルであり；ならびに R_6 、 R_7 、 R_8 、および R_9 の各々が、独立して、 H または OR_b である、請求項 31 に記載の化合物。

【請求項 33】

R_5 および R_{11} の各々がフェニルで置換されたアルキルである、請求項 32 に記載の

化合物。

【請求項 34】

R_2 がイソプロピルである、請求項 33 に記載の化合物。

【請求項 35】

R_6 、 R_7 、 R_8 、および R_9 の各々は、独立して、H または OH である、請求項 34 に記載の化合物。

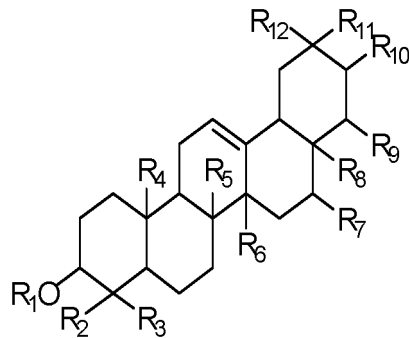
【請求項 36】

前記化合物が化合物 1 および 25 - 35 のうちの 1 つである、請求項 35 に記載の化合物。

【請求項 37】

式 (II) :

【化 6】



(II).

式 (II) 中、 R_1 は $C_3 - C_{20}$ シクロアルキルまたは $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキルであり；

R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_{11} 、および R_{12} の各々は、独立して、H、 $C_1 - C_{10}$ アルキルまたは OR_a であり；

R_7 および R_{10} の各々は、H であり；または R_7 および R_{10} は結合して、 $-O-$ であり；

R_8 は $C_1 - C_{10}$ アルキルまたは $COOR_b$ であり；ならびに

R_9 は H、 OR_c 、または $OC(O)R_c$ であり；

ここで R_a 、 R_b 、および R_c の各々は、独立して、H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、またはアリールである；

の化合物、またはそれらの塩、プロドラッグ、もしくは溶媒和物の有効量を含む、コロナウイルス感染治療剤組成物。

【請求項 38】

R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_{11} 、および R_{12} の各々は、独立して、H、OH、または必要であれば OH で置換される CH_3 である、請求項 37 に記載の 組成物。

【請求項 39】

R_8 が CH_3 または $COOH$ である、請求項 38 に記載の 組成物。

【請求項 40】

R_1 が $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、OR、または COOR で置換されたテトラヒドロピラニルであり；R は H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、またはアリールである、請求項 39 に記載の 組成物。

【請求項 41】

前記化合物が化合物 5、16 および 18 のうちの 1 つである、請求項 40 に記載の 組成物。

【請求項 42】

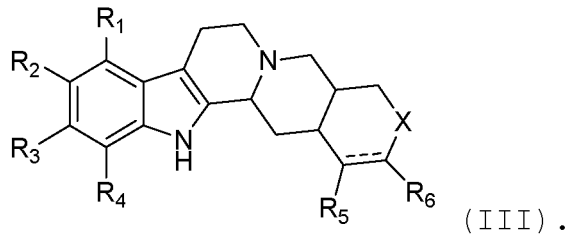
前記コロナウイルスが重症急性呼吸器症候群ウイルスである、請求項 37 に記載の 組成

物。

【請求項 43】

式 (III) :

【化 7】



式 (III) 中、

【化 8】

は、単一結合または二重結合であり；

X は、 $-O-$ または $-C(R_a R_b)-$ であり；ならびに

R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、および R_6 の各々は、独立して、H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリーール、アリーール、 OR_c 、または $COOR_c$ であり；

ここで R_a 、 R_b 、および R_c の各々は、独立して、H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリーール、アリーール、または $OC(O)R$ であり；R は H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_3 - C_{20}$ シクロアルキル、 $C_3 - C_{20}$ ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリーール、またはアリーールである

の化合物、またはそれらの塩、プロドラッグ、もしくは溶媒和物の有効量を含む、コロナウイルス感染治療剤組成物。

【請求項 44】

【化 9】

が、単一結合である、請求項 43 に記載の組成物。

【請求項 45】

X は、 $-C(R_a R_b)-$ である、請求項 44 に記載の組成物。

【請求項 46】

R_a および R_b の各々は、独立して、H または $OC(O)R$ である、請求項 45 に記載の組成物。

【請求項 47】

R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、および R_6 の各々は、独立して、H、OH、 OCH_3 、または $COOCH_3$ である、請求項 46 に記載の組成物。

【請求項 48】

前記化合物が化合物 13、19 および 21 - 24 のうちの 1 つである、請求項 47 に記載の組成物。

【請求項 49】

【化 10】

が二重結合である、請求項 43 に記載の組成物。

【請求項 50】

X が $-O-$ である、請求項 49 に記載の組成物。

【請求項 51】

R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、および R_6 の各々が、独立して、HまたはCOOCH₃である、請求項50に記載の組成物。

【請求項52】

前記化合物が化合物20である、請求項51に記載の組成物。

【請求項53】

前記コロナウイルスが重症急性呼吸器症候群ウイルスである、請求項43に記載の組成物。

【請求項54】

化合物3、4、6～12、14、15および17からなる群から選ばれる化合物、またはそれらの塩、プロドラッグ、もしくは溶媒和物の有効量を含む、コロナウイルス感染治療剤組成物。

