

【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23年6月16日(2011.6.16)

【公表番号】特表2009-537546(P2009-537546A)

【公表日】平成21年10月29日(2009.10.29)

【年通号数】公開・登録公報2009-043

【出願番号】特願2009-511069(P2009-511069)

【国際特許分類】

C 07 D 471/04	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 31/18	(2006.01)
A 61 P 37/04	(2006.01)
A 61 P 31/12	(2006.01)
A 61 K 31/4745	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
A 61 K 31/551	(2006.01)
C 07 D 513/14	(2006.01)
A 61 K 31/4985	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)

【F I】

C 07 D 471/04	1 0 4 Z
A 61 P 43/00	1 2 3
A 61 P 31/18	
A 61 P 37/04	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 31/12	
A 61 K 31/4745	
A 61 K 31/496	
A 61 K 31/551	
C 07 D 513/14	
A 61 K 31/4985	
A 61 K 31/5377	

【手続補正書】

【提出日】平成22年4月27日(2010.4.27)

【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

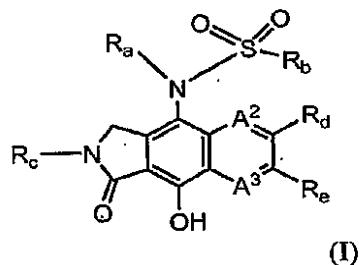
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

## 【化1】



(式中、

$A^2$  および  $A^3$  は、それぞれ独立して、N または  $CR_a$  であり、

各  $R_a$  は、独立して、H または  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、

$R_b$  は、H または  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、

$R_c$  は、H、 $R_k$ 、-M-R<sub>m</sub>、または-Q-R<sub>n</sub> であり、

$R_d$  は、H、ハロ、または  $R_j$  で任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、

$R_e$  は、H、ハロ、または  $R_j$  で任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、

$R_f$  は、H または  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、

M は、分枝  $C_2 \sim C_4$  アルキレンであり、

Q は、 $C_1 \sim C_4$  アルキレンであり、

各  $R_j$  は、1つまたは複数の F、Cl、Br、I、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、または  $C_1 \sim C_4$  アルキルで任意選択的に置換されたフェニルであり、

$R_k$  は、それぞれ、1つまたは複数のハロ、ヒドロキシ、カルボキシ、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N-エチル-N-メチルアミノ、モルホリノ、チオモルホリノ、ペリジノ、-C(=O)NR<sub>a</sub>aR<sub>a</sub>b、-N(R<sub>a</sub>a)SO<sub>2</sub>R<sub>a</sub>b、-SO<sub>2</sub>R<sub>a</sub>b、 $C_1 \sim C_6$  アルカノイル、 $C_3 \sim C_6$  炭素環、ピロリジノ、2-オキソピロリジノ、またはピペラジノで任意選択的に置換された-SO<sub>2</sub>R<sub>r</sub>、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、または  $C_2 \sim C_6$  アルキニルであり、

$R_m$  は、1つまたは複数の F、Cl、Br、I、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、または  $C_1 \sim C_4$  アルキルで任意選択的に置換されたフェニルであり、そして、

$R_n$  は、1つまたは複数の F、Cl、Br、I、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、または  $C_1 \sim C_4$  アルキルで任意選択的に置換された 5 員または 6 員のヘテロアリール環であるか、 $R_n$  は、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、R<sub>f</sub>SO<sub>2</sub>NH-、または R<sub>f</sub>C(=O)NH- から選択される少なくとも 1 つの基で置換されたか、1つまたは複数の F、Cl、Br、I、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、または  $C_1 \sim C_4$  アルキルで任意選択的に置換されたフェニル環であるか、 $R_n$  は、 $C_3 \sim C_6$  炭素環であり、そして

各  $R_{a_a}$  および  $R_{a_b}$  は、独立して、H または  $C_1 \sim C_6$  アルキルである) の化合物またはその薬学的に許容可能な塩もしくはプロドラッグ。

## 【請求項 2】

前記  $R_k$  が、それぞれ、1つまたは複数のハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N-エチル-N-メチルアミノ、モルホリノ、チオモルホリノ、ペリジノ、またはピペラジノで任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、または  $C_2 \sim C_6$  アルキニルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 3】

前記  $A^2$  が CH であり、前記  $A^3$  が N である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

前記  $R_a$  がメチルである、請求項 1 に記載の化合物。

**【請求項 5】**

前記 R<sub>b</sub> がメチルである、請求項 1 に記載の化合物。

**【請求項 6】**

前記 R<sub>c</sub> が H である、請求項 1 に記載の化合物。

**【請求項 7】**

前記 R<sub>c</sub> が R<sub>k</sub> である、請求項 1 に記載の化合物。

**【請求項 8】**

- M - R<sub>m</sub> である、請求項 1 に記載の化合物。

**【請求項 9】**

- Q - R<sub>n</sub> である、請求項 1 に記載の化合物。

**【請求項 10】**

前記 R<sub>d</sub> が H である、請求項 1 に記載の化合物。

**【請求項 11】**

前記 R<sub>d</sub> が R<sub>j</sub> で置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

**【請求項 12】**

前記 R<sub>e</sub> が H である、請求項 1 に記載の化合物。

**【請求項 13】**

前記 R<sub>e</sub> が、 R<sub>j</sub> で置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

**【請求項 14】**

前記 M が分枝 C<sub>2</sub> アルキレンである、請求項 1 に記載の化合物。

**【請求項 15】**

前記 Q が - C H<sub>2</sub> - である、請求項 1 に記載の化合物。

**【請求項 16】**

各 R<sub>j</sub> が 4 - フルオロフェニルである、請求項 1 に記載の化合物。

**【請求項 17】**

前記 R<sub>k</sub> が、プロピル、2 - プロピニル、2 - プチニル、メチル、2 - メトキシエチル、2 - ヒドロキシエチル、エチル、2 - モルホリノエチル、3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブチル、2 - フルオロエチル、または 2 - ( N , N - ジメチルアミノ ) エチルである、請求項 1 に記載の化合物。

**【請求項 18】**

前記 R<sub>k</sub> が、 N - メチルアミノ - カルボニルメチル、 N , N - ジメチルアミノカルボニルメチル、2 - [ N - ( メチルスルホニル ) - N - メチルアミノ ] エチル、シクロプロピルメチル、2 - ( 2 - オキソピロリドノ ) エチル、2 - ( メチルスルホニル ) エチル、メチルスルホニル、またはアセチルメチルである、請求項 1 に記載の化合物。

**【請求項 19】**

前記 R<sub>m</sub> が 4 - フルオロフェニルである、請求項 1 に記載の化合物。

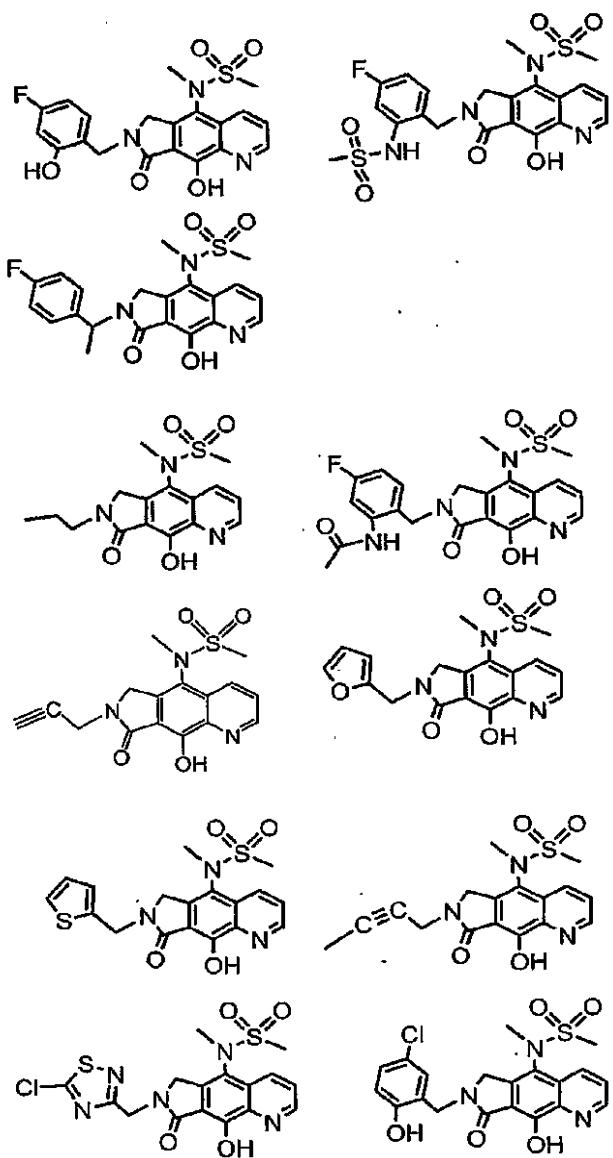
**【請求項 20】**

前記 R<sub>n</sub> が、4 - フルオロ - 2 - ヒドロキシフェニル、4 - フルオロ - 2 - メチルスルホニルアミノフェニル、4 - フルオロ - 2 - アシリルアミノフェニル、2 - フリル、2 - チエニル、5 - クロロ - [ 1 , 2 , 4 ] チアジアゾール - 2 - イル、5 - クロロ - 2 - ヒドロキシフェニル、3 - メチルイソオキサゾール - 5 - イル、4 - フルオロ - 3 - トリフルオロメチルフェニル、5 - トリフルオロメチルフル - 2 - イル、4 - ヒドロキシフェニル、4 - ピリジル ( N - オキシド ) 、または 3 - クロロ - 2 - ヒドロキシフェニルである、請求項 1 に記載の化合物。

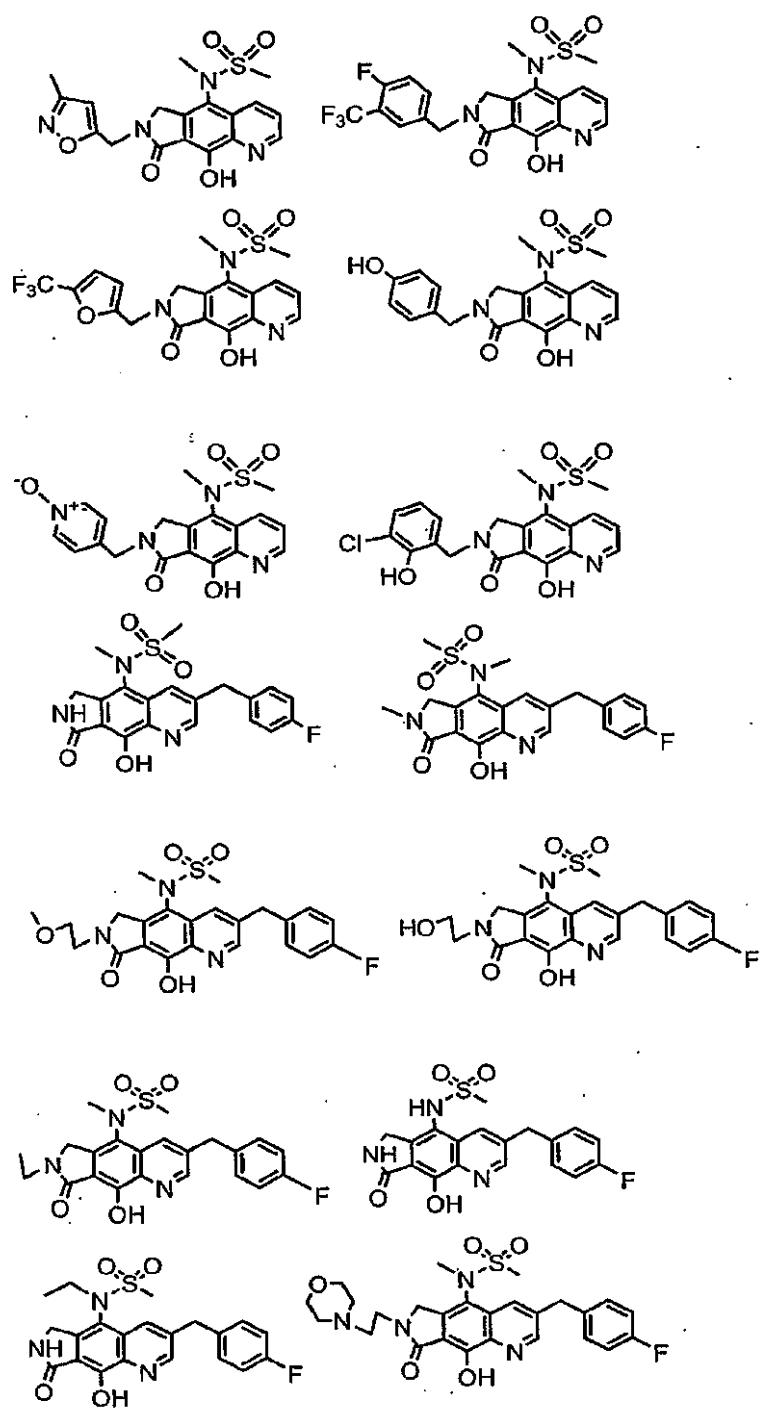
**【請求項 21】**

以下の式 :

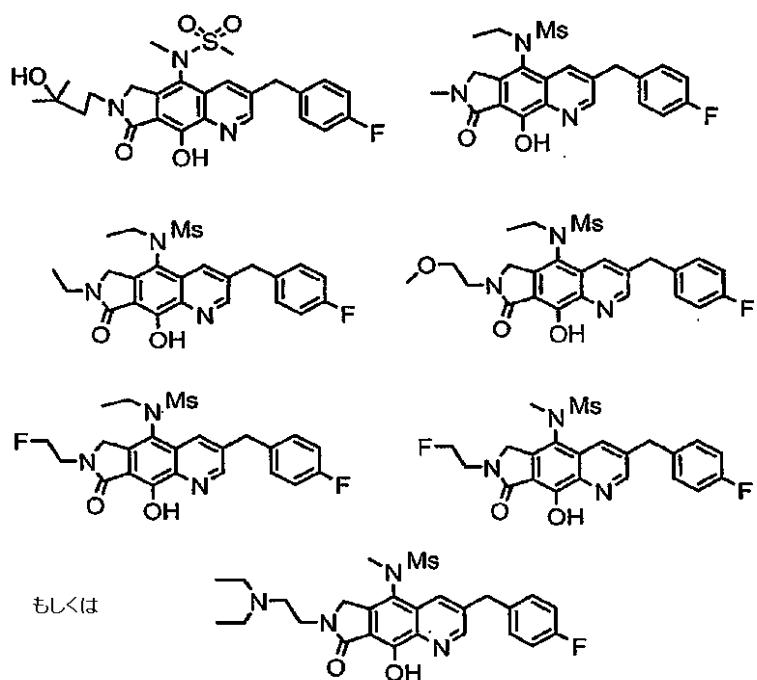
【化 2】



【化3】



【化 4】

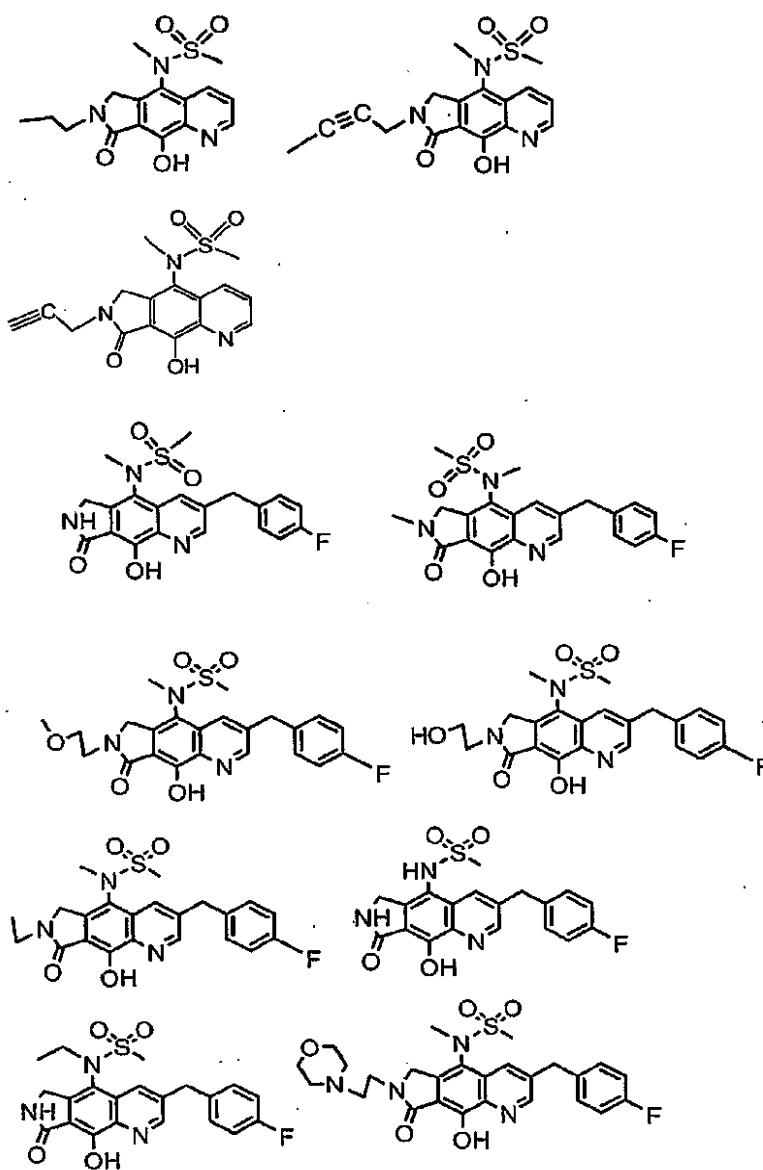


を有する、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

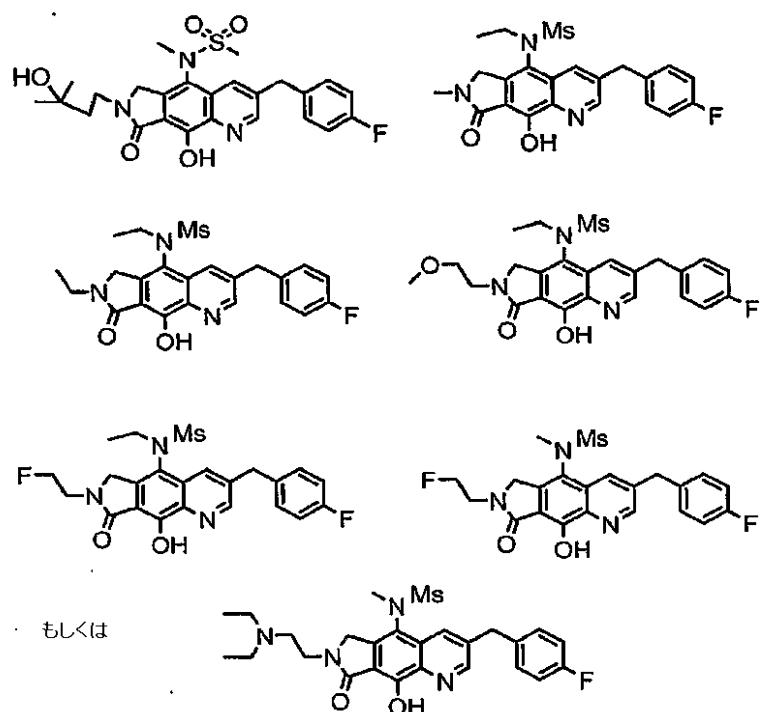
【請求項 2 2】

以下の式：

【化 5】



【化6】

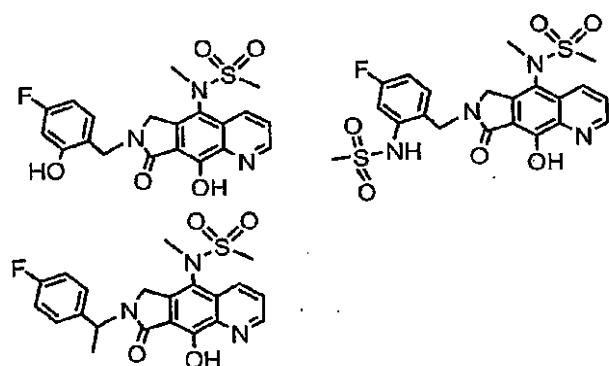


を有する、請求項1に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

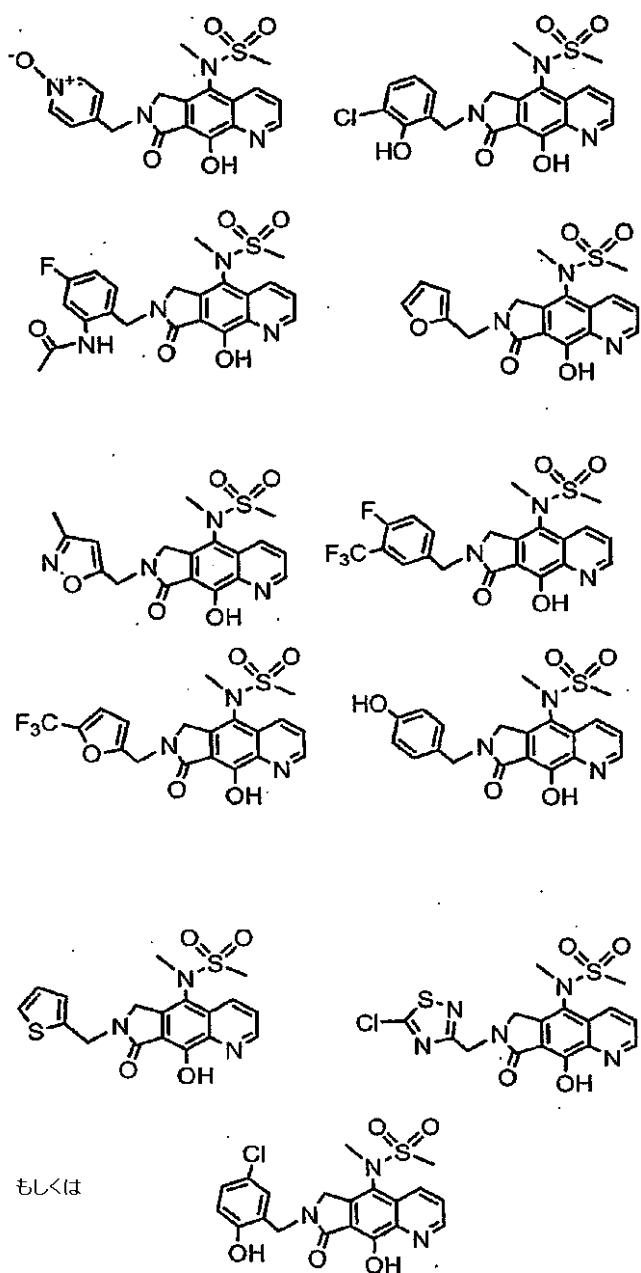
【請求項23】

以下の式：

【化7】



【化 8】

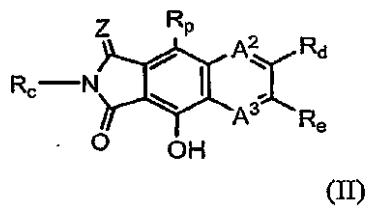


を有する、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 2 4】

式 ( I I ) :

【化 9】



(式中、

$A^2$  および  $A^3$  は、それぞれ独立して、N または CR<sub>a</sub> であり、各 R<sub>a</sub> は、独立して、H または C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、

$R_c$  は、 H、  $R_k$ 、 または -  $Q - R_n$  であり、

$R_d$  は、 H、 ハロ、 または  $R_j$  で任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、

$R_e$  は、 H、 ハロ、 または  $R_j$  で任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、

$Q$  は、  $C_1 \sim C_4$  アルキレンであり、

$Z$  は、 O または 2 つの水素であり、

各  $R_j$  は、 1 つまたは複数の F、 C1、 Br、 I、 ヒドロキシ、 シアノ、 トリフルオロメチル、 トリフルオロメトキシ、 または  $C_1 \sim C_4$  アルキルで任意選択的に置換されたフェニルであり、

$R_k$  は、 それぞれ、 1 つまたは複数のハロ、 ヒドロキシ、  $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 ジメチルアミノ、 ジエチルアミノ、 N - エチル - N - メチルアミノ、 モルホリノ、 チオモルホリノ、 ピペリジノ、 またはピペラジノで任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_6$  アルキル、  $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 または  $C_2 \sim C_6$  アルキニルであり、

$R_n$  は、  $C_3 \sim C_6$  炭素環、 フェニル環、 または 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール環であり、 フェニル環または 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール環は、 1 つまたは複数の F、 C1、 Br、 I、 ヒドロキシ、 シアノ、 トリフルオロメチル、 トリフルオロメトキシ、 または  $C_1 \sim C_4$  アルキルで任意選択的に置換され、

$R_p$  は、 OH、  $C_1 \sim C_4$  アルキル、  $C_1 \sim C_4$  アルカノイル、  $C_1 \sim C_4$  アルコキシ、  $C_2 \sim C_6$  アルケニル、  $C_2 \sim C_6$  アルキニル、 -  $C(=O)NR_xR_x$ 、 -  $C(=N$   $R_{ak})R_{am}$ 、 NH<sub>2</sub>、 - N( $R_a$ ) - C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>x</sub>、 4, 5 - ジヒドロ - 4, 4 - ジメチルオキサゾール、 または - N( $R_s$ ) - S(O)<sub>2</sub> - R<sub>t</sub> であり、 ここで、  $R_p$  の各  $C_1 \sim C_4$  アルキルは、 - C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>x</sub>、 N( $R_{ag}$ ) - C(=O) - R<sub>ah</sub>、 または - N( $R_{ag}$ ) - S(O)<sub>2</sub> - R<sub>ah</sub> で置換され、 ここで、  $R_p$  の各  $C_1 \sim C_4$  アルコキシ、  $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 および  $C_2 \sim C_6$  アルキニルは、 フェニル、 ヒドロキシ、  $C_3 \sim C_6$  炭素環、 または - C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>x</sub> で任意選択的に置換され、

$R_s$  は - S(O)<sub>2</sub> - R<sub>w</sub> であり、 且つ  $R_t$  は、  $R_v$  で任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルであるか、  $R_s$  は、  $R_u$  で置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、 且つ  $R_t$  は、  $R_v$  で任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルであるか、  $R_s$  は、  $R_u$  で任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、 且つ  $R_t$  は、  $R_z$ 、 NR<sub>x</sub>R<sub>x</sub>、 または  $R_v$  で置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、

各  $R_v$  は、 フルオロ、 クロロ、 フェニル、 ピリジル、 1, 4 - ジアゼパニル、 またはピペラジノであり、 ここで、 各フェニル、 ピリジル、 1, 4 - ジアゼパニル、 およびピペラジノは、 1 つまたは複数のフルオロ、 クロロ、 ブロモ、 ヨード、  $C_1 \sim C_4$  アルキル、  $C_1 \sim C_4$  アルキル - C(=O) - 、  $C_1 \sim C_4$  アルキル - S(O)<sub>2</sub> - 、 - C(=O)NR<sub>a</sub>R<sub>a</sub>、 または - C(=O)OR<sub>a</sub> で任意選択的に置換され、

各  $R_u$  は、 独立して、 ジメチルアミノ、 ジエチルアミノ、 N - エチル - N - メチルアミノ、 または  $C_3 \sim C_6$  炭素環、 ピロリジノ、 モルホリノ、 チオモルホリノ、 ピペリジノ、 およびピペラジノから選択される環であり、 環は、 1 つまたは複数の  $C_1 \sim C_4$  アルキルで任意選択的に置換され、

$R_w$  は、  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、

各  $R_x$  は、 独立して、 H、  $C_1 \sim C_4$  アルキル、  $C_3 \sim C_6$  炭素環、 または  $C_1 \sim C_4$  アルキル - R<sub>y</sub> であるか、 NR<sub>x</sub>R<sub>x</sub> は、 共に、 ピペリジノ、 モルホリノ、 アゼチジノ、 ピロリジノ、 またはピペラジノ環を形成し、 環は、 1 つまたは複数の  $C_1 \sim C_4$  アルキルまたはハロで任意選択的に置換され、

各  $R_y$  は、 独立して、 シアノ、 フェニル、 またはピリジルであり、 ここで、 各フェニルまたはピリジルは、 1 つまたは複数のフルオロ、 クロロ、 ブロモ、 ヨード、  $C_1 \sim C_4$  アルキル、  $C_1 \sim C_4$  アルキル - C(=O) - 、  $C_1 \sim C_4$  アルキル - S(O)<sub>2</sub> - 、 - C(=O)NR<sub>a</sub>R<sub>a</sub>、 または - C(=O)OR<sub>a</sub> で任意選択的に置換され、

$R_z$  は、 1 つまたは複数のフルオロ、 クロロ、 ブロモ、 ヨード、  $C_1 \sim C_4$  アルキル、  $C_1 \sim C_4$  アルキル - C(=O) - 、  $C_1 \sim C_4$  アルキル - S(O)<sub>2</sub> - 、 - C(=O)

$\text{N R}_a \text{R}_a$ 、または $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_a$ で任意選択的に置換されたフェニルであり、各 $\text{R}_{ag}$ および $\text{R}_{ah}$ は、独立して、Hまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルであり、各 $\text{R}_{ak}$ は、ヒドロキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ、または $\text{N R}_{am} \text{R}_{an}$ であり、各 $\text{R}_{ah}$ は、独立して、Hまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルであり、各 $\text{R}_{am}$ および $\text{R}_{an}$ は、独立して、Hまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルである)の化合物またはその薬学的に許容可能な塩もしくはプロドラッグ。

## 【請求項 25】

前記 $\text{R}_p$ が、 $\text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシ、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{N}(\text{R}_a)-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_x \text{R}_x$ 、または $-\text{N}(\text{R}_s)-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}_t$ であり、

各 $\text{R}_x$ は、独立して、H、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル- $\text{R}_y$ であるか、 $\text{NR}_x \text{R}_x$ は、共に、ピペリジノまたはピペラジノ環を形成し、環は、1つまたは複数の $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルで任意選択的に置換され、

各 $\text{R}_y$ は、独立して、フェニルまたはピリジルであり、ここで、各フェニルまたはピリジルは、1つまたは複数のフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル- $\text{C}(=\text{O})-$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル- $\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}_a \text{R}_a$ 、または $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}_a$ で任意選択的に置換される、請求項 24 に記載の化合物。

## 【請求項 26】

前記 $\text{A}^2$ が $\text{CH}$ であり、前記 $\text{A}^3$ が $\text{N}$ である、請求項 24 に記載の化合物。

## 【請求項 27】

前記 $\text{A}^2$ が $\text{N}$ であり、前記 $\text{A}^3$ が $\text{CH}$ である、請求項 24 に記載の化合物。

## 【請求項 28】

前記 $\text{R}_c$ が $\text{H}$ である、請求項 24 に記載の化合物。

## 【請求項 29】

前記 $\text{R}_c$ が $\text{R}_k$ である、請求項 24 に記載の化合物。

## 【請求項 30】

前記 $\text{R}_c$ が $-\text{Q}-\text{R}_n$ である、請求項 24 に記載の化合物。

## 【請求項 31】

前記 $\text{R}_d$ が $\text{H}$ である、請求項 24 に記載の化合物。

## 【請求項 32】

前記 $\text{R}_d$ が $\text{R}_j$ で置換された $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルである、請求項 24 に記載の化合物。

## 【請求項 33】

前記 $\text{R}_e$ が $\text{H}$ である、請求項 24 に記載の化合物。

## 【請求項 34】

前記 $\text{R}_e$ が、 $\text{R}_j$ で置換された $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルである、請求項 24 に記載の化合物。

## 【請求項 35】

前記 $\text{Q}$ が $-\text{CH}_2-$ である、請求項 24 に記載の化合物。

## 【請求項 36】

各 $\text{R}_j$ が4-フルオロフェニルである、請求項 24 に記載の化合物。

## 【請求項 37】

前記 $\text{R}_k$ が、エチル、2-モルホリノエチル、2-メトキシエチル、メチル、2-ヒドロキシエチル、または3-ヒドロキシ-3-メチルブチルである、請求項 24 に記載の化合物。

## 【請求項 38】

前記 $\text{Q}$ が $-\text{CH}_2-$ であり、前記 $\text{R}_n$ が4-フルオロフェニルである、請求項 24 に記載の化合物。

## 【請求項 39】

前記 $\text{R}_p$ が $\text{OH}$ である、請求項 24 に記載の化合物。

## 【請求項 40】

前記  $R_p$  が  $C_1 \sim C_4$  アルコキシである、請求項 2 4 に記載の化合物。

【請求項 4 1】

前記  $R_p$  が  $N(R_a) - C(=O)NR_xR_x$  である、請求項 2 4 に記載の化合物。

【請求項 4 2】

前記  $R_p$  が  $-N(R_s) - S(O)_2 - R_t$  である、請求項 2 4 に記載の化合物。

【請求項 4 3】

前記  $R_s$  が  $-S(O)_2 - R_w$  であり、前記  $R_t$  が  $R_v$  で任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルである、請求項 4 2 に記載の化合物。

【請求項 4 4】

前記  $R_s$  が  $R_u$  で置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、前記  $R_t$  が  $R_v$  で任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルである、請求項 4 2 に記載の化合物。

【請求項 4 5】

前記  $R_s$  が  $R_u$  で任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、前記  $R_t$  が  $NR_xR_x$  または  $R_v$  で置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルである、請求項 4 2 に記載の化合物。

【請求項 4 6】

前記  $R_s$  が  $-S(O)_2 - CH_3$  または  $-S(O)_2 - CH_2CH_3$  であり、前記  $R_t$  がメチルまたはエチルである、請求項 4 2 に記載の化合物。

【請求項 4 7】

前記  $R_s$  が、シクロプロピルメチル、2-(2,5-ジメチルピロリジノ)エチル、または2-モルホリノエチルである、請求項 4 2 に記載の化合物。

【請求項 4 8】

前記  $R_t$  が、2-クロロエチル、ベンジル、ピリド-4-イルメチル、4-メチルフェニル、4-クロロフェニル、2-(4-エチルピペラジン-1-イル)エチル、2-(4-エチルスルホニルピペラジン-1-イル)エチル、2-(4-アシルピペラジン-1-イル)エチル、2-(4-イソプロピルピペラジン-1-イル)エチル、 $N$ -(4-フルオロ-2-メチルアミノカルボニルベンジル)- $N$ -メチルアミノ、 $N$ -(4-フルオロ-2-メトキシカルボニルベンジル)アミノ、 $N$ -(4-フルオロ-2-カルボキシベンジル)- $N$ -メチルアミノ、および $N$ , $N$ -ジエチルアミノである、請求項 4 4 に記載の化合物。

【請求項 4 9】

前記  $R_p$  が  $N$ -メチル- $N$ -(4-メチルピペラジン-1-イルカルボニル)アミノである、請求項 2 4 に記載の化合物。

【請求項 5 0】

前記  $R_p$  がメトキシである、請求項 2 4 に記載の化合物。

【請求項 5 1】

前記  $R_p$  が、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルカノイル、 $C_1 \sim C_4$  アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_2 \sim C_6$  アルキニル、 $-C(=O)NR_xR_x$ 、 $-C(=O)NR_{a_m}$ 、または4,5-ジヒドロ-4,4-ジメチルオキサゾールであり、ここで、 $R_p$  の各  $C_1 \sim C_4$  アルキルは  $-C(=O)NR_xR_x$ 、 $-N(R_{a_g}) - C(=O)R_{a_h}$ 、または  $-N(R_{a_g}) - S(O)_2 - R_{a_h}$  で置換され、ここで、 $R_p$  の各  $C_1 \sim C_4$  アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、および  $C_2 \sim C_6$  アルキニルは、フェニル、ヒドロキシ、 $C_3 \sim C_6$  炭素環、または  $-C(=O)NR_xR_x$  で任意選択的に置換される、請求項 2 4 に記載の化合物。

【請求項 5 2】

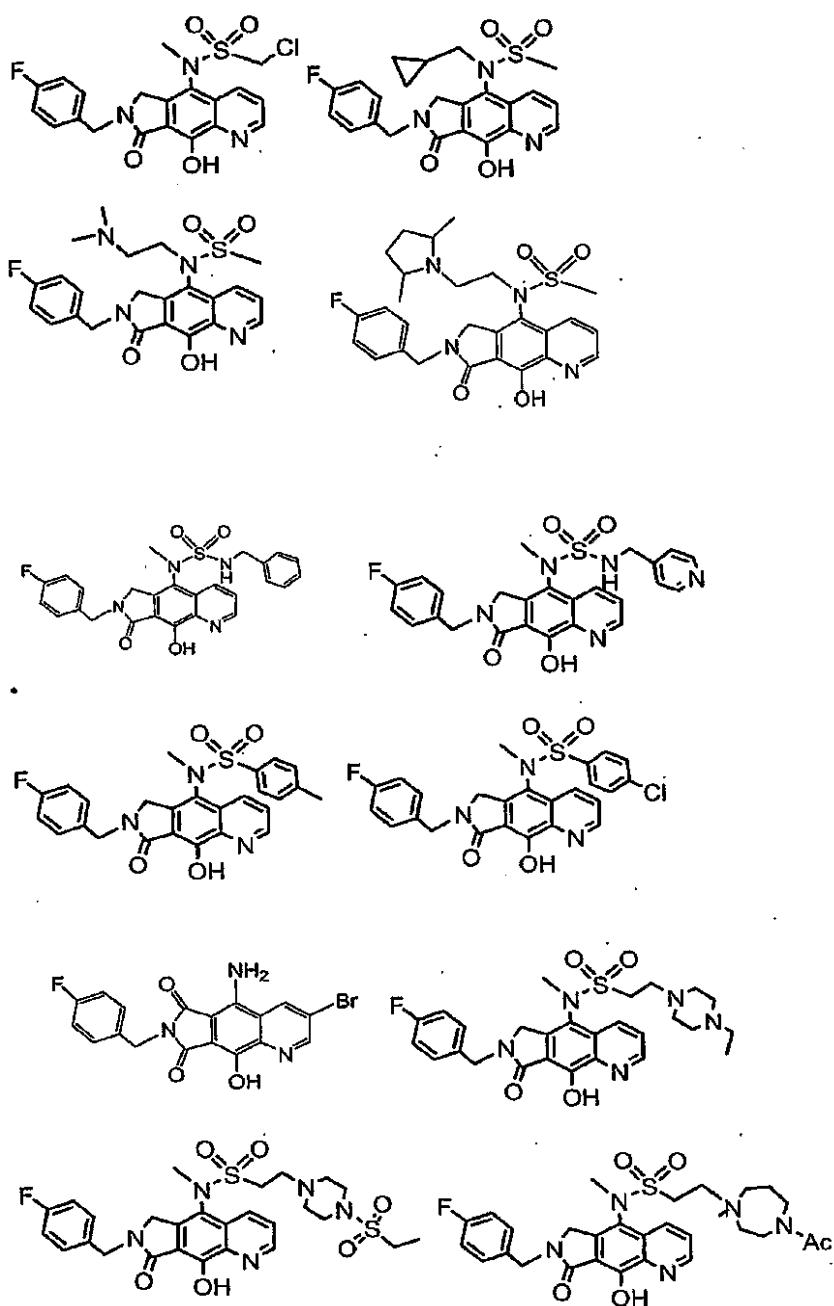
前記  $R_p$  が、2-( $N$ , $N$ -ジメチルアミノカルボニル)-2-メチルエトキシ、アリル、ペリジノカルボニル、4,4-ジフルオロピペリジノカルボニル、 $N$ -シクロプロピル- $N$ -(2-シアノエチル)アミノカルボニル、2-[ $N$ -メチル- $N$ -(メチルスルホニル)アミノ]エチル、 $N$ , $N$ -ジメチルアミノカルボニルメチル、 $N$ -メチルアミノカルボニル、 $N$ -(2,2,2-トリフルオロエチル)アミノカルボニル、アセチル、ペリジノカルボニルメチル、モルホリノカルボニルメチル、2-シクロプロピルエチニ

ル、アゼチジノカルボニル、4-フルオロピペリジノカルボニル、ピロリジノカルボニル、3,3-ジフルオロピロリジノカルボニル、エチニル、1-ヒドロキシミノエチル、2-フェニルエチニル、4,5-ジヒドロ-4,4-ジメチルオキサゾール、4-メチルピペラジン-1-イルカルボニル、N-アセチル-N-メチルアミノ、3,3-ジメチルブチン-1-イル、1-[N-(N',N'-ジメチルアミノ)イミノ]エチル、2-[N-(N'-メチルアミノ)イミノ]エチル、3-ヒドロキシ-3-メチルブチン-1-イル、1-メチルビニル、または1-(N-メトキシイミノ)エチルである、請求項24に記載の化合物。

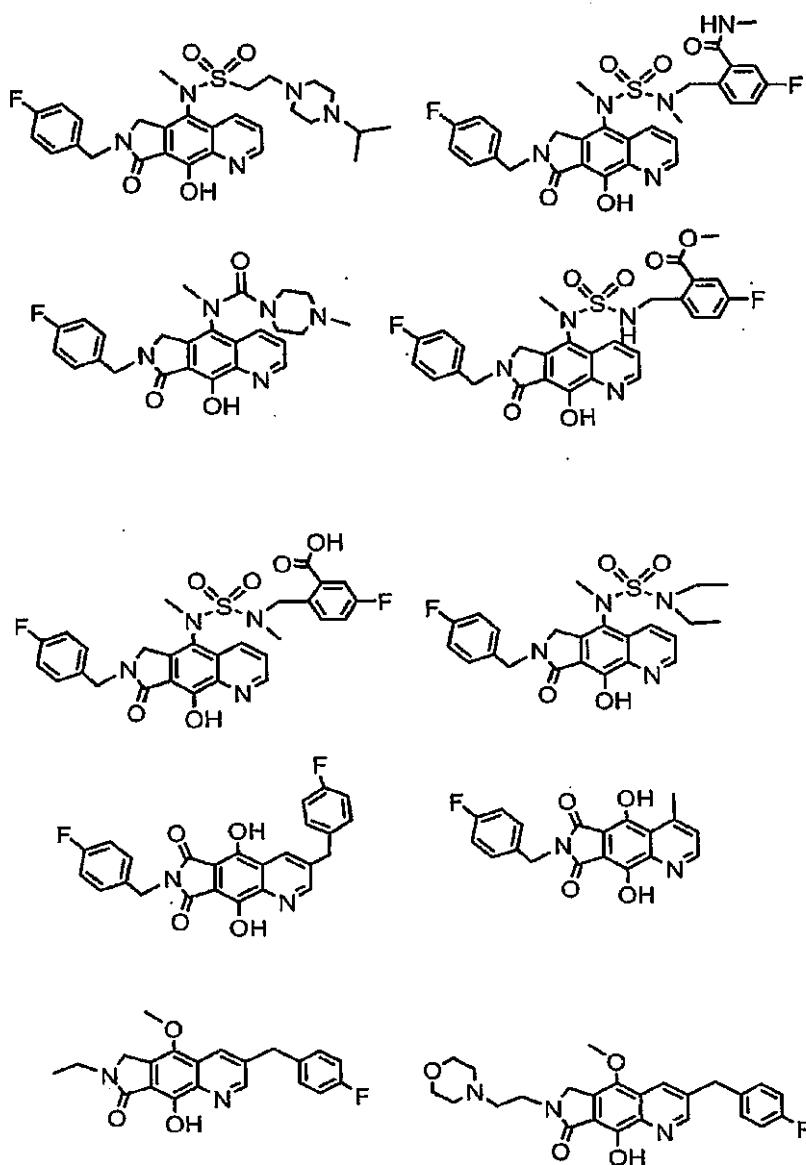
## 【請求項53】

以下の式：

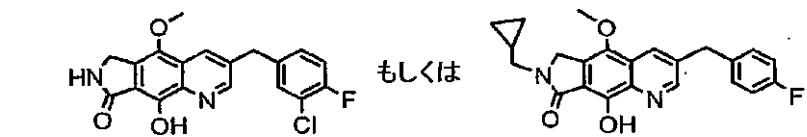
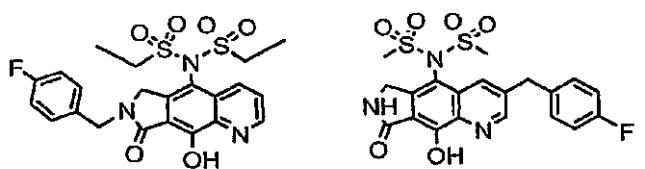
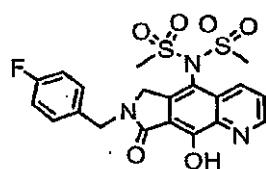
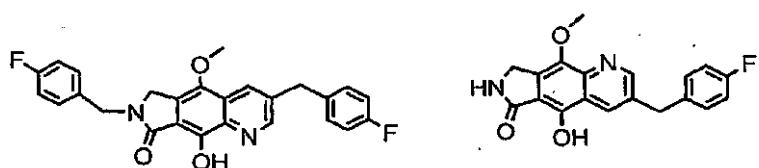
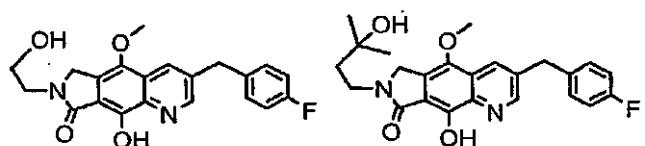
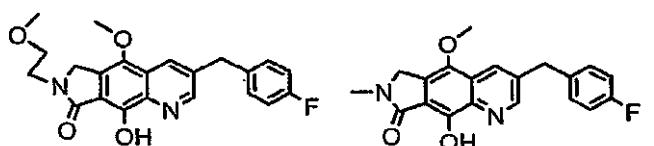
## 【化10】



【化 11】



【化 1 2】

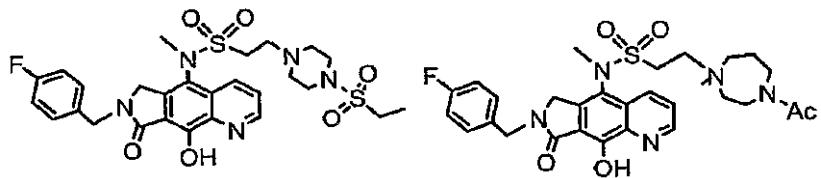
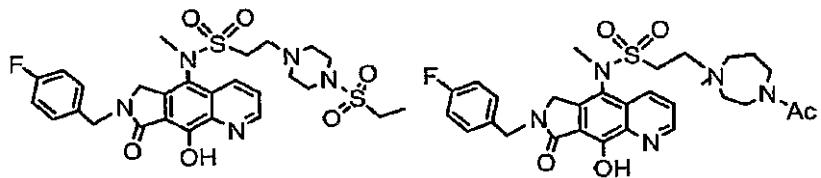
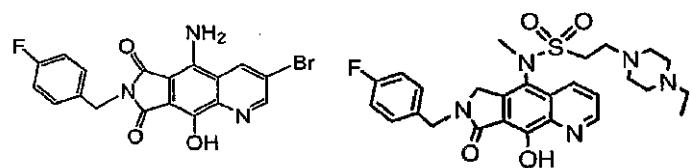
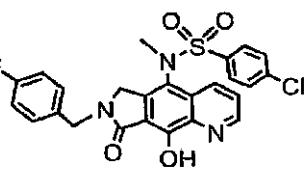
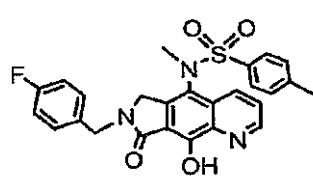
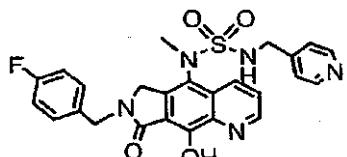
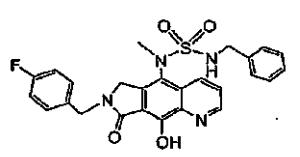
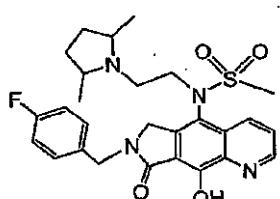
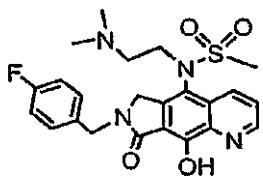
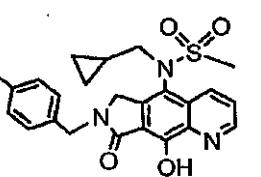
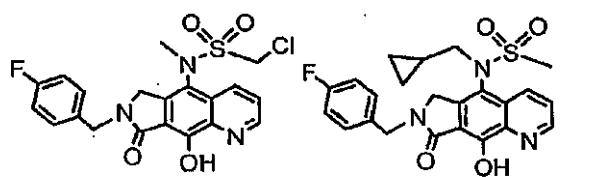


を有する、請求項 2 4 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

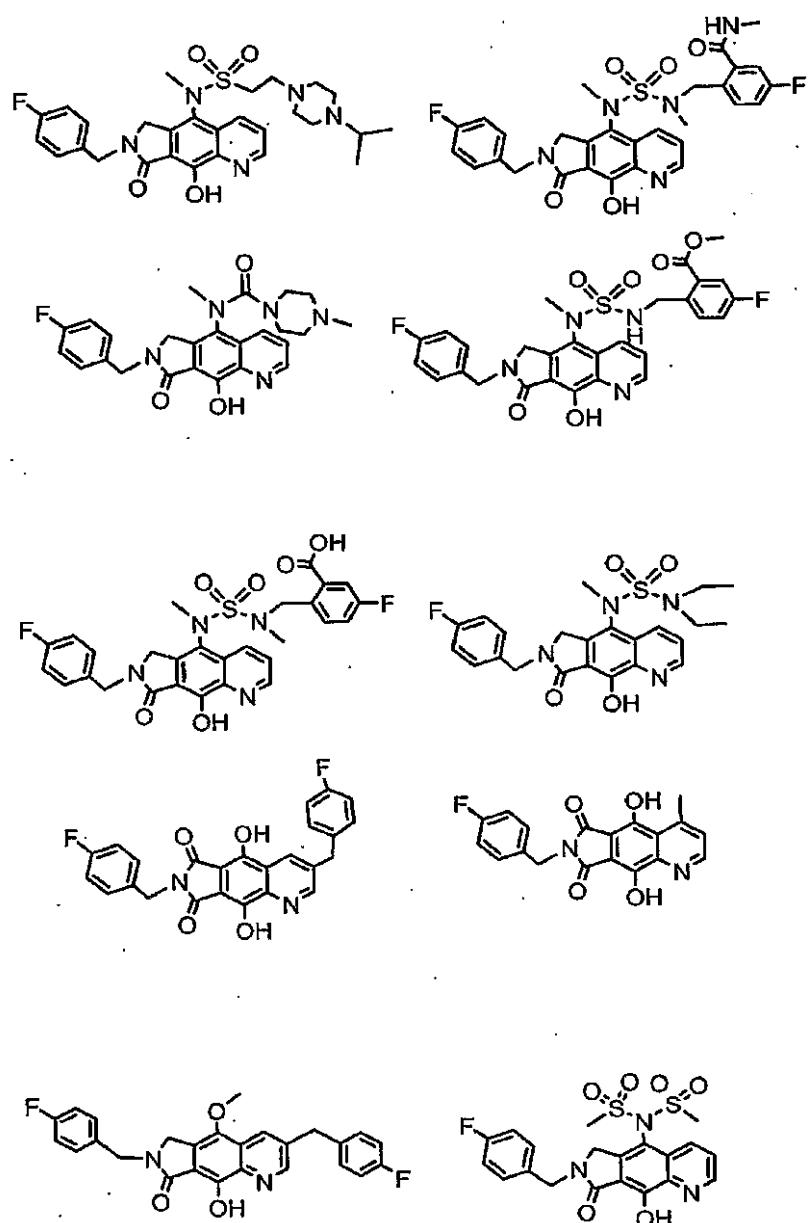
## 【請求項 5 4】

以下の式：

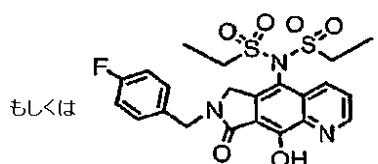
【化 1 3】



## 【化 1 4】



## 【化 1 5】

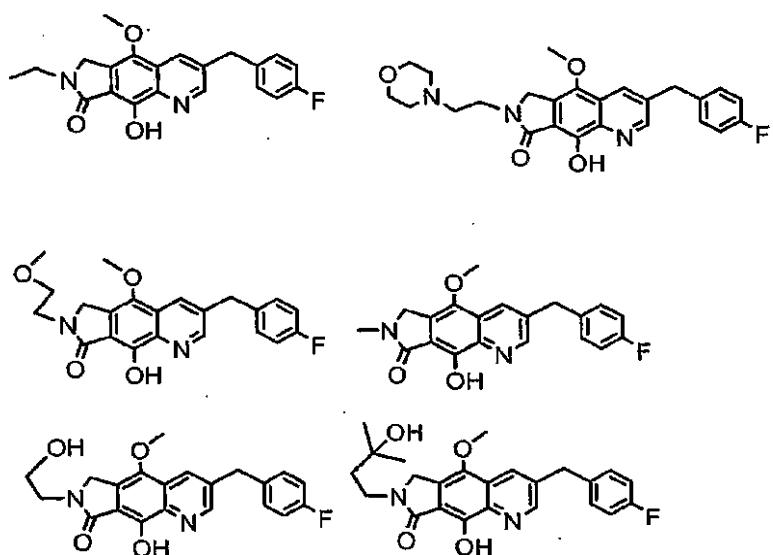


を有する、請求項 2 4 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

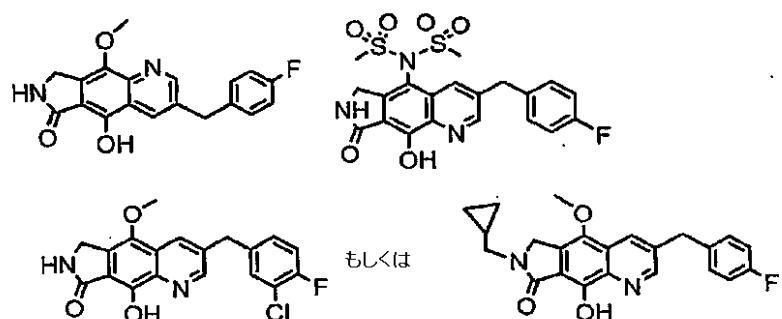
## 【請求項 5 5】

以下の式：

## 【化16】



## 【化17】

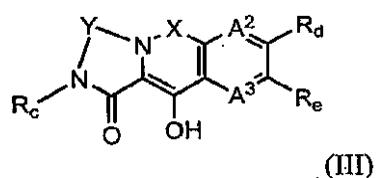


を有する、請求項24に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項56】

式(I)(I)(I)：

## 【化18】



(式中、

$A^2$  および  $A^3$  は、それぞれ独立して、NまたはCR<sub>g</sub>であり、ここで、各R<sub>g</sub>は、独立して、Hまたはアルキルであり、

R<sub>c</sub>は、H、R<sub>k</sub>、または-L-A<sub>r</sub>であり、

R<sub>d</sub>は、H、ハロ、またはR<sub>j</sub>で任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルであり、

R<sub>e</sub>は、H、ハロ、またはR<sub>j</sub>で任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルであり、

LはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキレンであり、

R<sub>k</sub>は、それぞれ、1つまたは複数のハロ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N-エチル-N-メチルアミノ、モルホリノ、チオモルホリノ、ピペリジノ、またはピペラジノで任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルであり、

Xは-C(=O)-または-S(O)<sub>2</sub>-であり、

Y は - C H <sub>2</sub> - または - C H <sub>2</sub> - C H <sub>2</sub> - であり、  
 A r は、 C <sub>3</sub> ~ C <sub>12</sub> 炭素環、 置換 C <sub>3</sub> ~ C <sub>12</sub> 炭素環、 C <sub>6</sub> ~ C <sub>20</sub> アリール、 置換  
 C <sub>6</sub> ~ C <sub>20</sub> アリール、 C <sub>6</sub> ~ C <sub>20</sub> ヘテロアリール、 置換 C <sub>6</sub> ~ C <sub>20</sub> ヘテロアリール  
 であり、

各 R <sub>j</sub> は、 1 つまたは複数の F、 Cl、 Br、 I、 ヒドロキシ、 シアノ、 トリフルオロメチル、 トリフルオロメトキシ、 または C <sub>1</sub> ~ C <sub>4</sub> アルキルで任意選択的に置換されたフェニルである ) の化合物またはその薬学的に許容可能な塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 5 7】

前記 A <sup>2</sup> が C H であり、 前記 A <sup>3</sup> が N である、 請求項 5 6 に記載の化合物。

【請求項 5 8】

前記 R <sub>c</sub> が 4 - フルオロベンジルまたはメチルである、 請求項 5 6 に記載の化合物。

【請求項 5 9】

前記 X が - C ( = O ) - である、 請求項 5 6 に記載の化合物。

【請求項 6 0】

前記 X が - S ( O ) <sub>2</sub> - である、 請求項 5 6 に記載の化合物。

【請求項 6 1】

前記 Y が - C H <sub>2</sub> - である、 請求項 5 6 に記載の化合物。

【請求項 6 2】

前記 Y が - C H <sub>2</sub> - C H <sub>2</sub> - である、 請求項 5 6 に記載の化合物。

【請求項 6 3】

前記 R <sub>d</sub> が H である、 請求項 5 6 に記載の化合物。

【請求項 6 4】

前記 R <sub>d</sub> が R <sub>j</sub> で置換された C <sub>1</sub> ~ C <sub>4</sub> アルキルである、 請求項 5 6 に記載の化合物。

【請求項 6 5】

前記 R <sub>e</sub> が H である、 請求項 5 6 に記載の化合物。

【請求項 6 6】

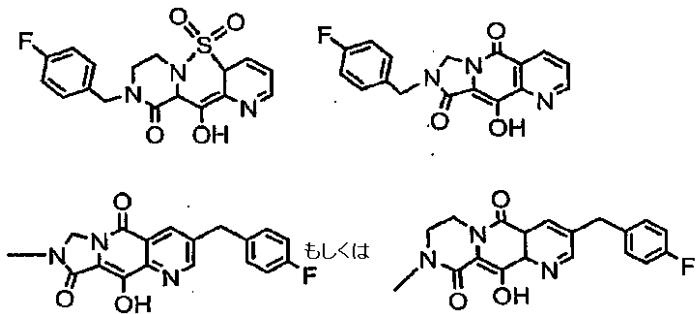
前記 R <sub>e</sub> が、 R <sub>j</sub> で置換された C <sub>1</sub> ~ C <sub>4</sub> アルキルである、 請求項 5 6 に記載の化合物

。

【請求項 6 7】

以下の式 :

【化 1 9】



を有する、 請求項 5 6 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

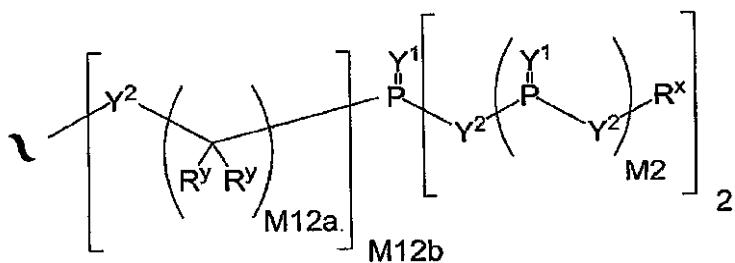
【請求項 6 8】

請求項 1 、 請求項 2 4 、 または 請求項 5 6 に記載の化合物のプロドラッグまたはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6 9】

少なくとも 1 つの水素原子は A <sup>5</sup> 基で置換され、 ここで、 各 A <sup>5</sup> は、 独立して、

## 【化 2 0】



であり、

Y<sup>1</sup> は、独立して、O、S、N(R<sup>x</sup>)、N(O)(R<sup>x</sup>)、N(OR<sup>x</sup>)、N(O)(OR<sup>x</sup>)、またはN(N(R<sup>x</sup>))<sub>2</sub> であり、

Y<sup>2</sup> は、独立して、単結合、O、N(R<sup>x</sup>)、N(O)(R<sup>x</sup>)、N(OR<sup>x</sup>)、N(O)(OR<sup>x</sup>)、N(N(R<sup>x</sup>))<sub>2</sub>、-S(=O)- (スルホキシド)、-S(=O)<sub>2</sub>- (スルホン)、-S- (スルフィド)、または-S-S- (ジスルフィド) であり、M2 は、0、1 または 2 であり、

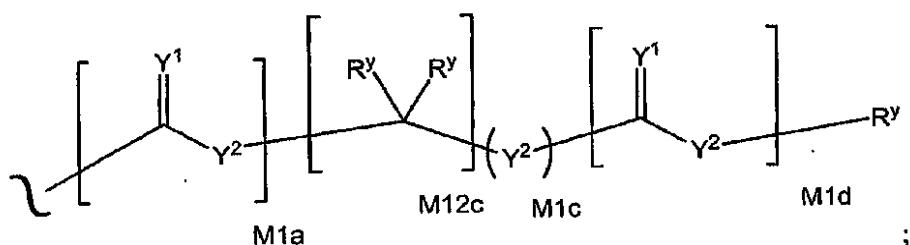
M12a は、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、または12 であり、

M12b は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、または12 であり、

RY は、独立して、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> 置換アルキル、アリール、置換アリール、または保護基であり、あるいは、1つの炭素原子、2つの隣接する RY 基と共に環を形成し(すなわち、スピロ炭素)、環は、全て炭素原子であってよく、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、またはシクロヘキシルであるか、あるいは、環は、1つまたは複数のヘテロ原子を含むことができ、例えば、ピペラジニル、ピペリジニル、ピラニル、またはテトラヒドロフリルであり、

R<sup>x</sup> は、独立して、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> 置換アルキル、C<sub>6</sub> ~ C<sub>20</sub> アリール、C<sub>6</sub> ~ C<sub>20</sub> 置換アリール、もしくは保護基、または式：

## 【化 2 1】



(式中、M1a、M1c、およびM1d は、独立して、0 または 1 であり、M12c は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、または12 である) である、式I、II、またはIIIの化合物である、請求項1、請求項24、または請求項56に記載の化合物のホスホナート。

## 【請求項 7 0】

プロドラッグである、請求項69に記載のホスホナート。

## 【請求項 7 1】

前記化合物のIC<sub>50</sub> が > 0 uM と約 1 uMとの間である、請求項1、請求項24、または請求項56に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 7 2】

前記化合物のEC<sub>50</sub> が > 0 uM と約 1 uMとの間である、請求項1、請求項24、または請求項56に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩。

## 【請求項 7 3】

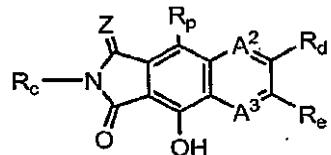
前記化合物のIC<sub>50</sub> が > 0 nM と約 1 nMとの間であり、前記化合物のEC<sub>50</sub> が > 0 uM と約 1 uMとの間である、請求項1、請求項24、または請求項56に記載の化合

物または薬学的に許容可能な塩。

【請求項 7 4】

式 ( I I ) :

【化 2 2】



(II)

(式中、

A<sup>2</sup> および A<sup>3</sup> は、それぞれ独立して、N または C R<sub>a</sub> であり、

各 R<sub>a</sub> は、独立して、H または C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、

R<sub>c</sub> は、H、R<sub>k</sub>、または - Q - R<sub>n</sub> であり、

R<sub>d</sub> は、R<sub>j</sub> で置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、

R<sub>e</sub> は、H、ハロ、または R<sub>j</sub> で任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、

Q は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキレンであり、

Z は、O または 2 つの水素であり、

各 R<sub>j</sub> は、1 つまたは複数の F、C<sub>1</sub>、Br、I、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、または C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルで任意選択的に置換されたフェニルであり、

R<sub>k</sub> は、それぞれ、1 つまたは複数のハロ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N - エチル - N - メチルアミノ、モルホリノ、チオモルホリノ、ピペリジノ、またはピペラジノで任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニルであり、

R<sub>n</sub> は、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> 炭素環、フェニル環、または 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール環であり、フェニル環または 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール環は、1 つまたは複数の F、C<sub>1</sub>、Br、I、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、- C(=O)NR<sub>a</sub>cR<sub>a</sub>d、または C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルで任意選択的に置換され、

R<sub>p</sub> は、- N(R<sub>a</sub>e) - S(O)<sub>2</sub> - R<sub>a</sub>f であり、

R<sub>w</sub> は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、

各 R<sub>x</sub> は、独立して、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、または C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル - R<sub>y</sub> であるか、NR<sub>x</sub>R<sub>x</sub> は、共に、ピペリジノまたはピペラジノ環を形成し、環は、1 つまたは複数の C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルで任意選択的に置換され、

各 R<sub>y</sub> は、独立して、フェニルまたはピリジルであり、ここで、各フェニルまたはピリジルは、1 つまたは複数のフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル - C(=O) - 、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル - S(O)<sub>2</sub> - 、- C(=O)NR<sub>a</sub>R<sub>a</sub>、または - C(=O)OR<sub>a</sub> で任意選択的に置換され、

R<sub>z</sub> は、1 つまたは複数のフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル - C(=O) - 、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル - S(O)<sub>2</sub> - 、- C(=O)NR<sub>a</sub>R<sub>a</sub>、または - C(=O)OR<sub>a</sub> で任意選択的に置換されたフェニルであり、

各 R<sub>a</sub>c および R<sub>a</sub>d は、独立して、H または C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルであり、

各 R<sub>a</sub>e および R<sub>a</sub>f は、独立して、H または C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルである) の化合物またはその薬学的に許容可能な塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 7 5】

前記 R<sub>c</sub> が、3 - クロロ - 4 , 6 - ジフルオロベンジル、4 - フルオロベンジル、3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル、4 - フルオロ - 2 - (N , N - ジメチルアミノカルボニル) ベンジル、または 4 - フルオロ - 2 - (N - メチルアミノカルボニル) ベンジルである、請求項 7 4 に記載の化合物。

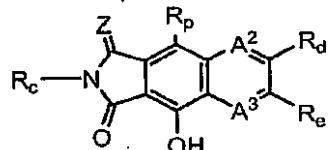
## 【請求項 7 6】

前記  $R_d$  が 4 - フルオロベンジルである、請求項 7 5 に記載の化合物。

## 【請求項 7 7】

式 ( I I ) :

## 【化 2 3】



(II)

(式中、

$A^2$  および  $A^3$  は、それぞれ独立して、N または  $CR_a$  であり、

各  $R_a$  は、独立して、H または  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、

$R_c$  は、H、 $R_k$ 、または  $-Q-R_n$  であり、

$R_d$  は、 $R_j$  で置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、

$R_e$  は、H、ハロ、または  $R_j$  で任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、

$Q$  は、 $C_1 \sim C_4$  アルキレンであり、

$Z$  は、O または 2 つの水素であり、

各  $R_j$  は、1 つまたは複数の F、C1、Br、I、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、または  $C_1 \sim C_4$  アルキルで任意選択的に置換されたフェニルであり、

$R_k$  は、それぞれ、1 つまたは複数のハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N - エチル - N - メチルアミノ、モルホリノ、チオモルホリノ、ピペリジノ、またはピペラジノで任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、または  $C_2 \sim C_6$  アルキニルであり、

$R_n$  は、 $C_3 \sim C_6$  炭素環、フェニル環、または 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール環であり、フェニル環または 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール環は、1 つまたは複数の F、C1、Br、I、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $C_1 \sim C_4$  アルコキシ、 $-C(=O)NR_{a,c}R_{a,d}$ 、または  $C_1 \sim C_4$  アルキルで任意選択的に置換され、

$R_p$  は、H、 $NH_2$ 、 $-C(=O)NR_xR_x$ 、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、ピリジル、1, 3, 4 - オキサジアゾール、5 - メチル - 1, 3, 4 - オキサジアゾール、または 1 つまたは複数の F、C1、CN、ヒドロキシ、またはトリフルオロメチルで任意選択的に置換されたフェニルであり、ここで、 $R_p$  の任意の  $C_1 \sim C_4$  アルキルは、1 つまたは複数のヒドロキシ、シアノ、 $-C(=O)NR_xR_x$ 、または  $-NR_{a,r}R_{a,s}$  で任意選択的に置換され、

$R_w$  は、 $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、

各  $R_x$  は、独立して、H、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_3 \sim C_6$  炭素環、または  $C_1 \sim C_4$  アルキル -  $R_y$  であるか、 $NR_xR_x$  は、共に、ピペリジノ、モルホリノ、アゼチジノ、ピロリジノ、またはピペラジノ環を形成し、環は、1 つまたは複数の  $C_1 \sim C_4$  アルキルまたはハロで任意選択的に置換され、

各  $R_y$  は、独立して、シアノ、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4$  アルコキシ、フェニル、またはピリジルであり、ここで、各フェニルまたはピリジルは、1 つまたは複数のフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルキル -  $C(=O)$  - 、 $C_1 \sim C_4$  アルキル -  $S(O)_2$  - 、 $-C(=O)NR_aR_a$ 、または  $-C(=O)OR_a$  で任意選択的に置換され、

$R_z$  は、1 つまたは複数のフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルキル -  $C(=O)$  - 、 $C_1 \sim C_4$  アルキル -  $S(O)_2$  - 、 $-C(=O)$

N R<sub>a</sub> R<sub>a</sub>、または - C ( = O ) O R<sub>a</sub> で任意選択的に置換されたフェニルであり、各 R<sub>a\_c</sub> および R<sub>a\_d</sub> は、独立して、H または C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルであり、各 R<sub>a\_e</sub> および R<sub>a\_f</sub> は、独立して、H または C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルであり、各 R<sub>a\_r</sub> および R<sub>a\_s</sub> は、独立して、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、または C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルカノイルである) の化合物またはその薬学的に許容可能な塩もしくはプロドラッグ。

【請求項 7 8】

前記 R<sub>d</sub> が 4 - フルオロベンジルである、請求項 7 7 に記載の化合物。

【請求項 7 9】

前記 R<sub>p</sub> が、4 - フルオロフェニル、3, 5 - ジフルオロフェニル、4 - クロロフェニル、H、2 - (N, N - ジメチルアミノカルボニル) エチル、4 - シアノフェニル、N - ピリド - 2 - イルメチルアミノカルボニル、N, N - ジメチルアミノカルボニルメチル、N - メチルアミノカルボニル、N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) アミノカルボニル、N - メチル - N - (メトキシメチル) アミノカルボニル、2, 6 - ジフルオロフェニル、N - メチル - N - (2 - ヒドロキシエチル) アミノカルボニル、2 - ヒドロキシ - 2 - メチルエチル、N - (2 - ヒドロキシエチル) アミノカルボニル、N - (2 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル) アミノカルボニル、2 - ヒドロキシエチル、N - メチルアミノカルボニルメチル、4 - ピリジル、3 - ピリジル、または 4 - ヒドロキシフェニルである、請求項 7 8 に記載の化合物。

【請求項 8 0】

前記 R<sub>p</sub> が、2 - (N, N - ジメチルアミノカルボニル) エチル、4 - シアノフェニル、N - ピリド - 2 - イルメチルアミノカルボニル、N, N - ジメチルアミノカルボニルメチル、N - メチルアミノカルボニル、N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) アミノカルボニル、N - メチル - N - (メトキシメチル) アミノカルボニル、N - メチル - N - (2 - ヒドロキシエチル) アミノカルボニル、2 - ヒドロキシ - 2 - メチルエチル、N - (2 - ヒドロキシエチル) アミノカルボニル、N - (2 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル) アミノカルボニル、2 - ヒドロキシエチル、または N - メチルアミノカルボニルメチルである、請求項 7 9 に記載の化合物。

【請求項 8 1】

前記 R<sub>p</sub> が、4 - フルオロフェニル、3, 5 - ジフルオロフェニル、4 - クロロフェニル、H、4 - シアノフェニル、2, 6 - ジフルオロフェニル、4 - ピリジル、3 - ピリジル、または 4 - ヒドロキシフェニルである、請求項 8 0 に記載の化合物。

【請求項 8 2】

前記 R<sub>c</sub> が、3 - クロロ - 4, 6 - ジフルオロベンジル、4 - フルオロベンジル、3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル、4 - フルオロ - 2 - (N, N - ジメチルアミノカルボニル) ベンジル、または 4 - フルオロ - 2 - (N - メチルアミノカルボニル) ベンジルである、請求項 8 1 に記載の化合物。

【請求項 8 3】

本明細書中に記載の化合物

【化 2 4】

209, 211, 212, 213, 214, 217, 218, 219, 220, 222, 223, 224, 225, 226, 227,  
235, 236, 237, 238, 239, 240, 242, 243, 244, 245, 246, 247, 250, 251, 277, 280, 282, 284,  
286, 287, 289, 291, 292, 294, 296, 298, 301, 303, 305, 307, 309, 311, 313, 314, 316, 320,  
326, 328, 330, 332, 336, 461, 339, 344, 351, 353, 354, 359, 361, 363, 369, 370, 372, 374,  
376, 378, 380, 382, 386, 390, 392, 394, 398, 400, 403, 404, 408, 421, 423, 429, 432, 433,  
436, 440, 442, 446, 451, 452, 453, 455もしくは 456

、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 8 4】

請求項 1、請求項 2 4、または請求項 5 6 に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩

と、薬学的に許容可能な賦形剤、希釈剤、またはキャリアとを含む、薬学的組成物。

【請求項 8 5】

AIDS治療薬、抗感染症薬、免疫調節薬、追加免疫薬、またはその混合物をさらに含む、請求項 8 4 に記載の薬学的組成物。

【請求項 8 6】

前記 AIDS 治療薬が、HIV-プロテアーゼ阻害剤、ヌクレオシド逆転写酵素阻害剤、非ヌクレオシド逆転写酵素阻害剤、またはその混合物である、請求項 8 5 に記載の薬学的組成物。

【請求項 8 7】

経口投薬形態である、請求項 8 4 に記載の薬学的組成物。

【請求項 8 8】

HIVウイルスの増殖を治療するか、AIDSを治療するか、AIDSまたはARC症候群の発症を遅延させるための組成物であって、請求項 1、請求項 2 4、または請求項 5 6 に記載の化合物の治療有効量を含む、組成物。

【請求項 8 9】

HIVインテグラーーゼを阻害するための組成物であって、請求項 1、請求項 2 4、または請求項 5 6 に記載の化合物の治療有効量を含む、組成物。

【請求項 9 0】

追加免疫薬、治療有効量のAIDS治療薬、治療有効量の抗感染症薬、治療有効量の免疫調節薬、またはその混合物と組み合わせて、必要とする哺乳動物に投与されるものであることを特徴とする、請求項 8 8 または 8 9 に記載の組成物。

【請求項 9 1】

インテグラーーゼ阻害が役割を果たす障害、症状、および疾患を治療するためのキットであって、2つまたはそれを超える個別の容器を1つの包装に含み、少なくとも1つの請求項 1、請求項 2 4、または請求項 5 6 に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩が、1つまたは複数の以下：薬学的に許容可能なキャリア、追加免疫薬、治療有効量のAIDS治療薬、治療有効量の抗感染症薬、または治療有効量の免疫調節薬と組み合わせて収められている、キット。

【請求項 9 2】

療法で用いるための、請求項 1、請求項 2 4、または請求項 5 6 に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩。

【請求項 9 3】

HIVの治療薬の製造における請求項 1、請求項 2 4、または請求項 5 6 に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩の使用。

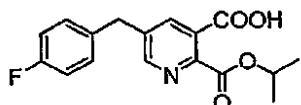
【請求項 9 4】

本明細書中に記載の化合物、薬学的に許容可能な塩、または薬学的組成物。

【請求項 9 5】

化合物 9 8 :

【化 2 5】



の調製方法であって、化合物 9 7 :



コキシ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N-エチル-N-メチルアミノ、モルホリノ、チオモルホリノ、ピペリジノ、-C(=O)NR<sub>a</sub>aR<sub>a</sub>b、-N(R<sub>a</sub>a)SO<sub>2</sub>R<sub>a</sub>b、-SO<sub>2</sub>R<sub>a</sub>b、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルカノイル、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>炭素環、ピロリジノ、2-オキソピロリジノ、またはピペラジノで任意選択的に置換された-SO<sub>2</sub>R<sub>r</sub>、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニルであり、

R<sub>m</sub>は、1つまたは複数のF、C1、Br、I、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルで任意選択的に置換されたフェニルであり、そして、

R<sub>n</sub>は、1つまたは複数のF、C1、Br、I、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルで任意選択的に置換された5員または6員のヘテロアリール環であるか、R<sub>n</sub>は、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、R<sub>f</sub>SO<sub>2</sub>NH-、またはR<sub>f</sub>C(=O)NH-から選択される少なくとも1つの基で置換されたか、1つまたは複数のF、C1、Br、I、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルで任意選択的に置換されたフェニル環であるか、R<sub>n</sub>は、C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>炭素環であり、そして

各R<sub>a</sub>aおよびR<sub>a</sub>bは、独立して、HまたはC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルである)の化合物またはその薬学的に許容可能な塩もしくはプロドラッグ。

(項目2)

上記R<sub>k</sub>が、それぞれ、1つまたは複数のハロ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N-エチル-N-メチルアミノ、モルホリノ、チオモルホリノ、ピペリジノ、またはピペラジノで任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アルキニルである、項目1に記載の化合物。

(項目3)

上記A<sup>2</sup>がCHであり、上記A<sup>3</sup>がNである、項目1に記載の化合物。

(項目4)

上記R<sub>a</sub>がメチルである、項目1に記載の化合物。

(項目5)

上記R<sub>b</sub>がメチルである、項目1に記載の化合物。

(項目6)

上記R<sub>c</sub>がHである、項目1に記載の化合物。

(項目7)

上記R<sub>c</sub>がR<sub>k</sub>である、項目1に記載の化合物。

(項目8)

-M-R<sub>m</sub>である、項目1に記載の化合物。

(項目9)

-Q-R<sub>n</sub>である、項目1に記載の化合物。

(項目10)

上記R<sub>d</sub>がHである、項目1に記載の化合物。

(項目11)

上記R<sub>d</sub>がR<sub>j</sub>で置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルである、項目1に記載の化合物。

(項目12)

上記R<sub>e</sub>がHである、項目1に記載の化合物。

(項目13)

上記R<sub>e</sub>が、R<sub>j</sub>で置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルである、項目1に記載の化合物。

(項目14)

上記Mが分枝C<sub>2</sub>アルキレンである、項目1に記載の化合物。

(項目15)

上記Qが-C(H<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-である、項目1に記載の化合物。

(項目16)

各R<sub>j</sub>が4-フルオロフェニルである、項目1に記載の化合物。

(項目17)

上記R<sub>k</sub>が、プロピル、2-プロピニル、2-ブチニル、メチル、2-メトキシエチル、2-ヒドロキシエチル、エチル、2-モルホリノエチル、3-ヒドロキシ-3-メチルブチル、2-フルオロエチル、または2-(N,N-ジメチルアミノ)エチルである、項目1に記載の化合物。

(項目18)

上記R<sub>k</sub>が、N-メチルアミノ-カルボニルメチル、N,N-ジメチルアミノカルボニルメチル、2-[N-(メチルスルホニル)-N-メチルアミノ]エチル、シクロプロピルメチル、2-(2-オキソピロリドノ)エチル、2-(メチルスルホニル)エチル、メチルスルホニル、またはアセチルメチルである、項目1に記載の化合物。

(項目19)

上記R<sub>m</sub>が4-フルオロフェニルである、項目1に記載の化合物。

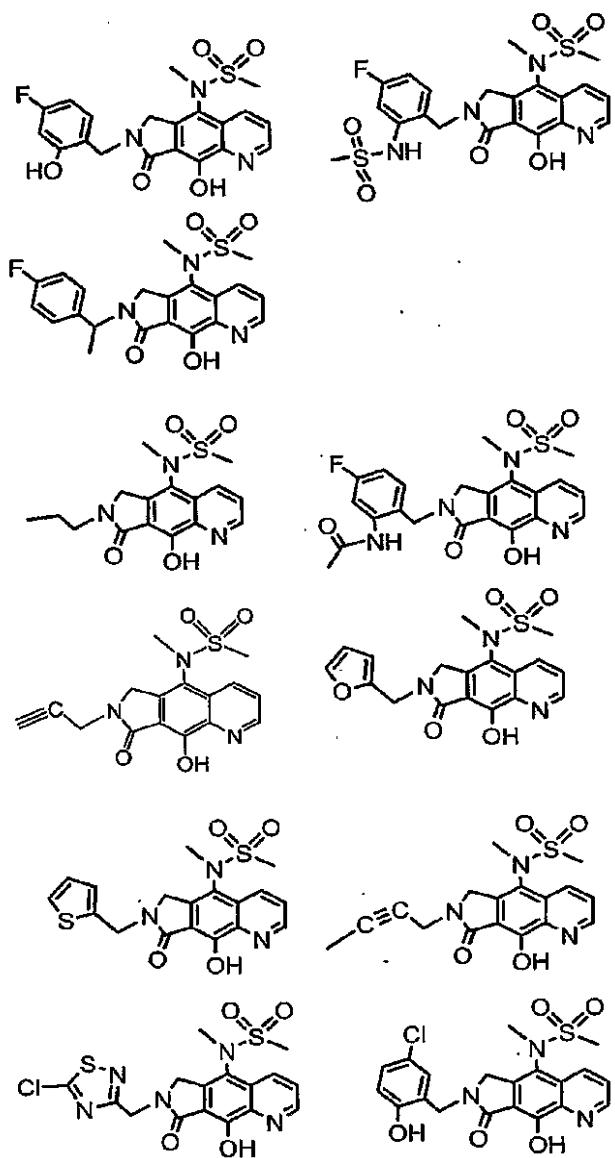
(項目20)

上記R<sub>n</sub>が、4-フルオロ-2-ヒドロキシフェニル、4-フルオロ-2-メチルスルホニルアミノフェニル、4-フルオロ-2-アシルアミノフェニル、2-フリル、2-チエニル、5-クロロ-[1,2,4]チアジアゾール-2-イル、5-クロロ-2-ヒドロキシフェニル、3-メチルイソオキサゾール-5-イル、4-フルオロ-3-トリフルオロメチルフェニル、5-トリフルオロメチルフル-2-イル、4-ヒドロキシフェニル、4-ピリジル(N-オキシド)、または3-クロロ-2-ヒドロキシフェニルである、項目1に記載の化合物。

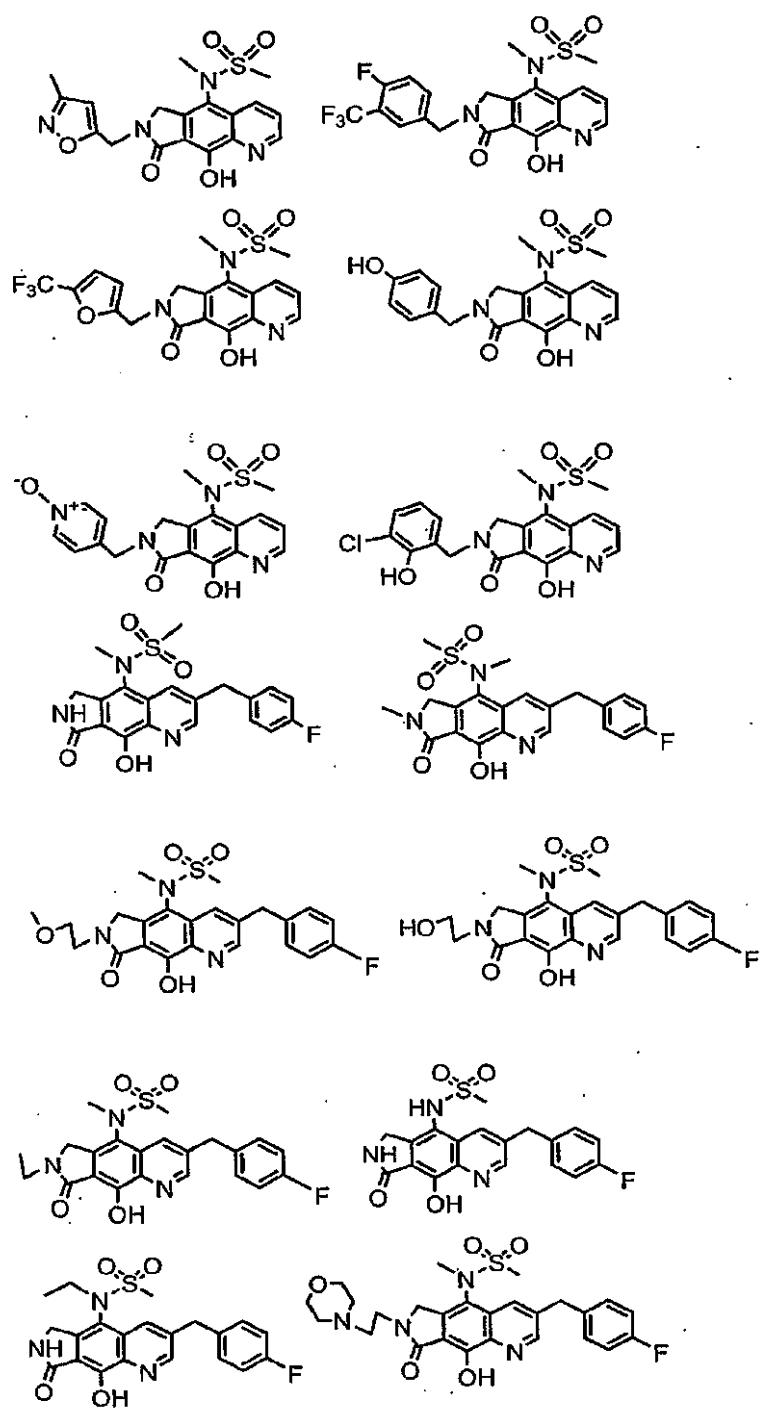
(項目21)

以下の式：

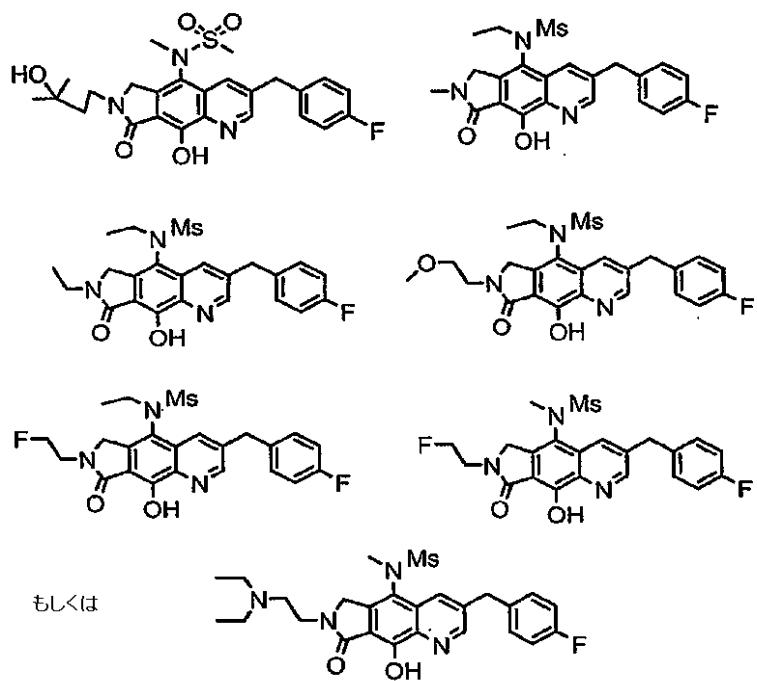
【化 2】



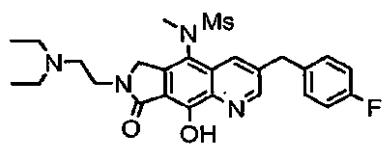
【化 3】



【化4】



もしくは

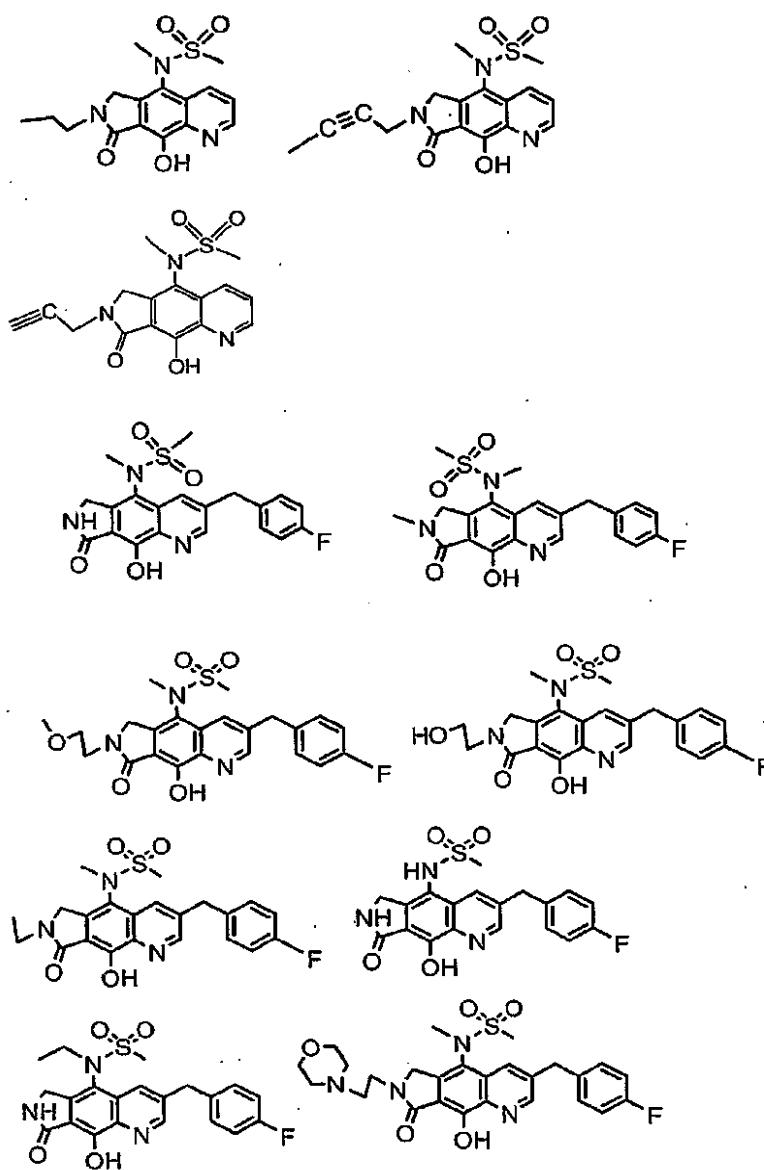


を有する、項目1に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

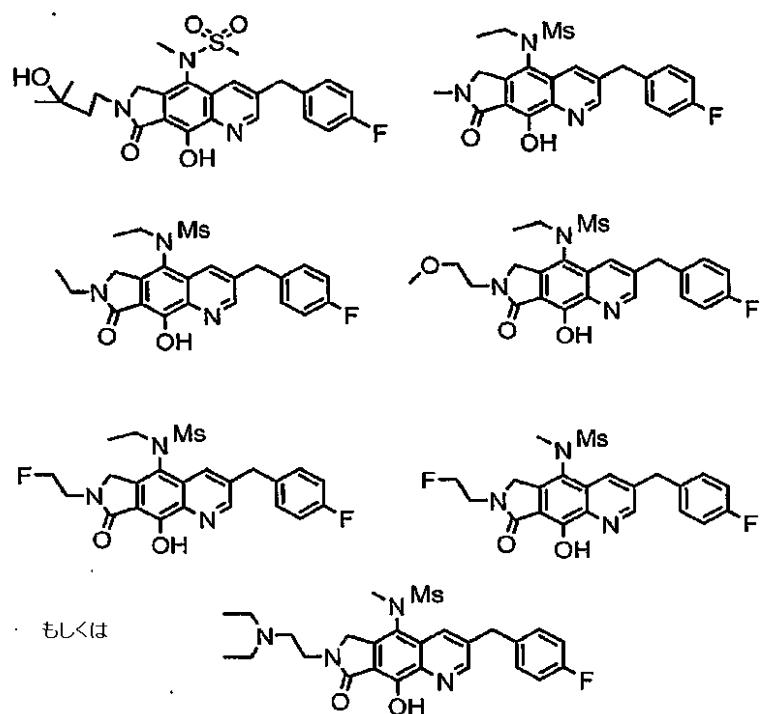
(項目22)

以下の式:

【化 5】



【化6】

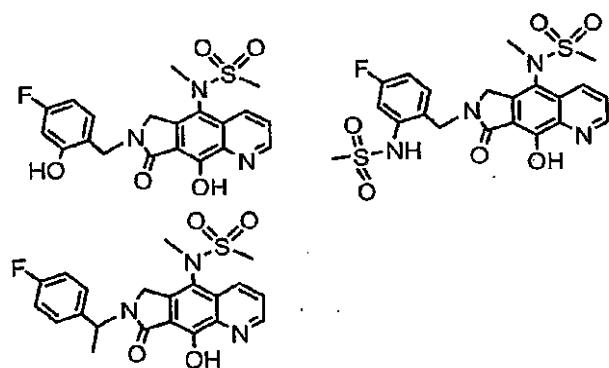


を有する、項目1に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

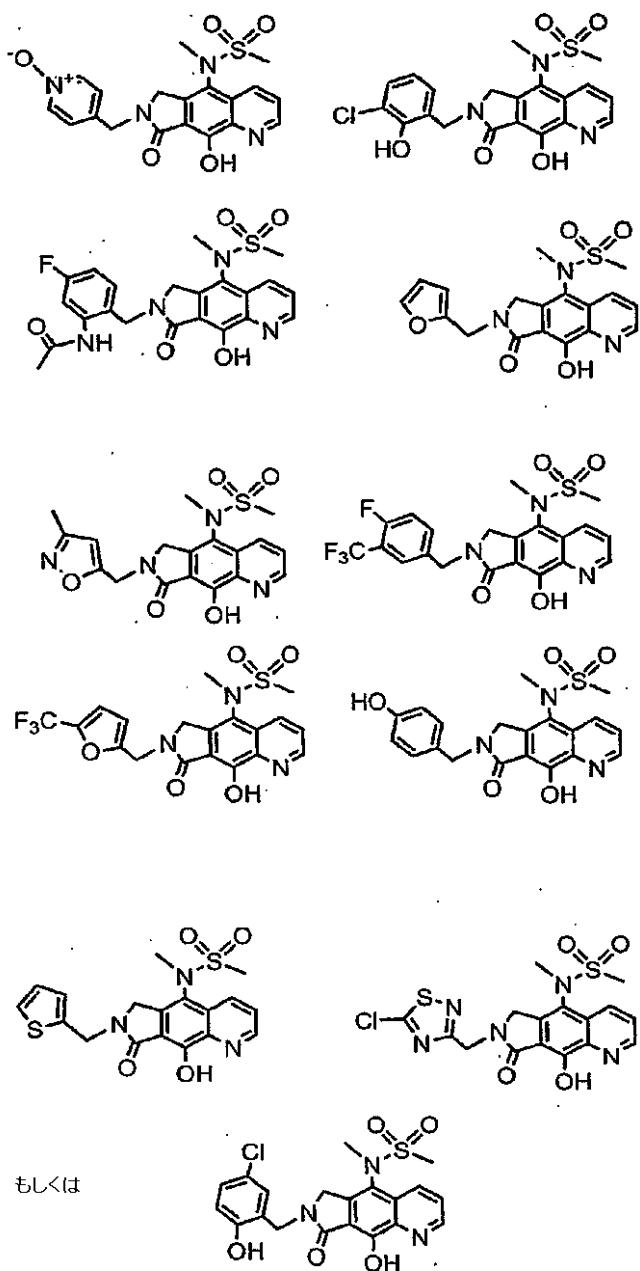
(項目23)

以下の式：

【化7】



【化 8】



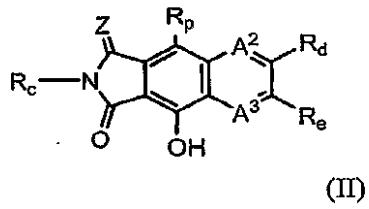
を有する、項目 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

---

( 項目 2 4 )

### 式 ( I I ) :

【化 9】



(式中、

A<sup>2</sup> および A<sup>3</sup> は、それぞれ独立して、N または CR<sub>a</sub> であり、

各 R<sub>a</sub> は、独立して、H または C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、

R<sub>c</sub> は、H、R<sub>k</sub>、または -Q-R<sub>n</sub> であり、

R<sub>d</sub> は、H、ハロ、または R<sub>j</sub> で任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、

R<sub>e</sub> は、H、ハロ、または R<sub>j</sub> で任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、

Q は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキレンであり、

Z は、O または 2 つの水素であり、

各 R<sub>j</sub> は、1 つまたは複数の F、C<sub>1</sub>、Br、I、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、または C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルで任意選択的に置換されたフェニルであり、

R<sub>k</sub> は、それぞれ、1 つまたは複数のハロ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N-エチル-N-メチルアミノ、モルホリノ、チオモルホリノ、ピペリジノ、またはピペラジノで任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニルであり、

R<sub>n</sub> は、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> 炭素環、フェニル環、または 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール環であり、フェニル環または 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール環は、1 つまたは複数の F、C<sub>1</sub>、Br、I、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、または C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルで任意選択的に置換され、

R<sub>p</sub> は、OH、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルカノイル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルコキシ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル、-C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>x</sub>、-C(=N)R<sub>a</sub>R<sub>a</sub>、NH<sub>2</sub>、-N(R<sub>a</sub>)-C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>x</sub>、4,5-ジヒドロ-4,4-ジメチルオキサゾール、または -N(R<sub>s</sub>)-S(O)<sub>2</sub>-R<sub>t</sub> であり、ここで、R<sub>p</sub> の各 C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルは、-C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>x</sub>、N(R<sub>a</sub>g)-C(=O)-R<sub>a</sub>h、または -N(R<sub>a</sub>g)-S(O)<sub>2</sub>-R<sub>a</sub>h で置換され、ここで、R<sub>p</sub> の各 C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルコキシ、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、および C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニルは、フェニル、ヒドロキシ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> 炭素環、または -C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>x</sub> で任意選択的に置換され、

R<sub>s</sub> は -S(O)<sub>2</sub>-R<sub>w</sub> であり、且つ R<sub>t</sub> は、R<sub>v</sub> で任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであるか、R<sub>s</sub> は、R<sub>u</sub> で置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、且つ R<sub>t</sub> は、R<sub>v</sub> で任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであるか、R<sub>s</sub> は、R<sub>u</sub> で任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、且つ R<sub>t</sub> は、R<sub>v</sub>、NR<sub>x</sub>R<sub>x</sub>、または R<sub>v</sub> で置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、

各 R<sub>v</sub> は、フルオロ、クロロ、フェニル、ピリジル、1,4-ジアゼパニル、またはピペラジノであり、ここで、各フェニル、ピリジル、1,4-ジアゼパニル、およびピペラジノは、1 つまたは複数のフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル-C(=O)-、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル-S(O)<sub>2</sub>-、-C(=O)NR<sub>a</sub>R<sub>a</sub>、または -C(=O)OR<sub>a</sub> で任意選択的に置換され、

各 R<sub>u</sub> は、独立して、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N-エチル-N-メチルアミノ、または C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> 炭素環、ピロリジノ、モルホリノ、チオモルホリノ、ピペリジノ、およびピペラジノから選択される環であり、環は、1 つまたは複数の C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルで任意選択的に置換され、

R<sub>w</sub> は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、

各 R<sub>x</sub> は、独立して、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> 炭素環、または C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル-R<sub>y</sub> であるか、NR<sub>x</sub>R<sub>x</sub> は、共に、ピペリジノ、モルホリノ、アゼチジノ、ピロリジノ、またはピペラジノ環を形成し、環は、1 つまたは複数の C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルまたはハロで任意選択的に置換され、

各 R<sub>y</sub> は、独立して、シアノ、フェニル、またはピリジルであり、ここで、各フェニルまたはピリジルは、1 つまたは複数のフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル-C(=O)-、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル-S(O)<sub>2</sub>-、-C(=O)NR<sub>a</sub>R<sub>a</sub>、または -C(=O)OR<sub>a</sub> で任意選択的に置換され、

R<sub>z</sub> は、1つまたは複数のフルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル-C(=O)-、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル-S(O)<sub>2</sub>-、-C(=O)NR<sub>a</sub>、または-C(=O)OR<sub>a</sub>で任意選択的に置換されたフェニルであり、各R<sub>a<sub>g</sub></sub>およびR<sub>a<sub>h</sub></sub>は、独立して、HまたはC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルであり、各R<sub>a<sub>k</sub></sub>は、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルコキシ、またはNR<sub>a<sub>m</sub></sub>R<sub>a<sub>n</sub></sub>であり、各R<sub>a<sub>h</sub></sub>は、独立して、HまたはC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルであり、各R<sub>a<sub>m</sub></sub>およびR<sub>a<sub>n</sub></sub>は、独立して、HまたはC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルである)の化合物またはその薬学的に許容可能な塩もしくはプロドラッグ。

(項目25)

上記R<sub>p</sub>が、OH、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルコキシ、NH<sub>2</sub>、N(R<sub>a</sub>)-C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>x</sub>、または-N(R<sub>s</sub>)-S(O)<sub>2</sub>-R<sub>t</sub>であり、

各R<sub>x</sub>は、独立して、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル、またはC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル-R<sub>y</sub>であるか、NR<sub>x</sub>R<sub>x</sub>は、共に、ピペリジノまたはピペラジノ環を形成し、環は、1つまたは複数のC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルで任意選択的に置換され、

各R<sub>y</sub>は、独立して、フェニルまたはピリジルであり、ここで、各フェニルまたはピリジルは、1つまたは複数のフルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル-C(=O)-、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル-S(O)<sub>2</sub>-、-C(=O)NR<sub>a</sub>R<sub>a</sub>、または-C(=O)OR<sub>a</sub>で任意選択的に置換される、項目24に記載の化合物。

(項目26)

上記A<sup>2</sup>がCHであり、上記A<sup>3</sup>がNである、項目24に記載の化合物。

(項目27)

上記A<sup>2</sup>がNであり、上記A<sup>3</sup>がCHである、項目24に記載の化合物。

(項目28)

上記R<sub>c</sub>がHである、項目24に記載の化合物。

(項目29)

上記R<sub>c</sub>がR<sub>k</sub>である、項目24に記載の化合物。

(項目30)

上記R<sub>c</sub>が-Q-R<sub>n</sub>である、項目24に記載の化合物。

(項目31)

上記R<sub>d</sub>がHである、項目24に記載の化合物。

(項目32)

上記R<sub>d</sub>がR<sub>j</sub>で置換されたC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルである、項目24に記載の化合物。

(項目33)

上記R<sub>e</sub>がHである、項目24に記載の化合物。

(項目34)

上記R<sub>e</sub>が、R<sub>j</sub>で置換されたC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキルである、項目24に記載の化合物。

(項目35)

上記Qが-CH<sub>2</sub>-である、項目24に記載の化合物。

(項目36)

各R<sub>j</sub>が4-フルオロフェニルである、項目24に記載の化合物。

(項目37)

上記R<sub>k</sub>が、エチル、2-モルホリノエチル、2-メトキシエチル、メチル、2-ヒドロキシエチル、または3-ヒドロキシ-3-メチルブチルである、項目24に記載の化合物。

(項目38)

上記Qが-CH<sub>2</sub>-であり、上記R<sub>n</sub>が4-フルオロフェニルである、項目24に記載の化合物。

(項目39)

上記R<sub>p</sub>がOHである、項目24に記載の化合物。

## (項目40)

上記  $R_p$  が  $C_1 \sim C_4$  アルコキシである、項目24に記載の化合物。

## (項目41)

上記  $R_p$  が  $N(R_a) - C(=O)NR_xR_x$  である、項目24に記載の化合物。

## (項目42)

上記  $R_p$  が  $-N(R_s) - S(O)_2 - R_t$  である、項目24に記載の化合物。

## (項目43)

上記  $R_s$  が  $-S(O)_2 - R_w$  であり、上記  $R_t$  が  $R_v$  で任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルである、項目42に記載の化合物。

## (項目44)

上記  $R_s$  が  $R_u$  で置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、上記  $R_t$  が  $R_v$  で任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルである、項目42に記載の化合物。

## (項目45)

上記  $R_s$  が  $R_u$  で任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、上記  $R_t$  が  $NR_xR_x$  または  $R_v$  で置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルである、項目42に記載の化合物。

## (項目46)

上記  $R_s$  が  $-S(O)_2 - CH_3$  または  $-S(O)_2 - CH_2CH_3$  であり、上記  $R_t$  がメチルまたはエチルである、項目42に記載の化合物。

## (項目47)

上記  $R_s$  が、シクロプロピルメチル、2-(2,5-ジメチルピロリジノ)エチル、または2-モルホリノエチルである、項目42に記載の化合物。

## (項目48)

上記  $R_t$  が、2-クロロエチル、ベンジル、ピリド-4-イルメチル、4-メチルフェニル、4-クロロフェニル、2-(4-エチルピペラジン-1-イル)エチル、2-(4-エチルスルホニルピペラジン-1-イル)エチル、2-(4-アシルピペラジン-1-イル)エチル、2-(4-イソプロピルピペラジン-1-イル)エチル、N-(4-フルオロ-2-メチルアミノカルボニルベンジル)-N-メチルアミノ、N-(4-フルオロ-2-メトキシカルボニルベンジル)アミノ、N-(4-フルオロ-2-カルボキシベンジル)-N-メチルアミノ、およびN,N-ジエチルアミノである、項目44に記載の化合物。

## (項目49)

上記  $R_p$  が  $N$ -メチル- $N$ -(4-メチルピペラジン-1-イルカルボニル)アミノである、項目24に記載の化合物。

## (項目50)

上記  $R_p$  がメトキシである、項目24に記載の化合物。

## (項目51)

上記  $R_p$  が、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルカノイル、 $C_1 \sim C_4$  アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_2 \sim C_6$  アルキニル、 $-C(=O)NR_xR_x$ 、 $-C(=N)R_{a_k}R_{a_m}$ 、または4,5-ジヒドロ-4,4-ジメチルオキサゾールであり、ここで、 $R_p$  の各  $C_1 \sim C_4$  アルキルは  $-C(=O)NR_xR_x$ 、 $-N(R_{a_g}) - C(=O) - R_{a_h}$ 、または  $-N(R_{a_g}) - S(O)_2 - R_{a_h}$  で置換され、ここで、 $R_p$  の各  $C_1 \sim C_4$  アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、および  $C_2 \sim C_6$  アルキニルは、フェニル、ヒドロキシ、 $C_3 \sim C_6$  炭素環、または  $-C(=O)NR_xR_x$  で任意選択的に置換される、項目24に記載の化合物。

## (項目52)

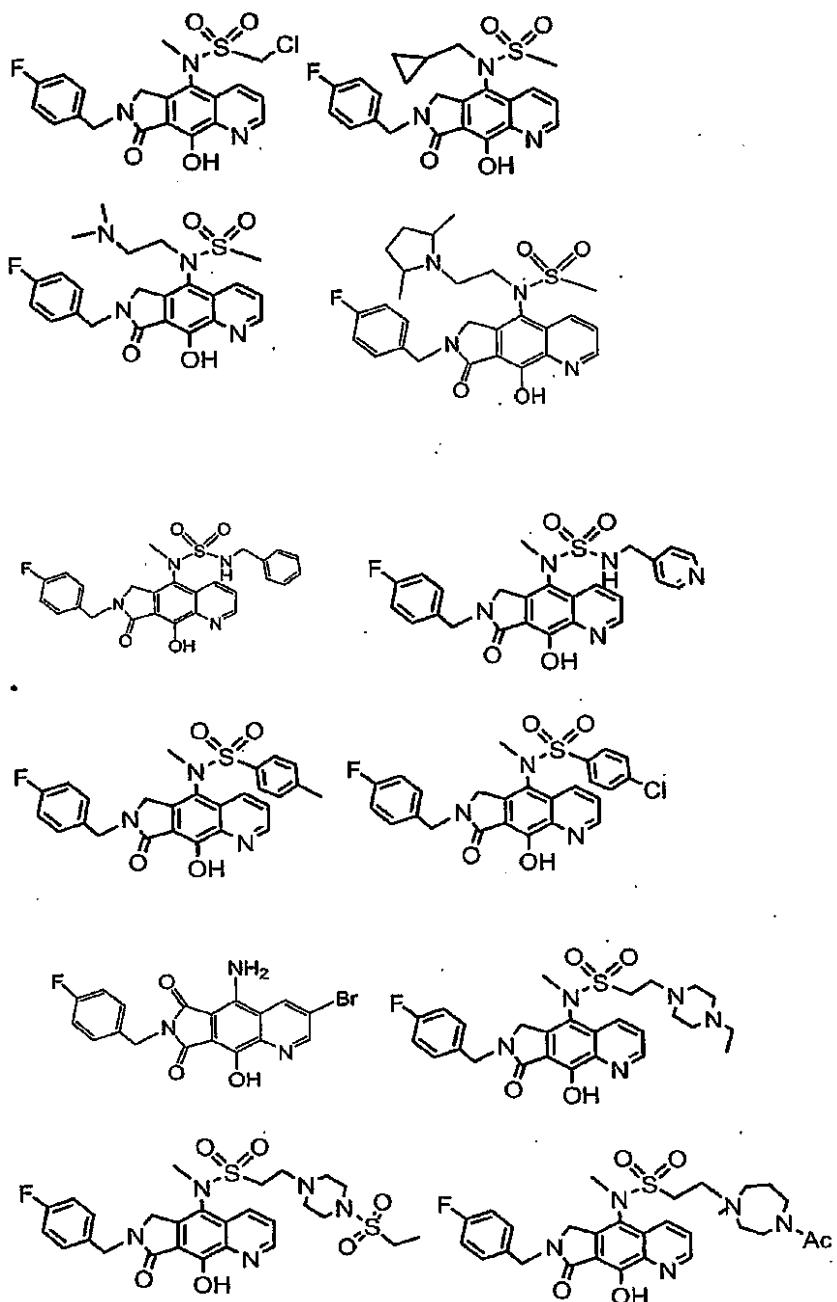
上記  $R_p$  が、2-( $N,N$ -ジメチルアミノカルボニル)-2-メチルエトキシ、アリル、ペリジノカルボニル、4,4-ジフルオロピペリジノカルボニル、 $N$ -シクロプロピル- $N$ -(2-シアノエチル)アミノカルボニル、2-[ $N$ -メチル- $N$ -(メチルスルホニル)アミノ]エチル、 $N,N$ -ジメチルアミノカルボニルメチル、 $N$ -メチルアミノカルボニル、 $N$ -(2,2,2-トリフルオロエチル)アミノカルボニル、アセチル、

ピペリジノカルボニルメチル、モルホリノカルボニルメチル、2-シクロプロピルエチニル、アゼチジノカルボニル、4-フルオロピペリジノカルボニル、ピロリジノカルボニル、3,3-ジフルオロピロリジノカルボニル、エチニル、1-ヒドロキシミノエチル、2-フェニルエチニル、4,5-ジヒドロ-4,4-ジメチルオキサゾール、4-メチルピペラジン-1-イル、1-[N-(N',N'-ジメチルアミノ)イミノ]エチル、2-[N-(N'-メチルアミノ)イミノ]エチル、3-ヒドロキシ-3-メチルブチニル、1-メチルビニル、または1-(N-メトキシイミノ)エチルである、項目24に記載の化合物。

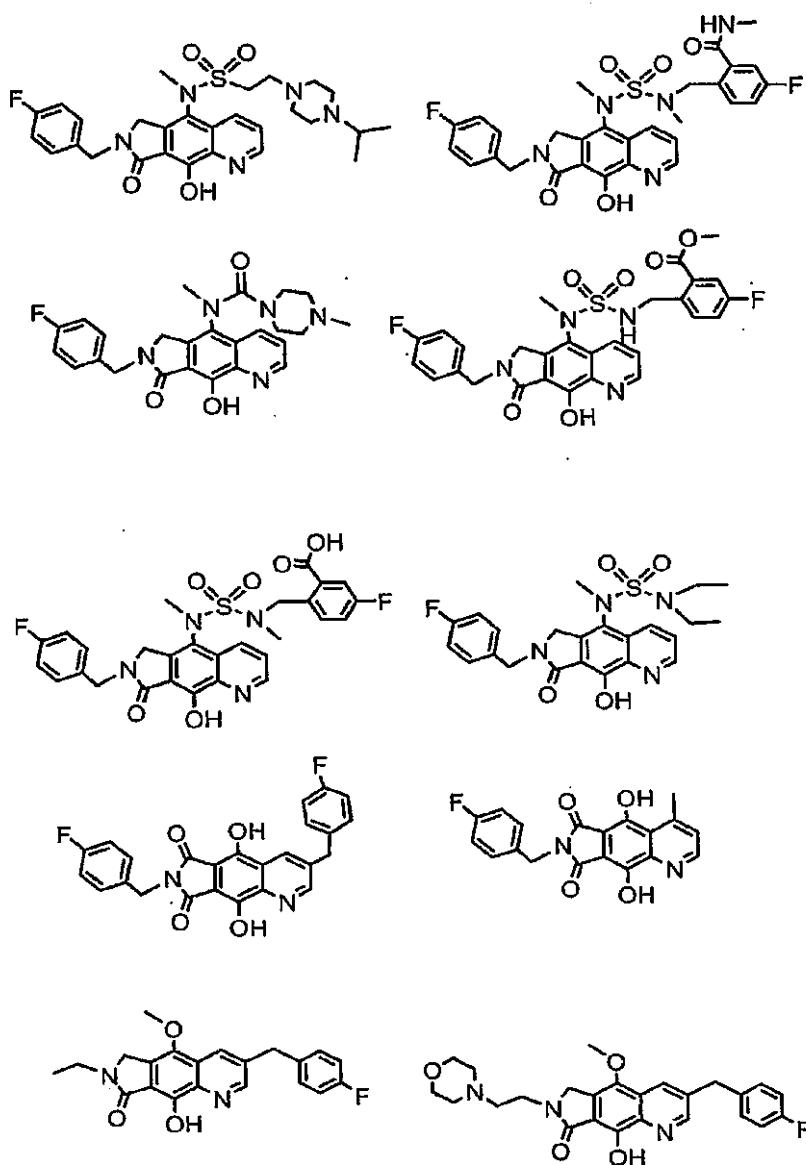
(項目53)

以下の式：

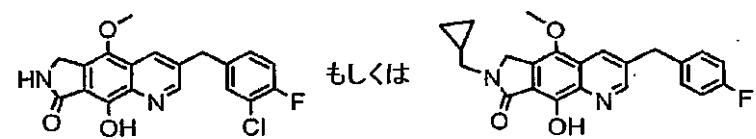
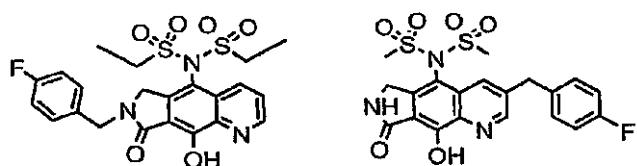
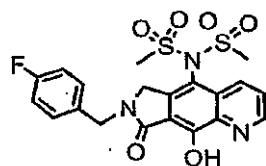
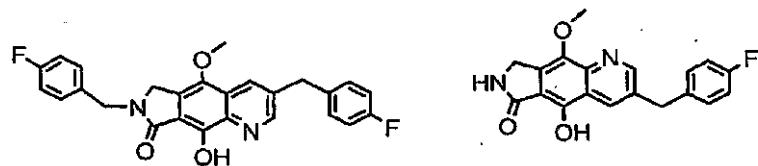
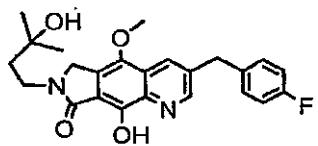
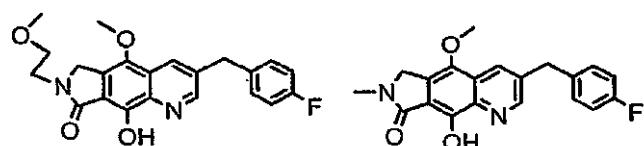
【化10】



【化 11】



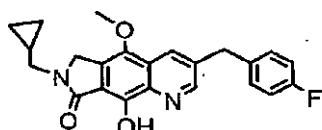
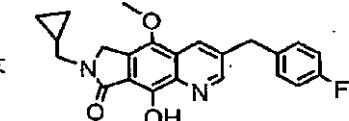
【化12】



を有する、項目24に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

(項目54)

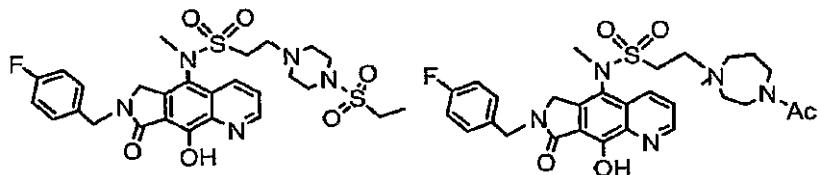
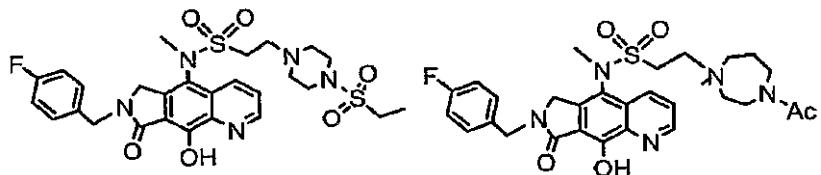
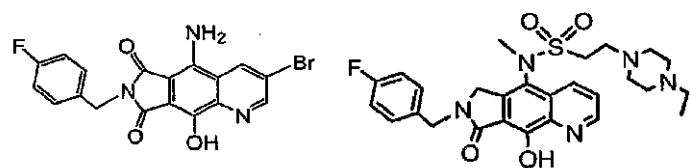
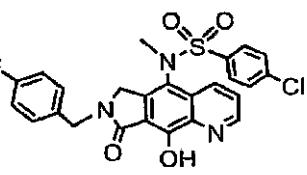
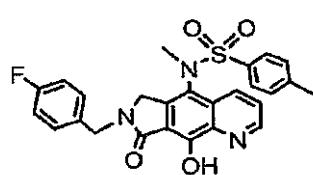
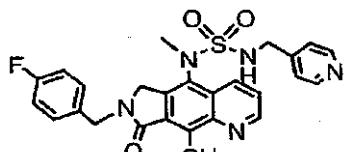
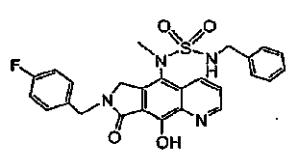
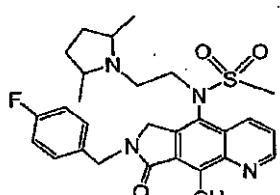
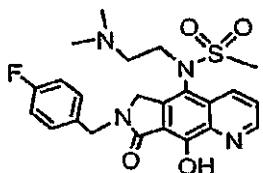
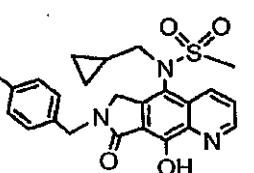
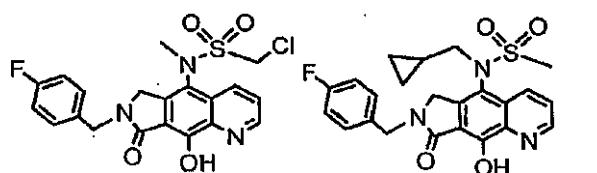
以下の式：



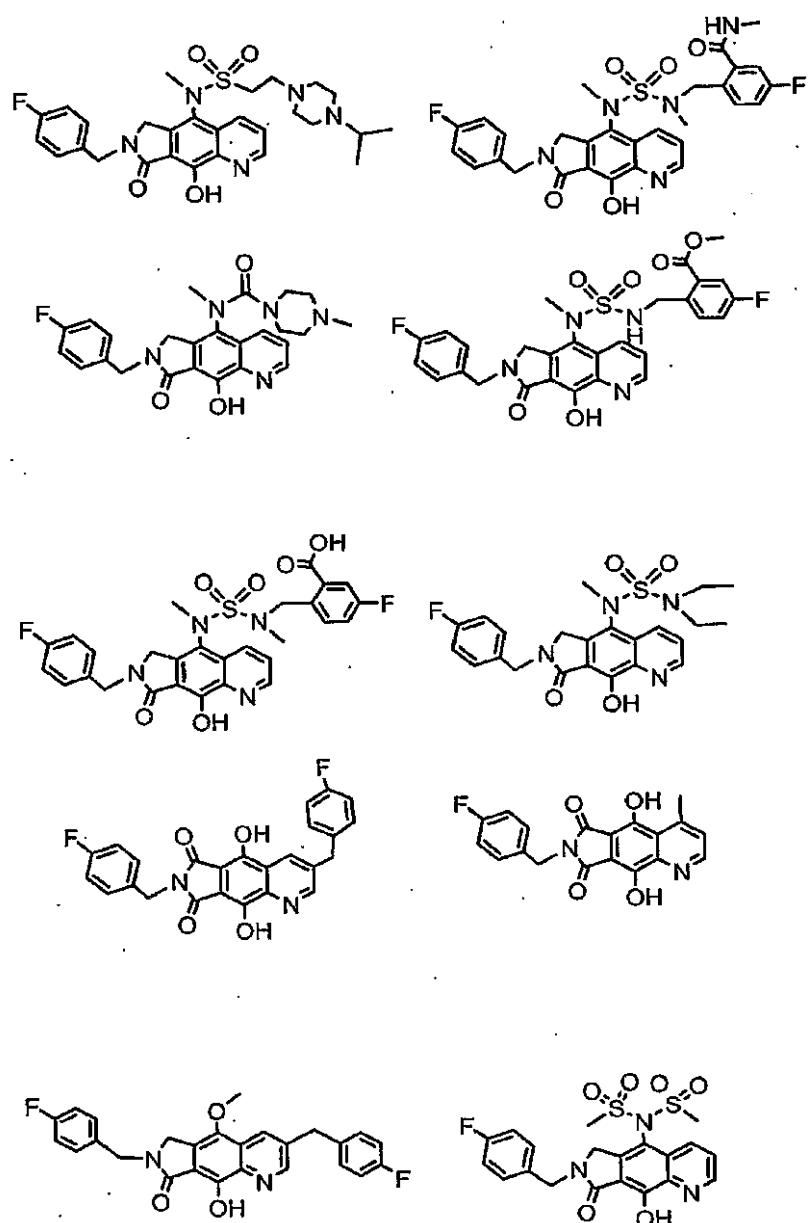
もしくは



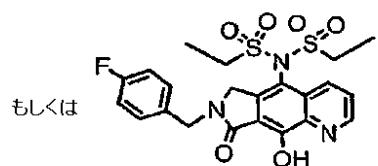
【化 1 3】



## 【化14】



## 【化15】

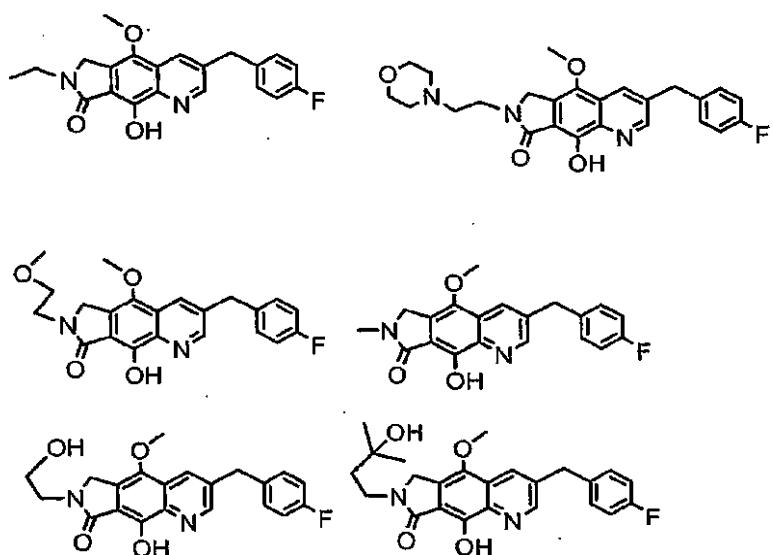


を有する、項目24に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

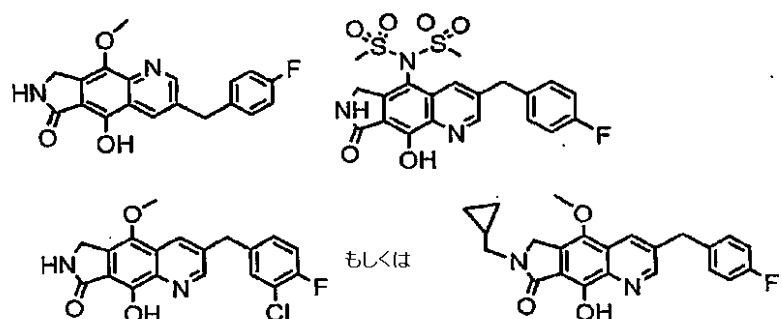
(項目55)

以下の式：

## 【化16】



## 【化17】

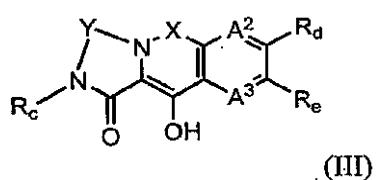


を有する、項目24に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

(項目56)

式(III)：

## 【化18】



(式中、

A<sup>2</sup> および A<sup>3</sup> は、それぞれ独立して、N または C R<sub>g</sub> であり、ここで、各 R<sub>g</sub> は、独立して、H またはアルキルであり、

R<sub>c</sub> は、H、R<sub>k</sub>、または -L-A<sub>r</sub> であり、

R<sub>d</sub> は、H、ハロ、または R<sub>j</sub> で任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、

R<sub>e</sub> は、H、ハロ、または R<sub>j</sub> で任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、

L は C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキレンであり、

R<sub>k</sub> は、それぞれ、1つまたは複数のハロ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N-エチル-N-メチルアミノ、モルホリノ、チオモルホ

リノ、ピペリジノ、またはピペラジノで任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、またはC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルであり、

Xは-C(=O)-または-S(O)<sub>2</sub>-であり、

Yは-CH<sub>2</sub>-または-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-であり、

Arは、C<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>炭素環、置換C<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>炭素環、C<sub>6</sub>～C<sub>20</sub>アリール、置換C<sub>6</sub>～C<sub>20</sub>アリール、C<sub>6</sub>～C<sub>20</sub>ヘテロアリール、置換C<sub>6</sub>～C<sub>20</sub>ヘテロアリールであり、

各R<sub>j</sub>は、1つまたは複数のF、Cl、Br、I、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルで任意選択的に置換されたフェニルである)の化合物またはその薬学的に許容可能な塩もしくはプロドラッグ。

(項目57)

上記A<sup>2</sup>がCHであり、上記A<sup>3</sup>がNである、項目56に記載の化合物。

(項目58)

上記R<sub>c</sub>が4-フルオロベンジルまたはメチルである、項目56に記載の化合物。

(項目59)

上記Xが-C(=O)-である、項目56に記載の化合物。

(項目60)

上記Xが-S(O)<sub>2</sub>-である、項目56に記載の化合物。

(項目61)

上記Yが-CH<sub>2</sub>-である、項目56に記載の化合物。

(項目62)

上記Yが-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-である、項目56に記載の化合物。

(項目63)

上記R<sub>d</sub>がHである、項目56に記載の化合物。

(項目64)

上記R<sub>d</sub>がR<sub>j</sub>で置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルである、項目56に記載の化合物。

(項目65)

上記R<sub>e</sub>がHである、項目56に記載の化合物。

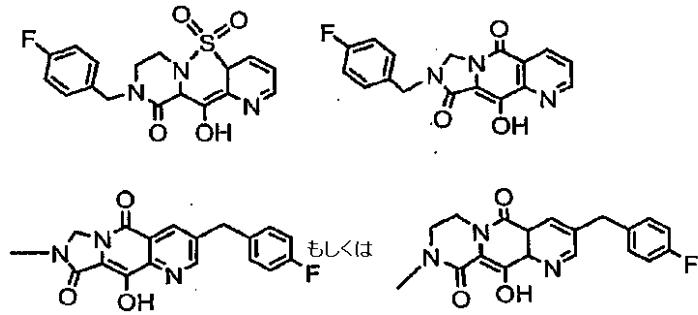
(項目66)

上記R<sub>e</sub>が、R<sub>j</sub>で置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルである、項目56に記載の化合物。

(項目67)

以下の式:

【化19】



を有する、項目56に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

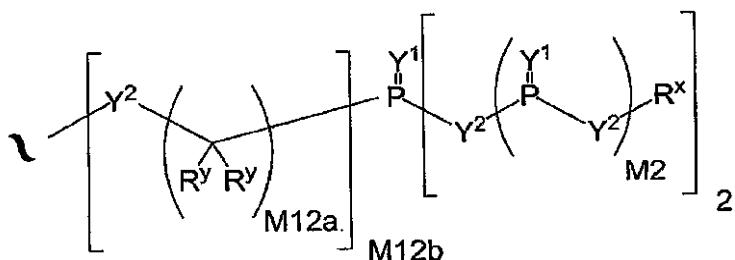
(項目68)

項目1、項目24、または項目56に記載の化合物のプロドラッグまたはその薬学的に許容可能な塩。

(項目69)

少なくとも1つの水素原子はA<sup>5</sup>基で置換され、ここで、各A<sup>5</sup>は、独立して、

【化20】



であり、

Y<sup>1</sup> は、独立して、O、S、N(R<sup>X</sup>)、N(O)(R<sup>X</sup>)、N(OR<sup>X</sup>)、N(O)(OR<sup>X</sup>)、またはN(N(R<sup>X</sup>))<sub>2</sub> であり、

Y<sup>2</sup> は、独立して、単結合、O、N(R<sup>X</sup>)、N(O)(R<sup>X</sup>)、N(OR<sup>X</sup>)、N(O)(OR<sup>X</sup>)、N(N(R<sup>X</sup>))<sub>2</sub>、-S(=O)- (スルホキシド)、-S(=O) - (スルホン)、-S- (スルフィド)、または-S-S- (ジスルフィド) であり、

M2 は、0、1 または 2 であり、

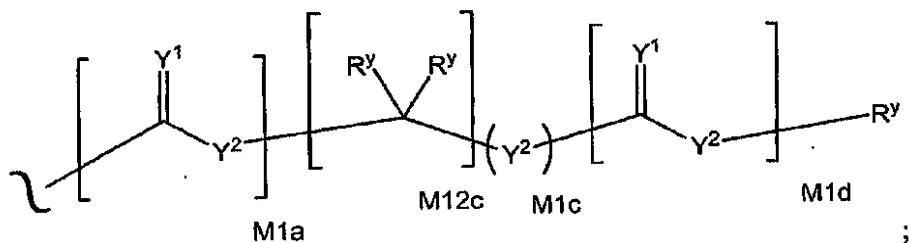
M12a は、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、または12 であり、

M12b は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、または12 であり、

RY は、独立して、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> 置換アルキル、アリール、置換アリール、または保護基であり、あるいは、1つの炭素原子、2つの隣接する RY 基と共に環を形成し（すなわち、スピロ炭素）、環は、全て炭素原子であってよく、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、またはシクロヘキシルであるか、あるいは、環は、1つまたは複数のヘテロ原子を含むことができ、例えば、ピペラジニル、ピペリジニル、ピラニル、またはテトラヒドロフリルであり、

R<sup>X</sup> は、独立して、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> 置換アルキル、C<sub>6</sub> ~ C<sub>20</sub> アリール、C<sub>6</sub> ~ C<sub>20</sub> 置換アリール、もしくは保護基、または式：

【化21】



（式中、M1a、M1c、およびM1d は、独立して、0 または 1 であり、M12c は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、または12 である）である、式I、II、またはIIIの化合物である、項目1、項目24、または項目56に記載の化合物のホスホナート。

（項目70）

プロドラッグである、項目64に記載のホスホナート。

（項目71）

上記化合物のIC<sub>50</sub> が > 0 uM と約 1 uMとの間である、項目1、項目24、または項目56に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩。

（項目72）

上記化合物のEC<sub>50</sub> が > 0 uM と約 1 uMとの間である、項目1、項目24、または項目56に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩。

（項目73）

上記化合物の  $I C_{50}$  が  $> 0 \text{ nM}$  と約  $1 \text{ nM}$  の間であり、上記化合物の  $E C_{50}$  が  $> 0 \text{ uM}$  と約  $1 \text{ uM}$  の間である、項目 1、項目 24、または項目 56 に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩。

(項目 74)

式 (II) :

【化 22】



(II)

(式中、

$A^2$  および  $A^3$  は、それぞれ独立して、N または  $CR_a$  であり、

各  $R_a$  は、独立して、H または  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、

$R_c$  は、H、 $R_k$ 、または  $-Q-R_n$  であり、

$R_d$  は、 $R_j$  で置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、

$R_e$  は、H、ハロ、または  $R_j$  で任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、

$Q$  は、 $C_1 \sim C_4$  アルキレンであり、

$Z$  は、O または 2 つの水素であり、

各  $R_j$  は、1 つまたは複数の F、Cl、Br、I、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、または  $C_1 \sim C_4$  アルキルで任意選択的に置換されたフェニルであり、

$R_k$  は、それぞれ、1 つまたは複数のハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N-エチル-N-メチルアミノ、モルホリノ、チオモルホリノ、ピペリジノ、またはピペラジノで任意選択的に置換された  $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、または  $C_2 \sim C_6$  アルキニルであり、

$R_n$  は、 $C_3 \sim C_6$  炭素環、フェニル環、または 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール環であり、フェニル環または 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール環は、1 つまたは複数の F、Cl、Br、I、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $-C(=O)NR_{ac}R_{ad}$ 、または  $C_1 \sim C_4$  アルキルで任意選択的に置換され、

$R_p$  は、 $-N(R_{ae})-S(O)_2-R_{af}$  であり、

$R_w$  は、 $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、

各  $R_x$  は、独立して、H、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、または  $C_1 \sim C_4$  アルキル-R<sub>y</sub> であるか、 $NR_xR_x$  は、共に、ピペリジノまたはピペラジノ環を形成し、環は、1 つまたは複数の  $C_1 \sim C_4$  アルキルで任意選択的に置換され、

各  $R_y$  は、独立して、フェニルまたはピリジルであり、ここで、各フェニルまたはピリジルは、1 つまたは複数のフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルキル-C(=O)-、 $C_1 \sim C_4$  アルキル-S(O)<sub>2</sub>-、-C(=O)NR<sub>a</sub>R<sub>a</sub>、または-C(=O)OR<sub>a</sub>で任意選択的に置換され、

$R_z$  は、1 つまたは複数のフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルキル-C(=O)-、 $C_1 \sim C_4$  アルキル-S(O)<sub>2</sub>-、-C(=O)NR<sub>a</sub>R<sub>a</sub>、または-C(=O)OR<sub>a</sub>で任意選択的に置換されたフェニルであり、

各  $R_{ac}$  および  $R_{ad}$  は、独立して、H または  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり、

各  $R_{ae}$  および  $R_{af}$  は、独立して、H または  $C_1 \sim C_6$  アルキルである)の化合物またはその薬学的に許容可能な塩もしくはプロドラッグ。

(項目 75)

上記  $R_c$  が、3-クロロ-4,6-ジフルオロベンジル、4-フルオロベンジル、3-

クロロ - 4 - フルオロベンジル、4 - フルオロ - 2 - (N, N - ジメチルアミノカルボニル) ベンジル、または 4 - フルオロ - 2 - (N - メチルアミノカルボニル) ベンジルである、項目 74 に記載の化合物。

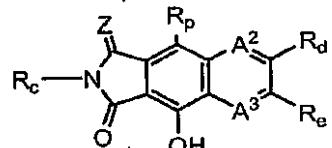
(項目 76)

上記 R<sub>d</sub> が 4 - フルオロベンジルである、項目 75 に記載の化合物。

(項目 77)

式 (II) :

【化 23】



(II)

(式中、

A<sup>2</sup> および A<sup>3</sup> は、それぞれ独立して、N または CR<sub>a</sub> であり、

各 R<sub>a</sub> は、独立して、H または C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、

R<sub>c</sub> は、H、R<sub>k</sub>、または -Q - R<sub>n</sub> であり、

R<sub>d</sub> は、R<sub>j</sub> で置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、

R<sub>e</sub> は、H、ハロ、または R<sub>j</sub> で任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、

Q は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキレンであり、

Z は、O または 2 つの水素であり、

各 R<sub>j</sub> は、1 つまたは複数の F、C<sub>1</sub>、Br、I、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、または C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルで任意選択的に置換されたフェニルであり、

R<sub>k</sub> は、それぞれ、1 つまたは複数のハロ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、N - エチル - N - メチルアミノ、モルホリノ、チオモルホリノ、ピペリジノ、またはピペラジノで任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、または C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニルであり、

R<sub>n</sub> は、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> 炭素環、フェニル環、または 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール環であり、フェニル環または 5 員もしくは 6 員のヘテロアリール環は、1 つまたは複数の F、C<sub>1</sub>、Br、I、ヒドロキシ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルコキシ、-C(=O)NR<sub>a</sub>cR<sub>a</sub>d、または C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルで任意選択的に置換され、

R<sub>p</sub> は、H、NH<sub>2</sub>、-C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>x</sub>、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、ピリジル、1,3,4 - オキサジアゾール、5 - メチル - 1,3,4 - オキサジアゾール、または 1 つまたは複数の F、C<sub>1</sub>、CN、ヒドロキシ、またはトリフルオロメチルで任意選択的に置換されたフェニルであり、ここで、R<sub>p</sub> の任意の C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルは、1 つまたは複数のヒドロキシ、シアノ、-C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>x</sub>、または -NR<sub>a</sub>rR<sub>a</sub>s で任意選択的に置換され、

R<sub>w</sub> は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、

各 R<sub>x</sub> は、独立して、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> 炭素環、または C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル - R<sub>y</sub> であるか、NR<sub>x</sub>R<sub>x</sub> は、共に、ピペリジノ、モルホリノ、アゼチジノ、ピロリジノ、またはピペラジノ環を形成し、環は、1 つまたは複数の C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルまたはハロで任意選択的に置換され、

各 R<sub>y</sub> は、独立して、シアノ、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルコキシ、フェニル、またはピリジルであり、ここで、各フェニルまたはピリジルは、1 つまたは複数のフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル

- C ( = O ) - 、 C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル - S ( O )<sub>2</sub> - 、 - C ( = O ) N R<sub>a</sub> R<sub>a</sub> 、または - C ( = O ) O R<sub>a</sub> で任意選択的に置換され、  
 R<sub>a</sub> は、1つまたは複数のフルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル - C ( = O ) - 、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル - S ( O )<sub>2</sub> - 、 - C ( = O ) N R<sub>a</sub> R<sub>a</sub> 、または - C ( = O ) O R<sub>a</sub> で任意選択的に置換されたフェニルであり、各 R<sub>a\_c</sub> および R<sub>a\_d</sub> は、独立して、H または C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルであり、各 R<sub>a\_e</sub> および R<sub>a\_f</sub> は、独立して、H または C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルであり、各 R<sub>a\_g</sub> および R<sub>a\_h</sub> は、独立して、H、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、または C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルカノイルである) の化合物またはその薬学的に許容可能な塩もしくはプロドラッグ。  
 (項目 78)

上記 R<sub>d</sub> が 4 - フルオロベンジルである、項目 77 に記載の化合物。

(項目 79)

上記 R<sub>p</sub> が、4 - フルオロフェニル、3, 5 - ジフルオロフェニル、4 - クロロフェニル、H、2 - (N, N - ジメチルアミノカルボニル) エチル、4 - シアノフェニル、N - ピリド - 2 - イルメチルアミノカルボニル、N, N - ジメチルアミノカルボニルメチル、N - メチルアミノカルボニル、N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) アミノカルボニル、N - メチル - N - (メトキシメチル) アミノカルボニル、2, 6 - ジフルオロフェニル、N - メチル - N - (2 - ヒドロキシエチル) アミノカルボニル、2 - ヒドロキシ - 2 - メチルエチル、N - (2 - ヒドロキシエチル) アミノカルボニル、N - (2 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル) アミノカルボニル、2 - ヒドロキシエチル、N - メチルアミノカルボニルメチル、4 - ピリジル、3 - ピリジル、または 4 - ヒドロキシフェニルである、項目 78 に記載の化合物。

(項目 80)

上記 R<sub>p</sub> が、2 - (N, N - ジメチルアミノカルボニル) エチル、4 - シアノフェニル、N - ピリド - 2 - イルメチルアミノカルボニル、N, N - ジメチルアミノカルボニルメチル、N - メチルアミノカルボニル、N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) アミノカルボニル、N - メチル - N - (メトキシメチル) アミノカルボニル、N - メチル - N - (2 - ヒドロキシエチル) アミノカルボニル、2 - ヒドロキシ - 2 - メチルエチル、N - (2 - ヒドロキシエチル) アミノカルボニル、N - (2 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル) アミノカルボニル、2 - ヒドロキシエチル、または N - メチルアミノカルボニルメチルである、項目 79 に記載の化合物。

(項目 81)

上記 R<sub>p</sub> が、4 - フルオロフェニル、3, 5 - ジフルオロフェニル、4 - クロロフェニル、H、4 - シアノフェニル、2, 6 - ジフルオロフェニル、4 - ピリジル、3 - ピリジル、または 4 - ヒドロキシフェニルである、項目 80 に記載の化合物。

(項目 82)

上記 R<sub>c</sub> が、3 - クロロ - 4, 6 - ジフルオロベンジル、4 - フルオロベンジル、3 - クロロ - 4 - フルオロベンジル、4 - フルオロ - 2 - (N, N - ジメチルアミノカルボニル) ベンジル、または 4 - フルオロ - 2 - (N - メチルアミノカルボニル) ベンジルである、項目 81 に記載の化合物。

(項目 83)

本明細書中に記載の化合物

## 【化24】

209, 211, 212, 213, 214, 217, 218, 219, 220, 222, 223, 224, 225, 226, 227,  
235, 236, 237, 238, 239, 240, 242, 243, 244, 245, 246, 247, 250, 251, 277, 280, 282, 284,  
286, 287, 289, 291, 292, 294, 296, 298, 301, 303, 305, 307, 309, 311, 313, 314, 316, 320,  
326, 328, 330, 332, 336, 461, 339, 344, 351, 353, 354, 359, 361, 363, 369, 370, 372, 374,  
376, 378, 380, 382, 386, 390, 392, 394, 398, 400, 403, 404, 408, 421, 423, 429, 432, 433,  
436, 440, 442, 446, 451, 452, 453, 455もしくは456

、またはその薬学的に許容可能な塩。

(項目84)

項目1、項目24、または項目56に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩と、薬学的に許容可能な賦形剤、希釈剤、またはキャリアとを含む、薬学的組成物。

(項目85)

AIDS治療薬、抗感染症薬、免疫調節薬、追加免疫薬、またはその混合物をさらに含む、項目84に記載の薬学的組成物。

(項目86)

上記AIDS治療薬が、HIV-プロテアーゼ阻害剤、ヌクレオシド逆転写酵素阻害剤、非ヌクレオシド逆転写酵素阻害剤、またはその混合物である、項目85に記載の薬学的組成物。

(項目87)

経口投薬形態である、項目84に記載の薬学的組成物。

(項目88)

HIVウイルスの増殖を治療するか、AIDSを治療するか、AIDSまたはARC症候群の発症を遅延させる方法であって、項目1、項目24、または項目56に記載の化合物の治療有効量を必要とする哺乳動物に投与する工程を含む、方法。

(項目89)

HIVインテグラーーゼを阻害する方法であって、項目1、項目24、または項目56に記載の化合物の治療有効量を必要とする哺乳動物に投与する工程を含む、方法。

(項目90)

追加免疫薬、治療有効量のAIDS治療薬、治療有効量の抗感染症薬、治療有効量の免疫調節薬、またはその混合物を、必要とする哺乳動物に投与する工程をさらに含む、項目74に記載の方法。

(項目91)

インテグラーーゼ阻害が役割を果たす障害、症状、および疾患を治療するためのキットであって、2つまたはそれを超える個別の容器を1つの包装に含み、少なくとも1つの項目1、項目24、または項目56に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩が、1つまたは複数の以下：薬学的に許容可能なキャリア、追加免疫薬、治療有効量のAIDS治療薬、治療有効量の抗感染症薬、または治療有効量の免疫調節薬と組み合わせて収められている、キット。

(項目92)

療法で用いるための、項目1、項目24、または項目56に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩。

(項目93)

HIVの治療薬の製造における項目1、項目24、または項目56に記載の化合物または薬学的に許容可能な塩の使用。

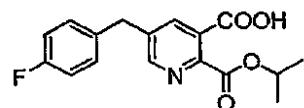
(項目94)

本明細書中に記載の化合物、薬学的に許容可能な塩、または薬学的組成物。

(項目95)

化合物 9 8 :

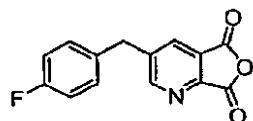
【化 2 5】



98

の調製方法であって、化合物 9 7 :

【化 2 6】



97

を Mg ( C<sub>1</sub>O<sub>4</sub> )<sub>2</sub> と組み合わせ、イソプロパノールを添加して化合物 9 8 を得る工程を含む、方法。

(項目 9 6)

上記化合物 9 7 および Mg ( C<sub>1</sub>O<sub>4</sub> )<sub>2</sub> を、約 - 10 のテトラヒドロフラン中で混合し、その後にイソプロパノールを添加する、項目 9 5 に記載の方法。

(項目 9 7)

項目 1、項目 2 4、または項目 5 6 に記載の化合物の有効量を動物に投与する工程を含む、動物の抗ウイルス効果を促進する方法。