

【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4年11月1日(2022.11.1)

【国際公開番号】WO2020/084491

【公表番号】特表2022-505637(P2022-505637A)

【公表日】令和4年1月14日(2022.1.14)

【年通号数】公開公報(特許)2022-006

【出願番号】特願2021-522048(P2021-522048)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 0 1 / 1 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 3 1 / 1 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 4 3 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 4 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 4 0 3 / 1 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 4 1 3 / 1 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 4 9 8 / 0 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 1 7 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 4 1 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 5 3 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 4 9 1 / 1 0 7 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 1 3 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 9 8 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 9 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

【 F I 】

C 0 7 D 4 0 1 / 1 4 C S P

A 6 1 P 3 1 / 1 8

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 2 1

A 6 1 K 4 5 / 0 0

C 0 7 D 4 0 3 / 1 4

C 0 7 D 4 1 3 / 1 4

C 0 7 D 4 9 8 / 0 8

A 6 1 K 3 1 / 5 1 7

A 6 1 K 3 1 / 5 5

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7

A 6 1 K 3 1 / 5 4 1

A 6 1 K 3 1 / 5 5 3

C 0 7 D 4 9 1 / 1 0 7

A 6 1 K 3 1 / 5 1 3

A 6 1 K 3 1 / 4 9 8 5

A 6 1 K 3 1 / 4 9 6

【手続補正書】

【提出日】令和4年10月21日(2022.10.21)

【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

10

20

30

40

50

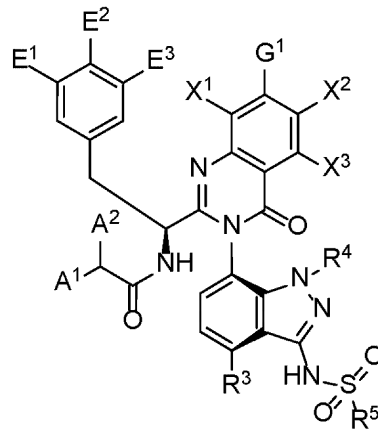
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物、又はその薬学的に許容される塩：

【化1】



式I

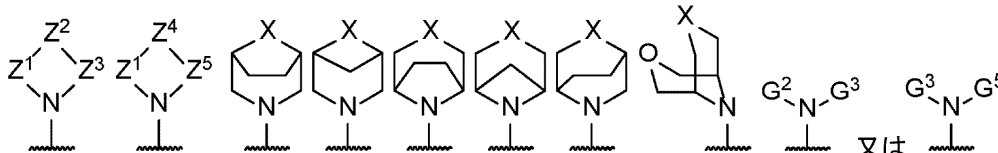
10

[式中、

20

G<sup>1</sup>は、

【化2】



から選択され、

Z<sup>1</sup>は、G<sup>4</sup>で場合により1回置換されており、また-CH<sub>3</sub>で場合により1回置換されている -C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキレンであり、

30

Z<sup>2</sup>は、-O-、-S-、-S(O<sub>2</sub>)-、-NH-、-N(G<sup>6</sup>)-、-N(C(O)G<sup>6</sup>)-、-N(SO<sub>2</sub>G<sup>6</sup>)-、-CH(G<sup>4</sup>)-、-C(G<sup>6</sup>)(G<sup>4</sup>)-、-C(F)(F)-、-C(-C<sub>s</sub>~C<sub>6</sub>アルキレン)-、-C(-O(C<sub>s</sub>~C<sub>5</sub>アルキレン)-)、-C(-(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキレン)-O-(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキレン)-)、-C(-(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキレン)-NH-(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキレン)-)-又は-C(-(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキレン)-N(G<sup>6</sup>)-(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキレン)-)-であり、

Z<sup>3</sup>は、G<sup>4</sup>で場合により1回置換されており、また-CH<sub>3</sub>で場合により1回置換されている -C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキレンであり、

Z<sup>4</sup>は、-C(H)=C(H)-、-N(H)S(O<sub>2</sub>)-又は-N(G<sup>6</sup>)S(O<sub>2</sub>)-であり、

Z<sup>5</sup>は、G<sup>4</sup>で場合により1回置換されており、また-CH<sub>3</sub>で場合により1回置換されている -C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキレンであり、

40

Xは、Z<sup>2</sup>又はZ<sup>4</sup>であり、

G<sup>2</sup>は、水素又はC<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキルであり、

G<sup>3</sup>は、-CH(G<sup>6</sup>)G<sup>7</sup>、-C(CH<sub>3</sub>)(G<sup>6</sup>)G<sup>7</sup>、C<sub>4</sub>~C<sub>6</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキルであり、ここで、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキルは、1~3個のフッ素で置換されており、

G<sup>4</sup>は、水素、F、OH、CN、-PO(OG<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、-SO<sub>3</sub>H、-S(O<sub>2</sub>)N(G<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、-S(O<sub>2</sub>)G<sup>6</sup>、-OG<sup>6</sup>、G<sup>6</sup>、1~2個のフッ素で場合により置換されている-C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル、CH<sub>2</sub>OH、CH<sub>2</sub>OG<sup>6</sup>、G<sup>7</sup>又はOG<sup>7</sup>であり、

G<sup>5</sup>は、水素若しくはC<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル、又はG<sup>3</sup>であり、

G<sup>6</sup>は、1~3個のフッ素で場合により置換されているC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、又は1~2個のフ

50

ッ素で場合により置換されているC<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキルであり、

G<sup>7</sup>はフェニルであり、

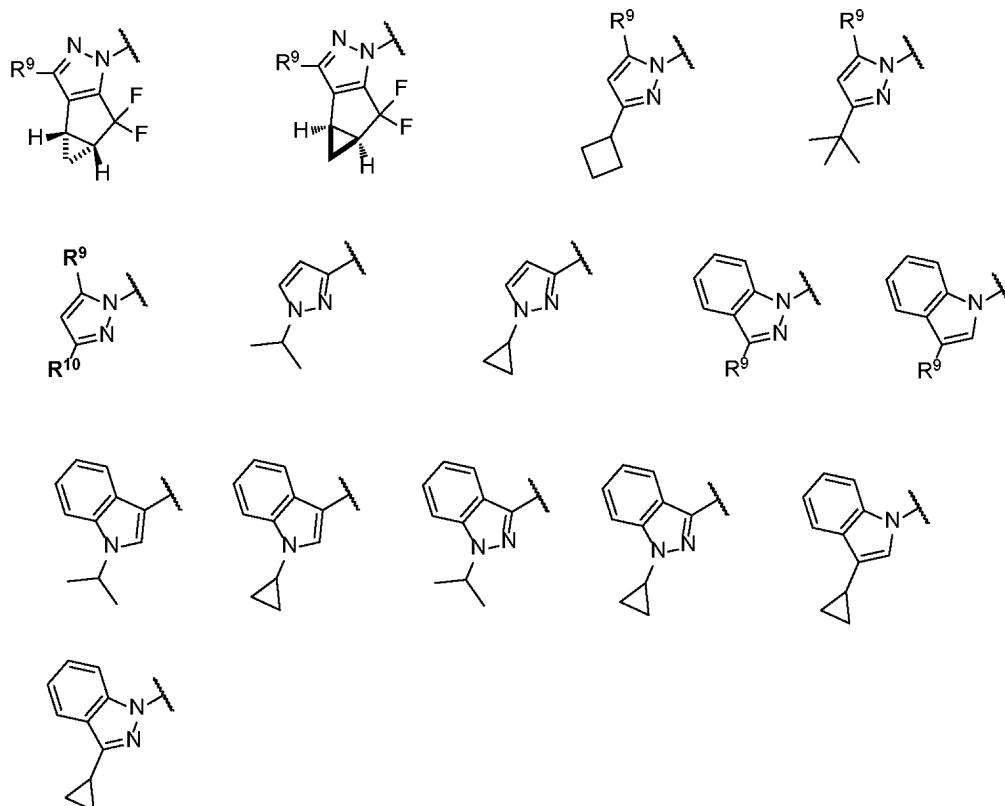
R<sup>3</sup>は、水素、Cl、F、CH<sub>3</sub>又はOCH<sub>3</sub>であり、

R<sup>4</sup>は、水素、1~3個のフッ素で場合により置換されているC<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル、又は1~3個のフッ素で場合により置換されているC<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキルであり、

R<sup>5</sup>は、1~3個のフッ素で場合により置換されているC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、又は1~3個のフッ素で場合により置換されているC<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキルであり、

A<sup>1</sup>は、

【化3】



10

20

30

から選択され、

ここで、R<sup>9</sup>及びR<sup>10</sup>は独立に、H、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>F、-CHF<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、イソプロピル、シクロプロピル又は-CF<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>から選択され、

A<sup>2</sup>は、H又は-CH<sub>3</sub>であり、

E<sup>1</sup>、E<sup>2</sup>及びE<sup>3</sup>は独立に、H、F、Cl、-CN、-OCH<sub>3</sub>、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>F、-CHF<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>から選択され、

X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>及びX<sup>3</sup>は独立に、H、F、Cl、-CN、-OCH<sub>3</sub>、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>F、-CHF<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>から選択される]。

【請求項2】

X<sup>1</sup>がHであり、X<sup>2</sup>がHであり、X<sup>3</sup>がHであるか、又はX<sup>3</sup>がHであり、X<sup>1</sup>がHであり、X<sup>2</sup>が、F、Cl、-CN、-OCH<sub>3</sub>、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>F、-CHF<sub>2</sub>又は-CF<sub>3</sub>であるか、又はX<sup>3</sup>がHであり、X<sup>2</sup>がHであり、X<sup>1</sup>が、F、Cl、-CN、-OCH<sub>3</sub>、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>F、-CHF<sub>2</sub>又は-CF<sub>3</sub>である、請求項1に記載の化合物又は塩。

【請求項3】

X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>及びX<sup>3</sup>がHである、請求項1又は2に記載の化合物又は塩。

【請求項4】

R<sup>3</sup>がCl又はCH<sub>3</sub>であり、R<sup>4</sup>が、1~3個のフッ素で場合により置換されているC<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキルであり、R<sup>5</sup>が、1~3個のフッ素で場合により置換されているC<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル、又は1~2個のフッ素で場合により置換されているC<sub>3</sub>~C<sub>4</sub>シクロアルキルである、請

40

50

求項1から3のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項5】

$E^2$ が水素である、請求項1から4のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項6】

$E^3$ が水素である、請求項1から5のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項7】

$E^1$ 、 $E^2$ 及び $E^3$ が独立に、H、F、Cl及び $-CH_3$ から選択され、但し、 $E_1$ 、 $E_2$ 及び $E_3$ 基内で、塩素は2回以下で使用され、 $-CH_3$ は2回以下で使用される、請求項1から6のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

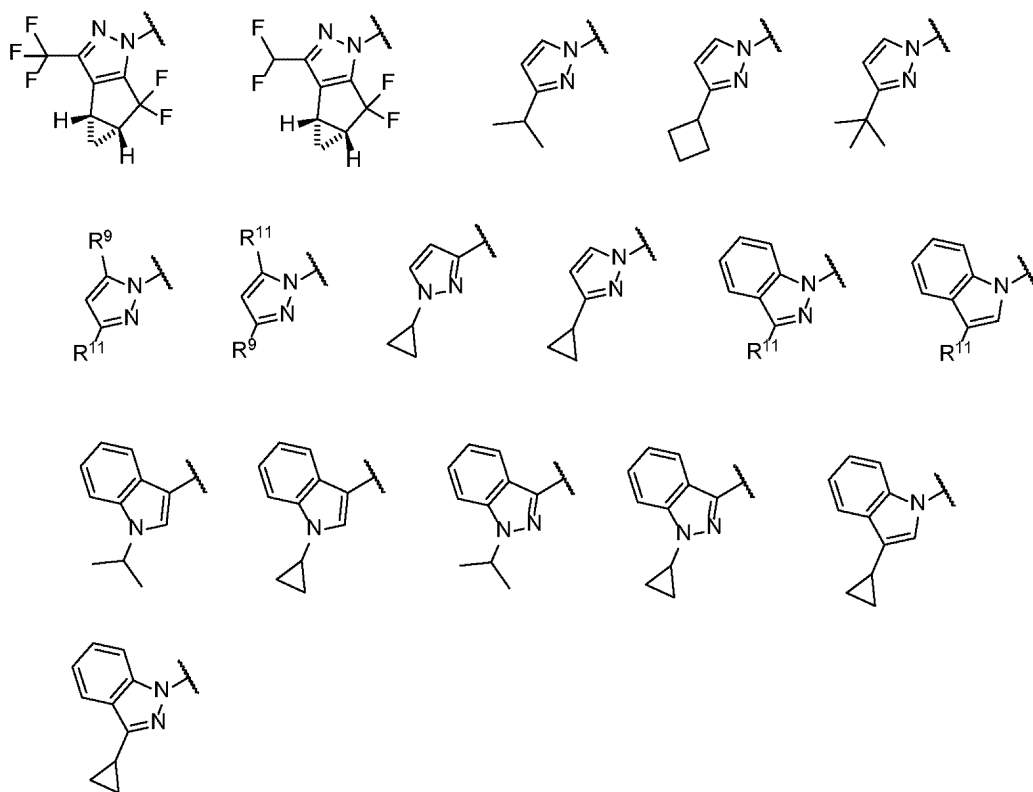
【請求項8】

$E^1$ がフッ素であり、 $E^2$ が水素であり、 $E^3$ がフッ素である、請求項1から4のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項9】

$A^2$ がH又は $-CH_3$ であり、 $A^1$ が、

【化4】



であり、

$R^9$ 及び $R^{10}$ が独立に、H、 $-CH_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、イソプロピル、シクロプロピル又は $-CF_2CH_3$ から選択され、 $R^{11}$ が $-CH_2F$ 又は $-CF_3$ である、請求項1から8のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項10】

$A^2$ がH又は $-CH_3$ であり、 $A^1$ が、以下：

10

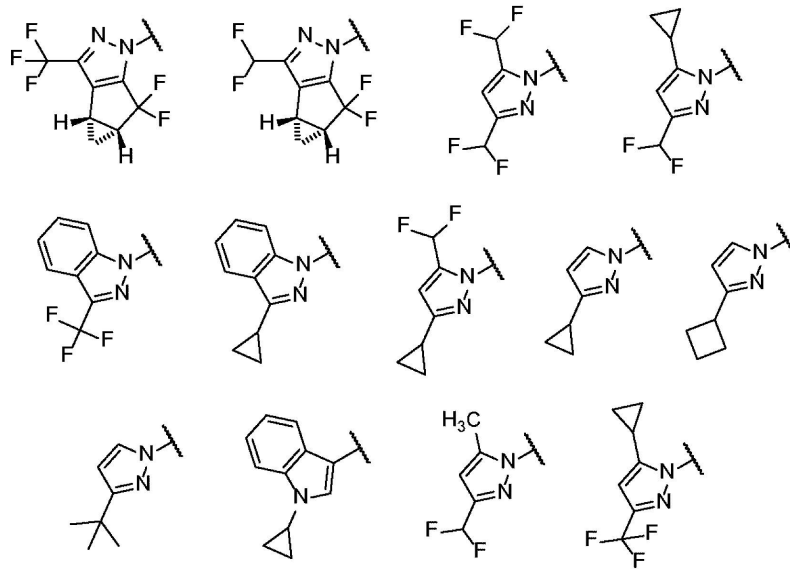
20

30

40

50

## 【化5】



10

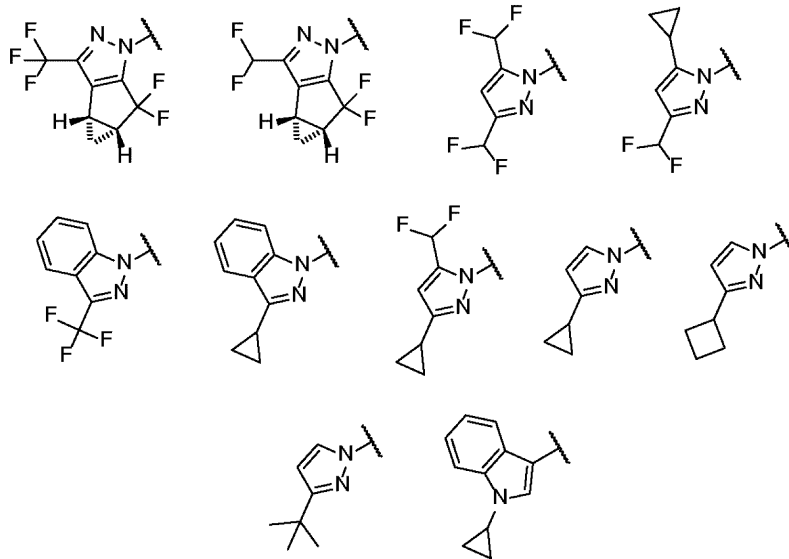
のうちの1つである、請求項1から8のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

20

## 【請求項11】

$A^2$ がHであり、 $A^1$ が、以下:

## 【化6】



30

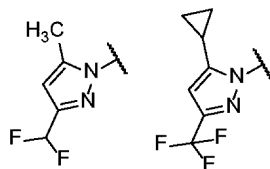
のうちの1つである、請求項1から8のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

40

## 【請求項12】

$A^2$ が $-CH_3$ であり、 $A^1$ が、以下:

## 【化7】



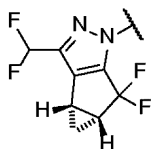
のうちの1つである、請求項1から8のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

50

【請求項 13】

$A^2$ がHであり、 $A^1$ が、

【化 8】



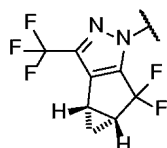
である、請求項1から8のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

10

【請求項 14】

$A^2$ がHであり、 $A^1$ が、

【化 9】



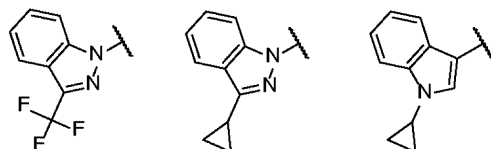
である、請求項1から8のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

20

【請求項 15】

$A^2$ がHであり、 $A^1$ が、以下:

【化 10】



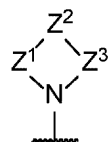
のうちの1つである、請求項1から8のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

30

【請求項 16】

$G^1$ が、

【化 11】



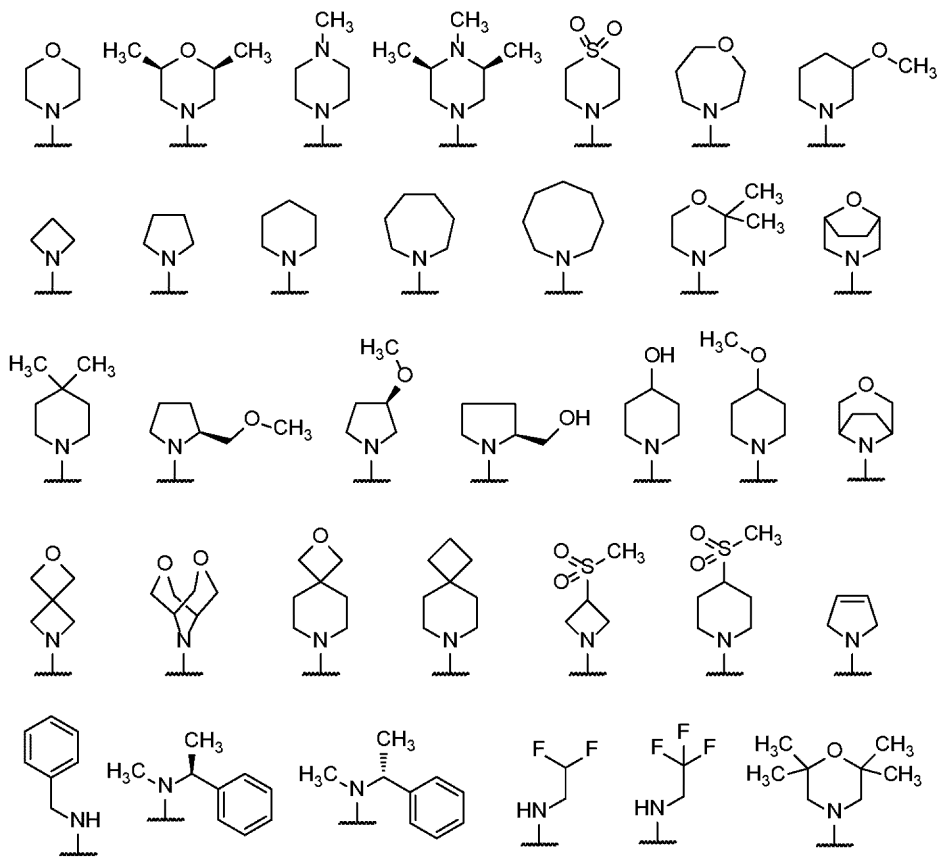
である、請求項1から15のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 17】

$G^1$ が、以下:

40

【化 1 2】



10

20

のうちの1つである、請求項1から15のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 1 8】

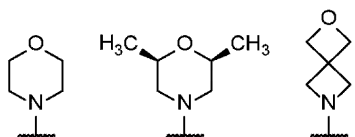
G<sup>1</sup>の化学式が、H<sub>(9 ~ 16)</sub>C<sub>(4 ~ 8)</sub>NOである、請求項1から17のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 1 9】

30

G<sup>1</sup>が、以下:

【化 1 3】



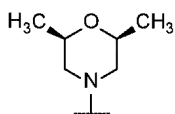
のうちの1つである、請求項1から15のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 2 0】

40

G<sup>1</sup>が、

【化 1 4】

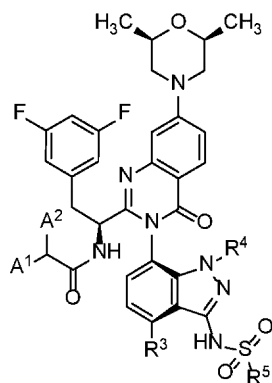


である、請求項1から15のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

【請求項 2 1】

50

## 【化 1 5】

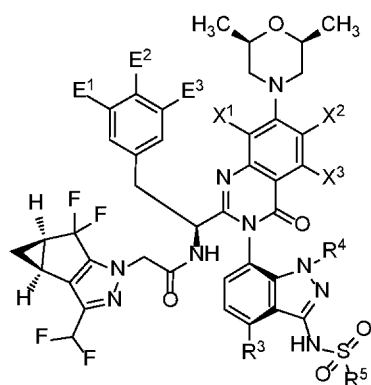


10

及びその薬学的に許容される塩から選択される、請求項1から20のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

## 【請求項 2 2】

## 【化 1 6】



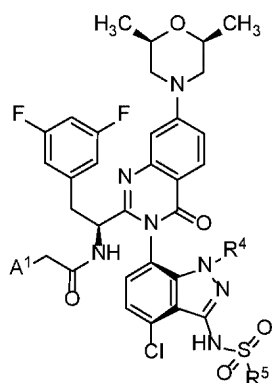
20

及びその薬学的に許容される塩から選択される、請求項1から20のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

30

## 【請求項 2 3】

## 【化 1 7】



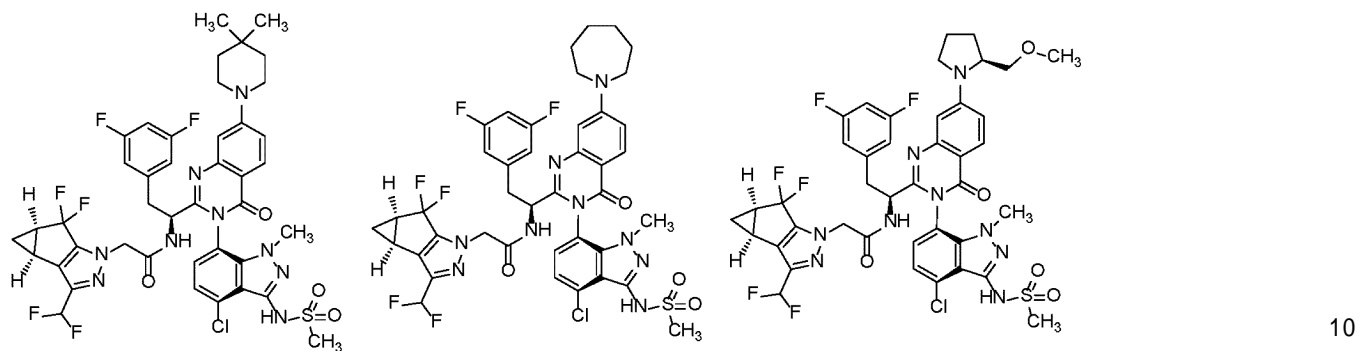
40

及びその薬学的に許容される塩から選択され、ここで、 $R^4$ が、 $-CH_3$ 、 $CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ であり、 $R^5$ が、 $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 又は $cPr$ である、請求項1から20のいずれか一項に記載の化合物又は塩。

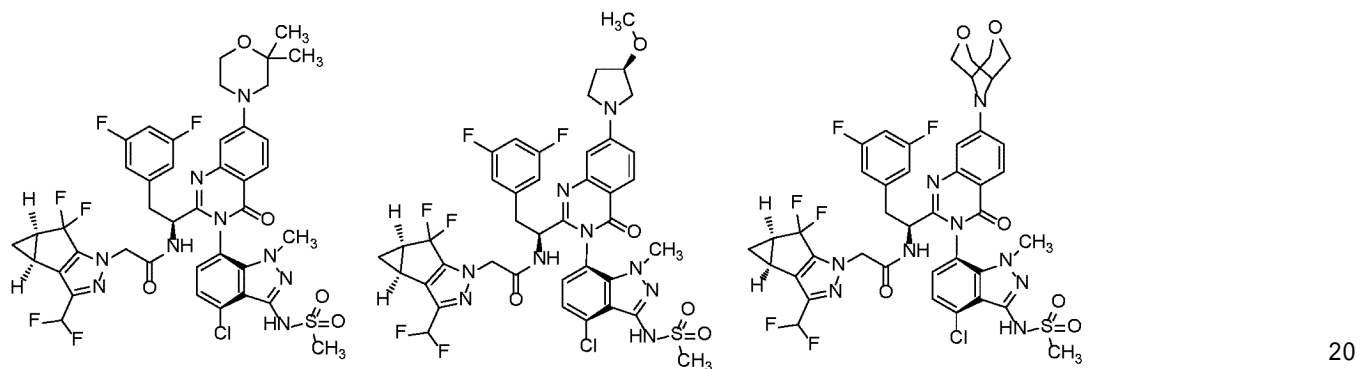
## 【請求項 2 4】

50

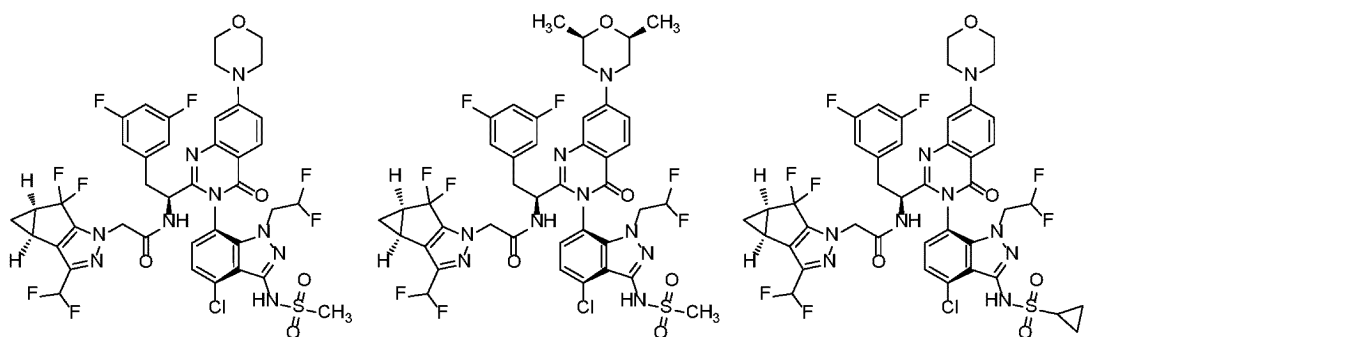
## 【化 1 8】



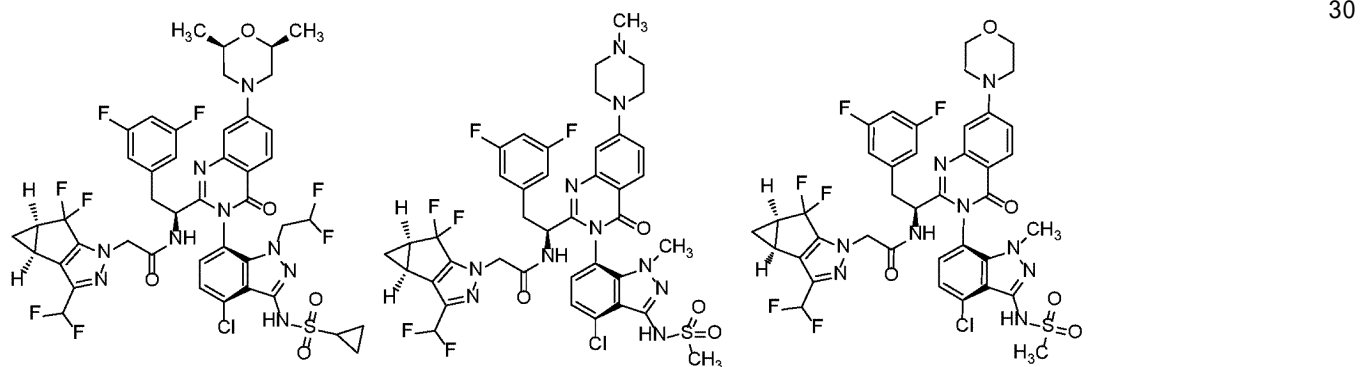
10



20

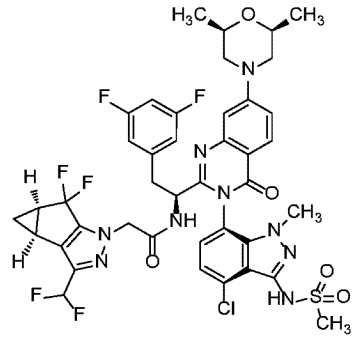
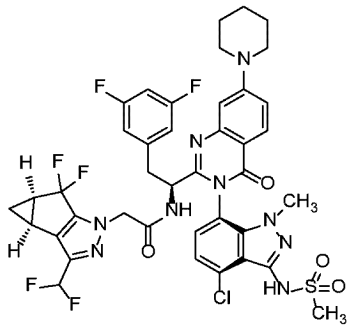
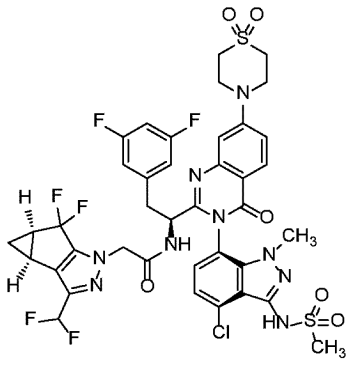


30

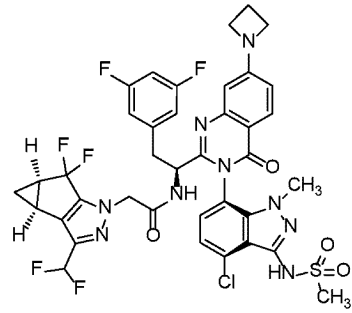
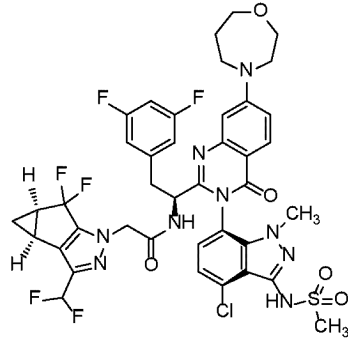
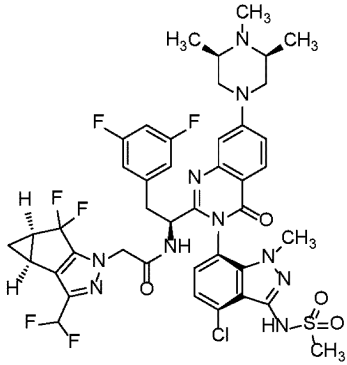


40

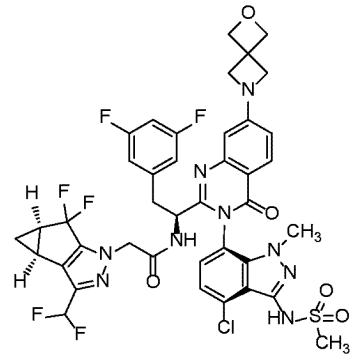
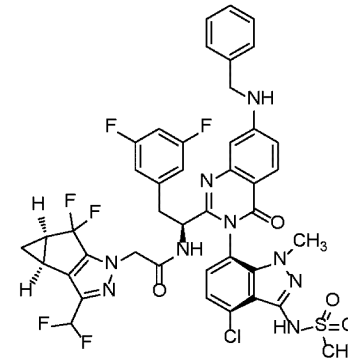
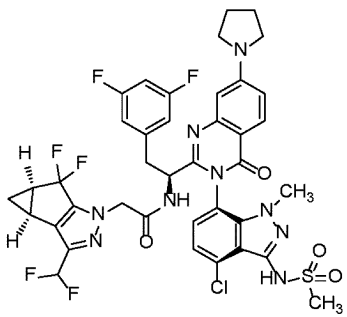
50



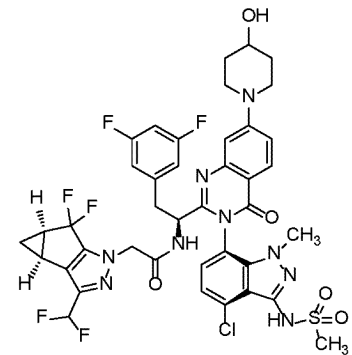
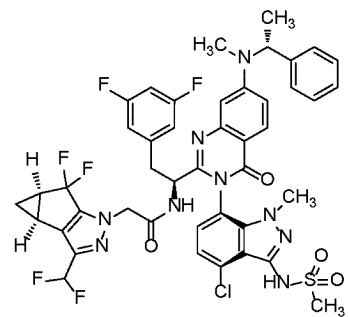
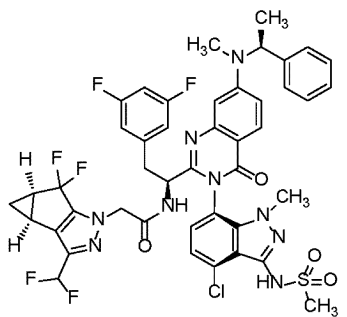
10



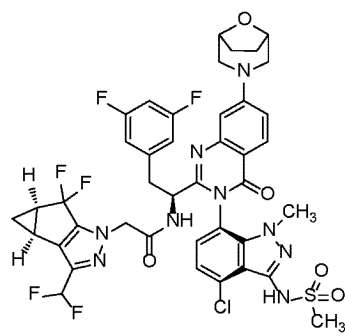
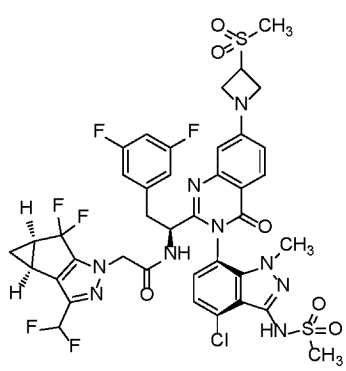
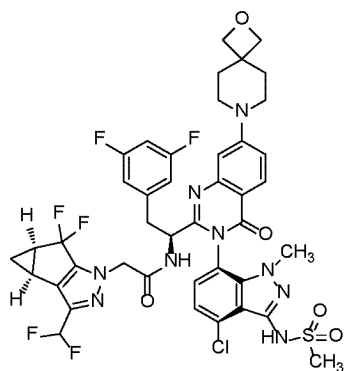
20



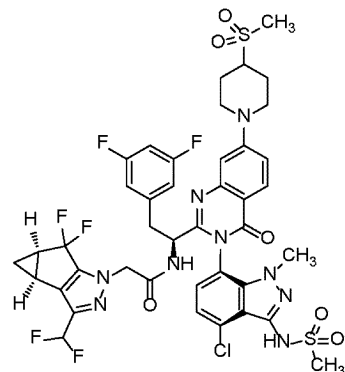
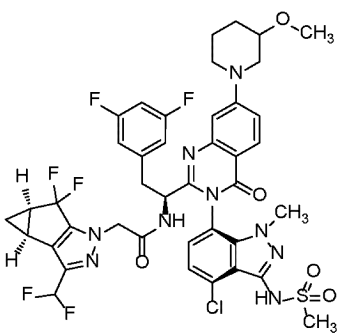
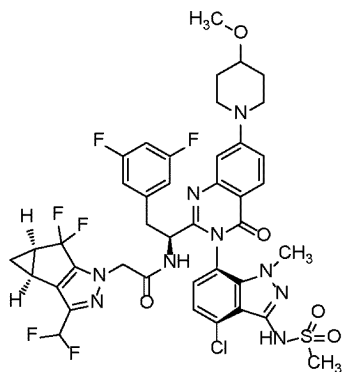
30



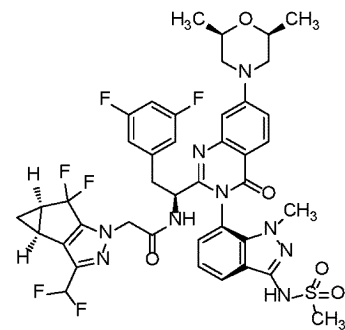
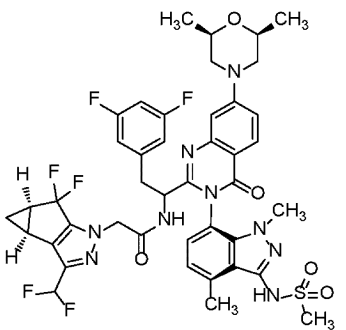
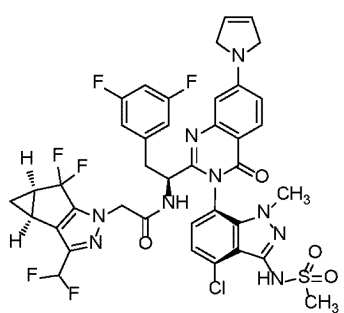
40



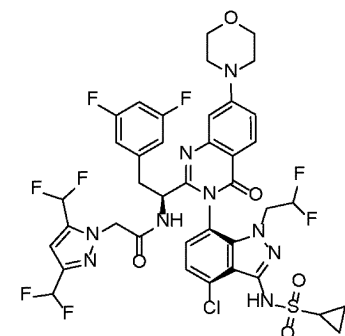
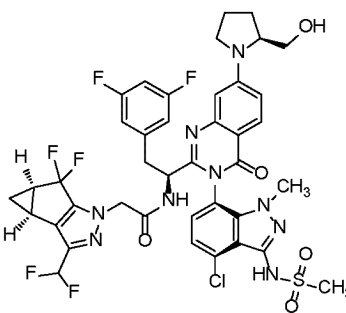
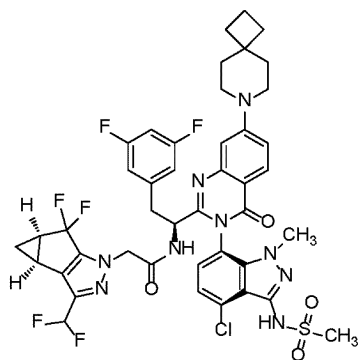
10



20

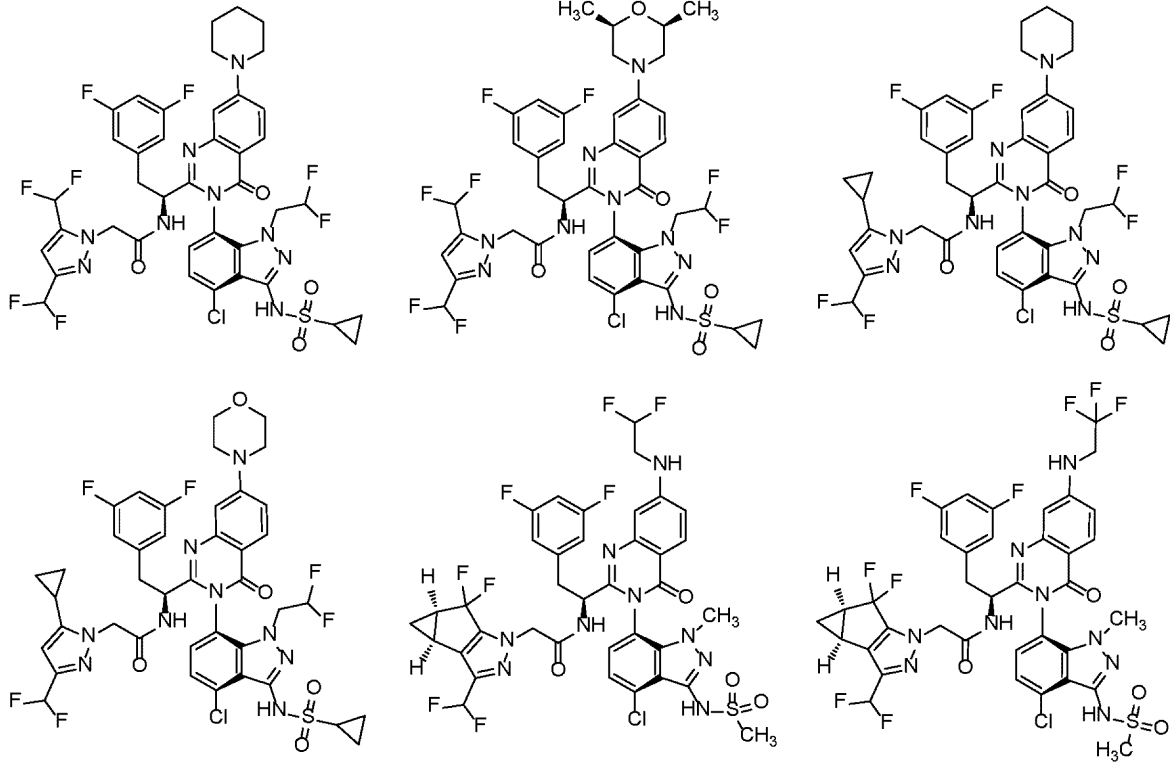


30



40

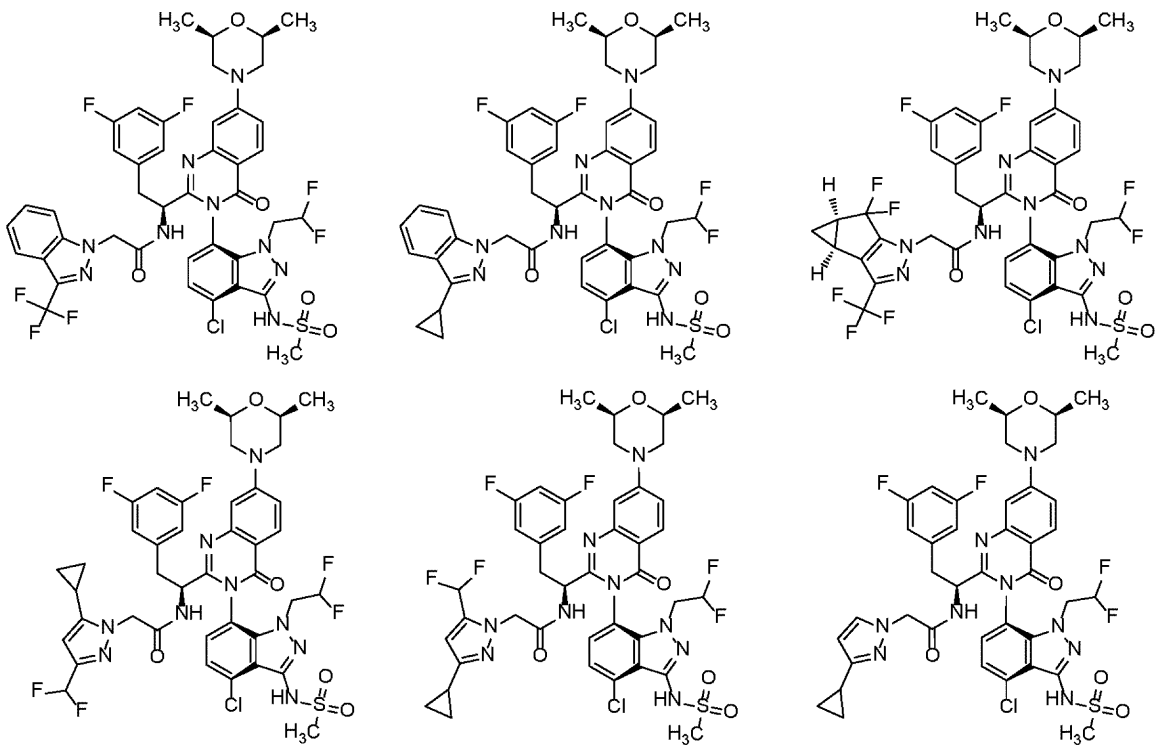
50

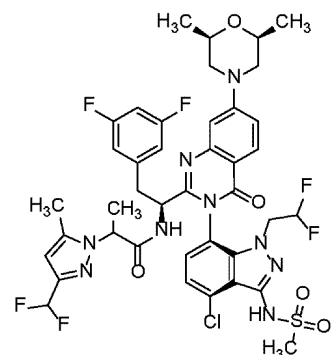
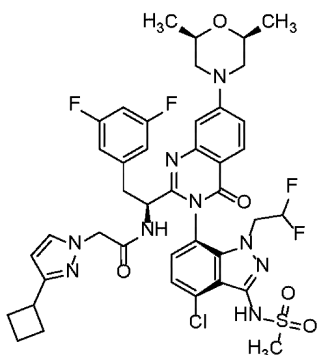
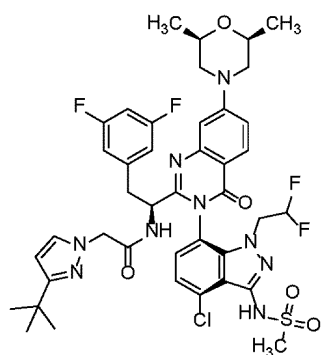


及びそれらの薬学的に許容される塩からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物又は塩。

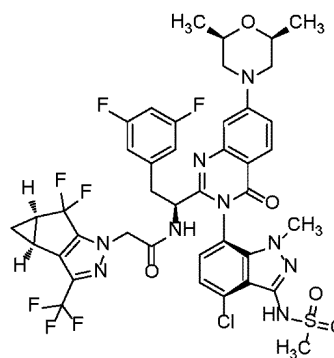
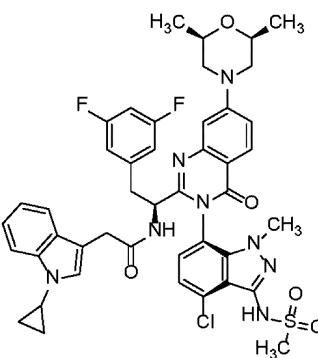
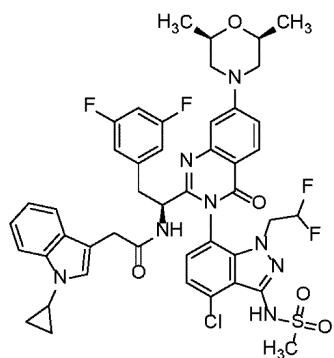
【請求項25】

【化19】

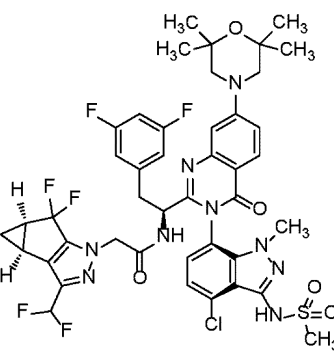
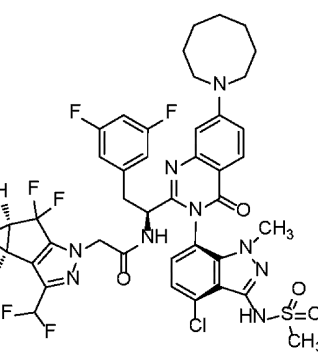
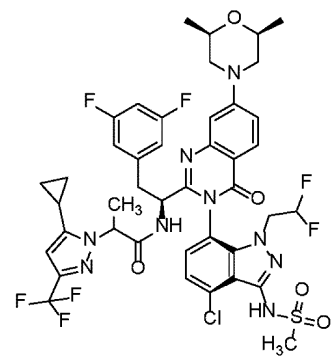




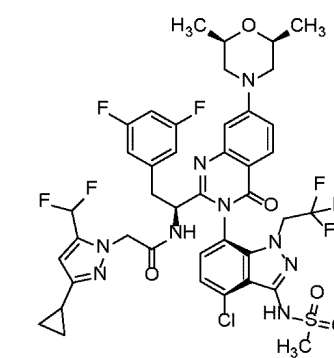
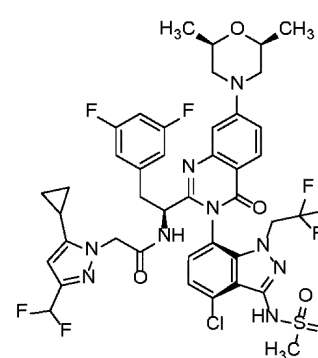
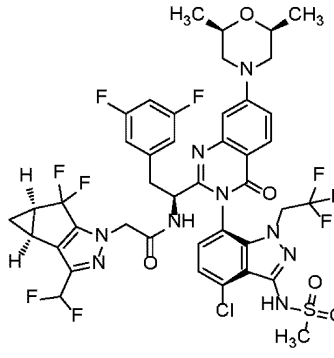
10



20

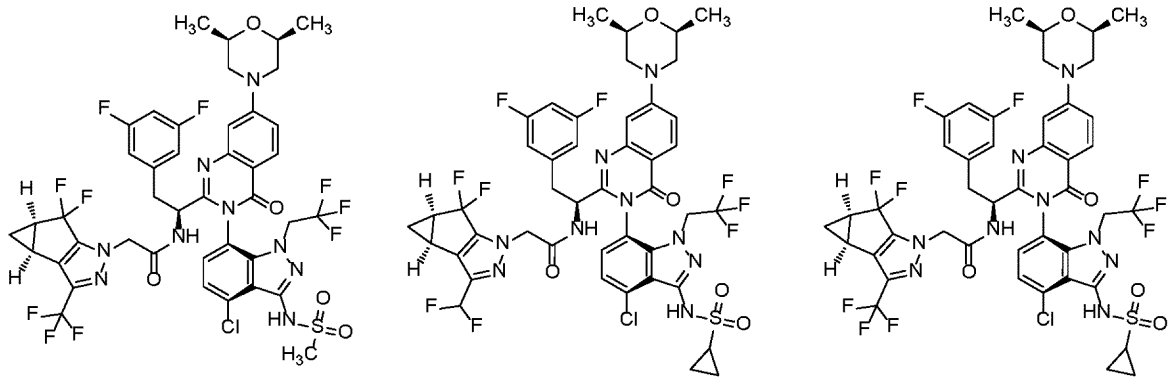


30

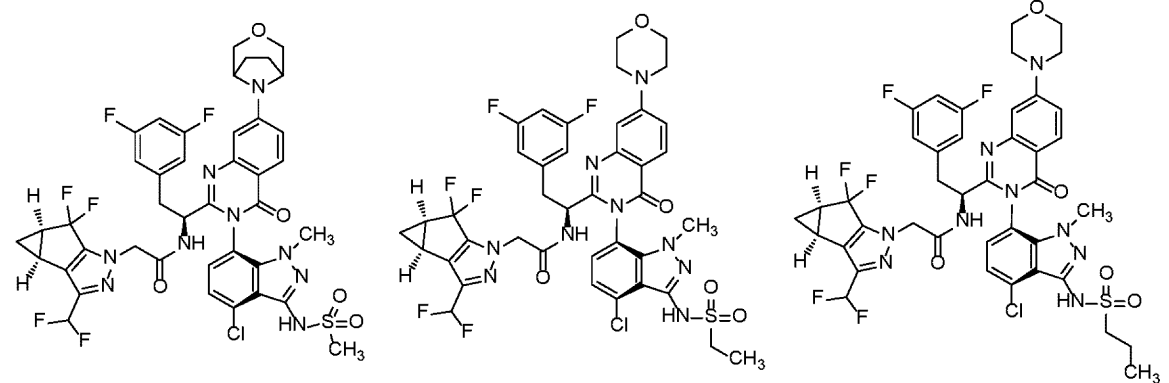


40

50



10

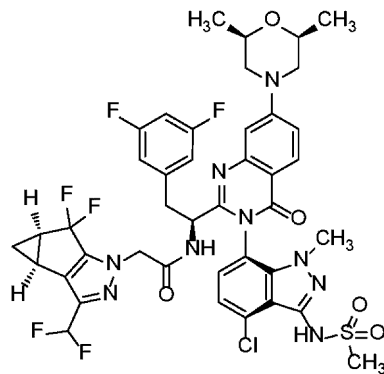


20

及びそれらの薬学的に許容される塩からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物又は塩。

【請求項26】

【化20】



30

及びその薬学的に許容される塩からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物又は塩。

40

【請求項27】

請求項1から26のいずれか一項に記載の化合物又は塩を含む、医薬組成物。

【請求項28】

薬学的に許容される担体、賦形剤及び/又は希釈剤をさらに含む、請求項27に記載の組成物。

【請求項29】

HIV感染を処置するための、請求項27又は28に記載の組成物。

【請求項30】

経口投与のための、請求項29に記載の組成物。

【請求項31】

50

筋肉内又は皮下注射による投与のための、請求項29に記載の組成物。

【請求項32】

ヌクレオシドHIV逆転写酵素阻害剤、非ヌクレオシドHIV逆転写酵素阻害剤、HIVプロテアーゼ阻害剤、HIV融合阻害剤、HIV付着阻害剤、CCR5阻害剤、CXCR4阻害剤、HIV出芽又は成熟阻害剤及びHIVインテグラーゼ阻害剤からなる群から選択される、AIDS又はHIV感染の処置に使用される少なくとも1つの他の薬剤をさらに含む、請求項29に記載の組成物。

【請求項33】

ヌクレオシドHIV逆転写酵素阻害剤、非ヌクレオシドHIV逆転写酵素阻害剤、HIVプロテアーゼ阻害剤、HIV融合阻害剤、HIV付着阻害剤、CCR5阻害剤、CXCR4阻害剤、HIV出芽又は成熟阻害剤及びHIVインテグラーゼ阻害剤からなる群から選択される、AIDS又はHIV感染の処置に使用される少なくとも1つの他の薬剤と組み合わせて使用される、請求項29に記載の組成物。

10

【請求項34】

少なくとも1つの他の薬剤が、ドルテグラビル、ラミブジン、ホステムサビル及びカボテグラビルからなる群から選択される、請求項32又は33に記載の組成物。

【請求項35】

治療において使用するための、請求項1から26のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩を含む、医薬組成物。

【請求項36】

HIV感染の処置において使用するための、請求項1から26のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩を含む、医薬組成物。

20

【請求項37】

HIV感染の処置のための医薬の製造における、請求項1から26のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩の使用。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0392

【補正方法】変更

【補正の内容】

30

【0392】

本発明は、前述の例示的な実施例に限定されるものではなく、実施例はすべての点において例示的であって、限定的なものでないとみなされるべきであり、前述の実施例よりも添付の特許請求の範囲を参照し、したがって特許請求の範囲の意味及び均等の範囲内に入る変更はすべて包含されることが意図される。

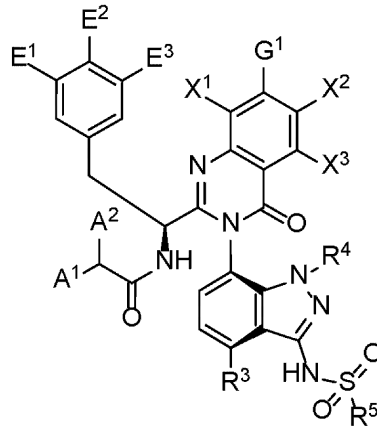
以下は、本発明の実施形態の一つである。

(1) 式Iの化合物、又はその薬学的に許容される塩:

40

50

【化173】



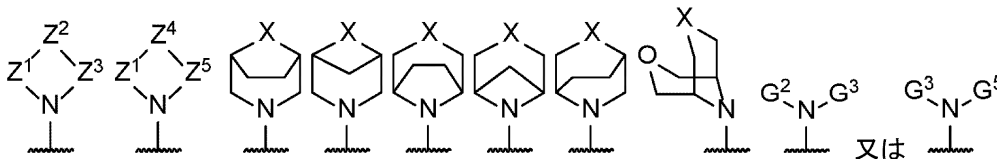
式I

10

[式中、

G<sup>1</sup>は、

【化174】



20

から選択され、

Z<sup>1</sup>は、G<sup>4</sup>で場合により1回置換されており、また-CH<sub>3</sub>で場合により1回置換されている-C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキレンであり、

Z<sup>2</sup>は、-O-、-S-、-S(O<sub>2</sub>)-、-NH-、-N(G<sup>6</sup>)-、-N(C(O)G<sup>6</sup>)-、-N(SO<sub>2</sub>G<sup>6</sup>)-、-CH(G<sup>4</sup>)-、-C(G<sup>6</sup>)(G<sup>4</sup>)-、-C(F)(F)-、-C(-C<sub>5</sub>~C<sub>6</sub>アルキレン)-、-C(-O(C<sub>5</sub>~C<sub>5</sub>アルキレン)-)、-C(-(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキレン)-O-(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキレン)-)、-C(-(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキレン)-N(H-(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキレン)-)-又は-C(-(C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキレン)-N(G<sup>6</sup>)-(C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキレン)-)であり、

30

Z<sup>3</sup>は、G<sup>4</sup>で場合により1回置換されており、また-CH<sub>3</sub>で場合により1回置換されている-C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキレンであり、

Z<sup>4</sup>は、-C(H)=C(H)-、-N(H)S(O<sub>2</sub>)-又は-N(G<sup>6</sup>)S(O<sub>2</sub>)-であり、

Z<sup>5</sup>は、G<sup>4</sup>で場合により1回置換されており、また-CH<sub>3</sub>で場合により1回置換されている-C<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>アルキレンであり、

Xは、Z<sup>2</sup>又はZ<sup>4</sup>であり、

G<sup>2</sup>は、水素又はC<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキルであり、

G<sup>3</sup>は、-CH(G<sup>6</sup>)G<sup>7</sup>、-C(CH<sub>3</sub>)(G<sup>6</sup>)G<sup>7</sup>、C<sub>4</sub>~C<sub>6</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキルであり、

40

ここで、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキルは、1~3個のフッ素で置換されており、G<sup>4</sup>は、水素、F、OH、CN、-PO(OG<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、-SO<sub>3</sub>H、-S(O<sub>2</sub>)N(G<sup>6</sup>)<sub>2</sub>、-S(O<sub>2</sub>)G<sup>6</sup>、-OG<sup>6</sup>、G<sup>6</sup>、1~2個のフッ素で場合により置換されている-C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル、CH<sub>2</sub>OH、CH<sub>2</sub>OG<sup>6</sup>、G<sup>7</sup>又はOG<sup>7</sup>であり、

G<sup>5</sup>は、水素若しくはC<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル、又はG<sup>3</sup>であり、

G<sup>6</sup>は、1~3個のフッ素で場合により置換されているC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル、又は1~2個のフッ素で場合により置換されているC<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキルであり、

G<sup>7</sup>はフェニルであり、

R<sup>3</sup>は、水素、Cl、F、CH<sub>3</sub>又はOCH<sub>3</sub>であり、

R<sup>4</sup>は、水素、1~3個のフッ素で場合により置換されているC<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル、又は1~3

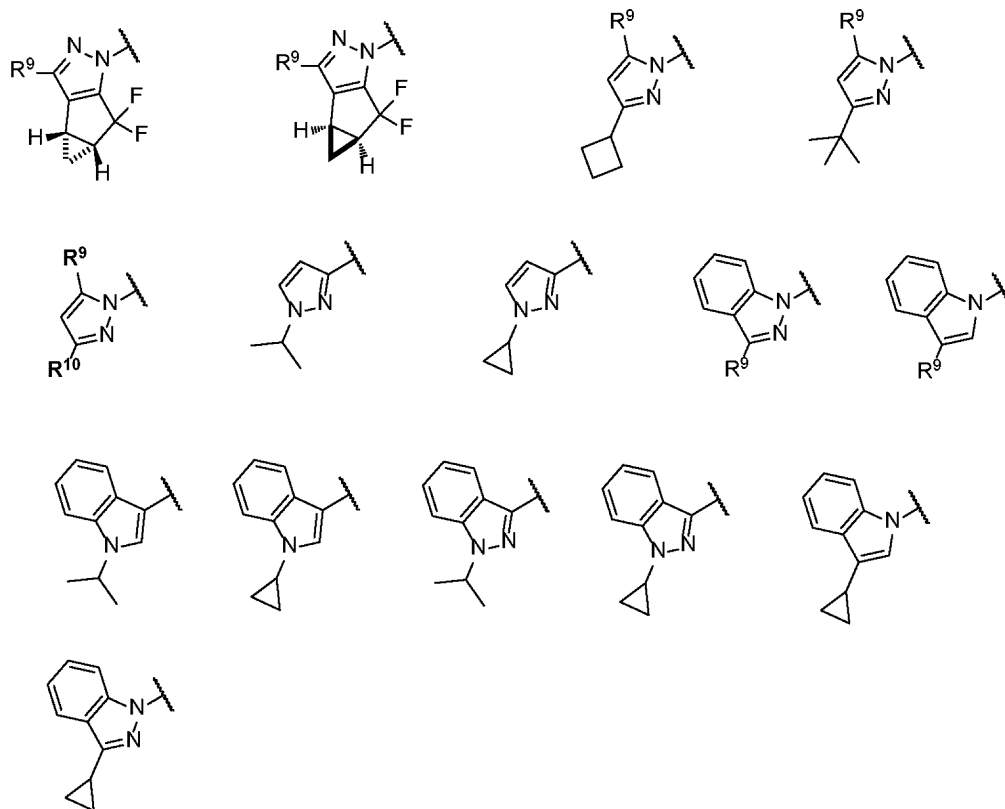
50

個のフッ素で場合により置換されているC<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキルであり、

R<sup>5</sup>は、1~3個のフッ素で場合により置換されているC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、又は1~3個のフッ素で場合により置換されているC<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキルであり、

A<sup>1</sup>は、

【化175】



10

20

から選択され、

ここで、R<sup>9</sup>及びR<sup>10</sup>は独立に、H、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>F、-CHF<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、イソプロピル、シクロプロピル又は-CF<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>から選択され、

30

A<sup>2</sup>は、H又は-CH<sub>3</sub>であり、

E<sup>1</sup>、E<sup>2</sup>及びE<sup>3</sup>は独立に、H、F、Cl、-CN、-OCH<sub>3</sub>、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>F、-CHF<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>から選択され、

X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>及びX<sup>3</sup>は独立に、H、F、Cl、-CN、-OCH<sub>3</sub>、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>F、-CHF<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>から選択される]。

(2) X<sup>1</sup>がHであり、X<sup>2</sup>がHであり、X<sup>3</sup>がHであるか、又はX<sup>3</sup>がHであり、X<sup>1</sup>がHであり、X<sup>2</sup>が、F、Cl、-CN、-OCH<sub>3</sub>、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>F、-CHF<sub>2</sub>又は-CF<sub>3</sub>であるか、又はX<sup>3</sup>がHであり、X<sup>2</sup>がHであり、X<sup>1</sup>が、F、Cl、-CN、-OCH<sub>3</sub>、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>F、-CHF<sub>2</sub>又は-CF<sub>3</sub>である、(1)に記載の化合物又は塩。

(3) X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>及びX<sup>3</sup>がHである、(1)又は(2)に記載の化合物又は塩。

40

(4) R<sup>3</sup>がCl又はCH<sub>3</sub>であり、R<sup>4</sup>が、1~3個のフッ素で場合により置換されているC<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキルであり、R<sup>5</sup>が、1~3個のフッ素で場合により置換されているC<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>アルキル、又は1~2個のフッ素で場合により置換されているC<sub>3</sub>~C<sub>4</sub>シクロアルキルである、(1)から(3)のいずれかに記載の化合物又は塩。

(5) E<sup>2</sup>が水素である、(1)から(4)のいずれかに記載の化合物又は塩。

(6) E<sup>3</sup>が水素である、(1)から(5)のいずれかに記載の化合物又は塩。

(7) E<sup>1</sup>、E<sup>2</sup>及びE<sup>3</sup>が独立に、H、F、Cl及び-CH<sub>3</sub>から選択され、但し、E<sup>1</sup>、E<sup>2</sup>及びE<sup>3</sup>基内で、塩素は2回以下で使用され、-CH<sub>3</sub>は2回以下で使用される、(1)から(6)のいずれかに記載の化合物又は塩。

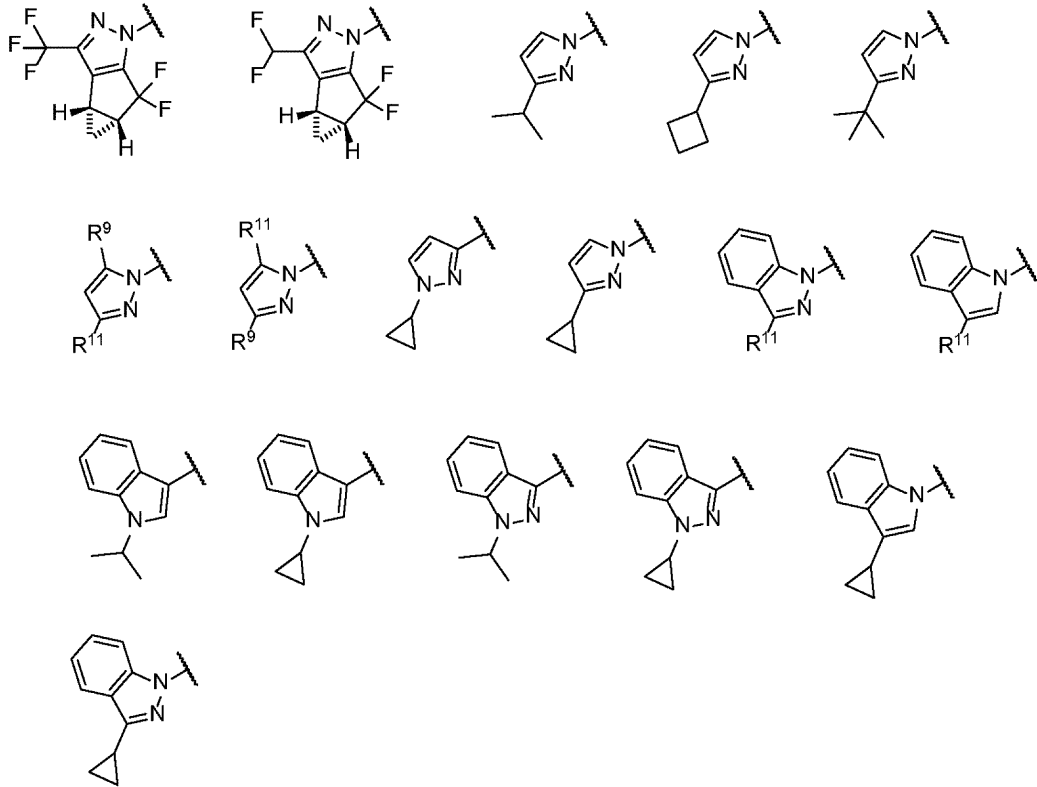
(8) E<sup>1</sup>がフッ素であり、E<sup>2</sup>が水素であり、E<sup>3</sup>がフッ素である、(1)から(4)のい

50

いずれかに記載の化合物又は塩。

(9)  $A^2$ がH又は $-CH_3$ であり、 $A^1$ が、

【化176】



10

20

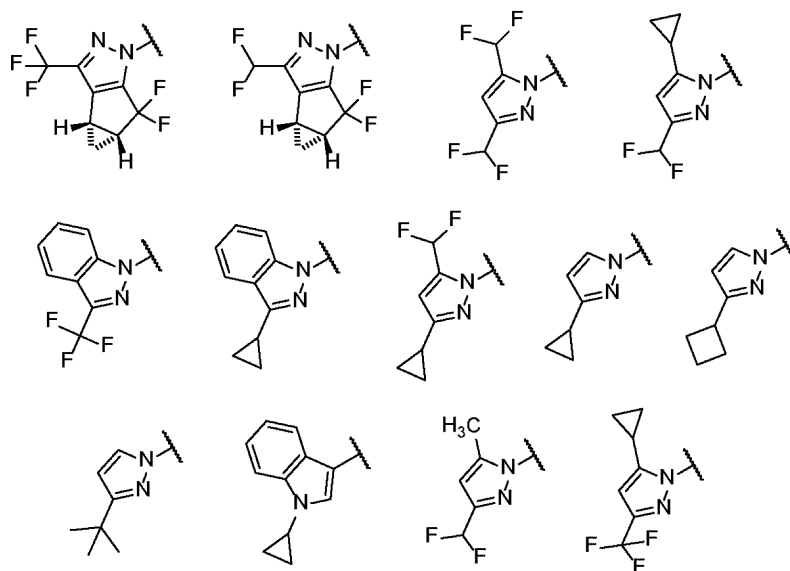
であり、

$R^9$ 及び $R^{10}$ が独立に、H、 $-CH_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、イソプロピル、シクロプロピル又は $-CF_2CH_3$ から選択され、 $R^{11}$ が $-CH_2F$ 又は $-CF_3$ である、

(1) から (8) のいずれかに記載の化合物又は塩。

(10)  $A^2$ がH又は $-CH_3$ であり、 $A^1$ が、以下:

【化177】



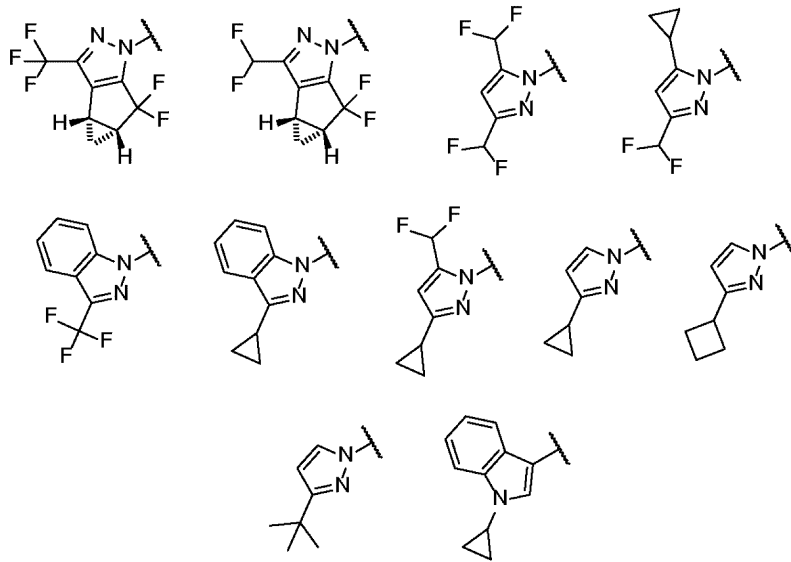
40

のうちの1つである、(1) から (8) のいずれかに記載の化合物又は塩。

(11)  $A^2$ がHであり、 $A^1$ が、以下:

50

## 【化178】



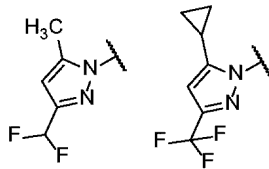
10

のうちの1つである、(1)から(8)のいずれかに記載の化合物又は塩。

(12)  $A^2$ が $-CH_3$ であり、 $A^1$ が、以下:

20

## 【化179】

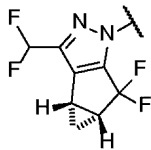


のうちの1つである、(1)から(8)のいずれかに記載の化合物又は塩。

(13)  $A^2$ がHであり、 $A^1$ が、

30

## 【化180】

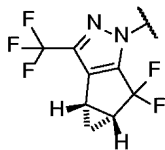


である、(1)から(8)のいずれかに記載の化合物又は塩。

(14)  $A^2$ がHであり、 $A^1$ が、

40

## 【化181】

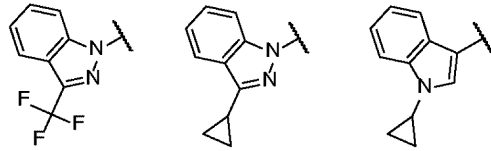


である、(1)から(8)のいずれかに記載の化合物又は塩。

(15)  $A^2$ がHであり、 $A^1$ が、以下:

50

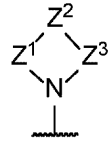
## 【化 1 8 2】



のうちの1つである、(1)から(8)のいずれかに記載の化合物又は塩。

(16) G<sup>1</sup>が、

## 【化 1 8 3】

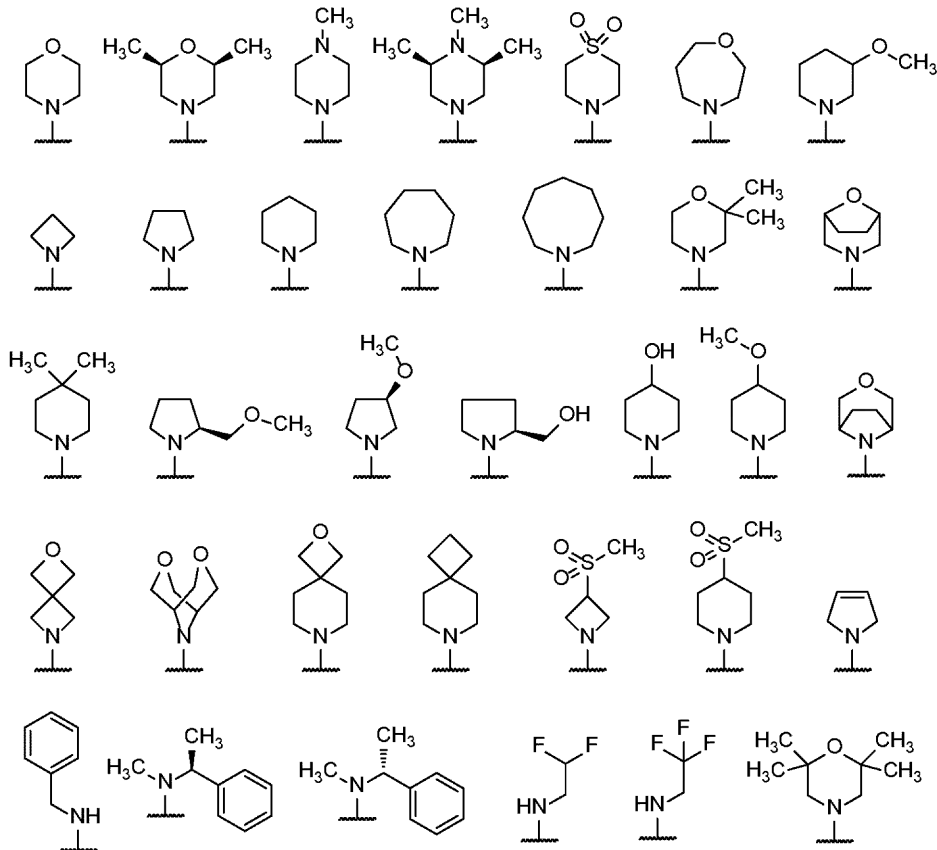


10

である、(1)から(15)のいずれかに記載の化合物又は塩。

(17) G<sup>1</sup>が、以下:

## 【化 1 8 4】



20

30

40

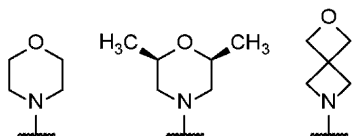
のうちの1つである、(1)から(15)のいずれかに記載の化合物又は塩。

(18) G<sup>1</sup>の化学式が、H<sub>(9~16)</sub>C<sub>(4~8)</sub>NOである、(1)から(17)のいずれかに記載の化合物又は塩。

(19) G<sup>1</sup>が、以下:

50

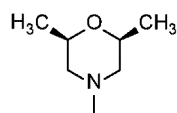
【化 1 8 5】



のうちの1つである、(1)から(15)のいずれかに記載の化合物又は塩。

(19) G<sup>1</sup>が、

【化 1 8 6】

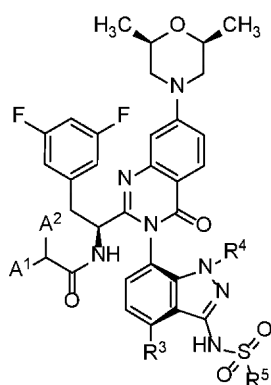


10

である、(1)から(15)のいずれかに記載の化合物又は塩。

(20)

【化 1 8 7】



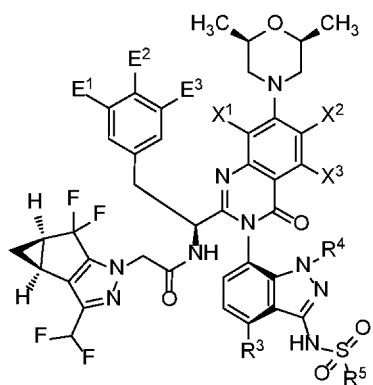
20

及びその薬学的に許容される塩から選択される、(1)から(19)のいずれかに記載の化合物又は塩。

30

(21)

【化 1 8 8】



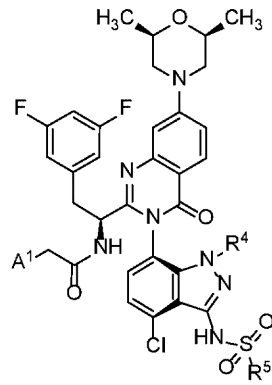
40

及びその薬学的に許容される塩から選択される、(1)から(19)のいずれかに記載の化合物又は塩。

(22)

50

【化 1 8 9】



10

及びその薬学的に許容される塩から選択され、ここで、R<sup>4</sup>が、-CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>であり、R<sup>5</sup>が、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>又はcPrである、(1)から(19)のいずれかに記載の化合物又は塩。

( 2 3 )

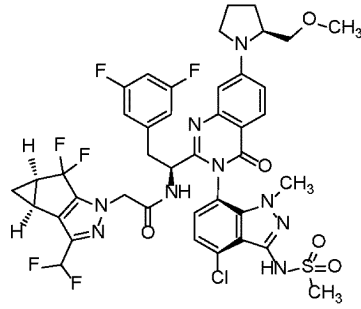
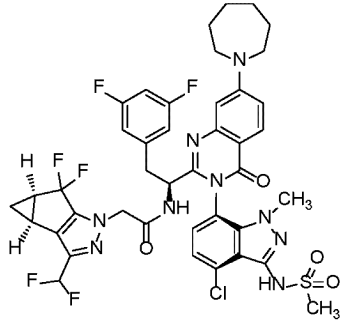
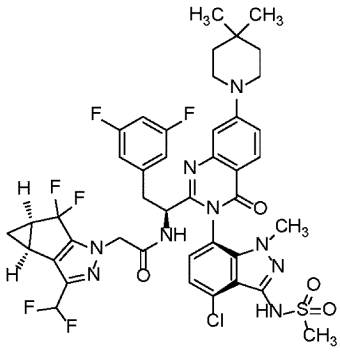
20

30

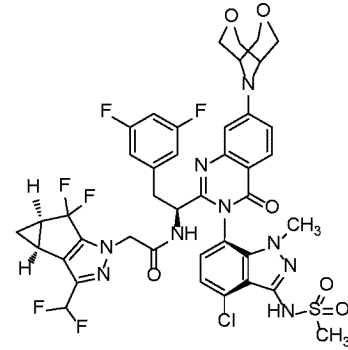
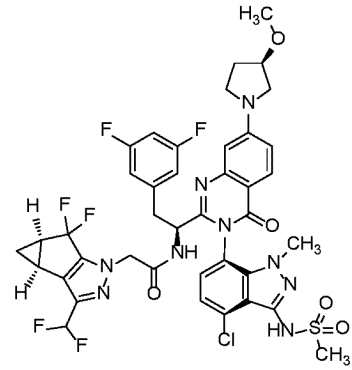
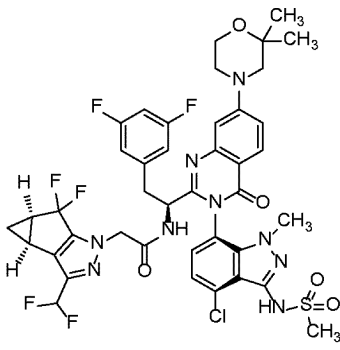
40

50

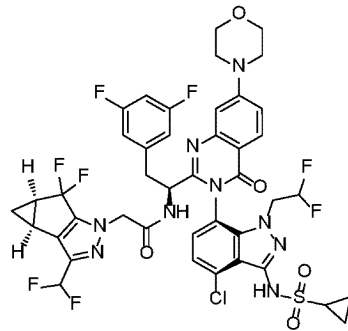
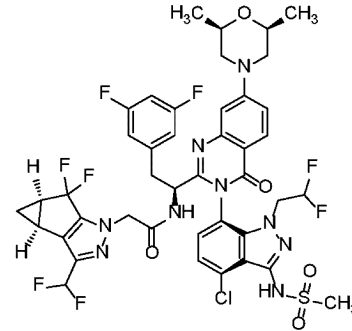
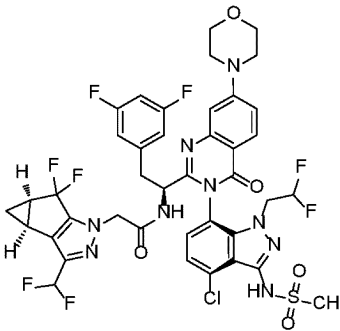
【化 190】



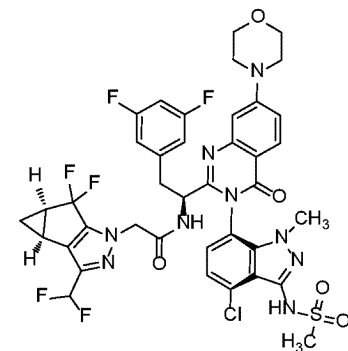
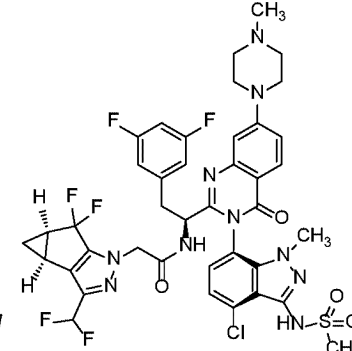
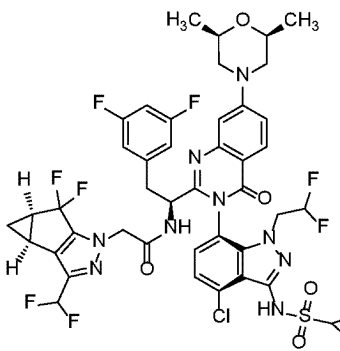
10



20

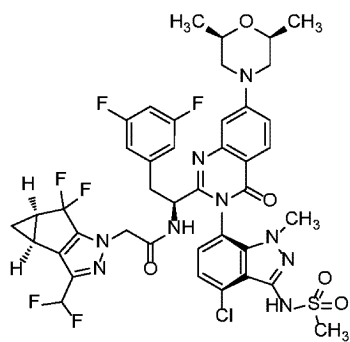
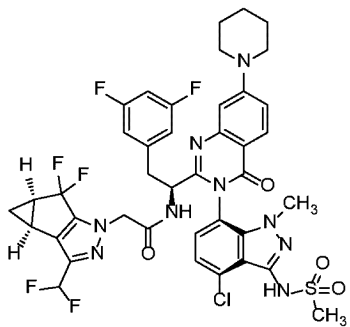
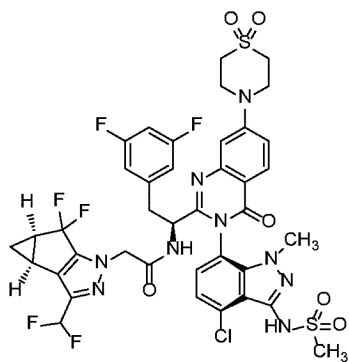


30

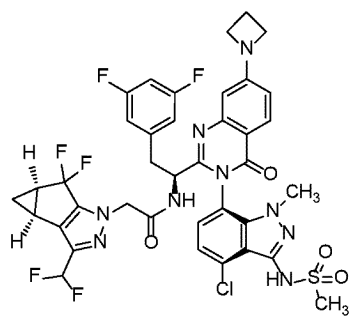
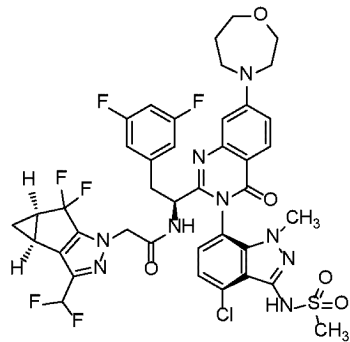
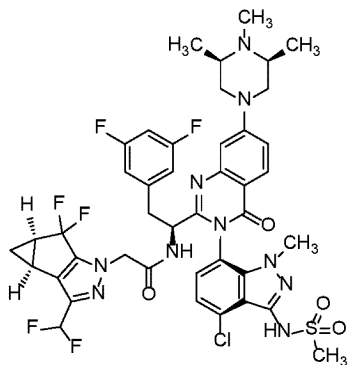


40

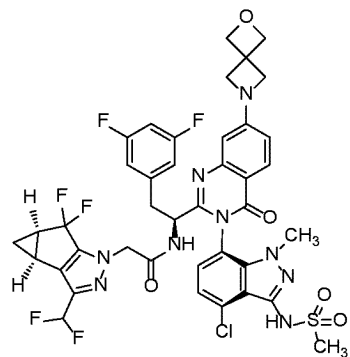
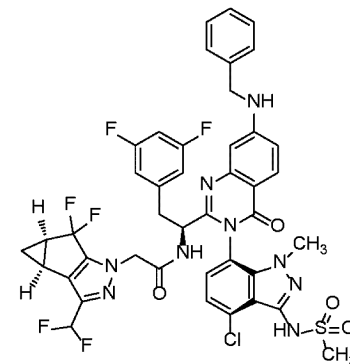
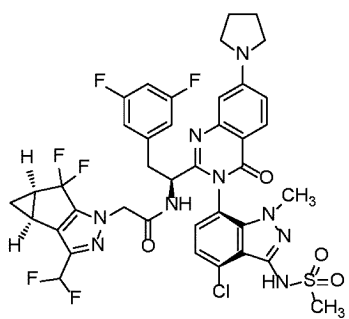
50



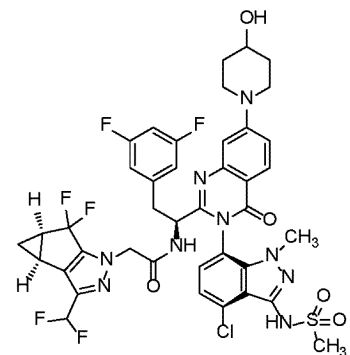
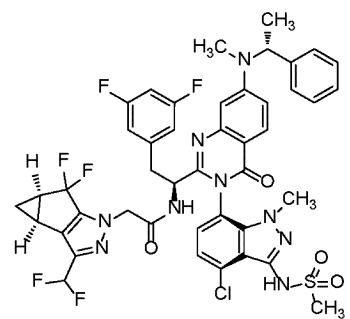
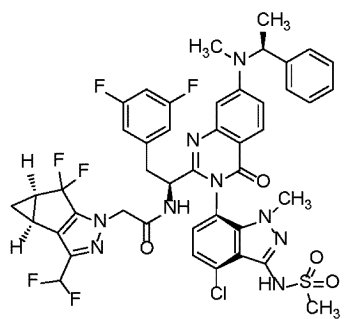
10



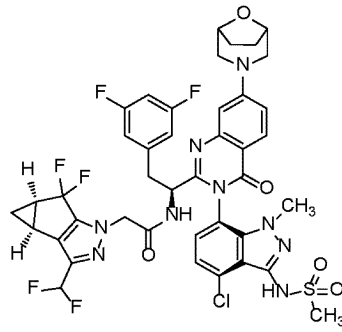
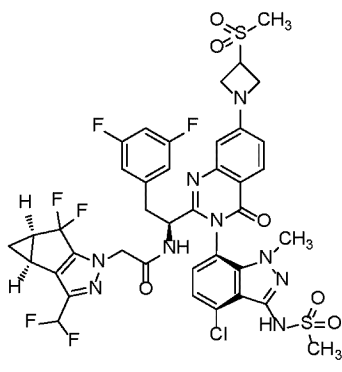
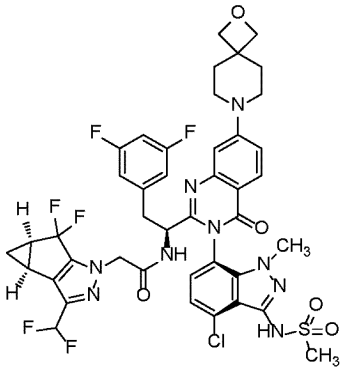
20



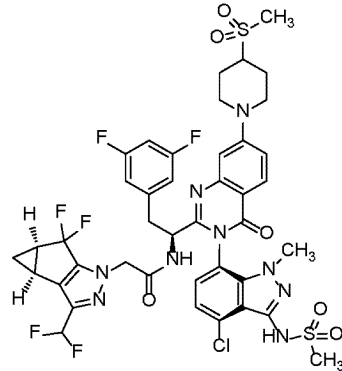
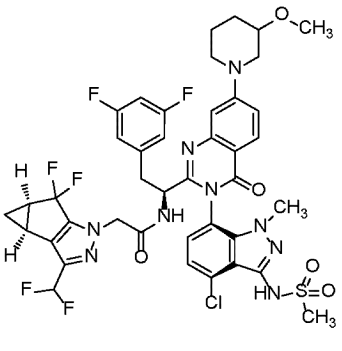
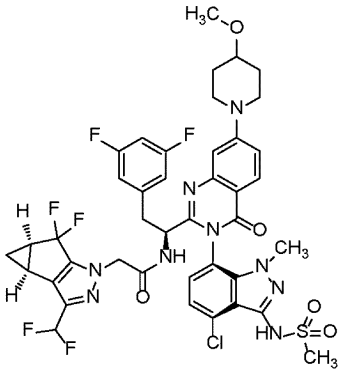
30



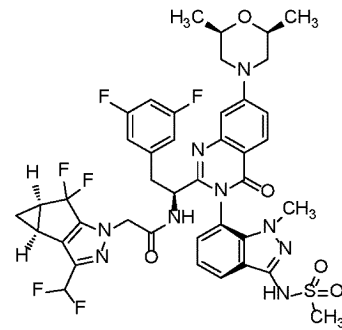
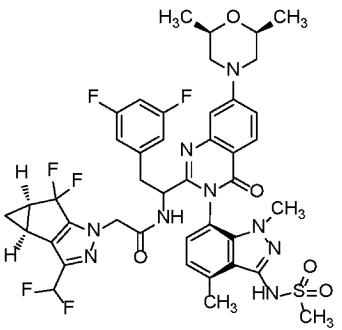
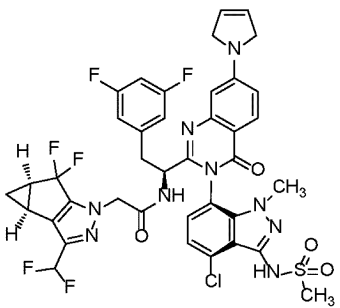
40



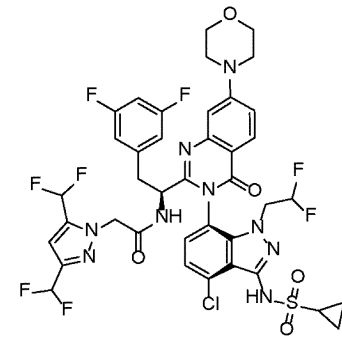
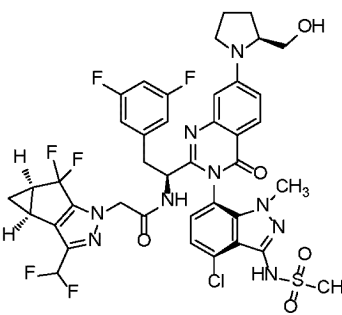
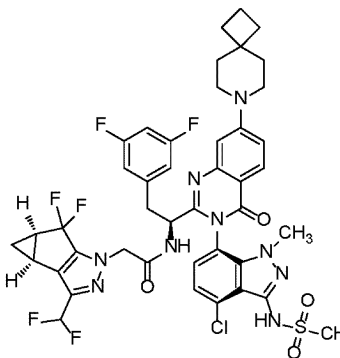
10



20

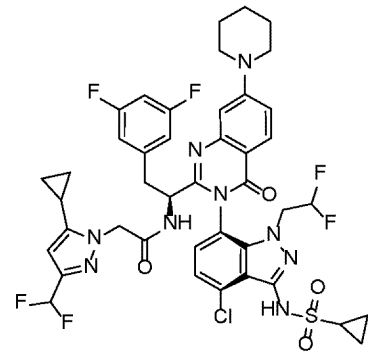
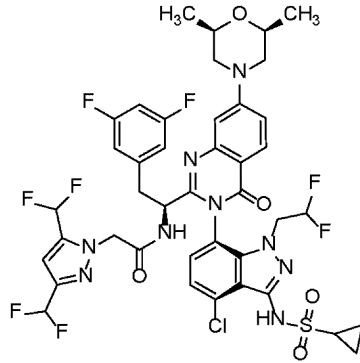
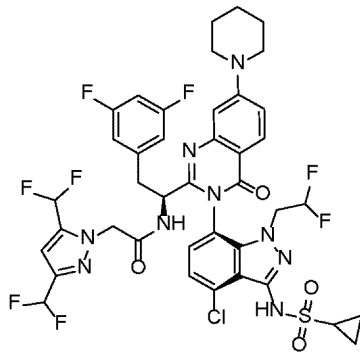


30

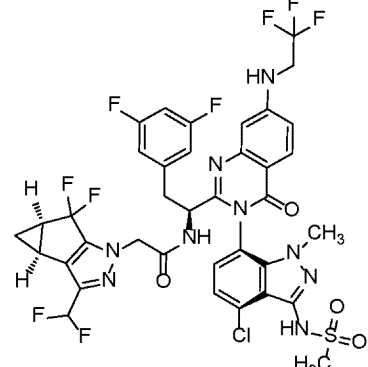
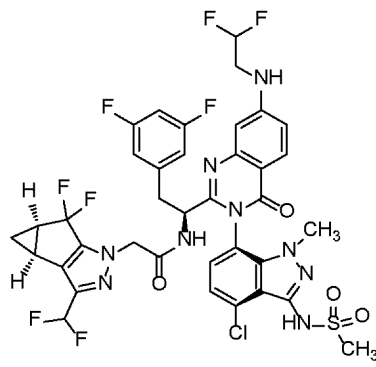
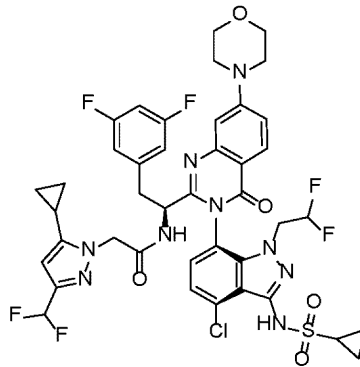


40

50



10

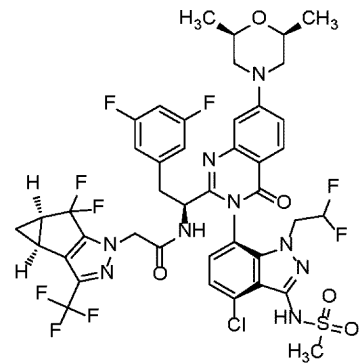
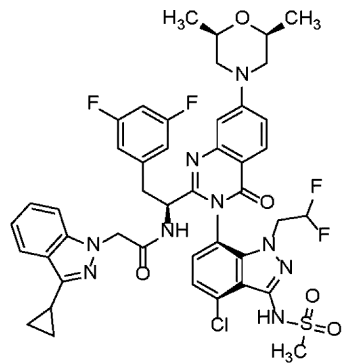
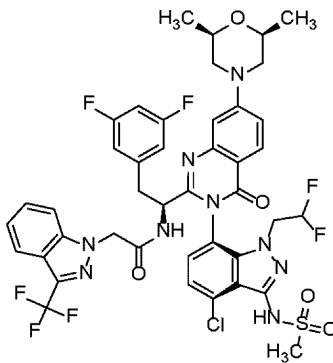


20

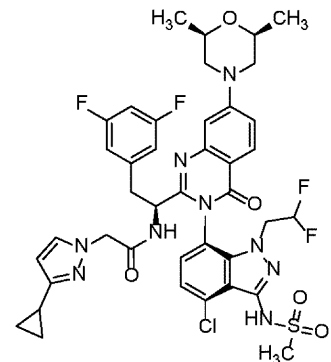
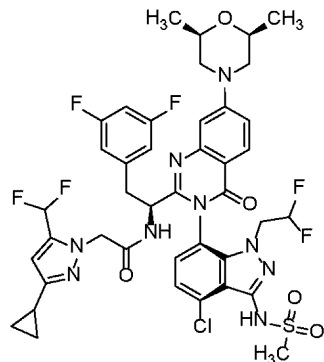
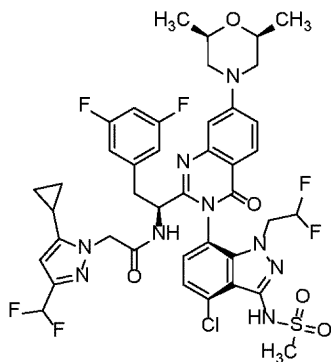
及びそれらの薬学的に許容される塩からなる群から選択される、(1)に記載の化合物又は塩。

(24)

【化191】

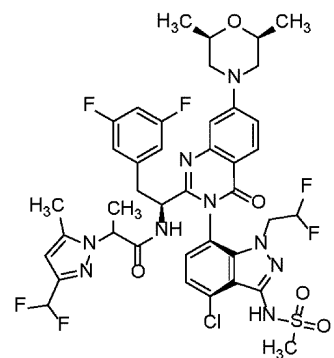
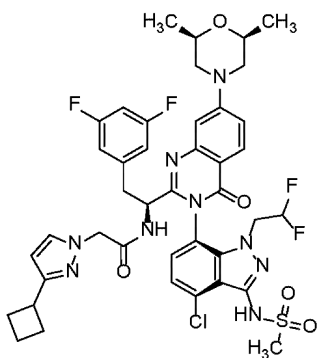
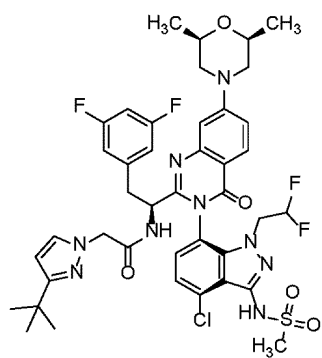


30

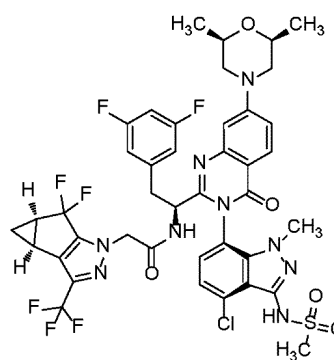
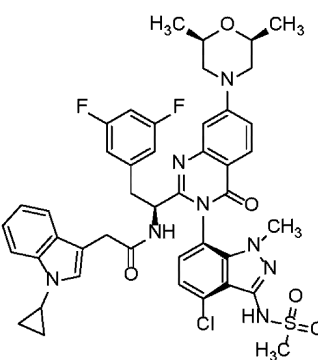
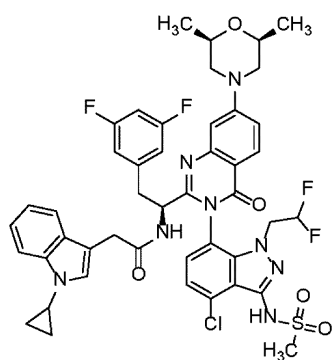


40

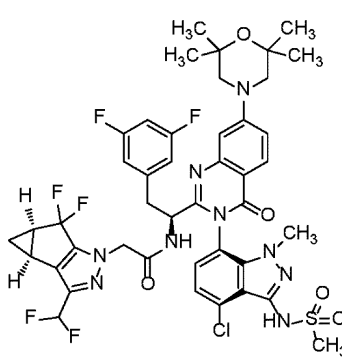
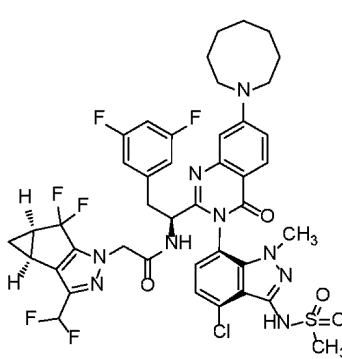
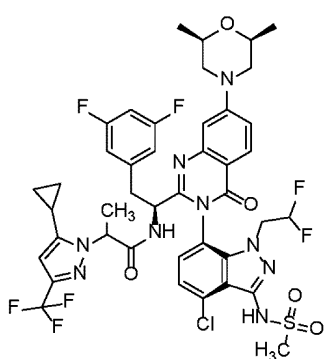
50



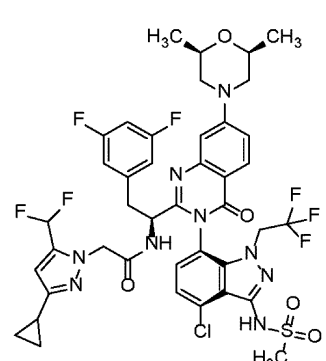
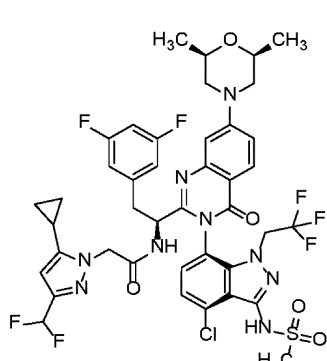
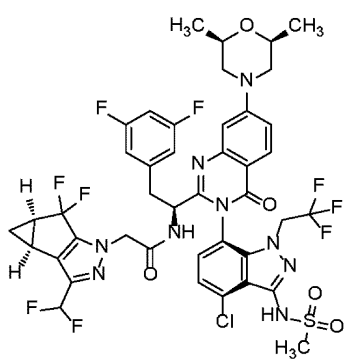
10



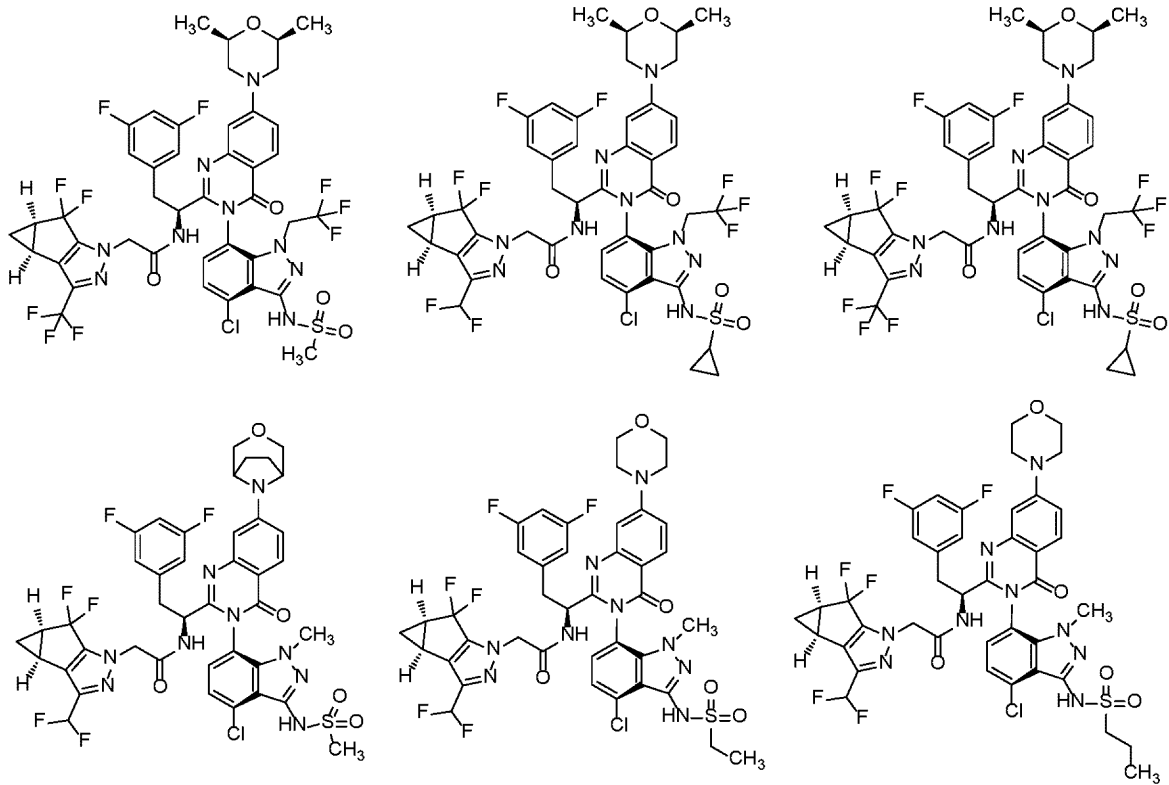
20



30



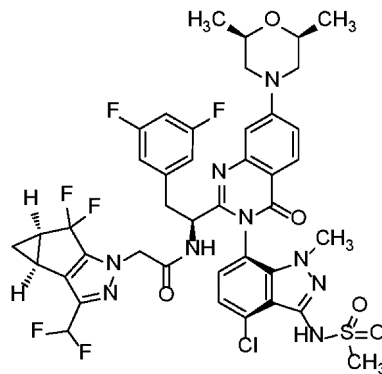
40



及びそれらの薬学的に許容される塩からなる群から選択される、(1)に記載の化合物又は塩。

(25)

【化192】



及びその薬学的に許容される塩からなる群から選択される、(1)に記載の化合物又は塩。

(26) (1) から (25) のいずれかに記載の化合物又は塩を含む、医薬組成物。

(27) 薬学的に許容される担体、賦形剤及び/又は希釈剤をさらに含む、(26)に記載の組成物。

(28) (26) 又は (27) に記載の組成物を患者に投与することを含む、HIV感染を処置する方法。

(29) 前記投与が経口である、(28)に記載の方法。

(30) 前記投与が筋肉内又は皮下注射による、(28)に記載の方法。

(31) ヌクレオシドHIV逆転写酵素阻害剤、非ヌクレオシドHIV逆転写酵素阻害剤、HIVプロテアーゼ阻害剤、HIV融合阻害剤、HIV付着阻害剤、CCR5阻害剤、CXCR4阻害剤、HIV出芽又は成熟阻害剤及びHIVインテグラーゼ阻害剤からなる群から選択される、

40

50

AIDS又はHIV感染の処置に使用される少なくとも1つの他の薬剤の投与をさらに含む、  
(28)に記載の方法。

(32)少なくとも1つの他の薬剤が、ドルテグラビル、ラミブジン、ホステムサビル及び  
ビカボテグラビルからなる群から選択される、(31)に記載の方法。

(33)治療において使用するための、(1)から(25)のいずれかに記載の化合物又  
はその薬学的に許容される塩。

(34)HIV感染の処置において使用するための、(1)から(25)のいずれかに記載  
の化合物又はその薬学的に許容される塩。

(35)HIV感染の処置のための医薬の製造において使用するための、(1)から(25  
)のいずれかに記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

10

20

30

40

50