

【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7年4月9日(2025.4.9)

【国際公開番号】WO2022/208113

【公表番号】特表2024-511881(P2024-511881A)

【公表日】令和6年3月15日(2024.3.15)

【年通号数】公開公報(特許)2024-049

【出願番号】特願2023-560997(P2023-560997)

【国際特許分類】

C 0 7 K 5/083(2006.01)

A 6 1 P 31/14(2006.01)

A 6 1 K 38/07(2006.01)

C 0 7 K 14/81(2006.01)

C 1 2 N 9/99(2006.01)

C 0 7 K 5/087(2006.01)

10

【F I】

C 0 7 K 5/083

A 6 1 P 31/14

A 6 1 K 38/07

C 0 7 K 14/81

C 1 2 N 9/99

C 0 7 K 5/087

20

【手続補正書】

【提出日】令和7年4月1日(2025.4.1)

【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

30

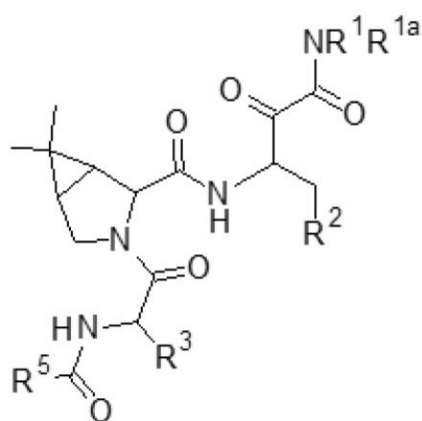
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(1b)：

【化1】



(1b)；

40

の化合物又はその塩であって、式中：

R¹及びR^{1a}は、独立して、H、1～6個のフッ素原子若しくは塩素原子で任意に置換

50

された C_{1-6} 飽和炭化水素基又は 1 ~ 6 個のフッ素原子若しくは塩素原子で任意に置換されたベンジル基であるか、あるいは R^1 及び R^{1a} は結合して追加のヘテロ原子を任意に含む飽和環を形成し；

R^2 は、フッ素又はヒドロキシルから選択される一又は複数の置換基で任意に置換されたシクロアルキル基を含む C_{3-5} 飽和炭化水素基であり；

R^3 は、飽和基であって、3 ~ 5 個の炭素原子を含み、任意にシクロアルキル基を含むか、あるいは任意に酸素ヘテロ原子を含む飽和環を含み、フッ素又はヒドロキシルから選択される一又は複数の置換基で任意に置換されるか、あるいは R^3 は、 CH_2 アリール、 $CH(CH_3)$ アリール又は $C(CH_3)_2$ アリールであり；

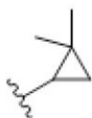
R^5 は、 C_{2-8} 炭化水素基であって、任意に一又は複数の環又は二重結合を含み、フッ素；塩素；臭素；シアノ；ヒドロキシ；メトキシ；アミノ；から選択される一又は複数の基又はシクロアルキル基、ヘテロシクロアルキル基、アリール基若しくはヘテロアリール基で任意に置換されている。

10

【請求項 2】

R^1 は、 H 、 CH_3 、ベンジル、シクロプロピル又は

【化 2】



20

である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^{1a} は H である、請求項 1 又は請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^1 及び R^{1a} は両方とも H である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

R^1 及び R^{1a} は両方とも $-CH_3$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

R^1 及び R^{1a} は、結合して 3 ~ 6 個の原子の飽和環を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

30

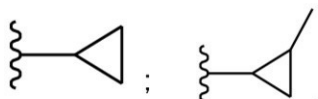
【請求項 7】

R^1 及び R^{1a} は、結合してアゼチジン又はアジリジン環を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

R^2 は、以下の：

【化 3】



40

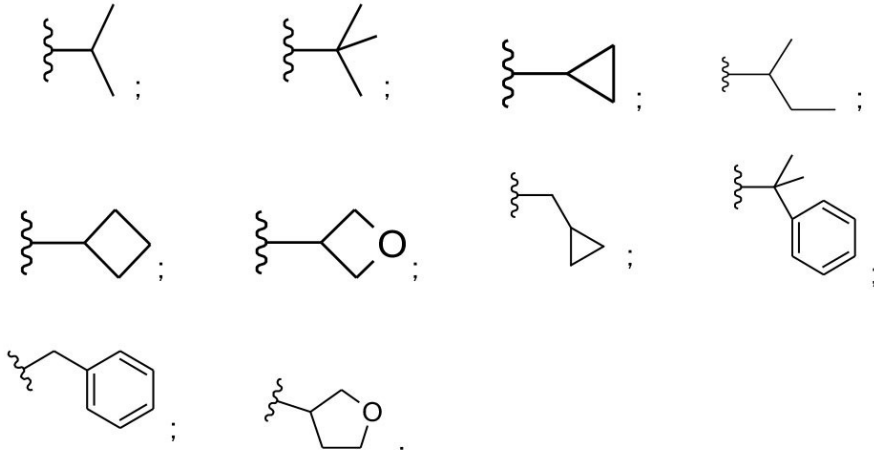
からなる群より選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

R^3 は、以下の：

50

【化 4】



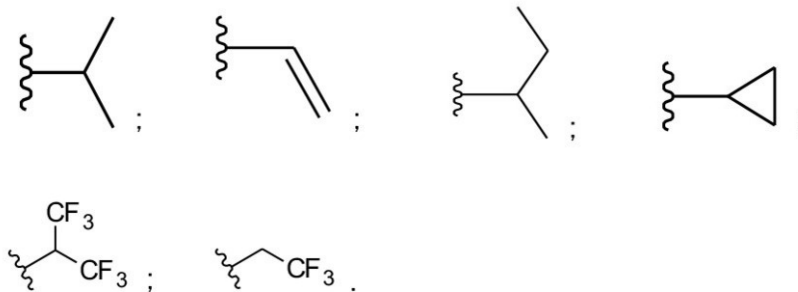
10

からなる群より選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

R^5 は、以下の：

【化 5】



20

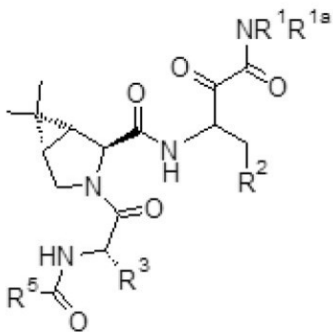
からなる群より選択される、請求項 1 に記載の化合物。

30

【請求項 11】

式 (3 b) :

【化 6】



(3 b) ;

40

の化合物又はその塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 12】

以下の：

(1R, 2S, 5S) - N - (4 - アミノ - 1 - シクロプロピル - 3, 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - ((S) - 2 - イソブチルアミド - 3, 3 - ジメチルブタノイル) - 6, 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ[3.1.0]ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

50

(1 R , 2 S , 5 S) - N - [3 - アミノ - 1 - (シクロプロピルメチル) - 2 , 3 - ジオキソ - プロピル] - 3 - [(2 S) - 2 - (シクロプロパンカルボニルアミノ) - 3 - メチルブタノイル] - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - アミノ - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - (イソブチリル - L - アロイソロイシル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

(1 R , 2 S , 5 S) - 3 - (アクリロイル - L - バリル) - N - (4 - アミノ - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

10

(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - アミノ - 1 - ((1 R , 2 S) - 2 - メチルシクロプロピル) - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - (イソブチリル - L - バリル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - アミノ - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - ((S) - 3 - シクロプロピル - 2 - イソブチルアミドプロパノイル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - アミノ - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - (イソブチリル - L - バリル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

20

(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - アミノ - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - (((S) - 2 - メチルブタノイル) - L - バリル) - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - アミノ - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - ((S) - 2 - (シクロプロパンカルボキサミド) - 2 - シクロプロピルアセチル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - アミノ - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - ((S) - 2 - シクロプロピル - 2 - イソブチルアミドアセチル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

30

(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - (ベンジルアミノ) - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - (イソブチリル - L - バリル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

(1 R , 2 S , 5 S) - N - (1 - シクロプロピル - 4 - (シクロプロピルアミノ) - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - (イソブチリル - L - バリル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - アミノ - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - (2 - イソブチルアミド - 2 - (オキセタン - 3 - イル) アセチル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

40

(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - アミノ - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - ((S) - 2 - (シクロプロパンカルボキサミド) - 3 , 3 - ジメチルブタノイル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

(1 R , 2 S , 5 S) - 3 - ((S) - 2 - アクリルアミド - 3 , 3 - ジメチルブタノイル) - N - (4 - アミノ - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

(1 R , 2 S , 5 S) - 3 - ((S) - 2 - アクリルアミド - 3 , 3 - ジメチルブタノイル) - N - (4 - (ベンジルアミノ) - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン

50

- 2 - イル) - 6, 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - (ベンジルアミノ) - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - ((S) - 2 - イソブチルアミド - 3 , 3 - ジメチルブタノイル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - (ベンジルアミノ) - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - ((S) - 2 - (シクロプロパンカルボキサミド) - 3 , 3 - ジメチルブタノイル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0]

ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;
(1 R , 2 S , 5 S) - 3 - ((S) - 2 - (シクロプロパンカルボキサミド) - 3 , 3 - ジメチルブタノイル) - N - (1 - シクロプロピル - 4 - (シクロプロピルアミノ) - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0]

ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;
(1 R , 2 S , 5 S) - 3 - ((S) - 2 - アクリルアミド - 3 , 3 - ジメチルブタノイル) - N - (1 - シクロプロピル - 4 - (シクロプロピルアミノ) - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0]

ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;
(1 R , 2 S , 5 S) - N - (1 - シクロプロピル - 4 - (シクロプロピルアミノ) - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - ((S) - 2 - イソブチルアミド - 3 , 3 -

ジメチルブタノイル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;
(1 R , 2 S , 5 S) - N - (1 - シクロプロピル - 4 - (メチルアミノ) - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - ((S) - 2 - イソブチルアミド - 3 , 3 -

ジメチルブタノイル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;
(1 R , 2 S , 5 S) - N - (1 - シクロプロピル - 4 - (ジメチルアミノ) - 3 , 4 -

ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - ((S) - 2 - イソブチルアミド - 3 , 3 - ジメチルブタノイル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0]

ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;
(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - (アジリジン - 1 - イル) - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 -

ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - ((S) - 2 - イソブチルアミド - 3 , 3 - ジメチルブタノイル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0]

ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;
(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - アミノ - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - ((S) - 2 - シクロブチル - 2 - イソブチルアミドアセチル) - 6 , 6 -

ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;
(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - アミノ - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - ((S) - 2 - イソブチルアミド - 3 - メチル - 3 - フェニルブタノイル) - 6 , 6 -

ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;
(1 R , 2 S , 5 S) - 3 - ((シクロプロパンカルボニル) - L - バリル) - N - (1 -

シクロプロピル - 4 - (シクロプロピルアミノ) - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 6 , 6 -

10

20

30

40

50

タン - 2 - イル) - 3 - (2 - イソブチルアミド - 2 - (テトラヒドロフラン - 3 - イル) アセチル) - 6, 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

(1 R , 2 S , 5 S) - N - (1 - シクロプロピル - 4 - ((S) - 2 , 2 - ジメチルシクロプロピル) アミノ) - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - ((S) - 2 - イソブチルアミド - 3 , 3 - ジメチルブタノイル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - アミノ - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - (イソブチリル - L - フェニルアラニル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - アミノ - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - ((S) - 3 , 3 - ジメチル - 2 - (3 , 3 , 3 - トリフルオロ - 2 - (トリフルオロメチル) プロパンアミド) ブタノイル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - アミノ - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - ((S) - 3 , 3 - ジメチル - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロアセトアミド) ブタノイル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

(1 R , 2 S , 5 S) - N - (4 - (アゼチジン - 1 - イル) - 1 - シクロプロピル - 3 , 4 - ジオキソブタン - 2 - イル) - 3 - ((S) - 3 , 3 - ジメチル - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロアセトアミド) ブタノイル) - 6 , 6 - ジメチル - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 2 - カルボキサミド ;

又はその塩、からなる群より選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

SARS - CoV - 2 Mpr o 阻害活性を有する。請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

請求項 1 に記載の化合物及び薬学的に許容される賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 1 5】

SARS - CoV - 2 の治療又は SARS - CoV - 2 と関連している障害の治療に使用するための、請求項 1 4 に記載の医薬組成物。

10

20

30

40

50