

【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21年8月20日(2009.8.20)

【公表番号】特表2007-525527(P2007-525527A)

【公表日】平成19年9月6日(2007.9.6)

【年通号数】公開・登録公報2007-034

【出願番号】特願2007-501073(P2007-501073)

【国際特許分類】

C 07 F 9/09 (2006.01)

C 07 C 311/41 (2006.01)

A 61 K 31/661 (2006.01)

A 61 P 31/18 (2006.01)

A 61 K 31/27 (2006.01)

【F I】

C 07 F 9/09 C S P U

C 07 C 311/41

A 61 K 31/661

A 61 P 31/18

A 61 K 31/27

【手続補正書】

【提出日】平成21年7月3日(2009.7.3)

【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

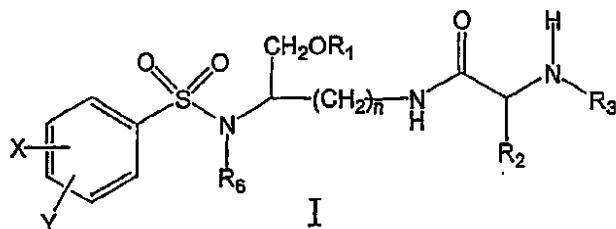
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式1:

【化1】



の化合物または医薬品として許容できるこれらの塩であつて、

式中、nは3または4であり、

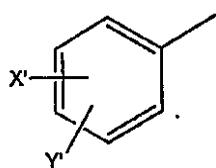
XおよびYは、同一であつても異なつてもよく、H、炭素原子1~6個の直鎖アルキル基、炭素原子3~6個の分岐アルキル基、炭素原子3~6個のシクロアルキル基、F、Cl、Br、I、-CF₃、-OCF₃、-CN、-NO₂、-NR₄R₅、-NHCOR₄、-OR₄、-SR₄、-COOR₄、-COR₄、および-CH₂OHからなる群から選択されるか、または、XおよびYが一緒になって式-OCH₂O-のメチレンジオキシ基および式-OCH₂CH₂O-のエチレンジオキシ基からなる群から選択されるアルキレンジオキシ基を定義するかであり、

R₆は、炭素原子1~6個の直鎖アルキル基、炭素原子3~6個の分岐アルキル基、およびシクロアルキルアルキル基(そのシクロアルキル部分に炭素原子3~6個を有し、そ

のアルキル部分に炭素原子1～3個を有するもの)からなる群から選択され、

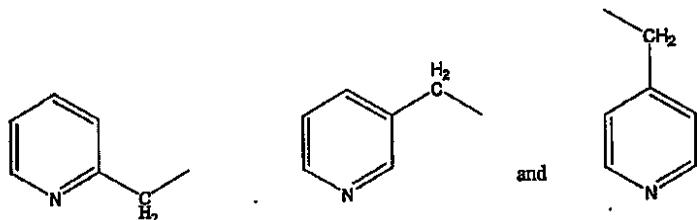
R_3 は、H、炭素原子1～6個の直鎖アルキル基、炭素原子3～6個の分岐アルキル基、炭素原子3～6個のシクロアルキル基、および、式 $R_{3A}-CO-$ の基からなる群から選択され(前記式中、 R_{3A} は、炭素原子1～6個の直鎖または分岐アルキル基、炭素原子3～6個のシクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基(そのシクロアルキル部分に炭素原子3～6個を有し、そのアルキル部分に炭素原子1～3個を有するもの)、炭素原子1～6個のアルコキシ基、テトラヒドロ-3-フラニルオキシ基、-CH₂OH、-CF₃、-CH₂CF₃、-CH₂CH₂CF₃、ピロリジニル、ピペリジニル、4-モルホリニル、CH₃O₂C-、CH₃O₂CCH₂-、アセチル-OCH₂CH₂-、HO₂CCH₂-、3-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル、4-CH₃OC₆H₄CH₂-、CH₃NH-、(CH₃)₂N-、(CH₃CH₂)₂N-、(CH₃CH₂CH₂)₂N-、HOCH₂CH₂NH-、CH₃OCH₂O-、CH₃OCH₂CH₂O-、C₆H₅CH₂O-、2-ピロリル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、2-ピラジニル、2-キノリル、3-キノリル、4-キノリル、1-イソキノリル、3-イソキノリル、2-キノキサリニル、式:

【化2】



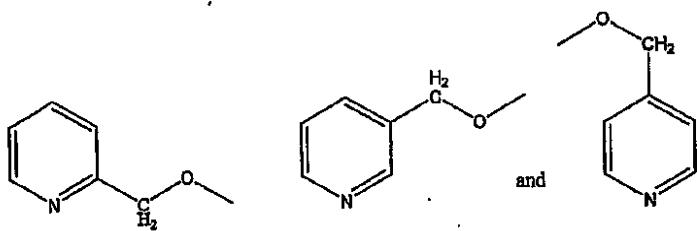
のフェニル基、式:

【化3】



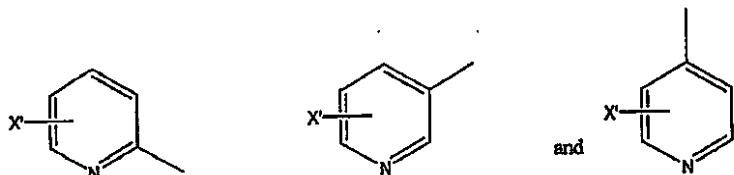
からなる群から選択されるピコリル基、式:

【化4】



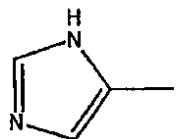
からなる群から選択されるピコリルオキシ基、式:

【化5】



からなる群から選択される置換ピリジル基、および、式:

【化6】



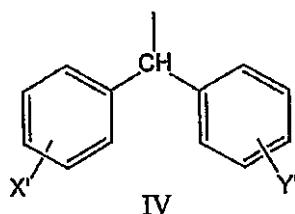
の基、からなる群から選択される)、

X'およびY'は、同一であっても異なっていてもよく、H、炭素原子1～6個の直鎖アルキル基、炭素原子3～6個の分岐アルキル基、炭素原子3～6個のシクロアルキル基、F、Cl、Br、I、-CF₃、-NO₂、-NR₄R₅、-NHCOR₄、-OR₄、-SR₄、-COOR₄、-COR₄、および-C₂H₅OHからなる群から選択され、

R₂およびR₅は、同一であっても異なっていてもよく、H、炭素原子1～6個の直鎖アルキル基、炭素原子3～6個の分岐アルキル基、および炭素原子3～6個のシクロアルキル基からなる群から選択され、

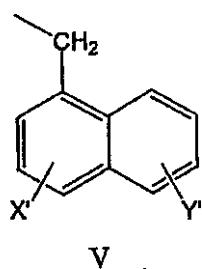
R₂は、式IV：

【化7】



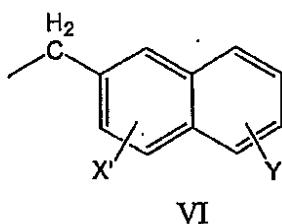
のジフェニルメチル基、式V：

【化8】



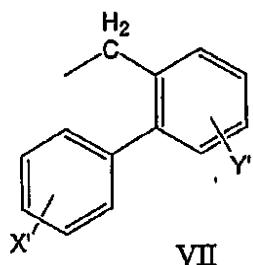
のナフチル-1-CH₂-基、式VI：

【化9】



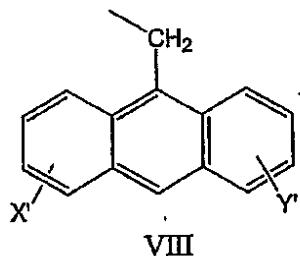
のナフチル-2-CH₂-基、式VII：

【化 1 0 】



のビフェニルメチル基、および、式VIII：

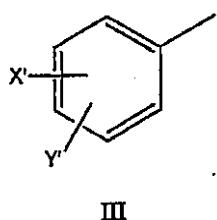
【化 1 1】



のアントリル-9-CH₂-基、からなる群から選択され、かつ、

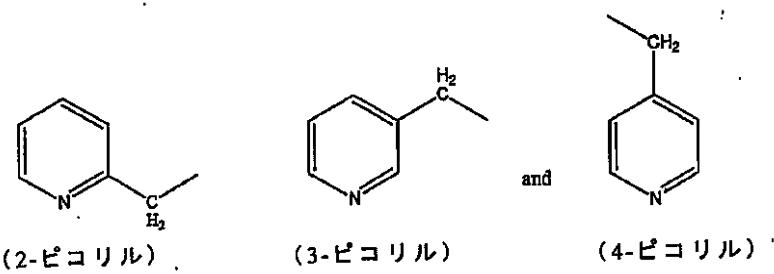
R₁ は、(HO)₂P(O)-、(MO)₂P(O)-、および式R_{1A}-CO-の基からなる群から選択される〔前記式中、Mは、アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属であり、R_{1A}は、炭素原子1～6個の直鎖または分岐アルキル基、炭素原子3～6個のシクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基(そのシクロアルキル部分に炭素原子3～6個を有し、そのアルキル部分に炭素原子1～3個を有するもの)、炭素原子1～6個のアルコキシ基、-CH₂OH、CH₃O₂C-、CH₃O₂CCH₂-、アセチル-OCH₂CH₂-、HO₂CCH₂-、2-ヒドロキシフェニル、3-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル、(CH₃)₂NCH₂-、(CH₃)₂CHCH(NH₂)-、HOCH₂CH₂NH-、CH₃OCH₂O-、CH₃OCH₂CH₂O-、2-ピロリル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、1-メチル-1,4-ジヒドロ-3-ピリジル、2-ピラジニル、2-キノリル、3-キノリル、4-キノリル、1-イソキノリル、3-イソキノリル、2-キノキサリニル、式：

【化 1 2】



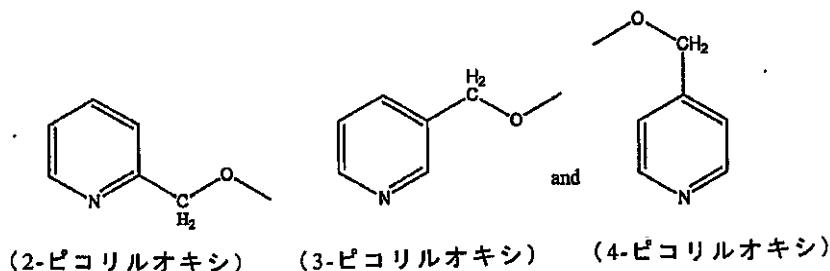
のフェニル基、式：

【化 1 3】



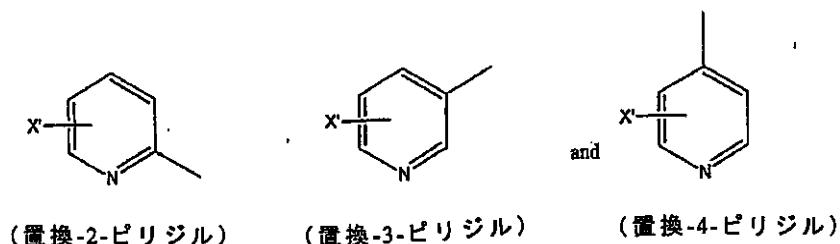
からなる群から選択されるピコリル基、式：

【化14】



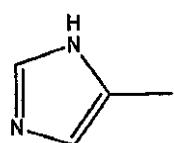
からなる群から選択されるピコリルオキシ基、式：

【化15】



からなる群から選択される置換ピリジル基、および、式：

【化16】

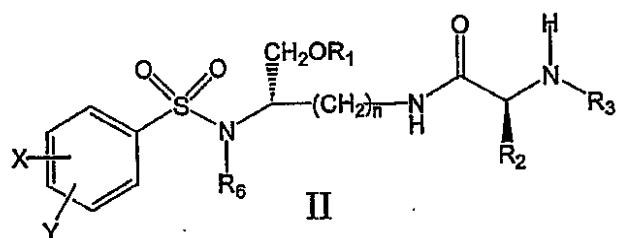


の基、からなる群から選択される]、
化合物または医薬品として許容できるこれらの塩。

【請求項2】

式II：

【化17】



の化合物または医薬品として許容できるこれらの塩であって、

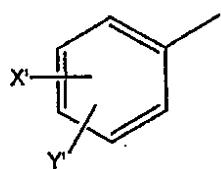
式中、nは3または4であり、

XおよびYは、同一であっても異なっていてもよく、H、炭素原子1～6個の直鎖アルキル基、炭素原子3～6個の分岐アルキル基、炭素原子3～6個のシクロアルキル基、F、Cl、Br、I、-CF₃、-OCF₃、-CN、-NO₂、-NR₄R₅、-NHCOR₄、-OR₄、-SR₄、-COOR₄、-COR₄、および-CH₂OHからなる群から選択されるか、または、XおよびYが一緒になって式-OCH₂-O-のメチレンジオキシ基および式-OCH₂CH₂O-のエチレンジオキシ基からなる群から選択されるアルキレンジオキシ基を定義するかのいずれかであり、

R₆は、炭素原子1～6個の直鎖アルキル基、炭素原子3～6個の分岐アルキル基、およびシクロアルキルアルキル基（そのシクロアルキル部分に炭素原子3～6個を有し、そのアルキル部分に炭素原子1～3個を有するもの）からなる群から選択され、

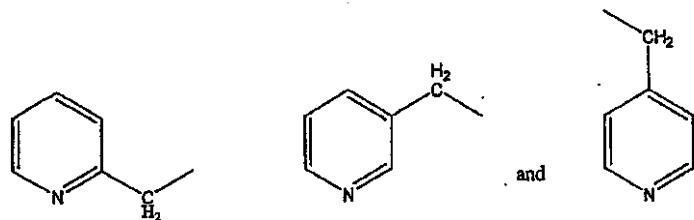
R_3 は、H、炭素原子1～6個の直鎖アルキル基、炭素原子3～6個の分岐アルキル基、炭素原子3～6個のシクロアルキル基、および、式 $R_{3A}-CO-$ の基からなる群から選択され〔前記式中、 R_{3A} は、炭素原子1～6個の直鎖または分岐アルキル基、炭素原子3～6個のシクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基（そのシクロアルキル部分に炭素原子3～6個を有し、そのアルキル部分に炭素原子1～3個を有するもの）、炭素原子1～6個のアルコキシ基、テトラヒドロ-3-フラニルオキシ基、-CH₂OH、-CF₃、-CH₂CF₃、-CH₂CH₂CF₃、ピロリジニル、ピペリジニル、4-モルホリニル、CH₃O₂C-、CH₃O₂CCH₂-、アセチル-OCH₂CH₂-、HO₂CCH₂-、3-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル、4-CH₃OC₆H₄CH₂-、CH₃NH-、(CH₃)₂N-、(CH₃CH₂)₂N-、(CH₃CH₂CH₂)₂N-、HOCH₂CH₂NH-、CH₃OCH₂O-、CH₃OCH₂CH₂O-、C₆H₅CH₂O-、2-ピロリル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、2-ピラジニル、2-キノリル、3-キノリル、4-キノリル、1-イソキノリル、3-イソキノリル、2-キノキサリニル、式：

【化18】



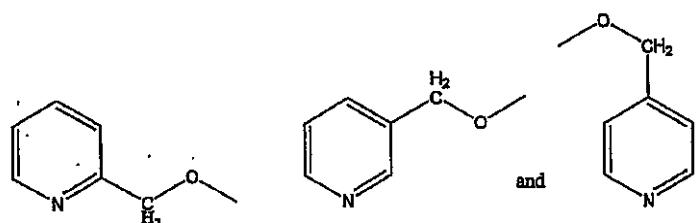
のフェニル基、式：

【化19】



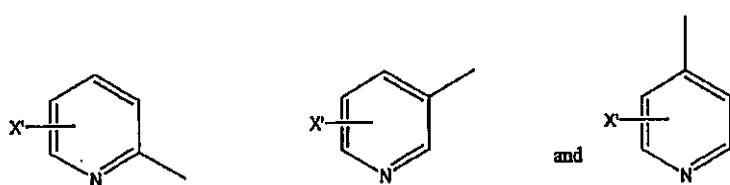
からなる群から選択されるピコリル基、式：

【化20】



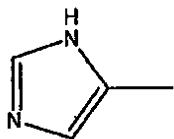
からなる群から選択されるピコリルオキシ基、式：

【化21】



からなる群から選択される置換ピリジル基、および、式：

【化22】



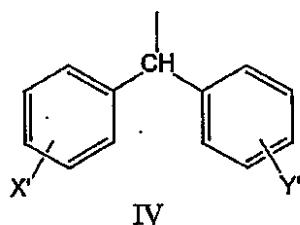
の基、からなる群から選択される)、

X'およびY'は、同一であっても異なっていてもよく、H、炭素原子1～6個の直鎖アルキル基、炭素原子3～6個の分岐アルキル基、炭素原子3～6個のシクロアルキル基、F、Cl、Br、I、-CF₃、-NO₂、-NR₄R₅、-NHCOR₄、-OR₄、-SR₄、-COOR₄、-COR₄、および-C₂H₅OHからなる群から選択され、

R₄およびR₅は、同一であっても異なっていてもよく、H、炭素原子1～6個の直鎖アルキル基、炭素原子3～6個の分岐アルキル基、および炭素原子3～6個のシクロアルキル基からなる群から選択され、

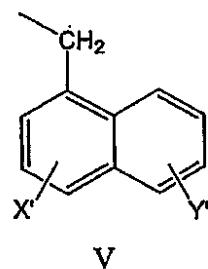
R₂は、式IV：

【化23】



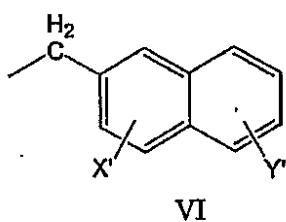
のジフェニルメチル基、式V：

【化24】



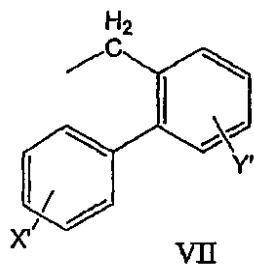
のナフチル-1-CH₂-基、式VI：

【化25】



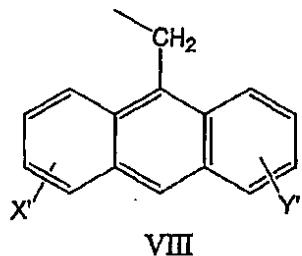
のナフチル-2-CH₂-基、式VII：

【化 2 6】



のビフェニルメチル基、および、式VIII：

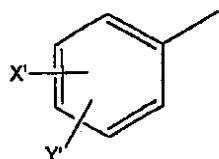
【化 2 7】



のアントリル-9-CH₂-基、からなる群から選択され、かつ、

R_1 は、 $(HO)_2P(O)-$ 、 $(MO)_2P(O)-$ 、 および式 $R_{1A}-CO-$ の基からなる群から選択される〔前記式中、 M は、 アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属であり、 R_{1A} は、 炭素原子 1 ~ 6 個の直鎖または分岐アルキル基、 炭素原子 3 ~ 6 個のシクロアルキル基、 シクロアルキルアルキル基（そのシクロアルキル部分に炭素原子 3 ~ 6 個を有し、 そのアルキル部分に炭素原子 1 ~ 3 個を有するもの）、 炭素原子 1 ~ 6 個のアルコキシ基、 $-CH_2OH$ 、 CH_3O_2C- 、 $CH_3O_2CCH_2-$ 、 アセチル- OCH_2CH_2- 、 HO_2CCH_2- 、 2-ヒドロキシフェニル、 3-ヒドロキシフェニル、 4-ヒドロキシフェニル、 $(CH_3)_2NCH_2-$ 、 $(CH_3)_2CHCH(NH_2)-$ 、 $HOCH_2CH_2NH-$ 、 CH_3OCH_2O- 、 $CH_3OCH_2CH_2O-$ 、 2-ピロリル、 2-ピリジル、 3-ピリジル、 4-ピリジル、 1-メチル-1,4-ジヒドロ-3-ピリジル、 2-ピラジニル、 2-キノリル、 3-キノリル、 4-キノリル、 1-イソキノリル、 3-イソキノリル、 2-キノキサリニル、 式：

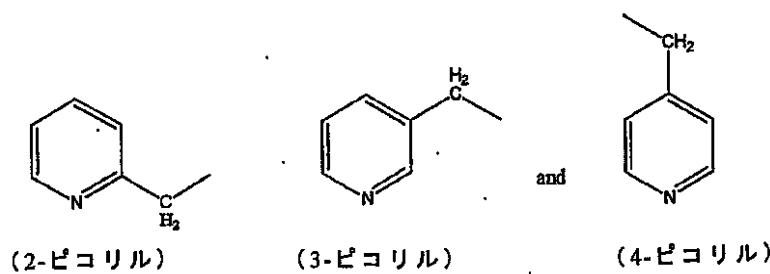
【化 2 8】



III

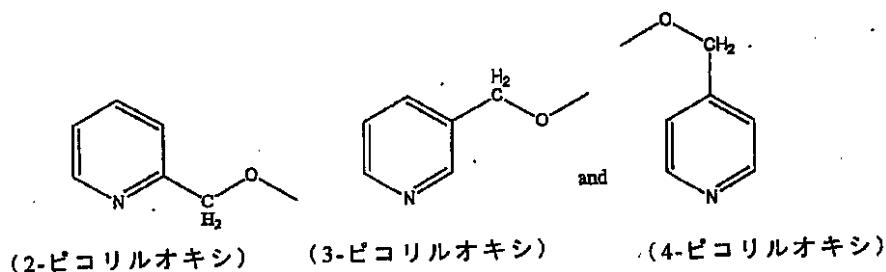
のフェニル基、式：

【化 2 9】



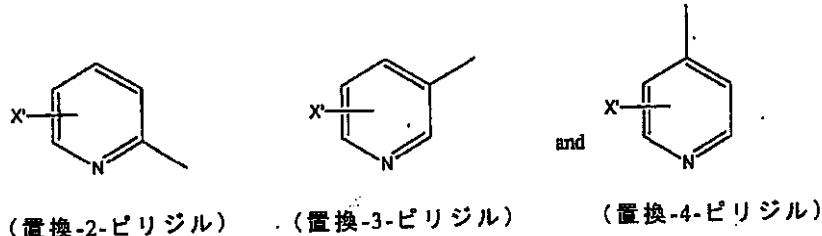
からなる群から選択されるピコリル基、式：

【化30】



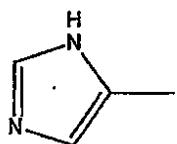
からなる群から選択されるピコリルオキシ基、式：

【化31】



からなる群から選択される置換ピリジル基、および、式：

【化32】



の基、からなる群から選択される]、

化合物または医薬品として許容できるこれらの塩。

【請求項3】

R_6 がイソブチルであり、 n が 3 である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項4】

R_6 がイソブチルであり、 n が 4 である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項5】

R_1 が $(HO)_2P(O)-$ または $(NaO)_2P(O)-$ である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項6】

R_1 が CH_3CO- 、3-ピリジル-CO-、 $(CH_3)_2NCH_2CO-$ 、および $(CH_3)_2CHCH(NH_2)CO-$ からなる群から選択される、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項7】

R_3 が CH_3CO- 、 CH_3O-CO- 、 $(CH_3)_2N-CO-$ 、3-ピリジル-CO-、4-ピリジル-CO-、および4-モルホリン-CO- からなる群から選択される、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項8】

R_3 が CH_3CO- 、 CH_3O-CO- 、 $(CH_3)_2N-CO-$ 、3-ピリジル-CO-、4-ピリジル-CO-、および4-モルホリン-CO- からなる群から選択される、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項9】

X が $4-NH_2-$ であり、 Y が H または F である、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項10】

X が $4-NH_2-$ であり、 Y が H または F である、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項11】

R_2 が、式IVのジフェニルメチル基、式Vのナフチル-1-CH₂-基、および式VIのナフチル-2-CH₂-基からなる群から選択される、請求項9に記載の化合物。

【請求項12】

R_2 が、式IVのジフェニルメチル基、式Vのナフチル-1-CH₂-基、および式VIのナフチル-2-CH₂-基からなる群から選択される、請求項10に記載の化合物。

【請求項13】

X' および Y' がHである、請求項11に記載の化合物。

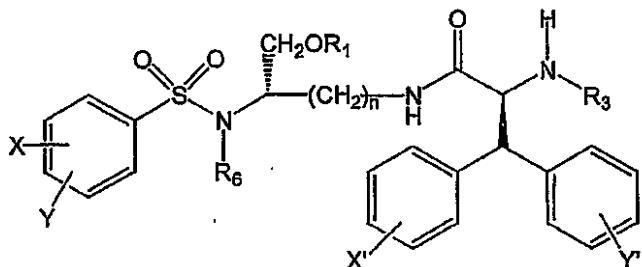
【請求項14】

X' および Y' がHである、請求項12に記載の化合物。

【請求項15】

式IIa:

【化33】



IIa

の化合物または医薬品として許容できるこれらの塩であって、

X および Y は、同一であっても異なっていてもよく、H、炭素原子1～6個の直鎖アルキル基、炭素原子3～6個の分岐アルキル基、炭素原子3～6個のシクロアルキル基、F、Cl、Br、I、-CF₃、-OCF₃、-CN、-NO₂、-NR₄R₅、-NHCOR₄、-OR₄、-SR₄、-COOR₄、-COR₄、および-CH₂OHからなる群から選択されるか、または、 X および Y が一緒になって式-OCH₂O-のメチレンジオキシ基および式-OCH₂CH₂O-のエチレンジオキシ基からなる群から選択されるアルキレンジオキシ基を定義するかのいずれかであり、

X' および Y' は、同一であっても異なっていてもよく、H、炭素原子1～6個の直鎖アルキル基、炭素原子3～6個の分岐アルキル基、炭素原子3～6個のシクロアルキル基、F、Cl、Br、I、-CF₃、-NO₂、-NR₄R₅、-NHCOR₄、-OR₄、-SR₄、-COOR₄、-COR₄、および-H₂OHからなる群から選択され、かつ、

n 、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、および R_6 は、請求項1に定義のものと同じである、化合物または医薬品として許容できるこれらの塩。

【請求項16】

R_6 がイソブチルである、請求項15に記載の化合物。

【請求項17】

n が4である、請求項16に記載の化合物。

【請求項18】

R_1 が(HO)₂P(O)-または(NaO)₂P(O)-である、請求項17に記載の化合物。

【請求項19】

R_1 がCH₃CO-、3-ピリジル-CO-、(CH₃)₂NCH₂CO-、および(CH₃)₂CHCH(NH₂)CO-からなる群から選択される、請求項17に記載の化合物。

【請求項20】

R_3 がCH₃-CO-、CH₃O-CO-、(CH₃)₂N-CO-、3-ピリジル-CO-、4-ピリジル-CO-、および4-モルホリン-CO-からなる群から選択される、請求項18に記載の化合物。

【請求項21】

R_3 がCH₃-CO-、CH₃O-CO-、(CH₃)₂N-CO-、3-ピリジル-CO-、4-ピリジル-CO-、および4-モルホリン-CO-からなる群から選択される、請求項19に記載の化合物。

【請求項 2 2】

X が4-NH₂-であり、Y がHまたはFである、請求項 2 0 に記載の化合物。

【請求項 2 3】

X が4-NH₂-であり、Y がHまたはFである、請求項 2 1 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

X が4-NH₂-であり、Y がHであり、X' がHであり、Y' がHであり、かつ、R₃ がCH₃O-CO-である、請求項 2 0 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

R₁ が(HO)₂P(O)-である、請求項 2 4 に記載の化合物。

【請求項 2 6】

R₁ が(NaO)₂P(O)-である、請求項 2 4 に記載の化合物。

【請求項 2 7】

X が4-NH₂-であり、Y が3-Fであり、X' がHであり、Y' がHであり、かつ、R₃ がCH₃O-CO-である、請求項 2 0 に記載の化合物。

【請求項 2 8】

R₁ が(HO)₂P(O)-である、請求項 2 7 に記載の化合物。

【請求項 2 9】

R₁ が(NaO)₂P(O)-である、請求項 2 7 に記載の化合物。

【請求項 3 0】

X が4-NH₂-であり、Y がHまたは3-Fであり、X' がHであり、Y' がHであり、かつ、R₃ がCH₃-CO-である、請求項 2 0 に記載の化合物。

【請求項 3 1】

R₁ が(HO)₂P(O)-である、請求項 3 0 に記載の化合物。

【請求項 3 2】

R₁ が(NaO)₂P(O)-である、請求項 3 0 に記載の化合物。

【請求項 3 3】

X が4-NH₂-であり、Y がHまたは3-Fであり、X' がHであり、Y' がHであり、かつ、R₃ が4-モルホリン-CO-である、請求項 2 0 に記載の化合物。

【請求項 3 4】

X が4-NH₂-であり、Y がHであり、X' がHであり、Y' がHであり、かつ、R₃ がCH₃O-CO-である、請求項 2 1 に記載の化合物。

【請求項 3 5】

R₁ が3-ピリジル-CO-である、請求項 3 4 に記載の化合物。

【請求項 3 6】

R₁ が(CH₃)₂NCH₂CO-である、請求項 3 4 に記載の化合物。

【請求項 3 7】

R₁ が(CH₃)₂CHCH(NH₂)CO-である、請求項 3 4 に記載の化合物。

【請求項 3 8】

R₁ がCH₃CO-である、請求項 3 4 に記載の化合物。

【請求項 3 9】

X が4-NH₂-であり、Y が3-Fであり、X' がHであり、Y' がHであり、かつ、R₃ がCH₃O-CO-である、請求項 2 1 に記載の化合物。

【請求項 4 0】

R₁ が3-ピリジル-CO-である、請求項 3 9 に記載の化合物。

【請求項 4 1】

R₁ が(CH₃)₂NCH₂CO-である、請求項 3 9 に記載の化合物。

【請求項 4 2】

R₁ が(CH₃)₂CHCH(NH₂)CO-である、請求項 3 9 に記載の化合物。

【請求項 4 3】

X が4-NH₂-であり、Y がHまたは3-Fであり、X' がHであり、Y' がHであり、かつ、R

R_3 が CH_3-CO- である、請求項 2 1 に記載の化合物。

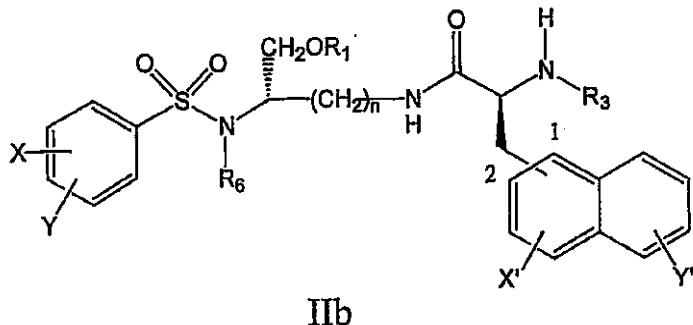
【請求項 4 4】

X が $4-NH_2-$ であり、 Y が H または $3-F$ であり、 X' が H であり、 Y' が H であり、かつ、 R_3 が 4 -モルホリン- $CO-$ である、請求項 2 1 に記載の化合物。

【請求項 4 5】

式 IIb :

【化 3 4】



の化合物または医薬品として許容できるこれらの塩であって、

X および Y は、同一であっても異なっていてもよく、 H 、炭素原子 $1 \sim 6$ 個の直鎖アルキル基、炭素原子 $3 \sim 6$ 個の分岐アルキル基、炭素原子 $3 \sim 6$ 個のシクロアルキル基、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR_4R_5$ 、 $-NHCOR_4$ 、 $-OR_4$ 、 $-SR_4$ 、 $-COOR_4$ 、 $-COR_4$ 、および $-CH_2OH$ からなる群から選択されるか、または、 X および Y が一緒にになって式 $-OCH_2O-$ のメチレンジオキシ基および式 $-OCH_2CH_2O-$ のエチレンジオキシ基からなる群から選択されるアルキレンジオキシ基を定義するかのいずれかであり、

X' および Y' は、同一であっても異なっていてもよく、 H 、炭素原子 $1 \sim 6$ 個の直鎖アルキル基、炭素原子 $3 \sim 6$ 個の分岐アルキル基、炭素原子 $3 \sim 6$ 個のシクロアルキル基、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CF_3$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR_4R_5$ 、 $-NHCOR_4$ 、 $-OR_4$ 、 $-SR_4$ 、 $-COOR_4$ 、 $-COR_4$ 、および $-H_2OH$ からなる群から選択され、かつ、

n 、 R_1 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、および R_6 は、請求項 1 に定義のものと同じである、化合物または医薬品として許容できるこれらの塩。

【請求項 4 6】

R_6 がイソブチルである、請求項 4 5 に記載の化合物。

【請求項 4 7】

n が 4 である、請求項 4 6 に記載の化合物。

【請求項 4 8】

R_1 が $(HO)_2P(O)-$ または $(NaO)_2P(O)-$ である、請求項 4 7 に記載の化合物。

【請求項 4 9】

R_1 が CH_3CO- 、 3 -ピリジル- $CO-$ 、 $(CH_3)_2NCH_2CO-$ 、および $(CH_3)_2CHCH(NH_2)CO-$ の群から選択される、請求項 4 7 に記載の化合物。

【請求項 5 0】

R_3 が CH_3-CO- 、 CH_3O-CO- 、 $(CH_3)_2N-CO-$ 、 3 -ピリジル- $CO-$ 、 4 -ピリジル- $CO-$ 、および 4 -モルホリン- $CO-$ からなる群から選択される、請求項 4 8 に記載の化合物。

【請求項 5 1】

R_3 が CH_3-CO- 、 CH_3O-CO- 、 $(CH_3)_2N-CO-$ 、 3 -ピリジル- $CO-$ 、 4 -ピリジル- $CO-$ 、および 4 -モルホリン- $CO-$ からなる群から選択される、請求項 4 9 に記載の化合物。

【請求項 5 2】

X が $4-NH_2-$ であり、 Y が H または F である、請求項 5 0 に記載の化合物。

【請求項 5 3】

X が $4-NH_2-$ であり、 Y が H または F である、請求項 5 1 に記載の化合物。

【請求項 5 4】

X が4-NH₂- であり、 Y がHまたは3-Fであり、 X' がHであり、 Y' がHであり、かつ、 R₃ がCH₃O-CO- である、請求項 5 0 に記載の化合物。

【請求項 5 5】

X が4-NH₂- であり、 Y がHまたは3-Fであり、 X' がHであり、 Y' がHであり、かつ、 R₃ がCH₃-CO- である、請求項 5 0 に記載の化合物。

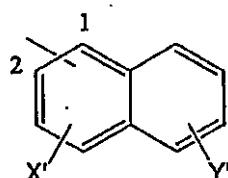
【請求項 5 6】

X が4-NH₂- であり、 Y がHまたは3-Fであり、 X' がHであり、 Y' がHであり、かつ、 R₃ が4-モルホリン-CO- である、請求項 5 0 に記載の化合物。

【請求項 5 7】

前記基：

【化 3 5】



がナフチル-2-CH₂- 基である、請求項 5 4 に記載の化合物。

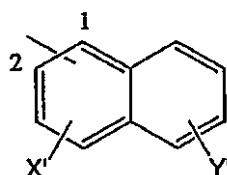
【請求項 5 8】

Y がHであり、 R₁ が(HO)₂P(O)- である、請求項 5 7 に記載の化合物。

【請求項 5 9】

前記基：

【化 3 6】



がナフチル-1-CH₂- 基である、請求項 5 6 に記載の化合物。

【請求項 6 0】

Y がHであり、 R₁ が(HO)₂P(O)- である、請求項 5 9 に記載の化合物。

【請求項 6 1】

X が4-NH₂- であり、 Y がHまたは3-Fであり、 X' がHであり、 Y' がHであり、かつ、 R₃ がCH₃O-CO- である、請求項 5 1 に記載の化合物。

【請求項 6 2】

X が4-NH₂- であり、 Y がHまたは3-Fであり、 X' がHであり、 Y' がHであり、かつ、 R₃ がCH₃-CO- である、請求項 5 1 に記載の化合物。

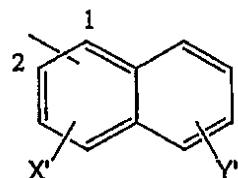
【請求項 6 3】

X が4-NH₂- であり、 Y がHまたは3-Fであり、 X' がHであり、 Y' がHであり、かつ、 R₃ が4-モルホリン-CO- である、請求項 5 1 に記載の化合物。

【請求項 6 4】

前記基：

【化 3 7】

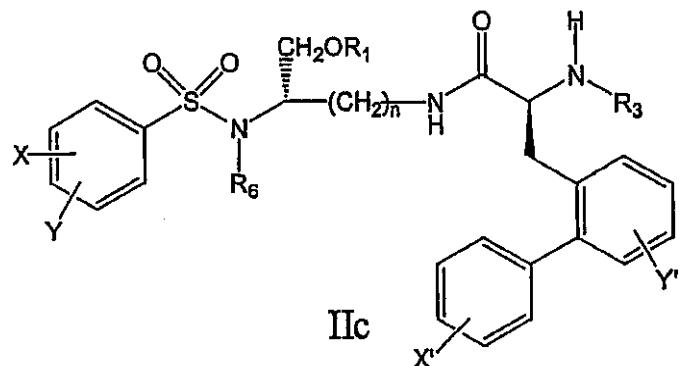


がナフチル-1-CH₂-基である、請求項63に記載の化合物。

【請求項65】

式IIc:

【化38】



の化合物または医薬品として許容できるこれらの塩であって、

n、X、Y、X'、Y'、R₁、R₃、R₄、R₅、およびR₆は、請求項1に定義のものと同じである、化合物または医薬品として許容できるこれらの塩。

【請求項66】

R₆がイソブチルである、請求項65に記載の化合物。

【請求項67】

nが4である、請求項66に記載の化合物。

【請求項68】

R₁が(HO)₂P(O)-または(NaO)₂P(O)-である、請求項67に記載の化合物。

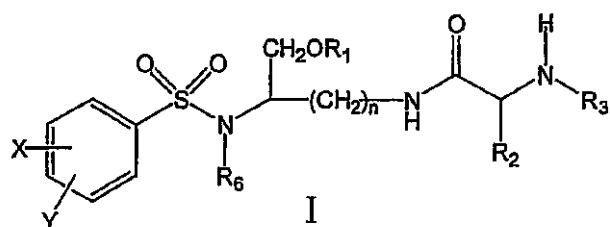
【請求項69】

R₁がCH₃CO-、3-ピリジル-CO-、(CH₃)₂NCH₂CO-、および(CH₃)₂CHCH(NH₂)CO-の群から選択される、請求項67に記載の化合物。

【請求項70】

式Iのリシンをベースとする化合物が、以下の通りに定義される化合物1～10からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物または医薬品として許容できるこれらの塩。

【化39】



実施例No.

(PL#)	X	Y	n	R ₁	R ₂	R ₃	R ₆	X'/Y'	D, L, R, S, RS
1 (PL-461)	4-NH ₂	H	4	(HO) ₂ P(O)	(C ₆ H ₅) ₂ CH	CH ₃ O-CO	iso-ブチル	H/H	S,S
2 (PL-462)	4-NH ₂	H	4	(NaO) ₂ P(O)	(C ₆ H ₅) ₂ CH	CH ₃ O-CO	iso-ブチル	H/H	S,S
3 (PL-507)	4-NH ₂	H	4	(HO) ₂ P(O)	ナフチル-2-CH ₂	CH ₃ O-CO	iso-ブチル	H/H	S,S
4 (PL-498)	4-NH ₂	H	4	(HO) ₂ P(O)	ナフチル-1-CH ₂	CO	4-モルホリン-	iso-ブチル	H/H
5 (PL-504)	4-NH ₂	H	4	(HO) ₂ P(O)	(C ₆ H ₅) ₂ CH	CH ₃ CO	iso-ブチル	H/H	S,S
6 (PL-515)	4-NH ₂	3-F	4	(HO) ₂ P(O)	(C ₆ H ₅) ₂ CH	CH ₃ O-CO	iso-ブチル	H/H	S,S
7 (PL-521)	4-NH ₂	H	4	CH ₃ CO	(C ₆ H ₅) ₂ CH	CH ₃ O-CO	iso-ブチル	H/H	S,S
8 (PL-520)	4-NH ₂	H	4	3-ピリジル-CO	(C ₆ H ₅) ₂ CH	CH ₃ O-CO	iso-ブチル	H/H	S,S
9 (PL-534)	4-NH ₂	H	4	(CH ₃) ₂ NCH ₂ CO	(C ₆ H ₅) ₂ CH	CH ₃ O-CO	iso-ブチル	H/H	S,S
10 (PL-530)	4-NH ₂	H	4	(CH ₃) ₂ CHCH(NH ₂)CO(C ₆ H ₅) ₂ CH		CH ₃ O-CO	iso-ブチル	H/H	S,S

【請求項71】

(1S,5S)-(1-{5-[(4-アミノ-ベンゼンスルホニル)-イソブチル-アミノ]-6-ホスホノオキシ-ヘキシリカルバモイル}-2,2-ジフェニル-エチル)-カルバミン酸メチルエステルもしくは医薬品として許容できるその塩、または、(1S,5S)-(1-{5-[(4-アミノ-3-フルオロ-ベンゼンスルホニル)-イソブチル-アミノ]-6-ホスホノオキシ-ヘキシリカルバモイル}-2,2-ジフェニル-エチル)-カルバミン酸メチルエステルもしくは医薬品として許容できるその塩である、請求項18に記載の化合物。

【請求項72】

(1S,5S)-(1-{5-[(4-アミノ-ベンゼンスルホニル)-イソブチル-アミノ]-6-ホスホノオキシ-ヘキシリカルバモイル}-2,2-ジフェニル-エチル)-カルバミン酸メチルエステルのナトリウム塩である、請求項71に記載の化合物。

【請求項73】

(1S,5S)-(1-{5-[(4-アミノ-3-フルオロ-ベンゼンスルホニル)-イソブチル-アミノ]-6-ホスホノオキシ-ヘキシリカルバモイル}-2,2-ジフェニル-エチル)-カルバミン酸メチルエステルのナトリウム塩である、請求項71に記載の化合物。

【請求項74】

少なくとも1種の、請求項1、2、15、45、65、または70のいずれか一項に記載の化合物、医薬品として許容できるこれらの塩、またはこれらの組合せと、医薬品として許容できる担体とを含む医薬組成物。

【請求項75】

少なくとも1種の、請求項1、2、15、45、65、または70のいずれか一項に記載の化合物、医薬品として許容できるこれらの塩、またはこれらの組合せの、HIV感染の治療または予防のための薬剤の製造における使用。

【請求項76】

HIV感染の治療または予防における使用のための、請求項1、2、15、45、65

、または70のいずれか一項に記載の化合物、医薬品として許容できるこれらの塩、またはこれらの組合せ。