

【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22年3月25日(2010.3.25)

【公表番号】特表2009-528989(P2009-528989A)

【公表日】平成21年8月13日(2009.8.13)

【年通号数】公開・登録公報2009-032

【出願番号】特願2008-554875(P2008-554875)

【国際特許分類】

C 07 D 471/04	(2006.01)
A 61 K 31/437	(2006.01)
A 61 K 31/497	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 K 31/444	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
A 61 K 31/501	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 31/12	(2006.01)
A 61 P 31/22	(2006.01)
A 61 P 31/14	(2006.01)
A 61 P 31/20	(2006.01)

【F I】

C 07 D 471/04	107 E
C 07 D 471/04	C S P
A 61 K 31/437	
A 61 K 31/497	
A 61 K 31/5377	
A 61 K 31/444	
A 61 K 31/506	
A 61 K 31/496	
A 61 K 31/501	
A 61 P 43/00	111
A 61 P 31/12	
A 61 P 31/22	
A 61 P 31/14	
A 61 P 31/20	

【手続補正書】

【提出日】平成22年2月2日(2010.2.2)

【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

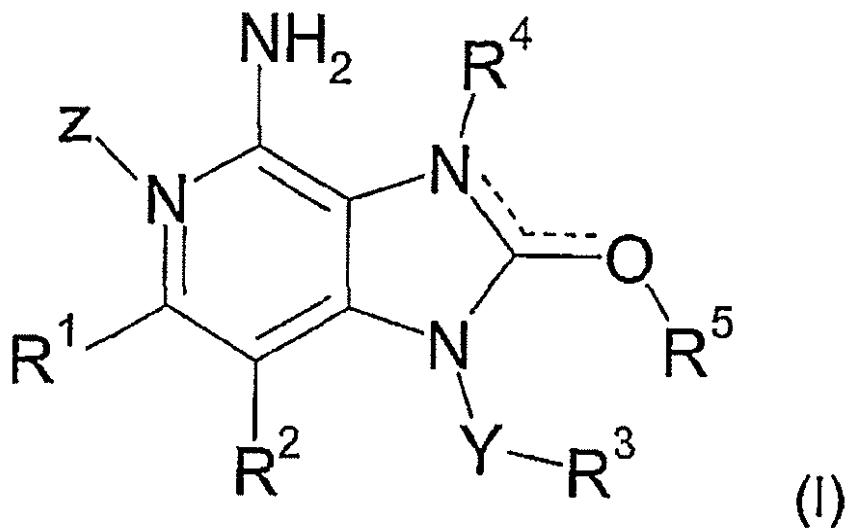
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物または前記化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物

【化1】



[式中、

(a) Yは、直接結合であり、R³は、アリール、(C₁~C₆)アルキルおよび-(C₁~C₄)アルキレン-O-(C₁~C₄)アルキルから選択されるか、

(b) Yは、(C₁~C₄)アルキレンであり、R³は、アリール、(C₃~C₇)シクロアルキルおよび3員から10員のヘテロシクリルから選択され、

Zは、酸素であるか、存在せず、

R¹は、H、ハロ、OH、CN、(C₁~C₆)アルキル、(C₃~C₇)シクロアルキル、(C₁~C₆)アルコキシ、-NHSO₂R⁶、-NR⁶R⁷、-C(O)R⁶、-CO₂R⁶、-C(O)NR⁶R⁷、-C(O)NR⁶SO₂R⁸、アリールおよび3員から10員のヘテロシクリルから選択され、

R²は、H、ハロ、OH、(C₁~C₆)アルキル、(C₃~C₇)シクロアルキル、(C₁~C₆)アルコキシ、-NR⁶R⁷、-CO₂R⁶、-C(O)NR⁶R⁷、-C(O)NR⁶SO₂R⁸および3員から10員のヘテロシクリルから選択されるか、

R¹およびR²は一緒になって、(C₂~C₅)アルキレン結合を形成してよく、前記結合には、N、OおよびSからそれぞれ独立に選択される1または2個のヘテロ原子が導入されていてもよく、

R⁵は存在せず、R⁴は、H、(C₃~C₇)シクロアルキル、アリール、-(CH₂)アリール、-C(O)R⁹、-CO₂R⁹、-(C₁~C₆)アルキレン-O-C(O)R⁹、-(C₁~C₆)アルキレン-O-CO₂R⁹、-C(O)NR⁹R¹⁰、-(C₁~C₆)アルキレン-O-C(O)NR⁹R¹⁰および-(C₁~C₆)アルキレン-O-P(O)(OH)₂から選択されるか、

R⁴は存在せず、R⁵は、R⁹、-C(O)R⁹、-CO₂R⁹、-(C₁~C₆)アルキレン-O-C(O)R⁹、-(C₁~C₆)アルキレン-O-CO₂R⁹、-C(O)NR⁹R¹⁰、-(C₁~C₆)アルキレン-O-C(O)NR⁹R¹⁰および-(C₁~C₆)アルキレン-O-P(O)(OH)₂から選択され、

R⁶およびR⁷はそれぞれ独立に、H、(C₁~C₆)アルキル、(C₃~C₇)シクロアルキルおよび-(C₁~C₆)アルキレン(C₃~C₇)シクロアルキルから選択されるか、R⁶およびR⁷はそれらが結合している窒素と一緒に、N、OおよびSから選択されるさらなる1または2個のヘテロ原子を含有していてよい3員から6員の飽和複素環を形成し、

R⁸は、(C₁~C₆)アルキル、(C₃~C₇)シクロアルキルおよびフェニルから選択され、

R^9 および R^{10} はそれぞれ独立に、H、(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₃ ~ C₇)シクロアルキル、アリール、-(CH₂)アリールおよび3員から10員のヘテロシクリルから選択されるか、 R^9 および R^{10} は、それらが結合している窒素と一緒にになって、3員から10員のヘテロシクリル基を形成し、

R^{11} および R^{12} は独立に、Hおよび(C₁ ~ C₆)アルキルから選択されるか、 R^{11} および R^{12} はそれらが結合しているNと一緒に、N、OおよびSから選択されるさなる1または2個のヘテロ原子を含有していてもよい3員から6員の飽和ヘテロシクリルを形成し、

ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールおよびヘテロシクリル基は、ハロ、OH、オキソ、CF₃、CN、(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₃ ~ C₇)シクロアルキル、(C₁ ~ C₆)アルコキシ、-(C₁ ~ C₆)アルキレン-O-(C₁ ~ C₆)アルキル、-(C₁ ~ C₆)アルキレン-OH、-NR¹¹R¹²、-(C₁ ~ C₆)アルキレン-NR¹¹R¹²、アリールおよび3員から10員のヘテロシクリルから独立に選択される1個または複数の原子または基により置換されていてもよく、

ただし、 R^1 および R^2 がHであり、ZおよびR⁵ が存在しない場合、

(a) Y-R³ がエチルであるときには、R⁴ はメチルではなく、

(b) Y-R³ がメチルであるときには、R⁴ はHまたはメチルではない]。

【請求項2】

R¹ が、

(a) H、

(b) CN、

(c) ハロ、

(d) 1から3個のハロ原子により置換されていてもよい(C₁ ~ C₆)アルキル、

(e) テトラヒドロフラノキシ、

(f) N、OおよびSから独立に選択される1から3個のヘテロ原子を含有する3員から6員の飽和ヘテロシクリルにより置換されている(C₁ ~ C₆)アルキル(ここで、前記ヘテロシクリルは、CF₃、(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₁ ~ C₆)アルコキシおよび-(C₁ ~ C₆)アルキレン-O-(C₁ ~ C₆)アルキルから独立に選択される1から3個の基により置換されていてもよい)、

(g) -(C₁ ~ C₄)アルキレン-O-(C₁ ~ C₆)アルキル、

(h) -(C₁ ~ C₄)アルキレン-N(H)-(C₁ ~ C₄)アルキレン-O-(C₁ ~ C₄)アルキル、

(i) OHまたはシクロプロピルにより置換されていてもよい(C₁ ~ C₆)アルコキシ、

(j) (C₃ ~ C₇)シクロアルキル、

(k) -(C₁ ~ C₄)アルキレン(C₃ ~ C₇)シクロアルキル、

(l) -C(O)NR⁶R⁷、

(m) -CO₂R⁶、

(n) -C(O)R⁶、

(o) (i) 1から4個の窒素原子または(i) 1から2個の窒素原子および1個の酸素もしくはイオウ原子または(i) 1個の酸素もしくはイオウ原子を含む5員の芳香族ヘテロシクリル、または1から3個の窒素原子を含む6員の芳香族ヘテロシクリル(ここで、前記5員および6員の芳香族ヘテロシクリルは、ハロ、OH、CF₃、(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₁ ~ C₆)アルコキシ、-(C₁ ~ C₆)アルキレン-O-(C₁ ~ C₆)アルキル、-(C₁ ~ C₆)アルキレン-OH、-NR¹¹R¹² および-(C₁ ~ C₆)アルキレン-NR¹¹R¹² から独立に選択される1から3個の原子または基により置換されていてもよい)、

(p) 1から3個のハロ原子により置換されていてもよいフェニル、

(q) -NR⁶R⁷、

(r) -NH-(C₁ ~ C₄)アルキレン-O-(C₁ ~ C₆)アルキル

(ここで、R⁶、R⁷、R^{1~1}およびR^{1~2}は、請求項1においてと同様に定義される)から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R¹が、
 (a) H、
 (b) CN、
 (c) ハロ、
 (d) 1から3個のハロ原子により置換されていてもよい(C₁~C₆)アルキル、
 (e) テトラヒドロフラノキシ、
 (f) 1または2個のメチル基により置換されていてもよいモルホリン、ピペラジンまたはピロロジンにより置換されている(C₁~C₆)アルキル、
 (h) -(C₁~C₄)アルキレン-N(H)-(C₁~C₄)アルキレン-O-(C₁~C₄)アルキル、
 (i) OHまたはシクロプロピルにより置換されていてもよい(C₁~C₆)アルコキシ、
 (j) (C₃~C₇)シクロアルキル、
 (k) -(C₁~C₄)アルキレン(C₃~C₇)シクロアルキル、
 (l) -C(O)NR⁶R⁷、
 (m) -CO₂R⁶、
 (n) -C(O)R⁶、
 (o) (i) 1から4個の窒素原子または(iii) 1から2個の窒素原子および1個の酸素もしくはイオウ原子または(iii) 1個の酸素もしくはイオウ原子を含む5員の芳香族ヘテロシクリル、または1から3個の窒素原子を含む6員の芳香族ヘテロシクリル(ここで、前記5員および6員の芳香族ヘテロシクリルは、ハロ、OH、CF₃、(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルコキシ、-(C₁~C₆)アルキレン-O-(C₁~C₆)アルキル、-(C₁~C₆)アルキレン-OH、-NR^{1~1}R^{1~2}および-(C₁~C₆)アルキレン-NR^{1~1}R^{1~2}から独立に選択される1から3個の原子または基により置換されていてもよい)、
 (p) 1から3個のハロ原子により置換されていてもよいフェニル、
 (q) -NR⁶R⁷、
 (r) -NH-(C₁~C₄)アルキレン-O-(C₁~C₆)アルキル
 (ここで、R⁶、R⁷、R^{1~1}およびR^{1~2}は、請求項1においてと同様に定義される)から選択される、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

R¹が、1から3個のフルオロ原子により置換されているメチルまたはエチル、シクロプロピル、-(C₁~C₂)アルキレン-O-(C₁~C₂)アルキル、OHまたはシクロプロピルで置換されていてもよい(C₁~C₄)アルコキシ、-COCH₃、-CH₂OCH₃および-CO₂CH₃から選択される、請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項5】

前記R¹が、シクロプロピルまたはCF₃である、請求項1から4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

R¹が、(i) 1から4個の窒素原子または(ii) 1から2個の窒素原子および1個の酸素もしくはイオウ原子または(iii) 1個の酸素もしくはイオウ原子を含む5員の芳香族ヘテロシクリルであり、ここで、前記5員の芳香族ヘテロシクリルは、ハロ、OH、CF₃、(C₁~C₆)アルキル、(C₁~C₆)アルコキシ、-(C₁~C₃)アルキレン-O-(C₁~C₄)アルキル、-(C₁~C₄)アルキレン-OH、-NR^{1~1}R^{1~2}および-(C₁~C₃)アルキレン-NR^{1~1}R^{1~2}から独立に選択される1から3個の原子または基により置換されていてもよく、R^{1~1}およびR^{1~2}が請求項1におい

てと同様に定義される、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

前記 R¹ が、全てハロ、OH、CF₃、(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₁ ~ C₆)アルコキシ、-(C₁ ~ C₃)アルキレン-O-(C₁ ~ C₄)アルキル、-(C₁ ~ C₄)アルキレン-OH および -(C₁ ~ C₃)アルキレン-NR¹R² から独立に選択される 1 から 3 個の原子または基により置換されていてもよいイマダゾリル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾール、ピラゾールおよびチアゾールから選択され、ここで、R¹ および R² が請求項 1 においてと同様に定義される、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

前記 R¹ が、非置換オキサゾリル、トリアゾール、ピラゾールおよびチアゾールから選択される、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

前記 R¹ がオキサゾリルである、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

R² が、

(a) H、

(b) ハロ、

(c) 1 から 3 個のハロ原子により置換されていてもよい(C₁ ~ C₆)アルキル、

(d) テトラヒドロフラノキシ、

(e) N、O および S から独立に選択される 1 から 3 個のヘテロ原子を含有する 3 員から 6 員の飽和ヘテロシクリルにより置換されている(C₁ ~ C₆)アルキル(ここで、前記ヘテロシクリルは、CF₃、(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₁ ~ C₆)アルコキシおよび-(C₁ ~ C₆)アルキレン-O-(C₁ ~ C₆)アルキルから独立に選択される 1 から 3 個の基により置換されていてもよい)、

(f) -(C₁ ~ C₄)アルキレン-O-(C₁ ~ C₆)アルキル、

(g) -(C₁ ~ C₄)アルキレン-N(H)-(C₁ ~ C₄)アルキレン-O-(C₁ ~ C₄)アルキル、

(h) OH またはシクロプロピルにより置換されていてもよい(C₁ ~ C₆)アルコキシ、

(i) (C₃ ~ C₇)シクロアルキル、

(j) -(C₁ ~ C₄)アルキレン(C₃ ~ C₇)シクロアルキル、

(k) -C(O)NR⁶R⁷、

(l) -CO₂R⁶、

(m) -C(O)R⁶、

(n) (i) 1 から 4 個の窒素原子または (ii) 1 から 2 個の窒素原子および 1 個の酸素もしくはイオウ原子または (iii) 1 個の酸素もしくはイオウ原子を含む 5 員の芳香族ヘテロシクリルか、または 1 から 3 個の窒素原子を含む 6 員の芳香族ヘテロシクリル(ここで、前記 5 員および 6 員の芳香族ヘテロシクリルは、ハロ、OH、CF₃、(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₁ ~ C₆)アルコキシ、-(C₁ ~ C₆)アルキレン-O-(C₁ ~ C₆)アルキル、-(C₁ ~ C₆)アルキレン-OH、-NR¹R² および-(C₁ ~ C₆)アルキレン-NR¹R² から独立に選択される 1 から 3 個の原子または基により置換されていてもよい)、

(o) 1 から 3 個のハロ原子により置換されていてもよいフェニル、

(p) -NR⁶R⁷、

(q) -NH-(C₁ ~ C₄)アルキレン-O-(C₁ ~ C₆)アルキル

(ここで、R⁶、R⁷、R¹ および R² は請求項 1 においてと同様に定義される)

から選択される、請求項 1 から 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 11】

R² が H またはメチルである、請求項 1 から 10 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 2】

R^2 が H である、請求項 1 から 1 1 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 3】

Z が存在しない、請求項 1 から 1 2 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 4】

Y がメチレンであり、 R^3 が、アリール、(i) 1 から 4 個の窒素原子または(ii) 1 から 2 個の窒素原子および 1 個の酸素もしくはイオウ原子または(iii) 1 個の酸素もしくはイオウ原子を含む 5 員の芳香族ヘテロシクリルならびに 1 から 3 個の窒素原子を含む 6 員の芳香族ヘテロシクリルから選択され、前記アリールおよび芳香族ヘテロシクリルは、ハロ、OH、オキソ、CF₃、CN、(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₃ ~ C₇)シクロアルキル、(C₁ ~ C₆)アルコキシ、-(C₁ ~ C₆)アルキレン-O-(C₁ ~ C₆)アルキル、-(C₁ ~ C₆)アルキレン-OH、-NR^{1 1}R^{1 2}、-(C₁ ~ C₆)アルキレン-NR^{1 1}R^{1 2}、アリールおよび 3 員から 10 員のヘテロシクリルから独立に選択される 1 から 3 個の原子または基により置換されていてもよく、ここで、R^{1 1} および R^{1 2} は、請求項 1 においてと同様に定義される、請求項 1 から 1 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 5】

Y がメチレンであり、 R^3 が、ハロ、(C₁ ~ C₄)アルキル、(C₁ ~ C₄)アルコキシおよび CF₃ から独立に選択される 1 から 3 個の原子または基によりそれぞれ置換されていてもよいフェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリジジニルおよびピラジニルから選択される、請求項 1 から 1 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 6】

Y がメチレンであり、 R^3 が、フェニル、ピリジン-3-イルおよび 6 - メチル - ピリジン-3-イルから選択される、請求項 1 から 1 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 7】

R^5 が存在せず、 R^4 が、-(C₁ ~ C₆)アルキレン-O-C(O)R⁹、-(C₁ ~ C₆)アルキレン-O-CO₂R⁹、-(C₁ ~ C₆)アルキレン-O-C(O)NR⁹R^{1 0} および -(C₁ ~ C₆)アルキレン-O-P(O)(OH)₂ から選択され、ここで、R⁹ および R^{1 0} が請求項 1 においてと同様に定義される、請求項 1 から 1 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 8】

R^4 が H であり、 R^5 が存在しない、請求項 1 から 1 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 9】

R^4 が存在せず、 R^5 が、-(C₁ ~ C₆)アルキレン-O-C(O)R⁹、-(C₁ ~ C₆)アルキレン-O-CO₂R⁹、-(C₁ ~ C₆)アルキレン-O-C(O)NR⁹R^{1 0} および -(C₁ ~ C₆)アルキレン-O-P(O)(OH)₂ から選択され、ここで、R⁹ および R^{1 0} が請求項 1 においてと同様に定義される、請求項 1 から 1 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 0】

Y が、メチレンであり、

R^1 が、CF₃、シクロプロピルおよびオキサゾールから選択され、

R^2 が、H であり、

R^3 が、フェニル、ピリジン-3-イルおよび 6 - メチル - ピリジン-3-イルから選択され、

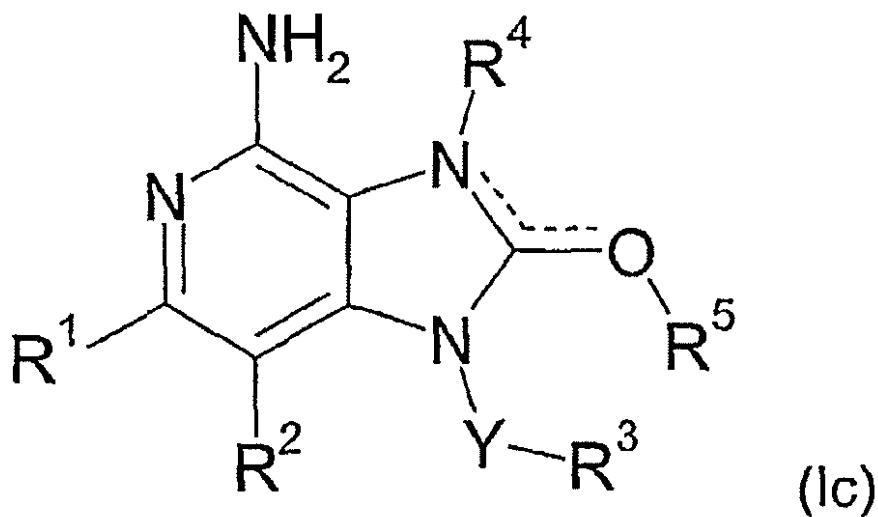
R^4 が、H であり、

R^5 が、存在しない、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 1】

式(Ic)の化合物もしくはその互変異性体または前記化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容できる塩、溶媒和物もしくは多形体

【化2】



[式中、

Yは、メチレンであり、

R¹およびR²はそれぞれ独立に、H、ハロ、OH、(C₁~C₆)アルキル、(C₃~C₇)シクロアルキル、(C₁~C₆)アルコキシ、-NR⁶R⁷、-CO₂R⁶、-C(O)NR⁶R⁷、-C(O)NR⁶SO₂R⁸、アリールおよび3員から10員のヘテロシクリルから選択されるか、

R¹およびR²は一緒にになって、(C₂~C₅)アルキレン結合を形成してよく、前記結合には、N、OおよびSからそれぞれ独立に選択される1または2個のヘテロ原子が導入されていてもよく、

R³は、(C₁~C₆)アルキル、(C₃~C₇)シクロアルキル、アリールおよび3員から10員のヘテロシクリルから選択され、

R⁴は、R⁹、-C(O)R⁹、-CO₂R⁹および-C(O)NR⁹R¹⁰から選択され、R⁵は存在しないか、

R⁵は、R⁹、-C(O)R⁹、-CO₂R⁹および-C(O)NR⁹R¹⁰から選択され、R⁴は存在せず、

R⁶およびR⁷はそれぞれ独立に、Hおよび(C₁~C₆)アルキルから選択され、

R⁸は、(C₁~C₆)アルキル、(C₃~C₇)シクロアルキルおよびフェニルから選択され、

R⁹およびR¹⁰はそれぞれ独立に、H、(C₁~C₆)アルキル、(C₃~C₇)シクロアルキル、アリール、-(CH₂)アリールおよび3員から10員のヘテロシクリルから選択されるか、

R⁹およびR¹⁰は、それらが結合している窒素と一緒に、3員から10員のヘテロシクリル基を形成し、

ここで、前記アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アリールおよびヘテロシクリル基は、ハロ、OH、オキソ、CF₃、CN、(C₁~C₆)アルキル、(C₃~C₇)シクロアルキル、(C₁~C₆)アルコキシ、-(C₁~C₆)アルキレン-O-(C₁~C₆)アルキル、-NH(C₁~C₆)アルキル、-N((C₁~C₆)アルキル)₂、アリールおよび3員から10員のヘテロシクリルから独立に選択される1個または複数の基により置換されていてもよく、

ただし、R¹およびR²がHであり、ZおよびR⁵が存在しない場合、

(a) Y-R³がエチルであるときには、R⁴はメチルではなく、

(b) Y-R³がメチルであるときには、R⁴はHまたはメチルではない]。

【請求項 2 2】

R^1 および R^2 がそれぞれ独立に、H、(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₃ ~ C₇)シクロアルキル、-CO₂H、-CO₂(C₁ ~ C₆)アルキルおよび-C(O)NH(C₁ ~ C₆)アルキレン(C₃ ~ C₇)シクロアルキルから選択されるか、R¹ および R² が一緒になって、(C₂ ~ C₅)アルキレン結合を形成してよい請求項 2 1 に記載の化合物。

【請求項 2 3】

R^1 が、H、メチル、n-プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、-CO₂H、-CO₂CH₃ および-C(O)NH(CH₂)シクロプロピルから選択され、R² が、H およびメチルから選択されるか、R¹ および R² が一緒になって、C₅-アルキレン結合を形成してよい、請求項 2 2 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

R^3 が、ハロ、OH、オキソ、CF₃、CN、(C₁ ~ C₆)アルキル、(C₃ ~ C₇)シクロアルキル、(C₁ ~ C₆)アルコキシ、(C₁ ~ C₆)アルコキシ(C₁ ~ C₆)アルキル、-NH(C₁ ~ C₆)アルキル、-N((C₁ ~ C₆)アルキル)₂、アリールおよび3員から10員のヘテロシクリルから独立に選択される1個または複数の基により置換されていてもよいアリールである、請求項 2 1 から 2 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 5】

R^3 が、ハロおよびCF₃ から独立に選択される1個または複数の基により置換されていてもよいフェニルである、請求項 2 4 に記載の化合物。

【請求項 2 6】

4-アミノ-1-ベンジル-6-シクロプロピル-1,3-ジヒドロ-イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-オン、
4-アミノ-1-ベンジル-6-オキサゾール-2-イル-1,3-ジヒドロ-イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-オンおよび
4-アミノ-1-ベンジル-6-トリフルオロメチル-1,3-ジヒドロ-イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-オン

または前記化合物の薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物から選択される、請求項 1 に記載の式(I)の化合物。

【請求項 2 7】

請求項 1 から 2 6 のいずれか一項に記載の式(I)の化合物または前記化合物の薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物を1種または複数の薬学的に許容できる賦形剤と共に含む医薬組成物。

【請求項 2 8】

1種または複数の追加の治療薬を包含する、請求項 2 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 9】

1種または複数の前記追加の治療活性薬が、HCVN S 3 A タンパク質、HCVN S 5 A タンパク質、HCVN S 4 B タンパク質、HCVN ポリメラーゼ、HCVN メタロプロテアーゼ、HCVN セリンプロテアーゼ、HCVN ヘリカーゼおよびp7タンパク質の阻害剤から選択される、請求項 2 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 0】

医薬品として使用するための請求項 1 から 2 6 のいずれか一項に記載の式(I)の化合物または前記化合物の薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物。

【請求項 3 1】

TLR 7 受容体の変調が関係している障害または状態を治療するための請求項 1 から 2 6 のいずれか一項に記載の式(I)の化合物または前記化合物の薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物。

【請求項 3 2】

前記障害または状態が、アデノウイルス、ヘルペスウイルス、ポックスウイルス、オル

トミクソウイルス、パラミクソウイルス、コロナウイルス、パポバウイルス、パピローマウイルス、ヘパドナウイルス、フラビウイルス、レトロウイルスおよびフィロウイルスから選択されるウイルス感染である、請求項31に記載の化合物。

【請求項33】

前記障害または状態がC型肝炎である、請求項31に記載の化合物。

【請求項34】

TLR7受容体の変調が関係している障害または状態を治療するための医薬品の調製における請求項1から26のいずれか一項に記載の式(I)の化合物または前記化合物の薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物の使用。

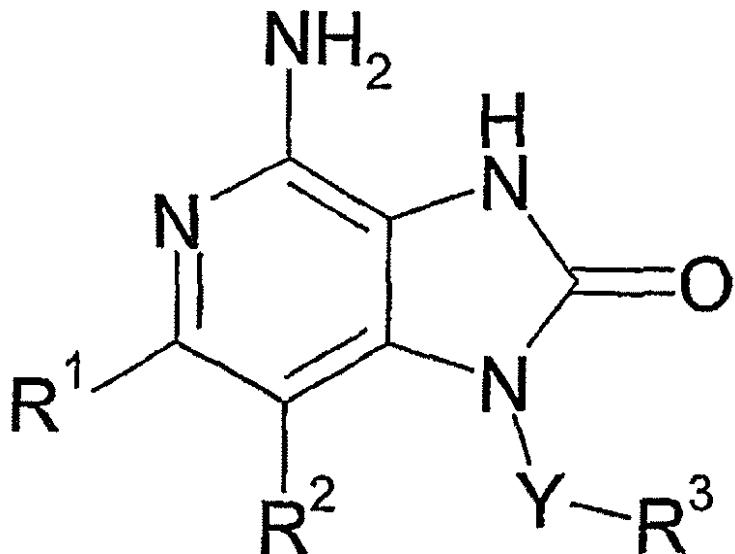
【請求項35】

哺乳動物において、TLR7受容体の変調が関係している障害または状態を治療するための、請求項1から26のいずれか一項に記載の式(I)の化合物または前記化合物の薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物を含む医薬組成物。

【請求項36】

式(I)の化合物

【化3】

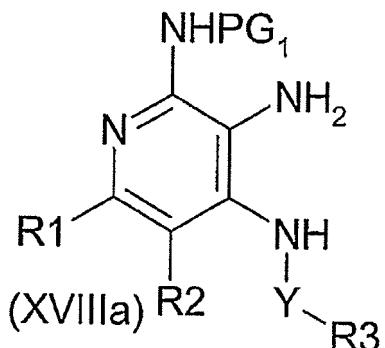
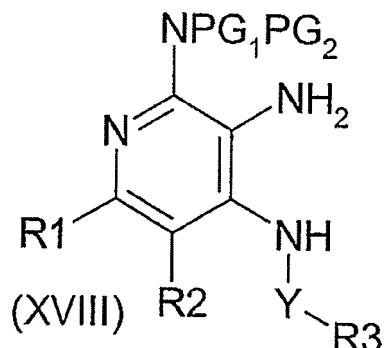


を調製する方法であって

[ここで、式I、XVIIII、XVIIIA、XIX、XIXa、XXa、XXb、XIV、XV、LIVおよびLXIIIIのそれぞれにおいて、 $\text{Y}-\text{R}^3$ は請求項14においてと同様に定義され、 R^1 は請求項2においてと同様に定義され、 R^2 は請求項10においてと同様に定義され、PG¹およびPG²は窒素保護剤であり、 R^{1-3} は(C₁₋₆)アルキルである]、

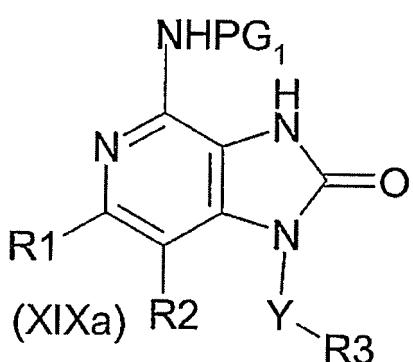
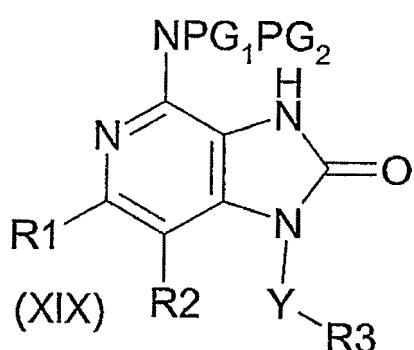
(a)式(XVIIII)または(XVIIIA)の化合物をカルボニル供与剤と反応させて、

【化 4】



対応する式 (XIX) または (XIXa) の化合物を形成し、

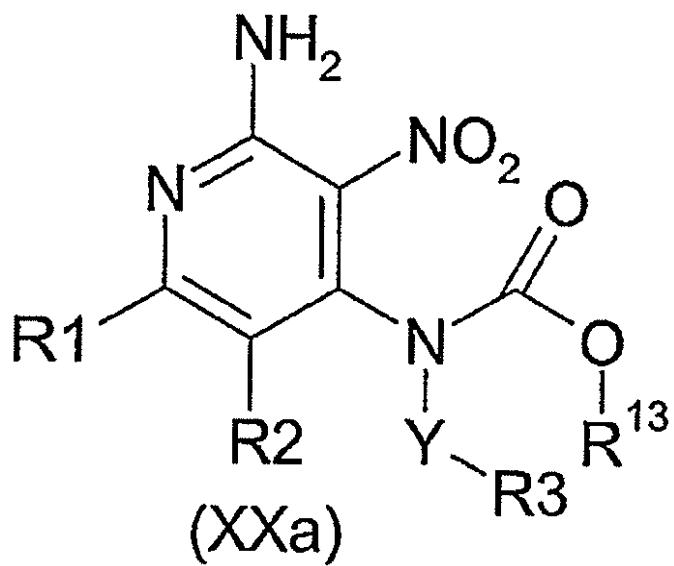
【化 5】



続いて、式(XIX)または(XIXa)の化合物を脱保護するか、

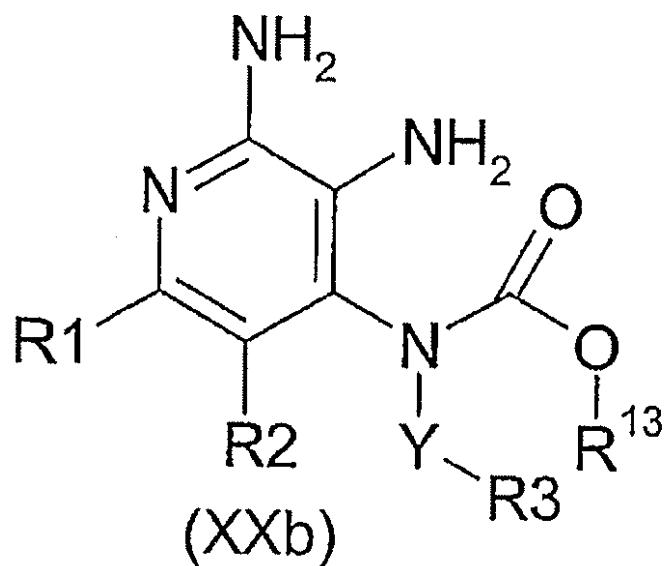
(b) 式 (X X a) の化合物を還元して、

【化 6】



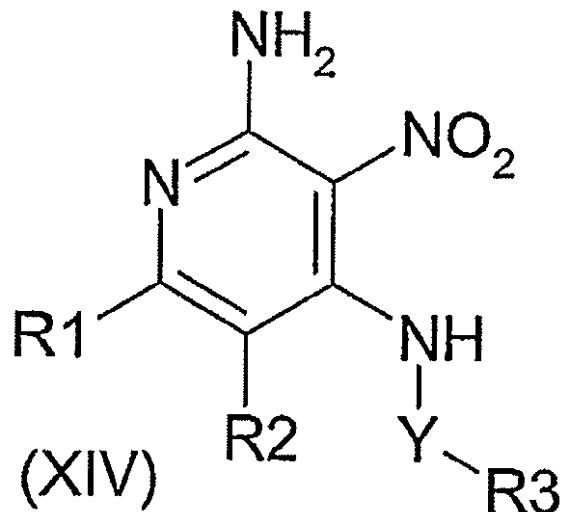
式 (X X b) の化合物を形成し、

【化7】



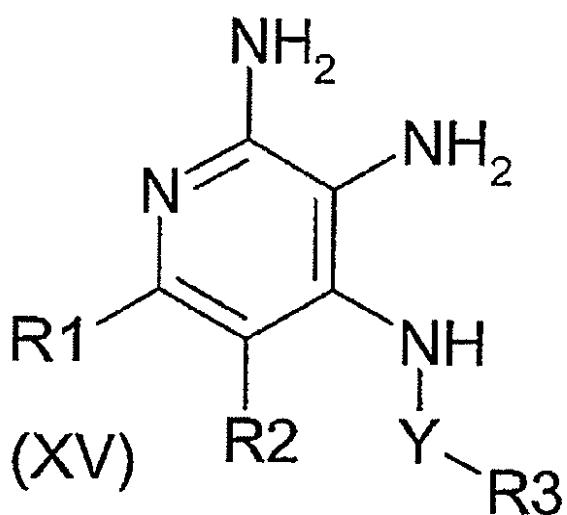
次いで、プロトン酸で処理することにより、式（XXb）の化合物を環化するか、
 (C) 式(XIV)の化合物を還元して、

【化8】



式(XV)の化合物を形成し、

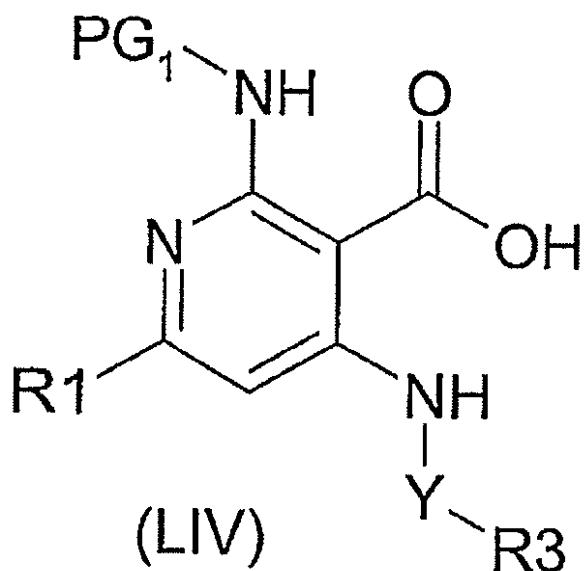
【化9】



次いで、カルボニル部分の存在下に、式(XV)の化合物を環化するか、

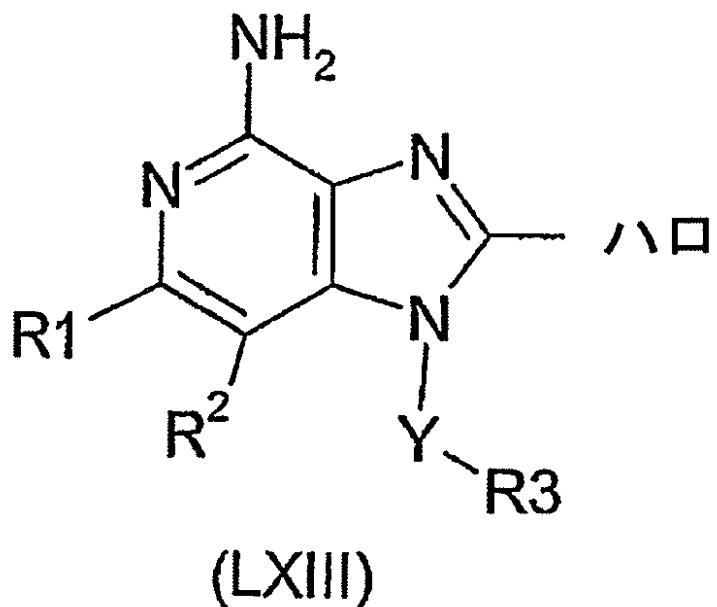
(e) アジ化ジフェニルホスホニルの存在下に、式(LIV)の化合物を環化して、前記の対応する式(XIXA)の化合物にし、続いて、アミノ保護基を脱保護するか、

【化10】



(f) 式(LXIII)の化合物を加水分解すること

【化 11】



を含む方法。