

【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 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/501 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/22 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

A 6 1 P 31/20 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 0 7 E

C 0 7 D 471/04 C S P

A 6 1 K 31/437

A 6 1 K 31/497

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/501

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 31/22

A 6 1 P 31/14

A 6 1 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

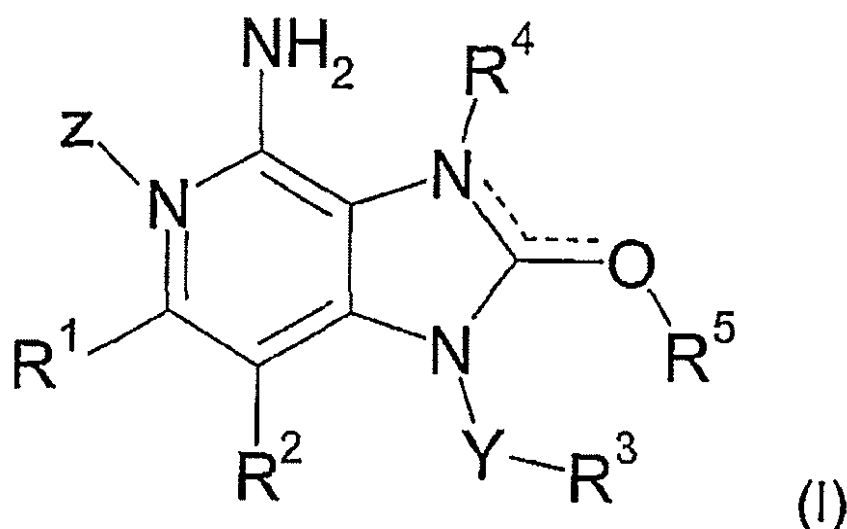
【補正の内容】

【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、 R^3 は、アリール、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルおよび - $(C_1 \sim C_4)$ アルキレン - O - $(C_1 \sim C_4)$ アルキルから選択されるか、

(b) Y は、 $(C_1 \sim 4)$ アルキレンであり、 R^3 は、アリール、 $(C_3 \sim C_7)$ 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、

R^1 は、H、ハロ、OH、CN、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、- $NHSO_2R^6$ 、- NR^6R^7 、- $C(O)R^6$ 、- CO_2R^6 、- $C(O)NR^6R^7$ 、- $C(O)NR^6SO_2R^8$ 、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、

R^2 は、H、ハロ、OH、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、- NR^6R^7 、- CO_2R^6 、- $C(O)NR^6R^7$ 、- $C(O)NR^6SO_2R^8$ 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^1 および R^2 は一緒になって、 $(C_2 \sim C_5)$ 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、

R^5 は存在せず、 R^4 は、H、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、アリール、- (CH_2) アリール、- $C(O)R^9$ 、- CO_2R^9 、- $(C_1 \sim C_6)$ アルキレン - O - $C(O)R^9$ 、- $(C_1 \sim C_6)$ アルキレン - O - CO_2R^9 、- $C(O)NR^9R^{10}$ 、- $(C_1 \sim C_6)$ アルキレン - O - $C(O)NR^9R^{10}$ および - $(C_1 \sim C_6)$ アルキレン - O - $P(O)(OH)_2$ から選択されるか、

R^4 は存在せず、 R^5 は、 R^9 、- $C(O)R^9$ 、- CO_2R^9 、- $(C_1 \sim C_6)$ アルキレン - O - $C(O)R^9$ 、- $(C_1 \sim C_6)$ アルキレン - O - CO_2R^9 、- $C(O)NR^9R^{10}$ 、- $(C_1 \sim C_6)$ アルキレン - O - $C(O)NR^9R^{10}$ および - $(C_1 \sim C_6)$ アルキレン - O - $P(O)(OH)_2$ から選択され、

R^6 および R^7 はそれぞれ独立に、H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルおよび - $(C_1 \sim C_6)$ アルキレン $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキルから選択されるか、 R^6 および R^7 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もよい 3 員から 6 員の飽和複素環を形成し、

R^8 は、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_3 \sim C_7)$ 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、($C_1 \sim C_6$) アルキル、($C_3 \sim C_7$) シクロアルキル、アリール、- (CH_2) 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、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($C_1 \sim C_6$) 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から選択されるさらなる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、 CF_3 、CN、($C_1 \sim C_6$) アルキル、($C_3 \sim C_7$) シクロアルキル、($C_1 \sim C_6$) アルコキシ、- ($C_1 \sim C_6$) アルキレン-O- ($C_1 \sim C_6$) アルキル、- ($C_1 \sim C_6$) アルキレン-OH、- $NR^{11}R^{12}$ 、- ($C_1 \sim C_6$) アルキレン- $NR^{11}R^{12}$ 、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 R^5 が存在しない場合、

(a) Y- R^3 がエチルであるときには、 R^4 はメチルではなく、

(b) Y- R^3 がメチルであるときには、 R^4 はHまたはメチルではない]。

【請求項2】

R^1 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($C_1 \sim C_6$) 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($C_1 \sim C_6$) アルキル(ここで、前記ヘテロシクリルは、 CF_3 、($C_1 \sim C_6$) アルキル、($C_1 \sim C_6$) アルコキシおよび- ($C_1 \sim C_6$) アルキレン-O- ($C_1 \sim C_6$) 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) - ($C_1 \sim C_4$) アルキレン-O- ($C_1 \sim C_6$) アルキル、

(h) - ($C_1 \sim C_4$) アルキレン-N(H)- ($C_1 \sim C_4$) アルキレン-O- ($C_1 \sim C_4$) 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($C_1 \sim C_6$) アルコキシ、

(j) ($C_3 \sim C_7$) シクロアルキル、

(k) - ($C_1 \sim C_4$) アルキレン($C_3 \sim C_7$) シクロアルキル、

(l) - $C(O)NR^6R^7$ 、

(m) - CO_2R^6 、

(n) - $C(O)R^6$ 、

(o) (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、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、 CF_3 、($C_1 \sim C_6$) アルキル、($C_1 \sim C_6$) アルコキシ、- ($C_1 \sim C_6$) アルキレン-O- ($C_1 \sim C_6$) アルキル、- ($C_1 \sim C_6$) アルキレン-OH、- $NR^{11}R^{12}$ および- ($C_1 \sim C_6$) アルキレン- $NR^{11}R^{12}$ 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) - NR^6R^7 、

(r) - NH - ($C_1 \sim C_4$) アルキレン-O- ($C_1 \sim C_6$) アルキル

(ここで、 R^6 、 R^7 、 R^{11} および R^{12} 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】

R^1 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($C_1 \sim C_6$)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($C_1 \sim C_6$)アルキル、
- (h) $-(C_1 \sim C_4)$ アルキレン-N(H)- $(C_1 \sim C_4)$ アルキレン-O- $(C_1 \sim C_4)$ 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($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、
- (j) ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル、
- (k) $-(C_1 \sim C_4)$ アルキレン($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル、
- (l) $-C(O)NR^6R^7$ 、
- (m) $-CO_2R^6$ 、
- (n) $-C(O)R^6$ 、
- (o) (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、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、 CF_3 、($C_1 \sim C_6$)アルキル、($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキレン-O- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_6)$ アルキレン-OH、 $-NR^{11}R^{12}$ および $-(C_1 \sim C_6)$ アルキレン- $-NR^{11}R^{12}$ 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) $-NR^6R^7$ 、
- (r) $-NH-(C_1 \sim C_4)$ アルキレン-O- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル

(ここで、 R^6 、 R^7 、 R^{11} および R^{12} 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】

R^1 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、 $-(C_1 \sim C_2)$ アルキレン-O- $(C_1 \sim C_2)$ 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($C_1 \sim C_4$)アルコキシ、 $-COCH_3$ 、 $-CH_2OCH_3$ および $-CO_2CH_3$ 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 R^1 が、シクロプロピルまたは CF_3 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】

R^1 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、 CF_3 、($C_1 \sim C_6$)アルキル、($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、 $-(C_1 \sim C_3)$ アルキレン-O- $(C_1 \sim C_4)$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_4)$ アルキレン-OH、 $-NR^{11}R^{12}$ および $-(C_1 \sim C_3)$ アルキレン- $-NR^{11}R^{12}$ 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^{11} および R^{12} 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 R^1 が、全てハロ、OH、 CF_3 、($C_1 \sim C_6$)アルキル、($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、-($C_1 \sim C_3$)アルキレン-O-($C_1 \sim C_4$)アルキル、-($C_1 \sim C_4$)アルキレン-OHおよび-($C_1 \sim C_3$)アルキレン- $NR^{11}R^{12}$ 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、 R^{11} および R^{12} 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 R^1 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 R^1 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】

R^2 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($C_1 \sim C_6$)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($C_1 \sim C_6$)アルキル(ここで、前記ヘテロシクリルは、 CF_3 、($C_1 \sim C_6$)アルキル、($C_1 \sim C_6$)アルコキシおよび-($C_1 \sim C_6$)アルキレン-O-($C_1 \sim C_6$)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) -($C_1 \sim C_4$)アルキレン-O-($C_1 \sim C_6$)アルキル、

(g) -($C_1 \sim C_4$)アルキレン-N(H)-($C_1 \sim C_4$)アルキレン-O-($C_1 \sim C_4$)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($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、

(i) ($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル、

(j) -($C_1 \sim C_4$)アルキレン($C_3 \sim C_7$)シクロアルキル、

(k) -C(O) NR^6R^7 、

(l) -CO₂ R^6 、

(m) -C(O) R^6 、

(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、 CF_3 、($C_1 \sim C_6$)アルキル、($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、-($C_1 \sim C_6$)アルキレン-O-($C_1 \sim C_6$)アルキル、-($C_1 \sim C_6$)アルキレン-OH、- $NR^{11}R^{12}$ および-($C_1 \sim C_6$)アルキレン- $NR^{11}R^{12}$ 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) - NR^6R^7 、

(q) -NH-($C_1 \sim C_4$)アルキレン-O-($C_1 \sim C_6$)アルキル

(ここで、 R^6 、 R^7 、 R^{11} および R^{12} 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】

R^2 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 12】

R^2 が H である、請求項 1 から 11 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 13】

Z が存在しない、請求項 1 から 12 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 14】

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、 CF_3 、CN、($C_1 \sim C_6$) アルキル、($C_3 \sim C_7$) シクロアルキル、($C_1 \sim C_6$) アルコキシ、-($C_1 \sim C_6$) アルキレン-O-($C_1 \sim C_6$) アルキル、-($C_1 \sim C_6$) アルキレン-OH、- $NR^{11}R^{12}$ 、-($C_1 \sim C_6$) アルキレン- $NR^{11}R^{12}$ 、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^{11} および R^{12} は、請求項 1 においてと同様に定義される、請求項 1 から 13 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 15】

Y がメチレンであり、 R^3 が、ハロ、($C_1 \sim 4$) アルキル、($C_1 \sim C_4$) アルコキシおよび CF_3 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、ピリジニルおよびピラジニルから選択される、請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 16】

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 15 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 17】

R^5 が存在せず、 R^4 が、-($C_1 \sim C_6$) アルキレン-O-C(O) R^9 、-($C_1 \sim C_6$) アルキレン-O-CO R^9 、-($C_1 \sim C_6$) アルキレン-O-C(O) NR^9R^{10} および -($C_1 \sim C_6$) アルキレン-O-P(O)(OH) $_2$ から選択され、ここで、 R^9 および R^{10} が請求項 1 においてと同様に定義される、請求項 1 から 16 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 18】

R^4 が H であり、 R^5 が存在しない、請求項 1 から 16 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 19】

R^4 が存在せず、 R^5 が、-($C_1 \sim C_6$) アルキレン-O-C(O) R^9 、-($C_1 \sim C_6$) アルキレン-O-CO R^9 、-($C_1 \sim C_6$) アルキレン-O-C(O) NR^9R^{10} および -($C_1 \sim C_6$) アルキレン-O-P(O)(OH) $_2$ から選択され、ここで、 R^9 および R^{10} が請求項 1 においてと同様に定義される、請求項 1 から 16 のいずれか一項に記載の化合物。

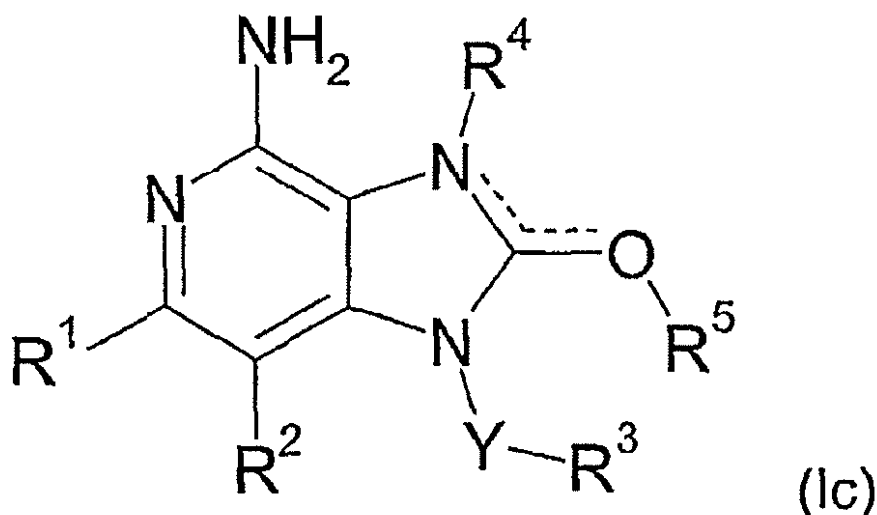
【請求項 20】

Y が、メチレンであり、
 R^1 が、 CF_3 、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 21】

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、アリーール、-(CH₂) アリーールおよび 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】

R¹ および R² 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】

R¹ 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】

R³ 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、アリアルおよび 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アルである、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】

R³ 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、HCV NS3A タンパク質、HCV NS5A タンパク質、HCV NS4B タンパク質、HCV ポリメラーゼ、HCV メタプロテアーゼ、HCV セリンプロテアーゼ、HCV 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】

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 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 3 1 に記載の化合物。

【請求項 3 3】

前記障害または状態が C 型肝炎である、請求項 3 1 に記載の化合物。

【請求項 3 4】

T L R 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医薬品の調製における請求項 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の使用。

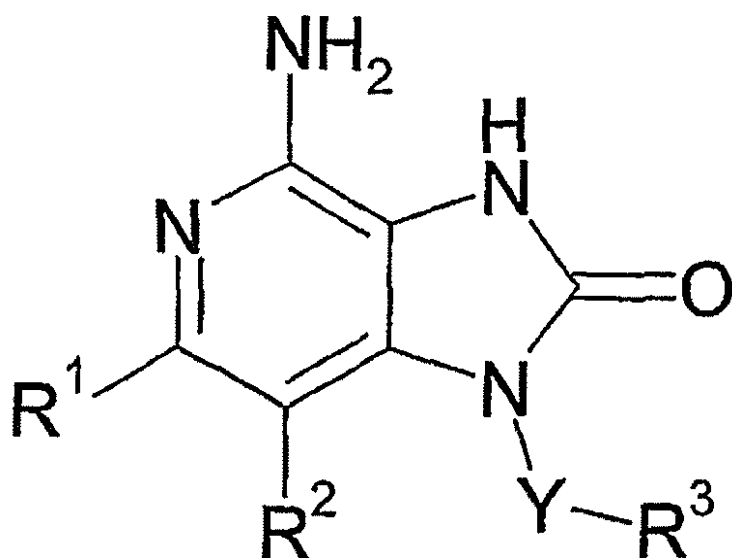
【請求項 3 5】

哺乳動物において、T L R 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を含む医薬組成物。

【請求項 3 6】

式 (I) の化合物

【化 3】

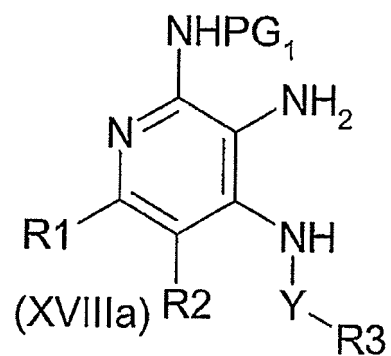
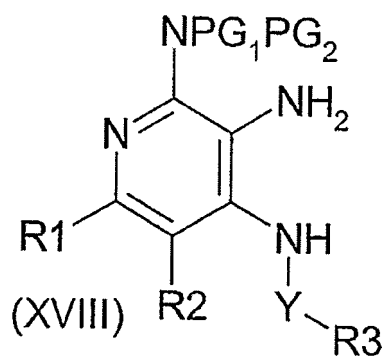


を調製する方法であって

[ここで、式 I、X V I I I、X V I I I a、X I X、X I X a、X X a、X X b、X I V、X V、L I V および L X I I I のそれぞれにおいて、Y - R³ は請求項 1 4 においてと同様に定義され、R¹ は請求項 2 においてと同様に定義され、R² は請求項 1 0 においてと同様に定義され、P G¹ および P G² は窒素保護剤であり、R^{1 3} は (C₁ - 6) アルキルである]、

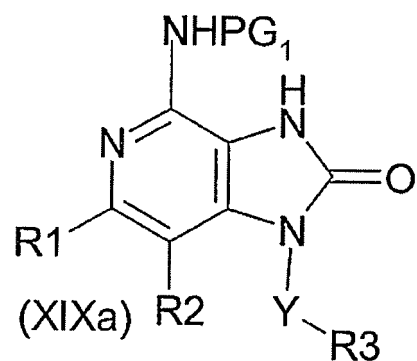
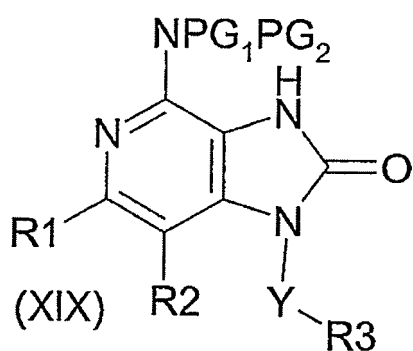
(a) 式 (X V I I I) または (X V I I I a) の化合物をカルボニル供与剤と反応させて、

【化 4】



対応する式 (XIX) または (XIXa) の化合物を形成し、

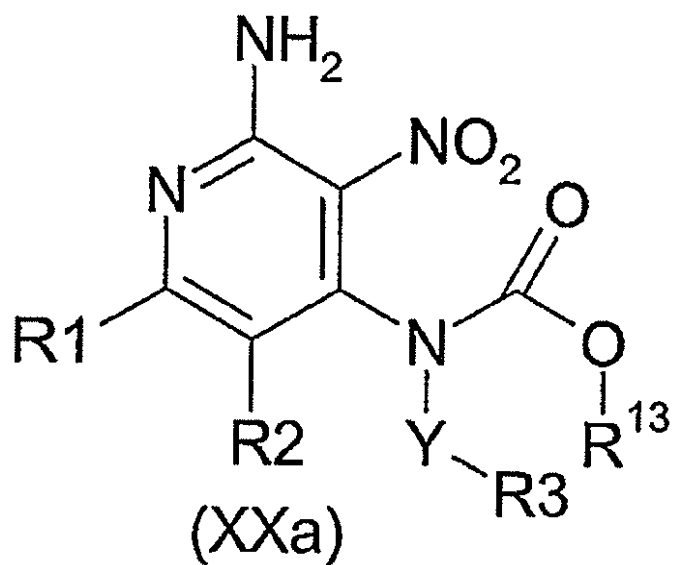
【化 5】



続いて、式 (XIX) または (XIXa) の化合物を脱保護するか、

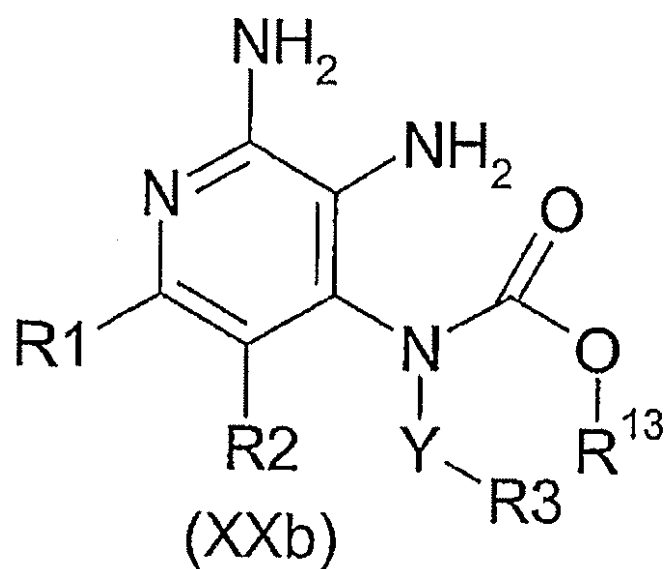
(b) 式 (XXa) の化合物を還元して、

【化 6】

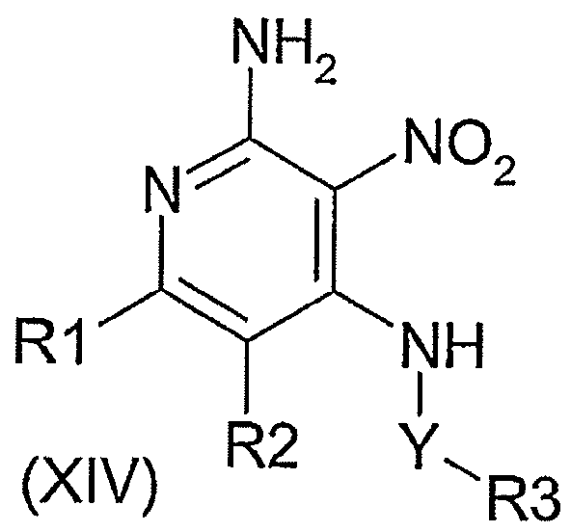


式 (XXb) の化合物を形成し、

【化 7】

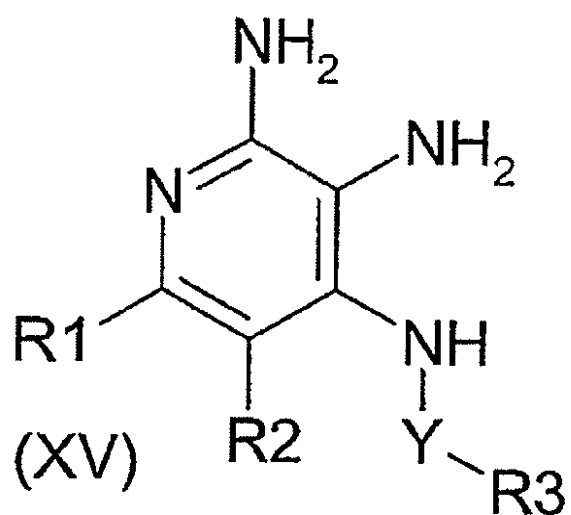


次いで、プロトン酸で処理することにより、式 (X X b) の化合物を環化するか、
 (C) 式 (X I V) の化合物を還元して、
 【化 8】



式 (X V) の化合物を形成し、

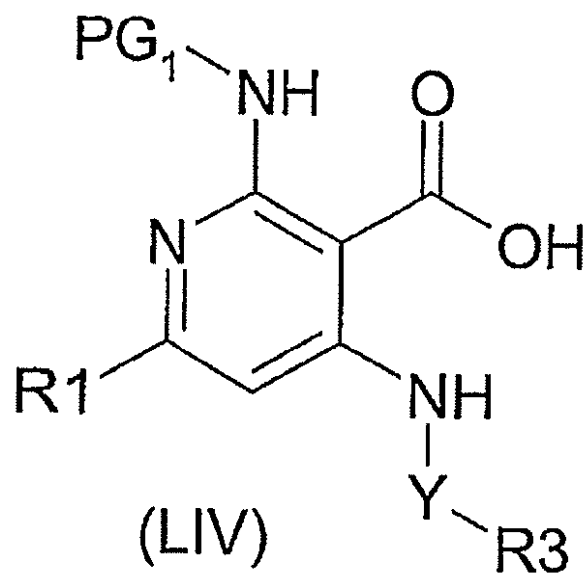
【化 9】



次いで、カルボニル部分の存在下に、式 (X V) の化合物を環化するか、

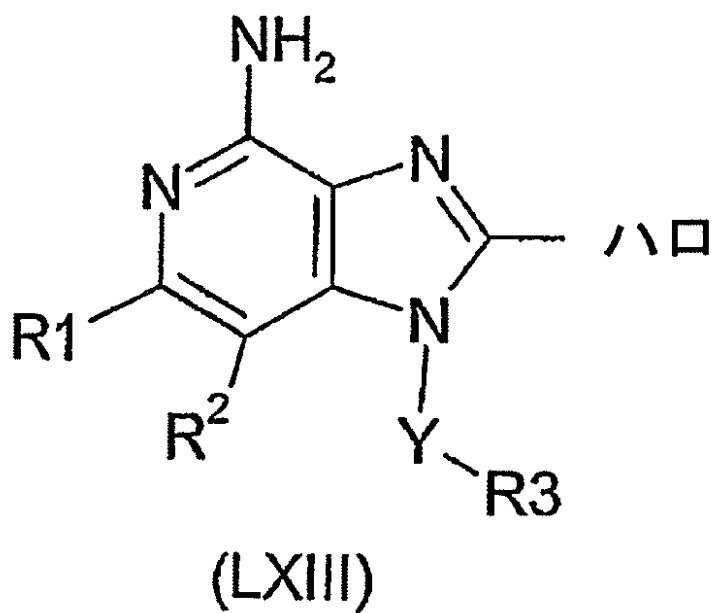
(e) アジ化ジフェニルホスホニルの存在下に、式 (L I V) の化合物を環化して、前記の対応する式 (X I X A) の化合物にし、続いて、アミノ保護基を脱保護するか、

【化 10】



(f) 式 (L X I I I) の化合物を加水分解すること

【化 1 1】



を含む方法。