

【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31年1月31日 (2019.1.31)

【公開番号】特開2018-188468(P2018-188468A)

【公開日】平成30年11月29日 (2018.11.29)

【年通号数】公開・登録公報2018-046

【出願番号】特願2018-149017(P2018-149017)

【国際特許分類】

C 0 7 H 19/06 (2006.01)

A 6 1 P 31/16 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/712 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

C 0 7 H 19/16 (2006.01)

C 0 7 H 19/20 (2006.01)

C 0 7 H 19/10 (2006.01)

C 0 7 H 19/12 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 H 19/06 C S P

A 6 1 P 31/16

A 6 1 P 31/14

A 6 1 K 31/712

A 6 1 K 45/00

C 0 7 H 19/16

C 0 7 H 19/20

C 0 7 H 19/10

C 0 7 H 19/12

【手続補正書】

【提出日】平成30年12月11日 (2018.12.11)

【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

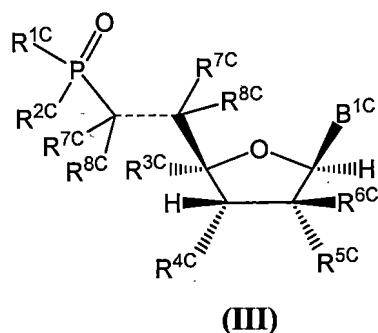
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 ( I I I ) で表される化合物またはその医薬的に許容される塩：

【化 1】

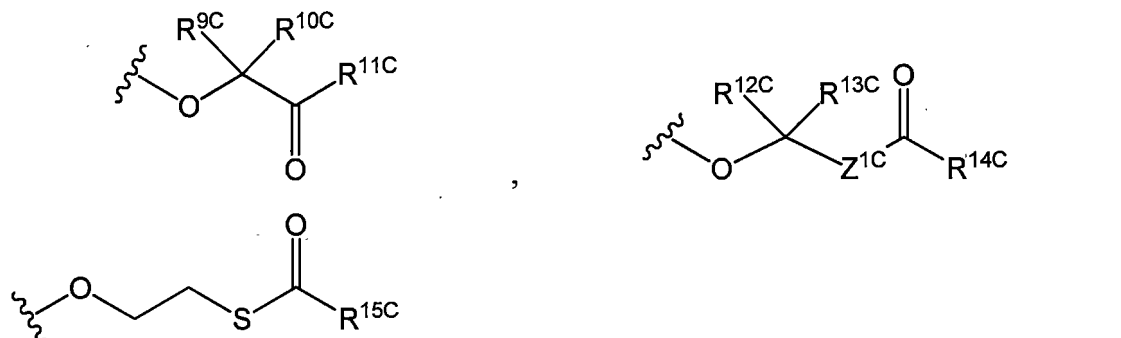


式中、

$B^{1C}$  は、置換されていてもよい複素環式塩基、または保護されたアミノ基を有する置換されていてもよい複素環式塩基であり；

$R^{1C}$  および  $R^{2C}$  は独立して、 $O^-$ 、 $OH$ 、置換されていてもよい  $C_1 \sim 6$  アルコキシ、

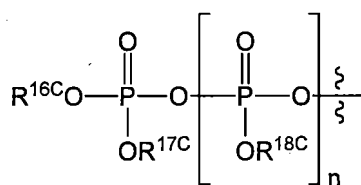
【化 2】



、置換されていてもよい  $N$  - 結合アミノ酸および置換されていてもよい  $N$  - 結合アミノ酸エステル誘導体からなる群から選択され；あるいは

$R^{1C}$  は、

【化 3】



であり、 $R^{2C}$  は、 $O^-$  または  $OH$  であり；

$R^{3C}$  は、置換されていてもよい  $C_1 \sim 6$  アルキル、置換されていてもよい  $C_2 \sim 6$  アルケニル、置換されていてもよい  $C_2 \sim 6$  アルキニル、置換されていてもよい  $C_3 \sim 6$  シクロアルキル、置換されていてもよい  $-O-C_1 \sim 6$  アルキル、置換されていてもよい  $-O-C_3 \sim 6$  アルケニル、置換されていてもよい  $-O-C_3 \sim 6$  アルキニルおよびシアノからなる群から選択され；

$R^{4C}$  は、 $OH$ 、 $-OC(=O)R^{11C}$  および置換されていてもよい  $O$  - 結合アミノ酸からなる群から選択され；

$R^{5C}$  はハロゲンであり；

$R^{6C}$  は、水素またはハロゲンであり；

$R^{9C}$ 、 $R^{10C}$ 、 $R^{12C}$  および  $R^{13C}$  は独立して、水素、置換されていてもよい  $C_1 \sim 24$  アルキルおよび置換されていてもよいアリールからなる群より選択され；

$R^{11C}$  および  $R^{14C}$  は独立して、水素、置換されていてもよい  $C_1 \sim 24$  アルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよい  $-O-C_1 \sim 24$  アルキルおよび置換されていてもよい  $-O$  - アリールからなる群より選択され；

$R^{15C}$  は、水素、置換されていてもよい  $C_1 \sim 24$  アルキルおよび置換されていてもよいアリールからなる群より選択され；

$R^{16C}$ 、 $R^{17C}$  および  $R^{18C}$  は独立して、非存在か水素であり；

- - - - - は、単結合または二重結合であり；

- - - - - が、単結合であるとき、各  $R^{7C}$  および各  $R^{8C}$  は独立して、水素またはハロゲンであり；

- - - - - が、二重結合であるとき、各  $R^{7C}$  は、非存在であり、各  $R^{8C}$  は独立

して、水素またはハロゲンであり；

$Z^{1C}$  は、O または S であり；

$R^{1C}$  は、置換されていてもよい  $C_1 \sim C_4$  - アルキルであり；

$n$  は 0 または 1 である。

【請求項 2】

$R^{1C}$  が O - または OH である、請求項 1 に記載の化合物。

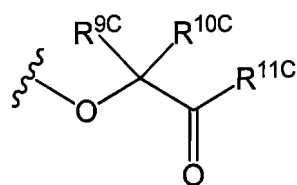
【請求項 3】

$R^{1C}$  が置換されていてもよい  $C_1 \sim C_6$  アルコキシである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

$R^{1C}$  が下記構造式で示される、請求項 1 に記載の化合物。

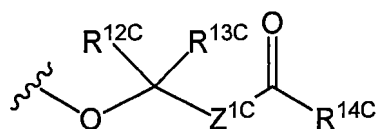
【化 4】



【請求項 5】

$R^{1C}$  が下記構造式で示される、請求項 1 に記載の化合物。

【化 5】



【請求項 6】

$R^{2C}$  が O - または OH である、請求項 1 から 5 のいずれかに記載の化合物。

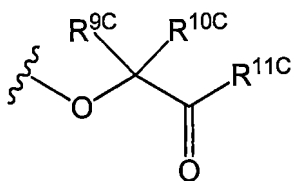
【請求項 7】

$R^{2C}$  が置換されていてもよい  $C_1 \sim C_6$  アルコキシである、請求項 1 から 5 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 8】

$R^{2C}$  が下記構造式で示される、請求項 1 から 5 のいずれかに記載の化合物。

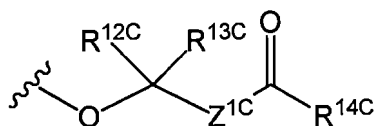
【化 6】



【請求項 9】

$R^{2C}$  が下記構造式で示される、請求項 1 から 5 のいずれかに記載の化合物。

【化 7】



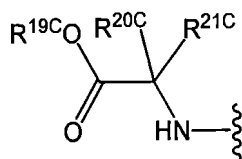
【請求項 10】

前記 N - 結合アミノ酸が、アラニン、アスパラギン、アスパラギン酸、システイン、グ

ルタミン酸、グルタミン、グリシン、プロリン、セリン、チロシン、アルギニン、ヒスチジン、イソロイシン、ロイシン、リシン、メチオニン、フェニルアラニン、トレオニン、トリプトファン、およびバリンからなる群より選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 1】

前記 N - 結合アミノ酸エステルが、下記構造式で示される、請求項 1 に記載の化合物：  
【化 8】



式中、

$R^{19C}$  は、水素、置換されていてもよい  $C_1 \sim 6$  - アルキル、置換されていてもよい  $C_3 \sim 6$  シクロアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアリール ( $C_1 \sim 6$  アルキル) および置換されていてもよいハロアルキルからなる群より選択され；

$R^{20C}$  は、水素、置換されていてもよい  $C_1 \sim 6$  アルキル、置換されていてもよい  $C_1 \sim 6$  ハロアルキル、置換されていてもよい  $C_3 \sim 6$  シクロアルキル、置換されていてもよい  $C_6$  アリール、置換されていてもよい  $C_{10}$  アリールおよび置換されていてもよいアリール ( $C_1 \sim 6$  アルキル) からなる群より選択され；

$R^{21C}$  は、水素または置換されていてもよい  $C_1 \sim 4$  - アルキルであり；あるいは  $R^{20C}$  および  $R^{21C}$  は一緒になって、置換されていてもよい  $C_3 \sim 6$  シクロアルキルを形成する。

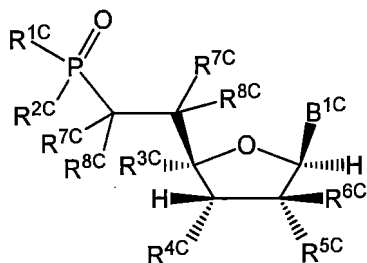
【請求項 1 2】

前記 O - 結合アミノ酸が、アラニン、アスパラギン、アスパラギン酸、システイン、グルタミン酸、グルタミン、グリシン、プロリン、セリン、チロシン、アルギニン、ヒスチジン、イソロイシン、ロイシン、リシン、メチオニン、フェニルアラニン、トレオニン、トリプトファン、バリン、オルニチン、ハイブシン、2 - アミノイソ酪酸、デヒドロアラニン、 $\alpha$  - アミノ酪酸、シトルリン、 $\beta$  - アラニン、 $\gamma$  - エチル - グリシン、 $\gamma$  - プロピル - グリシン、およびノルロイシンからなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

式 ( I I I ) が下記構造を有し、

【化 9】

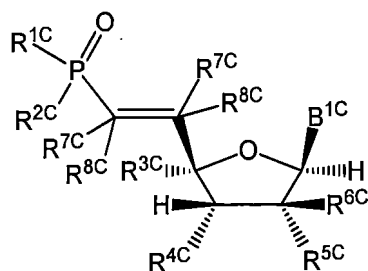


各  $R^{7C}$  および各  $R^{8C}$  が独立して水素またはハロゲンである、請求項 1 から 1 2 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 1 4】

式 ( I I I ) が下記構造を有し、

## 【化 1 0】



各  $R^{7C}$  が非存在であり、各  $R^{8C}$  が独立して水素またはハロゲンである、請求項 1 から 12 のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 15】

両方の  $B^C$  が水素である、請求項 14 に記載の化合物。

## 【請求項 16】

一方の  $B^C$  がハロゲンであり、もう一方の  $B^C$  が水素である、請求項 14 に記載の化合物。

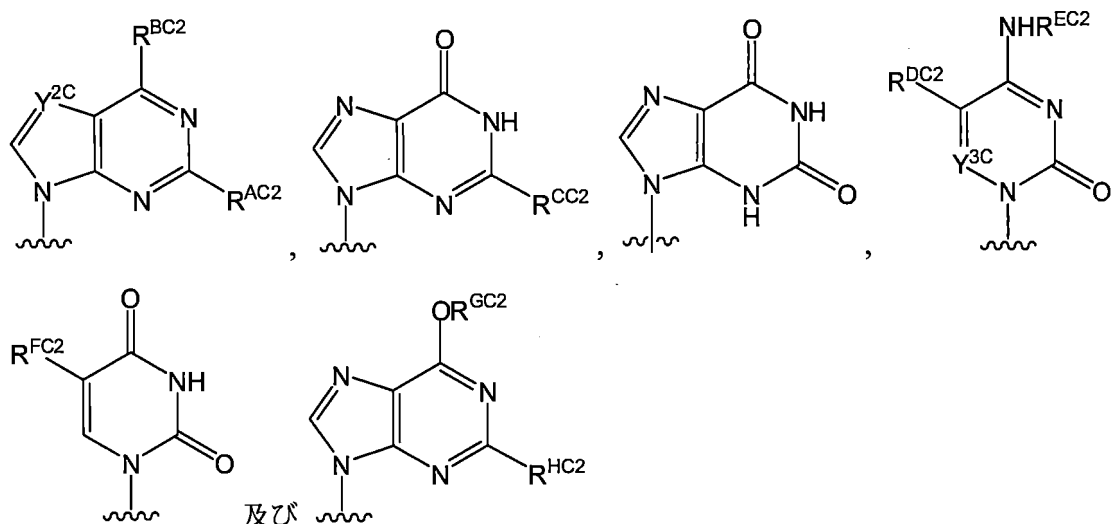
## 【請求項 17】

両方の  $B^C$  がハロゲンである、請求項 14 に記載の化合物。

## 【請求項 18】

$B^{1C}$  が下記構造からなる群より選択される、請求項 1 から 17 のいずれかに記載の化合物：

## 【化 1 1】



式中、

$R^{AC2}$  が、水素、ハロゲンおよび  $NHR^{JC2}$  からなる群より選択され、 $R^{JC2}$  が、水素、 $-C(=O)R^{KC2}$  および  $-C(=O)OR^{LC2}$  からなる群より選択され；

$R^{BC2}$  が、ハロゲンまたは  $NHR^{WC2}$  であり、 $R^{WC2}$  が、水素、置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル、置換されていてもよい  $C_{2-6}$  アルケニル、置換されていてもよい  $C_{3-8}$  シクロアルキル、 $-C(=O)R^{MC2}$  および  $-C(=O)OR^{NC2}$  からなる群より選択され；

$R^{CC2}$  が、水素または  $NHR^{OC2}$  であり、 $R^{OC2}$  が、水素、 $-C(=O)R^{PC2}$  および  $-C(=O)OR^{QC2}$  からなる群より選択され；

$R^{DC2}$  が、水素、ハロゲン、置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル、置換されていてもよい  $C_{2-6}$  アルケニルおよび置換されていてもよい  $C_{2-6}$  アルキニルからなる群より選択され；

$R^{EC2}$  が、水素、ヒドロキシ、置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル、置換されて

いてもよい  $C_3 \sim 8$  シクロアルキル、 $-C(=O)R^{RC2}$  および  $-C(=O)OR^{SC2}$  からなる群より選択され；

$R^{FC2}$  が、水素、ハロゲン、置換されていてもよい  $C_1 \sim 6$  アルキル、置換されていてもよい  $C_2 \sim 6$  アルケニルおよび置換されていてもよい  $C_2 \sim 6$  アルキニルからなる群より選択され；

$Y^{2C}$  および  $Y^{3C}$  は独立して、N または  $CR^{IC2}$  であり、 $R^{IC2}$  が、水素、ハロゲン、置換されていてもよい  $C_1 \sim 6$  - アルキル、置換されていてもよい  $C_2 \sim 6$  - アルケニルおよび置換されていてもよい  $C_2 \sim 6$  - アルキニルからなる群より選択され；

$R^{GC2}$  が、置換されていてもよい  $C_1 \sim 6$  アルキルであり；

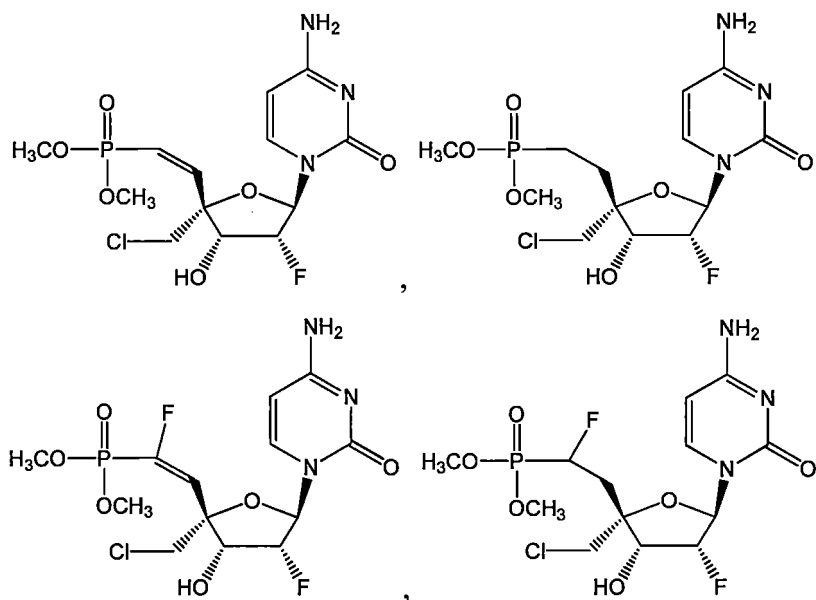
$R^{HC2}$  が、水素または  $NHR^{TC2}$  であり、 $R^{TC2}$  は独立して、水素、 $-C(=O)R^{UC2}$  および  $-C(=O)OR^{VC2}$  からなる群より選択され；

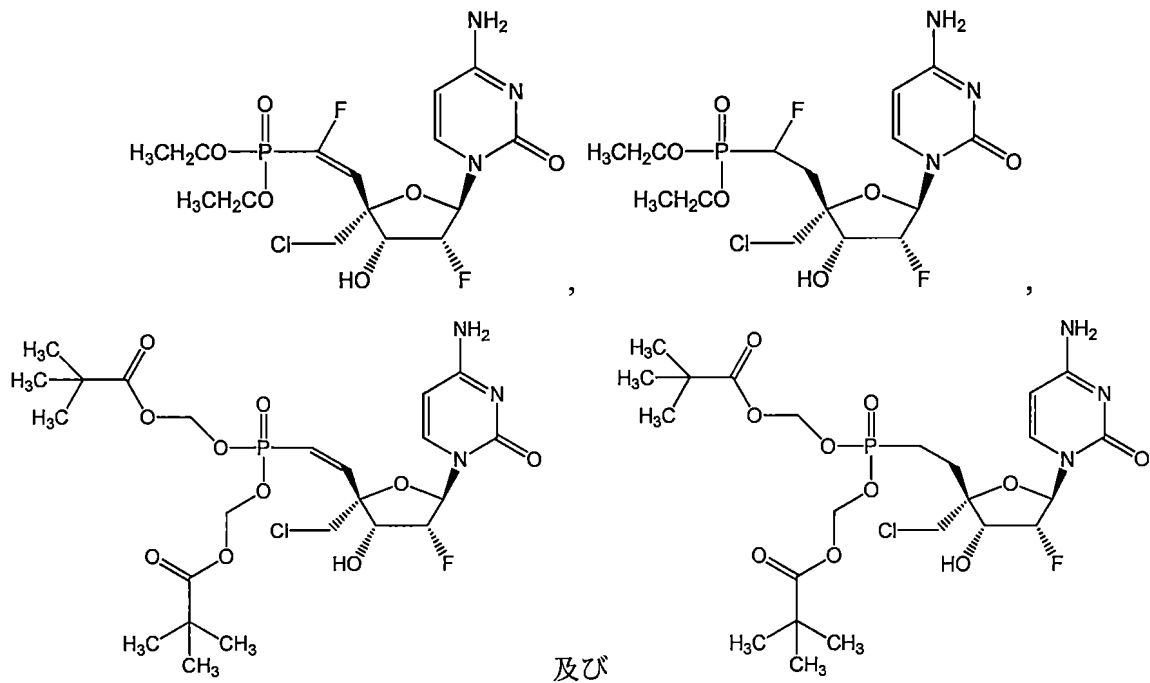
$R^{KC2}$ 、 $R^{LC2}$ 、 $R^{MC2}$ 、 $R^{NC2}$ 、 $R^{PC2}$ 、 $R^{QC2}$ 、 $R^{RC2}$ 、 $R^{SC2}$ 、 $R^{UC2}$  および  $R^{VC2}$  は独立して、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_2 \sim 6$  アルケニル、 $C_2 \sim 6$  アルキニル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルケニル、 $C_6 \sim 10$  アリール、ヘテロアリール、ヘテロアリシクリル、アリール ( $C_1 \sim 6$  アルキル)、ヘテロアリール ( $C_1 \sim 6$  アルキル) およびヘテロアリシクリル ( $C_1 \sim 6$  アルキル) からなる群より選択される。

【請求項 19】

式 (III) の化合物が、下記からなる群より選択される化合物またはその医薬的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【化 12】

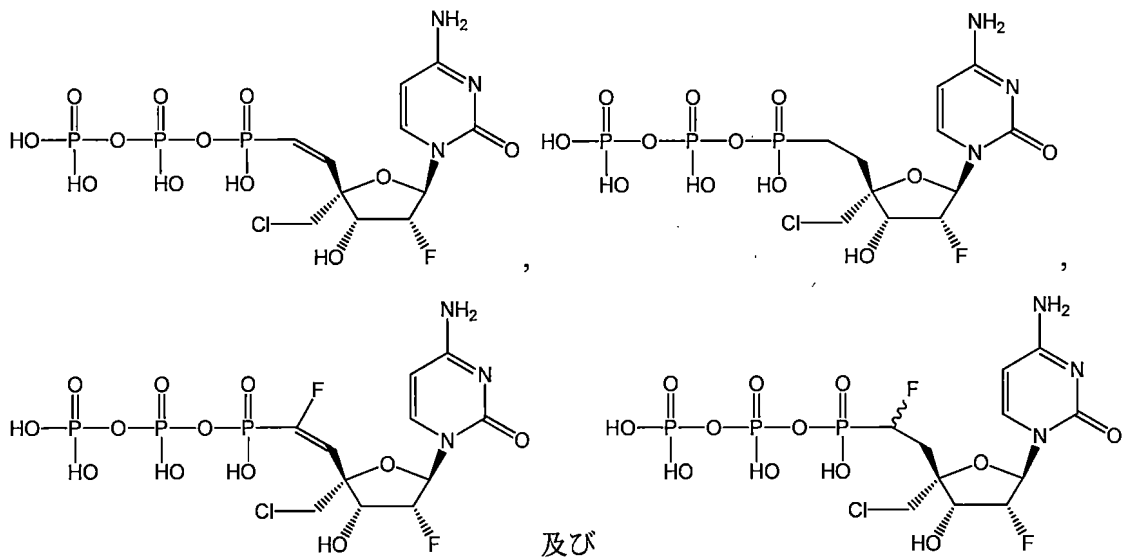




## 【請求項 20】

式 ( I I I ) の化合物が、下記からなる群より選択される化合物またはその医薬的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【化 1 3】



## 【請求項 21】

有効量の請求項 1 から 20 のいずれかに記載の化合物またはその医薬的に許容される塩、および医薬的に許容される担体、希釈剤、賦形剤またはその組み合わせを含む医薬組成物。

## 【請求項 22】

パラミクソウイルスによるウイルス感染症およびオルソミクソウイルスによるウイルス感染症から選択されるウイルス感染症を改善または処置するための、請求項 21 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 23】

パラミクソウイルスおよびオルソミクソウイルスから選択されるウイルスの複製を阻害するための、請求項 21 に記載の医薬組成物。