

【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30年2月22日 (2018.2.22)

【公表番号】特表2017-504626(P2017-504626A)

【公表日】平成29年2月9日 (2017.2.9)

【年通号数】公開・登録公報2017-006

【出願番号】特願2016-547099(P2016-547099)

【国際特許分類】

C 0 7 D 223/04 (2006.01)

C 0 7 D 223/08 (2006.01)

C 0 7 D 267/10 (2006.01)

C 0 7 D 223/32 (2006.01)

C 0 7 D 221/22 (2006.01)

C 0 7 D 243/08 (2006.01)

C 0 7 D 295/26 (2006.01)

C 0 7 D 281/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

A 6 1 K 31/439 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

A 6 1 K 31/554 (2006.01)

A 6 1 K 31/675 (2006.01)

A 6 1 P 31/20 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 38/21 (2006.01)

A 6 1 K 39/29 (2006.01)

C 0 7 F 9/553 (2006.01)

C 0 7 F 9/6527 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 223/04

C 0 7 D 223/08 C S P

C 0 7 D 267/10

C 0 7 D 223/32

C 0 7 D 221/22

C 0 7 D 243/08 5 0 8

C 0 7 D 295/26

C 0 7 D 281/06

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 31/553

A 6 1 K 31/439

A 6 1 K 31/551

A 6 1 K 31/554

A 6 1 K 31/675

A 6 1 P 31/20

A 6 1 P 1/16

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 37/66 G
 A 6 1 K 39/29
 C 0 7 F 9/553
 C 0 7 F 9/6527

【手続補正書】

【提出日】平成30年1月12日(2018.1.12)

【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

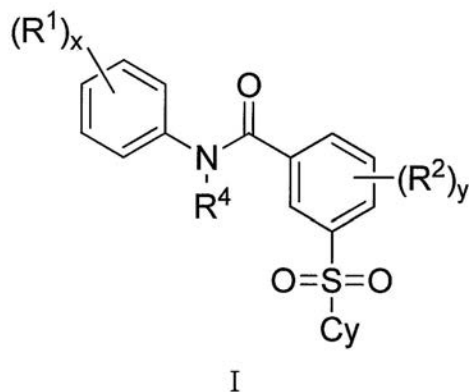
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物：

【化 1】



またはその薬学的に許容される塩であって；

式中

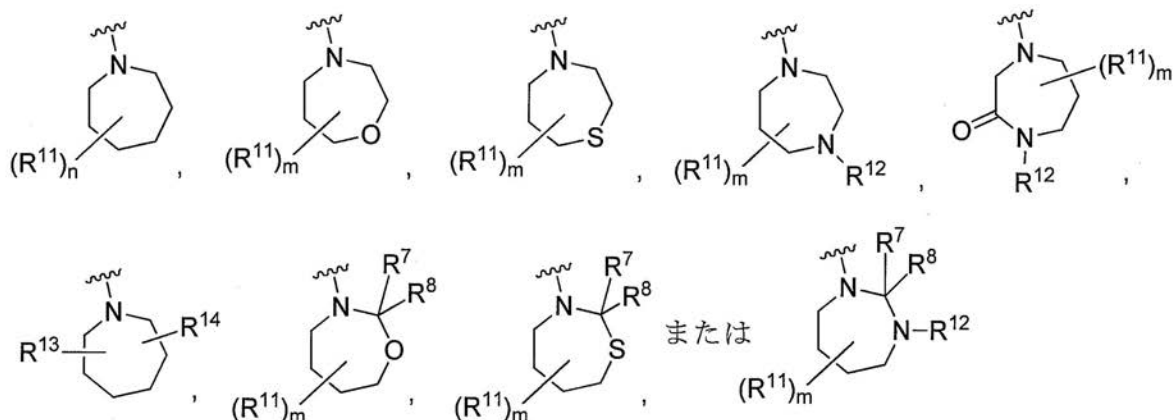
R⁴ は、H または C₁ - C₃ アルキルであり；

それぞれの R¹ は、それぞれの出現につき独立して、OH、ハロ、-CN、-NO₂、
 -C₁ - C₆ アルキル、-O - C₁ - C₆ アルキル、-C₁ - C₆ ヘテロアルキル、-O
 -C₁ - C₆ ヘテロアルキル、-C₃ - C₁₀ シクロアルキル、-C₃ - C₁₀ ヘテロシ
 クロアルキル、アリール、ヘテロアリール、-C₁ - C₄ アルキル - (C₃ - C₁₀ シク
 ロアルキル)、-C₁ - C₄ アルキル - (C₃ - C₁₀ ヘテロシクロアルキル)、-C₁
 - C₄ アルキル - (アリール) または -C₁ - C₄ アルキル - (ヘテロアリール) であり
 、式中前記アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリー
 ル及びヘテロアリール基は、ハロ、-OH、-CN または -NO₂ で 1 ~ 5 回任意に置換
 され；

それぞれの R² は、それぞれの出現につき独立して、OH、ハロ、-CN、-NO₂、
 R⁶ または OR⁶ であり、式中 R⁶ は、それぞれの出現につき独立して、-C₁ - C₆ ア
 ルキル、-C₁ - C₆ ヘテロアルキル、-C₃ - C₁₀ シクロアルキル、-C₃ - C₁₀
 ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、-C₁ - C₄ アルキル - (C₃ - C
₁₀ シクロアルキル)、-C₁ - C₄ アルキル - (C₃ - C₁₀ ヘテロシクロアルキル)
 、-C₁ - C₄ アルキル - (アリール) または -C₁ - C₄ アルキル - (ヘテロアリール
) であり、式中前記アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル
 、アリール及びヘテロアリール基は、ハロ、-OH、-CN または -NO₂ で 1 ~ 5 回任
 意に置換され；

Cy は、

【化 2】



であり；

R^7 及び R^8 は、それぞれの出現につき独立して、 $-C_1-C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-C_1-C_4$ アルキル-（アリール）または $-C_1-C_4$ アルキル-（ヘテロアリール）であり、式中前記アリールまたはヘテロアリール基は、 C_1-C_3 アルキルで任意に置換され；

または R^7 及び R^8 は、3～10員環を形成するために連結し；

R^{11} は、それぞれの出現につき独立して、OH、ハロ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C_1-C_6$ アルキル、 $-O-C_1-C_6$ アルキル、 $-C_1-C_6$ ヘテロアルキル、 $-O-C_1-C_6$ ヘテロアルキル、 $-C_3-C_{10}$ シクロアルキル、 $-C_3-C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-C_1-C_4$ アルキル-（ C_3-C_{10} シクロアルキル）、 $-C_1-C_4$ アルキル-（ C_3-C_{10} ヘテロシクロアルキル）、 $-C_1-C_4$ アルキル-（アリール）または $-C_1-C_4$ アルキル-（ヘテロアリール）であり、式中前記アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール基は、ハロ、 $-OH$ 、 $-CN$ または $-NO_2$ で1～5回任意に置換され；

R^{12} は、それぞれの出現につき独立して、Hまたは $-C_1-C_6$ アルキルであり；

R^{13} 及び R^{14} は、 CH_2 ブリッジを形成するために連結し；

mは、0、1、2、3または4であり；

nは、1、2、3または4であり；

xは、0、1、2、3、4または5であり；及び

yは、0、1、2、3または4である、前記化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

請求項 1 の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中

R^4 は、Hまたは $-C_1-C_3$ アルキルであり；

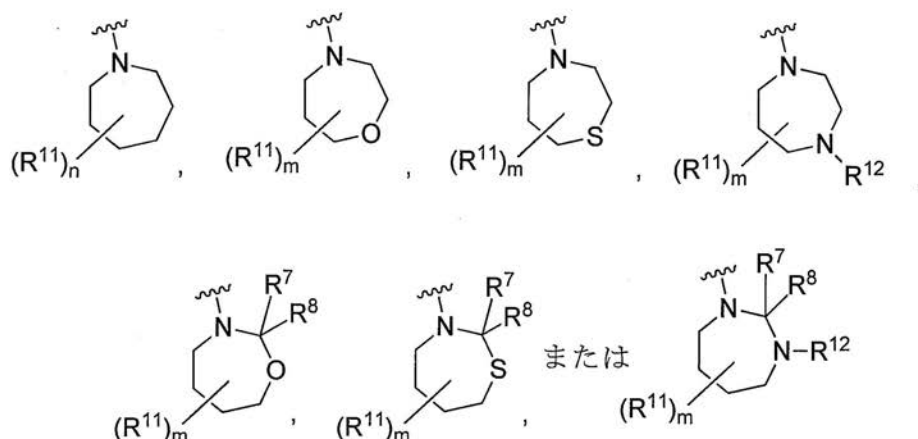
それぞれの R^1 は、それぞれの出現につき独立して、 $-OH$ 、ハロ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C_1-C_6$ アルキル、 $-O-C_1-C_6$ アルキル、 $-C_1-C_6$ ヘテロアルキル、 $-O-C_1-C_6$ ヘテロアルキル、 $-C_3-C_{10}$ シクロアルキル、 $-C_3-C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、 $-C_1-C_4$ アルキル-（ C_3-C_{10} シクロアルキル）または $-C_1-C_4$ アルキル-（ C_3-C_{10} ヘテロシクロアルキル）であり、式中前記アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキル基は、ハロ、 $-OH$ 、 $-CN$ または $-NO_2$ で1～3回任意に置換され；

それぞれの R^2 は、それぞれの出現につき独立して、 $-OH$ 、ハロ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 R^6 または $-OR^6$ であり、式中 R^6 は、それぞれの出現につき独立して、 $-C_1-C_6$ アルキル、 $-C_1-C_6$ ヘテロアルキル、 $-C_3-C_{10}$ シクロアルキル、 $-C_3-C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、 $-C_1-C_4$ アルキル-（ C_3-C_{10} シクロアルキル）または $-C_1-C_4$ アルキル-（ C_3-C_{10} ヘテロシクロアルキル）であり、式中前記アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキル基は、ハロ、 $-OH$

、 - CN または - NO₂ で 1 ~ 3 回任意に置換され；

Cy は、

【化 3】



であり；

R⁷ 及び R⁸ は、それぞれの出現につき独立して、- C₁ - C₆ アルキル、アリール、ヘテロアリール、- C₁ - C₄ アルキル - (アリール) または - C₁ - C₄ アルキル - (ヘテロアリール) であり；

または R⁷ 及び R⁸ は、3 ~ 7 員環を形成するために連結し；

R¹¹ は、それぞれの出現につき独立して、- OH、ハロ、- CN、- NO₂、- C₁ - C₆ アルキル、- O - C₁ - C₆ アルキル、- C₁ - C₆ ヘテロアルキル、- O - C₁ - C₆ ヘテロアルキル、- C₃ - C₁₀ シクロアルキル、- C₃ - C₁₀ ヘテロシクロアルキル、- C₁ - C₄ アルキル - (C₃ - C₁₀ シクロアルキル) または - C₁ - C₄ アルキル - (C₃ - C₁₀ ヘテロシクロアルキル) であり、式中前記アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキル基は、ハロ、- OH、- CN または - NO₂ で 1 ~ 3 回任意に置換され；

R¹² は、それぞれの出現につき独立して、H または - C₁ - C₆ アルキルであり；

m は、0、1、2 または 3 であり；

n は、1、2 または 3 であり；

x は、0、1、2 または 3 であり；及び

y は、0、1、2 または 3 である、前記化合物 またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 3】

請求項 1 もしくは 2 の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、

式中

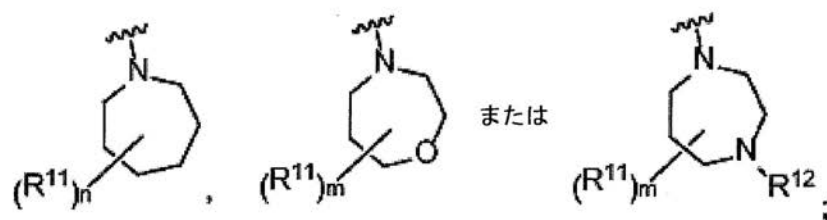
R⁴ は、H または C₁ - C₃ アルキルであり；

それぞれの R¹ は、それぞれの出現につき独立して、OH、ハロ、- C₁ - C₆ アルキル、- O - C₁ - C₆ アルキル、- C₁ - C₆ ヘテロアルキルまたは - O - C₁ - C₆ ヘテロアルキルであり、式中前記アルキル基は、ハロまたは - OH で 1 ~ 3 回任意に置換され；

それぞれの R² は、それぞれの出現につき独立して、OH、ハロ、R⁶ または OR⁶ であり、式中 R⁶ は、それぞれの出現につき独立して、- C₁ - C₆ アルキル、- C₃ - C₁₀ シクロアルキル、- C₁ - C₄ アルキル - (C₃ - C₁₀ シクロアルキル) であり、式中前記アルキル及びシクロアルキル基は、ハロまたは - OH で 1 ~ 3 回任意に置換され；

Cy は、

【化 4】



であり、

R^{1 1} は、それぞれの出現につき独立して、OH、ハロ、-C₁-C₆アルキル、-O-C₁-C₆アルキル、-C₁-C₆ヘテロアルキルまたは-O-C₁-C₆ヘテロアルキルであり、式中前記アルキル基は、ハロまたは-OHで1～3回任意に置換され；

R^{1 2} は、それぞれの出現につき独立して、Hまたは-C₁-C₆アルキルであり；

mは、0、1、2または3であり；

nは、1、2または3であり；

xは、0、1、2または3であり；及び

yは、0、1、2または3である、前記化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 4】

請求項 1～3 のいずれか 1 項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中 R⁴ は、Hである、前記化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 5】

請求項 1～2 のいずれか 1 項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中 R⁷ 及び R⁸ は、それぞれの出現につき独立して、-C₁-C₆アルキル、フェニル、ピリジル、ベンジルまたはピリジルメチルである、前記化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 6】

請求項 1～2 のいずれか 1 項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中 R⁷ 及び R⁸ は、それぞれの出現につき独立して、-C₁-C₆アルキルであり、式中前記 -C₁-C₆アルキル基は、3～7員環を形成するために連結する、前記化合物またはその薬学的に許容される塩。

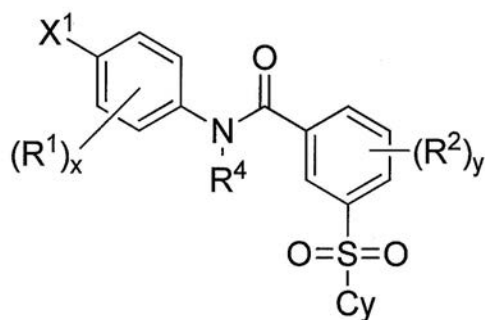
【請求項 7】

請求項 1～6 のいずれか 1 項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中それぞれの R¹ は、それぞれの出現につき独立して、ハロであり、及び x は、1、2または3である、前記化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 8】

請求項 1～7 のいずれか 1 項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式 I の前記化合物は、式 II：

【化 5】



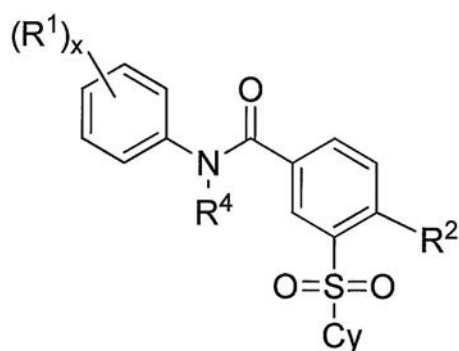
I I

であり、式中 X^1 は、ハロである、
前記化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 9】

請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、
式 I の前記化合物は、式 I I I :

【化 6】



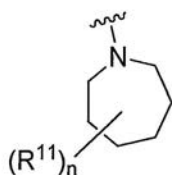
I I I

である、前記化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 10】

請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、
式中 Cy は、

【化 7】



である、前記化合物またはその薬学的に許容される塩。

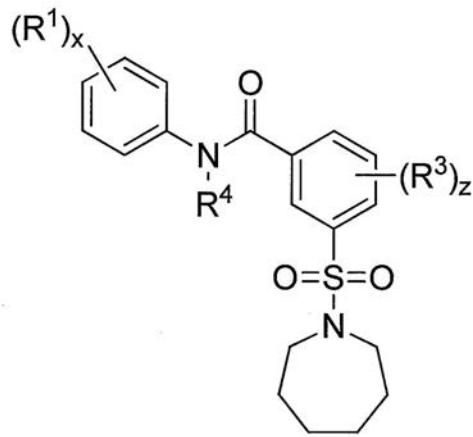
【請求項 11】

請求項 10 の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中それぞれの R^{11} は、それぞれの出現につき独立して、ハロ、OH、 $-C_1 - C_6$ アルキルまたは $-O - C_1 - C_6$ アルキルであり、式中前記アルキル基は、ハロまたは OH で 1 ~ 3 回任意に置換される、前記化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 12】

式 I V の化合物 :

【化 8】



I V

またはその薬学的に許容される塩であって；

式中

R^4 は、Hまたは $C_1 - C_3$ アルキルであり；

それぞれの R^1 は、それぞれの出現につき独立して、OH、ハロ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C_1 - C_6$ アルキル、 $-O - C_1 - C_6$ アルキル、 $-C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、 $-O - C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、 $-C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、 $-C_3 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-C_1 - C_4$ アルキル- ($C_3 - C_{10}$ シクロアルキル)、 $-C_1 - C_4$ アルキル- ($C_3 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル)、 $-C_1 - C_4$ アルキル- (アリール)または $-C_1 - C_4$ アルキル- (ヘテロアリール)であり、式中前記アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール基は、ハロ、 $-OH$ 、 $-CN$ または $-NO_2$ で1～5回任意に置換され；

それぞれの R^3 は、それぞれの出現につき独立して、OH、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C_1 - C_6$ アルキル、 $-C_1 - C_6$ アルコキシ、 R^9 または OR^9 であり、式中 R^9 は、それぞれの出現につき独立して、 $-C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、 $-C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、 $-C_3 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(CH_2)_1 - 4 - (C_3 - C_{10}$ シクロアルキル)、 $-(CH_2)_1 - 4 - (C_3 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル)、 $-(CH_2)_1 - 4 - (アリール)$ または $-(CH_2)_1 - 4 - (ヘテロアリール)$ であり、式中前記アルキル基は、ハロ、 $-OH$ 、 $-CN$ または $-NO_2$ で1～5回置換され；及び前記アルコキシ、 $-(CH_2)_1 - 4 -$ 、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール基は、ハロ、 $-OH$ 、 $-CN$ または $-NO_2$ で1～5回任意に置換され；

x は、0、1、2、3、4または5であり；及び

z は、1、2、3または4である、

前記化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 13】

請求項 12 の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中

R^4 は、Hまたは $C_1 - C_3$ アルキルであり；

それぞれの R^1 は、それぞれの出現につき独立して、OH、ハロ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C_1 - C_6$ アルキル、 $-O - C_1 - C_6$ アルキル、 $-C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、 $-O - C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、 $-C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、 $-C_3 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、 $-C_1 - C_4$ アルキル- ($C_3 - C_{10}$ シクロアルキル)または $-C_1 - C_4$ アルキル- ($C_3 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル)であり、式中前記アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキル基は、ハロ、 $-OH$ 、 $-CN$ また

は - NO₂ で 1 ~ 3 回任意に置換され；

それぞれの R³ は、それぞれの出現につき独立して、OH、- CN、- NO₂、- C₁ - C₆ アルキル、- C₁ - C₆ アルコキシ、R⁹ または OR⁹ であり、式中 R⁹ は、それぞれの出現につき独立して、- C₁ - C₆ ヘテロアルキル、- C₃ - C₁₀ シクロアルキル、- C₃ - C₁₀ ヘテロシクロアルキル、- (CH₂)₁₋₄ - (C₃ - C₁₀ シクロアルキル) または - (CH₂)₁₋₄ - (C₃ - C₁₀ ヘテロシクロアルキル) であり、式中前記アルキル基は、ハロ、- OH、- CN または - NO₂ で 1 ~ 3 回置換され；及び前記アルコキシ、- (CH₂)₁₋₄ -、ヘテロアルキル、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキル基は、ハロ、- OH、- CN または - NO₂ で 1 ~ 3 回任意に置換され；

x は、0、1、2 または 3 であり；及び

z は、1、2 または 3 である、

前記化合物 またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 14】

請求項 12 または 13 の前記化合物 またはその薬学的に許容される塩であって、
式中

R⁴ は、H または C₁ - C₃ アルキルであり；

それぞれの R¹ は、それぞれの出現につき独立して、OH、ハロ、- C₁ - C₆ アルキル、- O - C₁ - C₆ アルキル、- C₁ - C₆ ヘテロアルキルまたは - O - C₁ - C₆ ヘテロアルキルであり、式中前記アルキル基は、ハロまたは - OH で 1 ~ 3 回任意に置換され；

それぞれの R³ は、それぞれの出現につき独立して、OH、- C₁ - C₆ アルキル、- C₁ - C₆ アルコキシ、R⁹ または OR⁹ であり、式中 R⁹ は、それぞれの出現につき独立して、- C₃ - C₁₀ シクロアルキルまたは - (CH₂)₁₋₄ - (C₃ - C₁₀ シクロアルキル) であり、式中前記アルキル基は、ハロまたは - OH で 1 ~ 3 回置換され；及び前記アルコキシ、- (CH₂)₁₋₄ - 及びシクロアルキル基は、ハロまたは - OH で 1 ~ 3 回任意に置換され；

x は、0、1、2 または 3 であり；及び

z は、1、2 または 3 である、

前記化合物 またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 15】

請求項 12 ~ 14 のいずれか 1 項の前記化合物 またはその薬学的に許容される塩であって、 式中 R⁴ は、H である、前記化合物 またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 16】

請求項 12 ~ 15 のいずれか 1 項の前記化合物 またはその薬学的に許容される塩であって、 式中それぞれの R¹ は、それぞれの出現につき独立して、ハロであり、及び x は、1、2 または 3 である、前記化合物 またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 17】

請求項 12 ~ 16 のいずれか 1 項の前記化合物 またはその薬学的に許容される塩であって、 式中それぞれの R³ は、それぞれの出現につき独立して、OH または - C₁ - C₆ アルキルであり、式中前記アルキル基は、ハロまたは - OH で 1 ~ 3 回置換され、及び z は、1、2 または 3 である、前記化合物 またはその薬学的に許容される塩。

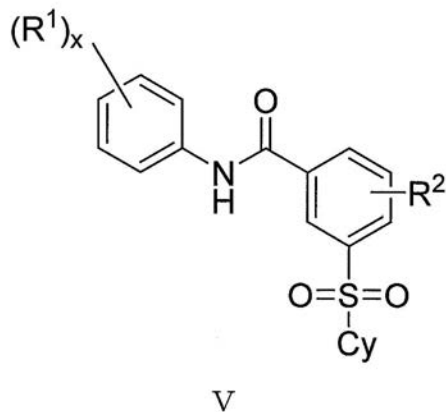
【請求項 18】

請求項 12 ~ 17 のいずれか 1 項の前記化合物 またはその薬学的に許容される塩であって、 式中 R³ は、- C₁ - C₃ アルキル - OH であり、及び z は、1 である、前記化合物 またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 19】

請求項 1 の前記化合物 またはその薬学的に許容される塩 であって、式 I の前記化合物は、式 V の化合物：

【化 9】



であり；

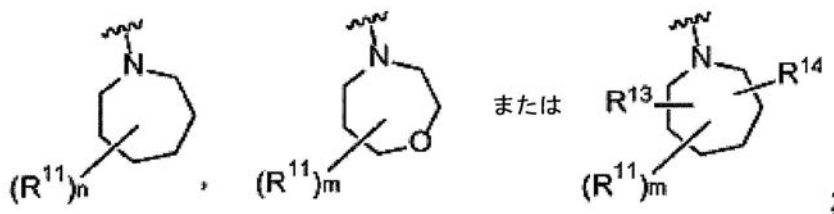
式中

それぞれの R^1 は、それぞれの出現につき独立して、ハロ、OH、 $-C_1 - C_6$ アルキルまたは $-O - C_1 - C_6$ アルキルであり、式中前記アルキル基は、ハロまたはOHで1～3回任意に置換され；

それぞれの R^2 は、それぞれの出現につき独立して、ハロ、OH、 $-C_1 - C_6$ アルキルまたは $-O - C_1 - C_6$ アルキルであり、式中前記アルキル基は、ハロまたはOHで1～3回任意に置換され；

Cy は、

【化 10】



であり；

R^{11} は、それぞれの出現につき独立して、 $-OH$ 、ハロ、 $-C_1 - C_6$ アルキル、 $-OC(O)CH_3$ または $-C_3 - C_{10}$ シクロアルキルであり；

R^{13} 及び R^{14} は、これらが付着する炭素と共に、シクロプロピル環を形成するために連結し；

m は、1、2 または 3 であり；

n は、1、2 または 3 であり；及び

x は、2 または 3 である、

前記化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 20】

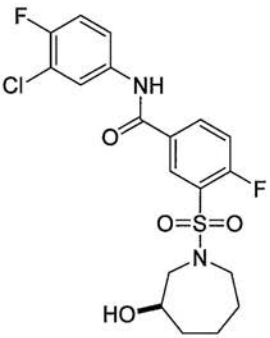
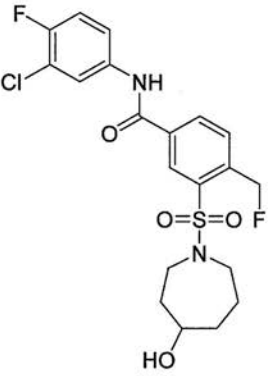
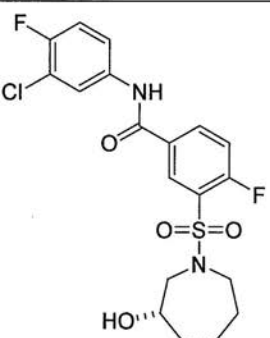
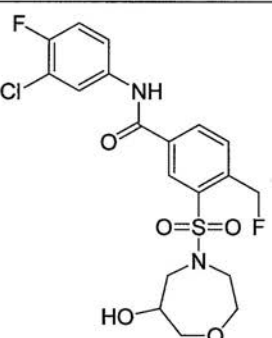
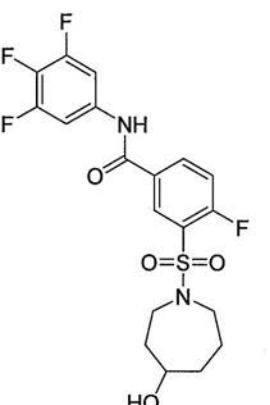
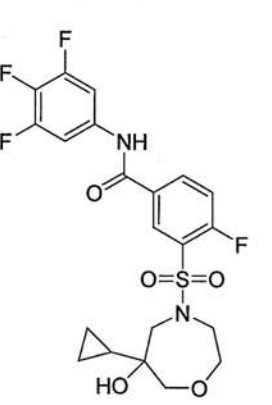
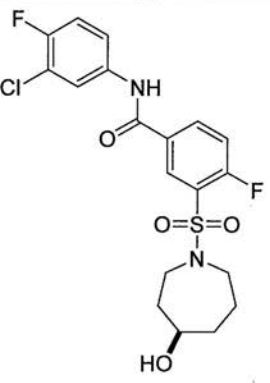
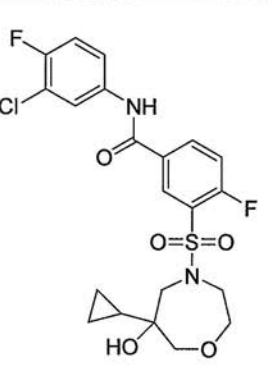
請求項 19 の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中それぞれの R^1 は、それぞれの出現につき独立して、ハロである、前記化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 21】

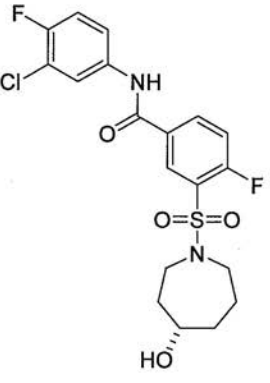
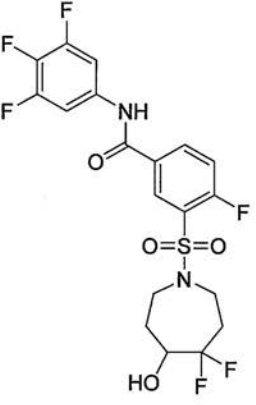
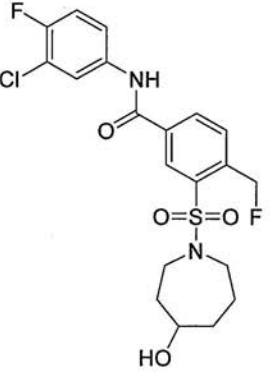
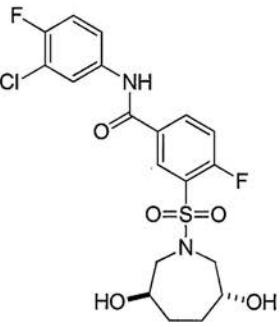
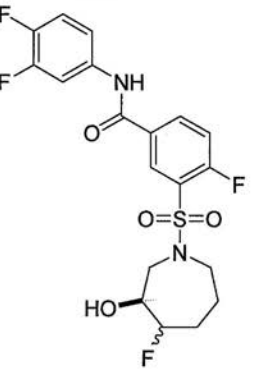
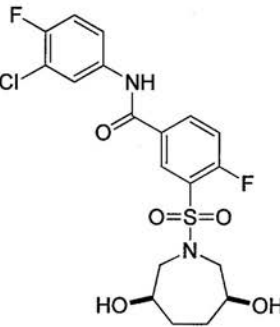
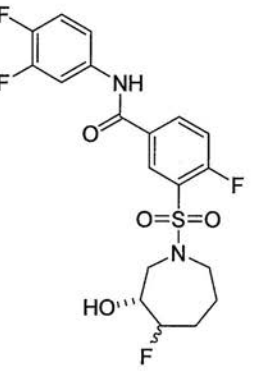
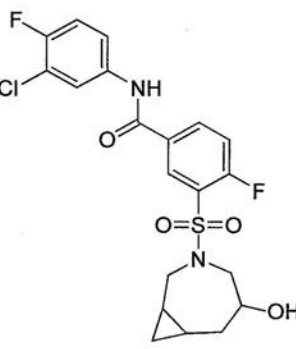
請求項 19 の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中それぞれの R^2 は、それぞれの出現につき独立して、ハロまたは $-C_1 - C_6$ アルキルであり、式中前記アルキルは、ハロで1～3回任意に置換される、前記化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 22】


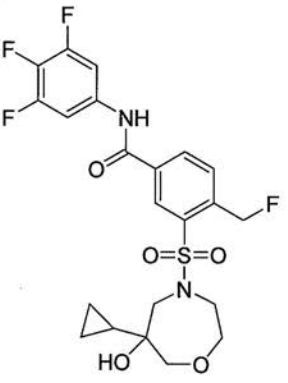
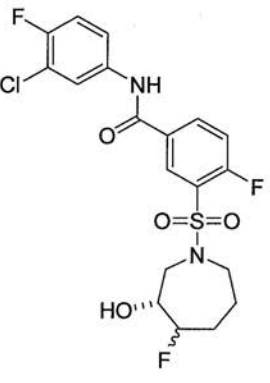
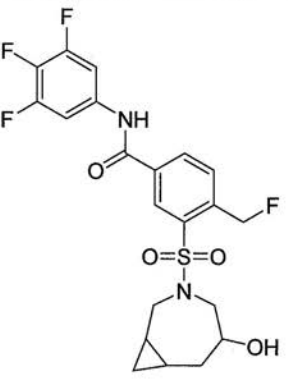
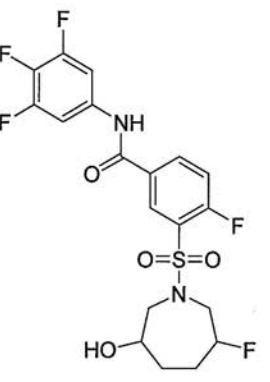
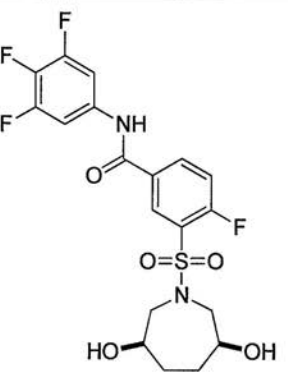
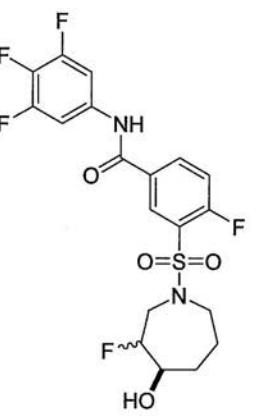
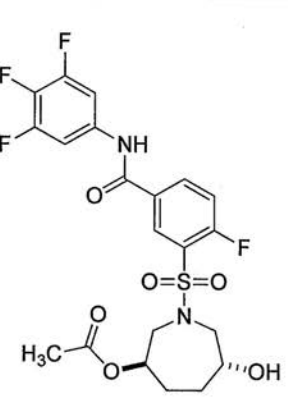
請求項 19 の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、前記化合物は：
【表 1 - 1】

	1 7 6 3 _ E 1			1 9 1 6
	1 7 6 3 _ E 2			1 9 8 3
	1 7 6 5			1 9 8 7
	1 7 6 6 _ E 1			1 9 8 9

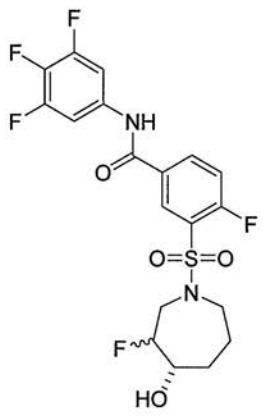
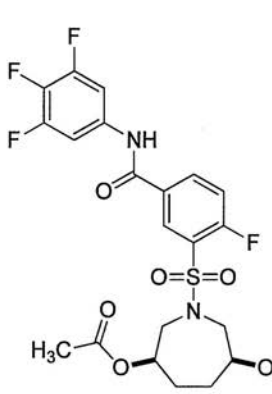
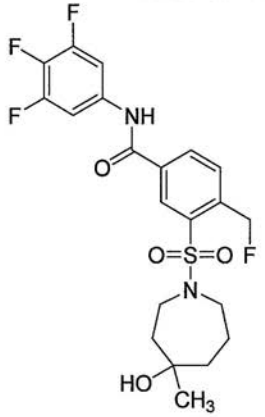
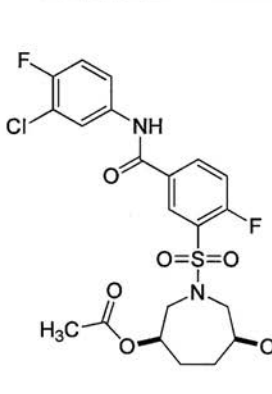
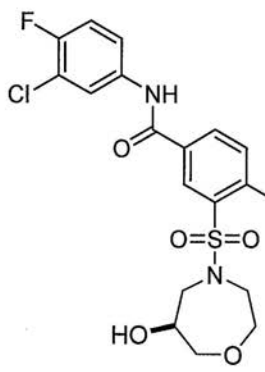
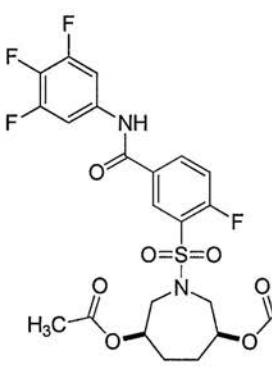
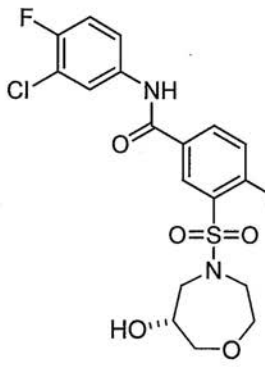
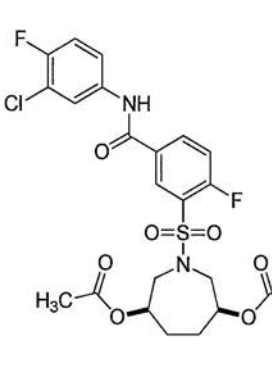
【表 1 - 2】

	1 7 6 6 _ E 2			2 2 0 2
	1 8 1 9			2 4 3 3 _ D 1
	1 8 2 1 _ D 1			2 4 3 3 _ D 2
	1 8 2 1 _ D 2			2 4 9 2

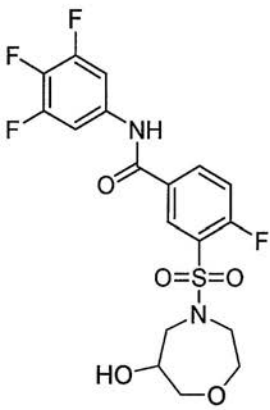
【表 1 - 3】

	1 8 2 2 _ D 1			2 5 0 5
	1 8 2 2 _ D 2			2 5 5 0
	1 8 2 6 _ D 2			2 6 1 7 _ D 2
	1 8 2 9 _ D 1			2 6 1 8 _ D 1

【表 1 - 4】

	1 8 2 9 _ D 2			2 6 1 8 _ D 2
	1 8 2 9 _ 2			2 6 1 9 _ D 2
	1 8 9 3 _ E 1			2 6 2 5 _ D 2
	1 8 9 3 _ E 2			2 6 2 6 _ D 2

【表 1 - 5】

	1 8 9 5			
---	---------	--	--	--

から選択される、前記化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 23】

薬学的に許容される担体と共に、請求項 1 ~ 22 のいずれか 1 項の化合物またはその薬学的に許容される塩を含む医薬組成物。

【請求項 24】

それを必要とする個体における H B V 感染を治療するのに用いるための医薬組成物であって、請求項 1 ~ 22 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を含む、前記医薬組成物。

【請求項 25】

請求項 24 の前記医薬組成物であって、H B V ポリメラーゼ阻害剤、免疫調節薬、ペグ化インターフェロン、ウイルス侵入阻害剤、ウイルス成熟阻害剤、文献に記述されたカプシド構築モジュレーター、逆転写酵素阻害剤、サイクロフィリン / T N F 阻害剤、T L R - アゴニスト及び H B V ワクチン及びそれらの組み合わせからなる群より選択される少なくとも 1 つのさらなる治療薬と組み合わせて用いられる、前記医薬組成物。

【請求項 26】

請求項 25 の前記医薬組成物であって、前記治療薬は、インターフェロンアルファ (I F N -)、インターフェロンベータ (I F N -)、インターフェロンラムダ (I F N -) 及びインターフェロンガンマ (I F N -) からなる群より選択されるインターフェロンである、前記医薬組成物。

【請求項 27】

請求項 26 の前記医薬組成物であって、前記インターフェロンは、インターフェロンアルファ - 2 a、インターフェロンアルファ - 2 b またはインターフェロンアルファ - n 1 である、前記医薬組成物。

【請求項 28】

請求項 26 または 27 の前記医薬組成物であって、前記インターフェロンアルファ - 2 a またはインターフェロンアルファ - 2 b は、ペグ化される、前記医薬組成物。

【請求項 29】

請求項 26 ~ 28 のいずれか 1 項の前記医薬組成物であって、前記インターフェロンアルファ - 2 a は、ペグ化インターフェロンアルファ - 2 a (P E G A S Y S) である、前記医薬組成物。

【請求項 30】

請求項 24 ~ 29 のいずれか 1 項の前記医薬組成物であって、少なくとも 1 つの H B V ワクチン、ヌクレオシド H B V 阻害剤、インターフェロンまたはそれらの任意の組み合わせと組み合わせて用いられる、前記医薬組成物。

【手続補正２】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】０８３０

【補正方法】変更

【補正の内容】

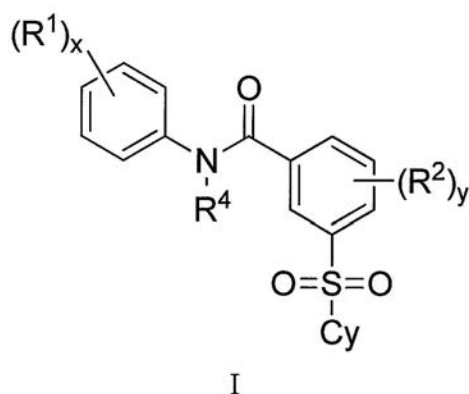
【０８３０】

本発明が具体的実施形態に関して開示される一方、本発明のその他の実施形態及び変更は、本発明の真の精神及び範囲を逸脱しない範囲で他の当業者によって考案されてもよいことは、明らかである。添付の特許請求の範囲は、全てのこのような実施形態及び均等物変化を含むと解釈されることを意図する。

本発明は以下の態様を包含し得る。

[１] 式 I の化合物：

【化 ３ ４ ０ - １】



またはその薬学的に許容される塩であって；

式中

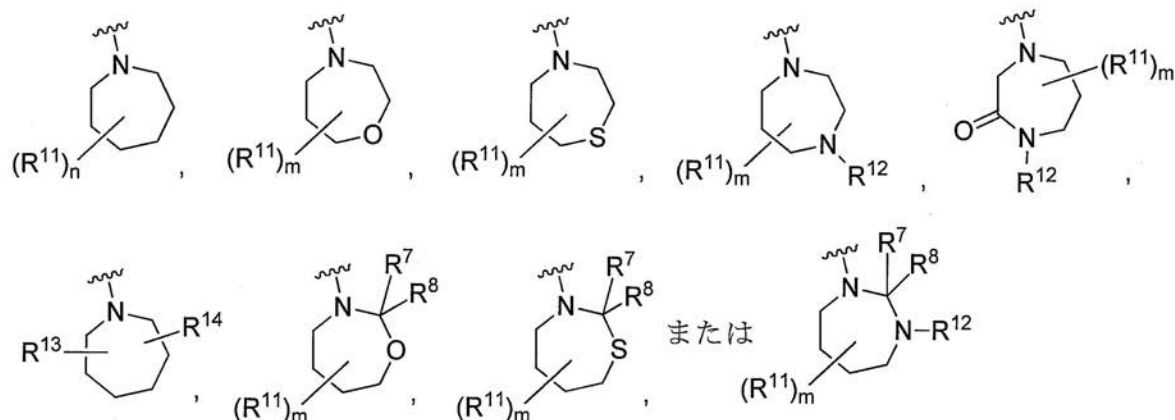
R⁴ は、HまたはC₁ - C₃ アルキルであり；

それぞれの R¹ は、それぞれの出現につき独立して、OH、ハロ、-CN、-NO₂、-C₁ - C₆ アルキル、-O - C₁ - C₆ アルキル、-C₁ - C₆ ヘテロアルキル、-O - C₁ - C₆ ヘテロアルキル、-C₃ - C₁₀ シクロアルキル、-C₃ - C₁₀ ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、-C₁ - C₄ アルキル - (C₃ - C₁₀ シクロアルキル)、-C₁ - C₄ アルキル - (C₃ - C₁₀ ヘテロシクロアルキル)、-C₁ - C₄ アルキル - (アリール)または -C₁ - C₄ アルキル - (ヘテロアリール)であり、式中前記アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール基は、ハロ、-OH、-CNまたは-NO₂で1～5回任意に置換され；

それぞれの R² は、それぞれの出現につき独立して、OH、ハロ、-CN、-NO₂、R⁶またはOR⁶であり、式中 R⁶ は、それぞれの出現につき独立して、-C₁ - C₆ アルキル、-C₁ - C₆ ヘテロアルキル、-C₃ - C₁₀ シクロアルキル、-C₃ - C₁₀ ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、-C₁ - C₄ アルキル - (C₃ - C₁₀ シクロアルキル)、-C₁ - C₄ アルキル - (C₃ - C₁₀ ヘテロシクロアルキル)、-C₁ - C₄ アルキル - (アリール)または -C₁ - C₄ アルキル - (ヘテロアリール)であり、式中前記アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール基は、ハロ、-OH、-CNまたは-NO₂で1～5回任意に置換され；

Cy は、

【化 3 4 0 - 2】



であり；

R^7 及び R^8 は、それぞれの出現につき独立して、 $-C_1-C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-C_1-C_4$ アルキル-（アリール）または $-C_1-C_4$ アルキル-（ヘテロアリール）であり、式中前記アリールまたはヘテロアリール基は、 C_1-C_3 アルキルで任意に置換され；

または R^7 及び R^8 は、3～10員環を形成するために連結し；

R^{11} は、それぞれの出現につき独立して、OH、ハロ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C_1-C_6$ アルキル、 $-O-C_1-C_6$ アルキル、 $-C_1-C_6$ ヘテロアルキル、 $-O-C_1-C_6$ ヘテロアルキル、 $-C_3-C_{10}$ シクロアルキル、 $-C_3-C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-C_1-C_4$ アルキル-（ C_3-C_{10} シクロアルキル）、 $-C_1-C_4$ アルキル-（ C_3-C_{10} ヘテロシクロアルキル）、 $-C_1-C_4$ アルキル-（アリール）または $-C_1-C_4$ アルキル-（ヘテロアリール）であり、式中前記アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール基は、ハロ、 $-OH$ 、 $-CN$ または $-NO_2$ で1～5回任意に置換され；

R^{12} は、それぞれの出現につき独立して、Hまたは $-C_1-C_6$ アルキルであり；

R^{13} 及び R^{14} は、 CH_2 ブリッジを形成するために連結し；

mは、0、1、2、3または4であり；

nは、1、2、3または4であり；

xは、0、1、2、3、4または5であり；及び

yは、0、1、2、3または4である、前記化合物。

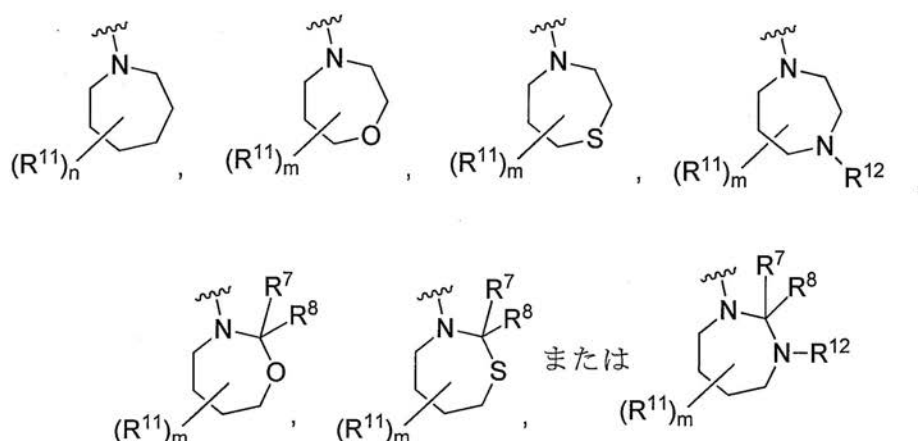
[2] 上記 [1] の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中

R^4 は、Hまたは $-C_1-C_3$ アルキルであり；

それぞれの R^1 は、それぞれの出現につき独立して、 $-OH$ 、ハロ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C_1-C_6$ アルキル、 $-O-C_1-C_6$ アルキル、 $-C_1-C_6$ ヘテロアルキル、 $-O-C_1-C_6$ ヘテロアルキル、 $-C_3-C_{10}$ シクロアルキル、 $-C_3-C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、 $-C_1-C_4$ アルキル-（ C_3-C_{10} シクロアルキル）または $-C_1-C_4$ アルキル-（ C_3-C_{10} ヘテロシクロアルキル）であり、式中前記アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキル基は、ハロ、 $-OH$ 、 $-CN$ または $-NO_2$ で1～3回任意に置換され；

それぞれの R^2 は、それぞれの出現につき独立して、 $-OH$ 、ハロ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 R^6 または $-OR^6$ であり、式中 R^6 は、それぞれの出現につき独立して、 $-C_1-C_6$ アルキル、 $-C_1-C_6$ ヘテロアルキル、 $-C_3-C_{10}$ シクロアルキル、 $-C_3-C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、 $-C_1-C_4$ アルキル-（ C_3-C_{10} シクロアルキル）または $-C_1-C_4$ アルキル-（ C_3-C_{10} ヘテロシクロアルキル）であり、式中前記アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキル基は、ハロ、 $-OH$ 、 $-CN$ または $-NO_2$ で1～3回任意に置換され；

C_y は、
【化 3 4 0 - 3】



であり；

R⁷ 及び R⁸ は、それぞれの出現につき独立して、- C₁ - C₆ アルキル、アリール、ヘテロアリール、- C₁ - C₄ アルキル - (アリール) または - C₁ - C₄ アルキル - (ヘテロアリール) であり；

または R⁷ 及び R⁸ は、3 ~ 7 員環を形成するために連結し；

R¹¹ は、それぞれの出現につき独立して、- OH、ハロ、- CN、- NO₂、- C₁ - C₆ アルキル、- O - C₁ - C₆ アルキル、- C₁ - C₆ ヘテロアルキル、- O - C₁ - C₆ ヘテロアルキル、- C₃ - C₁₀ シクロアルキル、- C₃ - C₁₀ ヘテロシクロアルキル、- C₁ - C₄ アルキル - (C₃ - C₁₀ シクロアルキル) または - C₁ - C₄ アルキル - (C₃ - C₁₀ ヘテロシクロアルキル) であり、式中前記アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキル基は、ハロ、- OH、- CN または - NO₂ で 1 ~ 3 回任意に置換され；

R¹² は、それぞれの出現につき独立して、H または - C₁ - C₆ アルキルであり；

m は、0、1、2 または 3 であり；

n は、1、2 または 3 であり；

x は、0、1、2 または 3 であり；及び

y は、0、1、2 または 3 である、前記化合物。

[3] 上記 [1] もしくは [2] の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、

式中

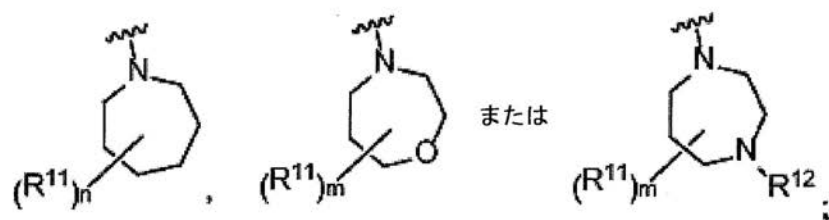
R⁴ は、H または C₁ - C₃ アルキルであり；

それぞれの R¹ は、それぞれの出現につき独立して、OH、ハロ、- C₁ - C₆ アルキル、- O - C₁ - C₆ アルキル、- C₁ - C₆ ヘテロアルキルまたは - O - C₁ - C₆ ヘテロアルキルであり、式中前記アルキル基は、ハロまたは - OH で 1 ~ 3 回任意に置換され；

それぞれの R² は、それぞれの出現につき独立して、OH、ハロ、R⁶ または OR⁶ であり、式中 R⁶ は、それぞれの出現につき独立して、- C₁ - C₆ アルキル、- C₃ - C₁₀ シクロアルキル、- C₁ - C₄ アルキル - (C₃ - C₁₀ シクロアルキル) であり、式中前記アルキル及びシクロアルキル基は、ハロまたは - OH で 1 ~ 3 回任意に置換され；

C_y は、

【化 3 4 0 - 4】



であり、

R^{11} は、それぞれの出現につき独立して、 OH 、ハロ、 $-C_1 - C_6$ アルキル、 $-O - C_1 - C_6$ アルキル、 $-C_1 - C_6$ ヘテロアルキルまたは $-O - C_1 - C_6$ ヘテロアルキルであり、式中前記アルキル基は、ハロまたは $-OH$ で 1 ~ 3 回任意に置換され；

R^{12} は、それぞれの出現につき独立して、 H または $-C_1 - C_6$ アルキルであり；

m は、0、1、2 または 3 であり；

n は、1、2 または 3 であり；

x は、0、1、2 または 3 であり；及び

y は、0、1、2 または 3 である、前記化合物。

[4] 上記 [1] ~ [3] のいずれか 1 項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中 R^4 は、 H である、前記化合物。

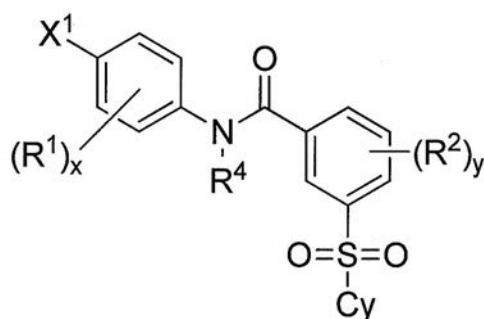
[5] 上記 [1] ~ [2] のいずれか 1 項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中 R^7 及び R^8 は、それぞれの出現につき独立して、 $-C_1 - C_6$ アルキル、フェニル、ピリジル、ベンジルまたはピリジリルメチルである、前記化合物。

[6] 上記 [1] ~ [2] のいずれか 1 項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中 R^7 及び R^8 は、それぞれの出現につき独立して、 $-C_1 - C_6$ アルキルであり、式中前記 $-C_1 - C_6$ アルキル基は、3 ~ 7 員環を形成するために連結する、前記化合物。

[7] 上記 [1] ~ [6] のいずれか 1 項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中それぞれの R^1 は、それぞれの出現につき独立して、ハロであり、及び x は、1、2 または 3 である、前記化合物。

[8] 上記 [1] ~ [7] のいずれか 1 項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式 I の前記化合物は、式 I I :

【化 3 4 0 - 5】



I I

であり、式中 X^1 は、ハロである、
前記化合物。

[9] 上記 [1] ~ [8] のいずれか 1 項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中それぞれの R^2 は、それぞれの出現につき独立して、ハロ、 OH 、 $-C_1 - C_6$ アルキルまたは $-O - C_1 - C_6$ アルキルであり、式中前記アルキル基は、ハロ

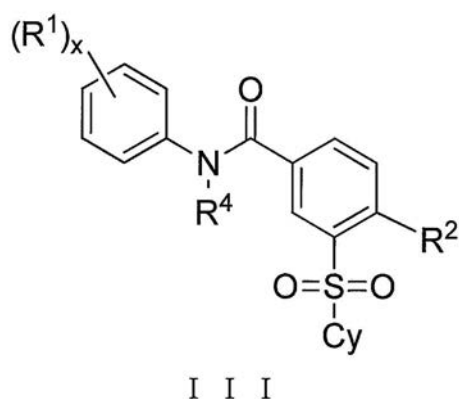
またはOHで1～3回任意に置換される、前記化合物。

[10] 上記[1]～[9]のいずれか1項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中 R^2 は、それぞれの出現につき独立して、ハロまたは $-C_1-C_3$ アルキル-OHであり、及び y は、1または2である、前記化合物。

[11] 上記[1]～[8]のいずれか1項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中それぞれの R^2 は、それぞれの出現につき独立して、 OR^6 であり、式中 R^6 は、それぞれの出現につき独立して、 $-C_1-C_6$ アルキルまたは $-C_3-C_1$ シクロアルキルであり、式中前記アルキル及びシクロアルキル基は、ハロまたはOHで1～2回任意に置換される、前記化合物。

[12] 上記[1]～[11]のいずれか1項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式Iの前記化合物は、式III:

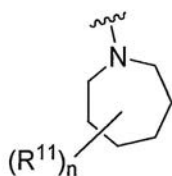
【化340-6】



である、前記化合物。

[13] 上記[1]～[12]のいずれか1項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中Cyは、

【化340-7】

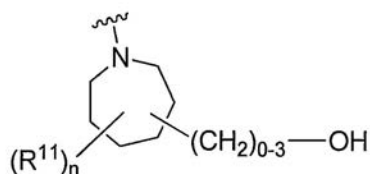


である、前記化合物。

[14] 上記[13]の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中それぞれの R^{11} は、それぞれの出現につき独立して、ハロ、OH、 $-C_1-C_6$ アルキルまたは $-O-C_1-C_6$ アルキルであり、式中前記アルキル基は、ハロまたはOHで1～3回任意に置換される、前記化合物。

[15] 上記[13]または[14]の前記化合物であって、式中Cyは、

【化340-8】



であり、及び n は、0、1または2である、前記化合物。

[16] 上記[15]の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中 R^{11} は、 $-O-C_1-C_3$ アルキルであり、及び n は、1である、前記化合物。

[1 7] 上記 [1 5] の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中 R^{11} は、OH または $-C_1-C_3$ アルキル-OH であり、及び n は、1 である、前記化合物。

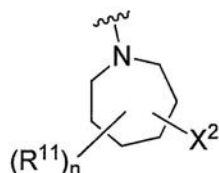
[1 8] 上記 [1 5] の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、 n は、0 である、前記化合物。

[1 9] 上記 [1 5] の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中 R^{11} は、ハロであり、及び n は、1 である、前記化合物。

[2 0] 上記 [1 5] の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中 R^{11} は、 $-C_1-C_3$ アルキルであり、及び n は、1 である、前記化合物。

[2 1] 上記 [1 3] または [1 4] の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中 C_y は、

【化 3 4 0 - 9】

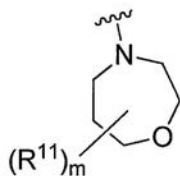


であり、式中 X^2 は、ハロであり、及び n は、0、1 または 2 である、前記化合物。

[2 2] 上記 [2 1] の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中 n は、0 である、前記化合物。

[2 3] 上記 [1] ~ [1 2] のいずれか 1 項の前記化合物であって、式中 C_y は、

【化 3 4 0 - 1 0】



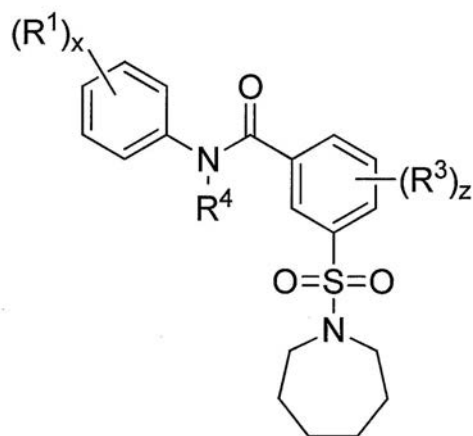
である、前記化合物。

[2 4] 上記 [2 3] の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中それぞれの R^{11} は、それぞれの出現につき独立して、OH または $-C_1-C_3$ アルキルであり、式中前記アルキル基は、ハロまたは OH で 1 ~ 3 回任意に置換され、及び m は、1 または 2 である、前記化合物。

[2 5] 上記 [2 3] の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中 m は、0 である、前記化合物。

[2 6] 式 I V の化合物：

【化 3 4 0 - 1 1】



I V

またはその薬学的に許容される塩であって；

式中

R^4 は、Hまたは $C_1 - C_3$ アルキルであり；

それぞれの R^1 は、それぞれの出現につき独立して、OH、ハロ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C_1 - C_6$ アルキル、 $-O - C_1 - C_6$ アルキル、 $-C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、 $-O - C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、 $-C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、 $-C_3 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-C_1 - C_4$ アルキル - ($C_3 - C_{10}$ シクロアルキル)、 $-C_1 - C_4$ アルキル - ($C_3 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル)、 $-C_1 - C_4$ アルキル - (アリール)または $-C_1 - C_4$ アルキル - (ヘテロアリール)であり、式中前記アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール基は、ハロ、 $-OH$ 、 $-CN$ または $-NO_2$ で1～5回任意に置換され；

それぞれの R^3 は、それぞれの出現につき独立して、OH、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C_1 - C_6$ アルキル、 $-C_1 - C_6$ アルコキシ、 R^9 または OR^9 であり、式中 R^9 は、それぞれの出現につき独立して、 $-C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、 $-C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、 $-C_3 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(CH_2)_1 - 4 - (C_3 - C_{10})$ シクロアルキル、 $-(CH_2)_1 - 4 - (C_3 - C_{10})$ ヘテロシクロアルキル、 $-(CH_2)_1 - 4 - (アリール)$ または $-(CH_2)_1 - 4 - (ヘテロアリール)$ であり、式中前記アルキル基は、ハロ、 $-OH$ 、 $-CN$ または $-NO_2$ で1～5回置換され；及び前記アルコキシ、 $-(CH_2)_1 - 4 -$ 、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール基は、ハロ、 $-OH$ 、 $-CN$ または $-NO_2$ で1～5回任意に置換され；

x は、0、1、2、3、4または5であり；及び

z は、1、2、3または4である、

前記化合物。

[2 7] 上記 [2 6] の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中

R^4 は、Hまたは $C_1 - C_3$ アルキルであり；

それぞれの R^1 は、それぞれの出現につき独立して、OH、ハロ、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C_1 - C_6$ アルキル、 $-O - C_1 - C_6$ アルキル、 $-C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、 $-O - C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、 $-C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、 $-C_3 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、 $-C_1 - C_4$ アルキル - ($C_3 - C_{10}$ シクロアルキル)または $-C_1 - C_4$ アルキル - ($C_3 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル)であり、式中前記アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキル基は、ハロ、 $-OH$ 、 $-CN$ または $-NO_2$ で1～3回任意に置換され；

それぞれの R^3 は、それぞれの出現につき独立して、 OH 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-C_1$ 、 $-C_6$ アルキル、 $-C_1 - C_6$ アルコキシ、 R^9 または OR^9 であり、式中 R^9 は、それぞれの出現につき独立して、 $-C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、 $-C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、 $-C_3 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、 $-(CH_2)_{1-4} - (C_3 - C_{10}$ シクロアルキル) または $-(CH_2)_{1-4} - (C_3 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル) であり、式中前記アルキル基は、ハロ、 $-OH$ 、 $-CN$ または $-NO_2$ で 1 ~ 3 回置換され；及び前記アルコキシ、 $-(CH_2)_{1-4}$ 、ヘテロアルキル、シクロアルキル及びヘテロシクロアルキル基は、ハロ、 $-OH$ 、 $-CN$ または $-NO_2$ で 1 ~ 3 回任意に置換され；

x は、0、1、2 または 3 であり；及び

z は、1、2 または 3 である、

前記化合物。

[2 8] 上記 [2 6] または [2 7] の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、

式中

R^4 は、 H または $C_1 - C_3$ アルキルであり；

それぞれの R^1 は、それぞれの出現につき独立して、 OH 、ハロ、 $-C_1 - C_6$ アルキル、 $-O - C_1 - C_6$ アルキル、 $-C_1 - C_6$ ヘテロアルキルまたは $-O - C_1 - C_6$ ヘテロアルキルであり、式中前記アルキル基は、ハロまたは $-OH$ で 1 ~ 3 回任意に置換され；

それぞれの R^3 は、それぞれの出現につき独立して、 OH 、 $-C_1 - C_6$ アルキル、 $-C_1 - C_6$ アルコキシ、 R^9 または OR^9 であり、式中 R^9 は、それぞれの出現につき独立して、 $-C_3 - C_{10}$ シクロアルキルまたは $-(CH_2)_{1-4} - (C_3 - C_{10}$ シクロアルキル) であり、式中前記アルキル基は、ハロまたは $-OH$ で 1 ~ 3 回置換され；及び前記アルコキシ、 $-(CH_2)_{1-4}$ 及びシクロアルキル基は、ハロまたは $-OH$ で 1 ~ 3 回任意に置換され；

x は、0、1、2 または 3 であり；及び

z は、1、2 または 3 である、

前記化合物。

[2 9] 上記 [2 6] ~ [2 8] のいずれか 1 項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中 R^4 は、 H である、前記化合物。

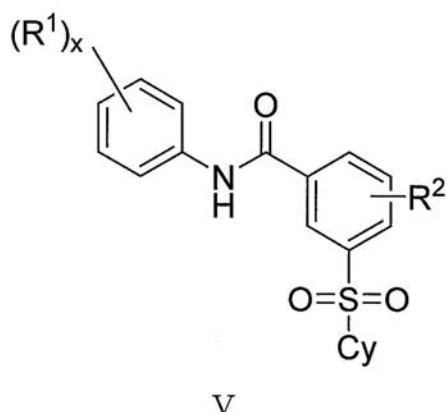
[3 0] 上記 [2 6] ~ [2 9] のいずれか 1 項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中それぞれの R^1 は、それぞれの出現につき独立して、ハロであり、及び x は、1、2 または 3 である、前記化合物。

[3 1] 上記 [2 6] ~ [3 0] のいずれか 1 項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中それぞれの R^3 は、それぞれの出現につき独立して、 OH または $-C_1 - C_6$ アルキルであり、式中前記アルキル基は、ハロまたは $-OH$ で 1 ~ 3 回置換され、及び z は、1、2 または 3 である、前記化合物。

[3 2] 上記 [2 6] ~ [3 1] のいずれか 1 項の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中 R^3 は、 $-C_1 - C_3$ アルキル - OH であり、及び z は、1 である、前記化合物。

[3 3] 上記 [1] の前記化合物であって、式 I の前記化合物は、式 V の化合物：

【化 3 4 0 - 1 2】



またはその薬学的に許容される塩であり；

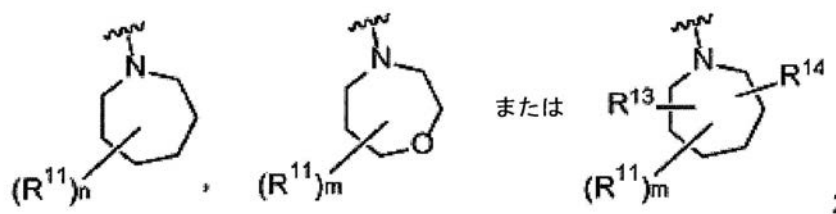
式中

それぞれの R^1 は、それぞれの出現につき独立して、ハロ、OH、 $-C_1 - C_6$ アルキルまたは $-O - C_1 - C_6$ アルキルであり、式中前記アルキル基は、ハロまたはOHで1～3回任意に置換され；

それぞれの R^2 は、それぞれの出現につき独立して、ハロ、OH、 $-C_1 - C_6$ アルキルまたは $-O - C_1 - C_6$ アルキルであり、式中前記アルキル基は、ハロまたはOHで1～3回任意に置換され；

Cy は、

【化 3 4 0 - 1 3】



であり；

R^{11} は、それぞれの出現につき独立して、 $-OH$ 、ハロ、 $-C_1 - C_6$ アルキル、 $-OC(O)CH_3$ または $-C_3 - C_{10}$ シクロアルキルであり；

R^{13} 及び R^{14} は、これらが付着する炭素と共に、シクロプロピル環を形成するために連結し；

m は、1、2 または 3 であり；

n は、1、2 または 3 であり；及び

x は、2 または 3 である、

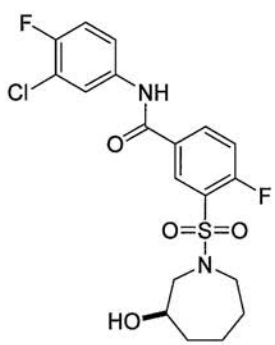
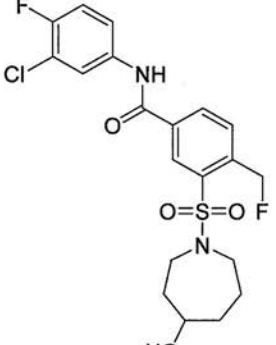
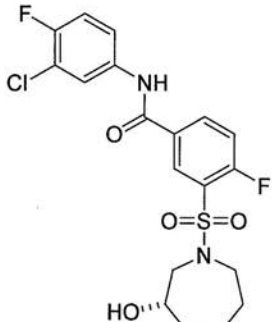
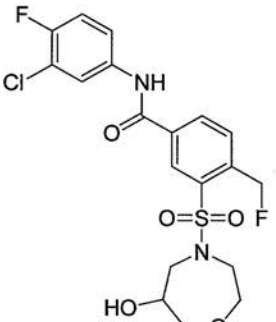
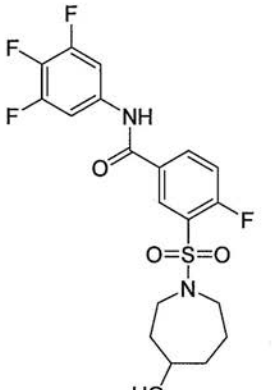
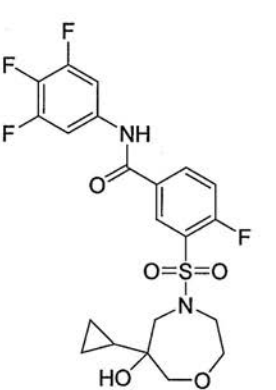
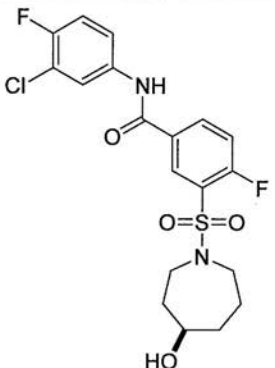
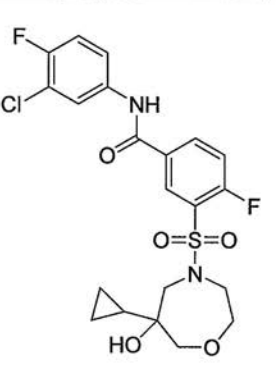
前記化合物。

[3 4] 上記 [3 3] の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中それぞれの R^1 は、それぞれの出現につき独立して、ハロである、前記化合物。

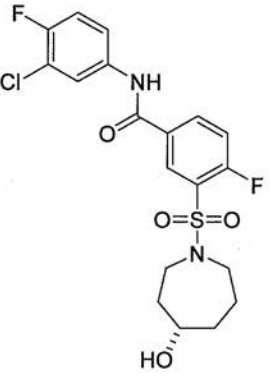
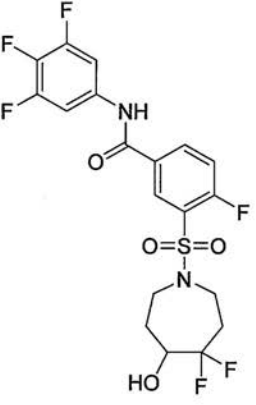
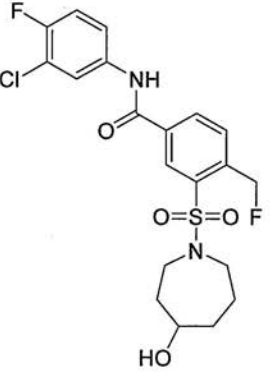
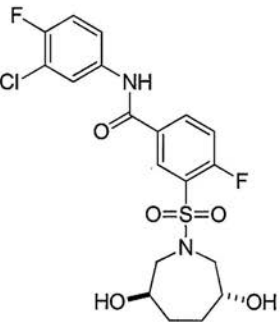
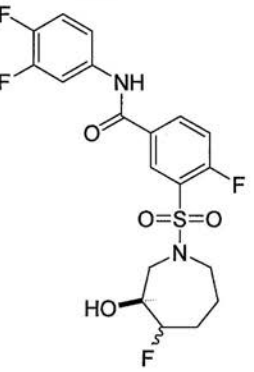
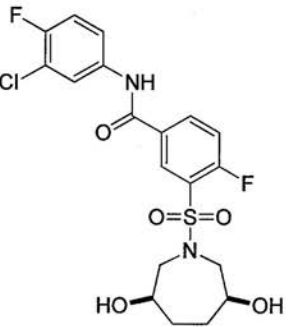
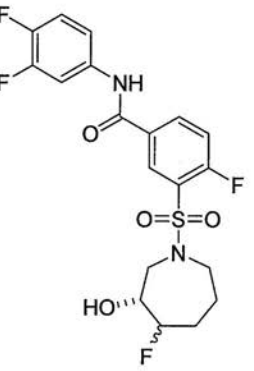
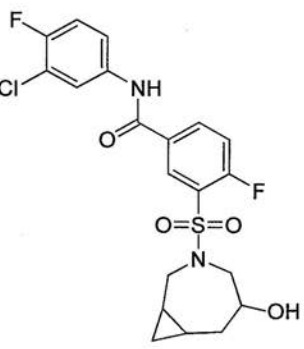
[3 5] 上記 [3 3] の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、式中それぞれの R^2 は、それぞれの出現につき独立して、ハロまたは $-C_1 - C_6$ アルキルであり、式中前記アルキルは、ハロで1～3回任意に置換される、前記化合物。

[3 6] 上記 [3 3] の前記化合物またはその薬学的に許容される塩であって、前記化合物は；


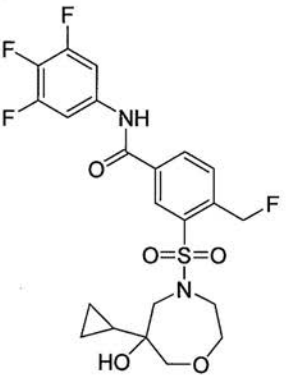
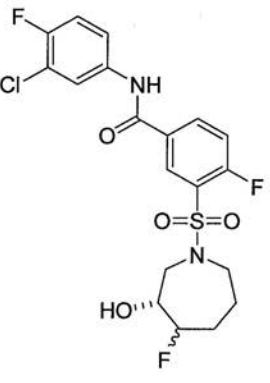
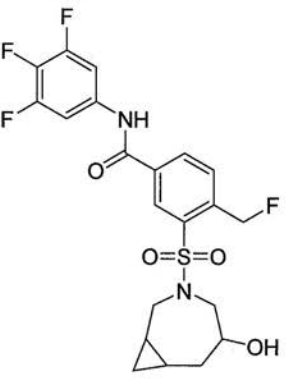
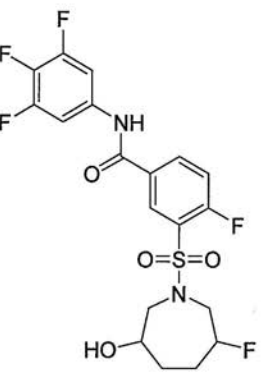
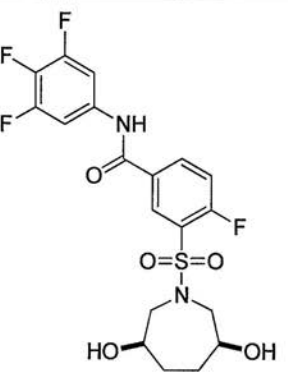
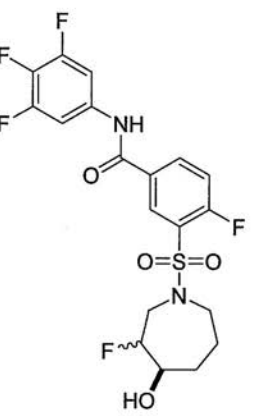
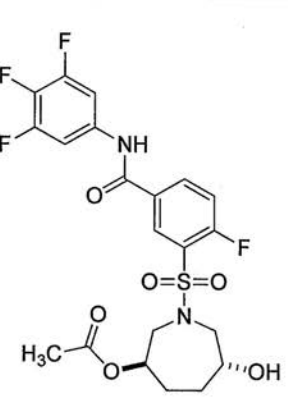
【表 6 - 1】

	1 7 6 3 _ E 1		1 9 1 6
	1 7 6 3 _ E 2		1 9 8 3
	1 7 6 5		1 9 8 7
	1 7 6 6 _ E 1		1 9 8 9

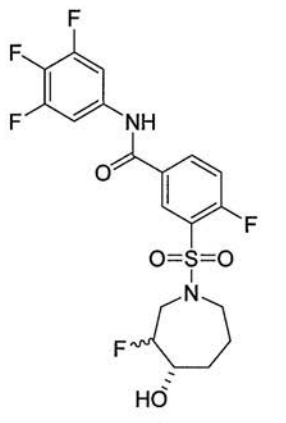
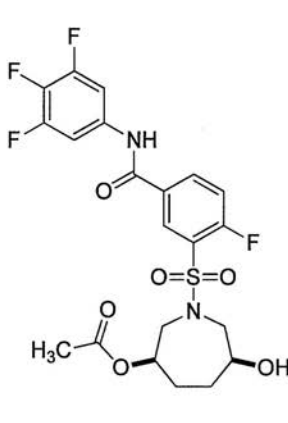
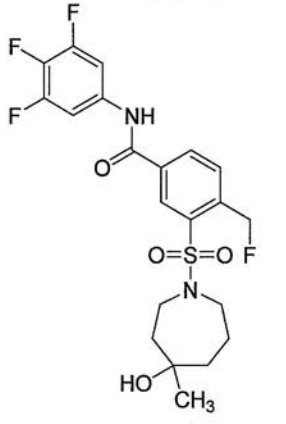
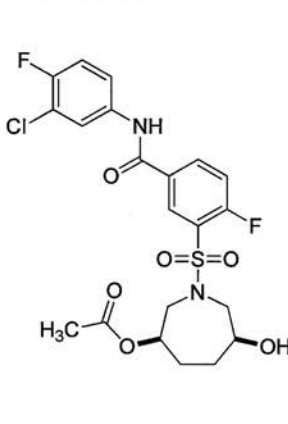
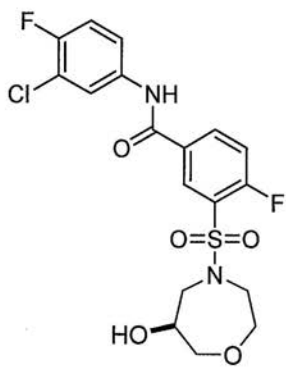
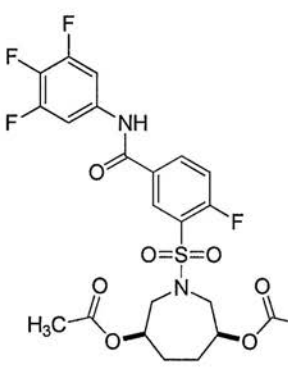
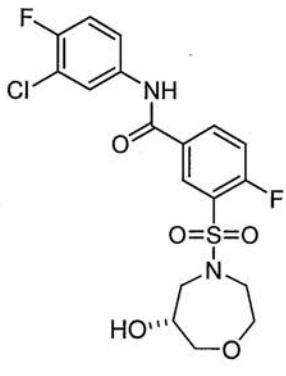
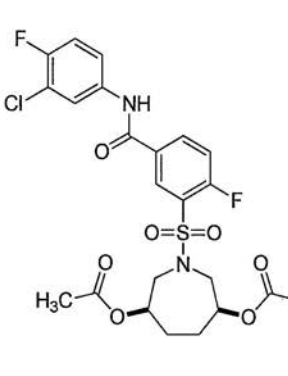
【表 6 - 2】

	1 7 6 6 _ E 2			2 2 0 2
	1 8 1 9			2 4 3 3 _ D 1
	1 8 2 1 _ D 1			2 4 3 3 _ D 2
	1 8 2 1 _ D 2			2 4 9 2

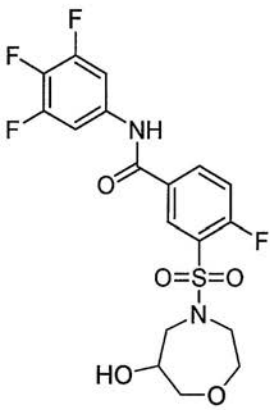
【表 6 - 3】

	1 8 2 2 _ D 1			2 5 0 5
	1 8 2 2 _ D 2			2 5 5 0
	1 8 2 6 _ D 2			2 6 1 7 _ D 2
	1 8 2 9 _ D 1			2 6 1 8 _ D 1

【表 6 - 4】

	1 8 2 9 _ D 2			2 6 1 8 _ D 2
	1 8 2 9 - 2			2 6 1 9 _ D 2
	1 8 9 3 _ E 1			2 6 2 5 _ D 2
	1 8 9 3 _ E 2			2 6 2 6 _ D 2

【表 6 - 5】

	1 8 9 5			
---	---------	--	--	--

から選択される、前記化合物。

[3 7] 薬学的に許容される担体と共に、上記 [1] ~ [3 6] のいずれか 1 項の化合物を含む医薬組成物またはその薬学的に許容される塩。

[3 8] それを必要とする個体における H B V 感染を治療する方法であって、上記 [1] ~ [3 6] のいずれか 1 項に記載の化合物の治療上有効な量を前記個体に投与することを含む、前記方法。

[3 9] それを必要とする個体における H B V 感染と関連するウイルス量を減少させる方法であって、上記 [1] ~ [3 6] のいずれか 1 項に記載の化合物の治療上有効な量を前記個体に投与することを含む、前記方法。

[4 0] それを必要とする個体における H B V 感染の再発を減少させる方法であって、上記 [1] ~ [3 6] のいずれか 1 項に記載の化合物の治療上有効な量を前記個体に投与することを含む、前記方法。

[4 1] それを必要とする個体における H B V 感染による肝臓傷害の緩解を誘導する方法であって、上記 [1] ~ [3 6] のいずれか 1 項に記載の化合物の治療上有効な量を前記個体に投与することを含む、前記方法。

[4 2] 上記 [3 8] ~ [4 1] のいずれかの前記方法であって、H B V ポリメラーゼ阻害剤、免疫調節薬、ペグ化インターフェロン、ウイルス侵入阻害剤、ウイルス成熟阻害剤、文献に記述されたカプシド構築モジュレーター、逆転写酵素阻害剤、サイクロフィリン / T N F 阻害剤、T L R - アゴニスト及び H B V ワクチン及びそれらの組み合わせからなる群より選択される少なくとも 1 つのさらなる治療薬を前記個体に投与することをさらに含む、前記方法。

[4 3] 上記 [4 2] の前記方法であって、前記治療薬は、逆転写酵素阻害剤であり、ジドブジン、ジダノシン、ザルシタビン、d d A、スタブジン、ラミブジン、アバカビル、エムトリシタビン、エンテカビル、アブリシタビン、アテビラビン、リバビリン、アシクロビル、ファムシクロビル、パラシクロビル、ガンシクロビル、バルガンシクロビル、テノホビル、アデホビル、シドホビル、エファビレンツ、ネビラビン、デラビルジン及びエトラビリンの少なくとも 1 つである、前記方法。

[4 4] 上記 [4 2] の前記方法であって、前記治療薬は、T L R アゴニストであり、及び前記 T L R アゴニストは、S M 3 6 0 3 2 0 (9 - ベンジル - 8 - ヒドロキシ - 2 - (2 - メトキシ - エトキシ) アデニン) 及び A Z D 8 8 4 8 (メチル [3 - ({ [3 - (6 - アミノ - 2 - ブトキシ - 8 - オキソ - 7 , 8 - ジヒドロ - 9 H - プリン - 9 - イル) プロピル] [3 - (4 - モルホリニル) プロピル] アミノ } メチル) フェニル] アセテート) からなる群より選択される T L R - 7 アゴニストである、前記方法。

[4 5] 上記 [4 2] の前記方法であって、前記治療薬は、インターフェロンアルファ (I F N -) 、インターフェロンベータ (I F N -) 、インターフェロンラムダ (I

FN -) 及びインターフェロンガンマ (IFN -) からなる群より選択されるインターフェロンである、前記方法。

[4 6] 上記 [4 5] の前記方法であって、前記インターフェロンは、インターフェロナルファ - 2 a、インターフェロナルファ - 2 b またはインターフェロナルファ - n 1 である、前記方法。

[4 7] 上記 [4 5] または [4 6] の前記方法であって、前記インターフェロナルファ - 2 a またはインターフェロナルファ - 2 b は、ペグ化される、前記方法。

[4 8] 上記 [4 5] ~ [4 7] のいずれか 1 項の前記方法であって、前記インターフェロナルファ - 2 a は、ペグ化インターフェロナルファ - 2 a (PEGASYS) である、前記方法。

[4 9] 上記 [4 2] ~ [4 8] のいずれか 1 項の前記方法であって、上記 [1] ~ [3 6] のいずれか 1 項に記載の前記化合物を投与することは、それを必要とする個体における HBV 感染を予防的に治療することにおいて類似の結果を達成するために必要とされる前記少なくとも 1 つのさらなる治療薬単独を投与することと比較して、より低い用量または頻度での前記少なくとも 1 つのさらなる治療薬の投与を可能にする、前記方法。

[5 0] 上記 [3 8] ~ [4 9] のいずれか 1 項の前記方法であって、上記 [1] ~ [3 6] のいずれか 1 項に記載の前記化合物を投与することは、HBV ポリメラーゼ阻害剤、インターフェロン、ウイルス侵入阻害剤、ウイルス成熟阻害剤、特有のカプシド構築モジュレーター、特有のまたは未知の機構の抗ウイルス化合物及びそれらの任意の組み合わせからなる群より選択される化合物の投与と比較して、より大きい程度まで、またはより速い速度で前記個体におけるウイルス量を減少させる、前記方法。

[5 1] 上記 [3 8] ~ [5 0] のいずれか 1 項の前記方法であって、上記 [1] ~ [3 6] のいずれか 1 項に記載の前記化合物を投与することは、HBV ポリメラーゼ阻害剤、インターフェロン、ウイルス侵入阻害剤、ウイルス成熟阻害剤、特有のカプシド構築モジュレーター、特有のまたは未知の機構の抗ウイルス化合物及びそれらの組み合わせからなる群より選択される化合物の投与より低いウイルス突然変異及び / またはウイルス抵抗性の発生率をもたらす、前記方法。

[5 2] 上記 [3 8] ~ [5 1] のいずれか 1 項の前記方法であって、少なくとも 1 つの HBV ワクチン、ヌクレオシド HBV 阻害剤、インターフェロンまたはそれらの任意の組み合わせを前記個体に投与することをさらに含む、前記方法。

[5 3] 上記 [5 2] の前記方法であって、前記 HBV ワクチンは、RECOMBIVAX HB、ENGERIX - B、ELOVAC B、GENEVAC - B 及び SHANVAC B からなる群より選択される、前記方法。

[5 4] それを必要とする個体における HBV 感染を治療する方法であって、上記 [1] ~ [3 6] のいずれか 1 項に記載の化合物の治療上有効な量単独で、または逆転写酵素阻害剤と組み合わせて前記個体に投与すること ; 及び HBV ワクチンの治療上有効な量を前記個体にさらに投与することによって HBV ウイルス量を減少させる、前記方法。

[5 5] 前記被験体の HBV ウイルス量をモニターすることをさらに含む上記 [3 8] ~ [5 4] のいずれか 1 項の前記方法であって、前記方法は、HBV ウイルスが検出不可能となる一定期間実施される、前記方法。