

【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31年4月25日 (2019.4.25)

【公開番号】特開2017-105750(P2017-105750A)

【公開日】平成29年6月15日 (2017.6.15)

【年通号数】公開・登録公報2017-022

【出願番号】特願2016-135602(P2016-135602)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/14 (2006.01)

C 0 7 D 498/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/53 (2006.01)

A 6 1 P 31/16 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 513/14 (2006.01)

C 0 7 D 491/22 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/14 1 0 2

C 0 7 D 498/14 C S P

A 6 1 K 31/53

A 6 1 P 31/16

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 513/14

C 0 7 D 491/22

【手続補正書】

【提出日】平成31年3月11日 (2019.3.11)

【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

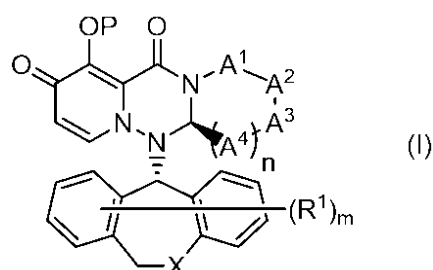
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

以下の式 (I) で示される化合物またはその製薬上許容される塩。

【化 1】



(式中、P は水素またはプロドラッグを形成する P<sup>R</sup> 基；

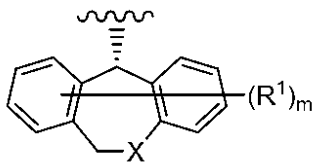
A<sup>1</sup> は、C R<sup>1</sup> A R<sup>1</sup> B、S または O；

A<sup>2</sup> は、C R<sup>2</sup> A R<sup>2</sup> B、S または O；

A<sup>3</sup> は、C R<sup>3</sup> A R<sup>3</sup> B、S または O；

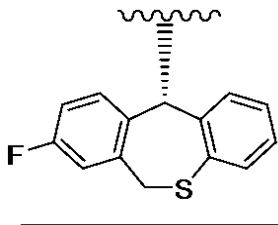
$A^4$  は、それぞれ独立して  $C R^{4A} R^{4B}$ 、S または O ;  
 ここで、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $A^4$ 、 $A^1$  に隣接する窒素原子、および  $A^4$  に隣接する炭素原子から構成される環の環構成原子のヘテロ原子の数は、1 または 2 個であり ;  
 $R^{1A}$  および  $R^{1B}$  は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルキルオキシ、またはフェニル ;  
 $R^{2A}$  および  $R^{2B}$  は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルキルオキシ、またはフェニル ;  
 $R^{3A}$  および  $R^{3B}$  は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルキルオキシ、またはフェニル ;  
 $R^{4A}$  および  $R^{4B}$  は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルキルオキシ、またはフェニル ;  
 $R^{3A}$  および  $R^{3B}$  は隣接する炭素原子と一緒にあって非芳香族炭素環または非芳香族複素環を形成してもよい ;

【化 3】



で示される基が

【化 4】

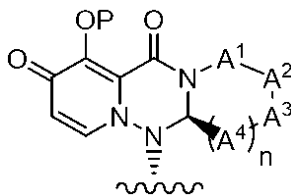


で示される基であり ;

n は 1 ~ 2 の整数 )

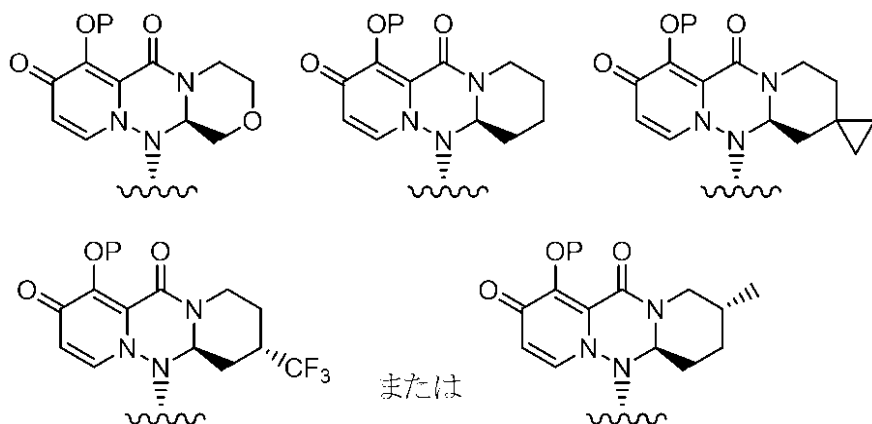
【請求項 2】

【化 9】



で示される基が

## 【化 1 0】



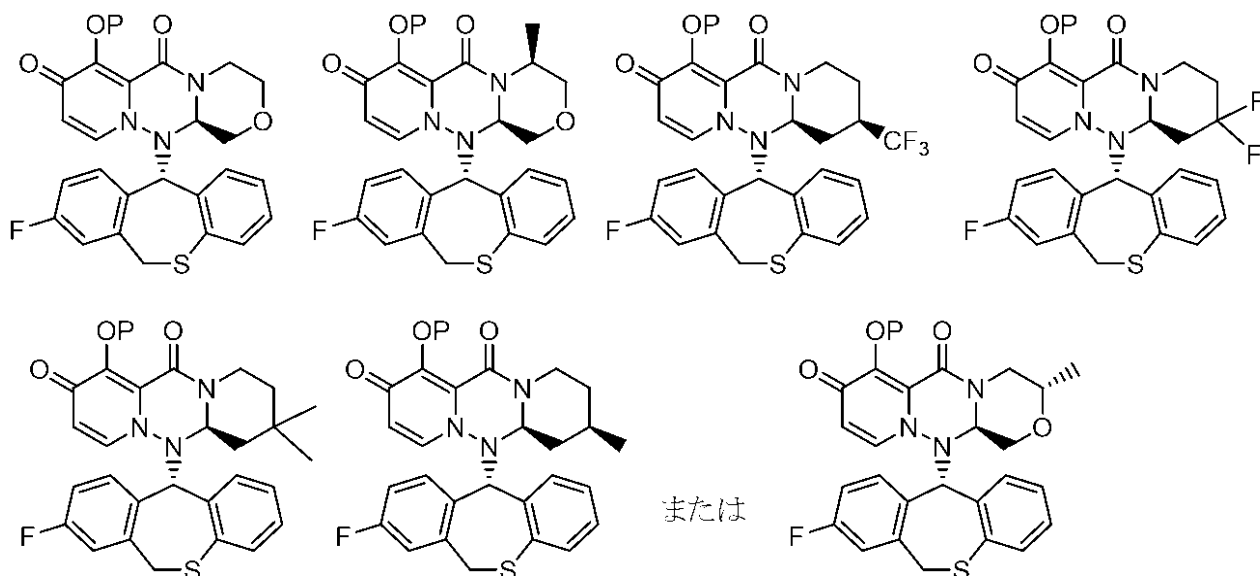
(式中、各記号は請求項 1 と同意義)

である請求項 1 記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

## 【請求項 3】

以下のいずれかの式で示される請求項 1 記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

## 【化 1 1】

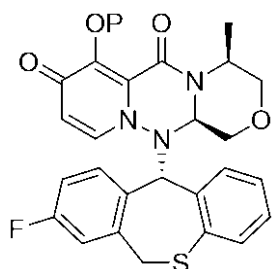


(式中、各記号は請求項 1 と同意義)

## 【請求項 4】

以下の式で示される請求項 1 記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

## 【化 1 3】

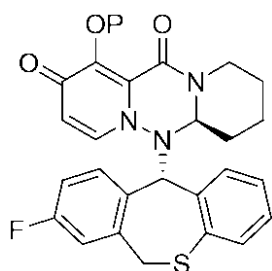


(式中、各記号は請求項 1 と同意義)

## 【請求項 5】

以下の式で示される請求項 1 記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【化 1 4】



(式中、各記号は請求項 1 と同意義)

【請求項 6】

$P^R$  が以下の式 a) ~ ac) から選ばれる基；

- a)  $-C(=O)-P^{R0}$ 、
- b)  $-C(=O)-P^{R1}$ 、
- c)  $-C(=O)-L-P^{R1}$ 、
- d)  $-C(=O)-L-O-P^{R1}$ 、
- e)  $-C(=O)-L-O-L-O-P^{R1}$ 、
- f)  $-C(=O)-L-O-C(=O)-P^{R1}$ 、
- g)  $-C(=O)-O-P^{R2}$ 、
- h)  $-C(=O)-N(-K)(P^{R2})$ 、
- i)  $-C(=O)-O-L-O-P^{R2}$ 、
- j)  $-C(P^{R3})_2-O-P^{R4}$ 、
- k)  $-C(P^{R3})_2-O-L-O-P^{R4}$ 、
- l)  $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-P^{R4}$ 、
- m)  $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-O-P^{R4}$ 、
- n)  $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-N(-K)-P^{R4}$ 、
- o)  $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-O-L-O-P^{R4}$ 、
- p)  $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-O-L-N(P^{R4})_2$ 、
- q)  $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-N(-K)-L-O-P^{R4}$ 、
- r)  $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-N(-K)-L-N(P^{R4})_2$ 、
- s)  $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-O-L-O-L-O-P^{R4}$ 、
- t)  $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-O-L-N(-K)-C(=O)-P^{R4}$ 、
- u)  $-C(P^{R3})_2-O-P(=O)(-P^{R5})_2$ 、
- v)  $-C(P^{R3})_2-P^{R6}$  (ただし、ベンジル基を除く)、
- w)  $-C(=N^+(P^{R7})_2)(-N(P^{R7})_2)$ 、
- x)  $-C(P^{R3})_2-C(P^{R3})_2-C(=O)-O-P^{R2}$ 、
- y)  $-C(P^{R3})_2-N(-K)-C(=O)-O-P^{R2}$ 、
- z)  $-P(=O)(-P^{R8})(-P^{R9})$ 、
- aa)  $-S(=O)_2-P^{R10}$ 、
- ab)  $-P^{R11}$ 、および
- ac)  $-C(P^{R3})_2-C(P^{R3})_2-O-P^{R2}$ 、

(式中、L は、直鎖もしくは分枝状のアルキレン、または直鎖もしくは分枝状のアルケニレンであり、

K は、水素、または置換基群 A で置換されていてもよいアルキルであり、

$P^{R0}$  は、置換基群 A で置換されていてもよいアルキル、または置換基群 A で置換されていてもよいアルケニルであり、

$P^{R1}$  は、置換基群 A で置換されていてもよい炭素環式基、置換基群 A で置換されていてもよい複素環式基、置換基群 A で置換されていてもよいアルキルアミノ、または置換基群

Aで置換されていてもよいアルキルスルファニルであり、

$P^{R2}$  は、置換基群 A で置換されていてもよいアルキル、置換基群 A で置換されていてもよい炭素環式基、置換基群 A で置換されていてもよい複素環式基、置換基群 A で置換されていてもよい炭素環アルキル、置換基群 A で置換されていてもよい複素環アルキル、またはトリアルキルシリルであり、

$P^{R3}$  は、それぞれ独立して、水素、アルキルであり、

$P^{R4}$  は、それぞれ独立して、置換基群 A で置換されていてもよいアルキル、置換基群 A で置換されていてもよい炭素環式基、置換基群 A で置換されていてもよい複素環式基、置換基群 A で置換されていてもよいアルキルアミノ、置換基群 A で置換されていてもよい炭素環アルキル、置換基群 A で置換されていてもよい複素環アルキル、またはトリアルキルシリルであり、

$P^{R5}$  は、それぞれ独立して、ヒドロキシまたは  $OB_n$  であり、

$P^{R6}$  は、置換基群 A で置換されていてもよい炭素環式基、または置換基群 A で置換されていてもよい複素環式基であり、

$P^{R7}$  は、それぞれ独立して、置換基群 A で置換されていてもよいアルキルであり、

$P^{R8}$  は、置換基群 A で置換されていてもよいアルキルオキシであり、

$P^{R9}$  は、置換基群 A で置換されていてもよいアルキルオキシ、置換基群 A で置換されていてもよいアルキルアミノ、置換基群 A で置換されていてもよい炭素環オキシ、置換基群 A で置換されていてもよい複素環オキシ、置換基群 A で置換されていてもよい炭素環アミノ、または置換基群 A で置換されていてもよい複素環アミノであり、ならびに、

$P^{R8}$  および  $P^{R9}$  は、隣接するリン原子と一緒にあって、置換基群 A で置換されていてもよい複素環を形成してもよく、

$P^{R10}$  は、置換基群 A で置換されていてもよいアルキル、置換基群 A で置換されていてもよい炭素環式基、置換基群 A で置換されていてもよい複素環式基、置換基群 A で置換されていてもよい炭素環アルキル、または置換基群 A で置換されていてもよい複素環アルキルであり、

$P^{R11}$  は、置換基群 A で置換されていてもよいアルキル、置換基群 A で置換されていてもよいアルケニル、置換基群 A で置換されていてもよい炭素環式基、または置換基群 A で置換されていてもよい複素環式基である。

置換基群 A ; オキシ、アルキル、ヒドロキシアルキル、アミノ、アルキルアミノ、炭素環式基、複素環式基、炭素環アルキル、アルキルカルボニル、ハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、アルキルカルボニルアミノ、アルキルカルボニルアミノアルキル、アルキルカルボニルオキシ、アルキルオキシカルボニル、アルキルオキシカルボニルアルキル、アルキルオキシカルボニルオキシ、アルキルアミノカルボニルオキシ、アルキルアミノアルキル、アルキルオキシ、シアノ、ニトロ、アジド、アルキルスルホニル、トリアルキルシリル、およびホスホ) である請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の化合物、またはその製薬上許容される塩。

#### 【請求項 7】

$P^R$  が以下の式から選ばれる基 ;

a)  $-C(=O)-P^{R0}$ 、

b)  $-C(=O)-P^{R1}$ 、

g)  $-C(=O)-O-P^{R2}$ 、

h)  $-C(=O)-N(-K)(P^{R2})$ 、

i)  $-C(=O)-O-L-O-P^{R2}$ 、

l)  $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-P^{R4}$ 、

m)  $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-O-P^{R4}$ 、

o)  $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-O-L-O-P^{R4}$ 、

v)  $-C(P^{R3})_2-P^{R6}$  (ただし、ベンジル基を除く)、

x)  $-C(P^{R3})_2-C(P^{R3})_2-C(=O)-O-P^{R2}$ 、

y)  $-C(P^{R3})_2-N(-K)-C(=O)-O-P^{R2}$ 、および

$z) - P(=O)(-P^{R8})(-P^{R9})$ 、  
 (式中、Lは、直鎖もしくは分枝状のアルキレン、  
 Kは、水素、または置換基群Aで置換されていてもよいアルキルであり、  
 $P^{R0}$ は、置換基群Aで置換されていてもよいアルキルであり、  
 $P^{R1}$ は、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環式基、または置換基群Aで置換されていてもよい複素環式基であり、  
 $P^{R2}$ は、置換基群Aで置換されていてもよいアルキル、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環式基、置換基群Aで置換されていてもよい複素環式基、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環アルキル、または置換基群Aで置換されていてもよい複素環アルキルであり、  
 $P^{R3}$ は、それぞれ独立して、水素、またはアルキルであり、  
 $P^{R4}$ は、置換基群Aで置換されていてもよいアルキル、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環式基、または置換基群Aで置換されていてもよい複素環式基であり、  
 $P^{R6}$ は、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環式基、または置換基群Aで置換されていてもよい複素環式基であり、  
 $P^{R8}$ は、置換基群Aで置換されていてもよいアルキルオキシであり、  
 $P^{R9}$ は、置換基群Aで置換されていてもよいアルキルオキシ、置換基群Aで置換されていてもよいアルキルアミノ、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環オキシ、置換基群Aで置換されていてもよい複素環オキシ、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環アミノ、または置換基群Aで置換されていてもよい複素環アミノであり、ならびに  
 $P^{R8}$ および $P^{R9}$ は、隣接するリン原子と一緒にあって、置換基群Aで置換されていてもよい複素環を形成してもよい。

置換基群A；オキシ、アルキル、アルキルアミノ、炭素環式基、複素環式基、アルキルカルボニル、ハロゲン、ヒドロキシ、アルキルカルボニルアミノ、アルキルカルボニルオキシ、アルキルオキシカルボニル、アルキルオキシカルボニルアルキル、アルキルアミノカルボニルオキシ、アルキルオキシ、ニトロ、アジド、アルキルスルホニル、およびトリアルキルシリル)である請求項6記載の化合物、またはその製薬上許容される塩。

【請求項8】

以下のいずれかの式で示される化合物、またはその製薬上許容される塩。

【化16】

