

【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8月31日 (2017.8.31)

【公表番号】特表2016-527259(P2016-527259A)

【公表日】平成28年9月8日 (2016.9.8)

【年通号数】公開・登録公報2016-054

【出願番号】特願2016-530495(P2016-530495)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/74 (2006.01)

C 0 7 D 241/20 (2006.01)

C 0 7 D 407/14 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 213/74

C 0 7 D 241/20 C S P

C 0 7 D 407/14

C 0 7 D 409/14

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D 417/12

A 6 1 K 31/497

A 6 1 K 31/496

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 31/14

【手続補正書】

【提出日】平成29年7月24日 (2017.7.24)

【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

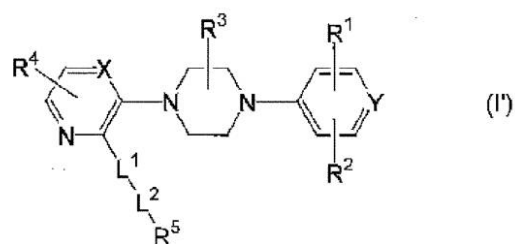
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I ') の化合物であって、

【化 1】



そのあらゆる立体化学的異性体形態を含む化合物（式中、
XおよびYは、C R⁶またはNから各々独立して選択され、ここで、R⁶は水素であり；
R¹およびR²は、水素、ハロ、ヒドロキシ、C₁～4アルキルまたはC₁～4アルキル
オキシから各々独立して選択され；
R³は、水素またはC₁～6アルキルであり；
R⁴は、水素であり；
L¹は、直接結合；酸素；C₁～4アルカンジイル；またはヒドロキシ、フェニルもしくは
C₁～4アルキルオキシで置換されたフェニルから各々独立して選択された1つまたは
2つの置換基で置換されたC₁～4アルカンジイルであり；
L²は、直接結合、フェニル、ピペラジンまたはヒドロキシで置換されたピペラジンであ
り；および
R⁵は、C₁～4アルキル、C₃～6シクロアルキル、ヘテロアルキル、アリールまたは
ヘテロアリールであり；
ここで、ヘテロアルキルはピペリジニルであり；
アリールは、フェニルまたはナフタレニルである；このとき各アリールは、ハロ、ヒドロ
キシ、C₁～4アルキル、C₁～4アルキルオキシ、C₁～4アルキルチオ、ポリハロC
₁～4アルキル、ポリハロC₁～4アルキルオキシ、シアノ、ジ(C₁～4アルキル)-
アミノ、C₁～4アルキルカルボニルまたはC₁～4アルキル(SO₂)-NH-から各
々独立して選択された1つまたは2つの置換基で置換されていてもよく；
ヘテロアリールは、フラニル、ピリジニル、2,3-ジヒドロ-ベンゾ[1,4]ジオキ
シニル、ベンゾ[1,3]ジオキサニル、1-ベンゾフラニル、2,3-ジヒドロ-1-
ベンゾフラニル、1-ベンゾチオフェニル、1-ベンゾピラゾニル、1,3-ベンゾチア
ゾニルまたはキノリニルである；このとき各ヘテロアリールはC₁～4アルキル、C₁～
4アルキルオキシ、ヒドロキシC₁～4アルキル、シアノC₁～4アルキルもしくはポリ
ハロC₁～4アルキルまたはC₁～4アルキルオキシC₁～4アルキルから各々独立して
選択される1つまたは2つの置換基で置換されていてもよい）、
 またはその薬学的に許容される酸付加塩。

【請求項 2】

XはNであり、YはNである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

XはNであり、YはC R⁶であり、ここで、R⁶は水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

XはC R⁶であり、ここで、R⁶は水素であり、YはNである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

XはC R⁶であり、ここで、R⁶は水素であり、YはC R⁶であり、ここで、R⁶は水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

XはC R⁶であり、ここで、R⁶は水素であり、YはNであり、L¹は直接結合であり、L²は直接結合である、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

XはNであり、YはNであり、L¹は直接結合であり、L²は直接結合である、請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

XはC R⁶であり、ここで、R⁶は水素であり、YはNであり、L¹は直接結合であり、L²は直接結合であり、R⁵はアリールである、請求項1に記載の化合物。

【請求項9】

XはNであり、YはNであり、L¹は直接結合であり、L²は直接結合であり、R⁵はアリールである、請求項1に記載の化合物。

【請求項10】

薬学的に許容される担体および治療有効量の請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項11】

治療有効量の請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物が薬学的に許容される担体と均質混合される、請求項10に記載の医薬組成物を調製する方法。

【請求項12】

医薬品として使用するための、請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項13】

RS（呼吸器合胞体）ウイルス感染症の治療において使用するための、請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物または請求項10に記載の医薬組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0133

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0133】

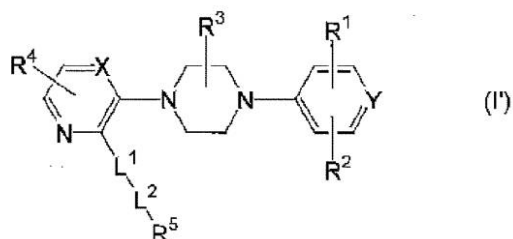
穏当な変動は、本発明の範囲からの逸脱とみなすべきではない。このように記載した本発明は、当業者によって多数の方法で変更されてよいことは明白であろう。

本発明は、以下の態様を含む。

[1]

式(I')の化合物であって、

【化57】



そのあらゆる立体化学的異性体形態を含む化合物（式中、

XおよびYは、各々独立してC R⁶またはNから選択され、ここで、R⁶は、水素、ハロ、ヒドロキシ、C₁～4アルキル、C₁～4アルキルオキシ、シアノ、ポリハロC₁～4

アルキル、ポリハロ C₁ ~ 4 アルキルオキシ、ニトロ、アミノ、モノ - もしくはジ (C₁ ~ 4 アルキル) アミノまたは C₁ ~ 4 アルキルカルボニルであり；

R¹ および R² は、各々独立して水素、ハロ、ヒドロキシ、C₁ ~ 4 アルキル、C₁ ~ 4 アルキルオキシ、ポリハロ C₁ ~ 4 アルキル、ポリハロ C₁ ~ 4 アルキルオキシ、シアノ、ニトロまたは C₁ ~ 4 アルキルカルボニルから選択され；

R³ は、水素または C₁ ~ 6 アルキルであり；

R⁴ は、水素、ハロ、ヒドロキシ、C₁ ~ 4 アルキル、C₁ ~ 4 アルキルオキシ、ポリハロ C₁ ~ 4 アルキル、ポリハロ C₁ ~ 4 アルキルオキシ、シアノ、ニトロまたは C₁ ~ 4 アルキルカルボニルであり；

L¹ は、直接結合；酸素；C₁ ~ 4 アルカンジイル；またはヒドロキシ、フェニルもしくは C₁ ~ 4 アルキルオキシで置換されたフェニルから各々独立して選択された 1 つまたは 2 つの置換基で置換された C₁ ~ 4 アルカンジイルであり；

L² は、直接結合、フェニル、ピペラジンまたはヒドロキシで置換されたピペラジンであり；および

R⁵ は、C₁ ~ 4 アルキル、C₃ ~ 6 シクロアルキル、ヘテロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；

ここで、ヘテロアルキルはピペリジニルであり；

アリールは、フェニルまたはナフタレニルであり；ここで、各アリールは、ハロ、ヒドロキシ、C₁ ~ 4 アルキル、C₁ ~ 4 アルキルオキシ、C₁ ~ 4 アルキルチオ、ポリハロ C₁ ~ 4 アルキル、ポリハロ C₁ ~ 4 アルキルオキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、o - もしくはジ (C₁ ~ 4 アルキル) アミノ、C₁ ~ 4 アルキルカルボニルまたは C₁ ~ 4 アルキル (SO₂) - NH - から各々独立して選択された 1 つまたは 2 つの置換基で置換されている；

ヘテロアリールは、フラニル、チオフェニル、ピラゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、2, 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1, 4] - ジオキシニル、ベンゾ [1, 3] ジオキソリル、1 - ベンゾフラニル、2, 3 - ジヒドロ - 1 - ベンゾフラニル、1 - ベンゾチオフェニル、1 - ベンゾピラゾリル、1, 3 - ベンゾチアゾリルまたはキノリニルであり；ここで、各ヘテロアリールは C₁ ~ 4 アルキル、C₁ ~ 4 アルキルオキシ、ヒドロキシ C₁ ~ 4 アルキル、シアノ C₁ ~ 4 アルキルもしくはポリハロ C₁ ~ 4 アルキルまたは C₁ ~ 4 アルキルオキシ C₁ ~ 4 アルキルから各々独立して選択される 1 つまたは 2 つの置換基で置換されている（もよい）、

またはその薬学的に許容される酸付加塩。

[2]

[1] に記載の化合物であって、式中

X および Y は、C R⁶ または N から各々独立して選択され、ここで、R⁶ は水素であり；

R¹ および R² は、水素、ハロ、ヒドロキシ、C₁ ~ 4 アルキルまたは C₁ ~ 4 アルキルオキシから各々独立して選択され；

R³ は、水素または C₁ ~ 6 アルキルであり；

R⁴ は、水素であり；

L¹ は、直接結合；酸素；C₁ ~ 4 アルカンジイル；またはヒドロキシ、フェニルもしくは C₁ ~ 4 アルキルオキシで置換されたフェニルから各々独立して選択された 1 つまたは 2 つの置換基で置換された C₁ ~ 4 アルカンジイルであり；

L² は、直接結合、フェニル、ピペラジンまたはヒドロキシで置換されたピペラジンであり；および

R⁵ は、C₁ ~ 4 アルキル、C₃ ~ 6 シクロアルキル、ヘテロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり；

ここで、ヘテロアルキルはピペリジニルであり；

アリールは、フェニルまたはナフタレニルであり；ここで、各アリールは、ハロ、ヒドロキシ、C₁ ~ 4 アルキル、C₁ ~ 4 アルキルオキシ、C₁ ~ 4 アルキルチオ、ポリハロ C₁ ~ 4 アルキル、ポリハロ C₁ ~ 4 アルキルオキシ、シアノ、ジ (C₁ ~ 4 アルキル) -

アミノ、 $C_1 \sim 4$ アルキルカルボニルまたは $C_1 \sim 4$ アルキル (SO_2) - NH - から各々独立して選択された 1 つまたは 2 つの置換基で置換されていてもよく；
 ヘテロアリールは、フラニル、ピリジニル、2, 3 - ジヒドロ - ベンゾ [1 , 4] ジオキシニル、ベンゾ [1 , 3] ジオキソリル、1 - ベンゾフラニル、2, 3 - ジヒドロ - 1 - ベンゾフラニル、1 - ベンゾチオフェニル、1 - ベンゾピラゾリル、1, 3 - ベンゾチアゾリルまたはキノリニルであり；ここで、各ヘテロアリールは $C_1 \sim 4$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ アルキルオキシ、ヒドロキシ $C_1 \sim 4$ アルキル、シアノ $C_1 \sim 4$ アルキルもしくはボリハロ $C_1 \sim 4$ アルキルまたは $C_1 \sim 4$ アルキルオキシ $C_1 \sim 4$ アルキルから各々独立して選択される 1 つまたは 2 つの置換基で置換されていてもよい、化合物、
 またはその薬学的に許容される酸付加塩。

[3]

X は N であり、Y は N である、[1] に記載の化合物。

[4]

X は N であり、Y は CR^6 であり、ここで、 R^6 は水素である、[1] に記載の化合物

。

[5]

X は CR^6 であり、ここで、 R^6 は水素であり、Y は N である、[1] に記載の化合物

。

[6]

X は CR^6 であり、ここで、 R^6 は水素であり、Y は CR^6 であり、ここで、 R^6 は水素である、[1] に記載の化合物。

[7]

X は CR^6 であり、ここで、 R^6 は水素であり、Y は N であり、 L^1 は直接結合であり、 L^2 は直接結合である、[1] に記載の化合物。

[8]

X は N であり、Y は N であり、 L^1 は直接結合であり、 L^2 は直接結合である、[1] に記載の化合物。

[9]

X は CR^6 であり、ここで、 R^6 は水素であり、Y は N であり、 L^1 は直接結合であり、 L^2 は直接結合であり、 R^5 はアリールである、[1] に記載の化合物。

[10]

X は N であり、Y は N であり、 L^1 は直接結合であり、 L^2 は直接結合であり、 R^5 はアリールである、[1] に記載の化合物。

[11]

薬学的に許容される担体および治療有効量の [1] ~ [10] のいずれか一項に記載の化合物を含む医薬組成物。

[12]

治療有効量の [1] ~ [10] のいずれか一項に記載の化合物が薬学的に許容される担体と均質混合される、[11] に記載の医薬組成物を調製する方法。

[13]

医薬品として使用するための、[1] ~ [10] のいずれか一項に記載の化合物。

[14]

RS (呼吸器合胞体) ウイルス感染症の治療において使用するための、[1] ~ [10] のいずれか一項に記載の化合物または [11] に記載の医薬組成物。