

【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4年11月4日(2022.11.4)

【国際公開番号】WO2020/089778

【公表番号】特表2022-505989(P2022-505989A)

【公表日】令和4年1月14日(2022.1.14)

【年通号数】公開公報(特許)2022-006

【出願番号】特願2021-523159(P2021-523159)

【国際特許分類】

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

C 0 7 D 4 0 3 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 0 5 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 1 7 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 4 1 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 1 / 1 8 (2 0 0 6 . 0 1)

10

【 F I 】

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

C 0 7 D 4 0 3 / 1 4

C 0 7 D 4 0 5 / 1 4

A 6 1 K 3 1 / 5 1 7

A 6 1 K 3 1 / 5 4 1

A 6 1 P 3 1 / 1 8

20

【手続補正書】

【提出日】令和4年10月26日(2022.10.26)

【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

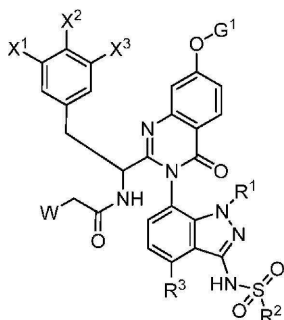
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物、又はその薬学的に許容される塩：

【化1】



式I

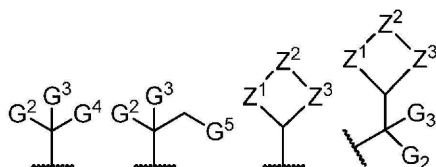
40

[式中、

G¹は1~3個のフッ素で場合により置換されているC₆~C₈アルキルであるか、又はG¹は

50

【化2】



のうちの1つであり、

Z¹は-C₁~C₂アルキレンであり、

Z²は-O-, -S(O₂)-又は-CH₂-であり、

Z³は-C₁~C₂アルキレンであり、

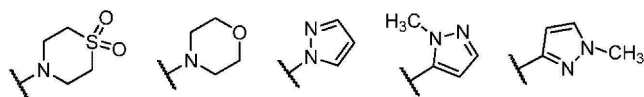
G²及びG³は独立に、H及び-CH₃から選択され、

G⁴はフェニル、ピリジン、ピリミジン又はピラジンであり、

G⁵はG⁴、-OG⁴、-O(1~3個のフッ素で場合により置換されているC₁~C₂アルキル)であり、又はG⁵は

10

【化3】



20

のうちの1つであり、

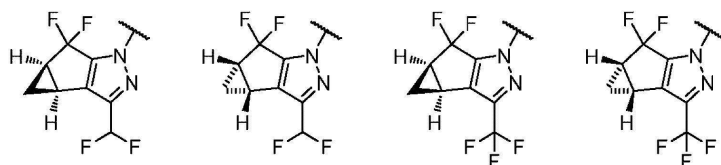
R¹は水素、1~3個のフッ素で場合により置換されているC₁~C₃アルキル、又は1~2個のフッ素で場合により置換されているシクロプロピルであり、

R²は1~3個のフッ素で場合により置換されているC₁~C₂アルキル、又は1~2個のフッ素で場合により置換されているC₃~C₄シクロアルキルであり、

R³は水素、Cl、F、CH₃又はOCH₃であり、

Wは

【化4】



30

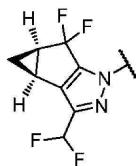
から選択され、

X¹、X²及びX³は独立に、H、F及びClから選択され、X¹、X²及びX³基のうちの1つは-CN、-OCH₃、-CH₃、-CH₂F、-CHF₂及び-CF₃から選択される]。

【請求項2】

Wが

【化5】



40

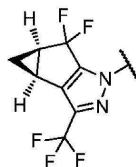
である、請求項1に記載の化合物又は塩。

【請求項3】

Wが

50

【化6】



である、請求項1に記載の化合物又は塩。

【請求項4】

R^1 が $-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CHF}_2$ 又は $-\text{CH}_2\text{CF}_3$ であり、 R^2 が $-\text{CH}_3$ 又はシクロプロピルであり、 R^3 がH、Cl又は CH_3 である、請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物又は塩。 10

【請求項5】

R^1 が $-\text{CH}_3$ であり、 R^2 が $-\text{CH}_3$ であり、 R^3 がClである、請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項6】

X^1 、 X^2 及び X^3 が独立に、H又はFから選択される、請求項1から5のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項7】

X^1 がFであり、 X^2 がHであり、 X^3 がFである、請求項1から5のいずれか一項に記載の化合物又は塩。 20

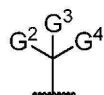
【請求項8】

G^2 及び G^3 がHである、請求項1から7のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項9】

G^1 が

【化7】



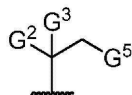
であり、 30

ここで、 G^4 がピリジン又はピリミジンである、
請求項1から8のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項10】

G^1 が

【化8】

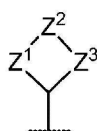


である、請求項1から8のいずれか一項に記載の化合物又は塩。 40

【請求項11】

G^1 が

【化9】



であり、

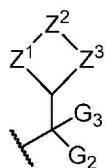
ここで、 Z^2 が $-\text{O}-$ 又は $-(\text{CH}_2)-$ である、請求項1から8のいずれか一項に記載の化合物又 50

は塩。

【請求項 1 2】

G¹が

【化 1 0】



10

であり、

ここで、Z²が-(CH₂)-である、請求項1から8のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

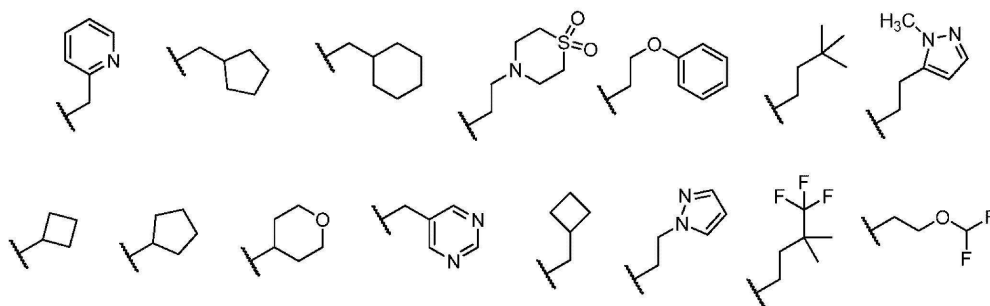
【請求項 1 3】

G¹が1～3個のフッ素で場合により置換されているC₆～C₈アルキルである、請求項1から7のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 1 4】

G¹が

【化 1 1】



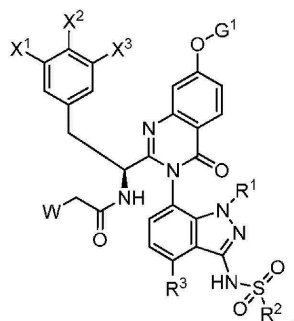
20

のうちの1つである、請求項1から7のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 1 5】

立体化学構造が

【化 1 2】



40

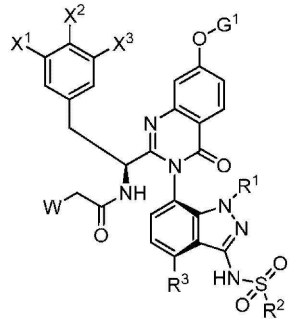
に示す通りである、請求項1から14のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 1 6】

立体化学構造が、

50

【化 1 3】



10

に示す通りである、請求項1から14のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 1 7】

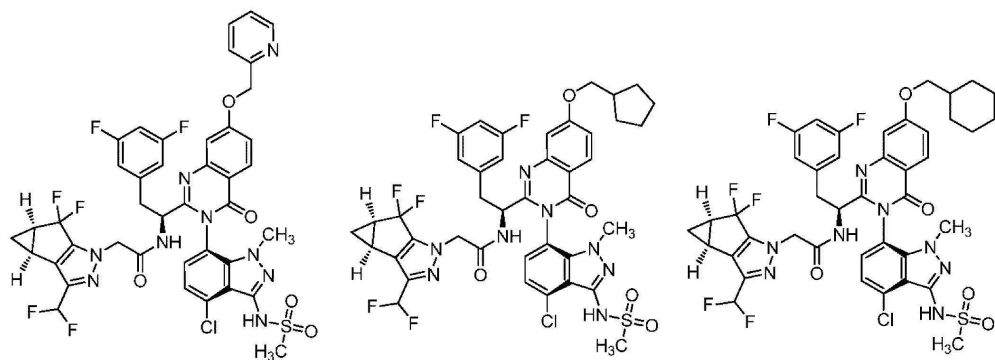
20

30

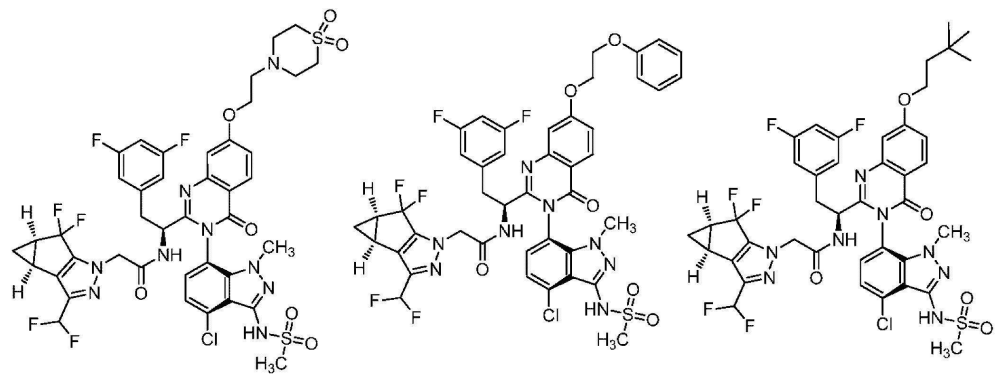
40

50

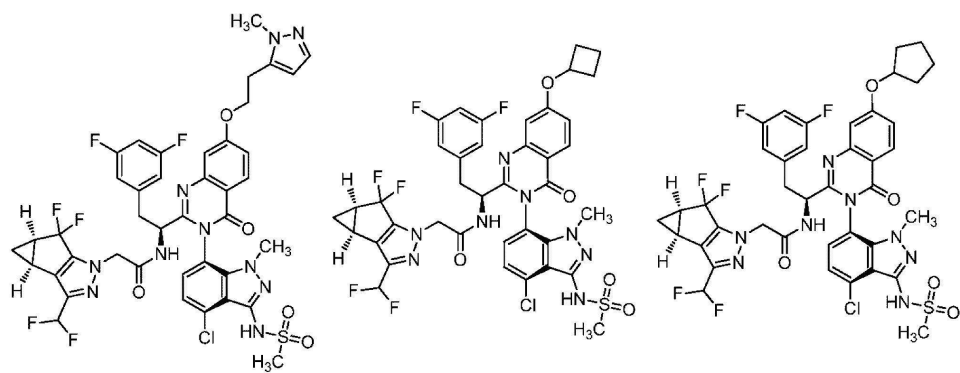
【化 1 4】



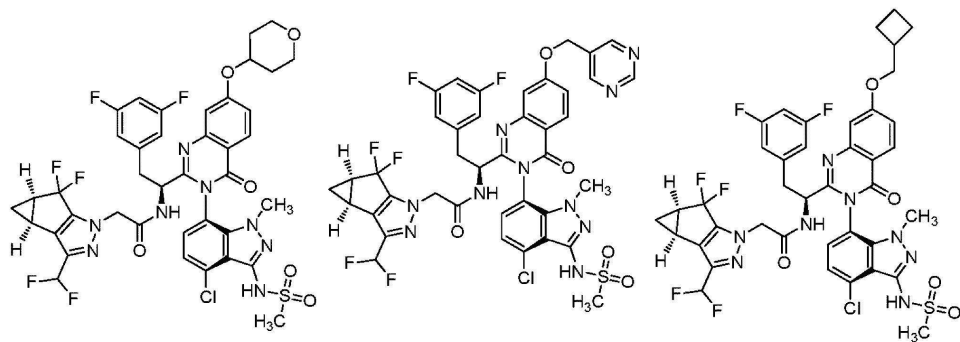
10



20



30



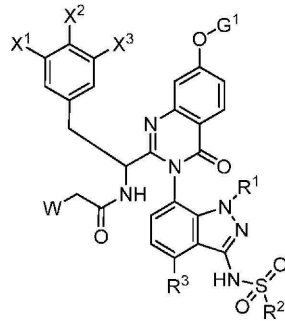
40

50

本開示は以下の実施形態を包含する。

[1.] 式Iの化合物、又はその薬学的に許容される塩:

[化108]



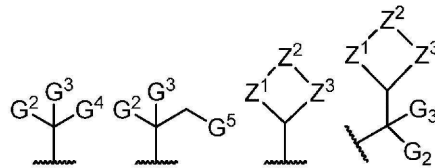
式I

10

[式中、]

G^1 は1~3個のフッ素で場合により置換されている $C_6 \sim C_8$ アルキルであるか、又は G^1 は

[化109]



20

のうちの1つであり、

Z^1 は $-C_1 \sim C_2$ アルキレンであり、

Z^2 は $-O-$ 、 $-S(O_2)-$ 又は $-CH_2-$ であり、

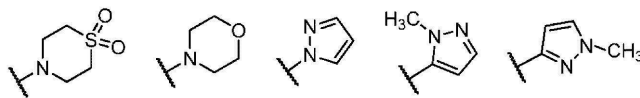
Z^3 は $-C_1 \sim C_2$ アルキレンであり、

G^2 及び G^3 は独立に、 H 及び $-CH_3$ から選択され、

G^4 はフェニル、ピリジン、ピリミジン又はピラジンであり、

G^5 は G^4 、 $-OG^4$ 、 $-O(1 \sim 3$ 個のフッ素で場合により置換されている $C_1 \sim C_2$ アルキル)であり、又は G^5 は

[化110]



のうちの1つであり、

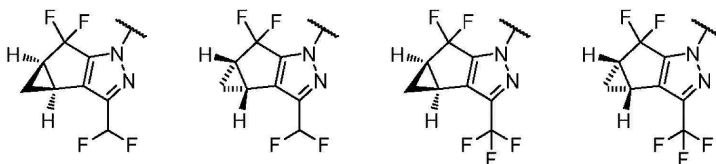
R^1 は水素、1~3個のフッ素で場合により置換されている $C_1 \sim C_3$ アルキル、又は1~2個のフッ素で場合により置換されているシクロプロピルであり、

R^2 は1~3個のフッ素で場合により置換されている $C_1 \sim C_2$ アルキル、又は1~2個のフッ素で場合により置換されている $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルであり、

R^3 は水素、 Cl 、 F 、 CH_3 又は OCH_3 であり、

W は

[化111]



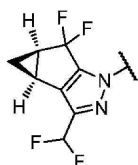
50

から選択され、

X^1 、 X^2 及び X^3 は独立に、H、F及びClから選択され、 X^1 、 X^2 及び X^3 基のうちの1つは-CN、-OCH₃、-CH₃、-CH₂F、-CHF₂及び-CF₃から選択される]。

[2] Wが

[化112]

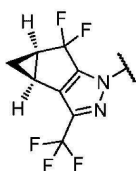


10

である、請求項1に記載の化合物又は塩。

[3] Wが

[化113]



20

である、請求項1に記載の化合物又は塩。

[4] R^1 が-CH₃、-CH₂CHF₂又は-CH₂CF₃であり、 R^2 が-CH₃又はシクロプロピルであり、 R^3 がH、Cl又はCH₃である、請求項1から3のいずれかに記載の化合物又は塩。

[5] R^1 が-CH₃であり、 R^2 が-CH₃であり、 R^3 がClである、請求項1から3のいずれかに記載の化合物又は塩。

[6] X^1 、 X^2 及び X^3 が独立に、H又はFから選択される、請求項1から5のいずれかに記載の化合物又は塩。

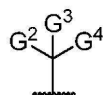
[7] X^1 がFであり、 X^2 がHであり、 X^3 がFである、請求項1から5のいずれかに記載の化合物又は塩。

[8] G^2 及び G^3 がHである、請求項1から7のいずれかに記載の化合物又は塩。

30

[9] G^1 が

[化114]



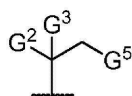
であり、

ここで、 G^4 がピリジン又はピリミジンである、

請求項1から8のいずれかに記載の化合物又は塩。

[10] G^1 が

[化115]



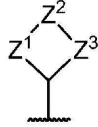
40

である、請求項1から8のいずれかに記載の化合物又は塩。

[11] G^1 が

[化116]

50

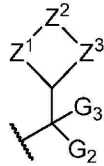


であり、

ここで、 Z^2 が-O-又は-(CH₂)-である、請求項1から8のいずれかに記載の化合物又は塩。

[1.2] G^1 が

[化117]



10

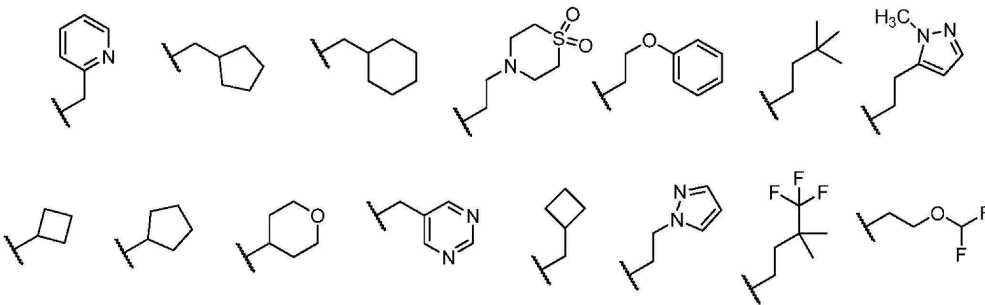
であり、

ここで、 Z^2 が-(CH₂)-である、請求項1から8のいずれかに記載の化合物又は塩。

[1.3] G^1 が1~3個のフッ素で場合により置換されているC₆~C₈アルキルである、請求項1から7のいずれかに記載の化合物又は塩。

[1.4] G^1 が

[化118]

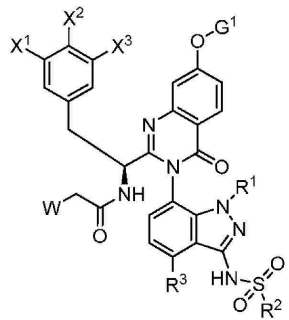


30

のうちの1つである、請求項1から7のいずれかに記載の化合物又は塩。

[1.5] 立体化学構造が

[化119]



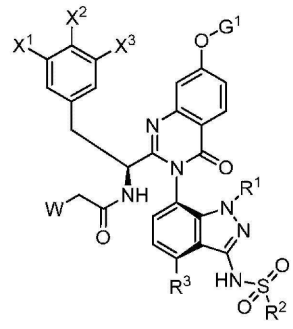
40

に示す通りである、請求項1から14のいずれかに記載の化合物又は塩。

[1.6] 立体化学構造が、

[化120]

50



10

に示す通りである、請求項1から14のいずれかに記載の化合物又は塩。

[1 7]

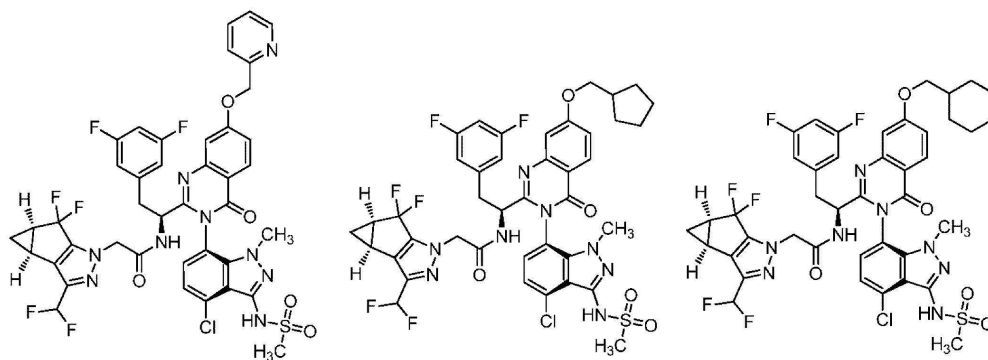
[化 1 2 1]

20

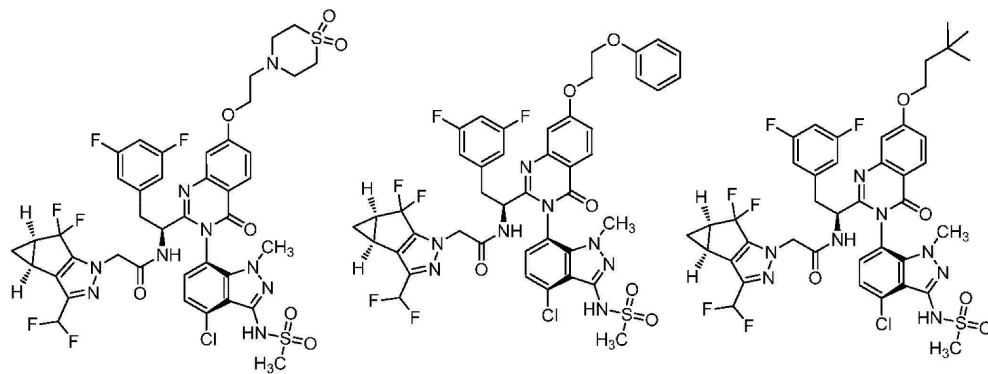
30

40

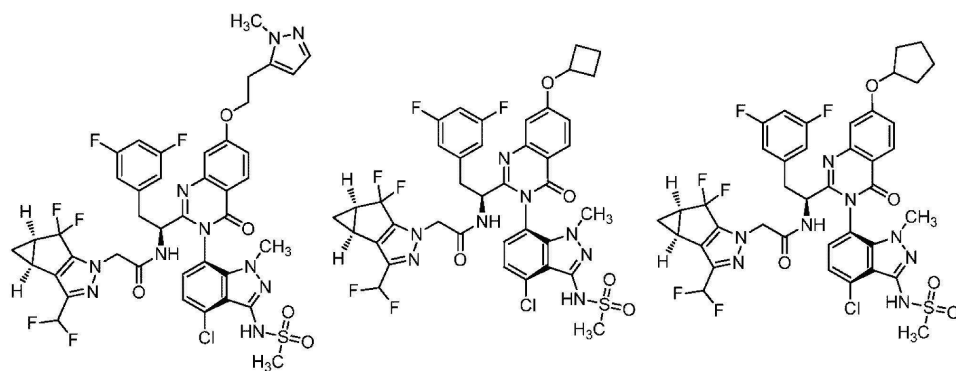
50



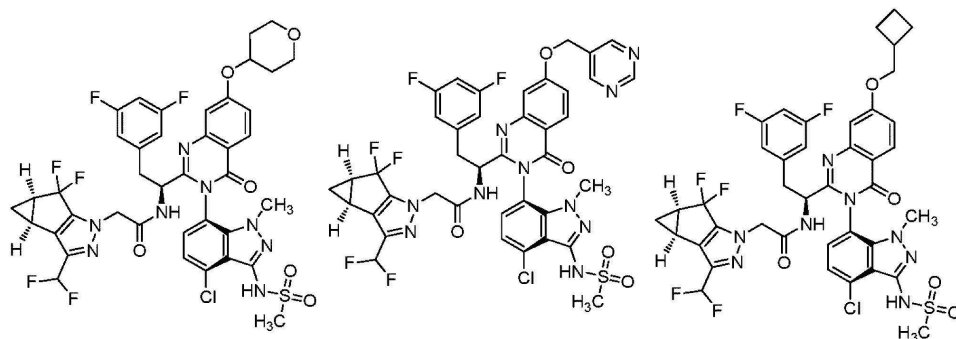
10



20

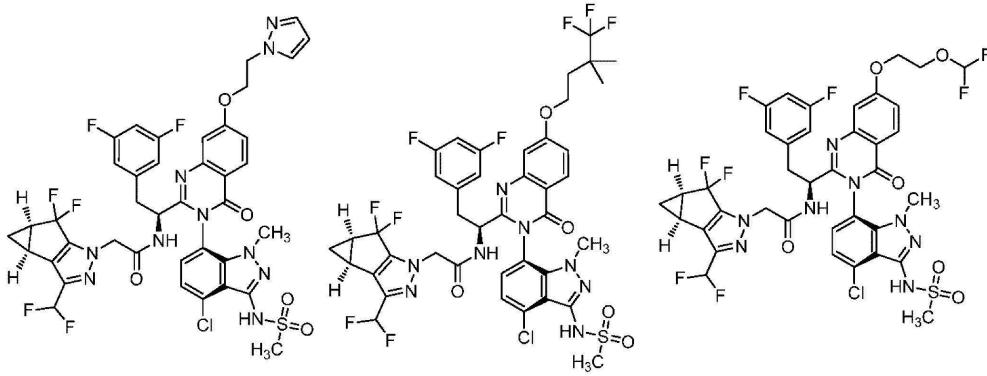


30



40

50



10

及びそれらの薬学的に許容される塩からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物又は塩。

[18] 請求項1から17のいずれかに記載の化合物又は塩を含む、医薬組成物。

[19] 薬学的に許容される担体、賦形剤及び/又は希釈剤をさらに含む、請求項18に記載の組成物。

[20] 請求項18又は19に記載の組成物を患者に投与することを含む、HIV感染を処置する方法。

[21] 前記投与が経口である、請求項20に記載の方法。

20

[22] 前記投与が、筋肉内注射又は皮下注射によるものである、請求項20に記載の方法。

[23] ヌクレオシドHIV逆転写酵素阻害剤、非ヌクレオシドHIV逆転写酵素阻害剤、HIVプロテアーゼ阻害剤、HIV融合阻害剤、HIV付着阻害剤、CCR5阻害剤、CXCR4阻害剤、HIV出芽又は成熟阻害剤及びHIVインテグラーゼ阻害剤からなる群から選択される、AIDS又はHIV感染の処置に使用される少なくとも1つの他の薬剤の投与をさらに含む、請求項20に記載の方法。

[24] 治療において使用するための、請求項1から17のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

[25] HIV感染の処置において使用するための、請求項1から17のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

30

[26] HIV感染の処置のための医薬の製造において使用するための、請求項1から17のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

40

50