

【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23年12月15日 (2011.12.15)

【公表番号】特表2011-502998(P2011-502998A)

【公表日】平成23年1月27日 (2011.1.27)

【年通号数】公開・登録公報2011-004

【出願番号】特願2010-532306(P2010-532306)

【国際特許分類】

C 0 7 D 233/96 (2006.01)

A 6 1 P 31/16 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/427 (2006.01)

C 0 7 D 417/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 277/20 (2006.01)

C 0 7 D 277/36 (2006.01)

A 6 1 K 31/426 (2006.01)

C 0 7 D 405/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/4178 (2006.01)

C 0 7 D 409/06 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/4166 (2006.01)

A 6 1 K 31/4174 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 233/96

A 6 1 P 31/16

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 31/12

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/427

C 0 7 D 417/06 C S P

A 6 1 K 31/4439

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D 277/36

A 6 1 K 31/426

C 0 7 D 405/06

A 6 1 K 31/4178

C 0 7 D 409/06

C 0 7 D 405/14

A 6 1 K 31/4166

A 6 1 K 31/4174

A 6 1 P 43/00 1 2 3

【手続補正書】

【提出日】平成23年10月27日 (2011.10.27)

## 【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

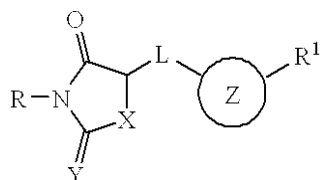
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

以下の式の化合物

【化 1】



またはその薬学的に許容される塩もしくはプロドラッグであって、式中、

X は、S または NH であり、

Y は、O または S であり、

Z は、置換もしくは非置換の 5 員ヘテロアリール環、6 員ヘテロアリール環、またはフェニルから選択され、

R<sup>1</sup> は、置換もしくは非置換のアリールまたはヘテロアリール環から選択され、

L は、直接結合であるか、または置換もしくは非置換の結合単位であり、前記結合単位は、1 ~ 4 個の炭素原子と、酸素、窒素、および硫黄から選択される 2 個までのヘテロ原子と、を有し、

X が S である場合、R は、置換もしくは非置換の縮合または二環式シクロアルキル環から選択され、X が NH である場合、R は、置換もしくは非置換の縮合または二環式シクロアルキル環、または 3 ~ 14 個の炭素環原子を有する置換もしくは非置換のシクロアルキル環から選択される、化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 2】

X が S である場合、R は、オクタヒドロ - ペンタレニル、オクタヒドロ - 1 H - インデニル、デカヒドロナフタレニル、デカヒドロアズレニル、デカヒドロ - 1 H - ベンゾ [ 7 ] アヌレニル ( annuleny l )、ビシクロ [ 1 . 1 . 0 ] - ブタニル、ビシクロ [ 1 . 1 . 1 ] ペンタニル、ビシクロ [ 2 . 1 . 1 ] ヘキサニル、ビシクロ [ 2 . 2 . 1 ] ヘプタニル、ビシクロ [ 3 . 1 . 1 ] ヘプタニル、ビシクロ [ 2 . 2 . 2 ] オクタニル、ビシクロ - [ 3 . 2 . 1 ] オクタニル、ビシクロ [ 3 . 3 . 2 ] デカニル、およびアダマンチルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

X が NH である場合、R は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル、シクロデシル、シクロドデシル、シクロウンデシル、オクタヒドロ - ペンタレニル、オクタヒドロ - 1 H - インデニル、デカヒドロナフタレニル、デカヒドロアズレニル、デカヒドロ - 1 H - ベンゾ [ 7 ] アヌレニル ( annuleny l )、ビシクロ [ 1 . 1 . 0 ] - ブタニル、ビシクロ [ 1 . 1 . 1 ] ペンタニル、ビシクロ [ 2 . 1 . 1 ] ヘキサニル、ビシクロ [ 2 . 2 . 1 ] ヘプタニル、ビシクロ [ 3 . 1 . 1 ] ヘプタニル、ビシクロ [ 2 . 2 . 2 ] オクタニル、ビシクロ - [ 3 . 2 . 1 ] オクタニル、ビシクロ [ 3 . 3 . 2 ] デカニル、およびアダマンチルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

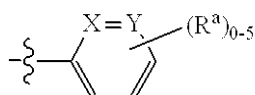
【請求項 4】

Z が、置換もしくは非置換のフラニル、チオフェニル、ピラゾリル、ピロリル、チアゾリル、オキサゾリル、イミダゾリル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イル、ピラジニル、またはトリアジニルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

$R^1$  が、式

## 【化 2】



を有し、式中、XおよびYは、それぞれ独立してCHおよびNから選択され、 $R^a$ は5個までの有機ラジカルを表し、前記ラジカルは水素に対する置換基である、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 6】

$R^1$  が、ハロゲン、置換または非置換のハロアルキル、置換または非置換の $C_1 - C_{12}$ アルキル、置換または非置換の $C_2 - C_{12}$ アルケニル、置換または非置換の $C_2 - C_{12}$ アルキニル、置換または非置換の $C_5 - C_{10}$ アリール、置換または非置換の $C_1 - C_{12}$ ヘテロアルキル、置換または非置換の $C_1 - C_{12}$ ヘテロアルケニル、置換または非置換の $C_2 - C_{12}$ ヘテロアルキニル、 $C_1 - C_9$ 置換または非置換の複素環、 $C_1 - C_{11}$ 置換または非置換のヘテロアリール、置換または非置換の $C_1 - C_5$ アルコキシアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_5$ アルコキシアルケニル、置換または非置換の $C_2 - C_5$ アルコキシアルキニル、置換または非置換の $C_1 - C_5$ アミノアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_5$ アミノアルケニル、置換または非置換の $C_2 - C_5$ アミノアルキニル、置換または非置換の $C_1 - C_5$ カルボキシアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_5$ カルボキシアルケニル、置換または非置換の $C_2 - C_5$ カルボキシアルキニル、置換または非置換の $C_1 - C_5$ アミドアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_5$ アミドアルケニル、置換または非置換の $C_2 - C_5$ アミドアルキニル、置換または非置換の $C_1 - C_5$ シアノアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_5$ シアノアルケニル、置換または非置換の $C_2 - C_5$ シアノアルキニル、置換または非置換の $C_1 - C_5$ ニトロアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_5$ ニトロアルケニル、置換または非置換の $C_2 - C_5$ ニトロアルキニル、置換または非置換の $C_1 - C_5$ スルホニルアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_5$ スルホニルアルケニル、置換または非置換の $C_2 - C_5$ スルホニルアルキニル、置換または非置換のアミノ、 $C_1 - C_4$ 直鎖または分岐鎖のハロアルキル、置換または非置換のアルコキシ、ハロゲン、シアノ、またはニトロから独立して選択される1～5個の有機ラジカルで置換される、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 7】

L が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、 $=CH-$ 、 $=CHCH_2-$ 、 $=CHCH_2CH_2-$ 、 $=CHCH_2CH_2CH_2-$ 、 $-NH-$ 、 $=N-$ 、 $-N=$ 、 $-CH_2NH-$ 、 $-NHCH_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CH_2(O)-$ 、 $-C(O)CH_2-$ 、 $-NHC(O)-$ 、 $-C(O)NH-$ 、 $-CH_2NHC(O)-$ 、 $-CH_2C(O)NH-$ 、 $-NHC(O)CH_2-$ 、または $-C(O)NHCH_2-$ から選択される、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 8】

請求項1～7のうちのいずれかに記載の1つ以上の化合物と、薬学的に許容される担体と、を含む、組成物。

## 【請求項 9】

第2の化合物または組成物をさらに含み、前記第2の化合物または組成物は抗ウイルス化合物である、請求項1～8のうちのいずれか1項に記載の化合物または組成物。

## 【請求項 10】

第2の化合物または組成物をさらに含み、前記第2の化合物または組成物は、ヌクレオシドもしくはヌクレオチド系逆転写酵素阻害剤、非ヌクレオシド系逆転写酵素阻害剤、プロテアーゼ阻害剤、インテグラーゼ阻害剤、RNAポリメラーゼ阻害剤、DNAポリメラーゼ阻害剤、キナーゼ阻害剤、酵素阻害剤、侵入阻害剤、構築阻害剤、成熟阻害剤、M2阻害剤、またはノイラミニダーゼ阻害剤である、請求項1～8のうちのいずれか1項に記載

載の化合物または組成物。

【請求項 11】

第2の化合物または組成物をさらに含み、前記第2の化合物または組成物は、アマンタジン、リマンタジン、オセルタミビル、ザナミビル、ペラミビル、ラルテグラビル、マラビロク、エンフビルチド、ベビリマット (bevirimat)、バイブコン (VIVECON (登録商標))、アバカビル、ジドブジン、エムトリシタピン、ラミブジン、ジダノシン、テノホビルジソプロキシルフマル酸塩、コンビビル (COMBIVIR (登録商標)) (ジドブジン+ラミブジン)、エプジコム (EPZICOM (登録商標)) (アバカビル+ラミブジン)、トリジビル (TRIZIVIR (登録商標)) (アバカビル+ジドブジン+ラミブジン)、ツルバダ (TRUVADA (登録商標)) (テノホビルジソプロキシルフマル酸塩+エムトリシタピン)、スタブジン、ラシビル、アムドキシビル、アプリシタピン (apricitabine)、エルブシタピン、 $\alpha$ -エビプロミド (alpha-epibromide)、アルデスロイキン)、HIV免疫原、BAY50-4798、IR103、エトラビルン、デラビルジン、エファビレンツ、ネビラピン、リルピビルン、アンプレナビル、チプラナビル、インジナビル、サキナビル、ロビナビル/リトナビル、ホスアンプレナビル、リトナビル、ダルナビル、アタザナビル、ネルフィナビル、エンフビルチド、マラビロク、ピクリビロク、PRO140、TNX-355、ラルテグラビル、エルビテグラビル、ベビリマット (bevirimat)、またはヒドロキシ尿素である、請求項1~8のうちのいずれか1項に記載の化合物または組成物。

【請求項 12】

薬物を作製するための、請求項1~11のいずれか1項に記載の化合物または組成物の使用。

【請求項 13】

A型インフルエンザウイルスを治療するための薬物を作製するための、請求項12に記載の使用。

【請求項 14】

B型インフルエンザウイルスを治療するための薬物を作製するための、請求項12に記載の使用。

【請求項 15】

ウイルスの細胞への侵入を阻害する、ウイルス媒介膜融合を阻害する、またはウイルス融合タンパク質を不安定化させる方法であって、請求項1~11に記載の1つ以上の化合物または組成物の有効量を細胞に投与するステップを含む、方法。