

【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 07D 213/74 (2006.01)

C 07D 241/20 (2006.01)

C 07D 407/14 (2006.01)

C 07D 409/14 (2006.01)

C 07D 401/14 (2006.01)

C 07D 417/14 (2006.01)

C 07D 417/12 (2006.01)

A 61K 31/497 (2006.01)

A 61K 31/496 (2006.01)

A 61P 11/00 (2006.01)

A 61P 31/14 (2006.01)

【F I】

C 07D 213/74

C 07D 241/20 C S P

C 07D 407/14

C 07D 409/14

C 07D 401/14

C 07D 417/14

C 07D 417/12

A 61K 31/497

A 61K 31/496

A 61P 11/00

A 61P 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

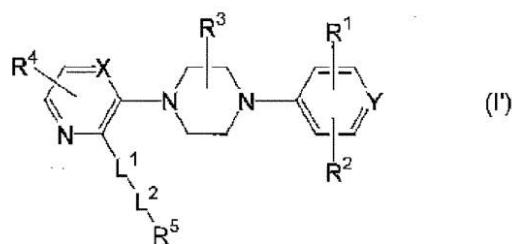
【補正の内容】

【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ンイルである；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、C₁～₄アルキルカルボニルまたはC₁～₄アルキル（S O₂）-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 R 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、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、L ¹ は直接結合であり、L ² 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 R 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、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、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、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】

R S (呼吸器合胞体) ウィ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】0 1 3 3

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 3 3】

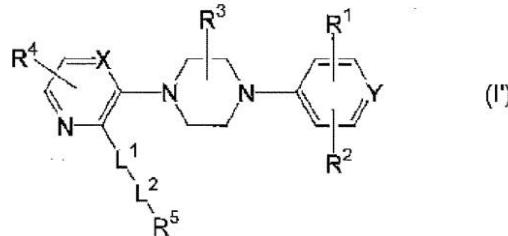
穏当な変動は、本発明の範囲からの逸脱とみなすべきではない。このように記載した本発明は、当業者によって多数の方法で変更されてよいことは明白であろう。

本発明は、以下の態様を含む。

[1]

式 (I') の化合物であって、

【化 5 7】



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 R ⁶ または N から選択され、ここで、R ⁶ は、水素、ハロ、ヒドロキシ、C _{1 ~ 4} アルキル、C _{1 ~ 4} アルキルオキシ、シアノ、ポリハロ C _{1 ~ 4}

アルキル、ポリハロ C_{1-4} アルキルオキシ、ニトロ、アミノ、モノ - もしくはジ (C_{1-4} アルキル) アミノまたは C_{1-4} アルキルカルボニルであり；

R^1 および R^2 は、各々独立して水素、ハロ、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルキルオキシ、ポリハロ C_{1-4} アルキル、ポリハロ C_{1-4} アルキルオキシ、シアノ、ニトロまたは C_{1-4} アルキルカルボニルから選択され；

R^3 は、水素または C_{1-6} アルキルであり；

R^4 は、水素、ハロ、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルキルオキシ、ポリハロ C_{1-4} アルキル、ポリハロ C_{1-4} アルキルオキシ、シアノ、ニトロまたは C_{1-4} アルキルカルボニルであり；

L^1 は、直接結合；酸素； C_{1-4} アルカンジイル；またはヒドロキシ、フェニルもしくは C_{1-4} 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 C_{1-4} アルカンジイルであり；

L^2 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

R^5 は、 C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} 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、ヘテロアルキルはビペリジニルであり；

アリールは、フェニルまたはナフタレンイルであり；ここで、各アリールは、ハロ、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルキルオキシ、 C_{1-4} アルキルチオ、ポリハロ C_{1-4} アルキル、ポリハロ C_{1-4} アルキルオキシ、シアノ、ニトロ、アミノ、 O - もしくはジ (C_{1-4} アルキル) アミノ、 C_{1-4} アルキルカルボニルまたは C_{1-4} 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よく；

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 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルキルオキシ、ヒドロキシ C_{1-4} アルキル、シアノ C_{1-4} アルキルもしくはポリハロ C_{1-4} アルキルまたは C_{1-4} アルキルオキシ C_{1-4} 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、 CR^6 または N から各々独立して選択され、ここで、 R^6 は水素であり；

R^1 および R^2 は、水素、ハロ、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキルまたは C_{1-4} アルキルオキシから各々独立して選択され；

R^3 は、水素または C_{1-6} アルキルであり；

R^4 は、水素であり；

L^1 は、直接結合；酸素； C_{1-4} アルカンジイル；またはヒドロキシ、フェニルもしくは C_{1-4} 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 C_{1-4} アルカンジイルであり；

L^2 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

R^5 は、 C_{1-4} アルキル、 C_{3-6} 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、ヘテロアルキルはビペリジニルであり；

アリールは、フェニルまたはナフタレンイルであり；ここで、各アリールは、ハロ、ヒドロキシ、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルキルオキシ、 C_{1-4} アルキルチオ、ポリハロ C_{1-4} アルキル、ポリハロ C_{1-4} アルキルオキシ、シアノ、ジ (C_{1-4} 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い；
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、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CR⁶であり、ここで、R⁶は水素である、[1]に記載の化合物。

。

[5]

XはCR⁶であり、ここで、R⁶は水素であり、YはNである、[1]に記載の化合物。

。

[6]

XはCR⁶であり、ここで、R⁶は水素であり、YはCR⁶であり、ここで、R⁶は水素である、[1]に記載の化合物。

[7]

XはCR⁶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、[1]に記載の化合物。

[8]

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、[1]に記載の化合物。

[9]

XはCR⁶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、[1]に記載の化合物。

[10]

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、[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。