

【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 5 年 2 月 7 日(2023.2.7)

【公開番号】特開 2022-106920(P2022-106920A)

【公開日】令和 4 年 7 月 20 日(2022.7.20)

【年通号数】公開公報(特許)2022-131

【出願番号】特願 2022-76713(P2022-76713)

【国際特許分類】

C 0 7 H 19/10(2006.01)

10

C 0 7 H 19/06(2006.01)

C 0 7 H 19/16(2006.01)

C 0 7 H 19/20(2006.01)

A 6 1 K 31/7072(2006.01)

A 6 1 K 31/7076(2006.01)

A 6 1 K 45/08(2006.01)

A 6 1 P 31/14(2006.01)

【F I】

C 0 7 H 19/10

C 0 7 H 19/06

C S P

20

C 0 7 H 19/16

C 0 7 H 19/20

A 6 1 K 31/7072

A 6 1 K 31/7076

A 6 1 K 45/08

A 6 1 P 31/14

【手続補正書】

【提出日】令和 5 年 1 月 27 日(2023.1.27)

【手続補正 1】

30

【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

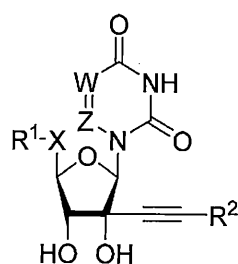
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

以下の式の化合物

【化 1】



40

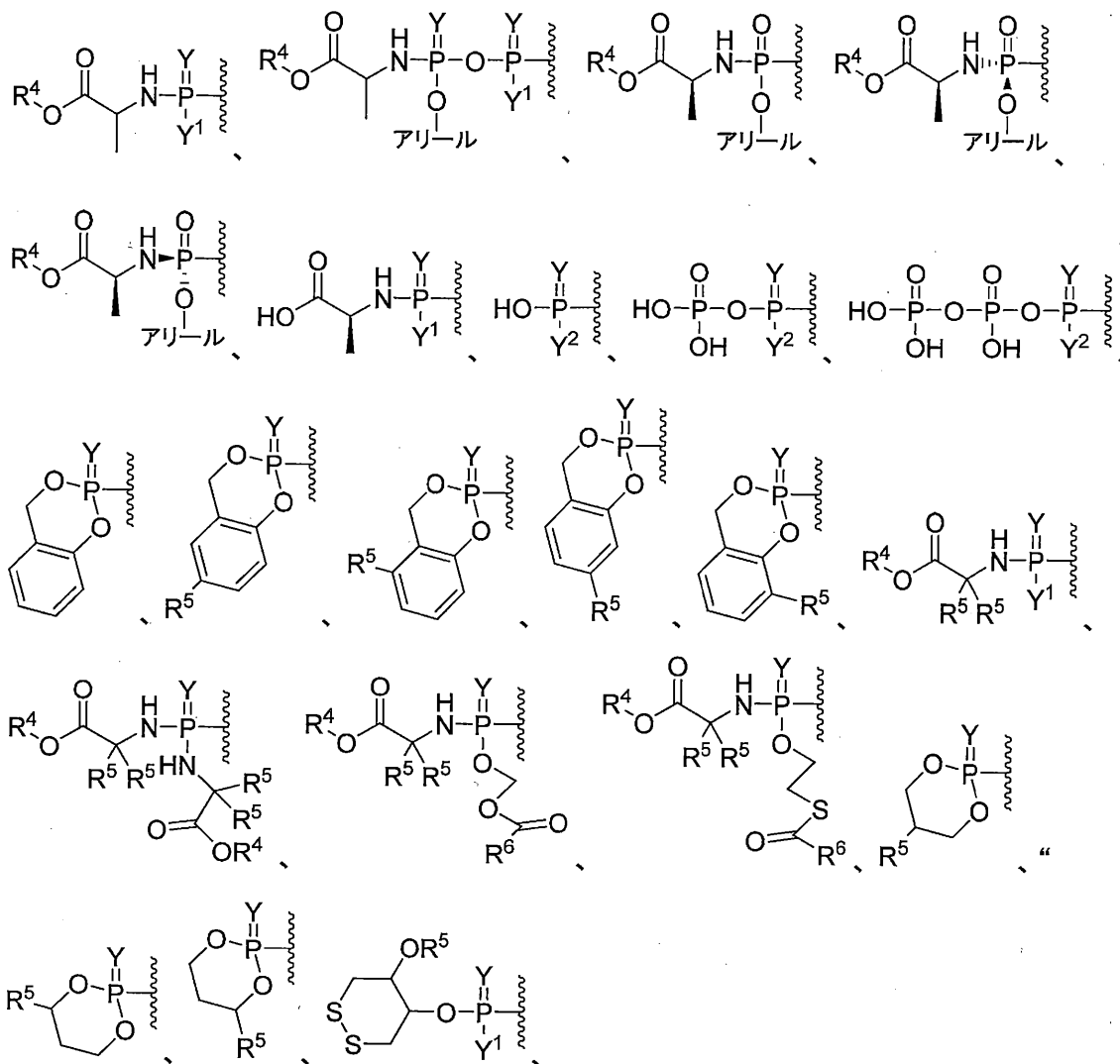
式XXXVIII

又はその薬学的に許容される塩であって、式中、

50

Xは、 $\text{OCH}_2$ 、 $\text{OCHMe}$ 、 $\text{OCMe}_2$ 、 $\text{OCHF}$ 、 $\text{OCF}_2$ 、又は $\text{OCD}_2$ であり、  
 Wは、N又は $\text{CR}^7$ であり、  
 Zは、N又は $\text{CR}^8$ であり、  
 $\text{R}^1$ は、Hから又は以下の式のうちの1つから選択され、

## 【化2】



10

20

30

Yは、Oであり、

$\text{Y}^1$ は、OH、Oアリール、又はOアルキルであり、

$\text{Y}^2$ は、OHであり、

アリールは、フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル、芳香族、ヘテロ芳香族、4-置換フェニル、4-クロロフェニル、又は4-ブモフェニルであり、

40

$\text{R}^2$ は、水素、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロ、ヒドロキシメチル、又はアミノメチルであり、

$\text{R}^4$ は、水素、メチル、エチル、イソプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ネオペンチル、ベンジル、アルキル、分枝アルキル、シクロアルキル、又は脂質であり、

$\text{R}^5$ は、水素、重水素、ヒドロキシル、シアノ、アジド、アミノ、置換アミノ、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、脂質、 $\text{C}_1 \sim 22$ アルコキシ、 $\text{C}_1 \sim 22$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim 22$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim 22$ アルキニル、又は置換ヘテロアリールであり、

$\text{R}^6$ は、メチル、エチル、tert-ブチル、 $\text{C}_1 \sim 22$ アルコキシ、 $\text{C}_1 \sim 22$ アルキル、分枝アルキル、シクロアルキル、アリール、置換アリール、又はアルキオキシであり、

$\text{R}^7$ は、H、D、ヒドロキシル、チオール、アミノ、メチル、フルオロメチル、ジフル

50

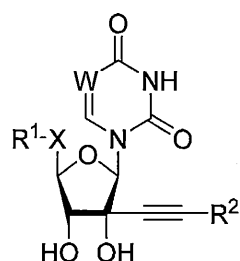
オロメチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル、C<sub>2</sub>~6アルケニル、C<sub>2</sub>~6アルキニル、エチニル、アジド、クロロ、ブromo、ヨード、アルコキシ、又はシアノであり、

R<sup>8</sup>は、D、ヒドロキシル、チオール、アミノ、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル、C<sub>2</sub>~6アルケニル、C<sub>2</sub>~6アルキニル、エチニル、アジド、ハロ、フルオロ、クロロ、ブromo、又はヨードである、化合物又はその薬学的に許容される塩、

あるいは、

以下の式の化合物

【化3】



式XXXIX

又はその薬学的に許容される塩であって、式中、

Xは、OCH<sub>2</sub>、OCHMe、OCMe<sub>2</sub>、OCHF、OCF<sub>2</sub>、又はOCD<sub>2</sub>であり、  
Wは、N又はCR<sup>7</sup>であり、

R<sup>1</sup>は、Hから又は以下の式のうちの1つから選択され、

10

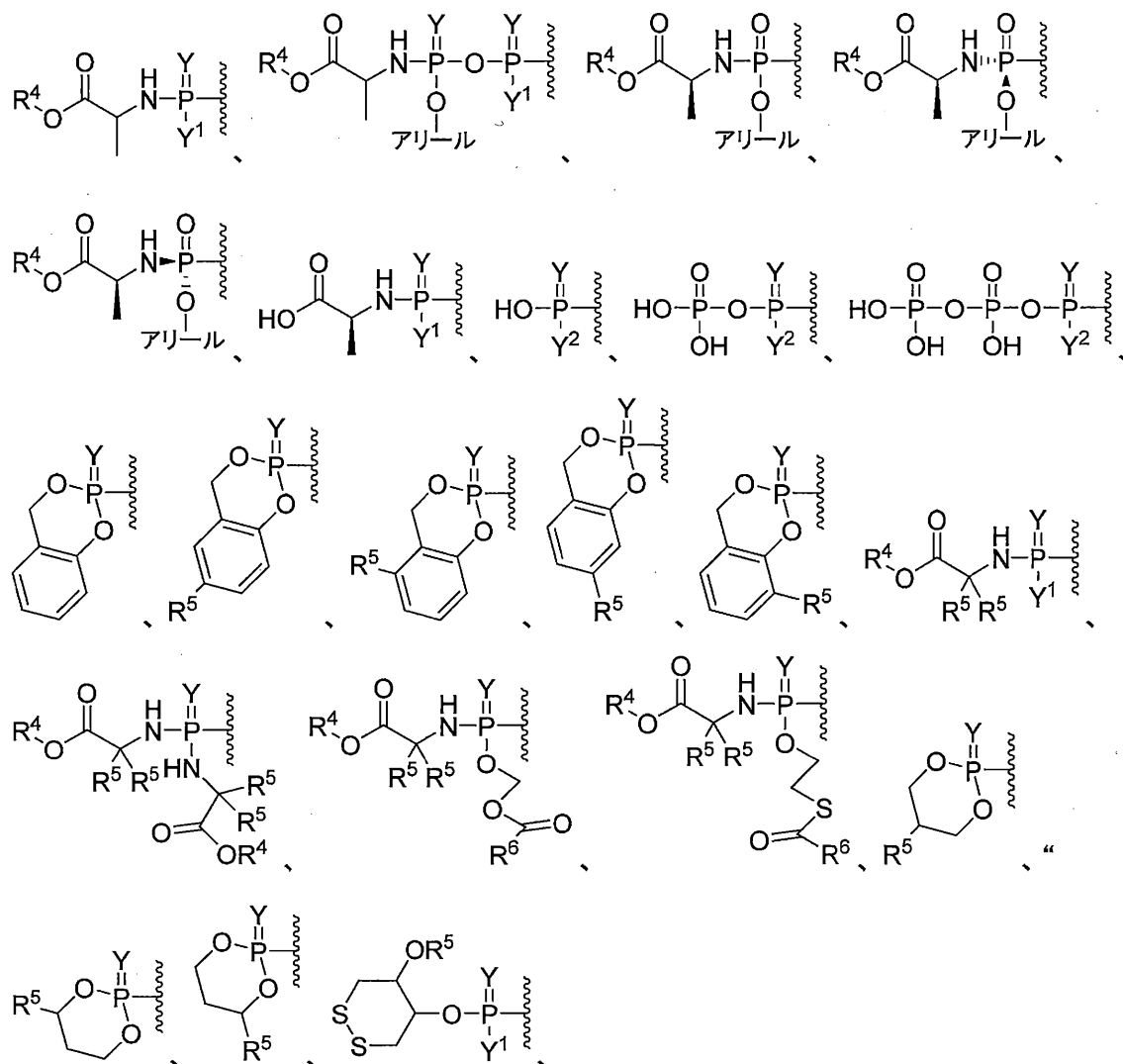
20

30

40

50

## 【化 4】



Y は、O であり、

Y<sup>1</sup> は、O H、O アリール、又は O アルキル であり、

Y<sup>2</sup> は、O H であり、

アリールは、フェニル、1 - ナフチル、2 - ナフチル、芳香族、ヘテロ芳香族、4 - 置換フェニル、4 - クロロフェニル、又は 4 - ブロモフェニル であり、

R<sup>2</sup> は、水素、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロ、ヒドロキシメチル、又は アミノメチル であり、

R<sup>4</sup> は、水素、メチル、エチル、イソプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ネオペンチル、ベンジル、アルキル、分枝アルキル、シクロアルキル、又は 脂質 であり、

R<sup>5</sup> は、水素、重水素、ヒドロキシル、シアノ、アジド、アミノ、置換アミノ、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、脂質、C<sub>1</sub> ~ 22 アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 22 アルキル、C<sub>2</sub> ~ 22 アルケニル、C<sub>2</sub> ~ 22 アルキニル、又は 置換ヘテロアリール であり、

R<sup>6</sup> は、メチル、エチル、tert - ブチル、C<sub>1</sub> ~ 22 アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 22 アルキル、分枝アルキル、シクロアルキル、アリール、置換アリール、又は アルキオキシ であり、

R<sup>7</sup> は、D、ヒドロキシル、チオール、アミノ、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル、C<sub>2</sub> ~ 6 アルケニル、C<sub>2</sub> ~ 6 アルキニル、エチニル、アジド、クロロ、ブロモ、ヨード、アルコキシ、又は シアノ である、化合物又はその薬学的に許容される塩、

あるいは、

10

20

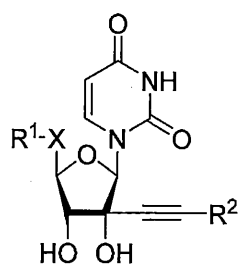
30

40

50

以下の式の化合物

【化 5】



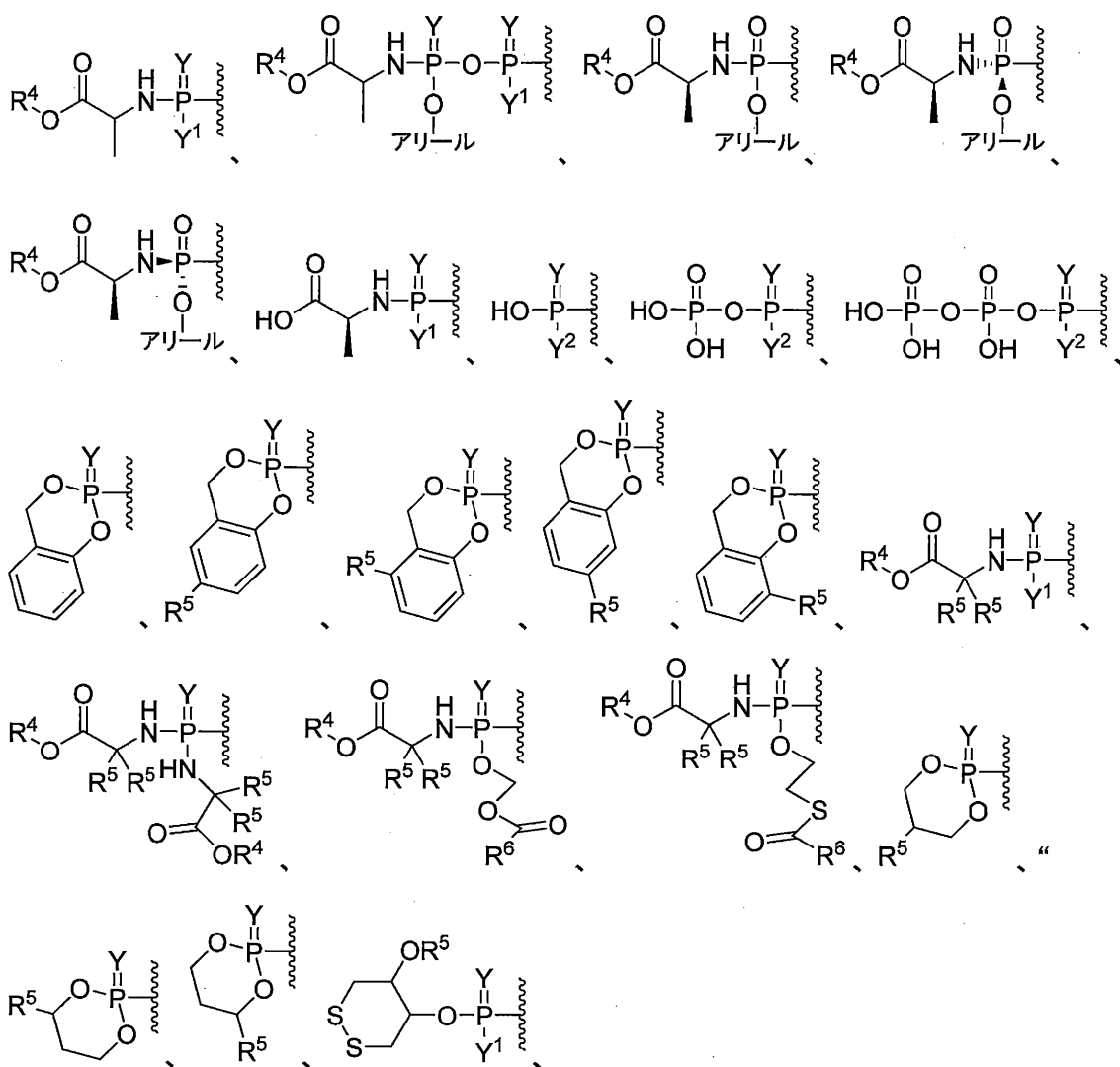
式XLI

又はその薬学的に許容される塩であって、式中、

Xは、 $\text{OCHMe}_2$ 、 $\text{OCHF}$ 、 $\text{OCF}_2$ 、又は $\text{OCD}_2$ であり、

R<sup>1</sup>は、Hから又は以下の式のうちの1つから選択され、

【化 6】



Yは、Oであり、

Y<sup>1</sup>は、OH、Oアリール、又はOアルキルであり、

Y<sup>2</sup>は、OHであり、

アリールは、フェニル、1 - ナフチル、2 - ナフチル、芳香族、ヘテロ芳香族、4 - 置換フェニル、4 - クロロフェニル、又は4 - ブロモフェニルであり、

R<sup>2</sup>は、水素、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロ、ヒドロキシメチル、又はアミノメチルであり、

R<sup>4</sup>は、水素、メチル、エチル、イソプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ネオペンチル、ベンジル、アルキル、分枝アルキル、シクロアルキル、又は脂質であり、

R<sup>5</sup>は、水素、重水素、ヒドロキシル、シアノ、アジド、アミノ、置換アミノ、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、脂質、C<sub>1</sub>~22アルコキシ、C<sub>1</sub>~22アルキル、C<sub>2</sub>~22アルケニル、C<sub>2</sub>~22アルキニル、又は置換ヘテロアリールであり、

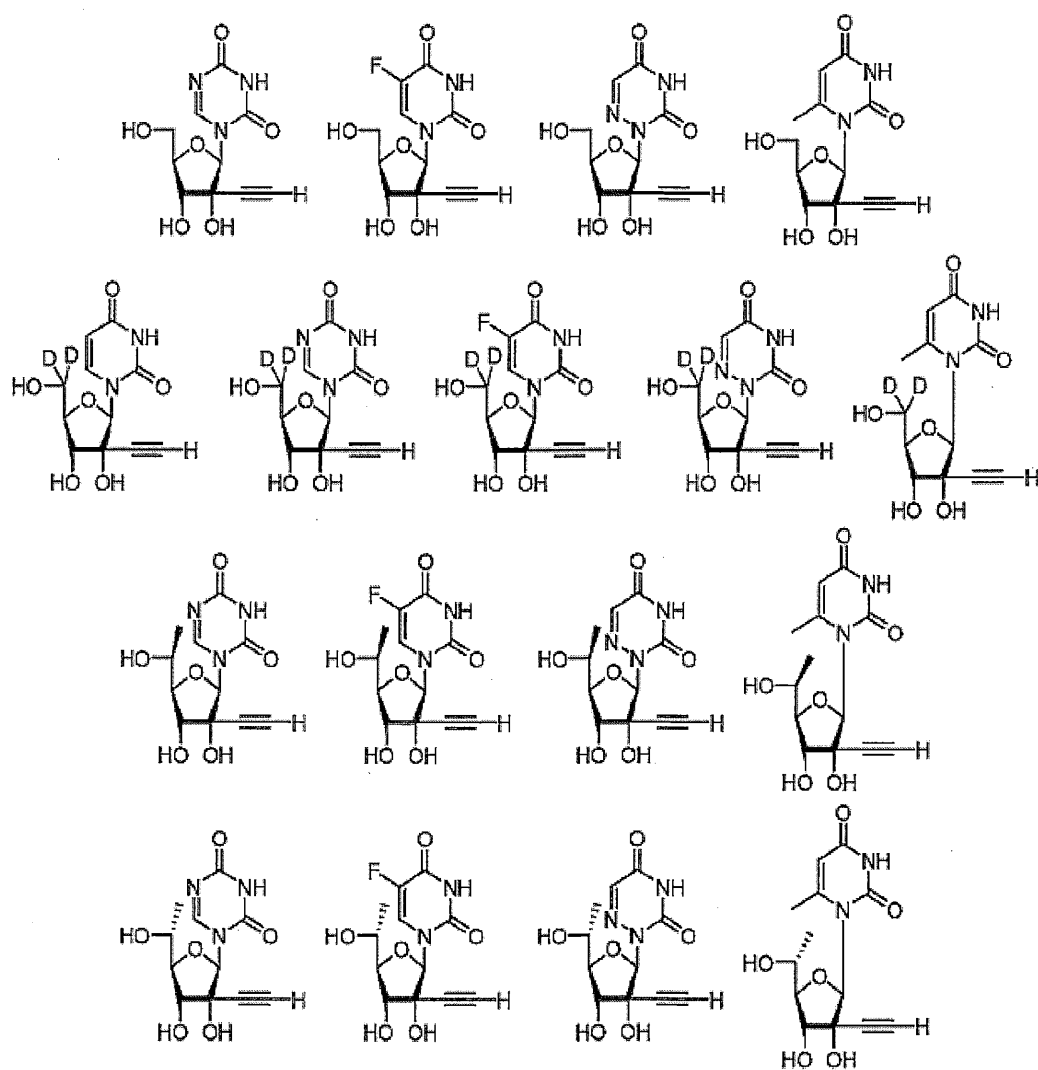
R<sup>6</sup>は、メチル、エチル、tert - ブチル、C<sub>1</sub>~22アルコキシ、C<sub>1</sub>~22アルキル、分枝アルキル、シクロアルキル、アリール、置換アリール、又はアルキオキシである、化合物又はその薬学的に許容される塩。

10

【請求項2】

以下の式を有する化合物。

【化7】

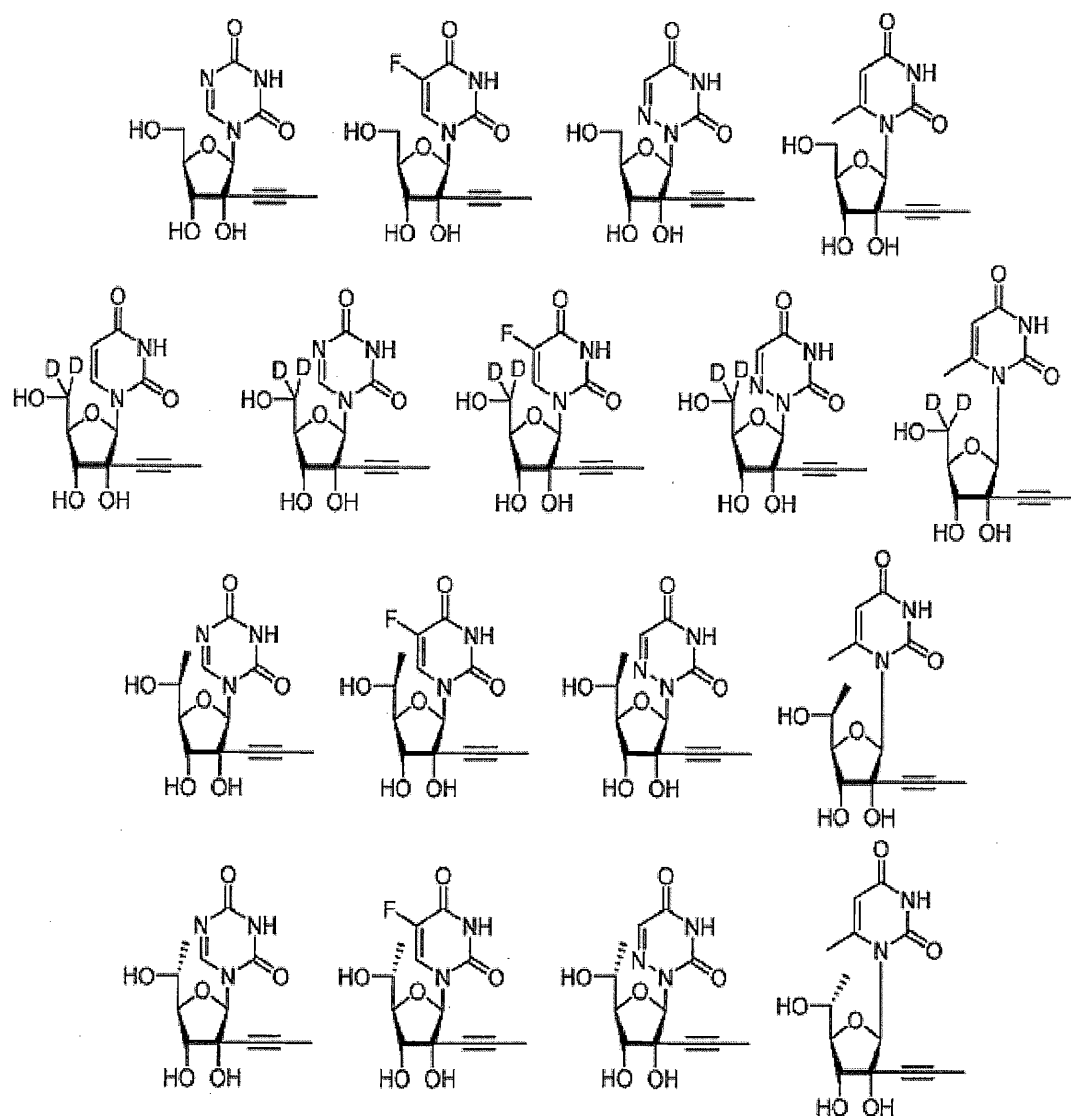


20

30

40

50



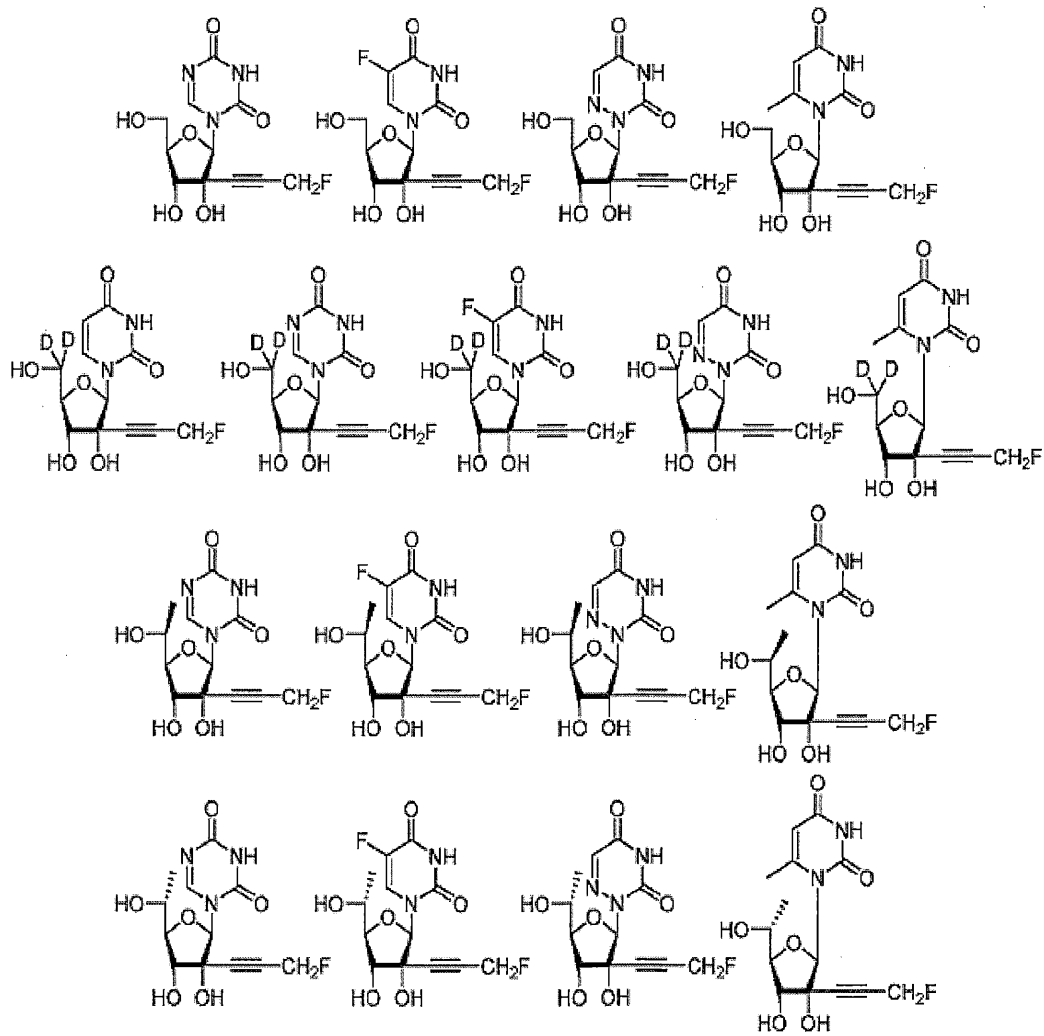
10

20

30

40

50



## 【請求項 3】

以下の式を有する化合物。

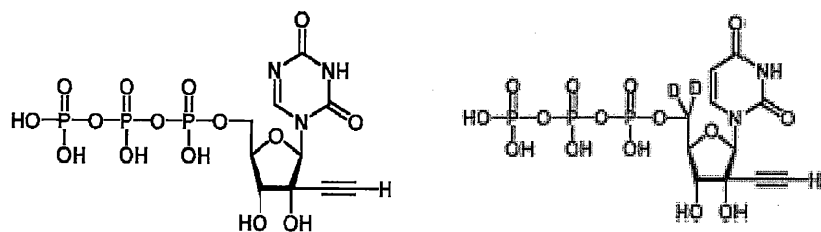
30

40

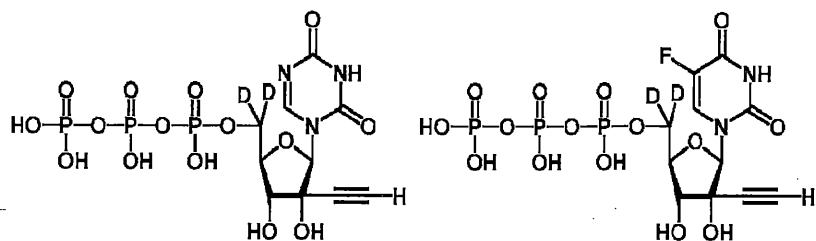
50



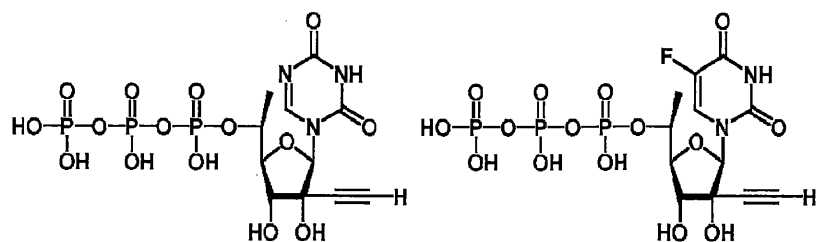
【化 8】



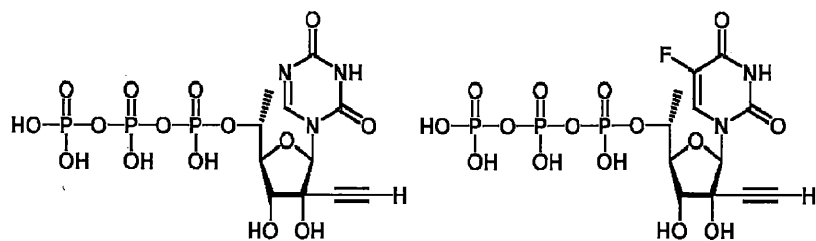
10



20

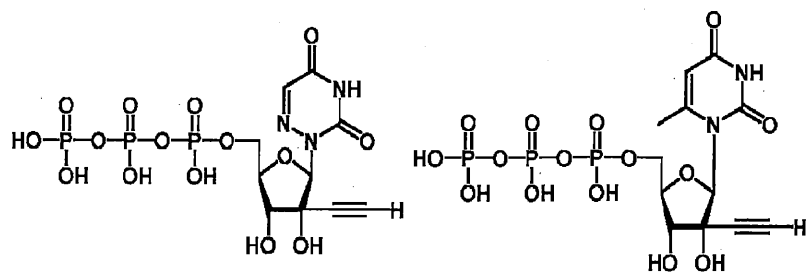


30

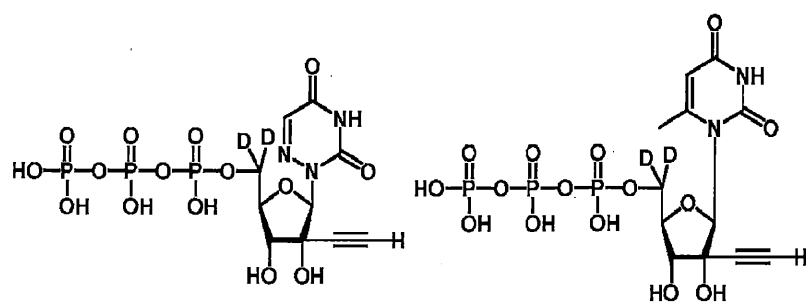


40

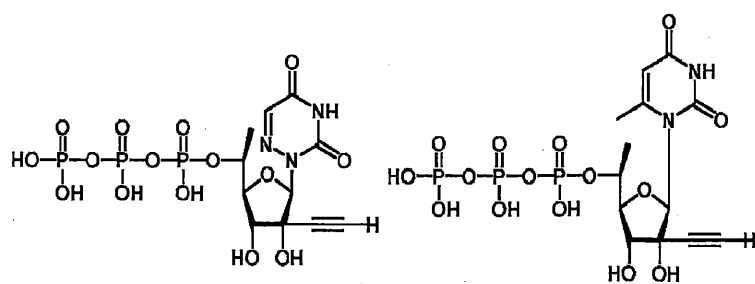
50



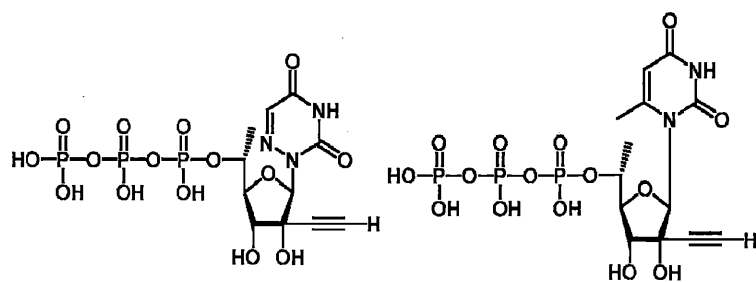
10



20

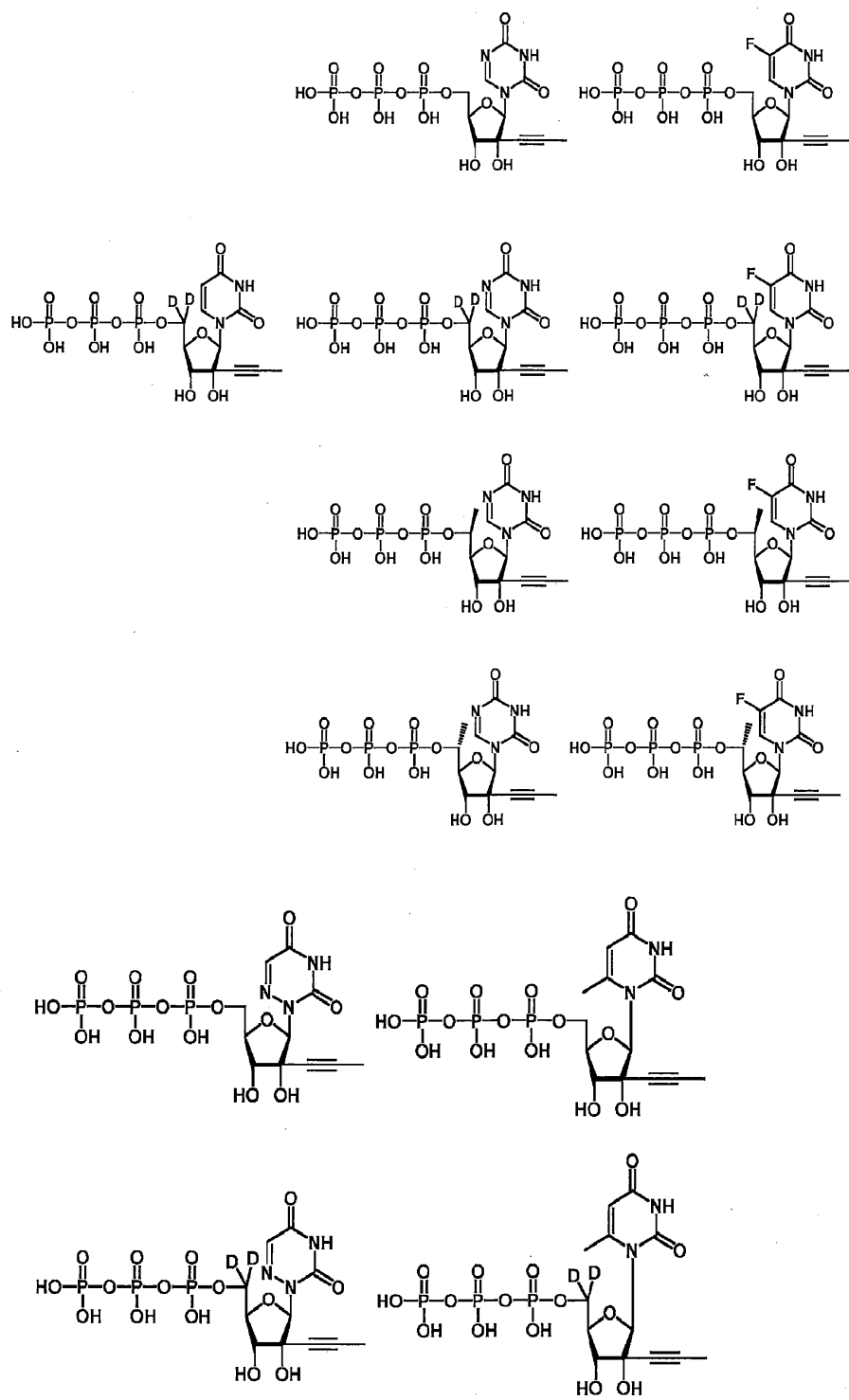


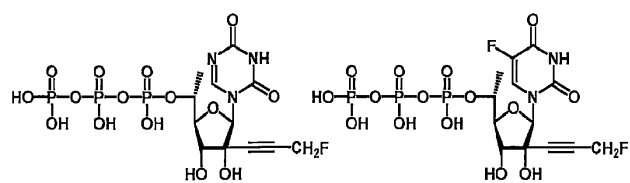
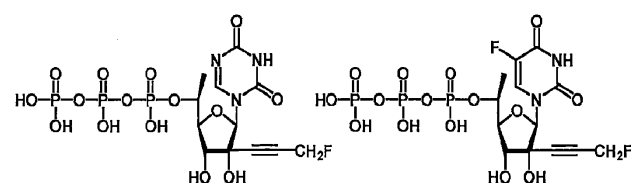
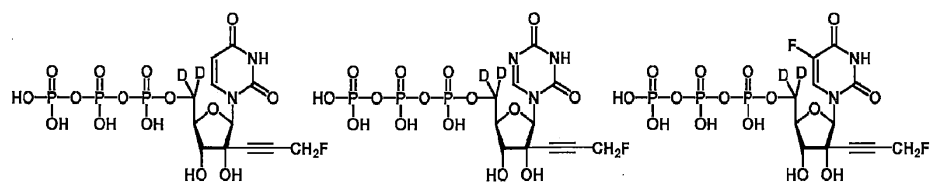
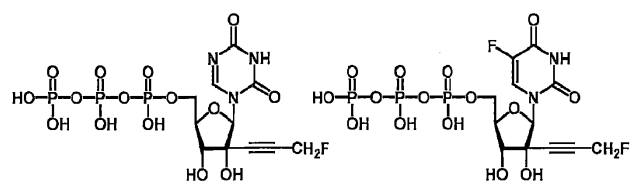
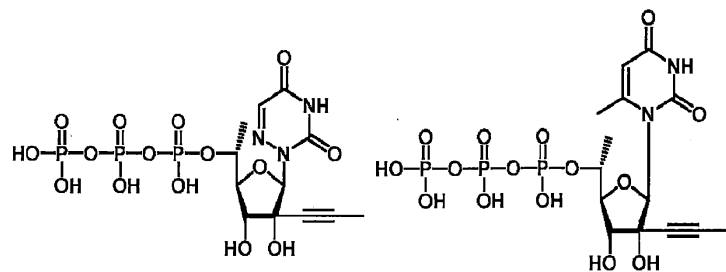
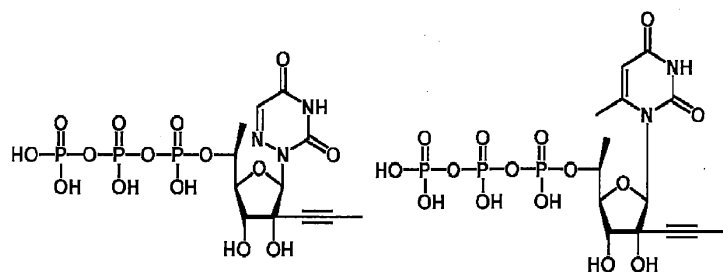
30



40

50





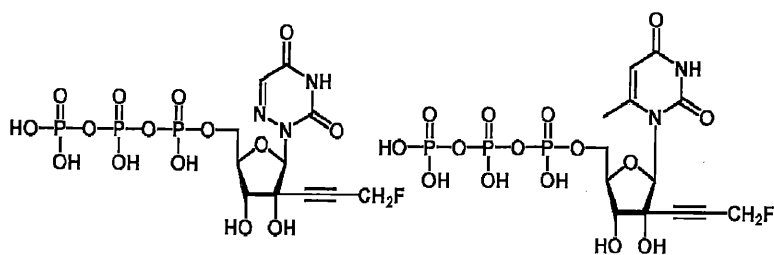
10

20

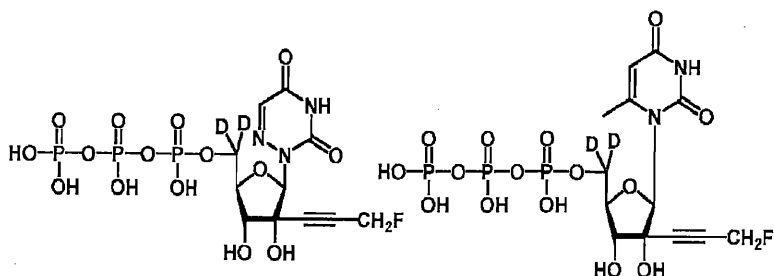
30

40

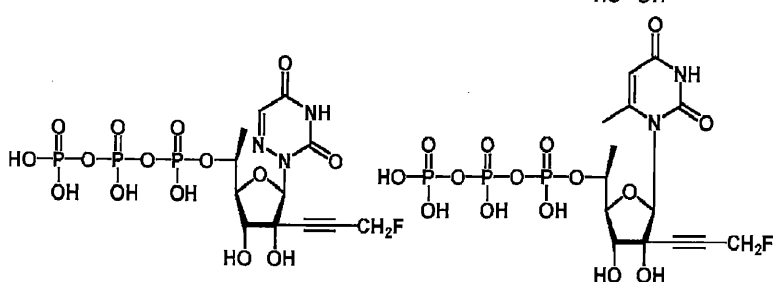
50



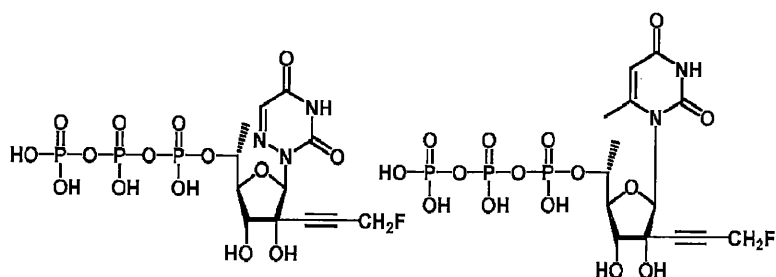
10



20



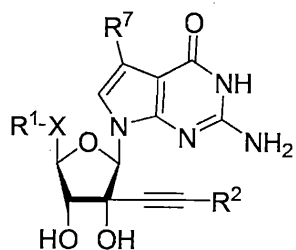
30



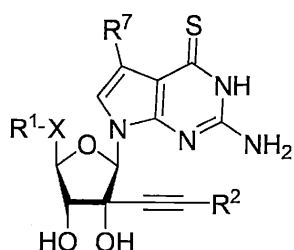
## 【請求項 4】

以下の式の化合物

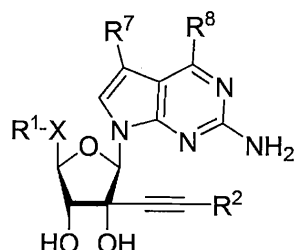
## 【化 9】



式XLVIIa



式XLVIIb



式XLVIIc

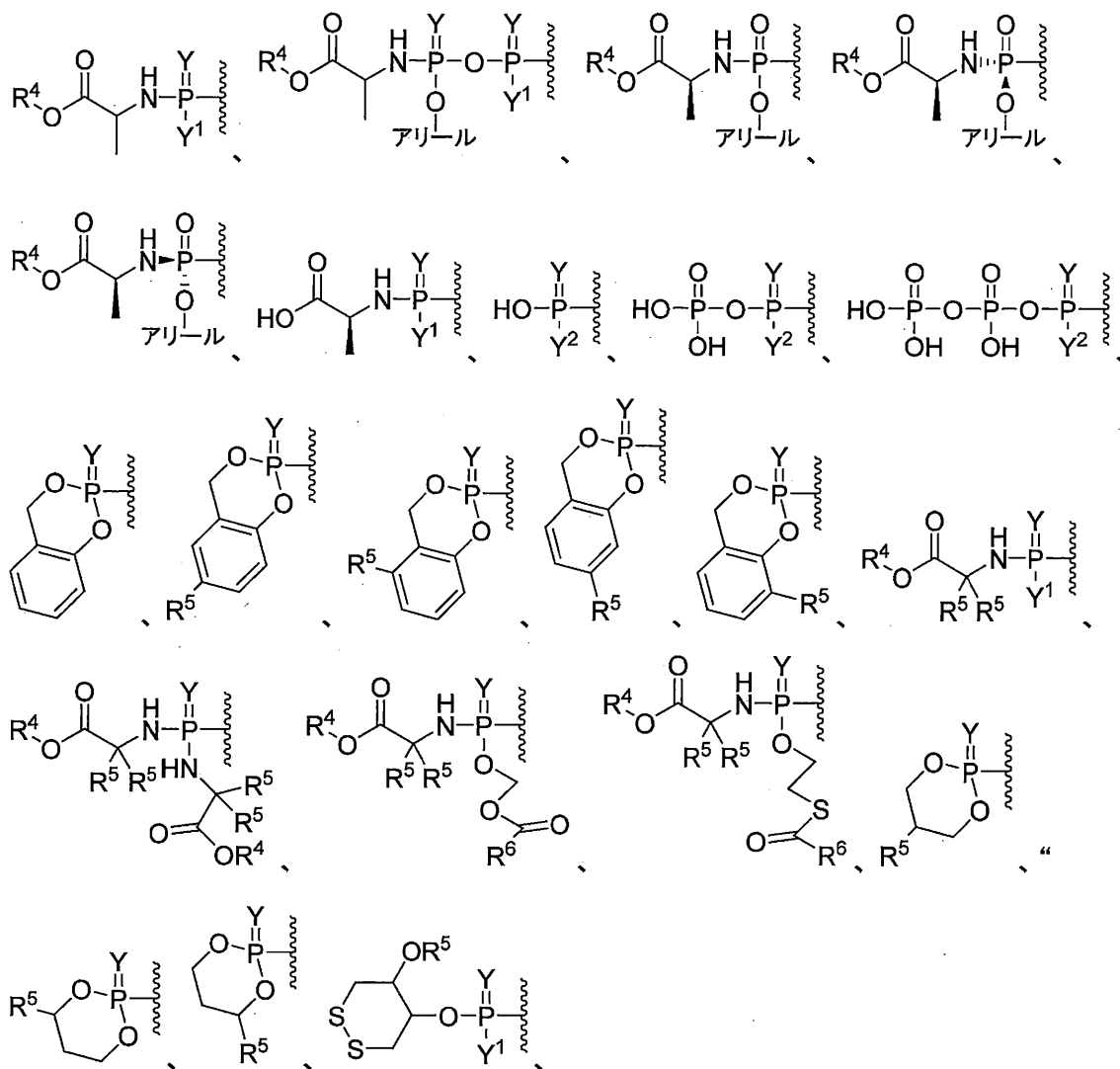
40

又はその薬学的に許容される塩であって、式中、

Xは、 $\text{OCH}_2$ 、 $\text{OCHMe}$ 、 $\text{OCMe}_2$ 、 $\text{OCHF}$ 、 $\text{OCF}_2$ 、又は $\text{OCD}_2$ であり、  
R<sup>1</sup>は、Hから又は以下の式のうちの1つから選択され、

50

## 【化 10】



$Y$  は、O であり、

$Y^1$  は、O H、O アリール、又は O アルキル であり、

$Y^2$  は、O H であり、

アリールは、フェニル、1 - ナフチル、2 - ナフチル、芳香族、ヘテロ芳香族、4 - 置換フェニル、4 - クロロフェニル、又は 4 - ブロモフェニルであり、

$R^2$  は、水素、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル、又は アミノメチル であり、

$R^4$  は、水素、メチル、エチル、イソプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ネオペンチル、ベンジル、アルキル、分枝アルキル、シクロアルキル、又は脂質であり、

$R^5$  は、水素、重水素、ヒドロキシル、シアノ、アジド、アミノ、置換アミノ、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、脂質、 $C_1 \sim 22$  アルコキシ、 $C_1 \sim 22$  アルキル、 $C_2 \sim 22$  アルケニル、 $C_2 \sim 22$  アルキニル、又は置換ヘテロアリールであり、

$R^6$  は、メチル、エチル、tert - ブチル、 $C_1 \sim 22$  アルコキシ、 $C_1 \sim 22$  アルキル、分枝アルキル、シクロアルキル、アリール、置換アリール、又はアルキオキシであり、

$R^7$  は、H、D、ヒドロキシル、チオール、アミノ、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル、アルケニル、アルキニル、エチニル、アジド、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、アルコキシ、又はシアノであり、

$R^8$  は、H、D、ヒドロキシル、チオール、アミノ、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル、 $C_2 \sim 6$  アルケニル、 $C_2 \sim 6$  アル



$Y^1$ は、OH、Oアリール、又はOアルキルであり、

$Y^2$ は、OHであり、

アリールは、フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル、芳香族、ヘテロ芳香族、4-置換フェニル、4-クロロフェニル、又は4-ブromフェニルであり、

$R^2$ は、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロ、ヒドロキシメチル、又はアミノメチルであり、

$R^4$ は、水素、メチル、エチル、イソプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ネオペンチル、ベンジル、アルキル、分枝アルキル、シクロアルキル、又は脂質であり、

$R^5$ は、水素、重水素、ヒドロキシル、シアノ、アジド、アミノ、置換アミノ、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、脂質、 $C_1 \sim 22$ アルコキシ、 $C_1 \sim 22$ アルキル、 $C_2 \sim 22$ アルケニル、 $C_2 \sim 22$ アルキニル、又は置換ヘテロアリールであり、

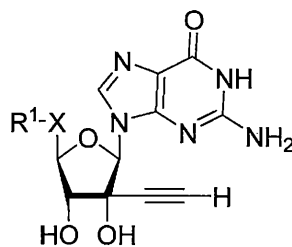
$R^6$ は、メチル、エチル、tert-ブチル、 $C_1 \sim 22$ アルコキシ、 $C_1 \sim 22$ アルキル、分枝アルキル、シクロアルキル、アリール、置換アリール、又はアルキオキシであり、

$R^8$ は、H、D、ヒドロキシル、チオール、アミノ、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、エチニル、アジド、ハロ、フルオロ、クロロ、ブromo、ヨード、メトキシ、エトキシ、又はシアノである、化合物又はその薬学的に許容される塩、

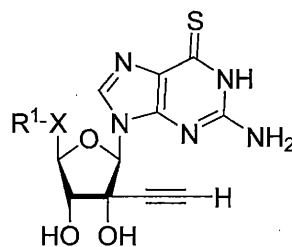
あるいは、

以下の式の化合物

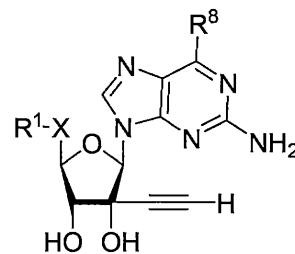
【化13】



式XLIXa



式XLIXb



式XLIXc

又はその薬学的に許容される塩であって、式中、

Xは、OCHMe、OCHMe<sub>2</sub>、OCHF、OCF<sub>2</sub>、又はOCD<sub>2</sub>であり、

$R^1$ は、Hから又は以下の式のうちの1つから選択され、

10

20

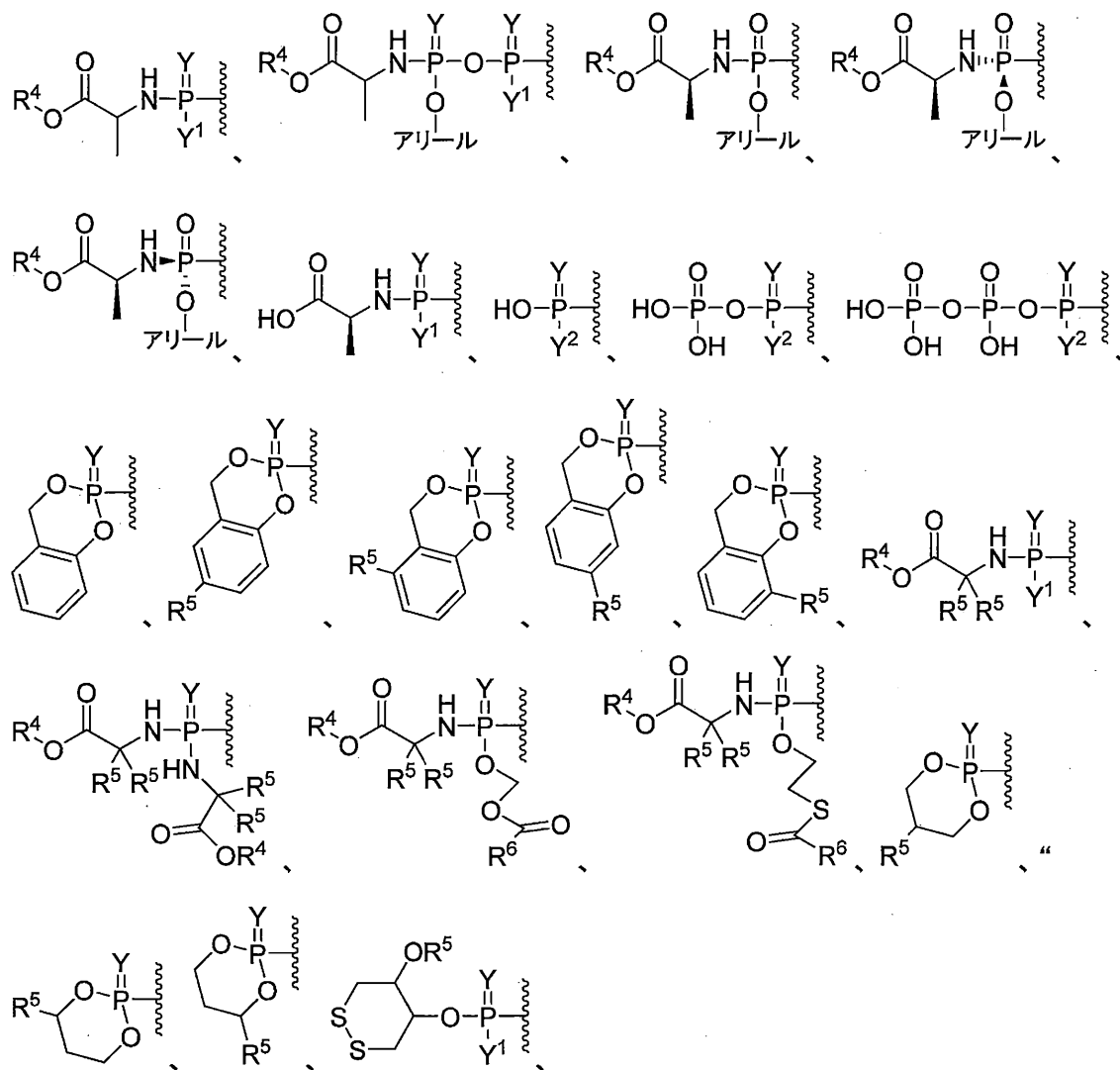
30

40

50



## 【化 1 4】



Y は、Oであり、

Y<sup>1</sup>は、O H、O アリール、又はO アルキルであり、

Y<sup>2</sup>は、O Hであり、

アリールは、フェニル、1 - ナフチル、2 - ナフチル、芳香族、ヘテロ芳香族、4 - 置換フェニル、4 - クロロフェニル、又は4 - ブロモフェニルであり、

R<sup>4</sup>は、水素、メチル、エチル、イソプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ネオペンチル、ベンジル、アルキル、分枝アルキル、シクロアルキル、又は脂質であり、

R<sup>5</sup>は、水素、重水素、ヒドロキシル、シアノ、アジド、アミノ、置換アミノ、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、脂質、C<sub>1</sub>~22アルコキシ、C<sub>1</sub>~22アルキル、C<sub>2</sub>~22アルケニル、C<sub>2</sub>~22アルキニル、又は置換ヘテロアリールであり、

R<sup>6</sup>は、メチル、エチル、tert - ブチル、C<sub>1</sub>~22アルコキシ、C<sub>1</sub>~22アルキル、分枝アルキル、シクロアルキル、アリール、置換アリール、又はアルキオキシであり、

R<sup>8</sup>は、H、D、ヒドロキシル、チオール、アミノ、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル、C<sub>2</sub>~6アルケニル、C<sub>2</sub>~6アルキニル、エチニル、アジド、ハロ、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、メトキシ、エトキシ、又はシアノである、化合物又はその薬学的に許容される塩、

あるいは、

以下の式の化合物

10

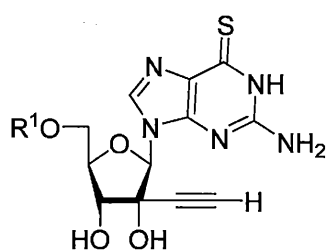
20

30

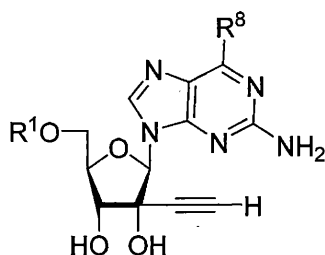
40

50

## 【化 1 5】



式La



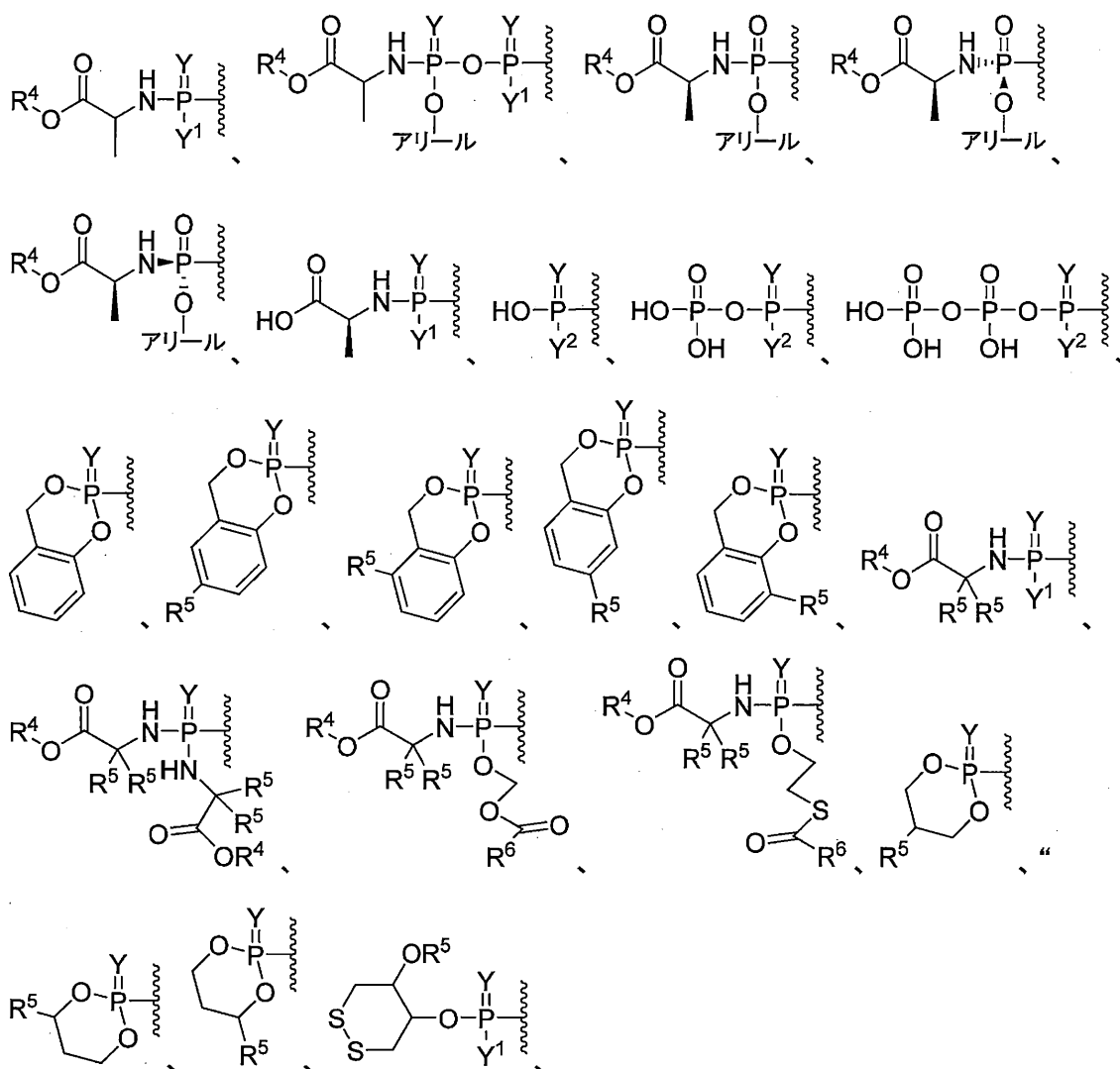
式Lb

10

又はその薬学的に許容される塩であって、式中、

R<sup>1</sup>は、Hから又は以下の式のうちの1つから選択され、

## 【化 1 6】



20

30

40

Yは、Oであり、

Y<sup>1</sup>は、OH、Oアリール、又はOアルキルであり、

Y<sup>2</sup>は、OHであり、

アリールは、フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル、芳香族、ヘテロ芳香族、4-置換フェニル、4-クロロフェニル、又は4-プロモフェニルであり、

R<sup>4</sup>は、水素、メチル、エチル、イソプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、ネ

50

オペンチル、ベンジル、アルキル、分枝アルキル、シクロアルキル、又は脂質であり、

R<sup>5</sup>は、水素、重水素、ヒドロキシル、シアノ、アジド、アミノ、置換アミノ、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、脂質、C<sub>1</sub>~22アルコキシ、C<sub>1</sub>~22アルキル、C<sub>2</sub>~22アルケニル、C<sub>2</sub>~22アルキニル、又は置換ヘテロアリールであり、

R<sup>6</sup>は、メチル、エチル、tert-ブチル、C<sub>1</sub>~22アルコキシ、C<sub>1</sub>~22アルキル、分枝アルキル、シクロアルキル、アリール、置換アリール、又はアルキオキシであり、

R<sup>8</sup>は、H、D、ヒドロキシル、チオール、アミノ、メチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル、C<sub>2</sub>~6アルケニル、C<sub>2</sub>~6アルキニル、エチニル、アジド、ハロ、フルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、エトキシ、又はシアノである、化合物又はその薬学的に許容される塩。

10

【請求項5】

以下のものから選択される請求項4に記載の化合物。

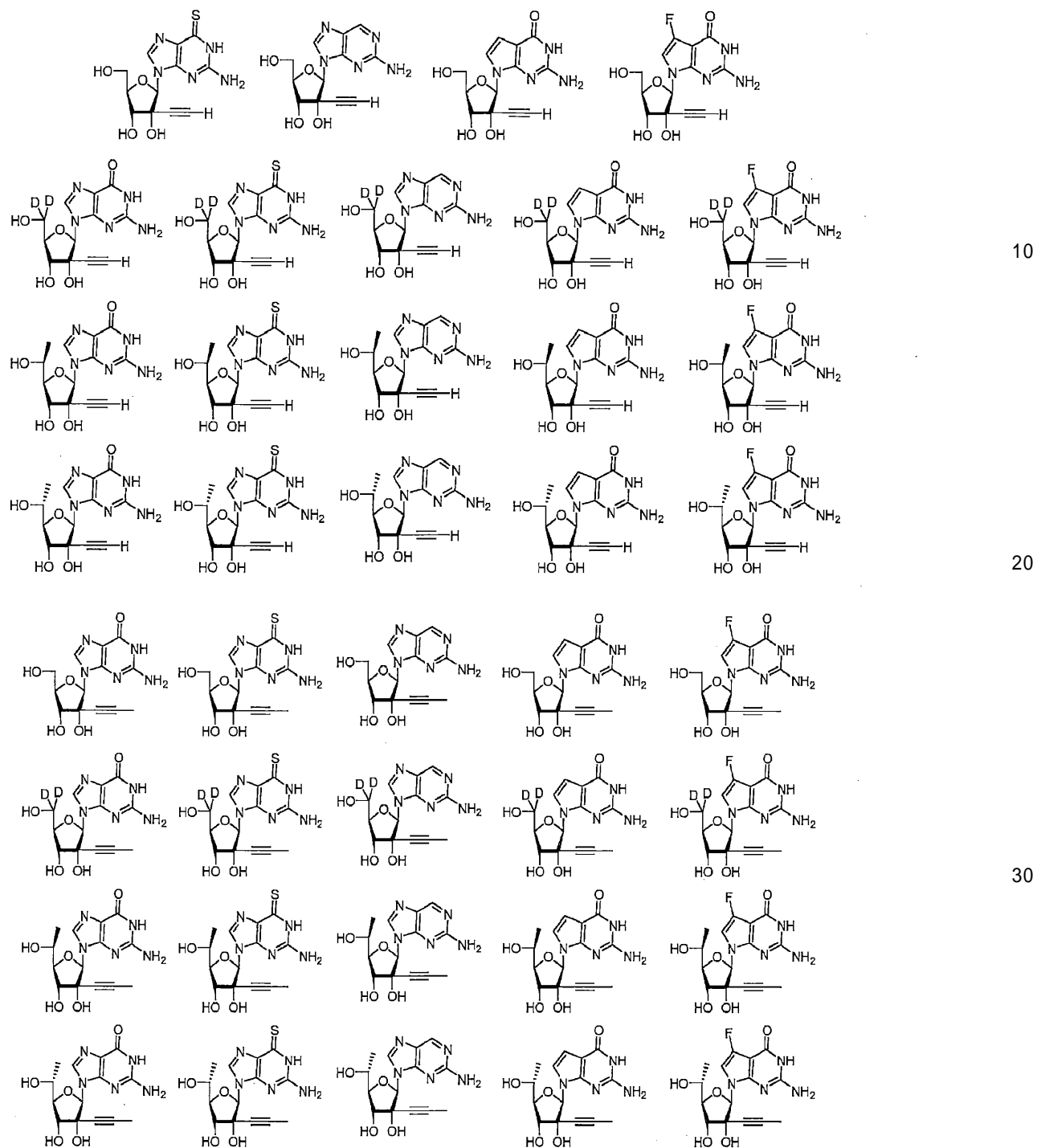
20

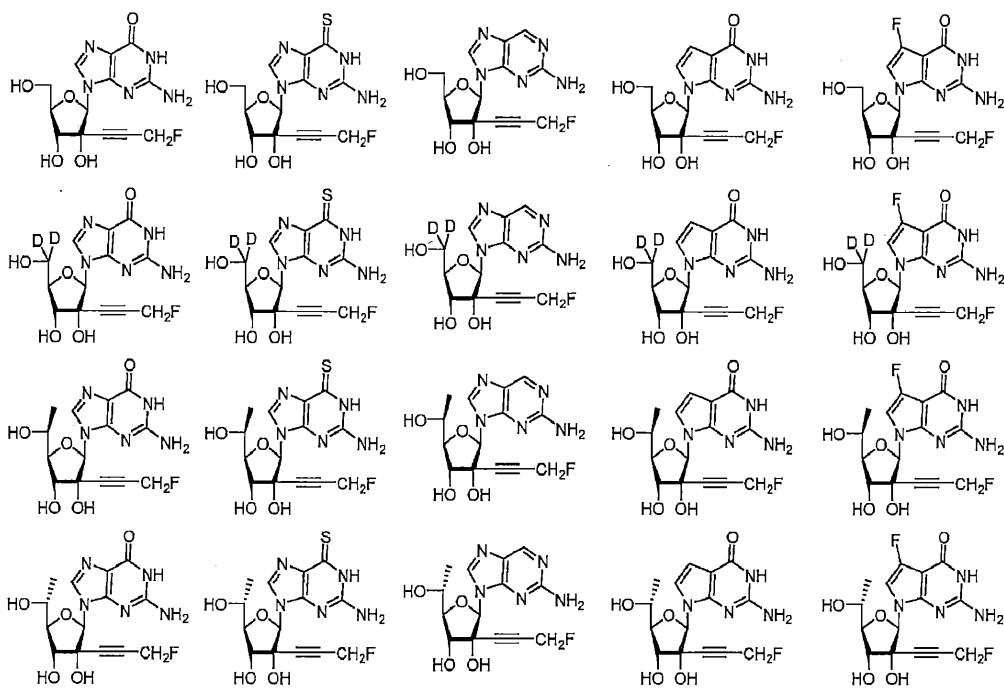
30

40

50

【化 17】





10

20

## 【請求項 6】

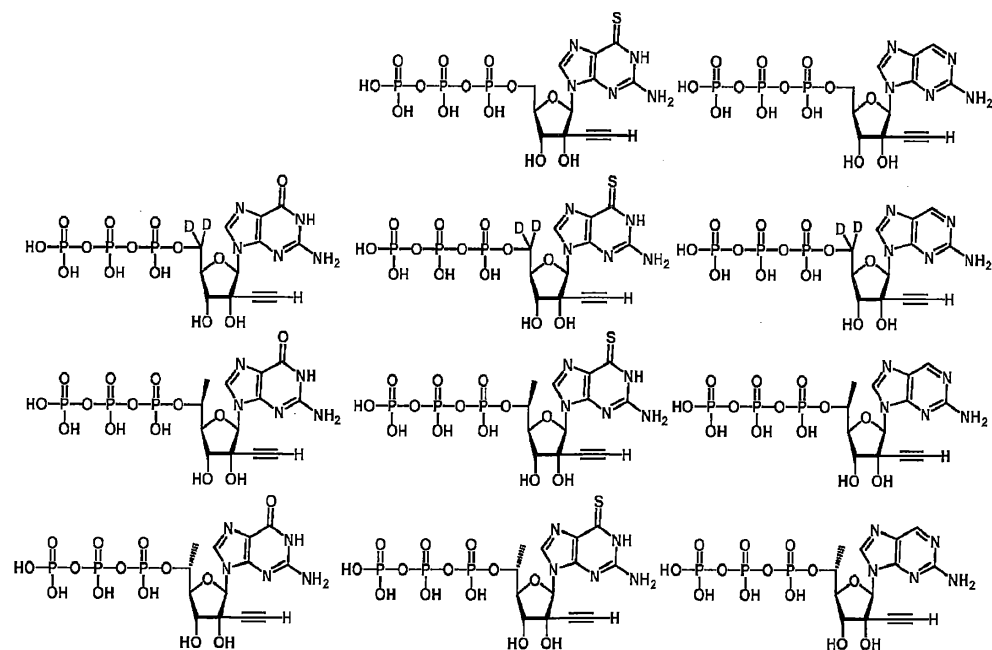
以下のものから選択される請求項 4 に記載の化合物。\_\_

30

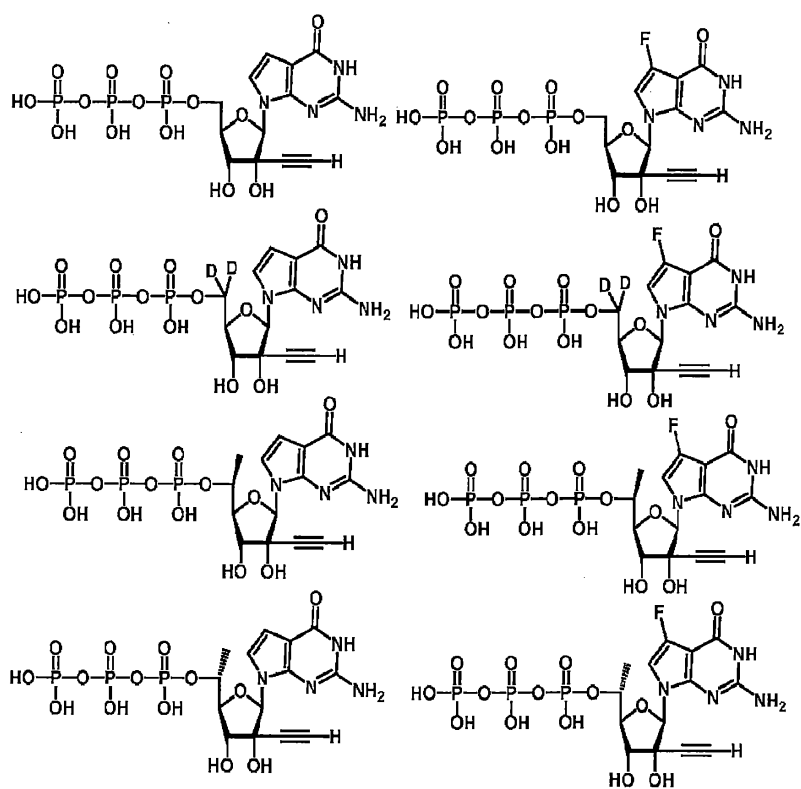
40

50

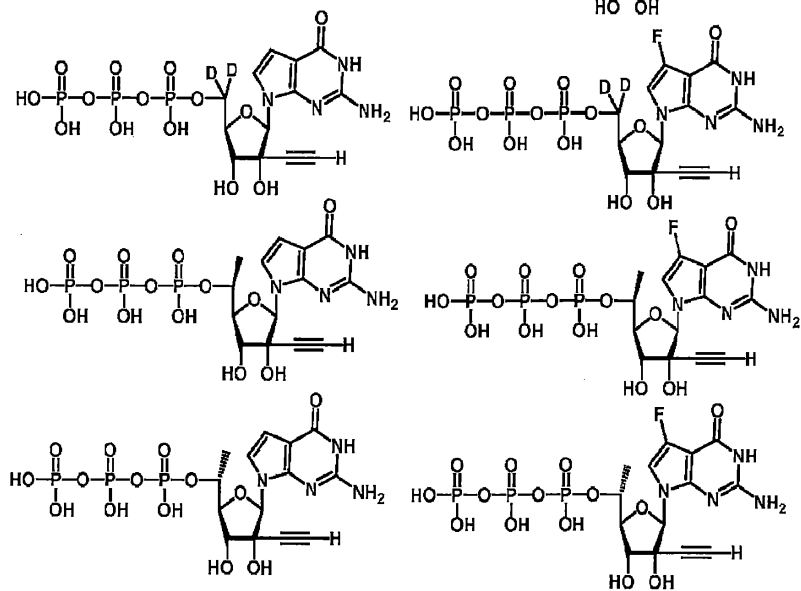
【化 1 8】



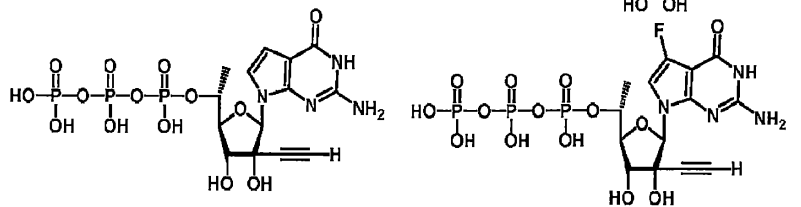
10



20

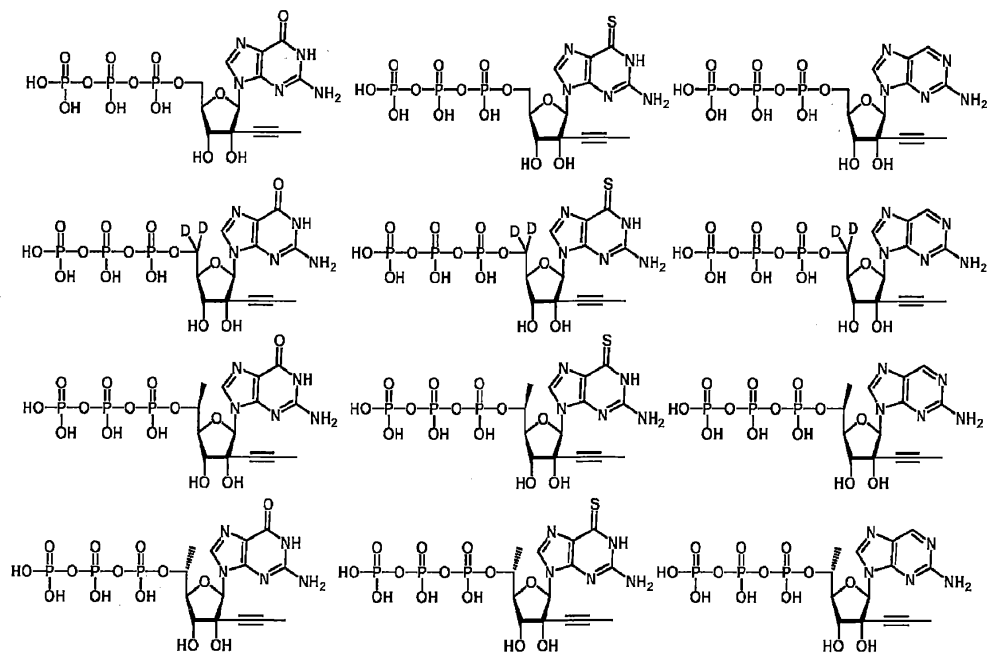


30

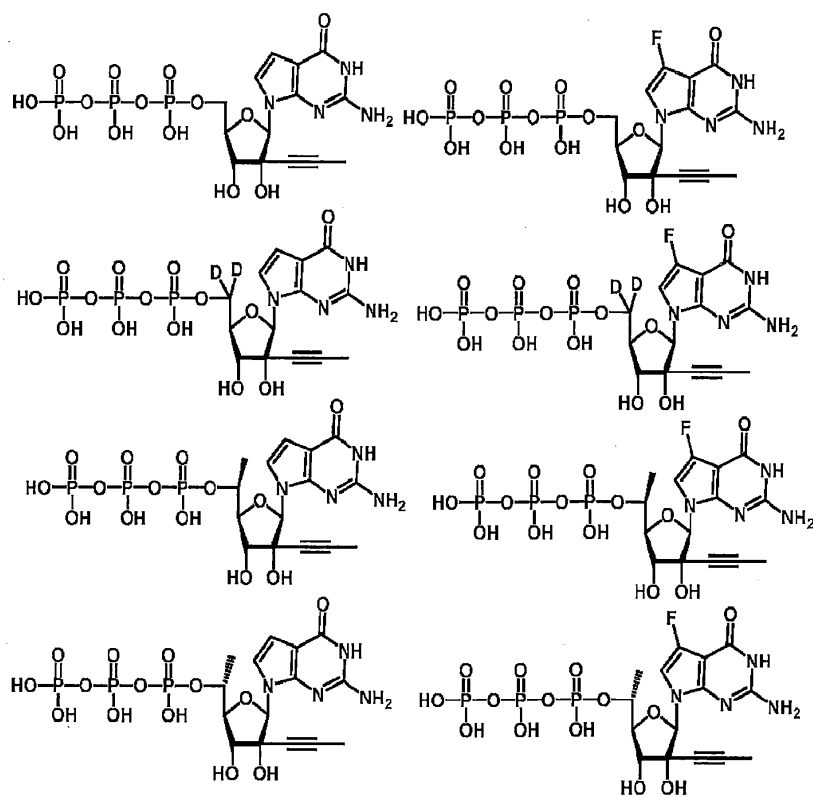


40

50



10

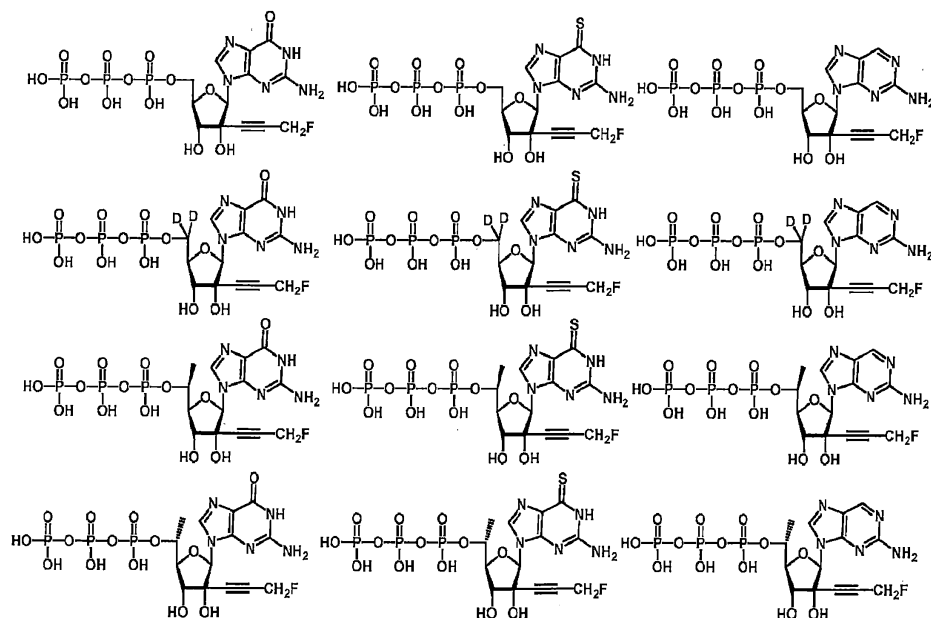


20

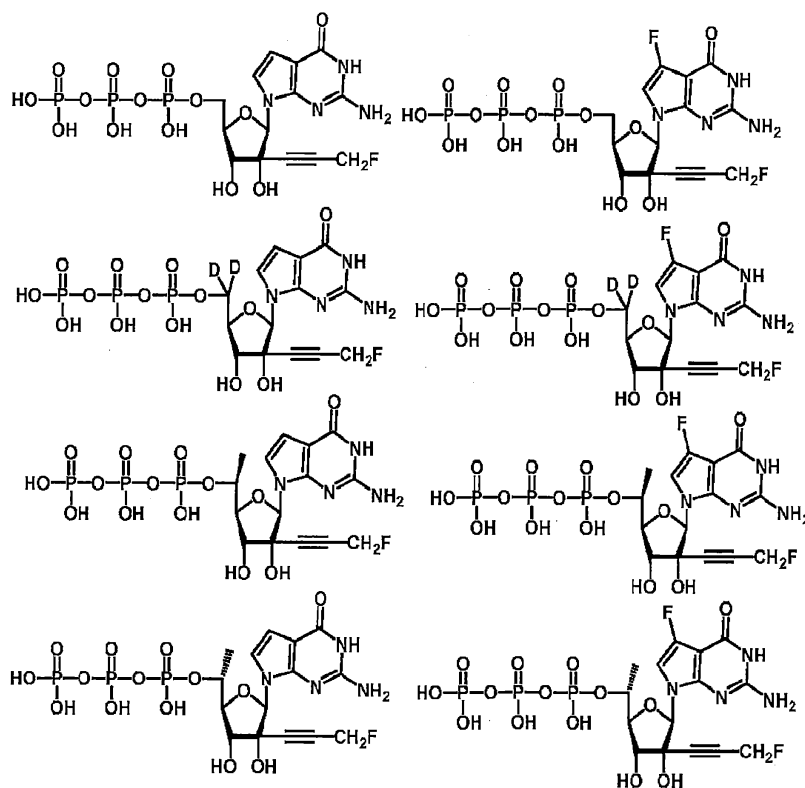
30

40

50



10



20

30

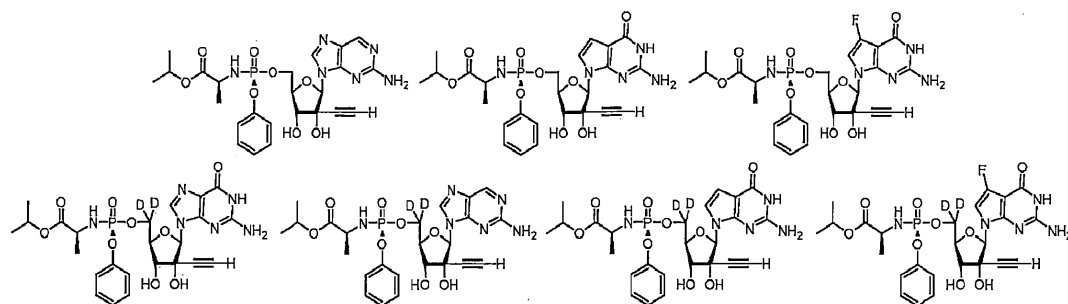
40

## 【請求項 7】

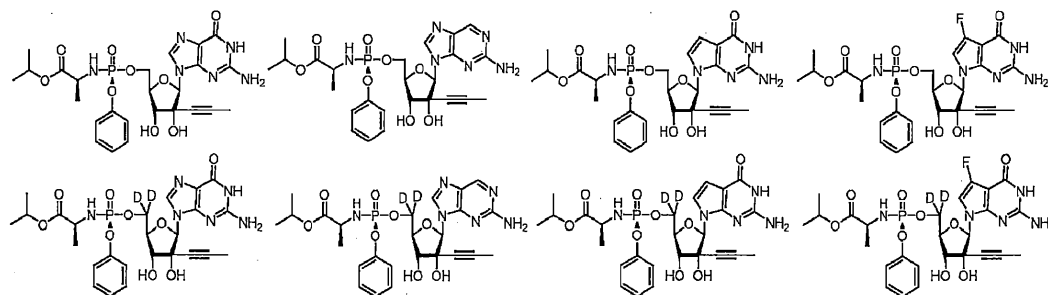
以下のものから選択される請求項 4 に記載の化合物。



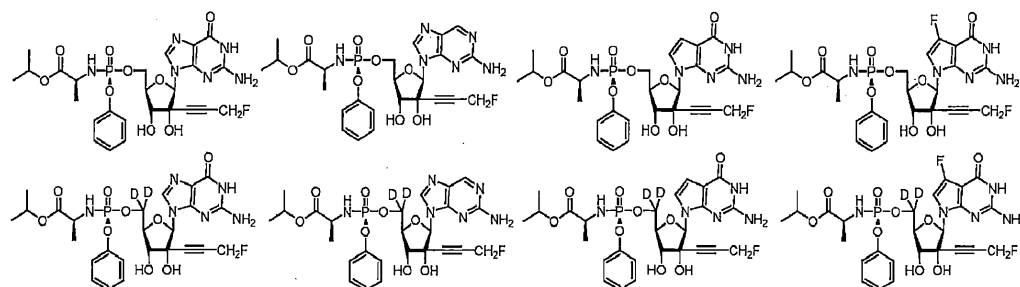
## 【化 19】



10



20

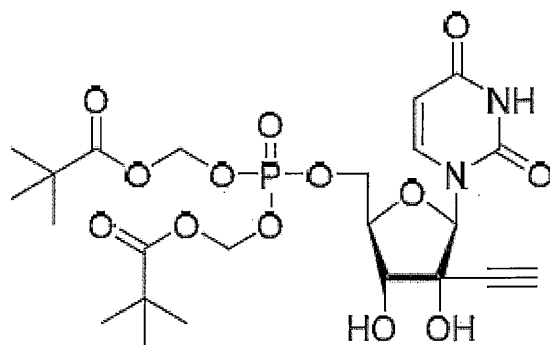


30

## 【請求項 8】

以下の構造を有する化合物。

## 【化 20】



40

## 【請求項 9】

請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される担体と、を含む、ウイルス感染の処置又は防止のための医薬組成物。

## 【請求項 10】

前記ウイルス感染が、RNA ウイルスを含む感染因子によって引き起こされる、請求項

50

9に記載の医薬組成物。

【請求項 1 1】

前記RNAウイルスがヘパシウイルス、フラビウイルス、ピコルナウイルス、デングウイルス、ダニ媒介性脳炎ウイルス、又はジカウイルスを含む、請求項 1 0に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2】

請求項 1 ~ 8のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される担体と、を含む組成物。

【請求項 1 3】

請求項 1 ~ 8のいずれか 1 項に記載の化合物と、A B T - 4 5 0、A B T - 2 6 7、A B T - 3 3 3、A B T - 4 9 3、A B T - 5 3 0、アバカビル、アシクロビル、アシクロビル、アデホビル、アマンタジン、アンブレナビル、アンプリジェン、アルピドール、アタザナビル、アトリブラ、ボセプレビル、シドホビル、コンビビル、ダクラタスビル、ダルナビル、ダサブビル、デラビルジン、ジダノシン、ドコサノール、エドクスジン、エファビレンツ、エムトリシタピン、エンフビルチド、エンテカビル、ファムシクロビル、ホミビルセン、ホスアンブレナビル、ホスカルネット、ホスホネット、ガンシクロビル、イバシタピン、イムノビル、イドクスウリジン、イミキモド、インジナビル、イノシン、インターフェロン I I I 型、インターフェロン I I 型、インターフェロン I 型、ラミブジン、レジパスビル、ロピナビル、ロビリド、マラビロク、モロキシジン、メチサゾン、ネルフィナビル、ネビラピン、ネキサビル、オムビタスビル、オセルタミビル、パリタプレビル、ペグインターフェロンアルファ - 2 a、ペンシクロビル、ペラミビル、プレコナリル、ポドフィロトキシン、ラルテグラビル、リバビリン、リマンタジン、リトナビル、ピラミジン、サキナビル、シメプレビル、ソホスブビル、スタブジン、テラプレビル、テルビブジン、テノホビル、テノホビルジソプロキシル、チプラナビル、トリフルリジン、トリジビル、トロマンタジン、ツルバダ、バラシクロビル、バルガンシクロビル、ピクリピロック、ピダラピン、ピラミジンザルシタピン、ザナミビル、又はジドブジン及びこれらの組み合わせから選択される少なくとも 1 つの第 2 の抗ウイルス剤と、を含む、組成物。

【請求項 1 4】

RNAウイルスによって引き起こされる感染の処置又は防止において使用するための請求項 1 ~ 8のいずれか 1 項に記載の化合物。—

【請求項 1 5】

前記RNAウイルスがヘパシウイルス、フラビウイルス、ピコルナウイルス、デングウイルス、ダニ媒介性脳炎ウイルス、又はジカウイルスを含む、請求項 1 4に記載の化合物—

【請求項 1 6】

RNAウイルスによって引き起こされる感染の処置又は防止において使用するための請求項 1 2 に記載の組成物。