

【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6年6月17日(2024.6.17)

【国際公開番号】WO2022/026285

【公表番号】特表2023-535771(P2023-535771A)

【公表日】令和5年8月21日(2023.8.21)

【年通号数】公開公報(特許)2023-156

【出願番号】特願2023-505421(P2023-505421)

【国際特許分類】

10

C 0 7 D 4 7 1 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 1 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 1 / 1 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 3 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 7 1 / 1 8 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 7 1 / 2 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 5 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 9 1 / 2 2 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

【 F I 】

20

C 0 7 D 4 7 1 / 1 4 1 0 2

A 6 1 P 3 1 / 1 2

A 6 1 P 3 1 / 1 6

A 6 1 K 3 1 / 5 3

C 0 7 D 4 7 1 / 1 8 C S P

C 0 7 D 4 7 1 / 2 0

A 6 1 K 3 1 / 5 5

C 0 7 D 4 9 1 / 2 2

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 2 0

30

【手続補正書】

【提出日】令和6年6月7日(2024.6.7)

【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】

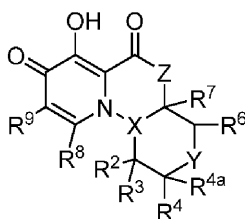
【特許請求の範囲】

【請求項1】

40

式

【化1】



〔式中、

50

Xは、N又はCHであり；

Yは、存在しないか、又は、CHR⁵、-CH₂-CHR⁵-、-CH₂-CHR⁵-CH₂-、S、SO若しくはSO₂であり；

Zは、NR¹又はCR¹R^{1a}であり；

R¹は、水素、C₁-₆アルキル、C₁-₃アルキル(C₃-₇シクロアルキル)、C₁-₃アルキル(ヘテロシクリル)、(C₁-₆アルキル)OR^x及びC₁-₃ハロアルキルからなる群から選択され、ここで、該シクロアルキル基は、単環式又は二環式であることができ、そして、ハロ及びR^xからなる群から独立して選択される1又は2の置換基で置換されていてもよく；

R^{1a}は、水素、C₁-₆アルキル、C₁-₃アルキル(シクロプロピル)、(C₁-₆アルキル)OR^x及びC₁-₃ハロアルキルからなる群から選択され； 10

R²は、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、ここで、該アリールは、単環式又は二環式であることができ、ここで、該アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及びヘテロシクリルは、ハロ、シアノ、シクロプロピル、R^x、R^y、SR^x及びOR^xからなる群から独立して選択される1~3の置換基で置換されていてもよく；

R³は、水素、ヒドロキシ、C₁-₆アルキル、OR^x又はC₁-₃ハロアルキルであり；

又は、

R²とR³は、それらが結合している炭素原子又はヘテロ原子と一緒に、ジヒドロインデン、1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン、クロマン、2,3-ジヒドロベンゾ[b]チオフェン、ジヒドロベンゾフラン又はチオクロマンを形成することができ； 20

R⁴は、水素、ヒドロキシ、N₃、NH(C=O)R^x、SR^x、C₁-₆アルキル、C₂-₆アルケニル、O(C₁-₆アルキル)、O(C₂-₆アルケニル)、(C₁-₃アルキル)R^y、O(C₁-₃アルキル)R^y、R^y及びヘテロアリールからなる群から選択され、ここで、該アルキル基は、ハロ、R^x、R^y、OR^x、シアノ及びフェニルからなる群から独立して選択される1~3の置換基で置換されていてもよく、ここで、該ヘテロアリール基及びアルケニル基は、ハロ、R^x及び(C₁-₃アルキル)OR^xからなる群から独立して選択される1~3の置換基で置換されていてもよく；

又は、 30

R²とR⁴は、それらが結合している炭素原子又はヘテロ原子と一緒に、ジヒドロインデン、1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン、2,3-ジヒドロベンゾ[b]チオフェン、ジヒドロベンゾフラン、クロマン又はチオクロマンを形成することができ；

R^{4a}は、水素及びC₁-₆アルキルからなる群から選択され、ここで、該アルキル基は、ハロ及びOR^xからなる群から独立して選択される1~3の置換基で置換されていてもよく；

又は

R⁴とR^{4a}は、それらが結合している炭素原子又はヘテロ原子と一緒に、オキソ基又はC₄-₆シクロアルキル基[ここで、該シクロアルキル基は、単環式又は二環式であることができ、そして、ハロ、C₁-₃アルキル及びC₁-₃ハロアルキルからなる群から独立して選択される1~3の置換基で置換されていてもよい]を形成することができ； 40

R⁵は、水素、C₁-₆アルキル、C₁-₃アルキル(シクロプロピル)及び(C₁-₆アルキル)OR^xからなる群から選択され；

R⁶は、水素、C₁-₆アルキル、SR^x、NR^x(C=O)C₁-₆アルキル又は(C₂-₃アルケニル)R^yであり；

又は、

R⁴とR⁶は、それらが結合している炭素原子と一緒にC₄-₆シクロアルキル基を形成することができ；

R⁷は、水素又はC₁-₃アルキルであり；

R⁸は、水素、C₁-₆アルキル又は(C₁-₆アルキル)OR^xであり； 50

R^9 は、水素、シアノ又は C_{1-6} アルキルであり、ここで、該アルキルは、1 ~ 3 の
八口で置換されていてもよく；

R^x は、水素及び C_{1-6} アルキルからなる群から選択され、ここで、該アルキルは、
1 ~ 3 の八口で置換されていてもよく；

R^y は、フェニル及び C_{3-6} シクロアルキルからなる群から選択され、ここで、該フ
ェニル及びシクロアルキル基は、八口、シアノ及び R^x からなる群から独立して選択され
る 1 ~ 3 の置換基で置換されていてもよい]

で表される化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項 2】

X は、N である、請求項 1 に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

10

【請求項 3】

R^1 は、メチルである、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩

【請求項 4】

Y は、 CH_2 である、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の化合物又は薬学的に許容される
その塩。

【請求項 5】

R^2 は、フェニルであり、ここで、該フェニルは、八口、 CH_3 、 CF_3 、 $OCHF_2$
及び OCH_3 からなる群から独立して選択される 1 又は 2 の置換基で置換されていてもよ
い、請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

20

【請求項 6】

R^3 は、水素、メチル、エチル又はヒドロキシである、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載
の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項 7】

R^4 は、水素、メチル、エチル、プロピル、トリフルオロエチル、 CH_2CH_2OH 、
 $CH_2CH_2OCH_3$ 又はシクロプロピルメチルである、請求項 1 ~ 6 のいずれかに記載
の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項 8】

R^4 と R^6 は、それらが結合している炭素原子と一緒に C_{4-6} シクロアルキル基を形
成することができる、請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の化合物又は薬学的に許容されるそ
の塩。

30

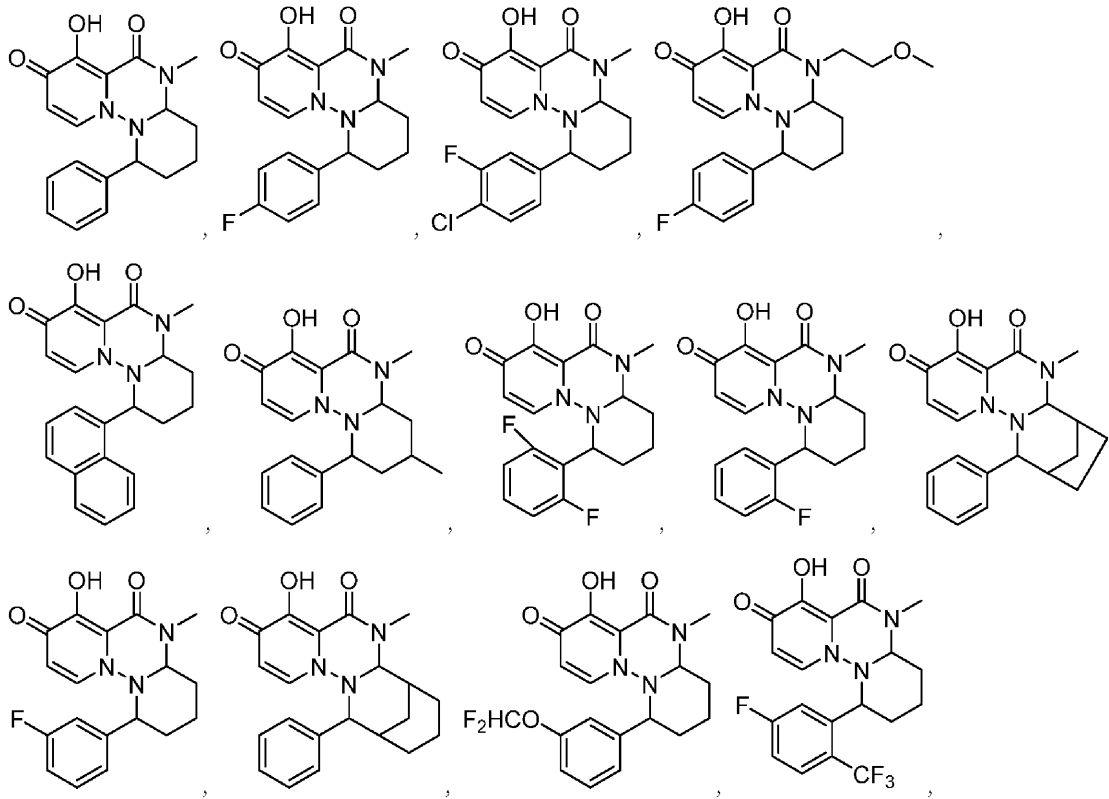
【請求項 9】

以下の、

40

50

【化 2】



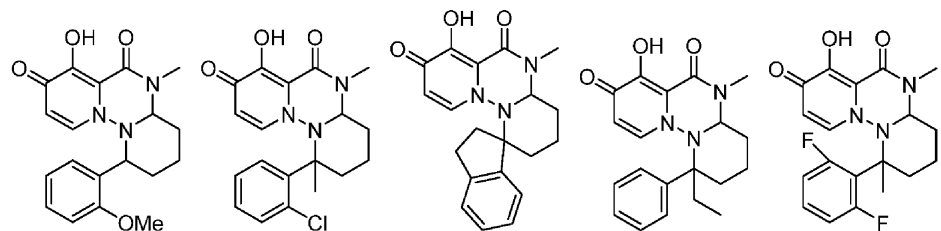
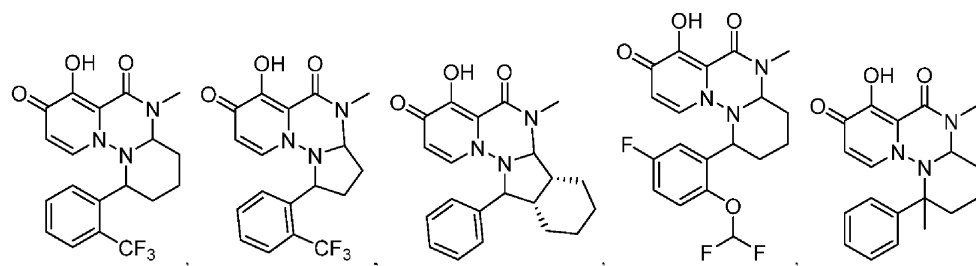
10

20

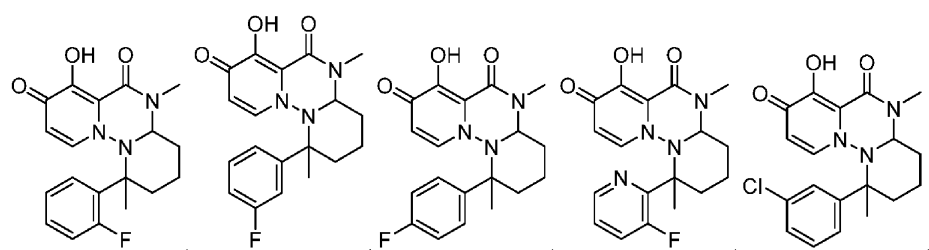
30

40

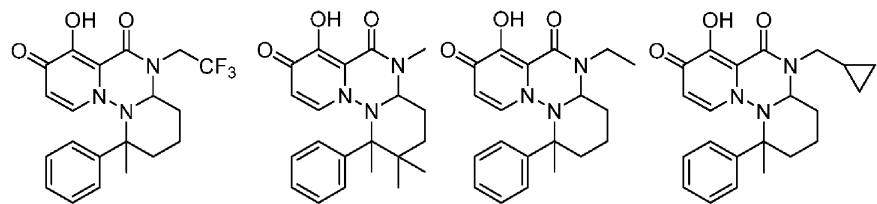
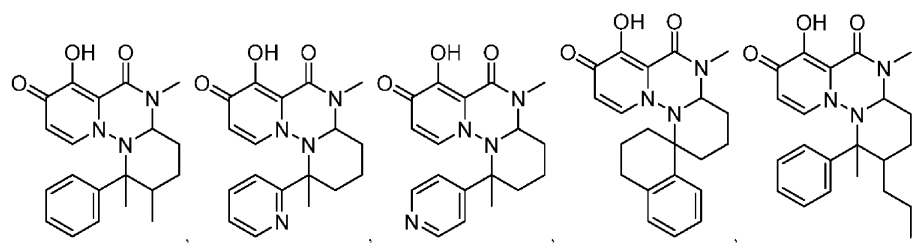
50



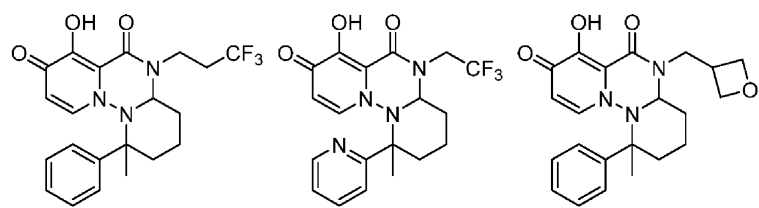
10



20

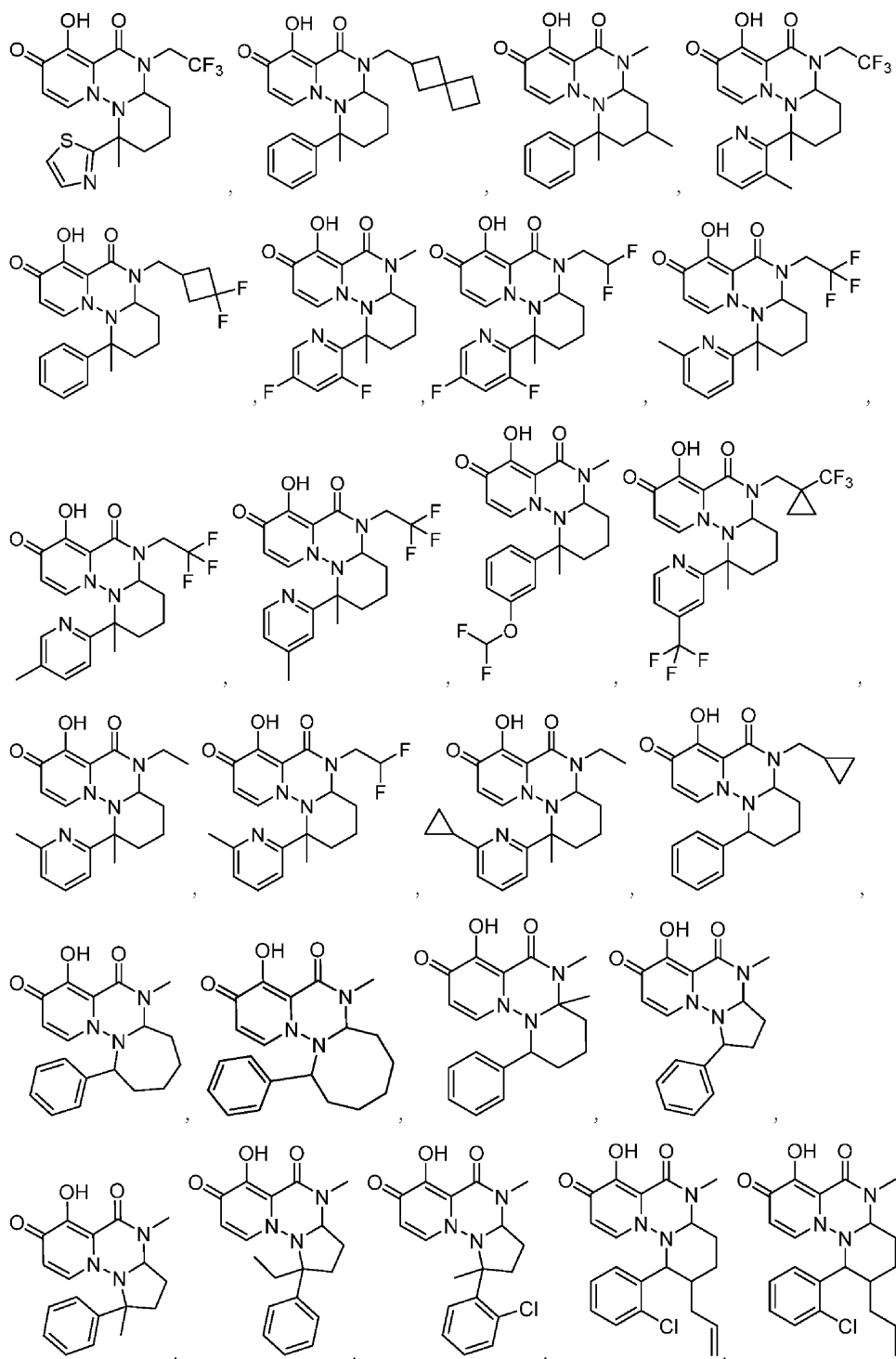


30



40

50



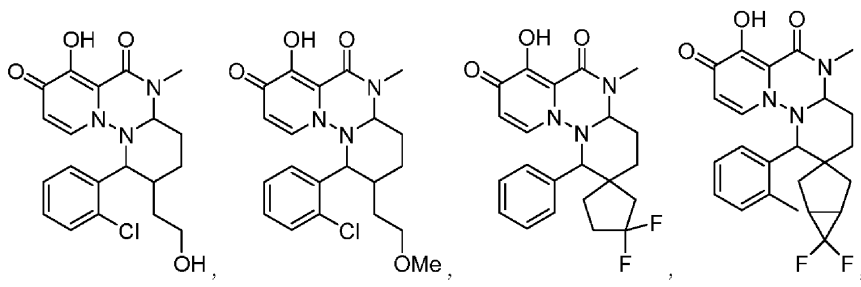
10

20

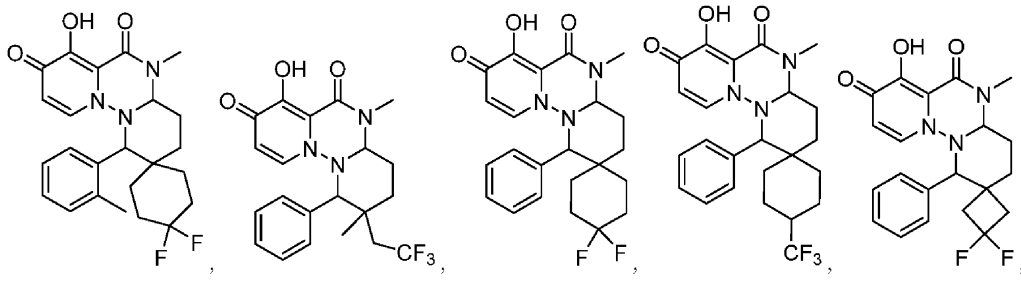
30

40

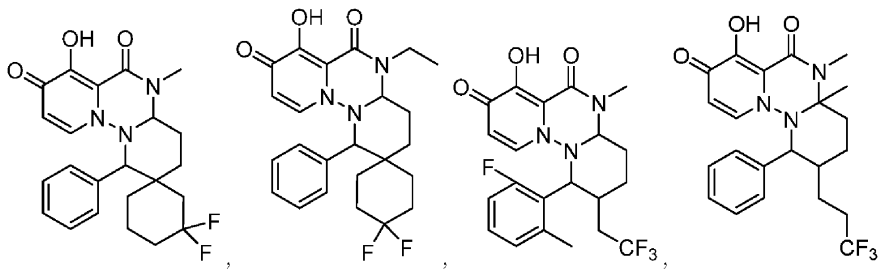
50



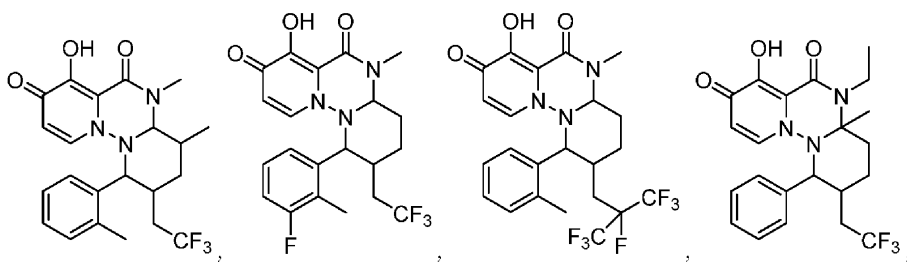
10



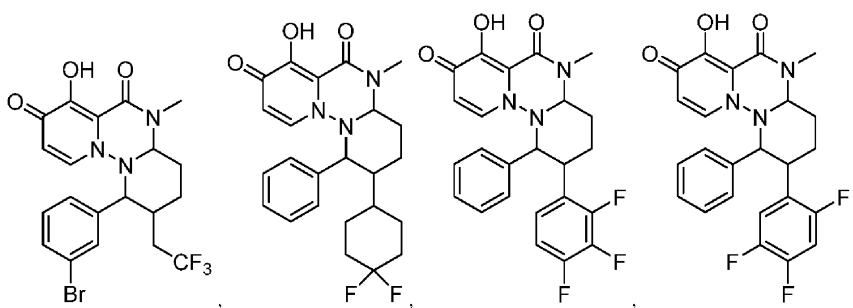
20



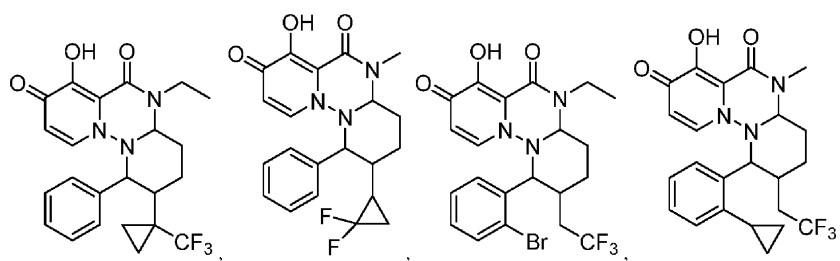
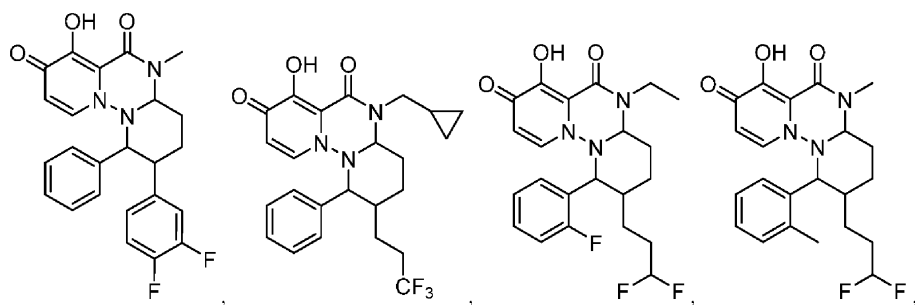
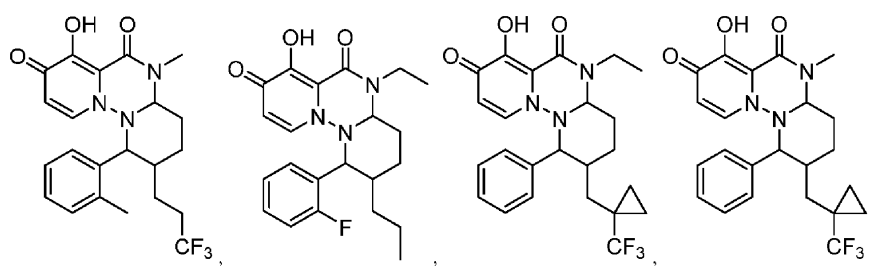
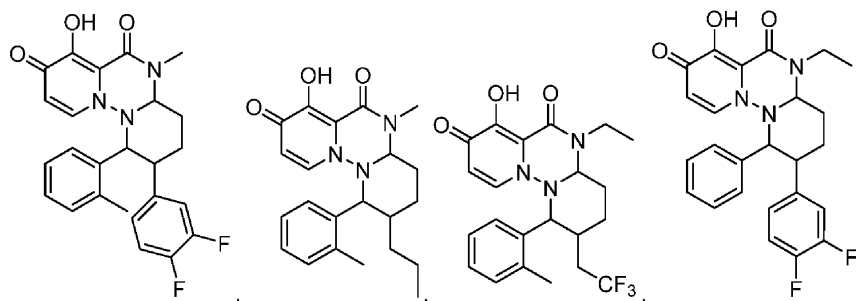
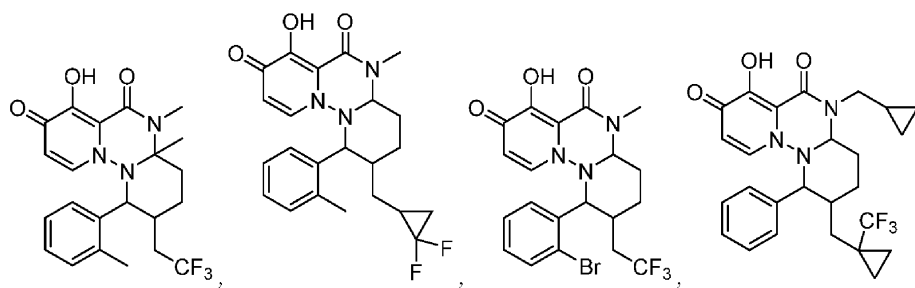
30



40



50



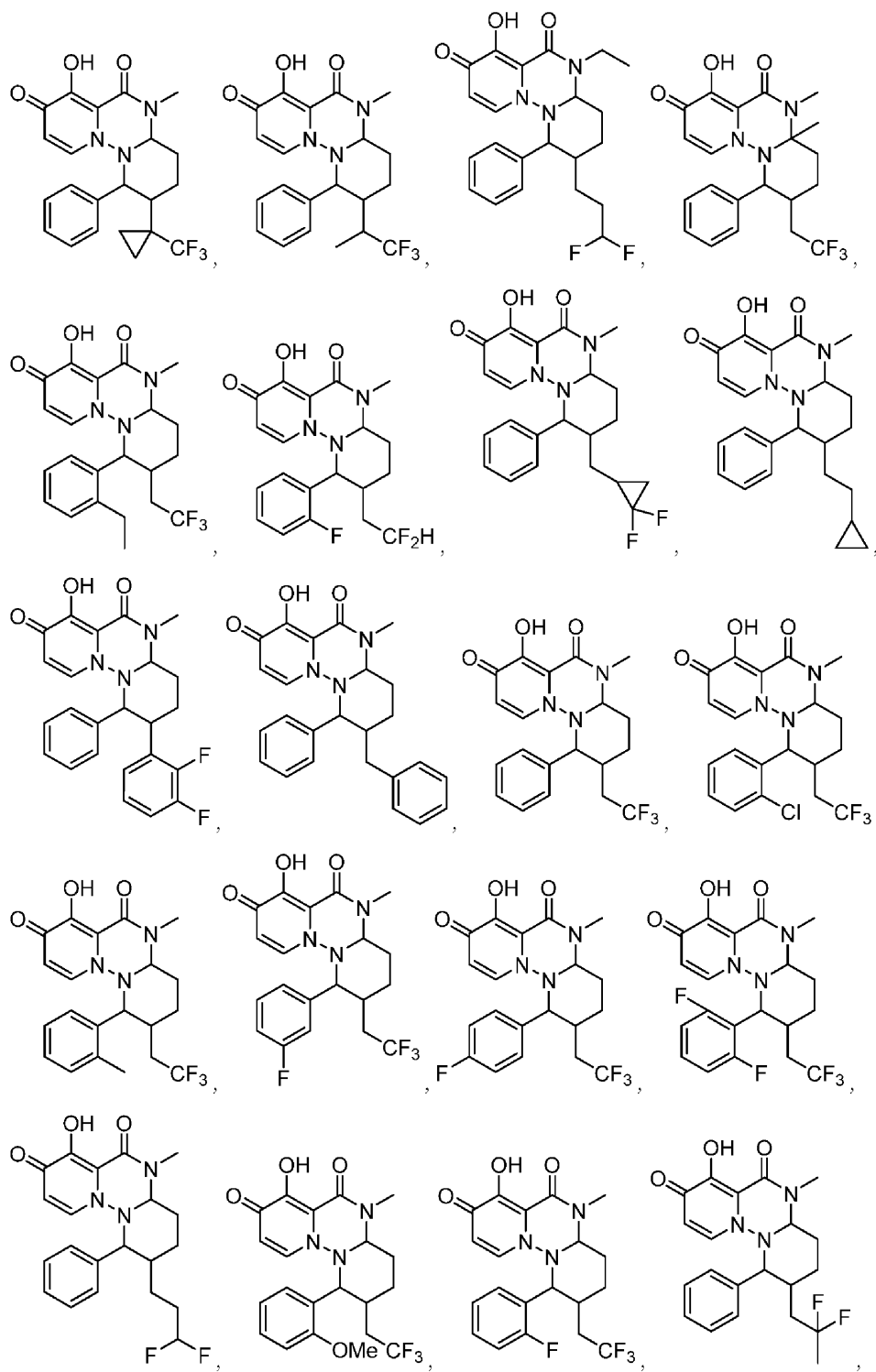
10

20

30

40

50



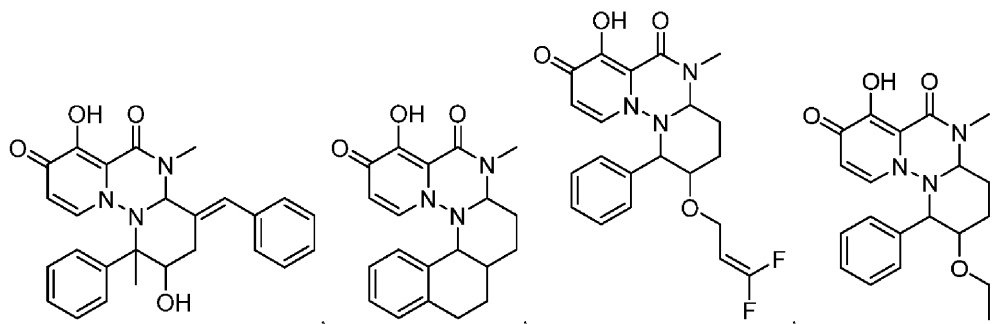
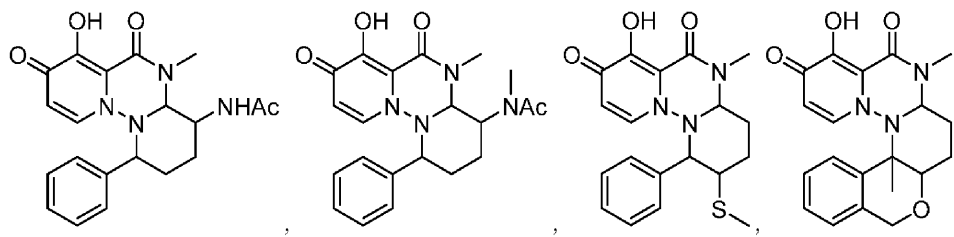
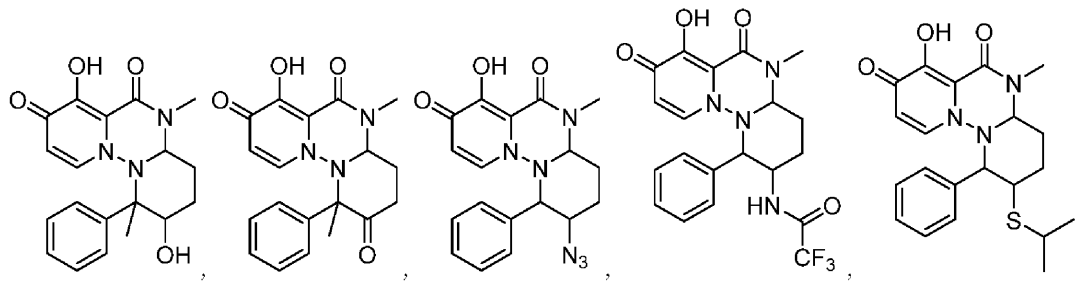
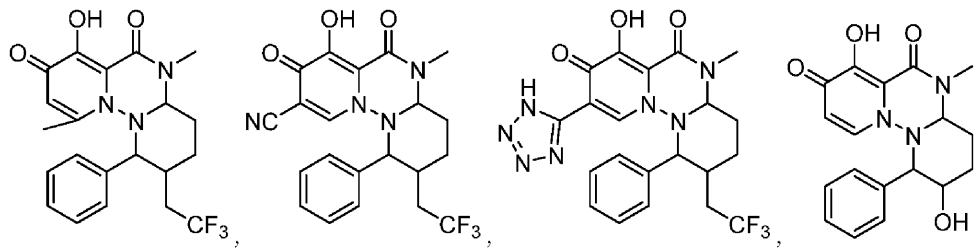
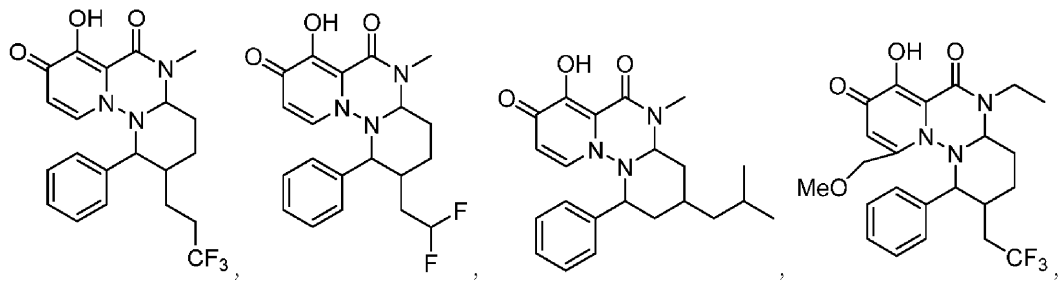
10

20

30

40

50



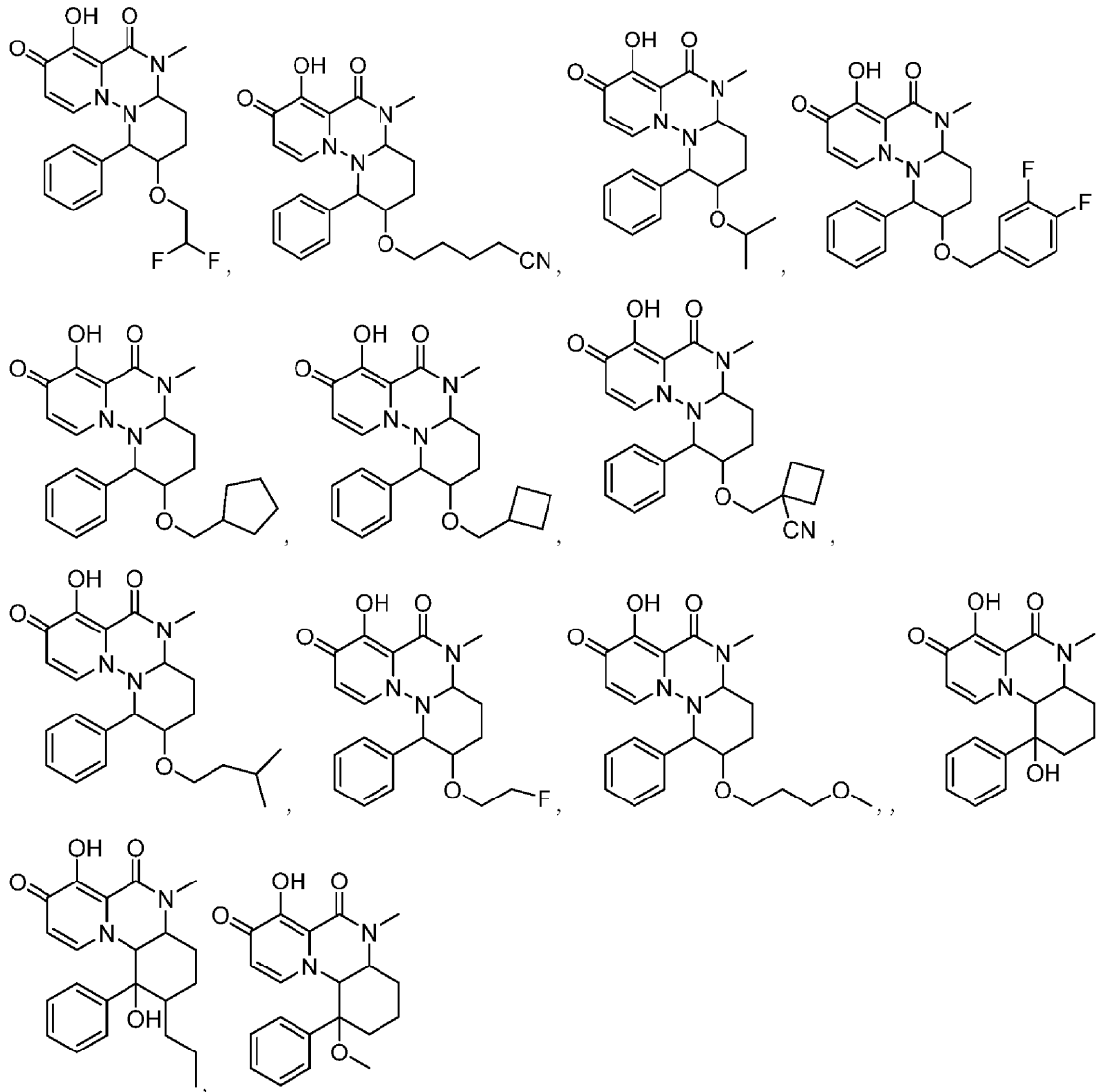
10

20

30

40

50



から選択される化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項 1 0】

請求項 1 ~ 9 のいずれかに記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩及び薬学的に許容される担体を含む、医薬組成物。

【請求項 1 1】

キャップ依存性エンドヌクレアーゼを有するウイルスによって引き起こされる疾患の治療用の、請求項 1 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2】

ウイルスにおけるキャップ依存性エンドヌクレアーゼの阻害用の、請求項 1 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3】

哺乳動物におけるインフルエンザの治療用の、請求項 1 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

哺乳動物におけるインフルエンザの予防用の、請求項 1 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

前記哺乳動物がヒトである、請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

前記哺乳動物がヒトである、請求項 1 4 に記載の医薬組成物。

10

20

30

40

50

【請求項 17】

インフルエンザを治療又は予防するための薬剤の製造における、請求項 1 ~ 9 のいずれかに記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩の使用。

【請求項 18】

療法において使用するための、請求項 1 ~ 9 のいずれかに記載の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

10

20

30

40

50