

【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29年11月2日 (2017.11.2)

【公表番号】特表2016-530315(P2016-530315A)

【公表日】平成28年9月29日 (2016.9.29)

【年通号数】公開・登録公報2016-057

【出願番号】特願2016-542074(P2016-542074)

【国際特許分類】

C 0 7 D 237/24 (2006.01)

A 6 1 K 31/50 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/501 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 405/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/5025 (2006.01)

C 0 7 D 498/06 (2006.01)

C 0 7 D 487/06 (2006.01)

C 0 7 D 487/08 (2006.01)

C 0 7 D 471/22 (2006.01)

C 0 7 D 498/22 (2006.01)

C 0 7 D 401/10 (2006.01)

C 0 7 D 405/10 (2006.01)

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

C 0 7 D 413/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

C 0 7 D 403/08 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/16 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/215 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 237/24 C S P

A 6 1 K 31/50

C 0 7 D 401/04

A 6 1 K 31/501

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 405/04

C 0 7 D 403/04

C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z

A 6 1 K 31/5025

C 0 7 D 498/06

C 0 7 D 487/06

C 0 7 D 487/08

C 0 7 D 471/22

C 0 7 D 498/22

C 0 7 D 401/10

C 0 7 D 405/10  
 C 0 7 D 403/06  
 A 6 1 K 31/55  
 C 0 7 D 413/06  
 A 6 1 K 31/553  
 C 0 7 D 403/08  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1  
 A 6 1 P 31/16  
 A 6 1 K 45/00  
 A 6 1 K 31/215

## 【手続補正書】

【提出日】平成29年9月22日(2017.9.22)

## 【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

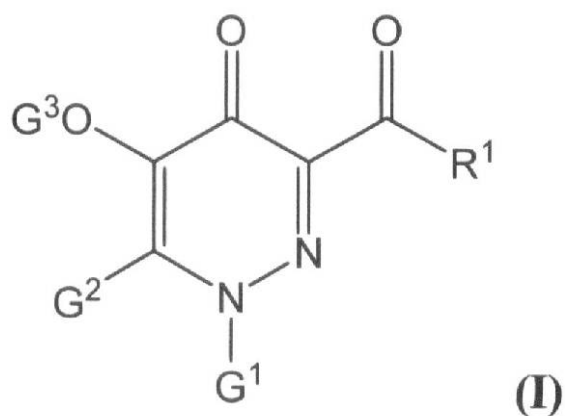
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

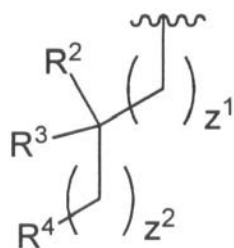
【請求項 1】

式 ( I ) の化合物またはその薬剂的に許容できる塩。

【化 1】

(式 ( I ) 中、G<sup>1</sup>は、

【化 2】

および R<sup>5</sup> からなる群から選択され；G<sup>2</sup> は、水素、ハロゲン、-CN、任意に置換された C<sub>1-6</sub> アルキル、任意に置換された

アリール、任意に置換されたヘテロアリール、 $-CH_2OH$ 、 $-CH(Y^1)(OH)$ または $-C(O)Y^1$ であり；

$G^3$ は、水素、 $-C(O)Y^2$ 、 $-C(O)O-Y^2$ 、 $-(CH_2)-O(CO)Y^2$ 、 $-(CH_2)-O(CO)OY^2$ 、 $-(CHCH_3)-O(CO)Y^2$ 、および $-(CHCH_3)-O(CO)OY^2$ からなる群から選択され；

$Y^1$ および $Y^2$ は独立して、任意に置換された $C_{1-6}$ アルキルまたは任意に置換されたアリールであり；

$R^1$ は、 $OR^6$ 、 $NH_2$ 、任意に置換されたアルキル、任意に置換されたアリール、任意に置換された一置換アミン、任意に置換された二置換アミン、任意に置換されたヘテロシクリル、任意に置換されたN-スルホンアミドおよび任意に置換されたアルコキシアミンからなる群から選択される、または $R^{10}$ であり；

$R^2$ は、水素、 $C_{1-6}$ アルキル、任意に置換された $C_{3-6}$ シクロアルキル、任意に置換されたアリール、任意に置換されたアリール( $C_{1-6}$ アルキル)または任意に置換されたC-アミドであり；

$R^3$ は水素または $C_{1-6}$ アルキルであり；

あるいは、 $R^2$ および $R^3$ は一緒になって、任意に置換された $C_{3-6}$ シクロアルキル、任意に置換された5～6員ヘテロシクリルまたは $=O$ を形成し；

$R^4$ は、任意に置換されたアリール、任意に置換されたシクロアルキル、任意に置換されたシクロアルケニル、任意に置換されたヘテロアリールおよび任意に置換されたヘテロシクリルからなる群から選択され；

あるいは、 $R^4$ は $A^1R^{A4}R^{B4}$ であり、 $A^1$ は $CH$ または $N$ であり； $R^{A4}$ および $R^{B4}$ はそれぞれ独立して任意に置換されたフェニルであり；

$R^5$ は、任意に置換されたアリール、任意に置換されたシクロアルキル、任意に置換されたシクロアルケニル、任意に置換されたヘテロアリールおよび任意に置換されたヘテロシクリルからなる群から選択され；

$R^6$ は、水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $-C(O)R^7$ および $-C(O)NR^8R^9$ からなる群から選択され；

$R^7$ は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール( $C_{1-6}$ アルキル)、ヘテロアリール( $C_{1-6}$ アルキル)およびヘテロシクリル( $C_{1-6}$ アルキル)からなる群から選択され；

$R^8$ および $R^9$ は独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール( $C_{1-6}$ アルキル)、ヘテロアリール( $C_{1-6}$ アルキル)およびヘテロシクリル( $C_{1-6}$ アルキル)からなる群から選択され；

あるいは、 $R^8$ および $R^9$ は一緒になって任意に置換されたヘテロシクリルを形成し；

式(I)中、 $R^1$ が $R^{10}$ である場合、 $R^{10}$ および $R^4$ が一緒になり、 $L^1$ を含んで、 $L^1$ が $R^{10}$ および $R^4$ を連結して11～20員環を形成し、あるいは、式(I)中、 $R^1$ が $R^{10}$ である場合、 $R^{10}$ および $R^5$ が一緒になり、 $L^1$ を含んで、 $L^1$ が $R^{10}$ および $R^5$ を連結して11～20員環を形成し；

$R^{10}$ は任意に置換された $-CH_2-$ 、任意に置換された $-CH=CH-$ 、 $O$ (酸素)、 $S$ (硫黄)、または $NR^{11}$ であり；

$R^{11}$ は水素または $C_{1-6}$ アルキルであり；

$L^1$ は $-L^2-$ 、または $-L^3-L^4-L^5-$ であり；

$L^2$ は任意に置換されたアルキレン、任意に置換されたアルケニレン、任意に置換されたヘテロアルキレンおよび任意に置換されたヘテロアルケニレンからなる群から選択され；

$L^3$ は任意に置換された $C_{1-6}$ アルキレンであり；

$L^4$ は任意に置換されたシクロアルキル、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロアリール、任意に置換されたヘテロシクリル、 $O$ (酸素)、 $S$ (硫黄)、また

は  $\text{NR}^{11}$  であり；

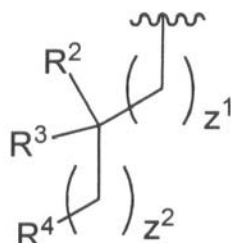
$\text{L}^5$  は任意に置換された  $\text{C}_{1-6}$  アルキレンまたは任意に置換されたヘテロアルキレンであり；

$\text{Z}^1$  および  $\text{Z}^2$  は独立して 0、1、2、3 または 4 である。）

【請求項 2】

$\text{G}^1$  が、

【化 3】



であり；

$\text{G}^2$  が水素または  $\text{C}_{1-6}$  アルキルであり；

$\text{G}^3$  が水素、 $-\text{C}(\text{O})\text{Y}^2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{O}-\text{Y}^2$ 、 $-(\text{CH}_2)-\text{O}(\text{CO})\text{Y}^2$ 、 $-(\text{CH}_2)-\text{O}(\text{CO})\text{OY}^2$ 、 $-(\text{CHCH}_3)-\text{O}(\text{CO})\text{Y}^2$ 、および  $-(\text{CHCH}_3)-\text{O}(\text{CO})\text{OY}^2$  からなる群から選択され；

$\text{Y}^2$  が  $\text{C}_{1-6}$  アルキルであり；

$\text{R}^1$  が  $\text{OR}^6$ 、 $\text{NH}_2$ 、一置換アミン、二置換アミン、ヘテロシクリルおよび N - スルホンアミドからなる群から選択され、前記一置換アミン、二置換アミン、ヘテロシクリルおよび N - スルホンアミドがそれぞれ、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール（アルキル）、ヘテロアリール（アルキル）、（ヘテロシクリル）アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アシル、シアノ、ハロゲン、チオカルボニル、O - カルバミル、N - カルバミル、O - チオカルバミル、N - チオカルバミル、C - アミド、N - アミド、S - スルホンアミド、N - スルホンアミド、C - カルボキシ、O - カルボキシ、イソシアナト、チオシアナト、イソチオシアナト、ニトロ、シリル、スルフェニル、スルフィニル、スルホニル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、トリハロメタンスルホニル、トリハロメタンスルホンアミド、アミノ、一置換アミノ基および二置換アミノ基からなる群から選択される一つまたは複数の置換基で任意に置換されており；

$\text{R}^2$  が水素または  $\text{C}_{1-6}$  アルキルであり；

$\text{R}^3$  が水素または  $\text{C}_{1-6}$  アルキルであり；

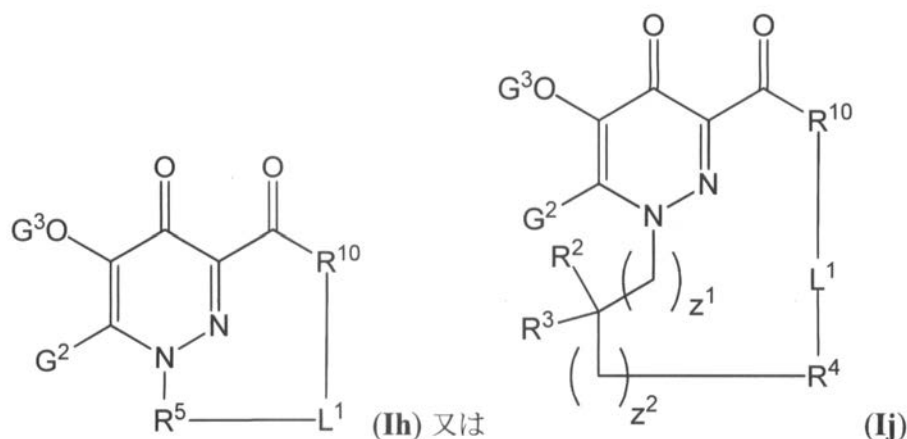
あるいは、 $\text{R}^2$  および  $\text{R}^3$  が一緒になって任意に置換された  $\text{C}_{3-6}$  シクロアルキルまたは任意に置換された 5 ~ 6 員ヘテロシクリルを形成している；

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

式 (I h) もしくは式 (I j) の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物またはその薬剤的に許容できる塩。

## 【化 4】



## 【請求項 4】

$L^2$ が任意に置換されたアルキレンまたは任意に置換されたアルケニレンである、請求項 3 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

$L^2$ が任意に置換されたヘテロアルキレンまたは任意に置換されたヘテロアルケニレンである、請求項 3 に記載の化合物。

## 【請求項 6】

$L^1$ が  $-L^3-L^4-L^5-$  であり；

$L^3$ が任意に置換された  $C_{1-4}$  アルキレンであり；

$L^4$ が任意に置換されたシクロアルキル、任意に置換されたアリール、または任意に置換されたヘテロアリールであり；

$L^5$ が任意に置換された  $C_{1-4}$  アルキレンである、または、

$L^1$ が  $-L^3-L^4-L^5-$  であり；

$L^3$ が任意に置換された  $C_{1-4}$  アルキレンであり；

$L^4$ が O (酸素)、S (硫黄)、または  $NR^{11}$  であり；

$L^5$ が任意に置換された  $C_{1-4}$  アルキレンである、または、

$L^1$ が  $-L^3-L^4-L^5-$  であり；

$L^3$ が任意に置換された  $C_{2-4}$  アルキレンであり；

$L^4$ が任意に置換されたシクロアルキル、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロアリール、任意に置換されたヘテロシクリル、O (酸素)、S (硫黄)、または  $NR^{11}$  であり；

$L^5$ が任意に置換された  $C_{2-4}$  アルキレンである、請求項 3 に記載の化合物。

## 【請求項 7】

$R^1$ が  $R^{10}$  であり、 $R^{10}$ が  $NR^{11}$  であり；

$R^{11}$ が H (水素) である、

請求項 3 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 8】

$R^1$ が  $OR^6$  であり、 $R^6$ が水素または  $C_{1-6}$  アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 9】

$R^1$ が  $OR^6$  であり、 $R^6$ が  $-C(O)R^7$  または  $-C(O)NR^8R^9$  である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 10】

$R^1$ が  $NH_2$ 、任意に置換された一置換アミン、任意に置換された二置換アミン、任意に置換された N - スルホンアミド、または任意に置換されたヘテロシクリルである、請求項

1 に記載の化合物。

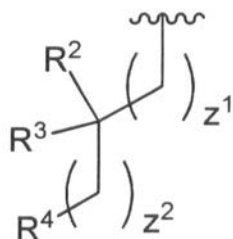
【請求項 1 1】

$R^1$  が  $R^{10}$  であり、 $R^{10}$  が  $CH_2$  または  $NR^{11}$  である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 2】

$G^1$  が、

【化 5】



である、請求項 8 ~ 1 0 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 3】

$R^2$  が水素または  $C_{1-6}$  アルキルである、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

$R^3$  が水素または  $C_{1-6}$  アルキルである、請求項 1 2 または 1 3 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

$R^2$  および  $R^3$  が一緒になって任意に置換された  $C_{3-6}$  シクロアルキルを形成している、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 1 6】

$R^2$  および  $R^3$  が一緒になって任意に置換された 5 ~ 6 員ヘテロシクリルを形成している、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 1 7】

$R^4$  が任意に置換されたシクロアルキル、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロアリールおよび任意に置換されたヘテロシクリルからなる群から選択され、 $R^4$  が置換されているとき、 $R^4$  は、ハロゲン、 $C_{1-6}$  アルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヒドロキシアルキル、N - スルホンアミド、S - スルホンアミド、スルホニル、任意に置換されたアリール（ここで、任意に置換されたアリールが置換アリールである場合、該アリールは、 $C_{1-6}$  アルキル、アルコキシ、アリール、シアノ、ハロゲン、ハロアルキルおよびハロアルコキシから選択される一つまたは複数の置換基で置換されている）、任意に置換されたシクロアルキル（ここで、任意に置換されたシクロアルキルが置換シクロアルキルである場合、該シクロアルキルは、 $C_{1-6}$  アルキル、アルコキシ、ハロゲンおよびハロアルキルから選択される一つまたは複数の置換基で置換されている）、任意に置換されたヘテロシクリル（ここで、任意に置換されたヘテロシクリルが置換ヘテロシクリルである場合、該ヘテロシクリルは、 $C_{1-6}$  アルキル、アルコキシ、ハロゲン、ハロアルキル、アリール（ $C_{1-6}$  アルキル）および C - カルボキシから選択される一つまたは複数の置換基で置換されている）、カルボニル、C - カルボキシ、 $-CH_2-$ （一置換アミン）および  $CH_2-$ （二置換アミン）からなる群より選択される一つまたは複数の置換基で置換されている、

請求項 1 2 ~ 1 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 8】

任意に置換されたアリールが任意に置換されたフェニルである、請求項 1 7 に記載の化合物。

【請求項 1 9】

$Z^1$  が 0 または 1 である、請求項 1 2 ~ 1 8 のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 20】

$Z^1$ が2、3または4である、請求項12～18のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 21】

$Z^2$ が0または1である、請求項12～20のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 22】

$Z^2$ が2、3または4である、請求項12～20のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 23】

$G^1$ が $R^5$ である、請求項8～10のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 24】

$R^5$ が任意に置換されたアリールである、請求項23に記載の化合物。

## 【請求項 25】

$G^1$ が $R^5$ であり、 $R^5$ が任意に置換されたシクロアルキル、任意に置換されたヘテロアリールまたは任意に置換されたヘテロシクリルであり、 $R^5$ が置換されているとき、 $R^5$ は、ハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル、アルコキシ、アリールオキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ヒドロシアルキル、N - スルホンアミド、S - スルホンアミド、スルホニル、任意に置換されたアリール（ここで、任意に置換されたアリールが置換アリールである場合、該アリールは、 $C_{1-6}$ アルキル、アルコキシ、ハロゲンおよびハロアルキルから選択される一つまたは複数の置換基で置換されている）、任意に置換されたシクロアルキル（ここで、任意に置換されたシクロアルキルが置換シクロアルキルである場合、該シクロアルキルは、 $C_{1-6}$ アルキル、アルコキシ、ハロゲンおよびハロアルキルから選択される一つまたは複数の置換基で置換されている）、任意に置換されたヘテロシクリル（ここで、任意に置換されたヘテロシクリルが置換ヘテロシクリルである場合、該ヘテロシクリルは、 $C_{1-6}$ アルキル、アルコキシ、ハロゲン、ハロアルキル、アリール（ $C_{1-6}$ アルキル）およびC - カルボキシから選択される一つまたは複数の置換基で置換されている）、カルボニル、C - カルボキシ、 $-CH_2-$ （一置換アミン）および $CH_2-$ （二置換アミン）からなる群より選択される一つまたは複数の置換基で置換されている、請求項8～10のいずれか一項に記載の化合物。

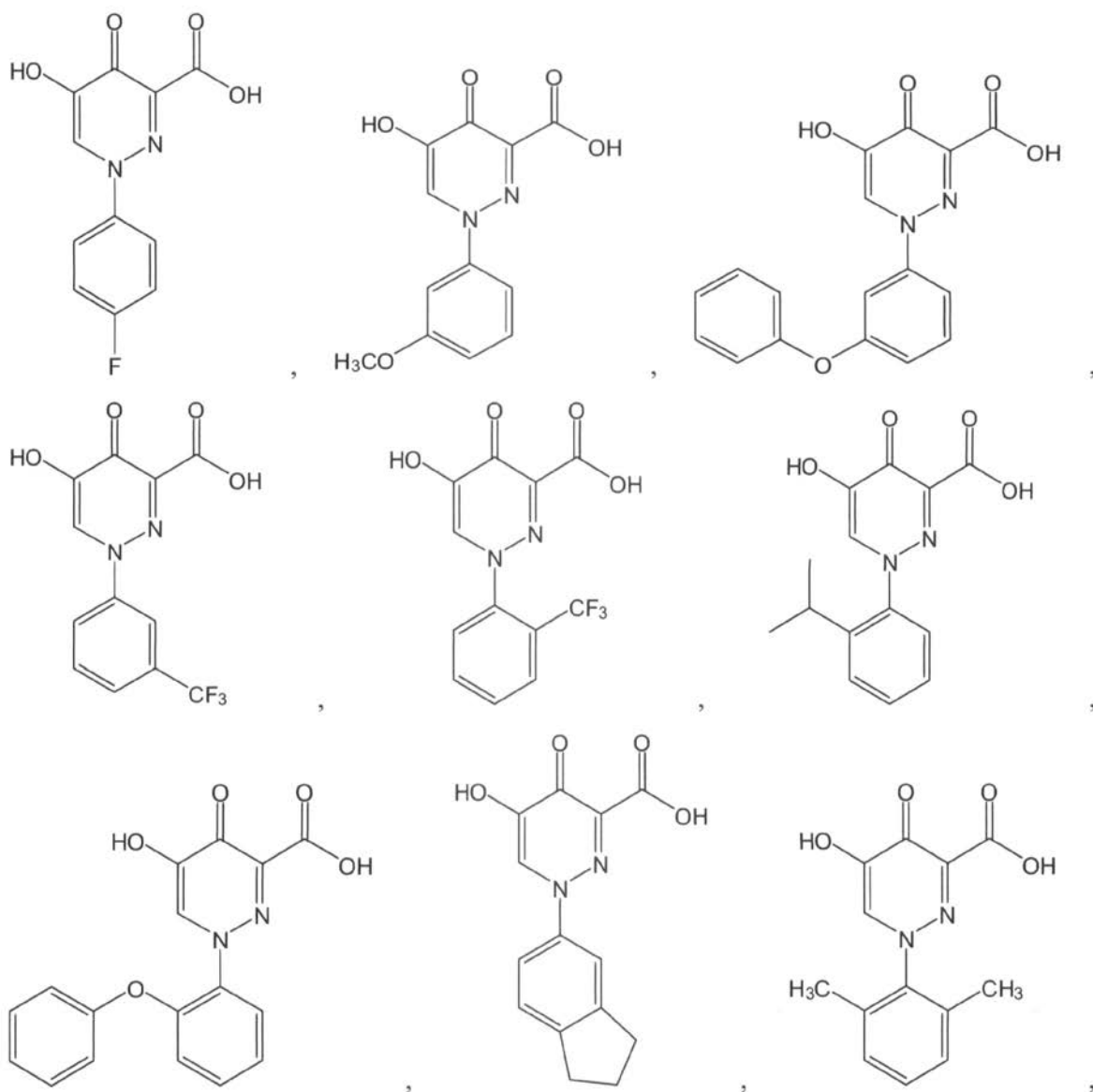
## 【請求項 26】

$G^3$ が水素である、請求項1～25のいずれか一項に記載の化合物。

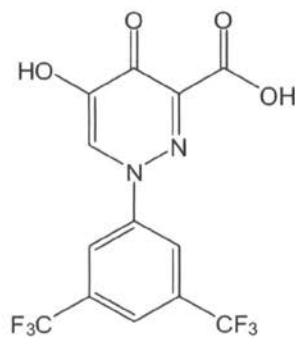
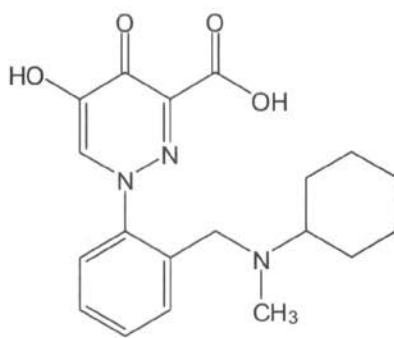
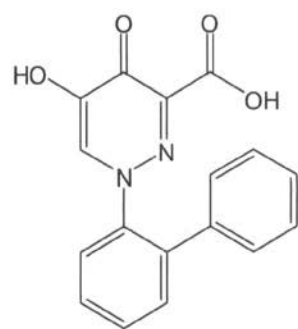
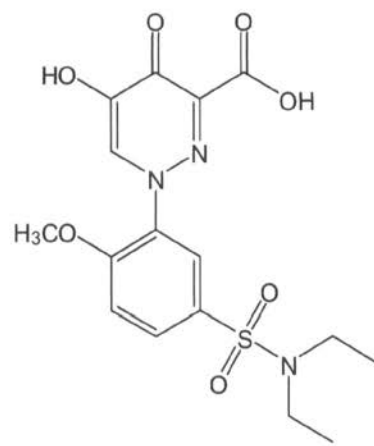
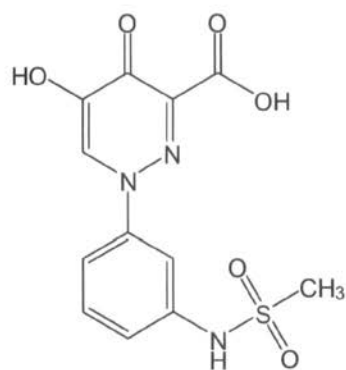
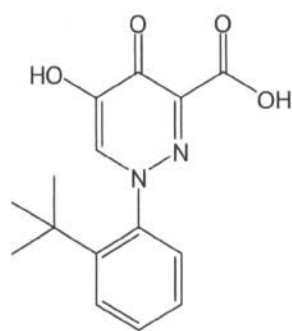
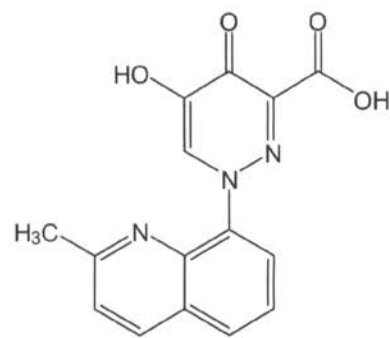
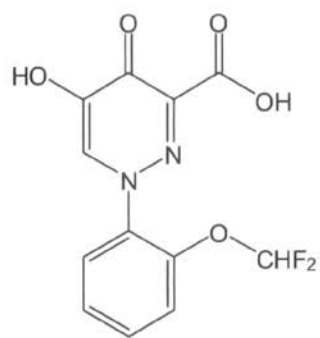
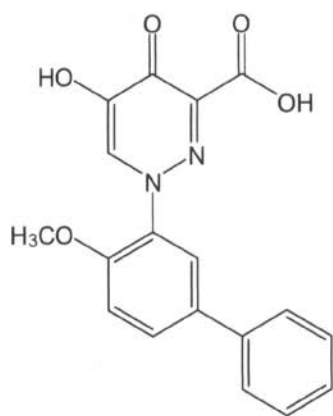
## 【請求項 27】

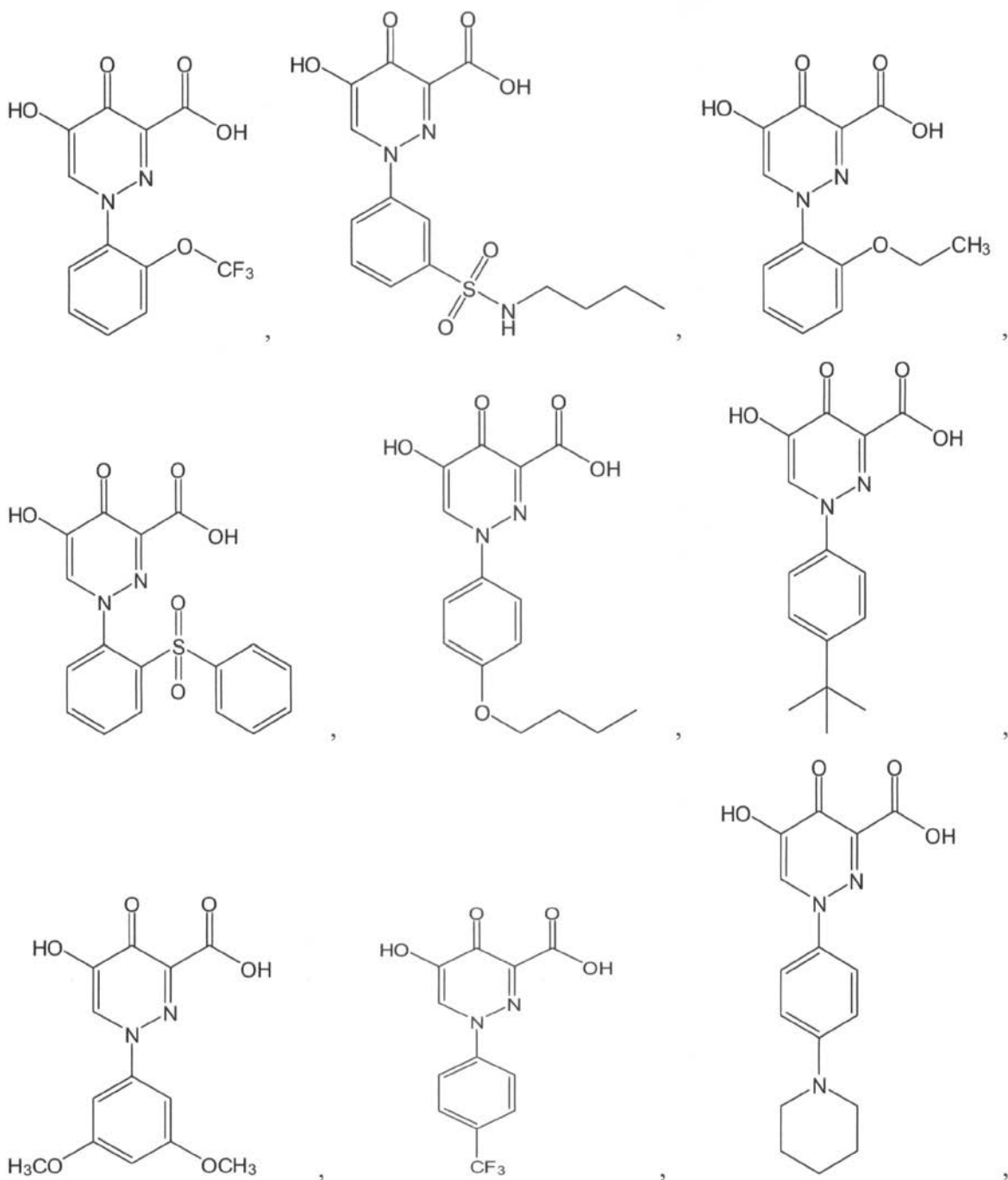
以下からなる群から選択される化合物、またはいずれかの前記化合物の薬剂的に許容できる塩である、請求項1に記載の化合物。

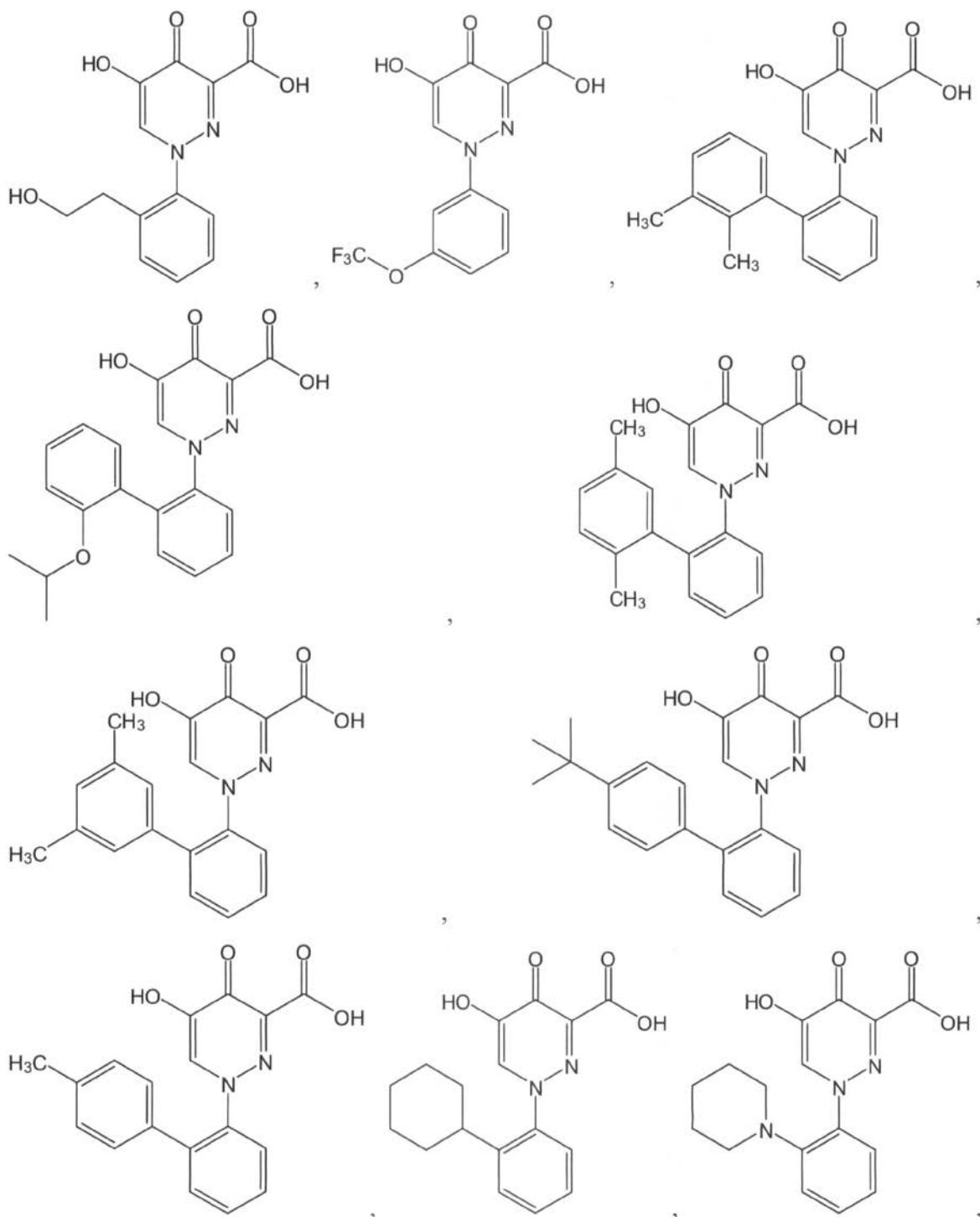
## 【化 6】

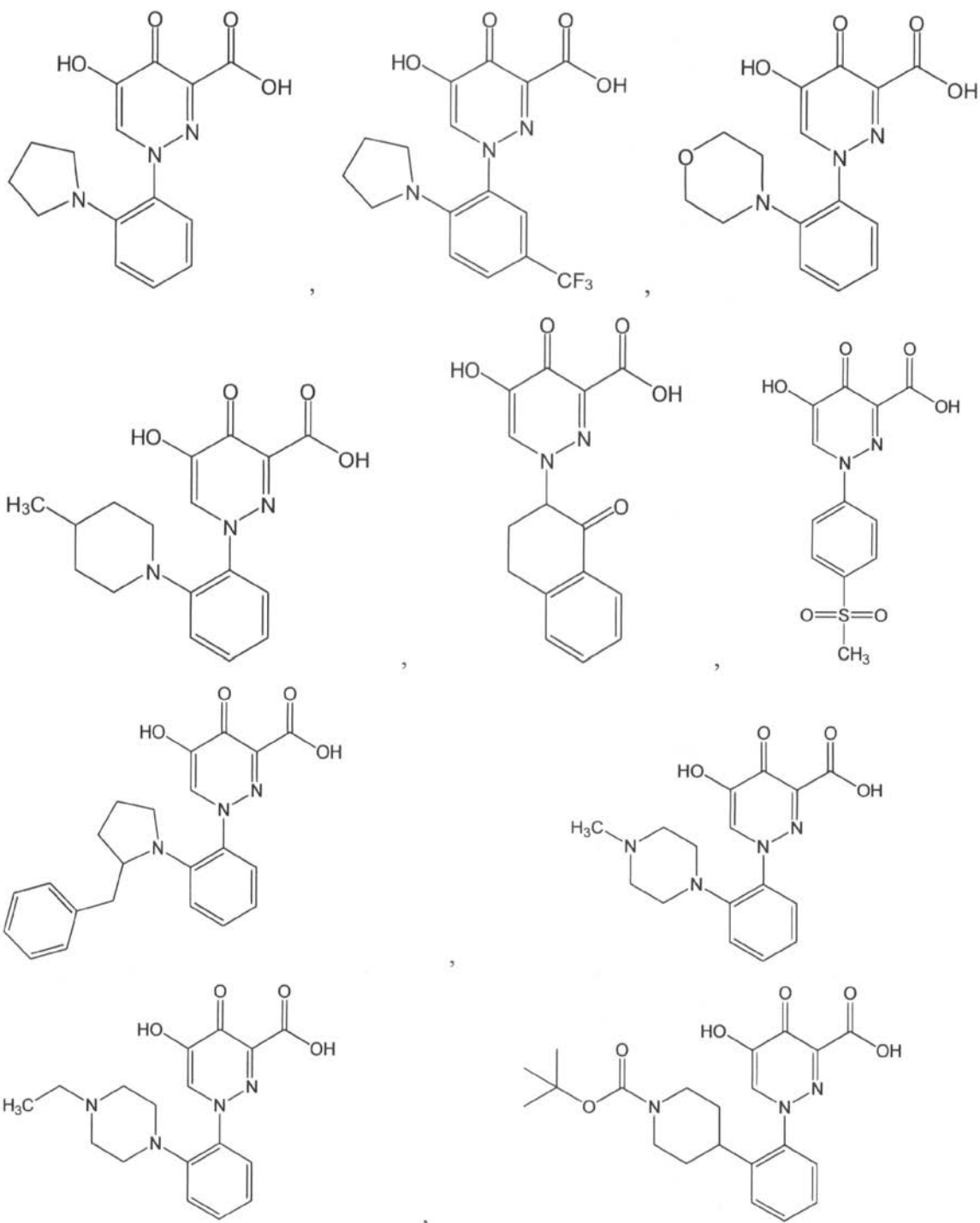


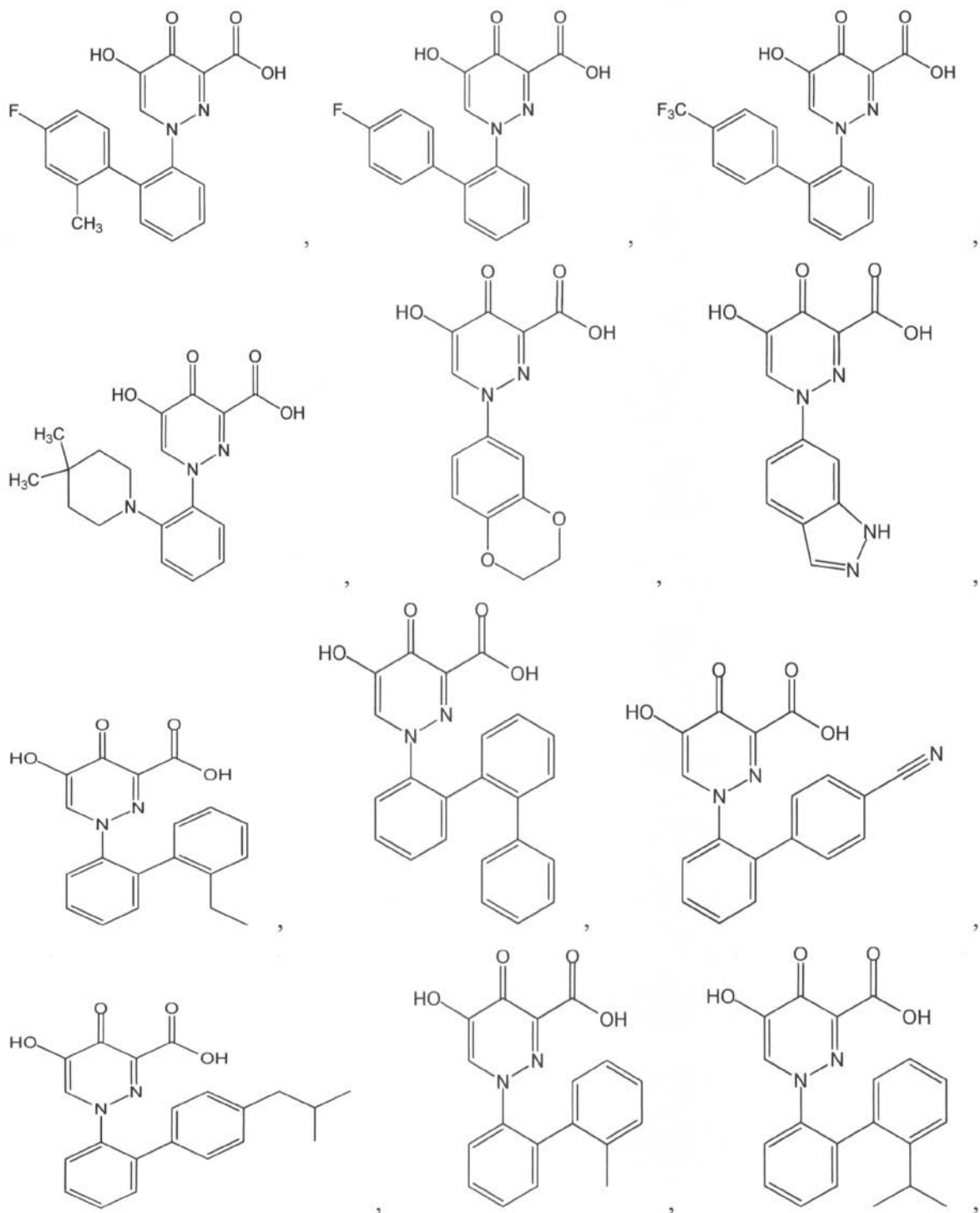


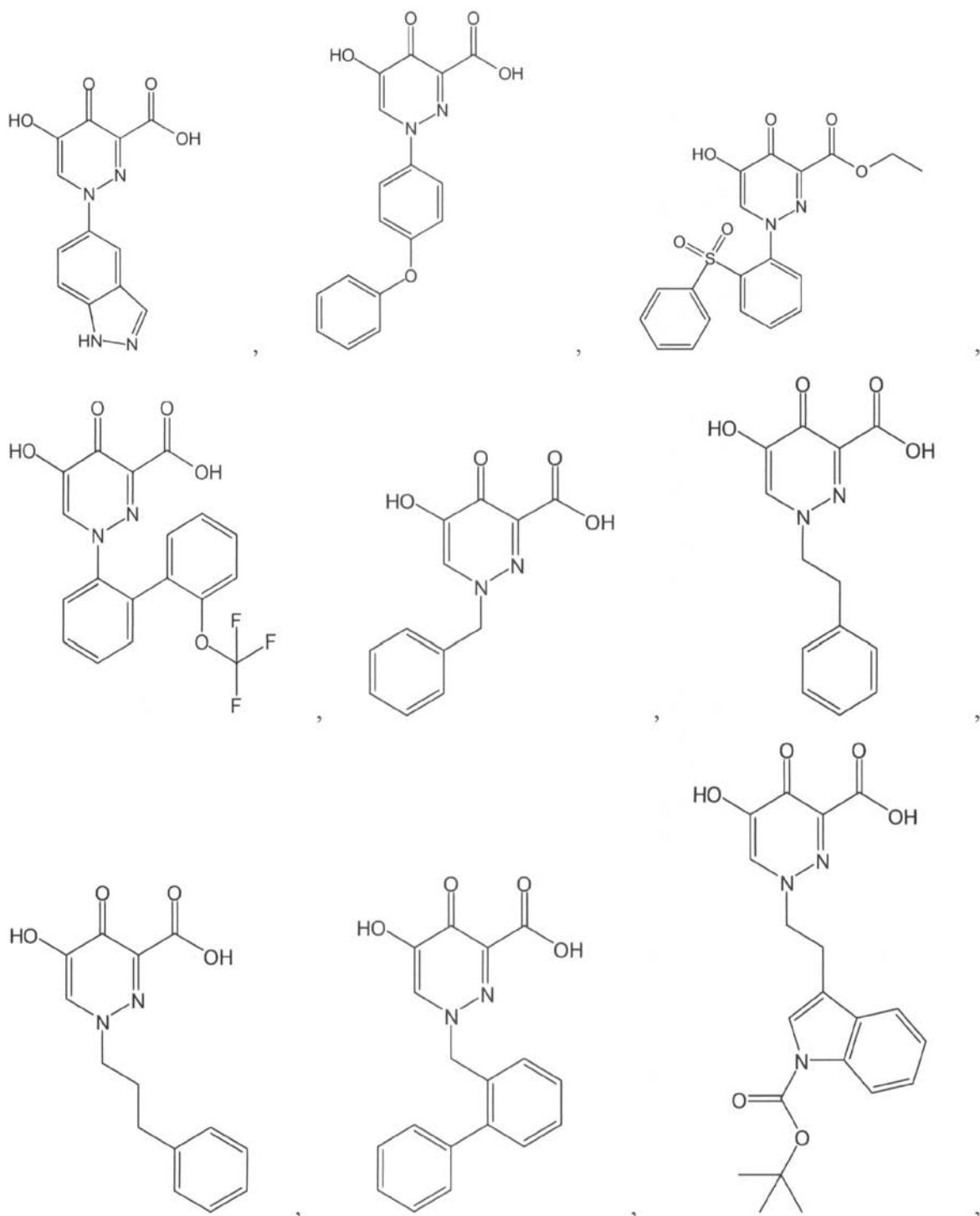


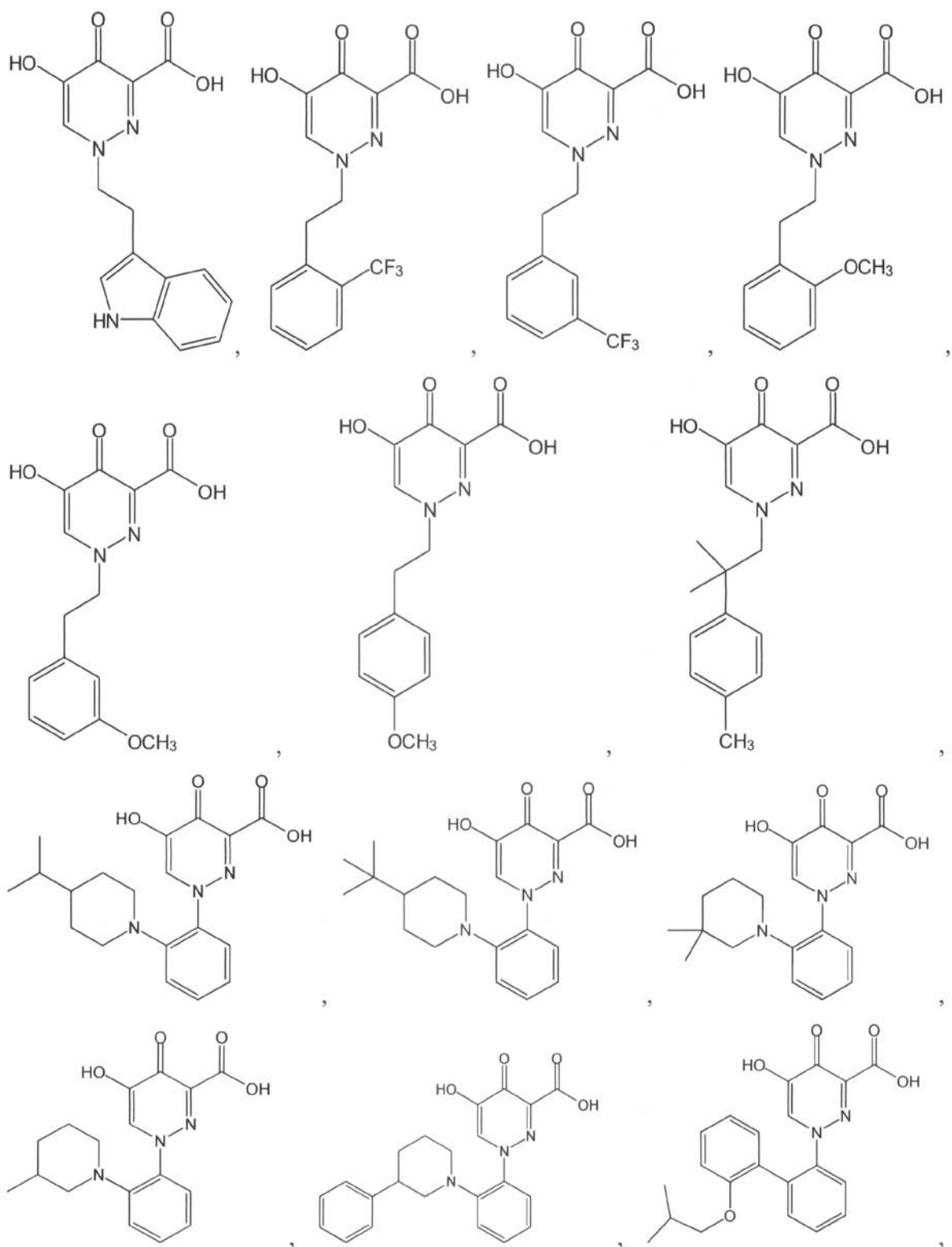


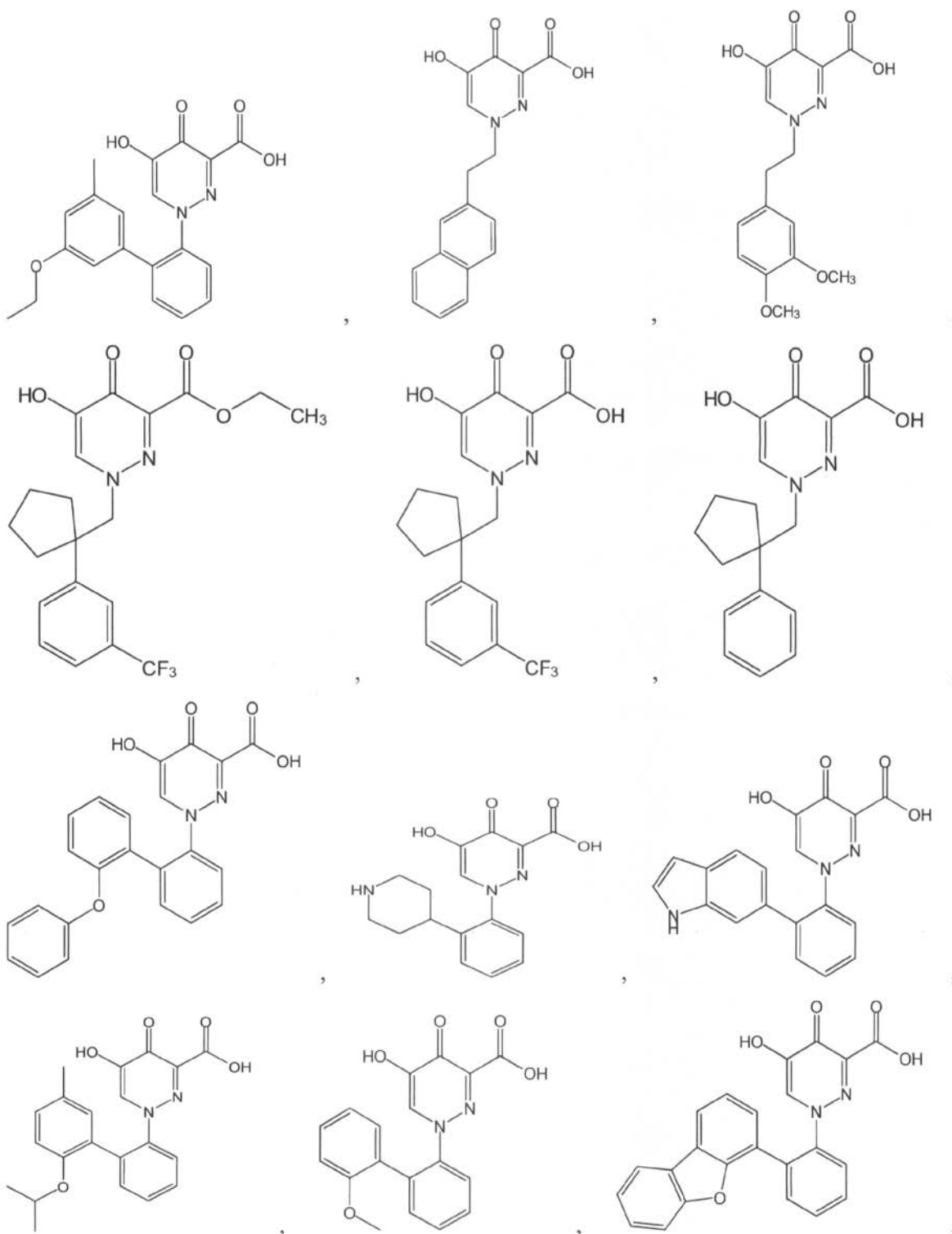




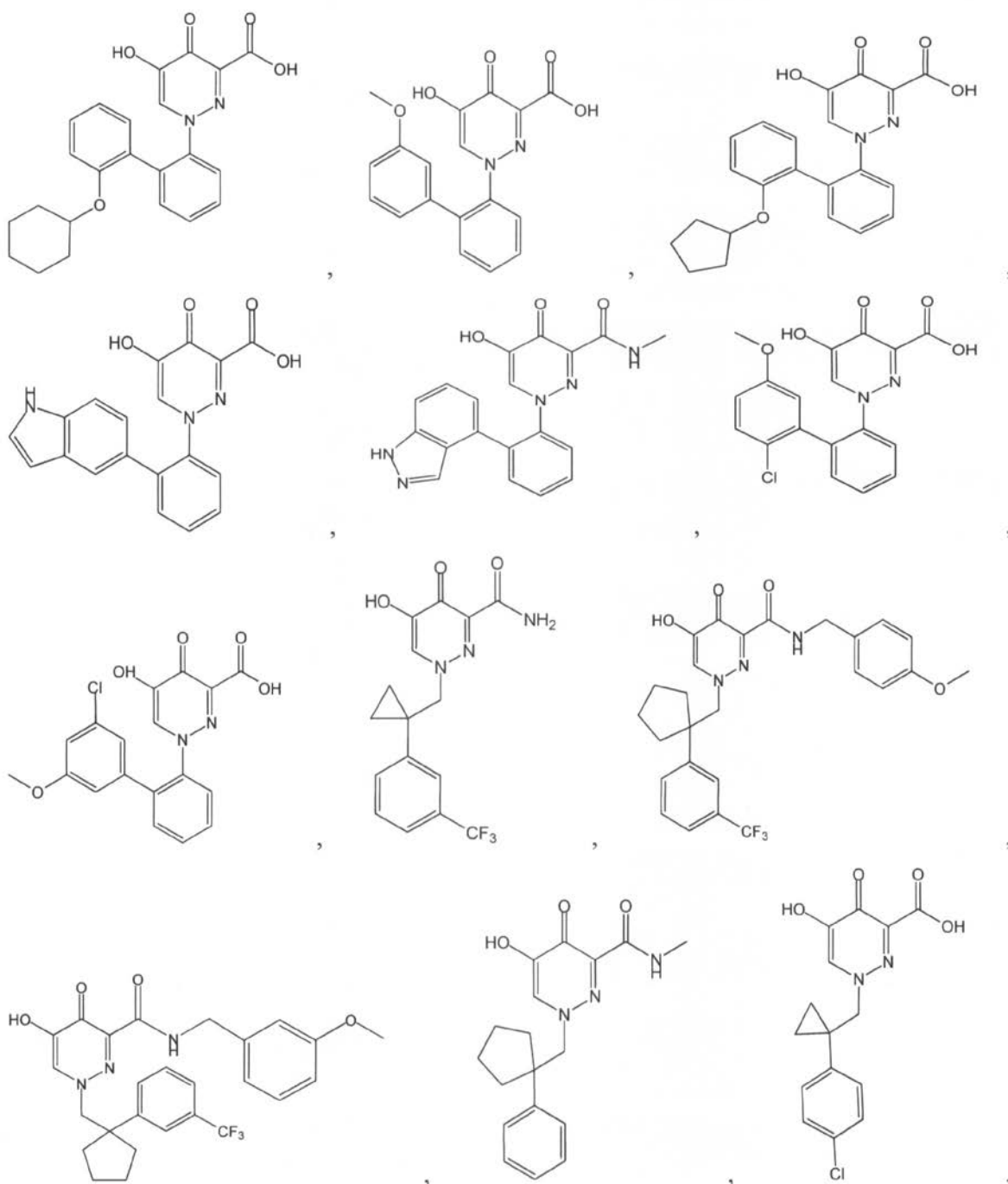


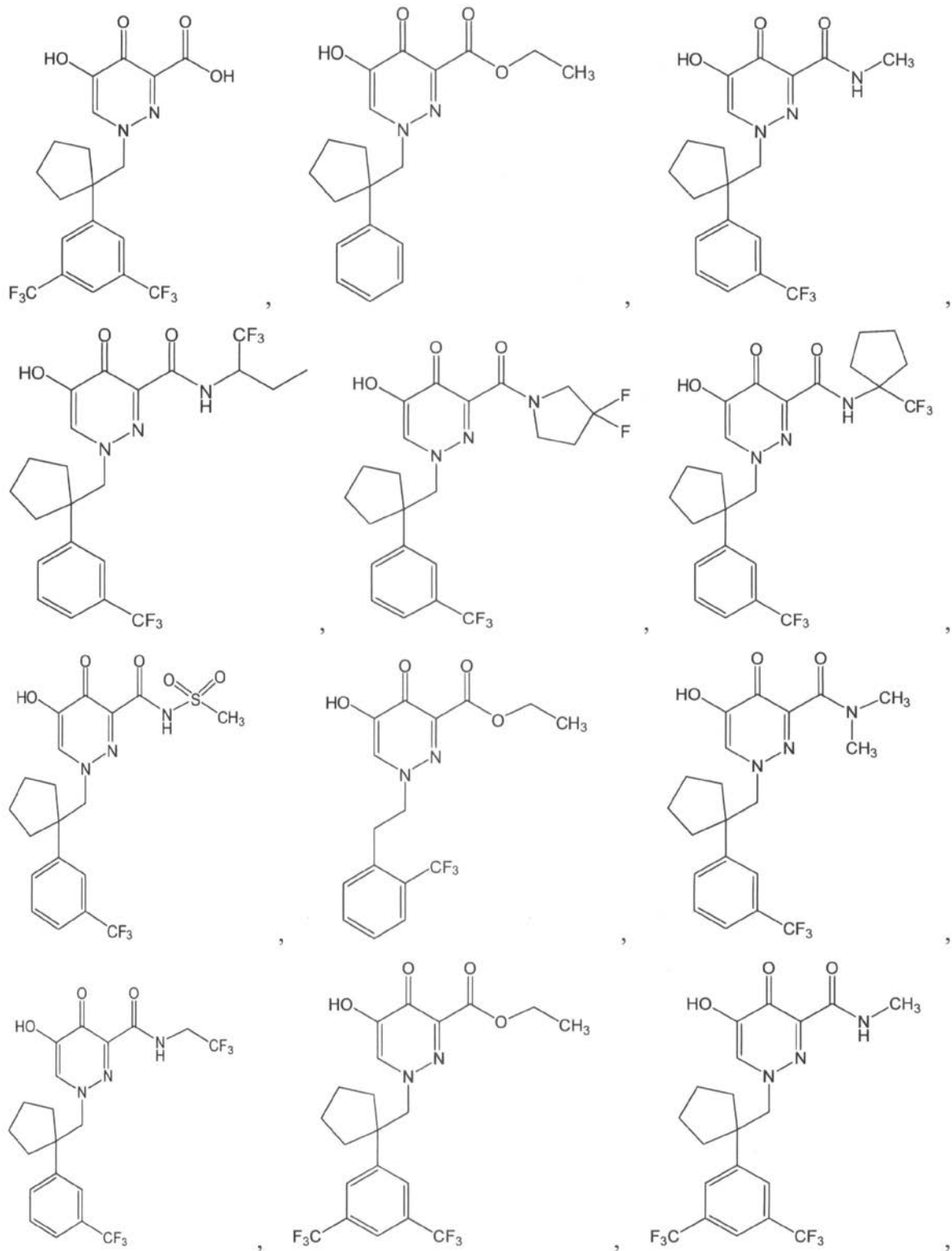


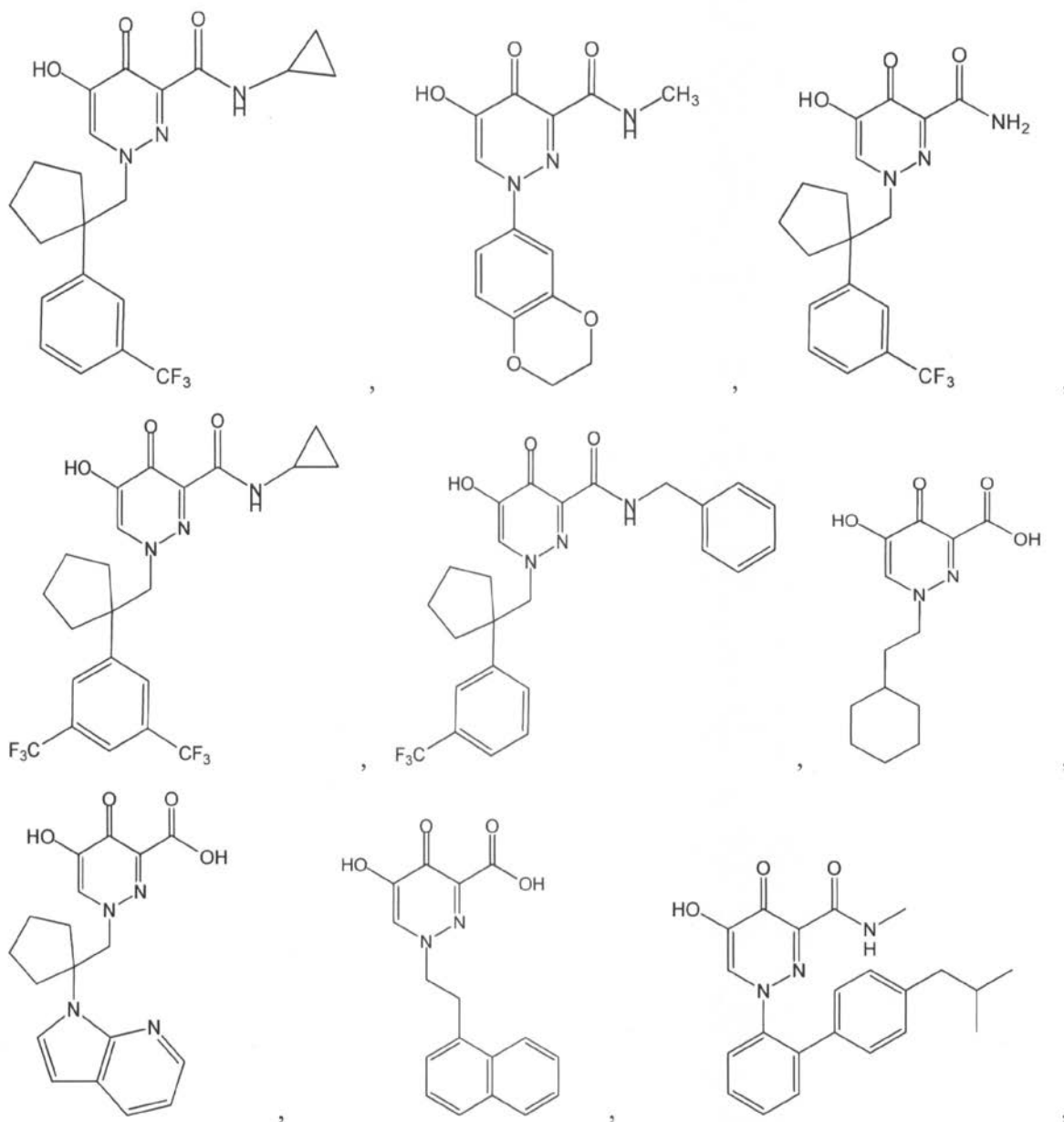


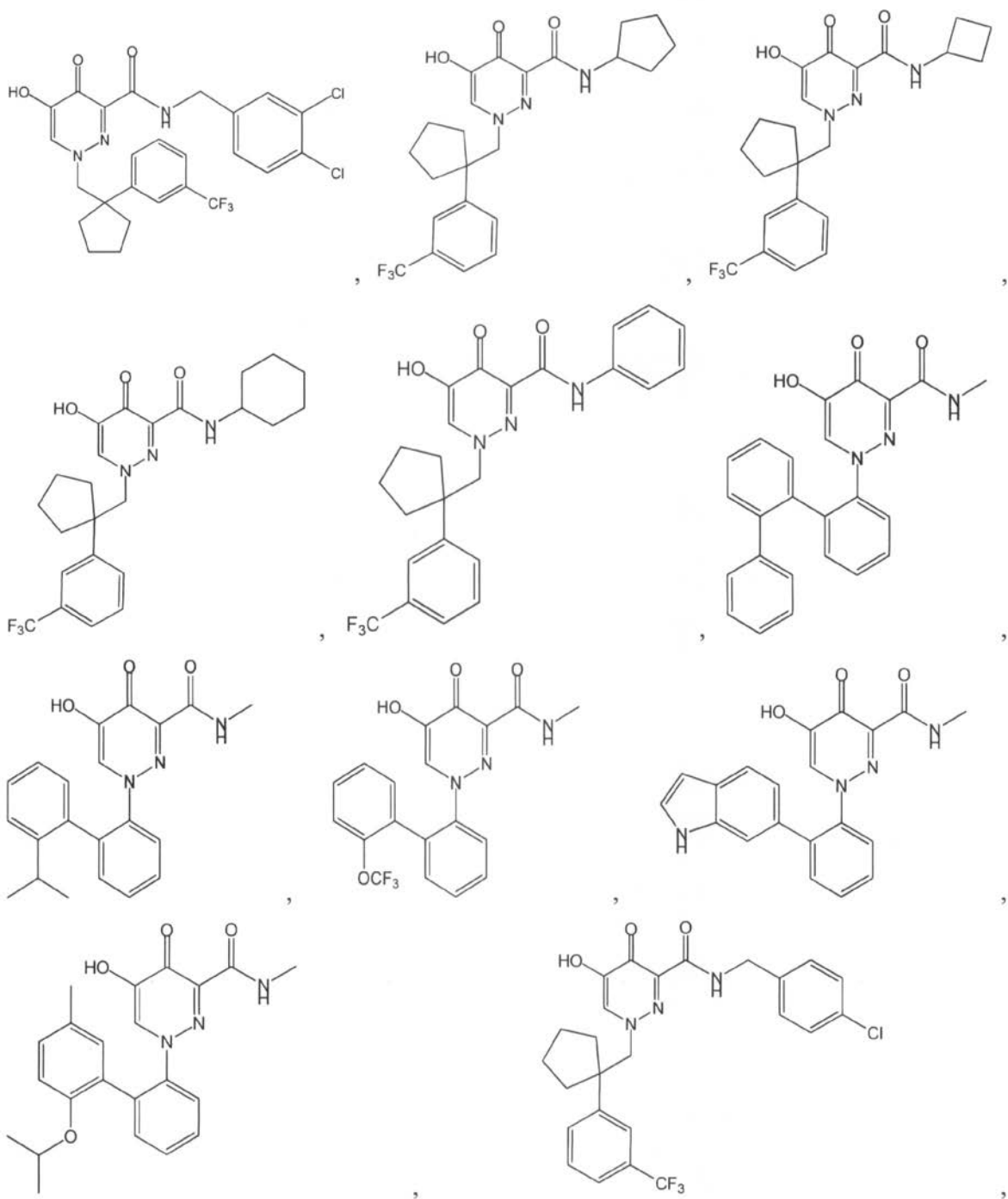


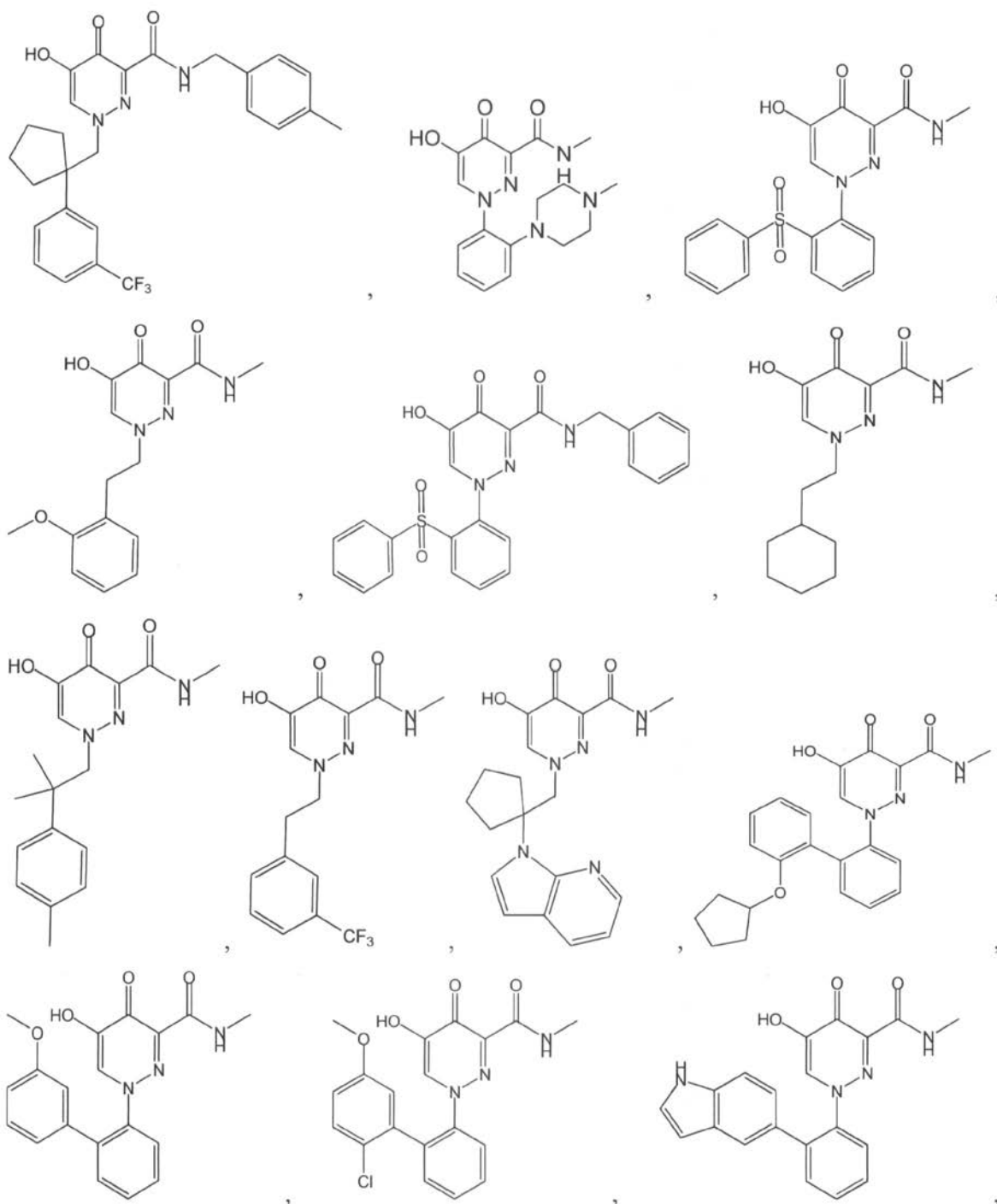




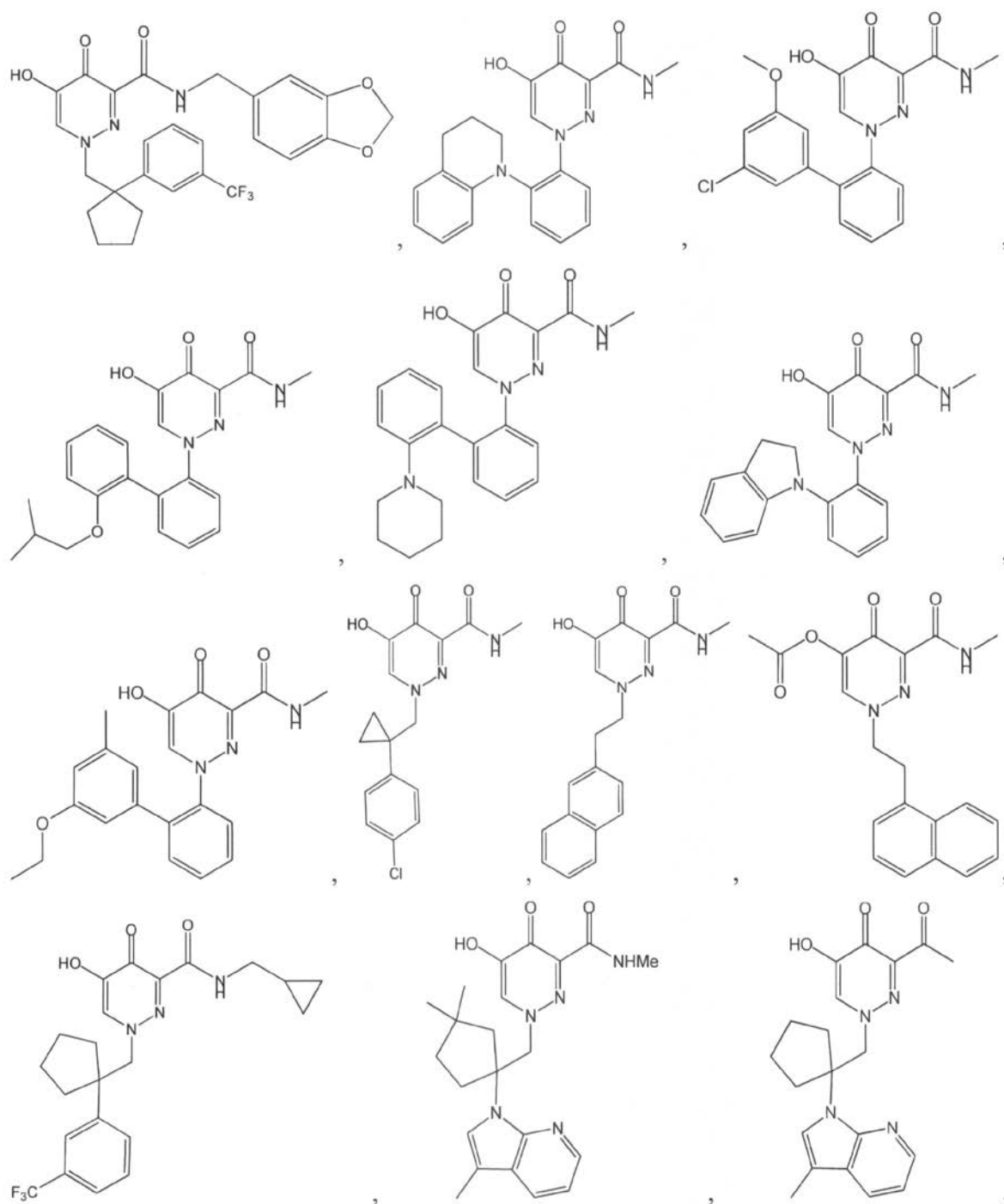


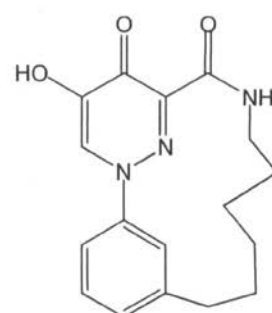
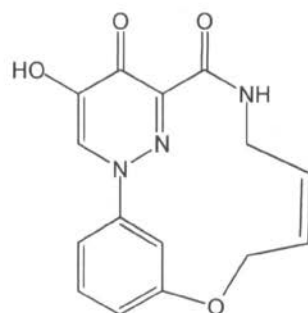
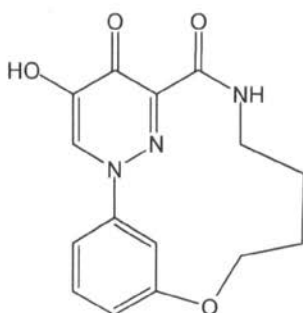
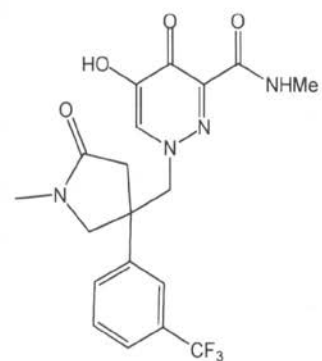
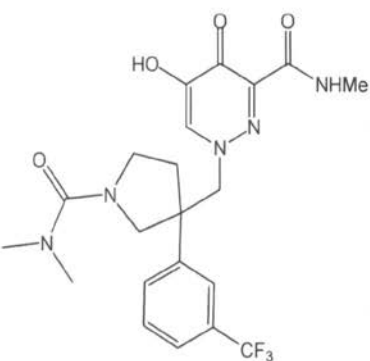
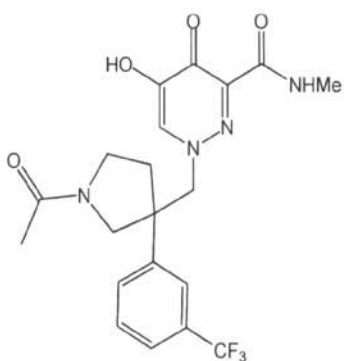
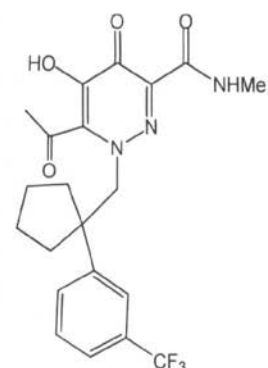
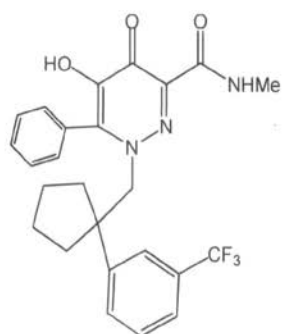
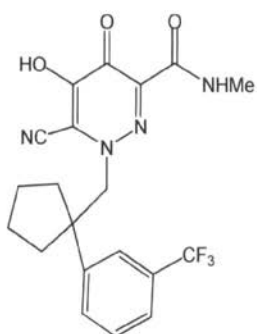
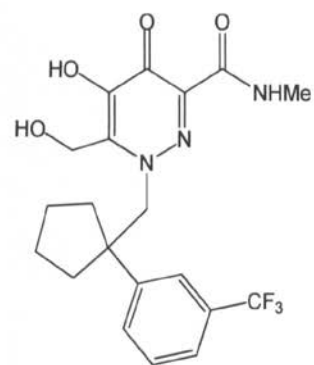
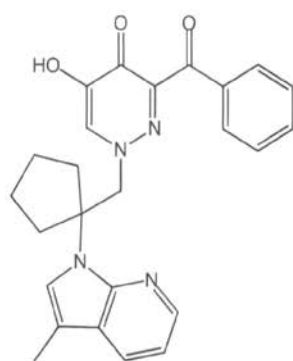
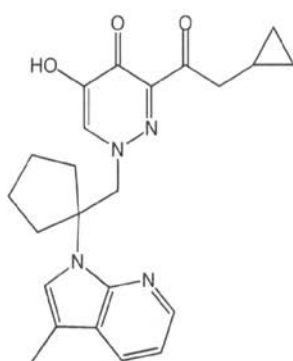




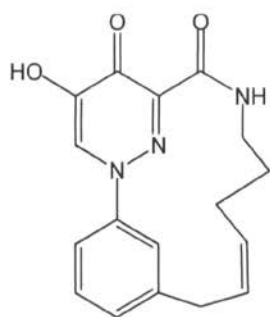




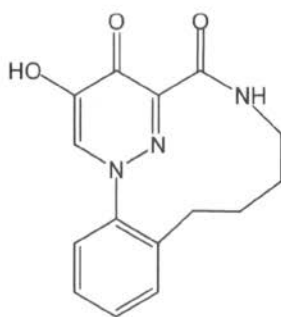




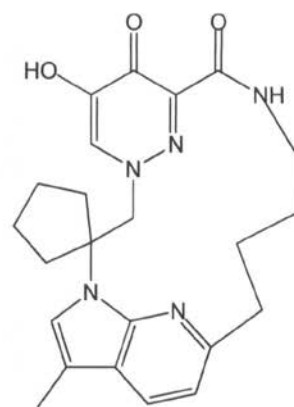




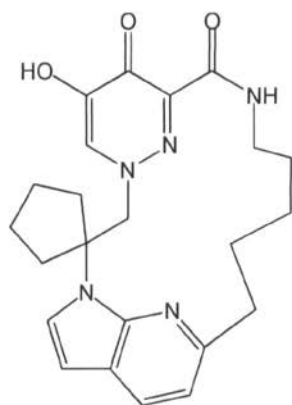
,



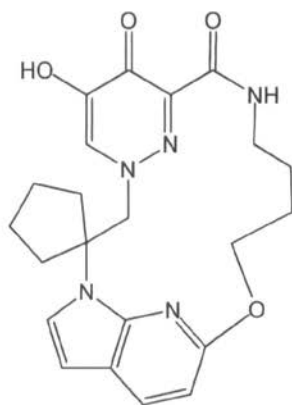
,



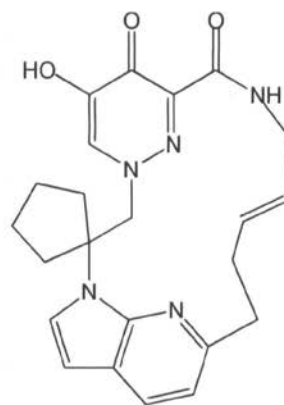
,



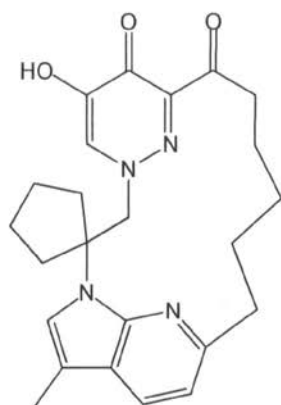
,



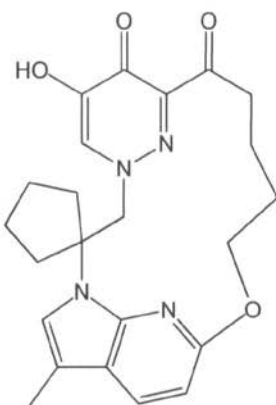
,



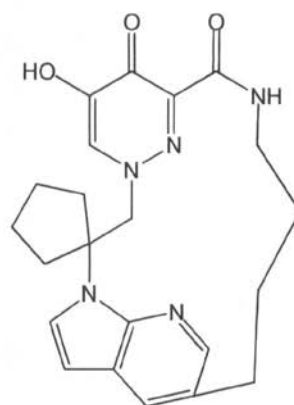
,



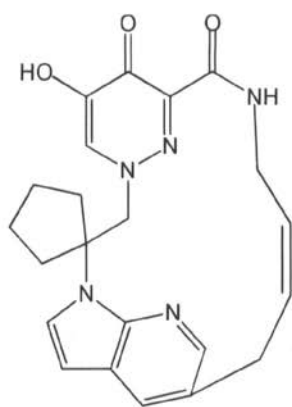
,



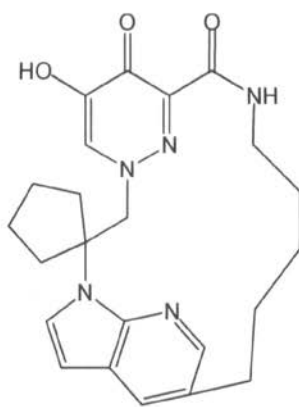
,



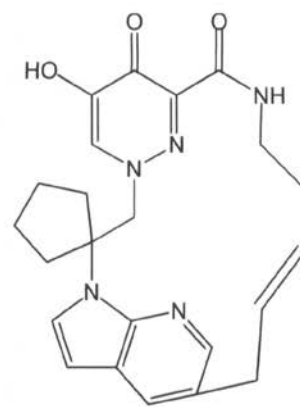
,



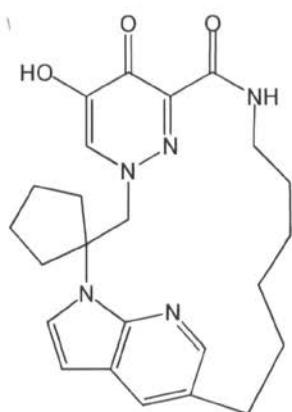
,



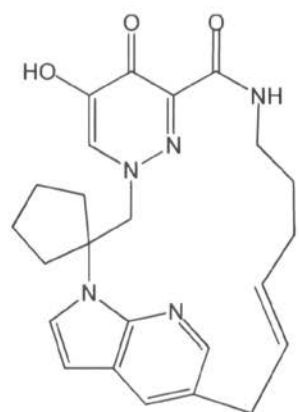
,



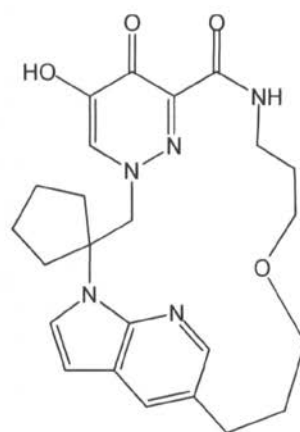
,



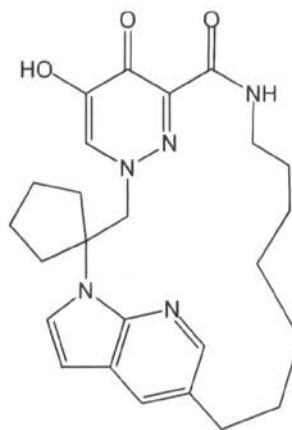
,



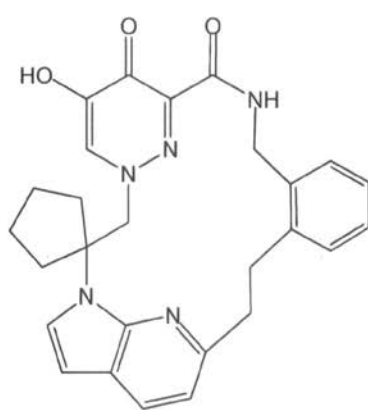
,



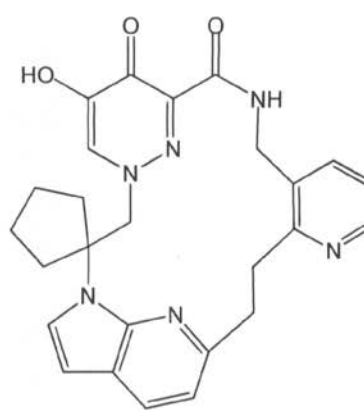
,



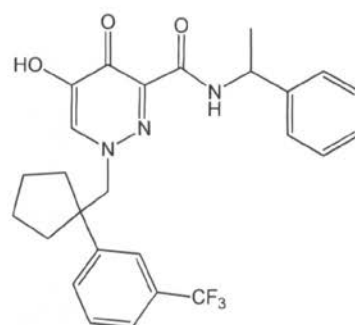
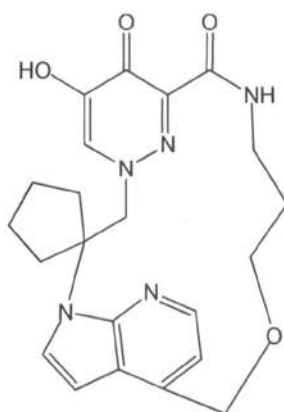
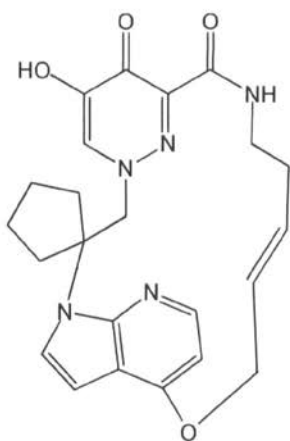
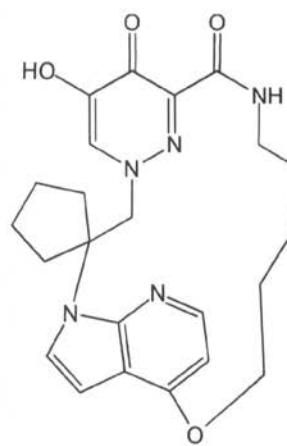
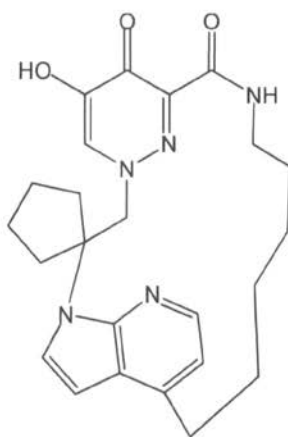
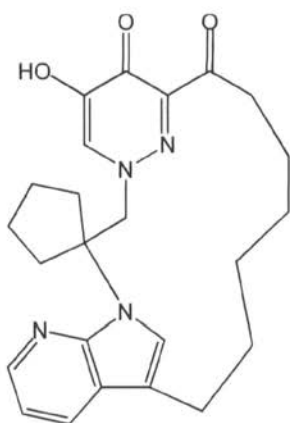
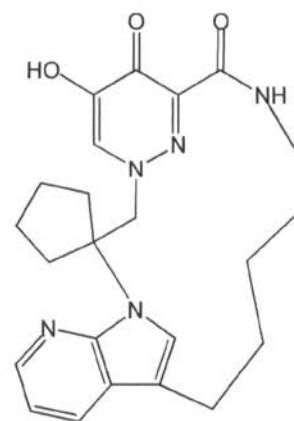
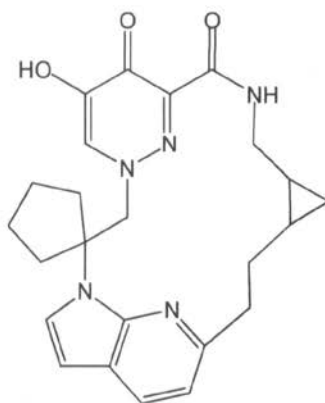
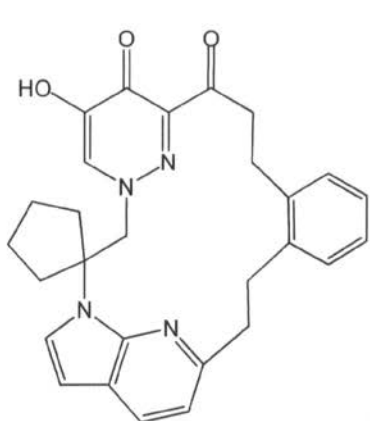
,

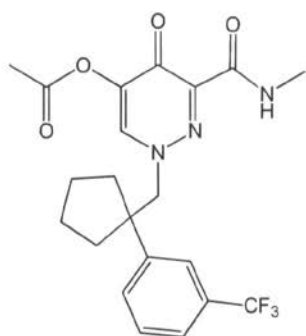


,

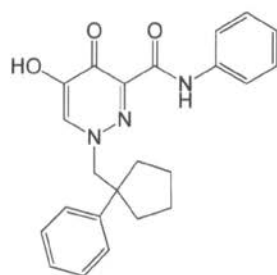


,

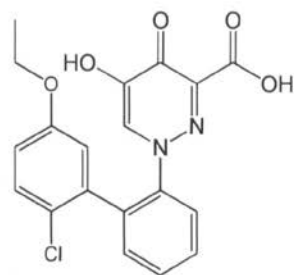




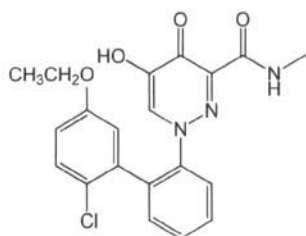
,



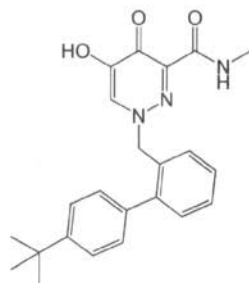
,



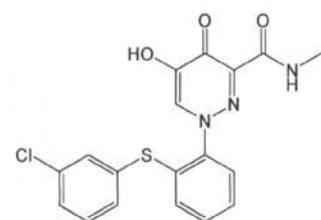
,



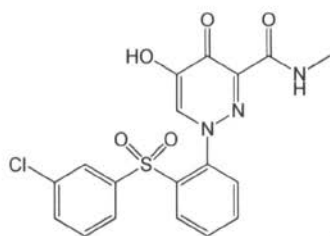
,



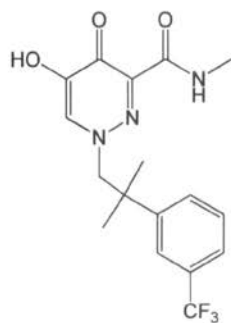
,



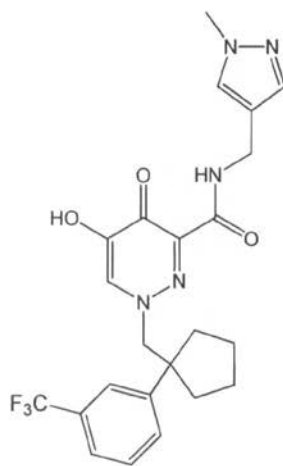
,



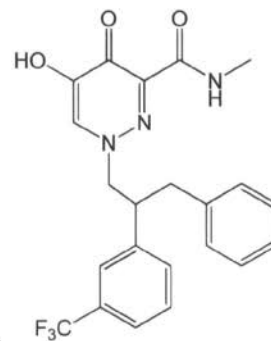
,



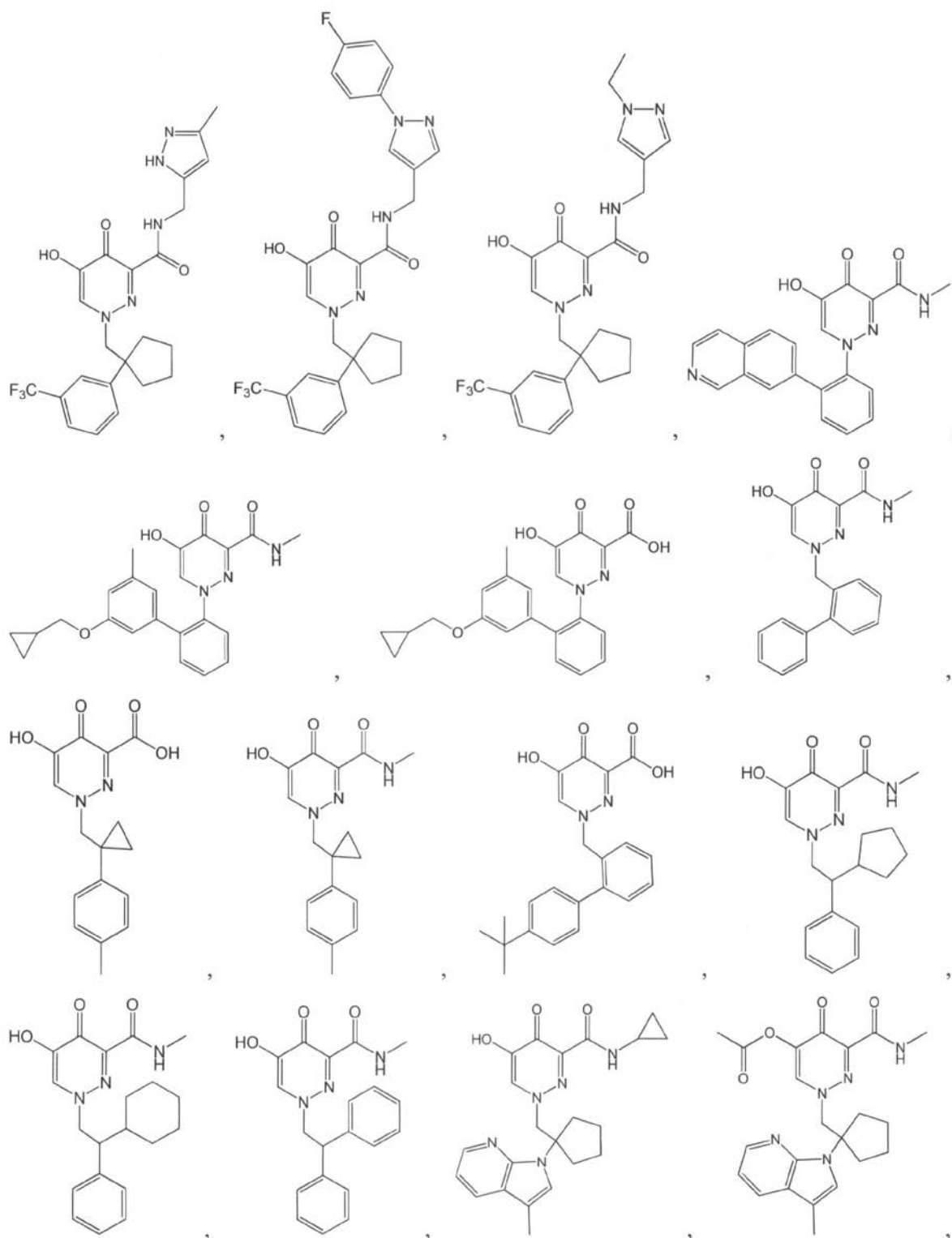
,

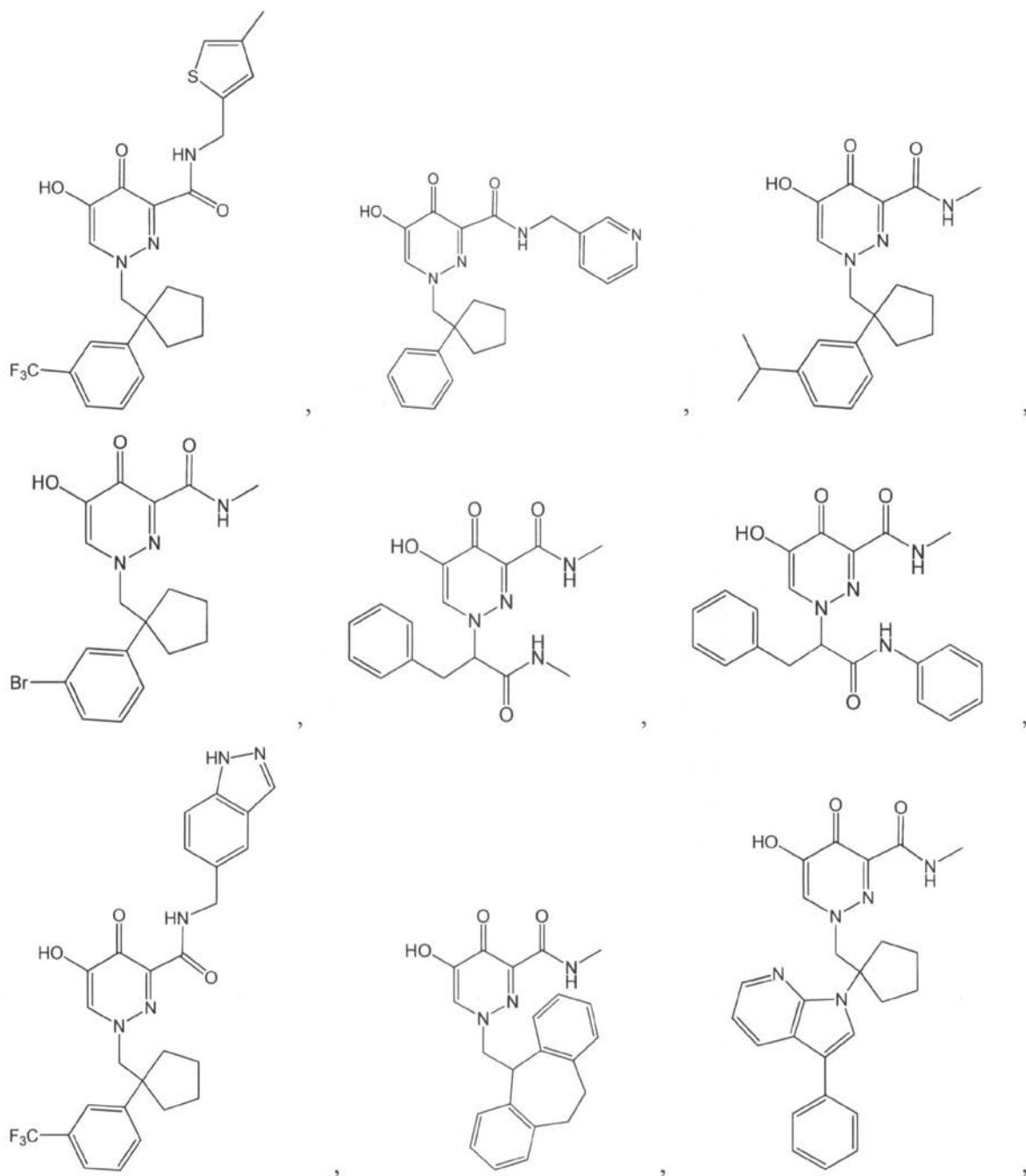


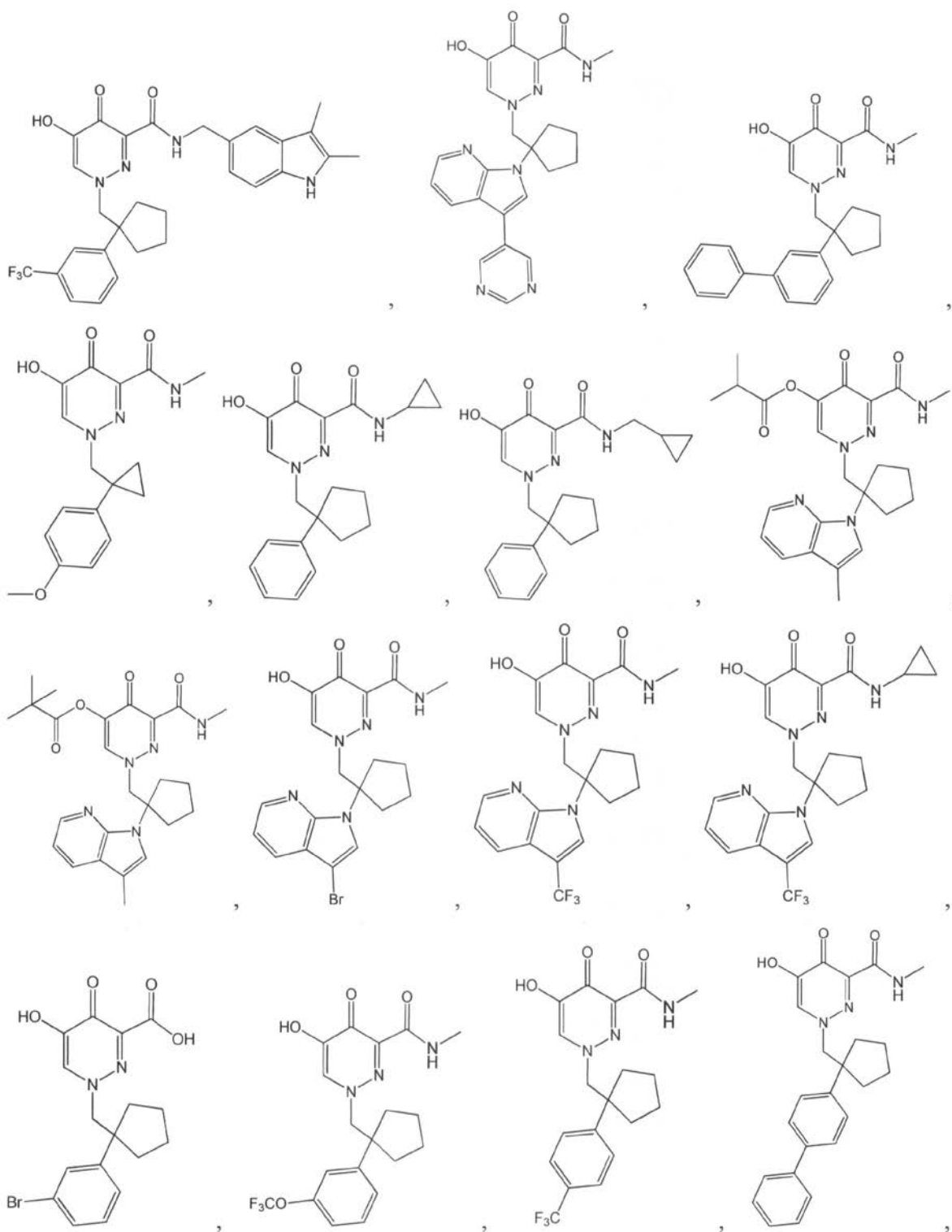
,

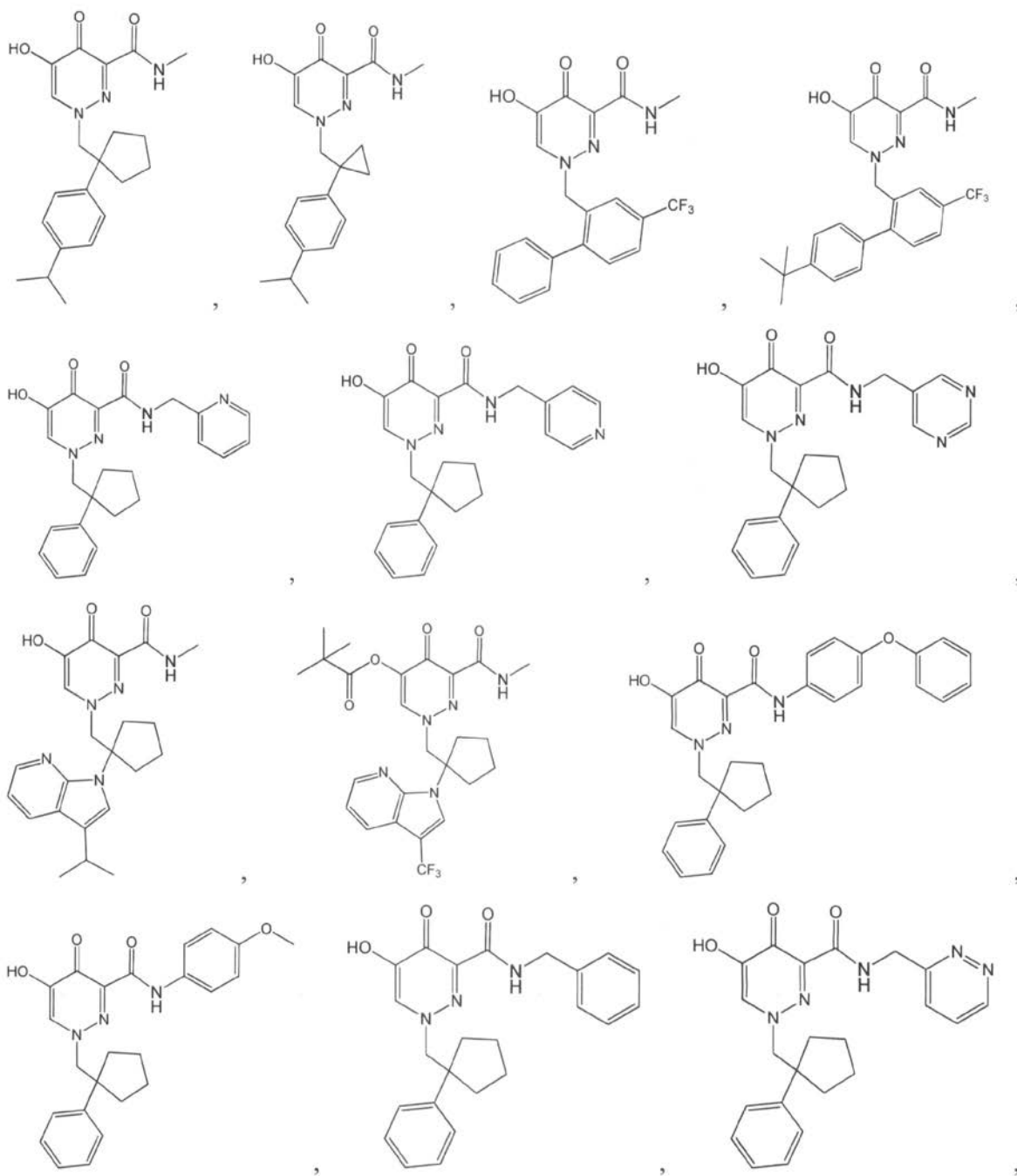


,

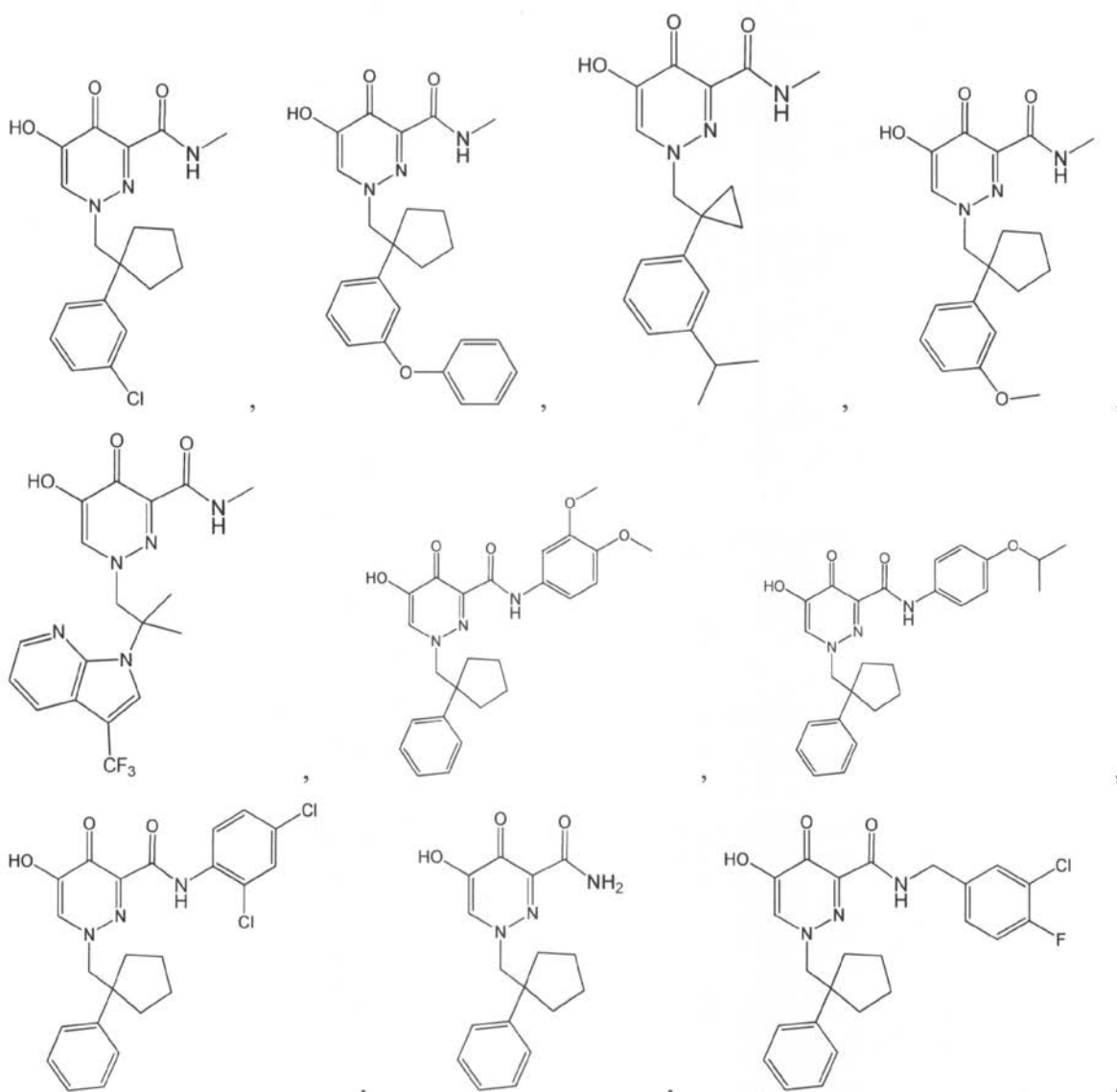


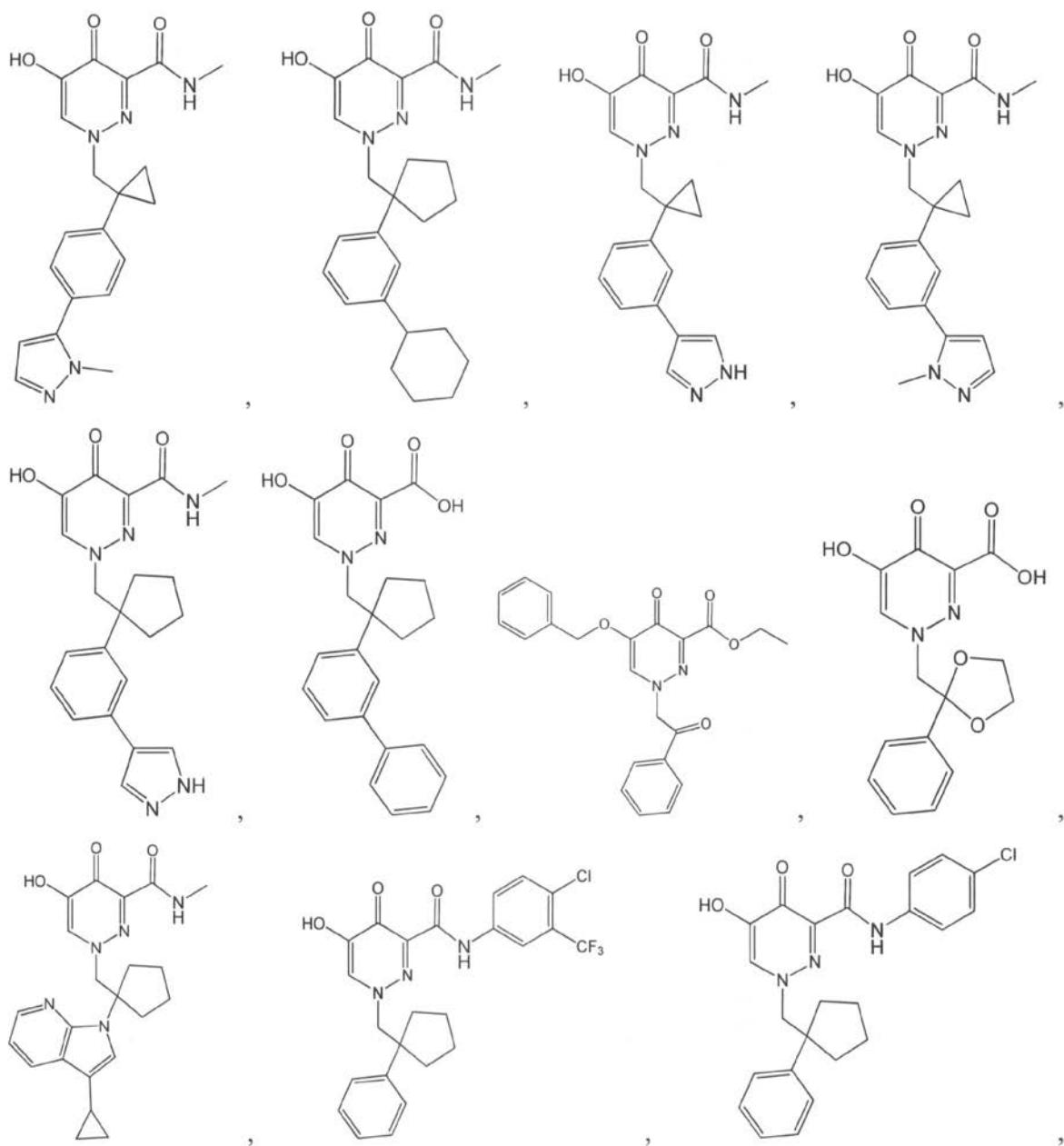


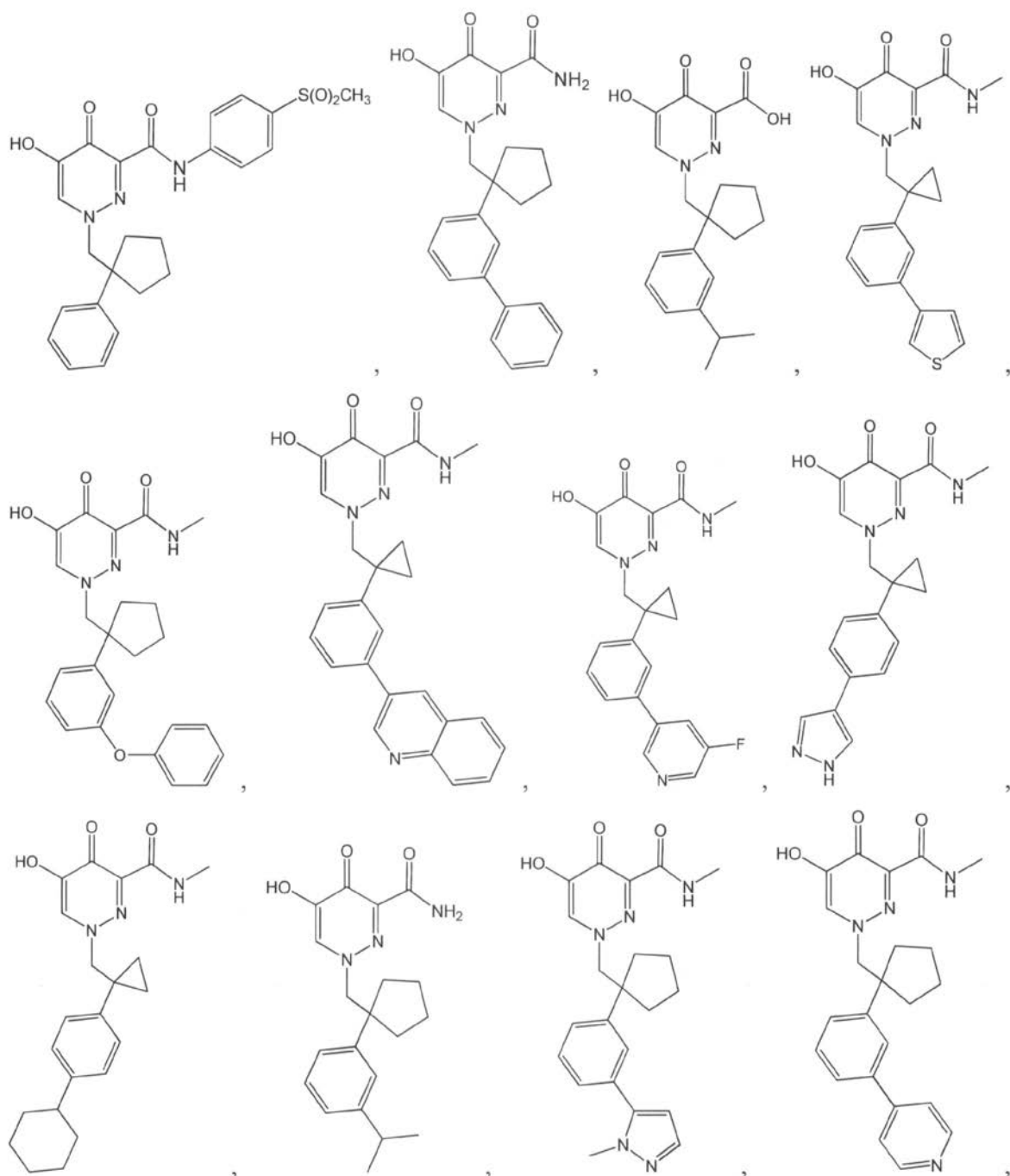


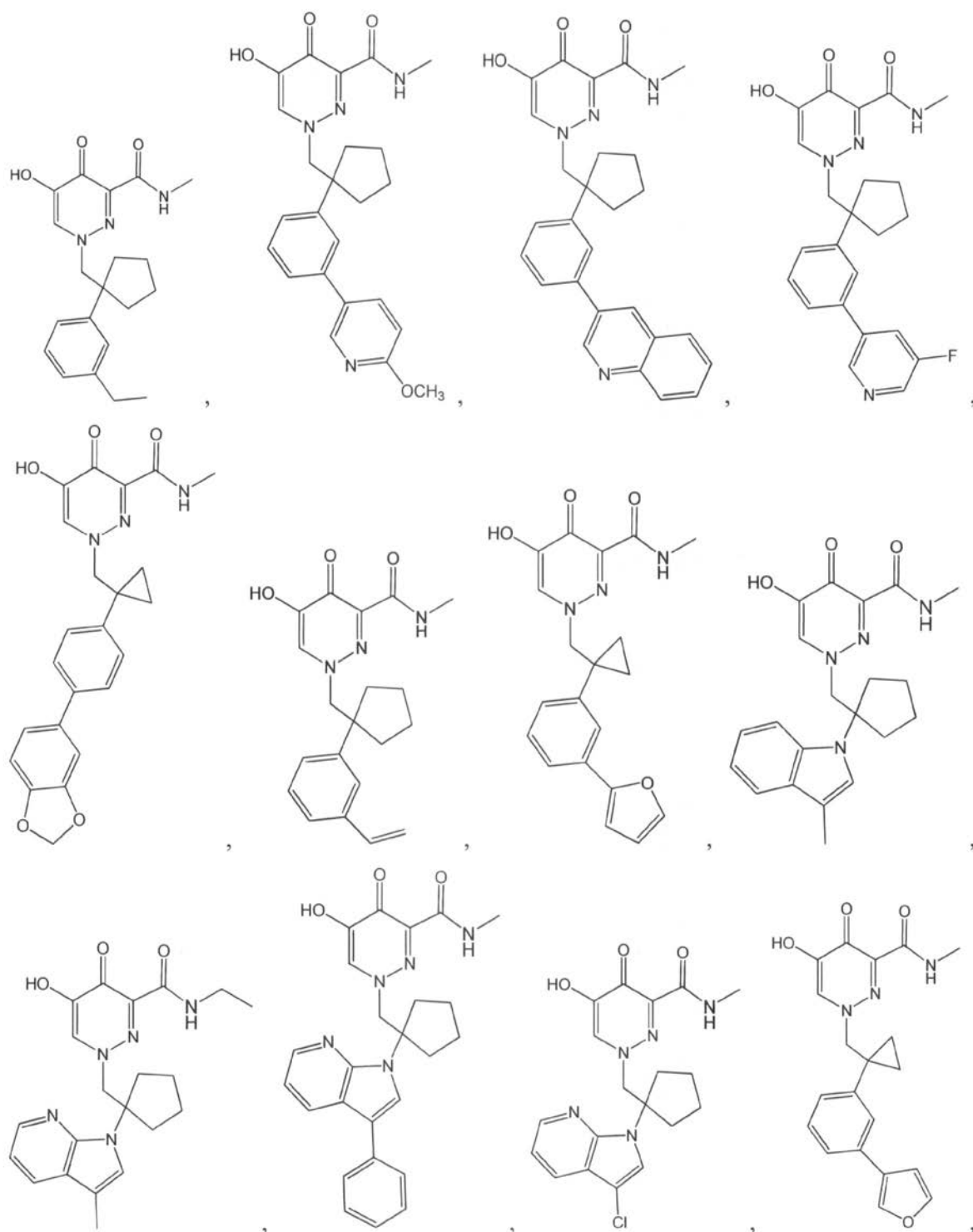


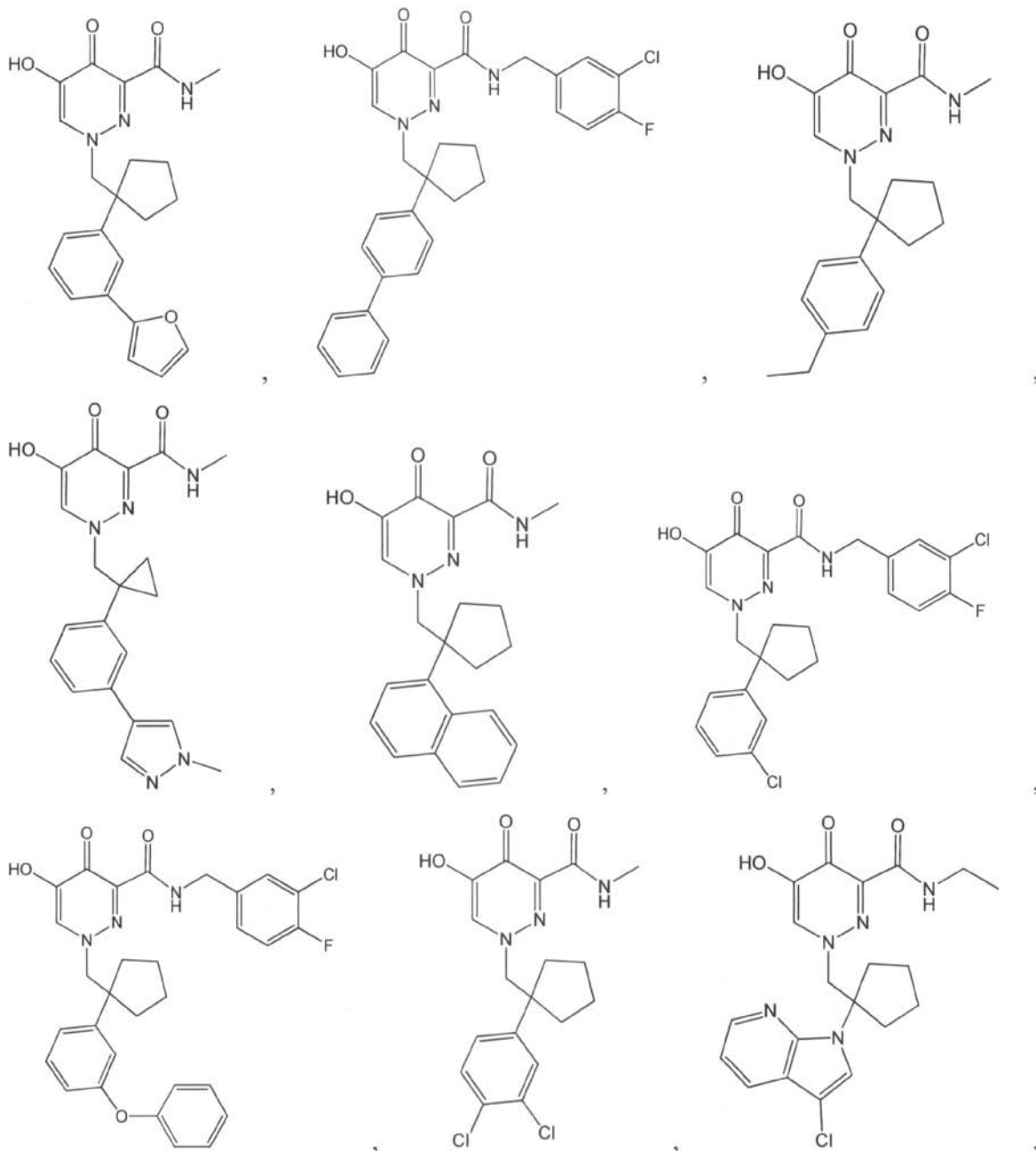


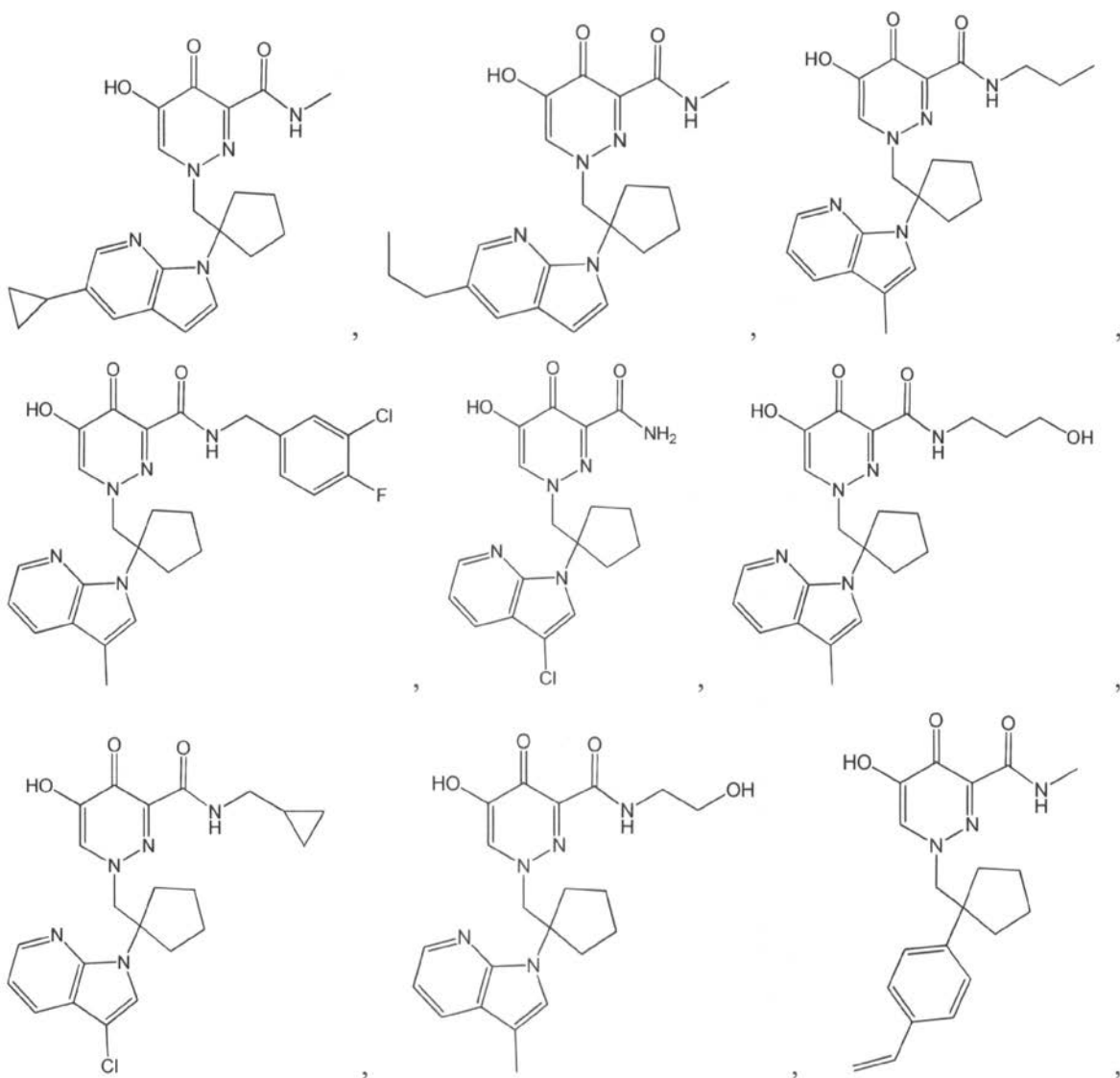


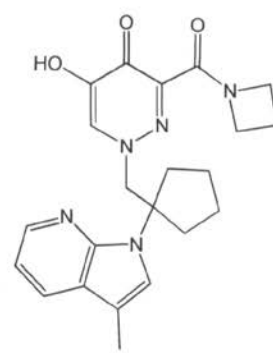
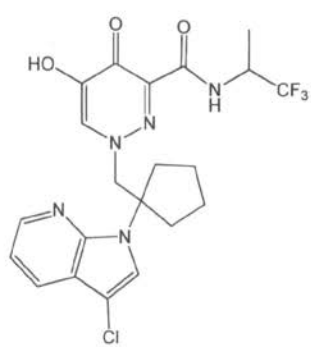
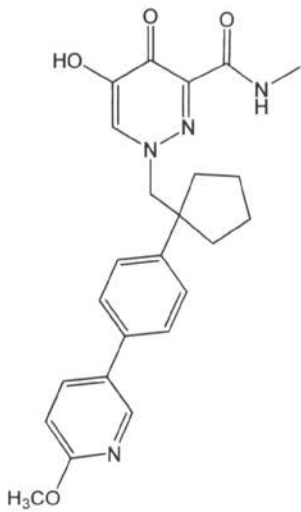
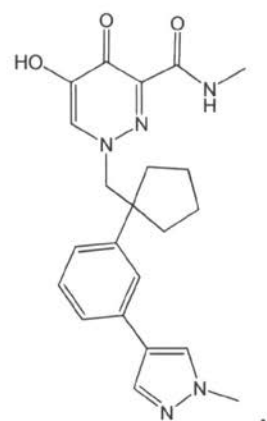
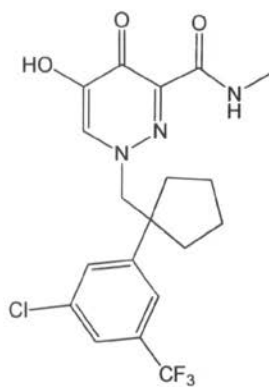
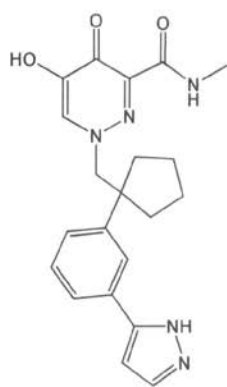
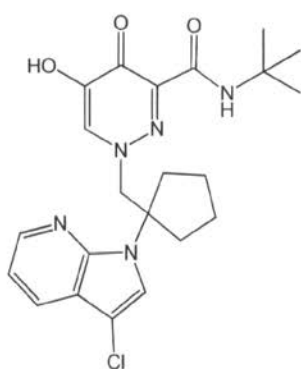
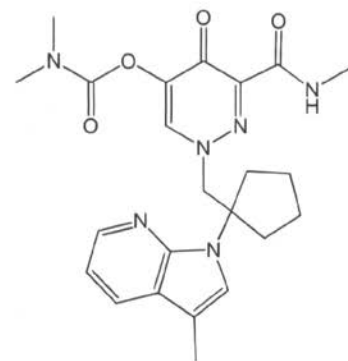
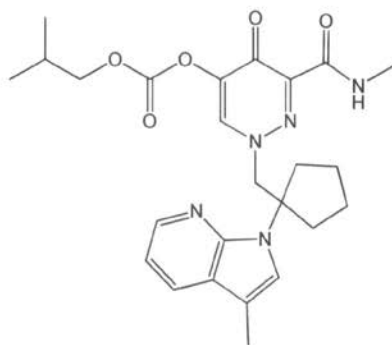
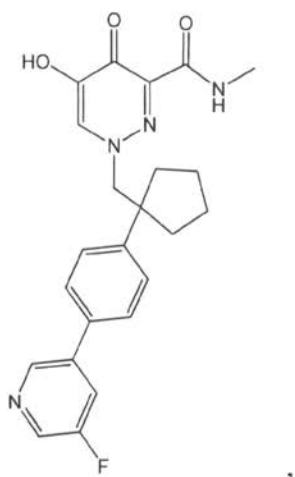


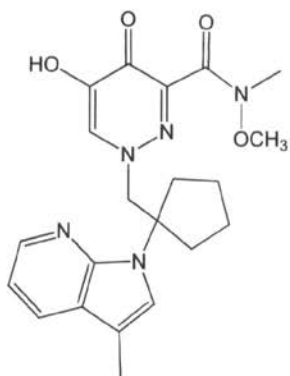




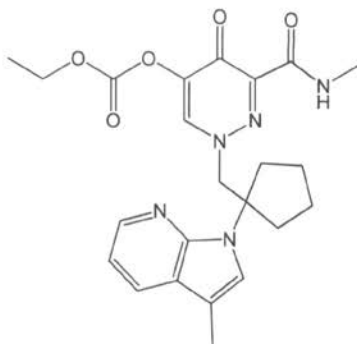




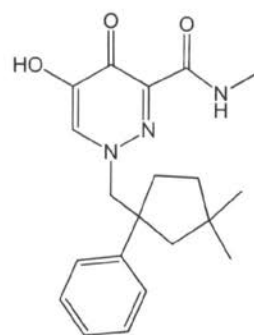




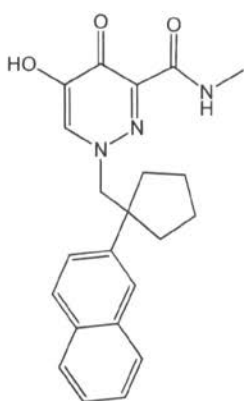
,



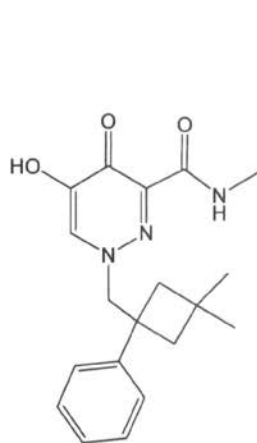
,



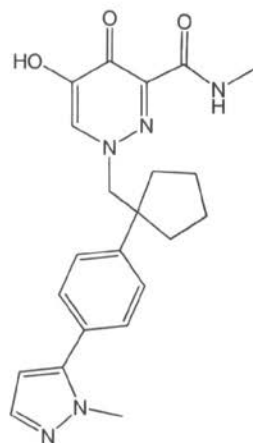
,



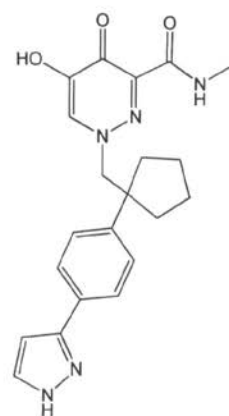
,



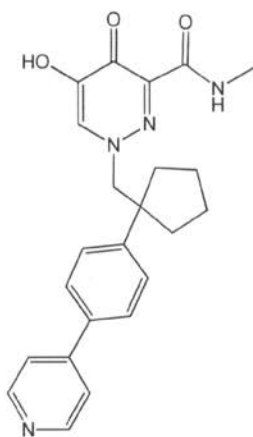
,



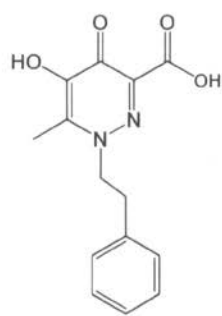
,



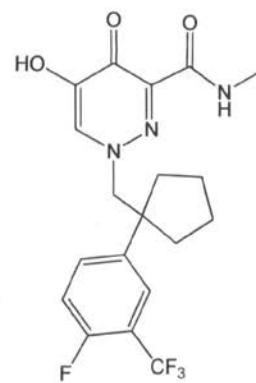
,



,

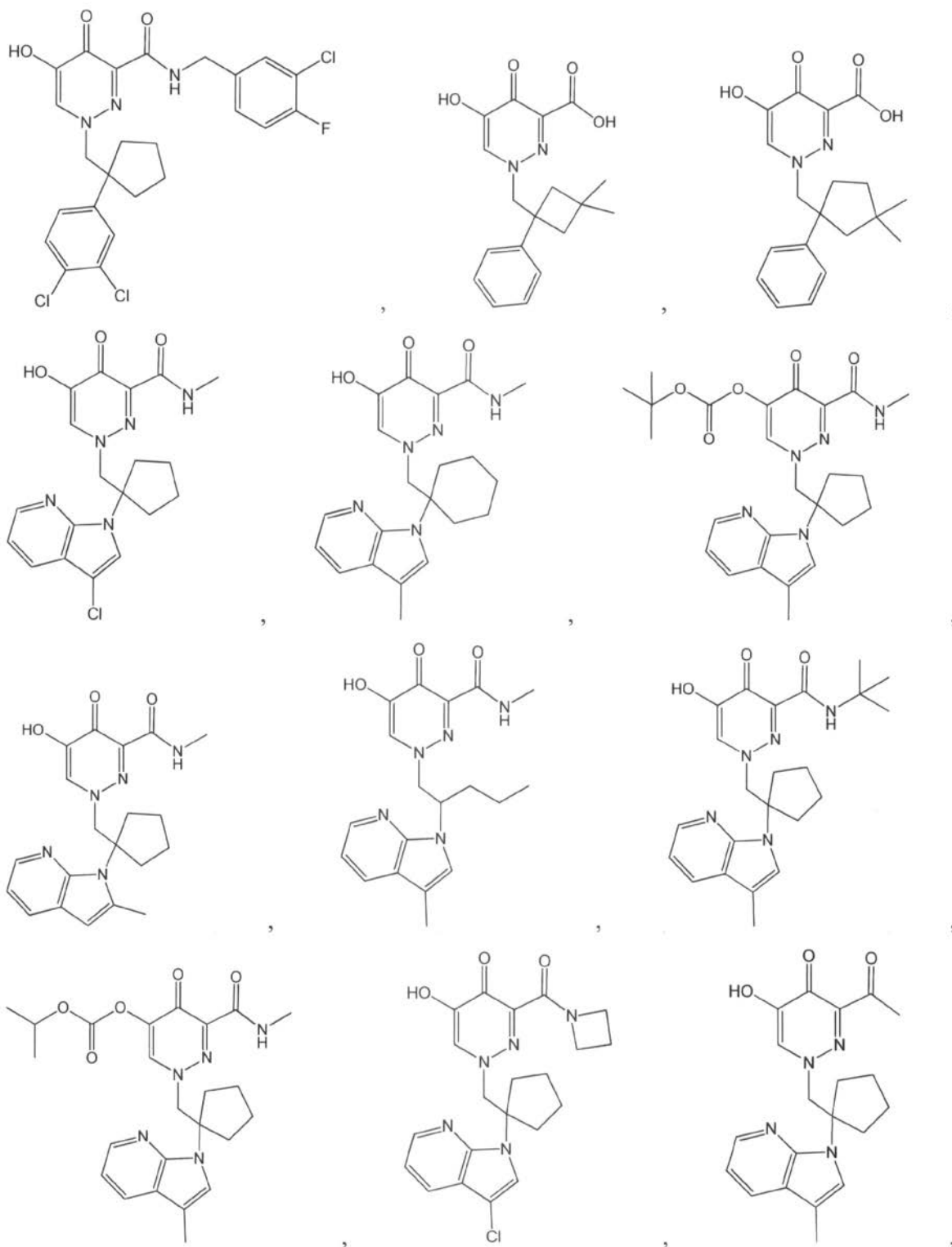


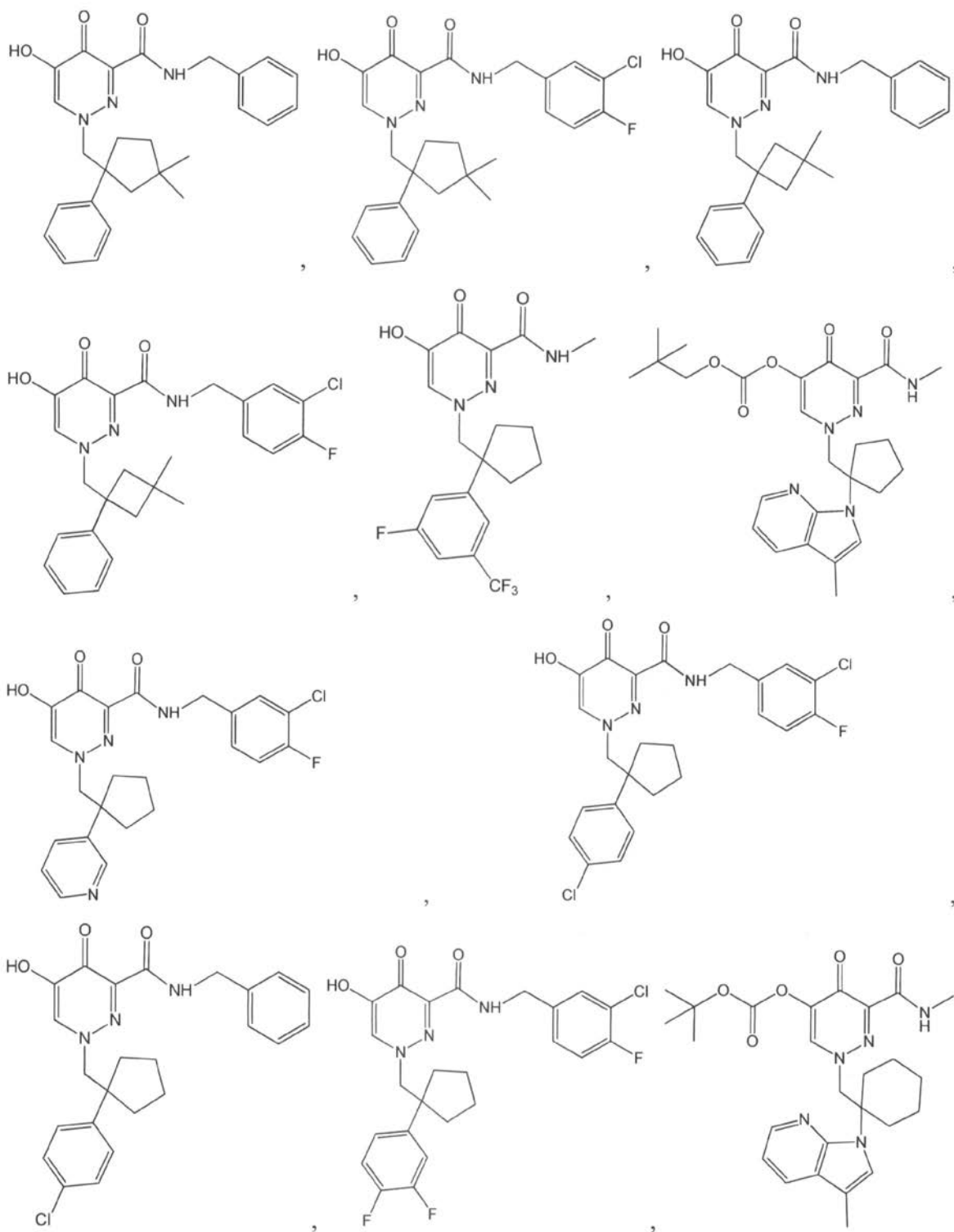
,

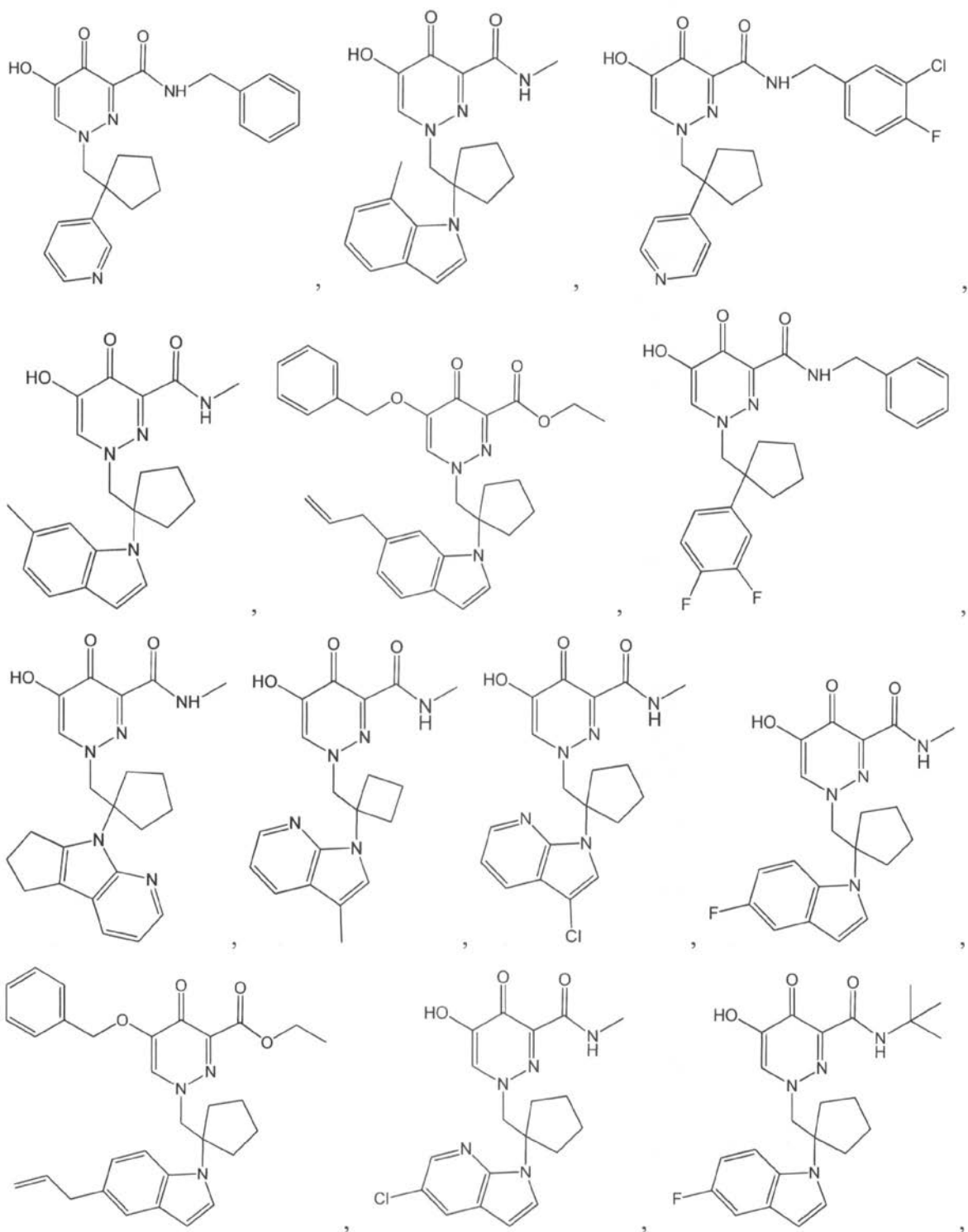


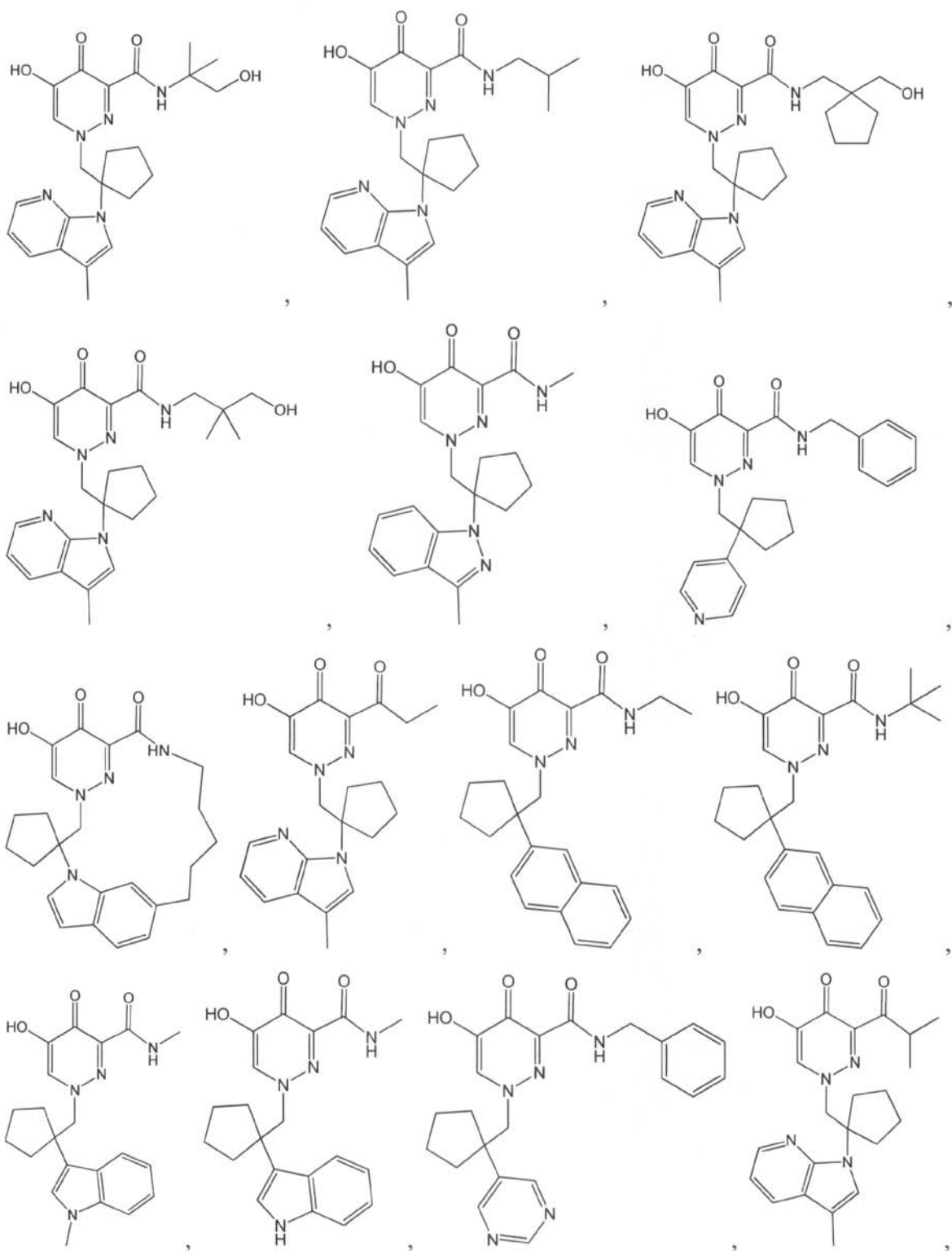
,

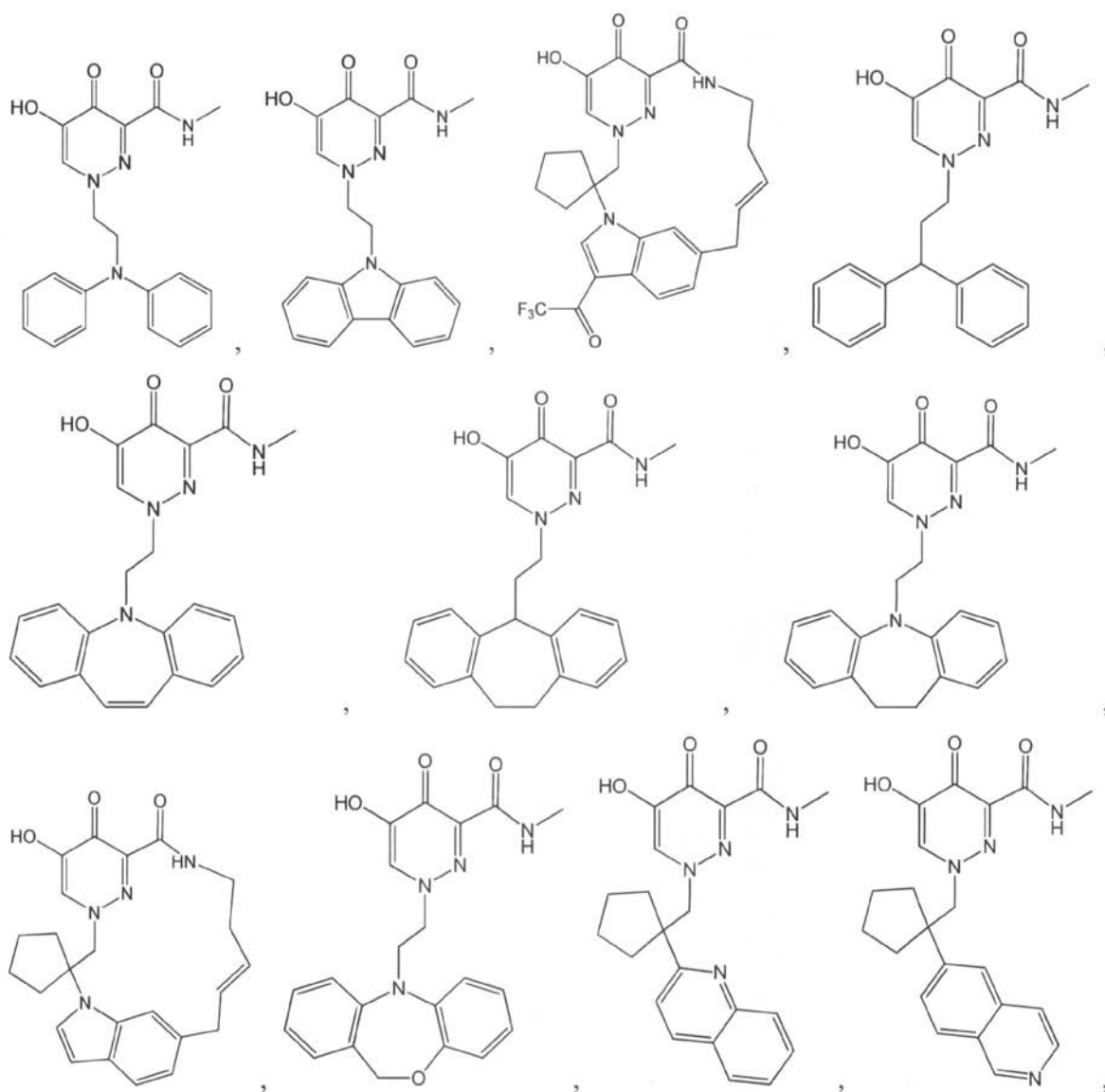


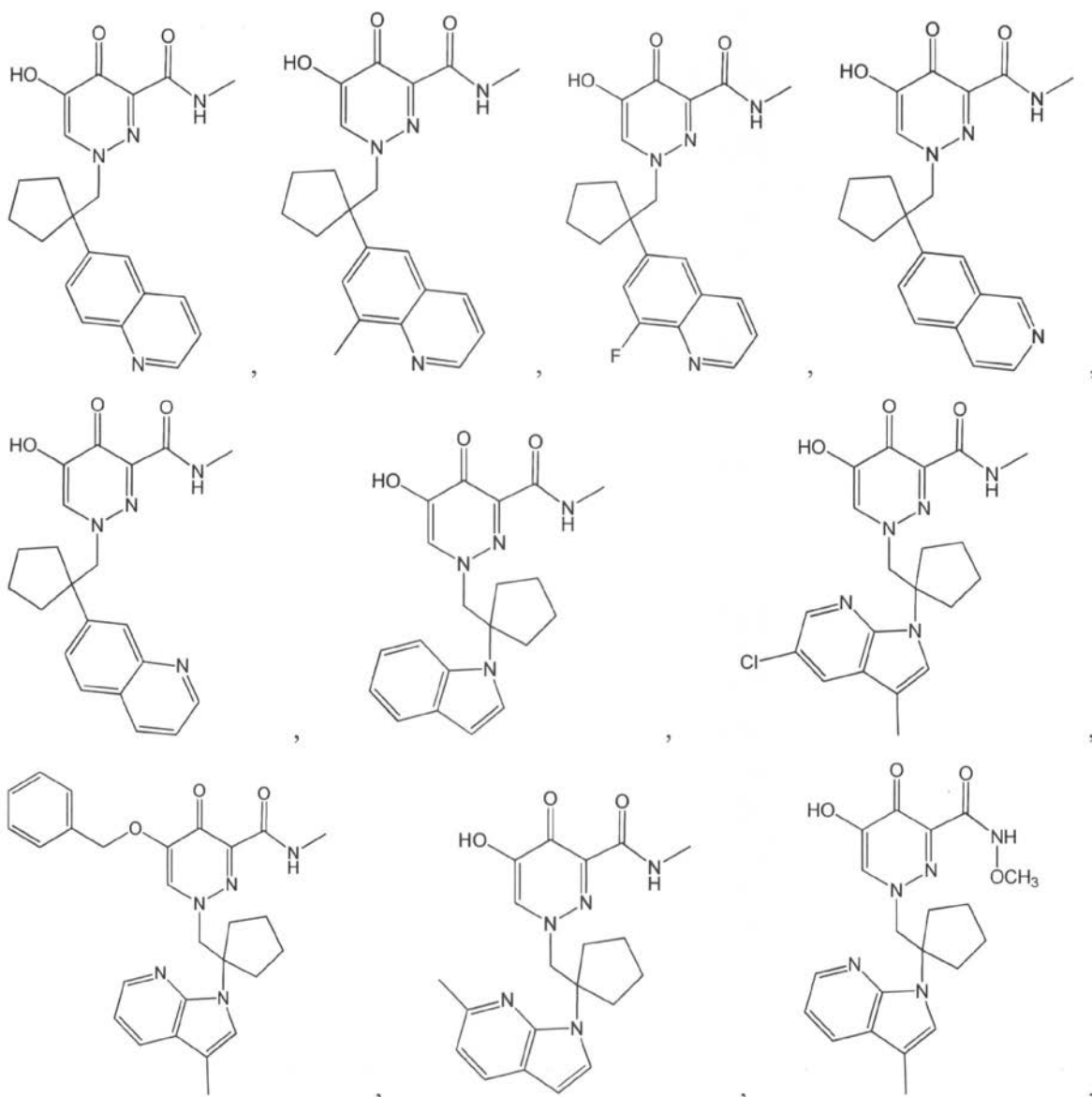


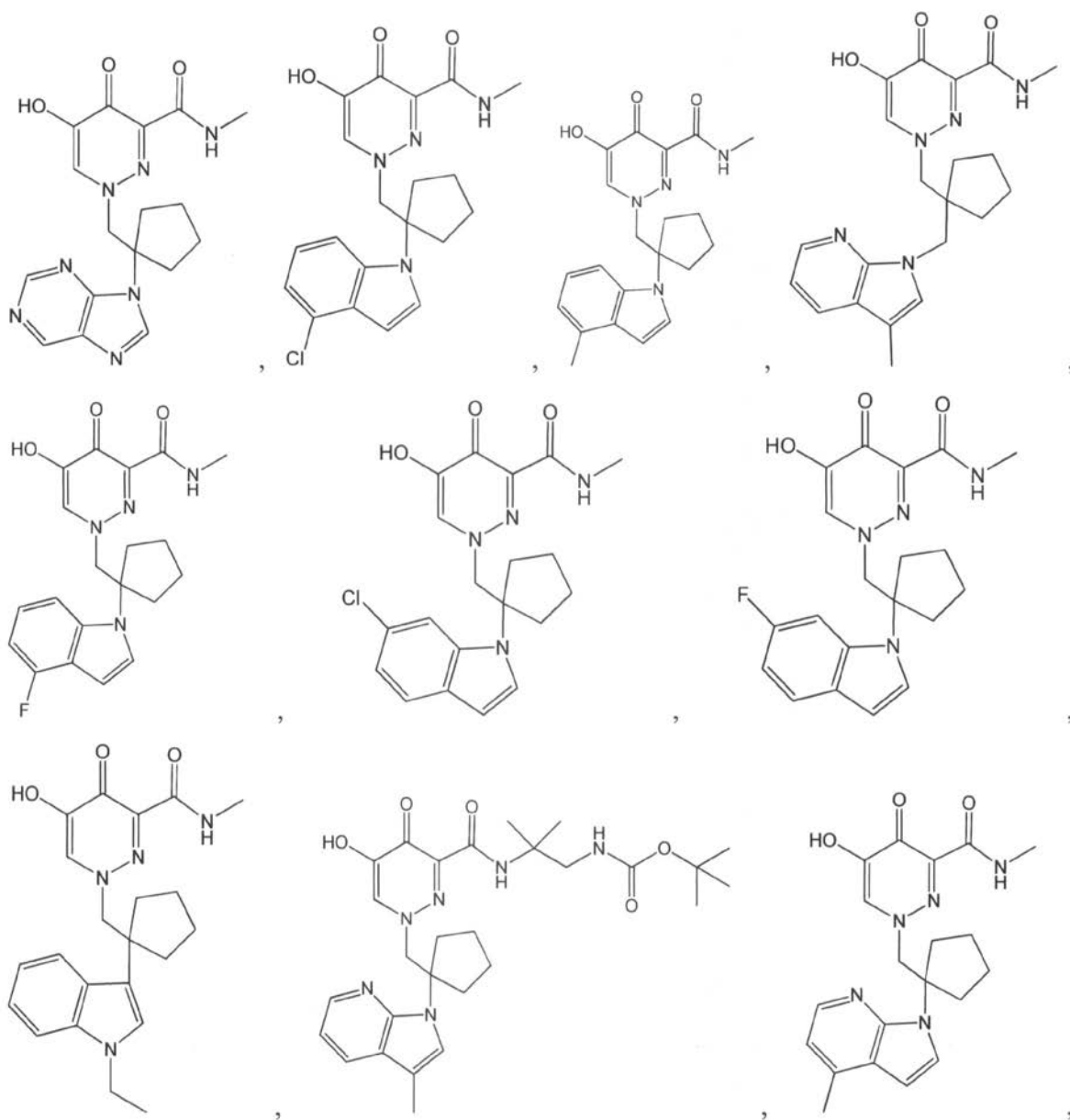


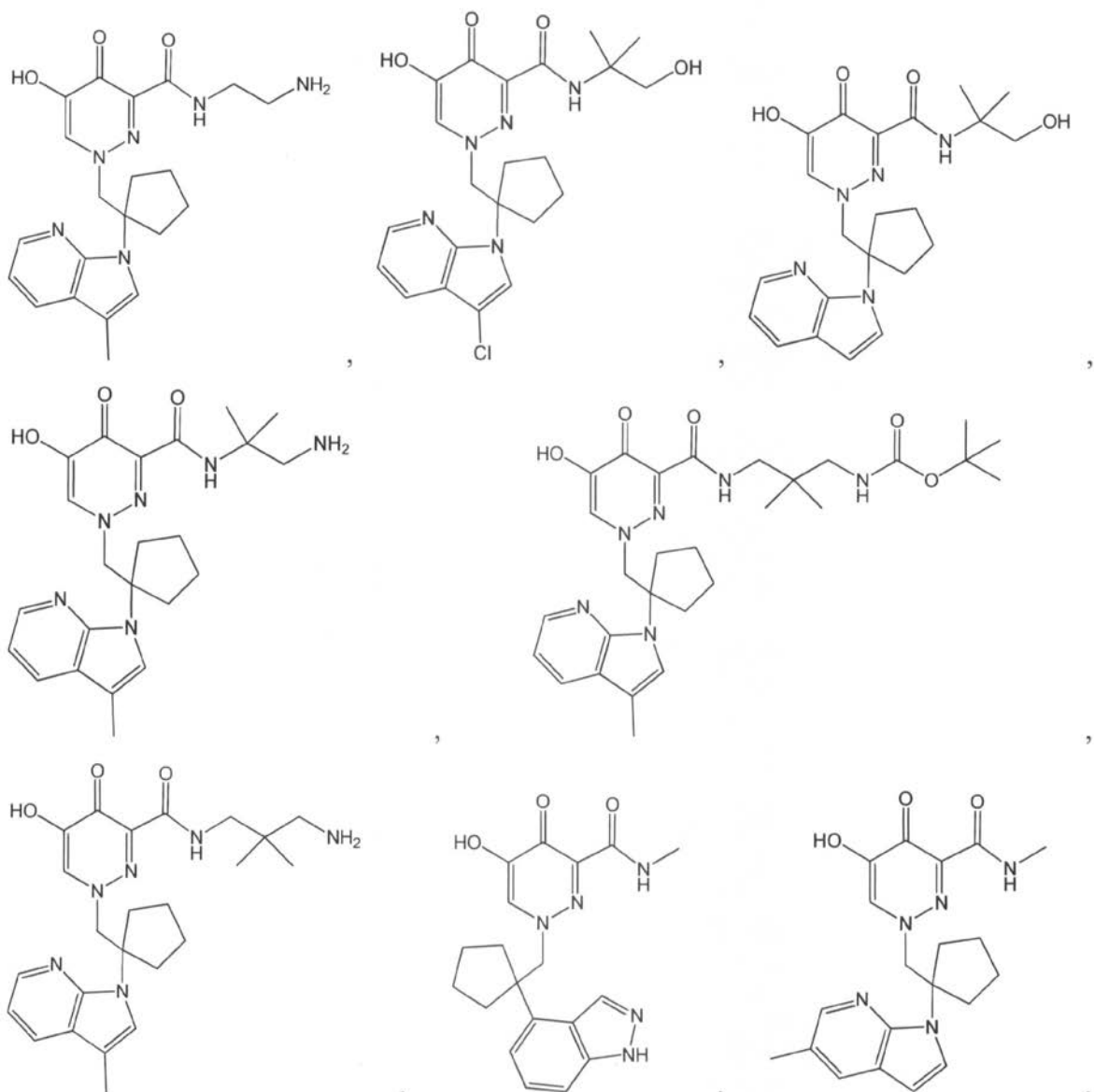




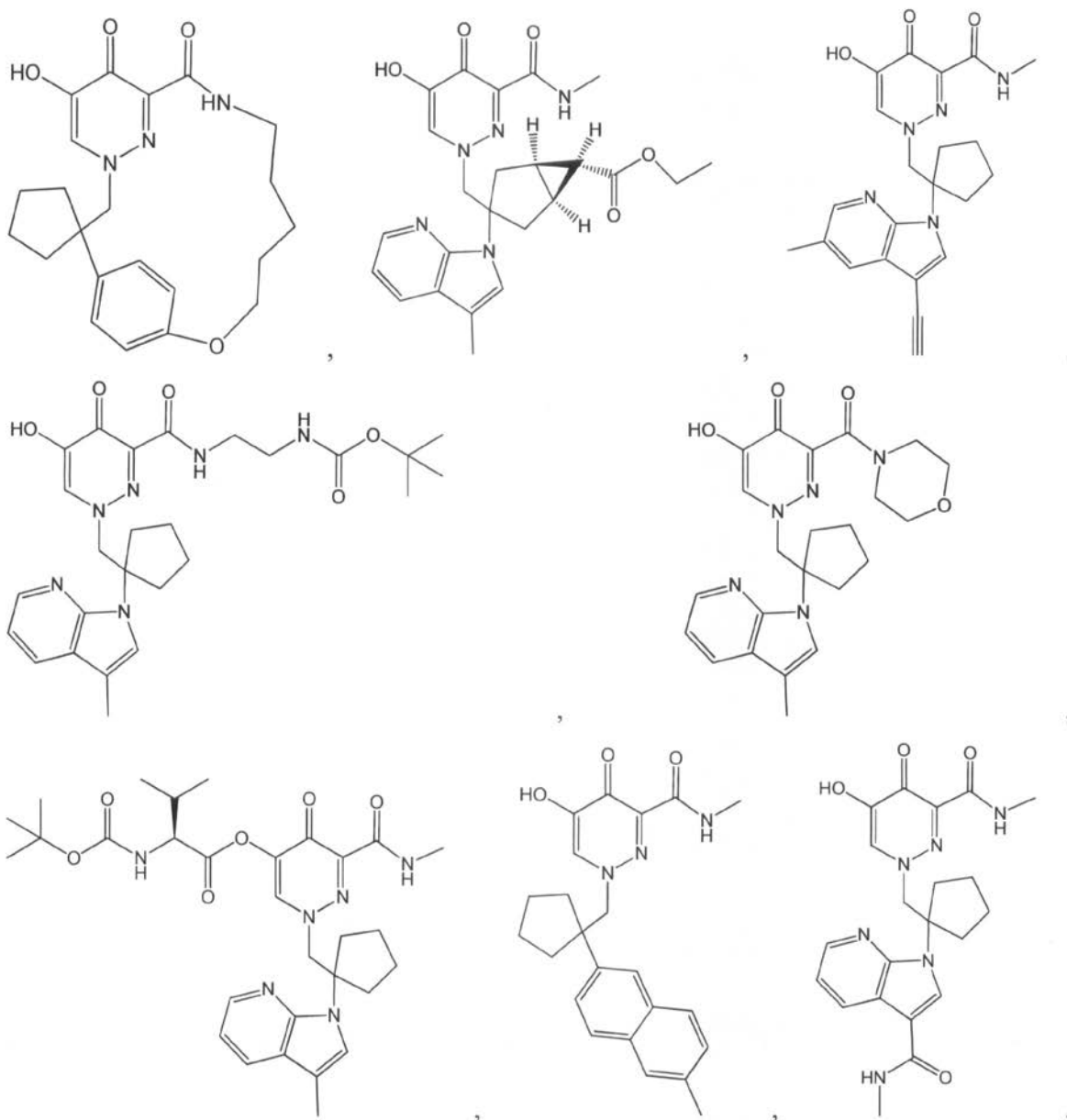


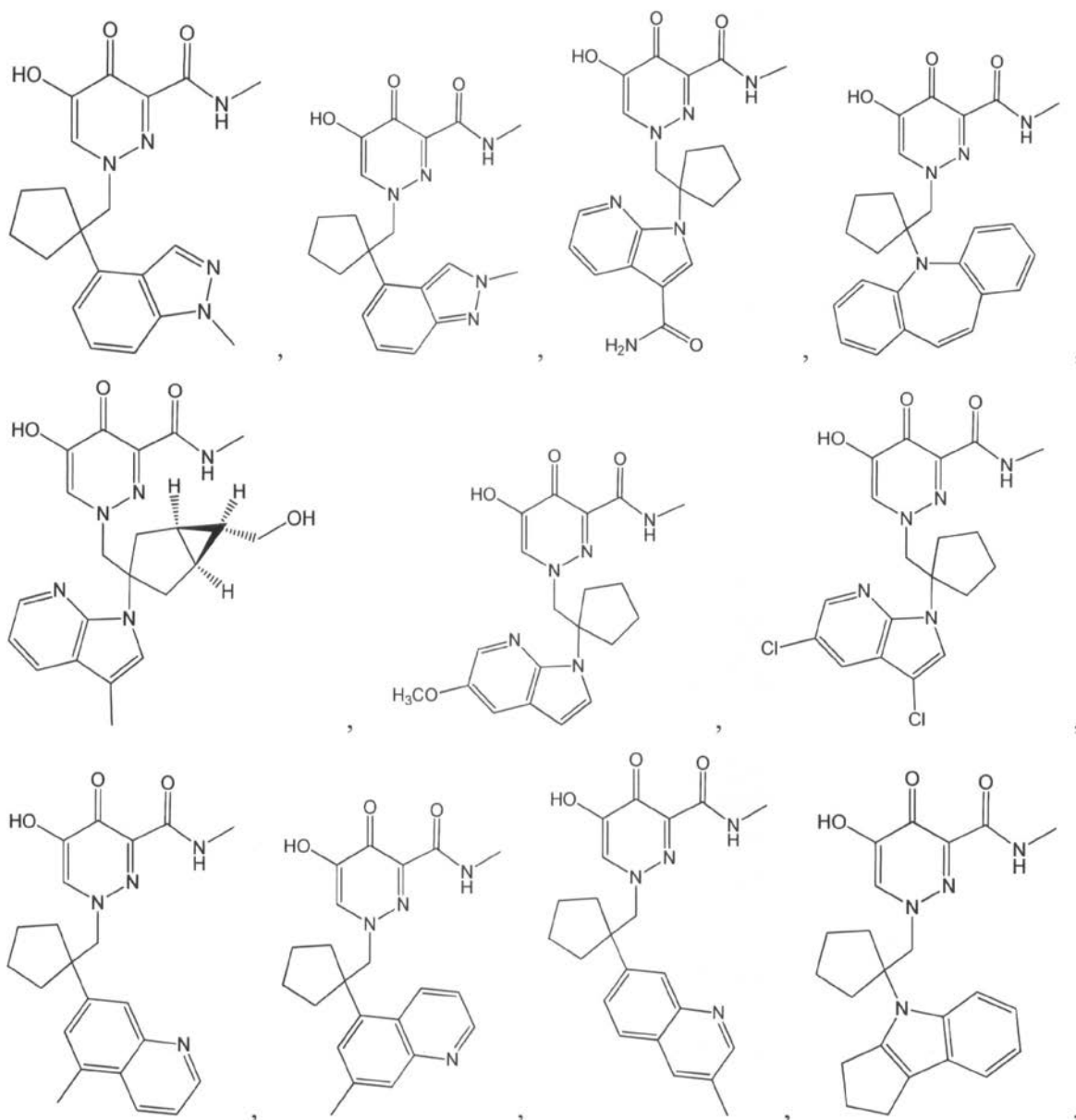






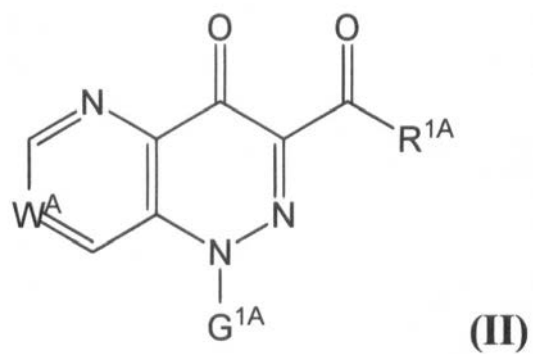








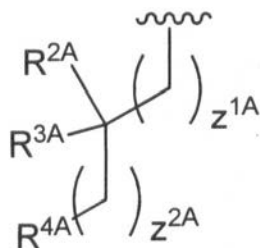
【化 7】



(式 (I I) 中、

$G^{1A}$  は、

【化 8】



および  $R^{5A}$  からなる群から選択され；

$R^{1A}$  は、 $OR^{6A}$ 、 $NH_2$ 、任意に置換されたアルキル、任意に置換されたアリール、任意に置換された一置換アミン、任意に置換された二置換アミン、任意に置換されたヘテロシクリルおよび任意に置換された N - スルホンアミドからなる群から選択され、または  $R^{10A}$  であり；

$W^A$  は - CH - または - N - であり；

$R^{2A}$  は水素または  $C_{1-6}$  アルキルであり；

$R^{3A}$  は水素または  $C_{1-6}$  アルキルであり；

あるいは、 $R^{2A}$  および  $R^{3A}$  は一緒になって任意に置換された  $C_{3-6}$  シクロアルキルまたは任意に置換された 5 ~ 6 員ヘテロシクリルを形成し；

$R^{4A}$  は任意に置換されたアリール、任意に置換されたシクロアルキル、任意に置換されたシクロアルケニル、任意に置換されたヘテロアリールおよび任意に置換されたヘテロシクリルからなる群から選択され；

$R^{5A}$  は任意に置換されたアリール、任意に置換されたシクロアルキル、任意に置換されたシクロアルケニル、任意に置換されたヘテロアリールおよび任意に置換されたヘテロシクリルからなる群から選択され；

$R^{6A}$  は水素、 $C_{1-6}$  アルキル、 $-C(O)R^{7A}$  および  $-C(O)NR^{8A}R^{9A}$  からなる群から選択され；

$R^{7A}$  は水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール ( $C_{1-6}$  アルキル)、ヘテロアリール ( $C_{1-6}$  アルキル) およびヘテロシクリル ( $C_{1-6}$  アルキル) からなる群から選択され；

$R^{8A}$  および  $R^{9A}$  は独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール ( $C_{1-6}$  アルキル)、ヘテロアリール ( $C_{1-6}$  アルキル) およびヘテロシクリル ( $C_{1-6}$  アルキル) からなる群から選択され；

あるいは、 $R^{8A}$  および  $R^{9A}$  は一緒になって任意に置換されたヘテロシクリルを形成し；

式 (I I) 中、 $R^{1A}$  が  $R^{10A}$  である場合、 $R^{10A}$  および  $R^{4A}$  は一緒になって  $L^{1A}$  を含み、 $L^{1A}$  は  $R^{10A}$  および  $R^{4A}$  を連結して 11 ~ 20 員環を形成し、あるいは、式 (I I) 中、 $R^{1A}$  が  $R^{10A}$  である場合、 $R^{10A}$  および  $R^{5A}$  は一緒になって  $L^{1A}$  を含み、 $L^{1A}$  は  $R^{1A}$  および  $R^{5A}$  を連結して 11 ~ 20 員環を形成し；

$R^{10A}$  は任意に置換された  $-CH_2-$ 、任意に置換された  $-CH=CH-$ 、O (酸素)、S (硫黄)、または  $NR^{11A}$  であり；

$R^{11A}$  は水素または  $C_{1-6}$  アルキルであり；

$L^{1A}$  は  $-L^{2A}-$ 、または  $-L^{3A}-L^{4A}-L^{5A}-$  であり；

$L^{2A}$  は任意に置換されたアルキレン、任意に置換されたアルケニレン、任意に置換されたヘテロアルキレンおよび任意に置換されたヘテロアルケニレンからなる群から選択さ

れ；

$L^{3A}$ は任意に置換された $C_{1-6}$ アルキレンであり；

$L^{4A}$ は任意に置換されたシクロアルキル、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロアリール、任意に置換されたヘテロシクリル、O（酸素）、S（硫黄）、または $NR^{11A}$ であり；

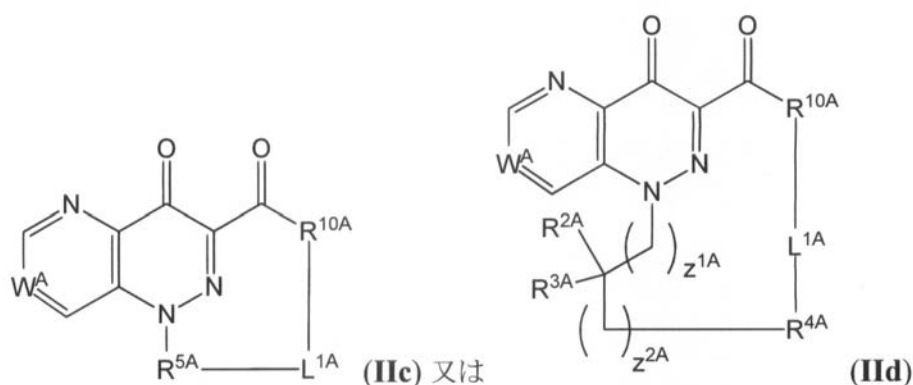
$L^{5A}$ は任意に置換された $C_{1-6}$ アルキレンまたは任意に置換されたヘテロアルキレンであり；

$Z^{1A}$ および $Z^{2A}$ は独立して0、1、2、3または4である。）

【請求項29】

式（IIc）または式（II d）の構造を有する請求項28に記載の化合物、またはその薬剂的に許容できる塩。

【化9】



【請求項30】

$L^{2A}$ が任意に置換されたアルキレンまたは任意に置換されたアルケニレンである、請求項29に記載の化合物。

【請求項31】

$L^{2A}$ が任意に置換されたヘテロアルキレンまたは任意に置換されたヘテロアルケニレンである、請求項29に記載の化合物。

【請求項32】

$L^{1A}$ が $-L^{3A}-L^{4A}-L^{5A}-$ であり；

$L^{3A}$ が任意に置換された $C_{1-4}$ アルキレンであり；

$L^{4A}$ が任意に置換されたシクロアルキル、任意に置換されたアリール、または任意に置換されたヘテロアリールであり；

$L^{5A}$ が任意に置換された $C_{1-4}$ アルキレンである、または

$L^{1A}$ が $-L^{3A}-L^{4A}-L^{5A}-$ であり；

$L^{3A}$ が任意に置換された $C_{1-4}$ アルキレンであり；

$L^{4A}$ がO（酸素）、S（硫黄）、または $NR^{11A}$ であり；

$L^{5A}$ が任意に置換された $C_{1-4}$ アルキレンである、または

$L^{1A}$ が $-L^{3A}-L^{4A}-L^{5A}-$ であり；

$L^{3A}$ が任意に置換された $C_{2-4}$ アルキレンであり；

$L^{4A}$ が任意に置換されたシクロアルキル、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロアリール、任意に置換されたヘテロシクリル、O（酸素）、S（硫黄）、または $NR^{11}$ であり；

$L^{5A}$ が任意に置換された $C_{2-4}$ アルキレンである、請求項29に記載の化合物。

## 【請求項 3 3】

$R^{1A}$ が $R^{10A}$ であり、 $R^{10A}$ が $NR^{11A}$ であり；

$R^{11A}$ がH（水素）である、または

$R^{1A}$ が $NH_2$ 、任意に置換された一置換アミンまたは任意に置換された二置換アミンである、

請求項 2 9 ~ 3 2 のいずれか一項に記載の化合物。

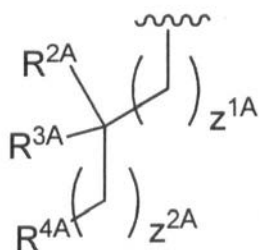
## 【請求項 3 4】

$R^{1A}$ が任意に置換されたアルキルである、請求項 2 9 に記載の化合物。

## 【請求項 3 5】

$G^{1A}$ が、

## 【化 1 0】



である、または、 $G^{1A}$ が $R^{5A}$ であり、 $R^{5A}$ が、任意に置換されたアリールである、請求項 3 4 に記載の化合物。

## 【請求項 3 6】

$R^{2A}$ および $R^{3A}$ が一緒になって任意に置換された $C_{3-6}$ シクロアルキルを形成している、請求項 3 5 に記載の化合物。

## 【請求項 3 7】

$R^{4A}$ が任意に置換されたアリールまたは任意に置換されたヘテロアリールである、請求項 3 5 または 3 6 に記載の化合物。

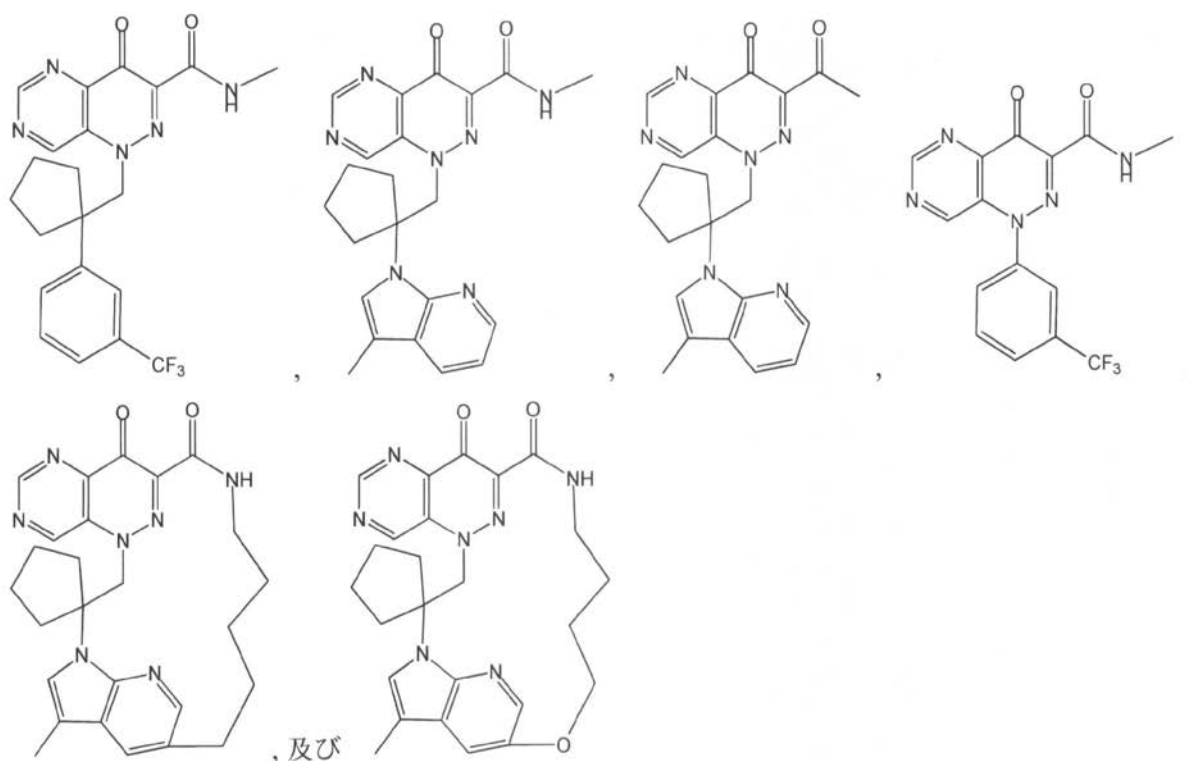
## 【請求項 3 8】

$Z^{1A}$ が 0 または 1 である、請求項 3 5 ~ 3 7 のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 3 9】

以下からなる群から選択される化合物、またはいずれかの前記化合物の薬剂的に許容できる塩である、請求項 2 9 に記載の化合物。

## 【化 1 1】



## 【請求項 4 0】

オルソミクソウイルスを改善または治療するための、請求項 1 ~ 3 9 のいずれか一項に記載の化合物もしくはその薬剂的に許容できる塩を含有する医薬組成物。

## 【請求項 4 1】

オルソミクソウイルスの複製を阻害するための、請求項 1 ~ 3 9 のいずれか一項に記載の化合物もしくはその薬剂的に許容できる塩を含有する医薬組成物。

## 【請求項 4 2】

オルソミクソウイルス感染症がインフルエンザウイルスである、請求項 4 0 または 4 1 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 4 3】

ノイラミニダーゼ阻害剤、M2 タンパク質阻害剤、ポリメラーゼ阻害剤、PB2 阻害剤、アマンタジン、リマンタジン、ザナミビル、オセルタミビル、ペラミビル、ラニナミビル、ラニナミビルオクタン酸エステル、ファビピラビル、フルダーゼ、ADS-8902、免疫調節剤、ベラプロスト、Neugene（登録商標）、リバビリン、(R)-3-((5-フルオロ-2-((5-フルオロ-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-3-イル)ピリミジン-4-イル)アミノ)-4,4-ジメチルペンタン酸、(2S,3S)-3-((5-フルオロ-2-((5-フルオロ-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-3-イル)ピリミジン-4-イル)アミノ)ビシクロ[2.2.2]オクタン-2-カルボン酸、FluMist Quadrivalent（登録商標）（メドイミュン社（Medimmune））、Fluarix（登録商標）Quadrivalent（グラクソスミスクライン社）、Fluzone（登録商標）Quadrivalent（サノフィ・パスツール社）、Flucelvax（登録商標）（ノバルティス社）およびFluBlock（登録商標）（プロテイン・サイエンス社（Protein Sciences））からなる群から選択される一つまたは複数の作用剤との組合せでインフルエンザウイルスを改善または治療するための、請求項 1 ~ 3 9 のいずれか一項に記載の化合物もしくはその薬剂的に許容できる塩を含有する医薬組成物。

## 【請求項 4 4】

インフルエンザウイルスが A 型インフルエンザまたは B 型インフルエンザである、請求項 4 2 または 4 3 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 4 5】

インフルエンザウイルスが H 1 N 1、H 3 N 2、H 5 N 1 および H 7 N 9 からなる群から選択される、請求項 4 2 または 4 3 に記載の医薬組成物。