

【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 0 7 F 9/09 (2006.01)

C 0 7 C 311/41 (2006.01)

A 6 1 K 31/661 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 K 31/27 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 F 9/09 C S P U

C 0 7 C 311/41

A 6 1 K 31/661

A 6 1 P 31/18

A 6 1 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

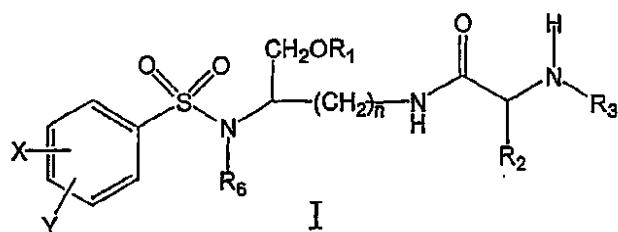
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【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、

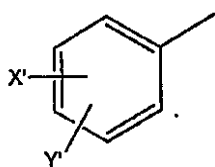
X および Y は、同一であっても異なってもよく、H、炭素原子 1 ~ 6 個の直鎖アルキル基、炭素原子 3 ~ 6 個の分岐アルキル基、炭素原子 3 ~ 6 個のシクロアルキル基、F、Cl、Br、I、-CF₃、-OCF₃、-CN、-NO₂、-NR₄R₅、-NHCOR₄、-OR₄、-SR₄、-COOR₄、-COR₄、および -CH₂OH からなる群から選択されるか、または、X および Y が一緒になって式 -OCH₂O- のメチレンジオキシ基および式 -OCH₂CH₂O- のエチレンジオキシ基からなる群から選択されるアルキレンジオキシ基を定義するであり、

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、

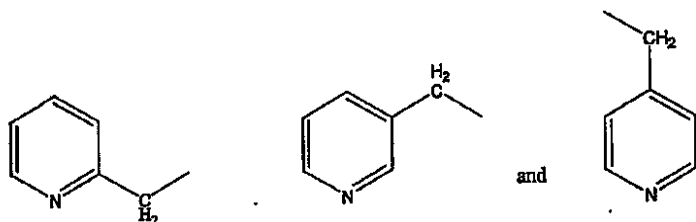
R_3 は、H、炭素原子 1 ~ 6 個の直鎖アルキル基、炭素原子 3 ~ 6 個の分岐アルキル基、炭素原子 3 ~ 6 個のシクロアルキル基、および、式 $R_{3A}-CO-$ の基からなる群から選択され〔前記式中、 R_{3A} は、炭素原子 1 ~ 6 個の直鎖または分岐アルキル基、炭素原子 3 ~ 6 個のシクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基 (そのシクロアルキル部分に炭素原子 3 ~ 6 個を有し、そのアルキル部分に炭素原子 1 ~ 3 個を有するもの)、炭素原子 1 ~ 6 個のアルコキシ基、テトラヒドロ-3-フラニルオキシ基、 $-CH_2OH$ 、 $-CF_3$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CH_2CF_3$ 、ピロリジニル、ピペリジニル、4-モルホリニル、 CH_3O_2C- 、 $CH_3O_2CCH_2-$ 、アセチル- OCH_2CH_2- 、 HO_2CCH_2- 、3-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル、4- $CH_3OC_6H_4CH_2-$ 、 CH_3NH- 、 $(CH_3)_2N-$ 、 $(CH_3CH_2)_2N-$ 、 $(CH_3CH_2CH_2)_2N-$ 、 $HOCH_2CH_2NH-$ 、 CH_3OCH_2O- 、 $CH_3OCH_2CH_2O-$ 、 $C_6H_5CH_2O-$ 、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】



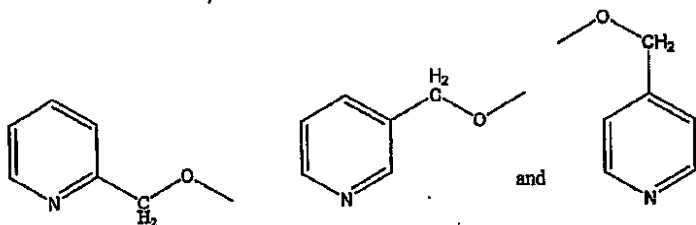
のフェニル基、式：

【化 3】



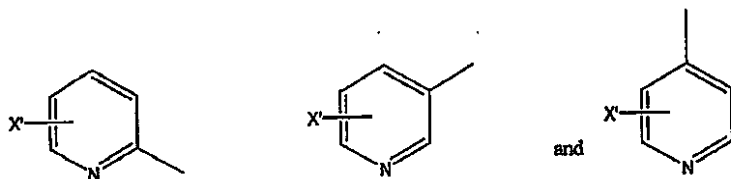
からなる群から選択されるピコリル基、式：

【化 4】



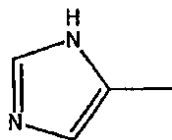
からなる群から選択されるピコリルオキシ基、式：

【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】



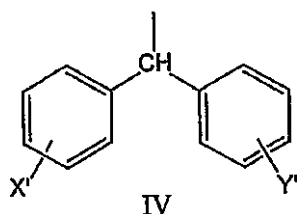
の基、からなる群から選択される〕、

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 -CH₂OH 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、

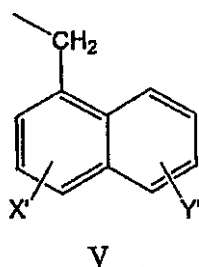
R₂ は、式 IV :

【化 7】



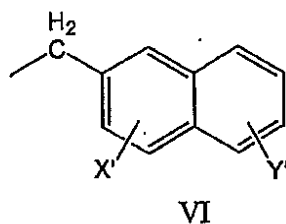
のジフェニルメチル基、式 V :

【化 8】



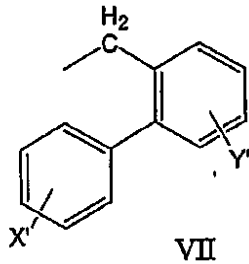
のナフチル-1-CH₂-基、式 VI :

【化 9】



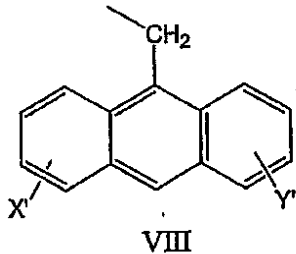
のナフチル-2-CH₂-基、式 VII :

【化 1 0】



のビフェニルメチル基、および、式VIII：

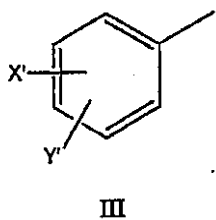
【化 1 1】



のアントリル-9-CH₂-基、からなる群から選択され、かつ、

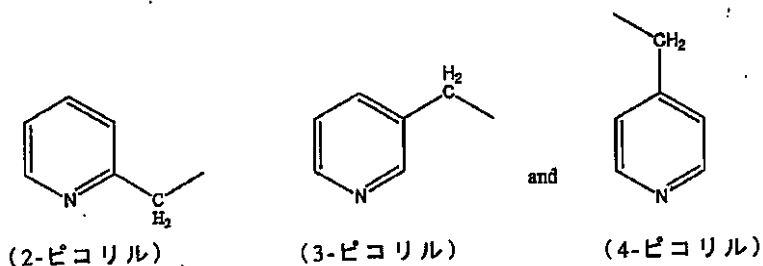
R₁ は、(HO)₂P(O)-、(MO)₂P(O)-、および式R_{1A}-CO-の基からなる群から選択される〔前記式中、Mは、アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属であり、R_{1A}は、炭素原子1～6個の直鎖または分岐アルキル基、炭素原子3～6個のシクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基（そのシクロアルキル部分に炭素原子3～6個を有し、そのアルキル部分に炭素原子1～3個を有するもの）、炭素原子1～6個のアルコキシ基、-CH₂OH、CH₃O₂C-、CH₃O₂CCH₂-、アセチル-OCH₂CH₂-、HO₂CCH₂-、2-ヒドロキシフェニル、3-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル、(CH₃)₂NCH₂-、(CH₃)₂CHCH(NH₂)-、HOCH₂CH₂NH-、CH₃OCH₂O-、CH₃OCH₂CH₂O-、2-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



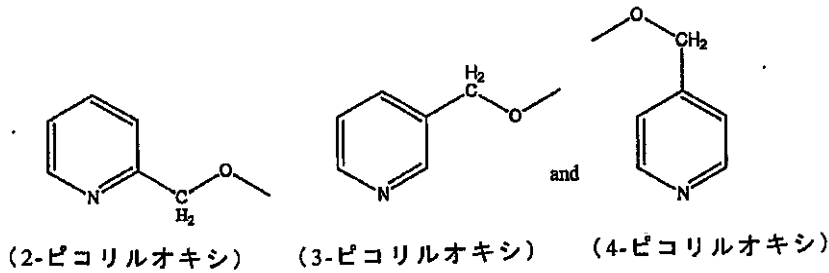
のフェニル基、式：

【化 1 3】



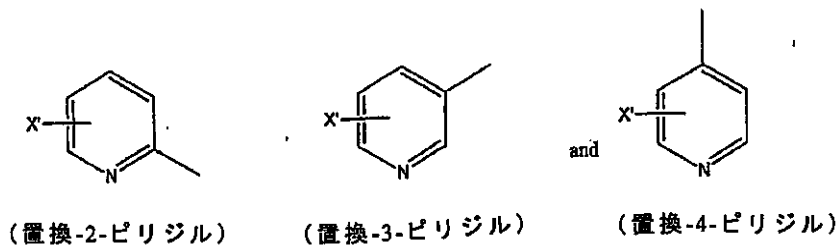
からなる群から選択されるピコリル基、式：

【化 1 4】



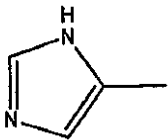
からなる群から選択されるピコリルオキシ基、式：

【化 1 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 1 6】



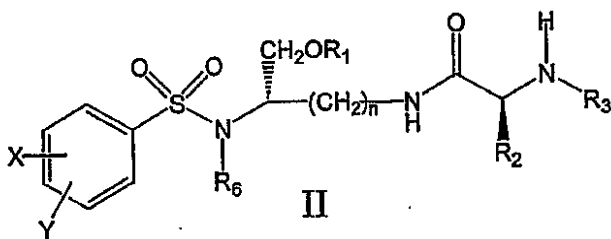
の基、からなる群から選択される）、

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 1 7】



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、

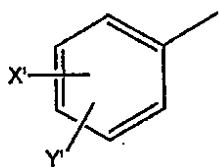
式中、n は 3 または 4 であり、

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、

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、

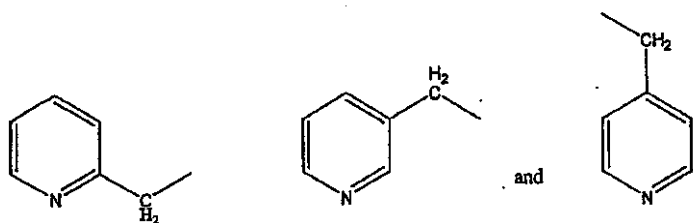
R_3 は、H、炭素原子 1 ~ 6 個の直鎖アルキル基、炭素原子 3 ~ 6 個の分岐アルキル基、炭素原子 3 ~ 6 個のシクロアルキル基、および、式 $R_{3A}-CO-$ の基からなる群から選択され〔前記式中、 R_{3A} は、炭素原子 1 ~ 6 個の直鎖または分岐アルキル基、炭素原子 3 ~ 6 個のシクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基（そのシクロアルキル部分に炭素原子 3 ~ 6 個を有し、そのアルキル部分に炭素原子 1 ~ 3 個を有するもの）、炭素原子 1 ~ 6 個のアルコキシ基、テトラヒドロ-3-フラニルオキシ基、 $-CH_2OH$ 、 $-CF_3$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CH_2CF_3$ 、ピロリジニル、ピペリジニル、4-モルホリニル、 CH_3O_2C- 、 $CH_3O_2CCH_2-$ 、アセチル- OCH_2CH_2- 、 HO_2CCH_2- 、3-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル、4- $CH_3OC_6H_4CH_2-$ 、 CH_3NH- 、 $(CH_3)_2N-$ 、 $(CH_3CH_2)_2N-$ 、 $(CH_3CH_2CH_2)_2N-$ 、 $HOCH_2CH_2NH-$ 、 CH_3OCH_2O- 、 $CH_3OCH_2CH_2O-$ 、 $C_6H_5CH_2O-$ 、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】



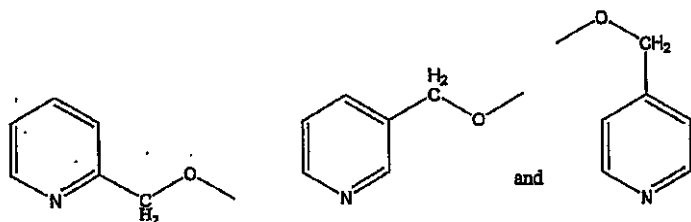
のフェニル基、式：

【化 19】



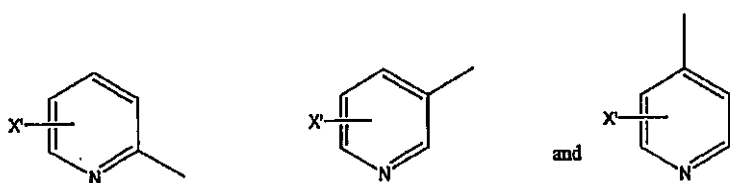
からなる群から選択されるピコリル基、式：

【化 20】



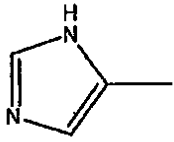
からなる群から選択されるピコリルオキシ基、式：

【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 2 2】



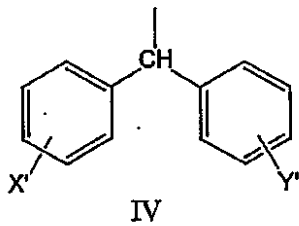
の基、からなる群から選択される〕、

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 -CH₂OH 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、

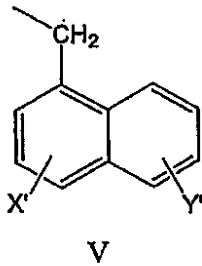
R₂ は、式 IV :

【化 2 3】



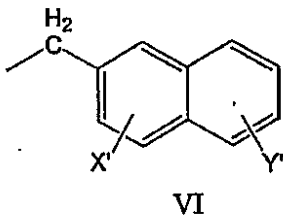
のジフェニルメチル基、式 V :

【化 2 4】



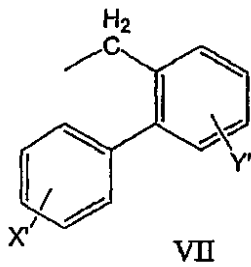
のナフチル-1-CH₂-基、式 VI :

【化 2 5】



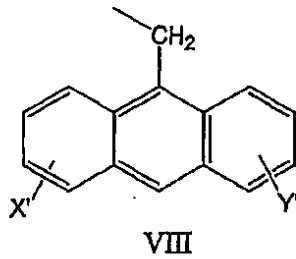
のナフチル-2-CH₂-基、式 VII :

【化 2 6】



のビフェニルメチル基、および、式VIII：

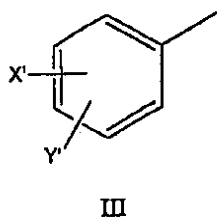
【化 2 7】



のアントリル-9-CH₂-基、からなる群から選択され、かつ、

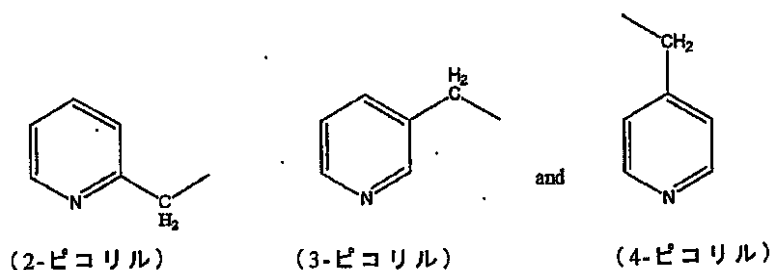
R₁ は、(HO)₂P(O)-、(MO)₂P(O)-、および式R_{1A}-CO-の基からなる群から選択される〔前記式中、Mは、アルカリ金属もしくはアルカリ土類金属であり、R_{1A}は、炭素原子1～6個の直鎖または分岐アルキル基、炭素原子3～6個のシクロアルキル基、シクロアルキルアルキル基（そのシクロアルキル部分に炭素原子3～6個を有し、そのアルキル部分に炭素原子1～3個を有するもの）、炭素原子1～6個のアルコキシ基、-CH₂OH、CH₃O₂C-、CH₃O₂CCH₂-、アセチル-OCH₂CH₂-、HO₂CCH₂-、2-ヒドロキシフェニル、3-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル、(CH₃)₂NCH₂-、(CH₃)₂CHCH(NH₂)-、HOCH₂CH₂NH-、CH₃OCH₂O-、CH₃OCH₂CH₂O-、2-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 2 8】



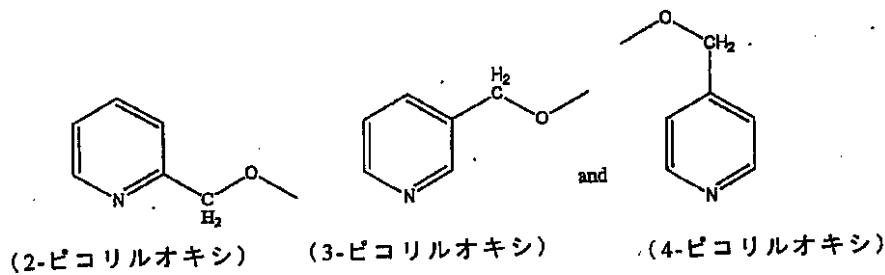
のフェニル基、式：

【化 2 9】



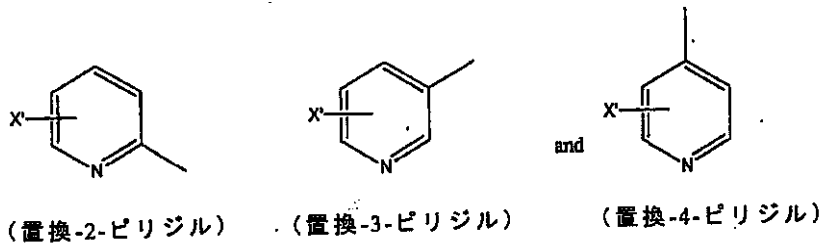
からなる群から選択されるピコリル基、式：

【化 3 0】



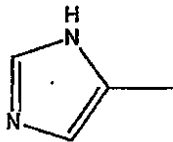
からなる群から選択されるピコリルオキシ基、式：

【化 3 1】



からなる群から選択される置換ピリジル基、および、式：

【化 3 2】



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- CH_2 -基、および式VIのナフチル-2- CH_2 -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- CH_2 -基、および式VIのナフチル-2- CH_2 -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。

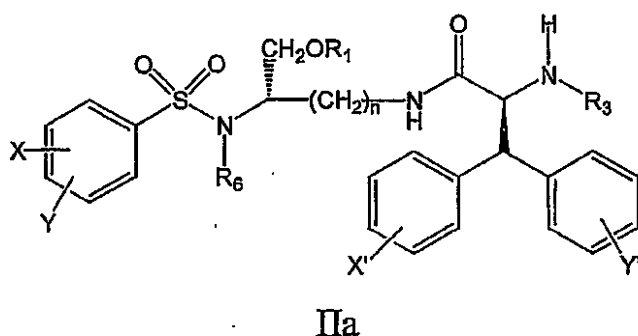
【請求項14】

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】



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、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{NR}_4\text{R}_5$ 、 $-\text{NHCOR}_4$ 、 $-\text{OR}_4$ 、 $-\text{SR}_4$ 、 $-\text{COOR}_4$ 、 $-\text{COR}_4$ 、および $-\text{CH}_2\text{OH}$ 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 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ のメチレンジオキシ基および式 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 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、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{NR}_4\text{R}_5$ 、 $-\text{NHCOR}_4$ 、 $-\text{OR}_4$ 、 $-\text{SR}_4$ 、 $-\text{COOR}_4$ 、 $-\text{COR}_4$ 、および $-\text{CH}_2\text{OH}$ 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に定義のものと同一である、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 $(\text{HO})_2\text{P}(\text{O})-$ または $(\text{NaO})_2\text{P}(\text{O})-$ である、請求項17に記載の化合物。

【請求項19】

R_1 が $\text{CH}_3\text{CO}-$ 、3-ピリジル- $\text{CO}-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{NCH}_2\text{CO}-$ 、および $(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}(\text{NH}_2)\text{CO}-$ 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 $\text{CH}_3-\text{CO}-$ 、 $\text{CH}_3\text{O}-\text{CO}-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{N}-\text{CO}-$ 、3-ピリジル- $\text{CO}-$ 、4-ピリジル- $\text{CO}-$ 、および4-モルホリン- $\text{CO}-$ 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 $\text{CH}_3-\text{CO}-$ 、 $\text{CH}_3\text{O}-\text{CO}-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{N}-\text{CO}-$ 、3-ピリジル- $\text{CO}-$ 、4-ピリジル- $\text{CO}-$ 、および4-モルホリン- $\text{CO}-$ 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

₃ がCH₃-CO-である、請求項 2 1 に記載の化合物。

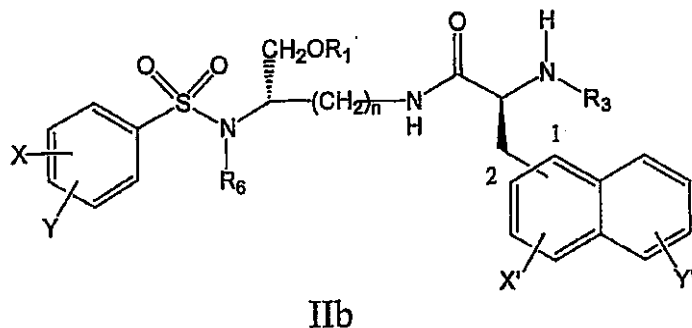
【請求項 4 4】

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-C₂H₄OHからなる群から選択され、かつ、

n、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 4 6】

R₆ 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】

R₁ 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】

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 4 7 に記載の化合物。

【請求項 5 0】

R₃ 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 4 8 に記載の化合物。

【請求項 5 1】

R₃ 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 4 9 に記載の化合物。

【請求項 5 2】

X が4-NH₂-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-NH₂-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50に記載の化合物。

【請求項55】

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50に記載の化合物。

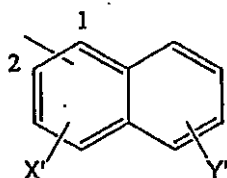
【請求項56】

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50に記載の化合物。

【請求項57】

前記基：

【化35】



がナフチル-2-CH₂-基である、請求項54に記載の化合物。

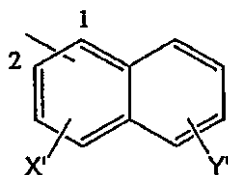
【請求項58】

Y がHであり、R₁ が(HO)₂P(O)-である、請求項57に記載の化合物。

【請求項59】

前記基：

【化36】



がナフチル-1-CH₂-基である、請求項56に記載の化合物。

【請求項60】

Y がHであり、R₁ が(HO)₂P(O)-である、請求項59に記載の化合物。

【請求項61】

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51に記載の化合物。

【請求項62】

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51に記載の化合物。

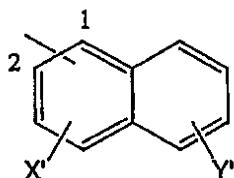
【請求項63】

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51に記載の化合物。

【請求項64】

前記基：

【化37】

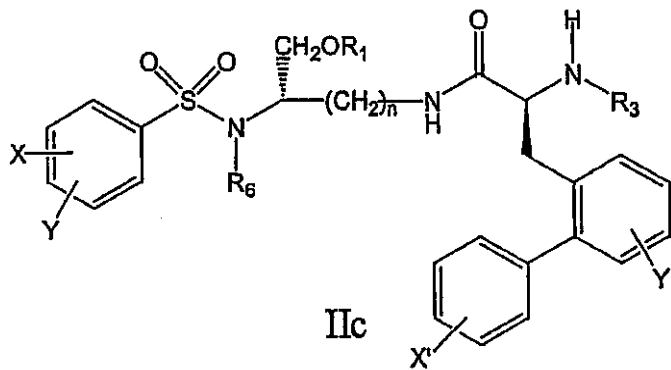


がナフチル-1-CH₂-基である、請求項 6 3 に記載の化合物。

【請求項 6 5】

式 IIc :

【化 3 8】



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 6 6】

R₆ がイソブチルである、請求項 6 5 に記載の化合物。

【請求項 6 7】

n が 4 である、請求項 6 6 に記載の化合物。

【請求項 6 8】

R₁ が(HO)₂P(O)-または(NaO)₂P(O)-である、請求項 6 7 に記載の化合物。

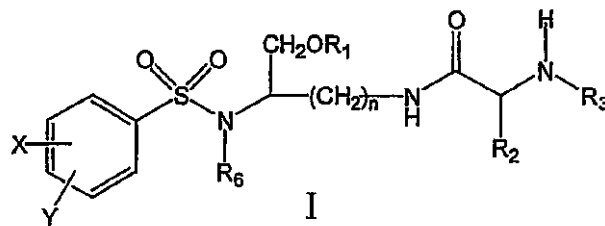
【請求項 6 9】

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 6 7 に記載の化合物。

【請求項 7 0】

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 ~ 1 0 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 3 9】



実施例No.

(PL-#)	X	Y	n	R ₁	R ₂	R ₃	R ₆	X'/Y'	D, L, DL 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	S,S
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 7 1】

(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-ヘキシルカルバモイル}-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-ヘキシルカルバモイル}-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 1 8 に記載の化合物。

【請求項 7 2】

(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-ヘキシルカルバモイル}-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 7 1 に記載の化合物。

【請求項 7 3】

(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-ヘキシルカルバモイル}-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 7 1 に記載の化合物。

【請求項 7 4】

少なくとも 1 種の、請求項 1、2、1 5、4 5、6 5、または 7 0 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 7 5】

少なくとも 1 種の、請求項 1、2、1 5、4 5、6 5、または 7 0 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、H I V 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 7 6】

H I V 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、1 5、4 5、6 5

、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。