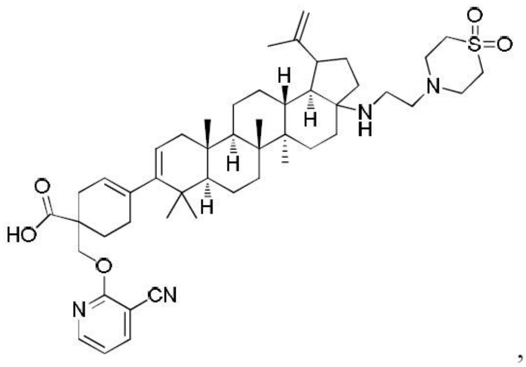
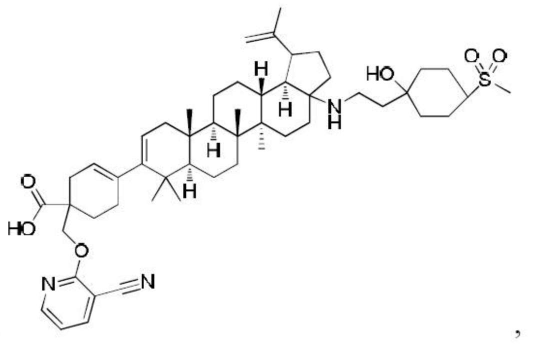
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和2年1月30日(2020.1.30)

【公表番号】特表2019-504104(P2019-504104A)
【公表日】平成31年2月14日(2019.2.14)
【年通号数】公開・登録公報2019-006
【出願番号】特願2018-540806(P2018-540806)
【国際特許分類】
　Ｃ０７Ｊ　63/00　(2006.01)
　Ａ６１Ｐ　31/18　(2006.01)
　Ａ６１Ｋ　31/541　(2006.01)
　Ａ６１Ｋ　31/4545　(2006.01)
　Ａ６１Ｋ　31/4402　(2006.01)
　Ａ６１Ｋ　31/44　(2006.01)
　Ｃ０７Ｋ　19/00　(2006.01)
　Ｃ０７Ｋ　14/155　(2006.01)
【ＦＩ】
　Ｃ０７Ｊ　63/00　ＣＳＰ
　Ａ６１Ｐ　31/18
　Ａ６１Ｋ　31/541
　Ａ６１Ｋ　31/4545
　Ａ６１Ｋ　31/4402
　Ａ６１Ｋ　31/44
　Ｃ０７Ｋ　19/00
　Ｃ０７Ｋ　14/155

【手続補正書】
【提出日】令和1年12月12日(2019.12.12)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
　以下：
【化１】



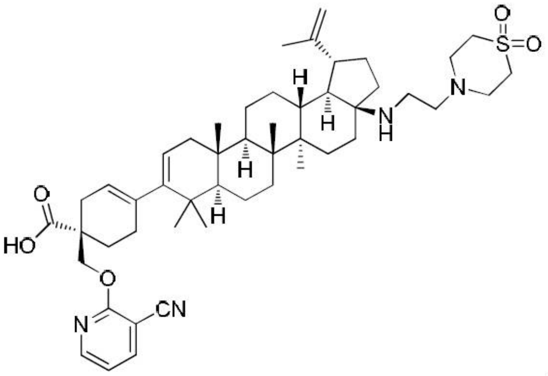
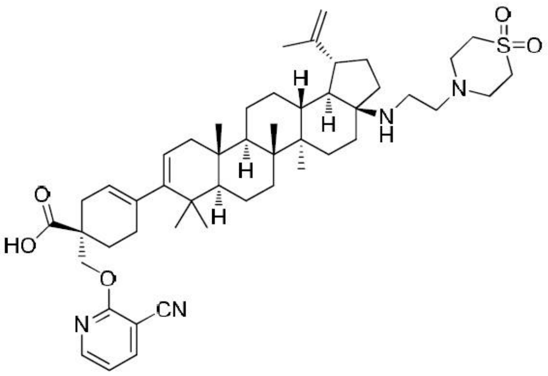
，



，

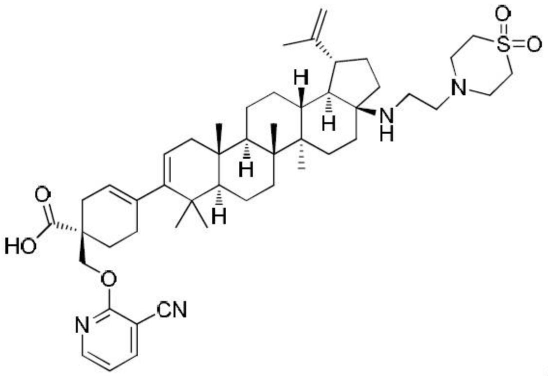
及び薬学的に許容されるその塩からなる群から選択される、化合物又は塩。
【請求項２】

以下：
【化２】


,

,

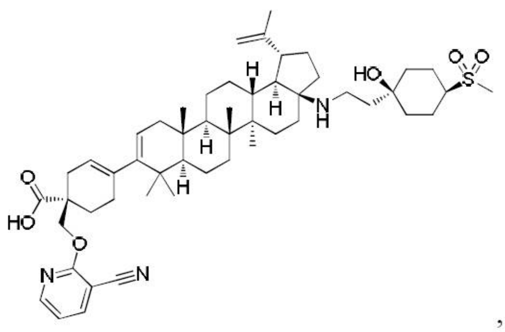
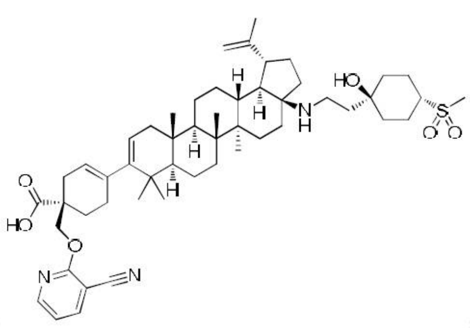
及び薬学的に許容されるその塩からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物又は塩。

【請求項３】
以下：
【化３】


,

及び薬学的に許容されるその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。

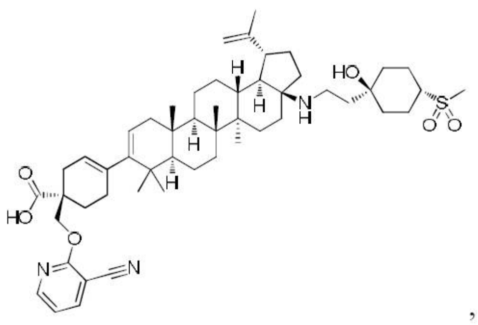
【請求項４】
以下：
【化４】


,

,

及び薬学的に許容されるその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５】
以下：

【化５】



,

及び薬学的に許容されるその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６】

請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物又は塩を含む医薬組成物。

【請求項７】

請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物又は塩を含む、HIVウイルスに感染した哺乳動物を治療するための医薬組成物。

【手続補正２】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】０９９４

【補正方法】変更

【補正の内容】

【０９９４】

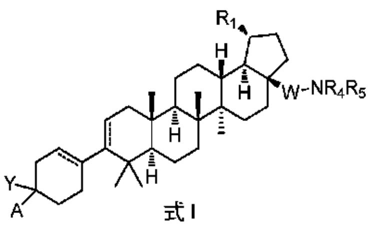
前述の記載は単なる説明であり、本発明の範囲又は基本原理を制限するものとして決して理解されるべきではない。事実、本明細書に示され記載されているものに加えて、本発明の様々な変更が、以下の例及び前述の記載から当業者には明白である。そのような変更も、添付の特許請求の範囲の範囲内であることが意図される。

本発明の実施形態として例えば以下を挙げることができる。

［実施形態１］

薬学的に許容されるその塩を含む、式Iの化合物

【化２７９】



式I

［式中、R_1は、イソプロペニル又はイソプロピルであり、

Aは、$-C_{1\sim6}$アルキル$-OR_0$であり、

ここでR_0はヘテロアリール$-Q_0$であり、

Q_0は、-H、-CN、$-C_{1\sim6}$アルキル、-COOH、-Ph、$-OC_{1\sim6}$アルキル、-ハロ、$-CF_3$の群から選択され、

Yは、$-COOR_2$、$-C(O)NR_2SO_2R_3$、$-C(O)NHSO_2NR_2R_2$、$-SO_2NR_2C(O)R_2$、-テトラゾール、及び-CONHOHの群から選択され、

ここで、n=1～6であり、

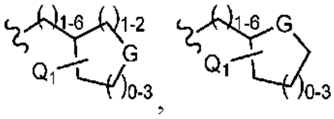
R_2は、-H、$-C_{1\sim6}$アルキル、-アルキル置換$C_{1\sim6}$アルキル又は-アリール置換$C_{1\sim6}$アルキルであり、

Wは、不在であるか、又は$-CH_2-$若しくは-CO-であり、

R_3は、-H、$-C_{1\sim6}$アルキル又は-アルキル置換$C_{1\sim6}$アルキルであり、

R_4は、-H、-$C_{1～6}$アルキル、-$C_{1～6}$アルキル-$C_{3～6}$シクロアルキル、-$C_{1～6}$置換-$C_{1～6}$アルキル、-$C_{1～6}$アルキル-Q_1、-$C_{1～6}$アルキル-$C_{3～6}$シクロアルキル-Q_1、アリール、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、-COR_6、-SO_2R_7、-$SO_2NR_2R_2$、及び

【化２８０】



の群から選択され、

ここでGは、-O-、-SO_2-及び-NR_{12}-の群から選択され、

ここでQ_1は、-$C_{1～6}$アルキル、-$C_{1～6}$フルオロアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ハロゲン、-CF_3、-OR_2、-$COOR_2$、-NR_8R_9、-$CONR_8R_9$及び-SO_2R_7の群から選択され、

R_5は、-H、-$C_{1～6}$アルキル、-$C_{3～6}$シクロアルキル、-$C_{1～6}$アルキル置換アルキル、-$C_{1～6}$アルキル-NR_8R_9、-COR_3、-SO_2R_7及び-$SO_2NR_2R_2$の群から選択され、

但し、R_4又はR_5は、Wが-CO-である場合、-COR_6ではないことが条件であり、

さらに、R_4又はR_5の一方のみが、-COR_6、-$COCOR_6$,-SO_2R_7及び-$SO_2NR_2R_2$の群から選択されることが条件であり、

R_6は-H、-$C_{1～6}$アルキル、-$C_{1～6}$アルキル置換アルキル、-$C_{3～6}$シクロアルキル、-$C_{3～6}$置換シクロアルキル-Q_2、-$C_{1～6}$アルキル-Q_2、-$C_{1～6}$アルキル置換アルキル-Q_2、-$C_{3～6}$シクロアルキル-Q_2、アリール-Q_2、-$NR_{13}R_{14}$、及び-OR_{15}の群から選択され、

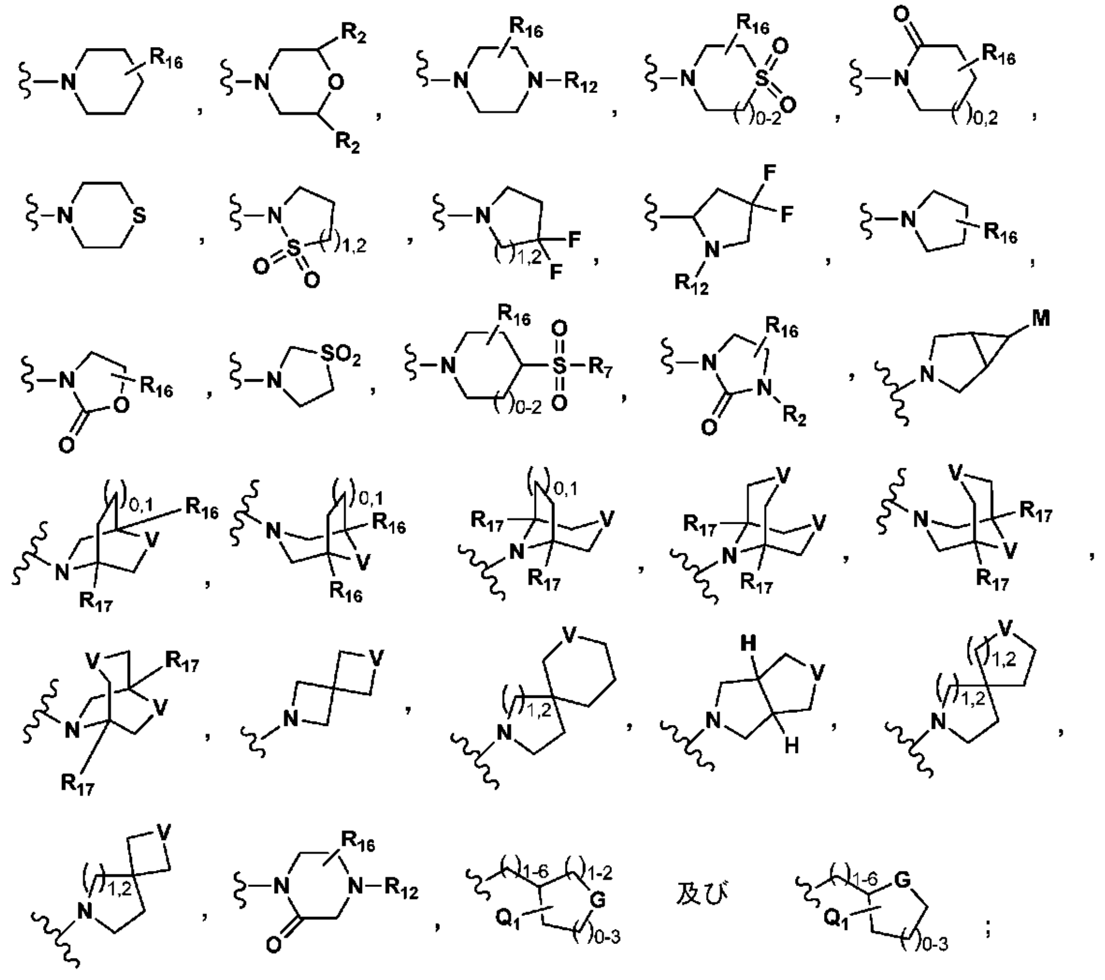
ここでQ_2はアリール、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、-OR_2、-$COOR_2$、-NR_8R_9、SO_2R_7、-$CONHSO_2R_3$、及び-$CONHSO_2NR_2R_2$の群から選択され、

R_7は-H、-$C_{1～6}$アルキル、-$C_{1～6}$置換アルキル、-$C_{3～6}$シクロアルキル、-CF_3、アリール、及びヘテロアリールの群から選択され、

R_8及びR_9は、-H、-$C_{1～6}$アルキル、-$C_{1～6}$置換アルキル、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、置換ヘテロアリール、-$C_{1～6}$アルキル-Q_2、及び-$COOR_3$の群から独立して選択され、

又はR_8及びR_9は、隣接するNと一緒になって

【化２８１】



の群から選択される環を形成し、

Mは、-R_{15}、-SO_2R_2、-$SO_2NR_2R_2$、-OH及び-NR_2R_{12}の群から選択され、

Vは、-$CR_{10}R_{11}$-、-SO_2-、-O-及び-NR_{12}-の群から選択され、

但し、R_8又はR_9の一方のみが-$COOR_3$であり得ることが条件であり、

R_{10}及びR_{11}は、-H、-$C_{1\sim6}$アルキル、-$C_{1\sim6}$置換アルキル及び-$C_{3\sim6}$シクロアルキルの群から独立して選択され、

R_{12}は、-H、-$C_{1\sim6}$アルキル、-アルキル置換$C_{1\sim6}$アルキル、-$CONR_2R_2$、-SO_2R_3、及び-$SO_2NR_2R_2$の群から選択され、

R_{13}及びR_{14}は、-H、-$C_{1\sim6}$アルキル、-$C_{3\sim6}$シクロアルキル、-$C_{1\sim6}$置換アルキル、-$C_{1\sim6}$アルキル-Q_3、-$C_{1\sim6}$アルキル-$C_{3\sim6}$シクロアルキル-Q_3、及び$C_{1\sim6}$置換アルキル-Q_3の群から独立して選択され、

Q_3は、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、-NR_2R_{12}、-$CONR_2R_2$、-$COOR_2$、-OR_2、及び-SO_2R_3の群から選択され、

R_{15}は、-$C_{1\sim6}$アルキル、-$C_{3\sim6}$シクロアルキル、-$C_{1\sim6}$置換アルキル、-$C_{1\sim6}$アルキル-Q_3、-$C_{1\sim6}$アルキル-$C_{3\sim6}$シクロアルキル-Q_3及び-$C_{1\sim6}$置換アルキル-Q_3の群から選択され、

R_{16}は、-H、-$C_{1\sim6}$アルキル、-NR_2R_2、及び-$COOR_2$の群から選択され、

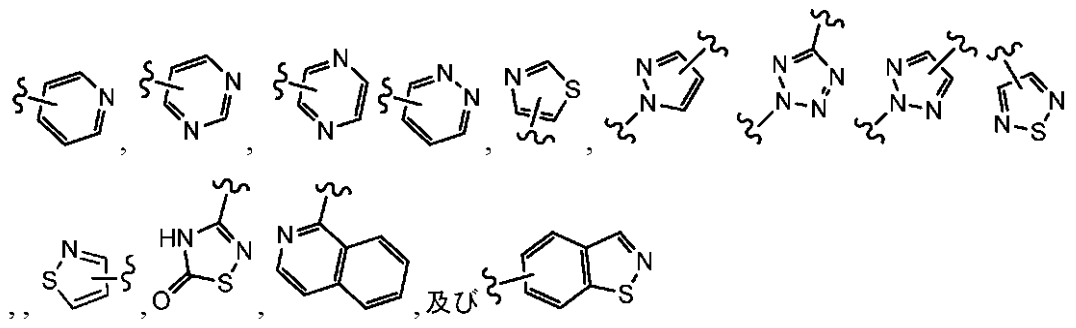
但し、Vが-NR_{12}-である場合、R_{16}は-NR_2R_2でないことが条件であり、

R_{17}は、-H、-$C_{1\sim6}$アルキル、-$COOR_3$、及びアリールの群から選択される］。

［実施形態２］

R_0基のヘテロアリール部分が

【化２８２】



の群から選択される、実施形態1に記載の化合物。

［実施形態３］

R_1がイソプロペニルである、実施形態2に記載の化合物。

［実施形態４］

Yが-COOR$_2$である、実施形態3に記載の化合物。

［実施形態５］

R_2が-Hである、実施形態4に記載の化合物。

［実施形態６］

R_4が-$C_{1\sim6}$アルキル-Q_1である、実施形態1に記載の化合物。

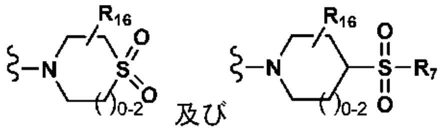
［実施形態７］

Q_1が-NR$_8$R$_9$である、実施形態6に記載の化合物。

［実施形態８］

R_8及びR_9が隣接する-Nと一緒になって環を形成する場合、環が

【化２８３】



の群から選択される、実施形態7に記載の化合物。

［実施形態９］

R_7及びR_{16}が各々-H及び-$C_{1\sim6}$アルキルの群から選択される、実施形態8に記載の化合物。

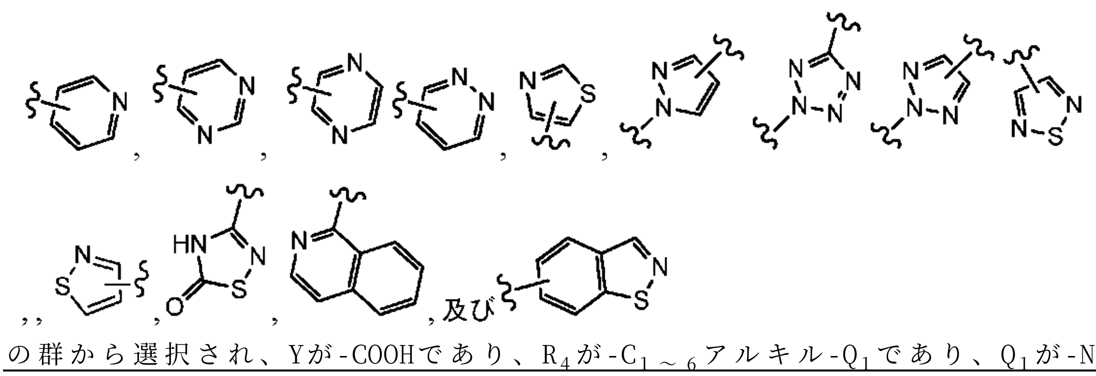
［実施形態１０］

Q_0が-CNである、実施形態1に記載の化合物。

［実施形態１１］

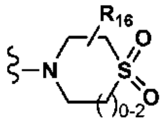
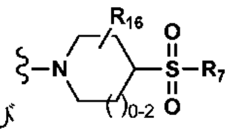
R_1がイソプロペニルであり、R_0基の「ヘテロアリール」部分が

【化２８４】



の群から選択され、Yが-COOHであり、R_4が-$C_{1\sim6}$アルキル-Q_1であり、Q_1が-NR$_8$R$_9$であり、R_8及びR_9が隣接する-Nと一緒になって

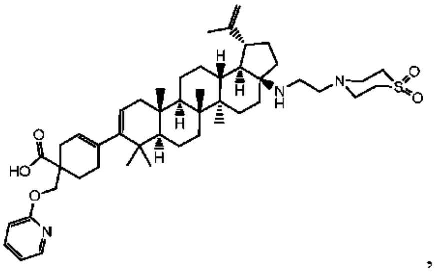
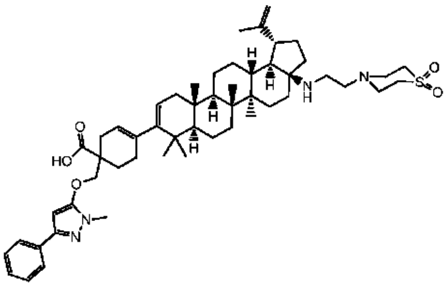
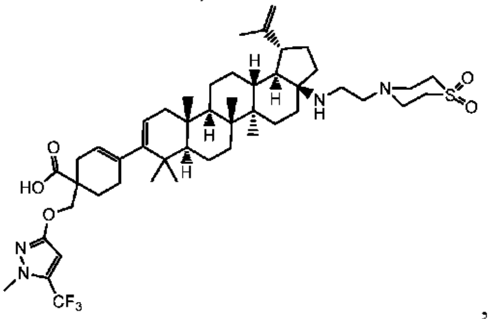
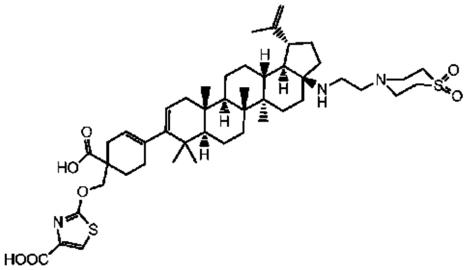
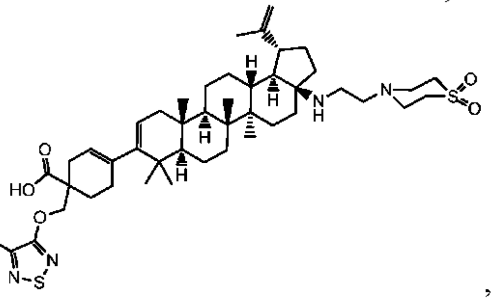
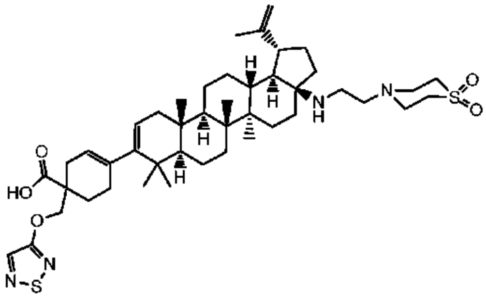
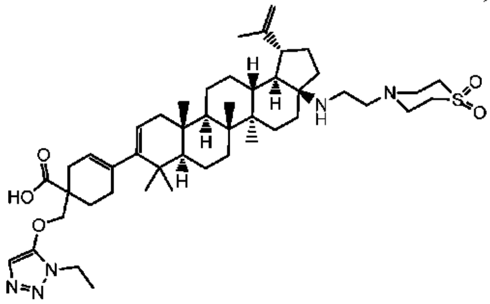
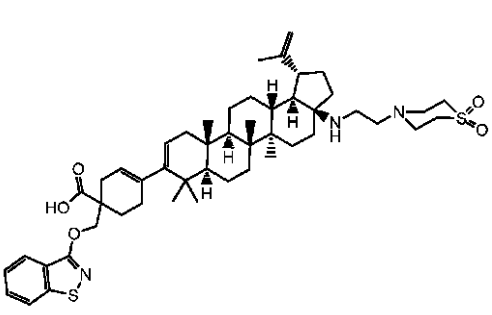
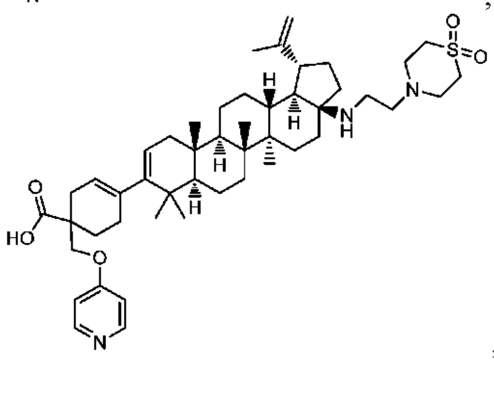
【化２８５】

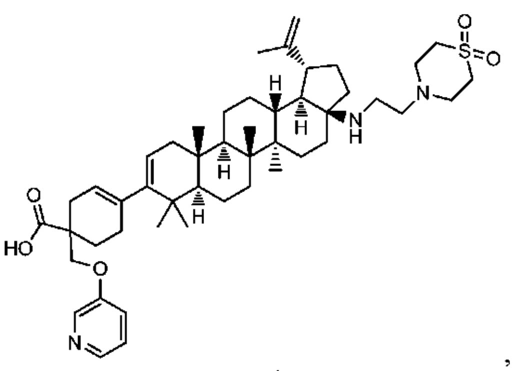
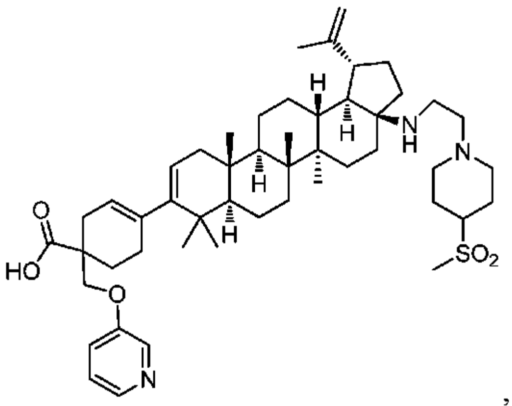
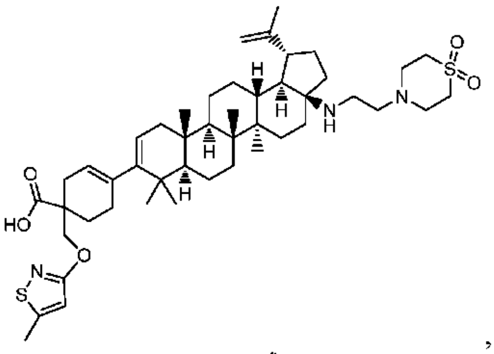
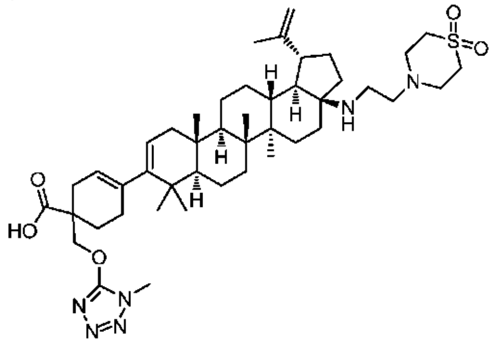
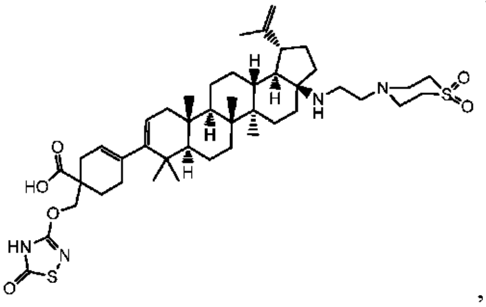
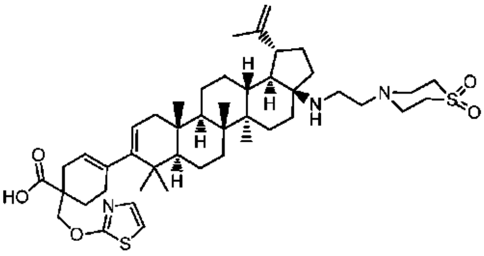
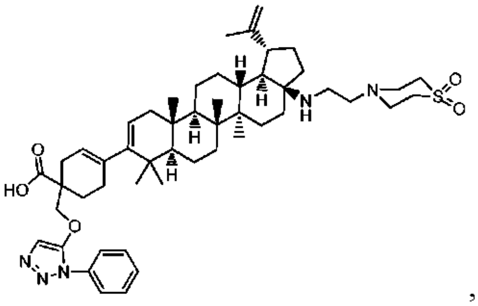
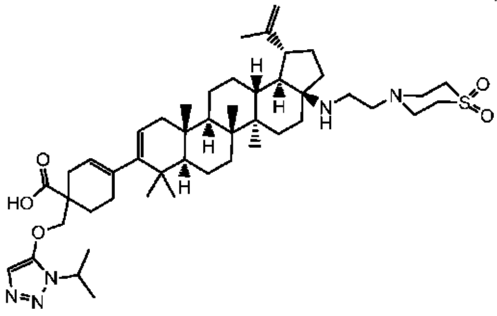
 及び 

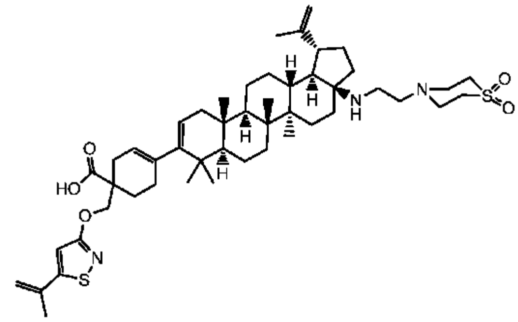
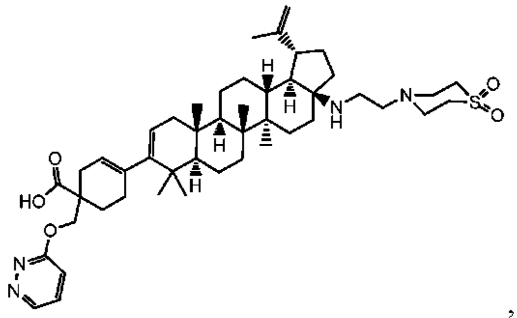
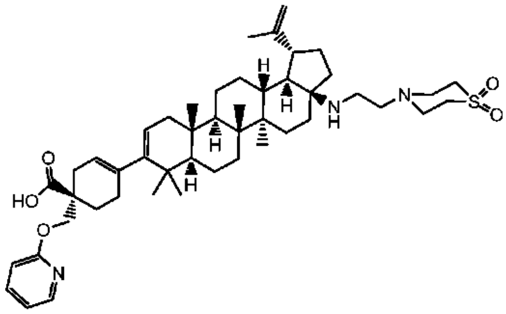
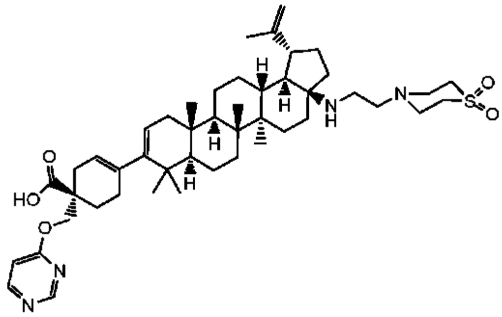
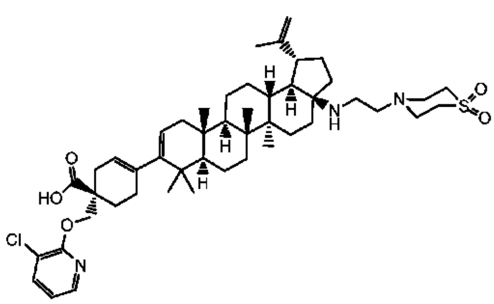
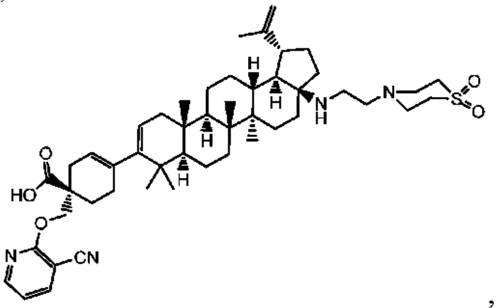
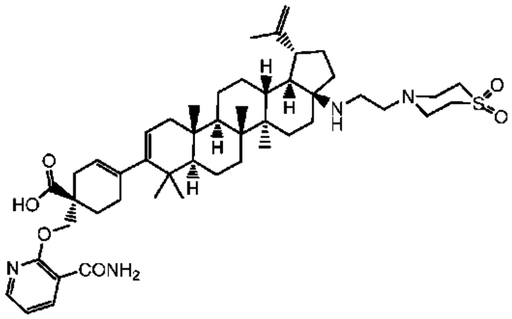
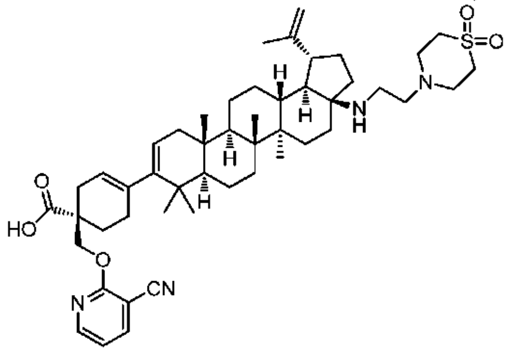
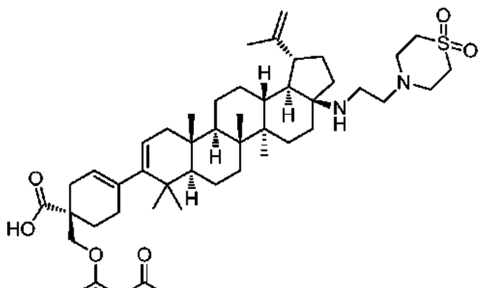
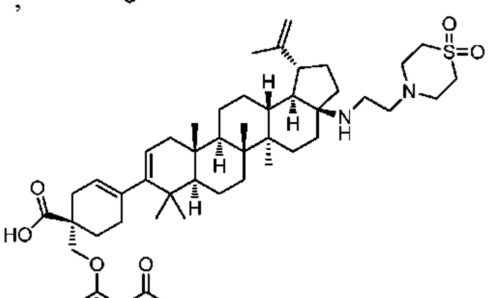
の群から選択される環を形成する、実施形態1に記載の化合物。

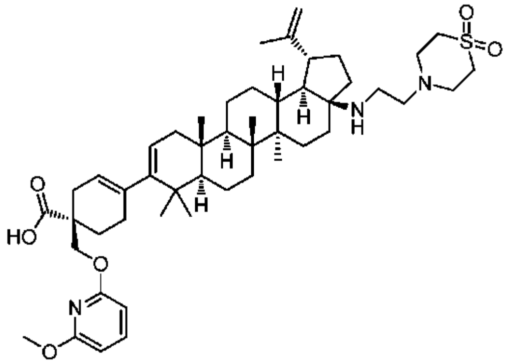
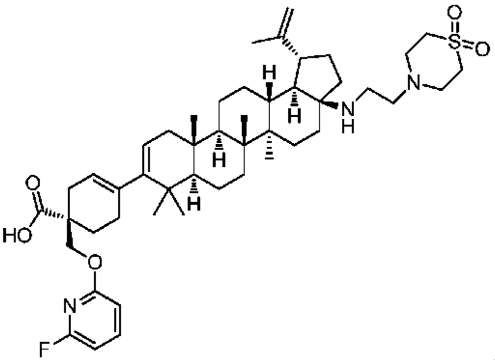
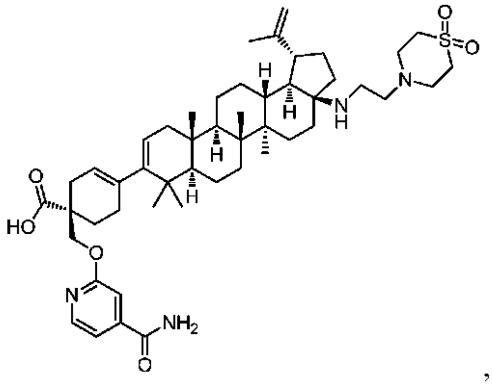
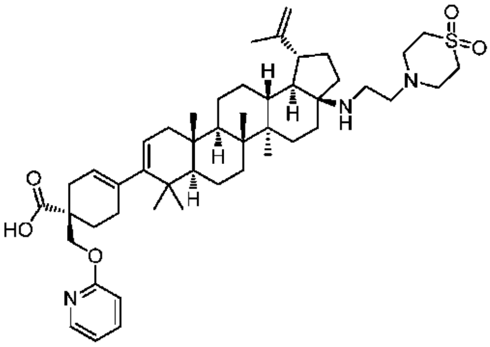
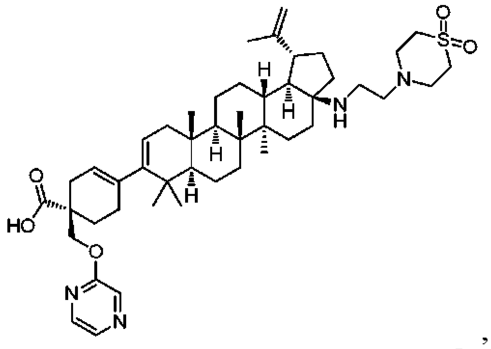
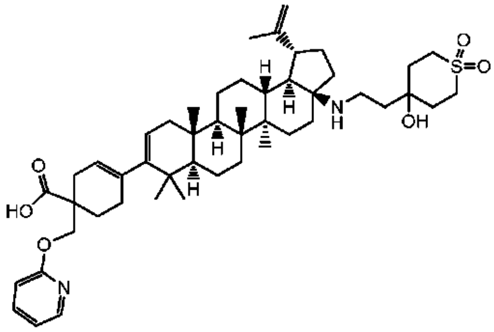
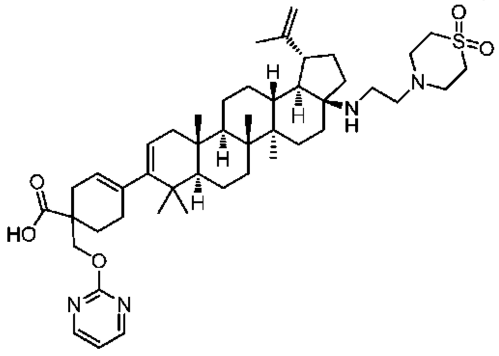
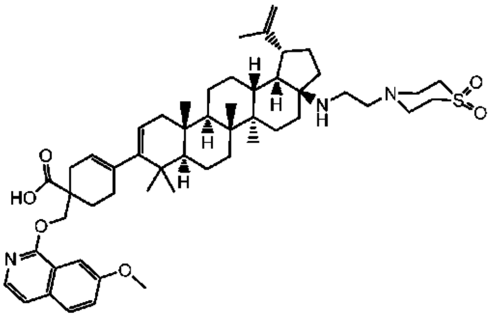
［実施形態１２］

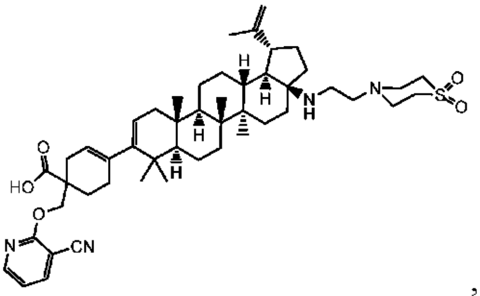
【化２８６】

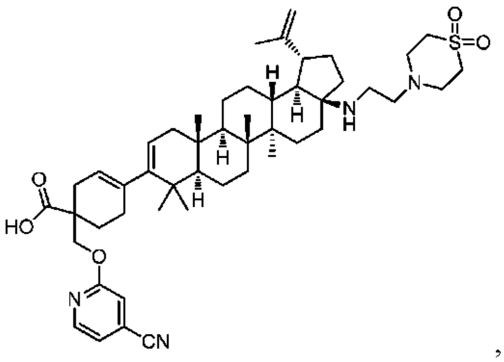

,

, 
,

, 
,

, 
,

, 
,

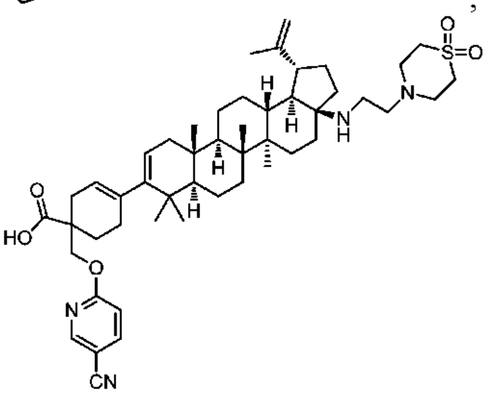

,

,

,

,

,

,

,

,

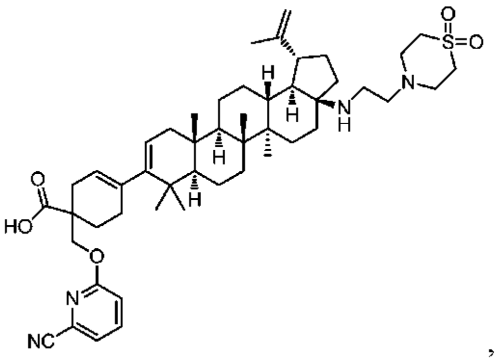

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,

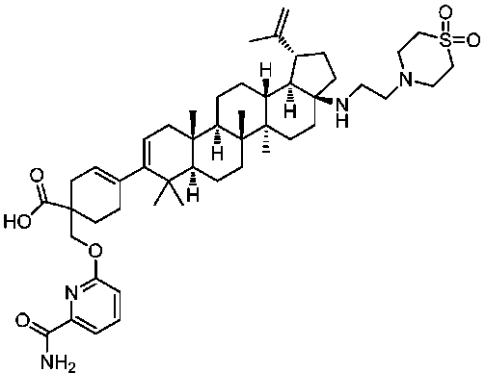

,

,

,

,

,

,

,

,

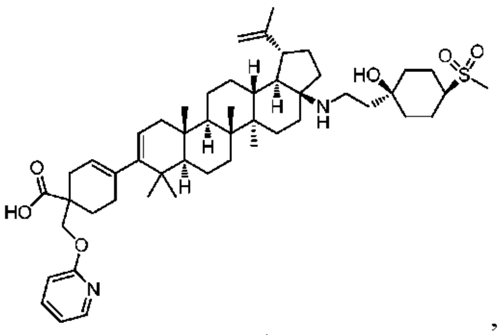

,

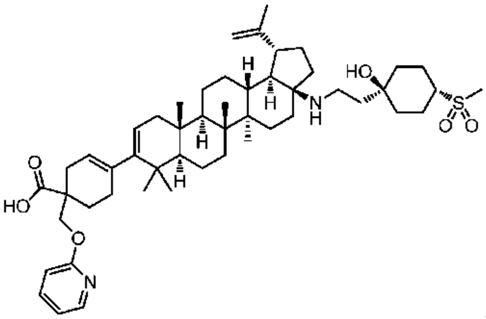

,

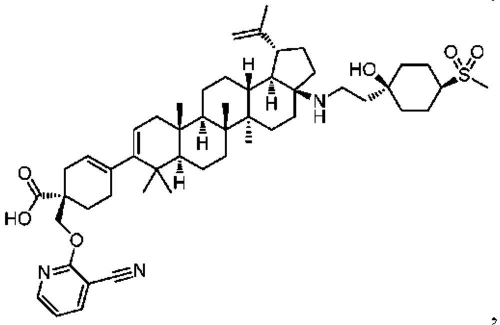

,

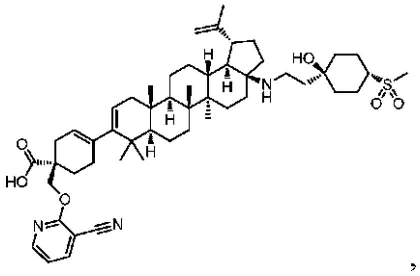
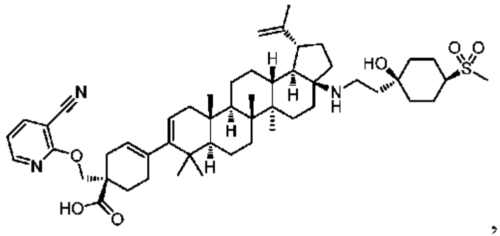
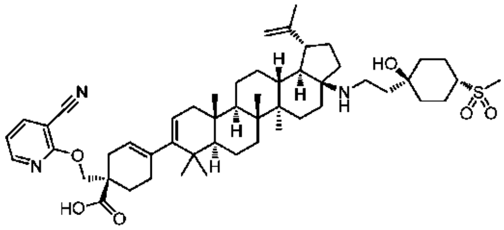
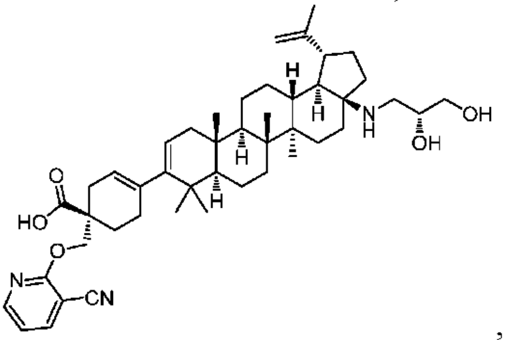
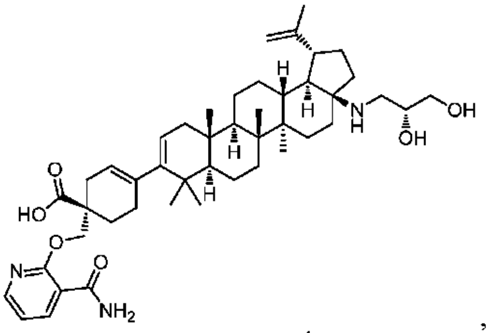
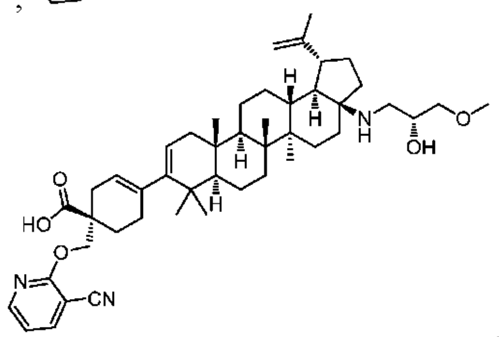
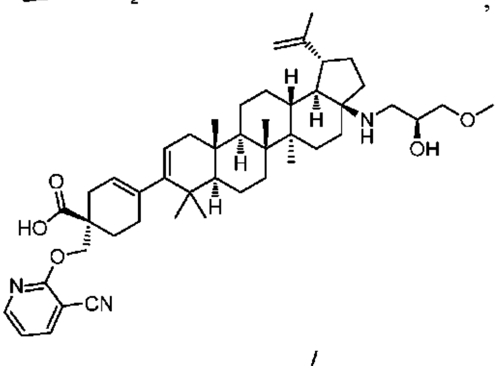
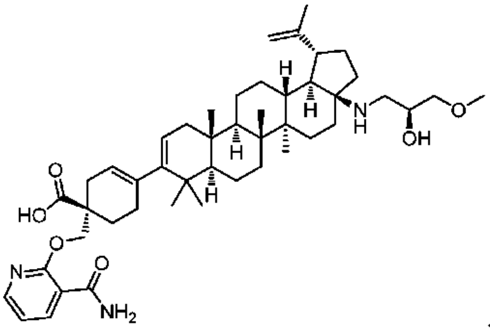
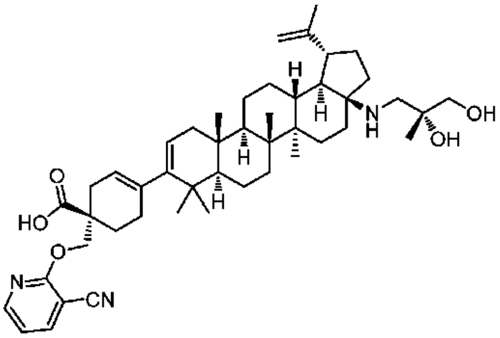
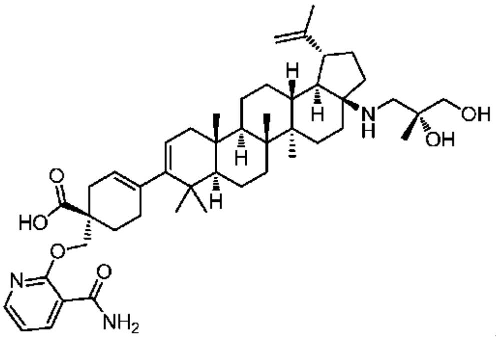

,

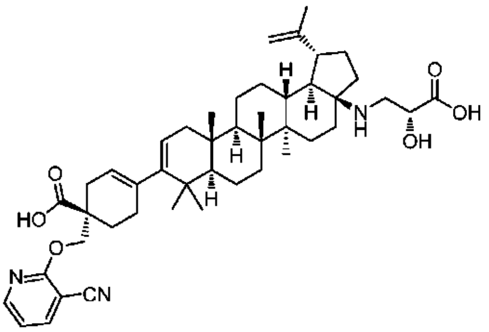
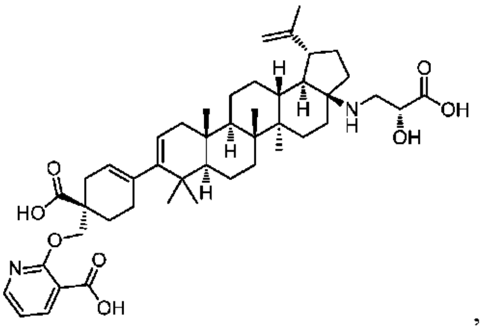
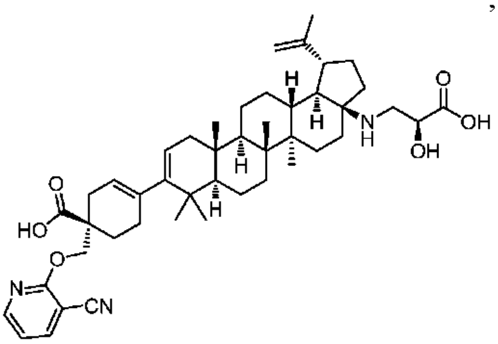
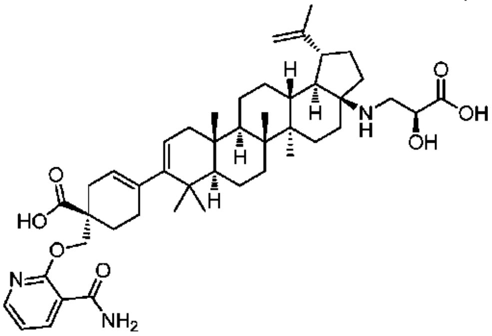
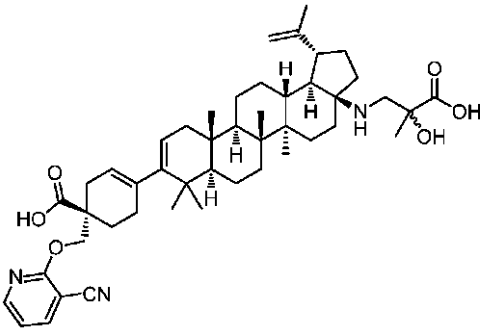
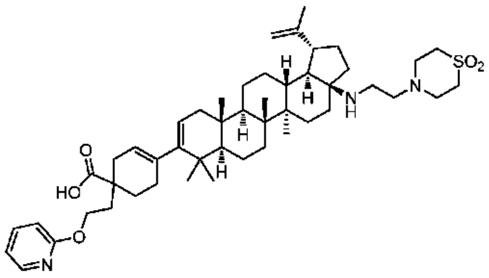
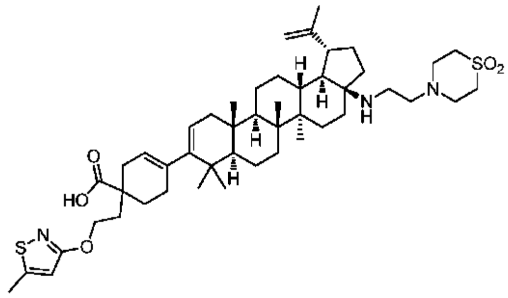
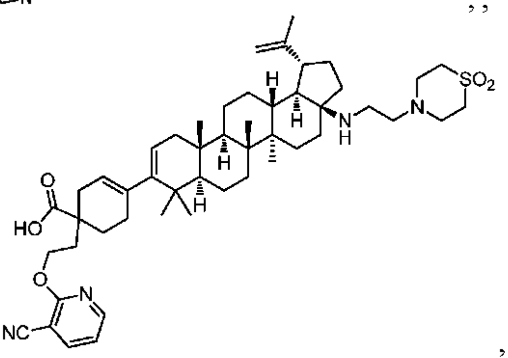

,

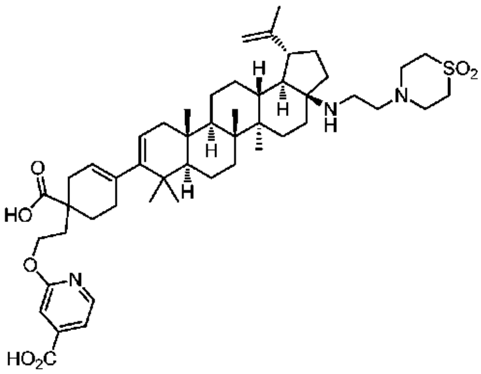
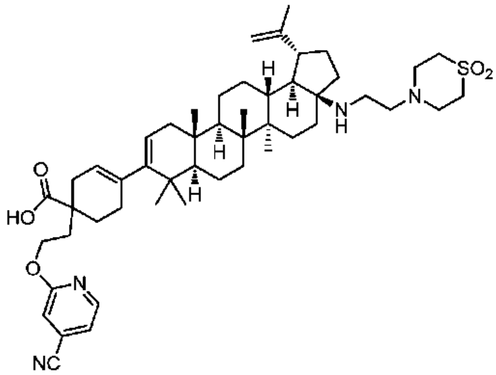
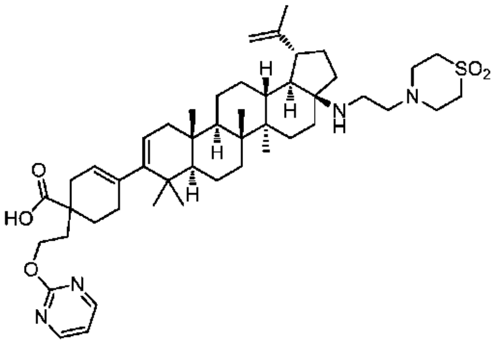
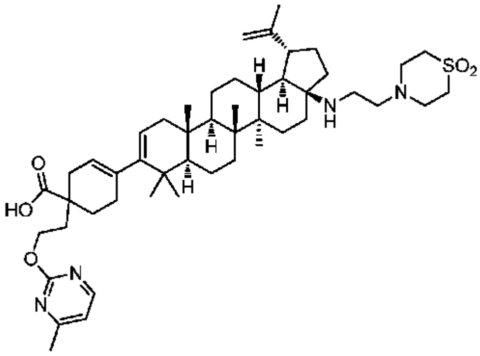
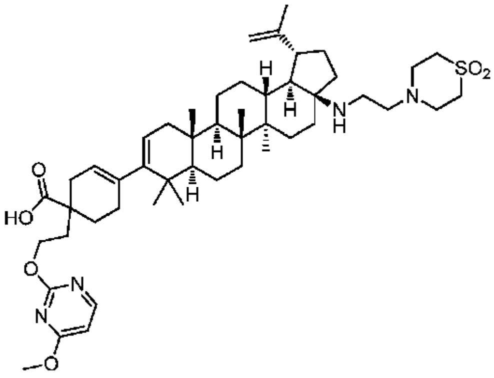
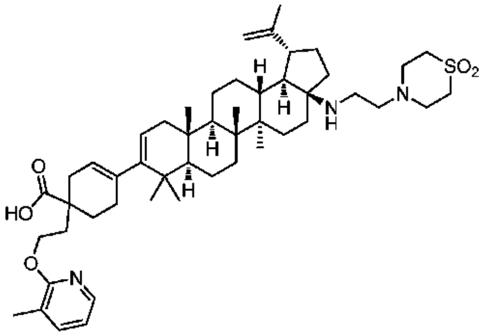
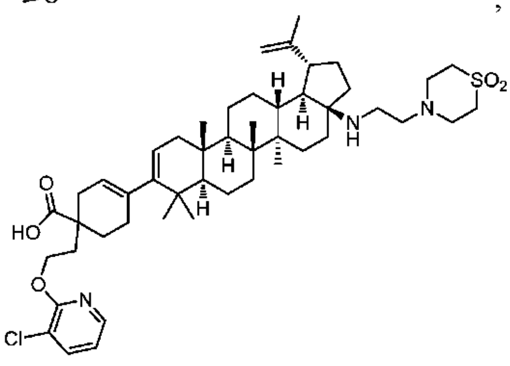
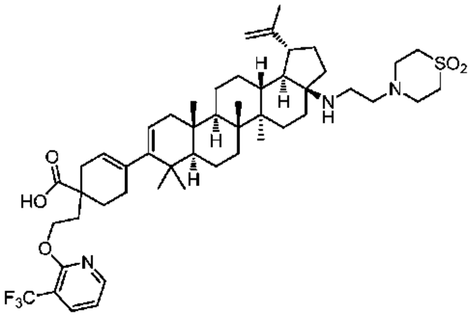

,

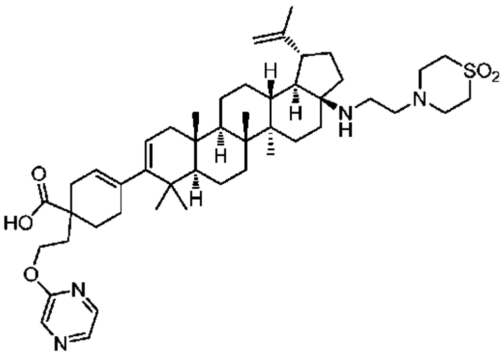
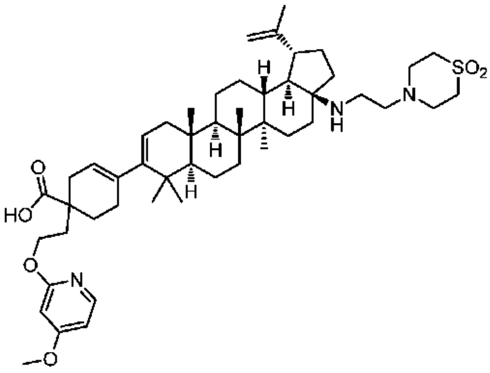
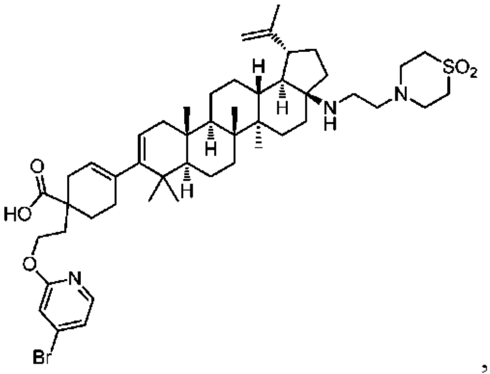
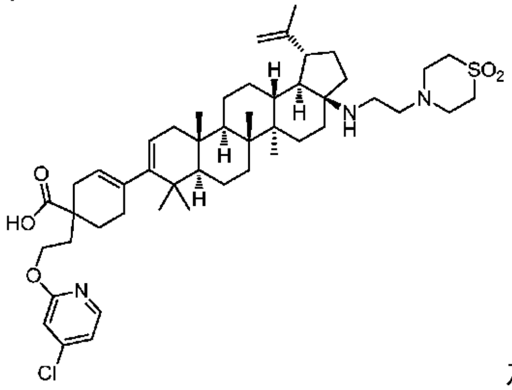
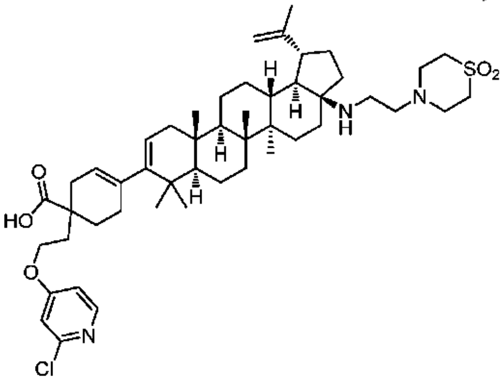

,


,

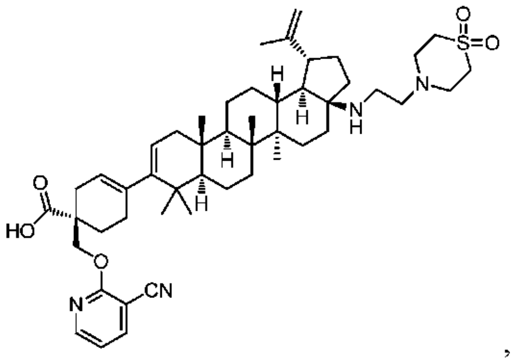

,

,

,

,

,

,

,

,

,

,


,

,

,

,

,

, ,

,

,

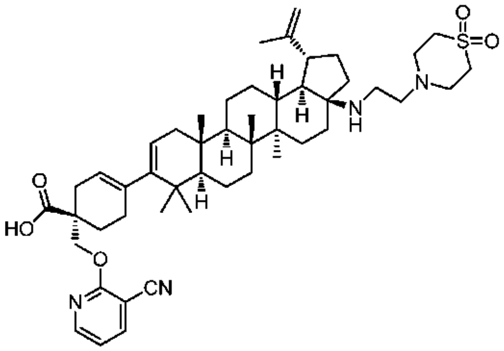

,

,

,

,

,

,

,

,


,

,

,

及び

.
の群から選択される、薬学的に許容されるその塩を含む化合物。
［実施形態１３］

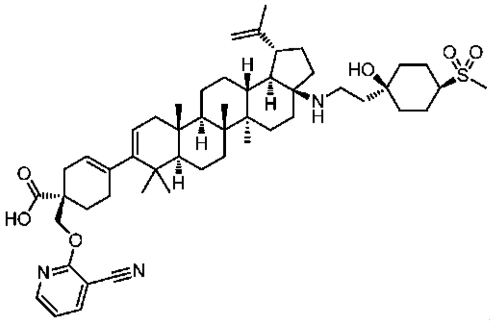
【化２８７】



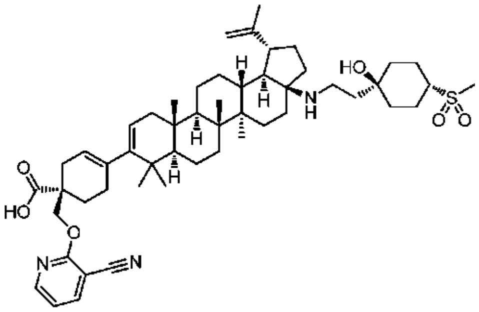
,



,



,及び



.

の群から選択される、薬学的に許容されるその塩を含む化合物。

［実施形態１４］

HIVを寛解させる量の1つ以上の実施形態1に記載の化合物を、1つ以上の薬学的に許容される担体、賦形剤、及び/又は希釈剤と一緒に含む組成物。

［実施形態１５］

HIVを寛解させる量の1つ以上の実施形態11に記載の化合物を、1つ以上の薬学的に許容される担体、賦形剤、及び/又は希釈剤と一緒に含む組成物。

［実施形態１６］

HIVを寛解させる量の1つ以上の実施形態12に記載の化合物を、1つ以上の薬学的に許容

される担体、賦形剤、及び/又は希釈剤と一緒に含む組成物。

［実施形態１７］

HIVを寛解させる量の1つ以上の実施形態13に記載の化合物を、1つ以上の薬学的に許容される担体、賦形剤、及び/又は希釈剤と一緒に含む組成物。

［実施形態１８］

HIVウイルスに感染した哺乳動物を治療する方法であって、HIVを寛解させる量の実施形態1に記載の化合物を1つ以上の薬学的に許容される担体、賦形剤、及び/又は希釈剤と一緒に前記哺乳動物に投与することを含む、方法。

［実施形態１９］

HIVウイルスに感染した哺乳動物を治療する方法であって、HIVを寛解させる量の実施形態12に記載の化合物を1つ以上の薬学的に許容される担体、賦形剤、及び/又は希釈剤と一緒に前記哺乳動物に投与することを含む、方法。

［実施形態２０］

HIVウイルスに感染した哺乳動物を治療する方法であって、HIVを寛解させる量の実施形態13に記載の化合物を1つ以上の薬学的に許容される担体、賦形剤、及び/又は希釈剤と一緒に前記哺乳動物に投与することを含む、方法。

［実施形態２１］

T332S/V362I/pr R41Gとして同定される三重突然変異タンパク質。