

【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3年10月28日(2021.10.28)

【公表番号】特表2020-534361(P2020-534361A)

【公表日】令和2年11月26日(2020.11.26)

【年通号数】公開・登録公報2020-048

【出願番号】特願2020-537296(P2020-537296)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/53 (2006.01)

C 0 7 H 11/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

C 0 7 H 3/02 (2006.01)

C 0 7 H 5/02 (2006.01)

C 0 7 H 7/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/661 (2006.01)

A 6 1 K 31/7004 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 487/04 1 4 0

A 6 1 K 31/53

C 0 7 H 11/04

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 31/14

C 0 7 H 3/02

C 0 7 H 5/02

C 0 7 H 7/06

A 6 1 K 31/661

A 6 1 K 31/7004

【手続補正書】

【提出日】令和3年9月17日(2021.9.17)

【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

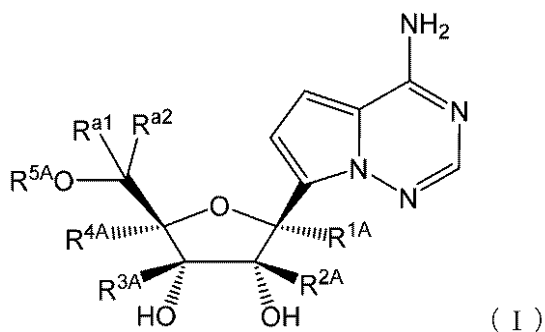
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の構造を有する式(Ⅰ)の化合物又はその薬学的に許容される塩であって、

【化 1】



式中、

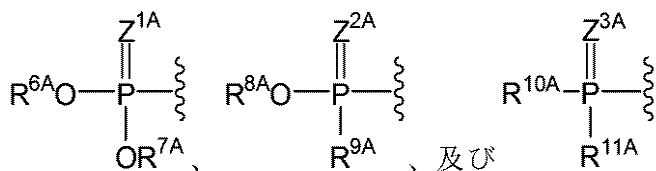
R^{1A} は、フルオロ、シアノ、アジド、置換されていない C_{2-4} アルケニル、置換されていない C_{2-4} アルキニル、置換されていない C_{1-4} アルコキシ、置換されていない C_{1-4} アルキル、及び置換された C_{1-4} アルキルからなる群から選択され、前記置換された C_{1-4} アルキルは、フルオロ及びクロロから選択される 1 つ以上の置換基で置換されており、

R^{4A} は、フルオロ、シアノ、アジド、置換されていない C_{2-4} アルケニル、置換されていない C_{2-4} アルキニル、置換されていない C_{1-4} アルコキシ、置換されていない C_{1-4} アルキル、及び置換された C_{1-4} アルキルからなる群から選択され、前記置換された C_{1-4} アルキルは、フルオロ及びクロロから選択される 1 つ以上の置換基で置換されており、

R^{2A} 、 R^{3A} 、 R^{a1} 及び R^{a2} は、それぞれ独立して、水素又は重水素であり、

R^{5A} は、水素、任意置換されたアシル、任意置換された O-結合型アミノ酸、

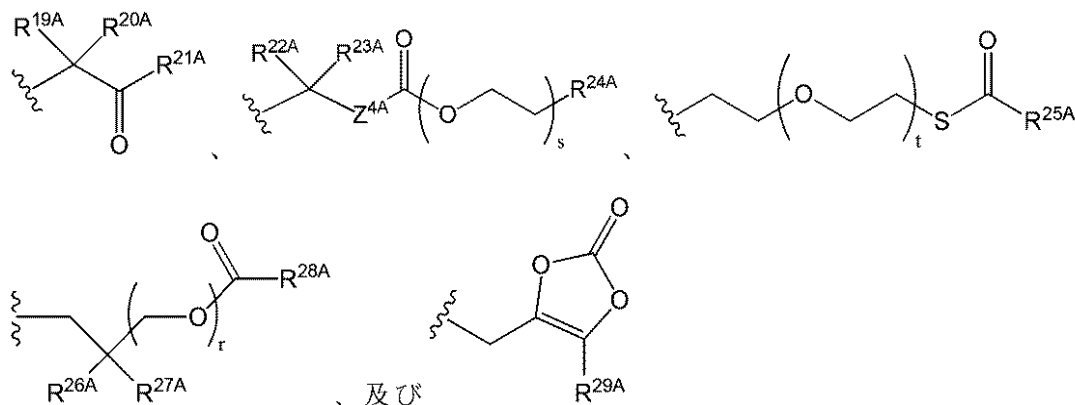
【化 2】



からなる群から選択され、

R^{6A} 、 R^{7A} 、及び R^{8A} は、独立して、存在しない、水素、任意置換された C_{1-24} アルキル、任意置換された C_{3-24} アルケニル、任意置換された C_{3-24} アルキニル、任意置換された C_{3-6} シクロアルキル、任意置換された C_{3-6} シクロアルケニル、任意置換されたアリール、任意置換されたヘテロアリール、任意置換されたアリール (C_{1-6} アルキル)、任意置換された $^*-(CR^{15A}R^{16A})_p-O-C_{1-24}$ アルキル、任意置換された $^*-(CR^{17A}R^{18A})_q-O-C_{1-24}$ アルケニル、

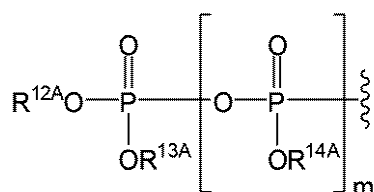
【化 3】



からなる群から選択されるか、又は

R^{6A} は、

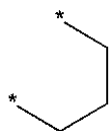
【化 4】



であり、かつ R^{7A} は、存在しないか若しくは水素であるか、又は

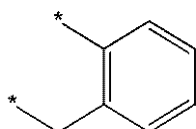
R^{6A} 及び R^{7A} は、一緒になって、任意置換された

【化 5】



及び任意置換された

【化 6】



からなる群から選択される部分を形成し、 R^{6A} 及び R^{7A} に結合した酸素、リン、及び前記部分は、6員～10員の環系を形成し、

R^{9A} は、独立して、任意置換された C_{1-24} アルキル、任意置換された C_{2-24} アルケニル、任意置換された C_{2-24} アルキニル、任意置換された C_{3-6} シクロアルキル、任意置換された C_{3-6} シクロアルケニル、 $NR^{30A}R^{31A}$ 、任意置換された N-結合型アミノ酸、及び任意置換された N-結合型アミノ酸エステル誘導体からなる群から選択され、

R^{10A} 及び R^{11A} は、独立して、任意置換された N-結合型アミノ酸又は任意置換された N-結合型アミノ酸エステル誘導体であり、

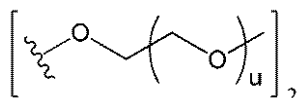
R^{12A} 、 R^{13A} 、及び R^{14A} は、独立して、存在しないか又は水素であり、

各 R^{15A} 、各 R^{16A} 、各 R^{17A} 、及び各 R^{18A} は、独立して、水素、任意置換された C_{1-24} アルキル、又はアルコキシであり、

R^{19A} 、 R^{20A} 、 R^{22A} 、及び R^{23A} は、独立して、水素、任意置換された C_{1-24} アルキル、及び任意置換されたアリールからなる群から選択され、

R^{21A} 及び R^{24A} は、独立して、水素、任意置換された C_{1-24} アルキル、任意置換されたアリール、任意置換された $-O-C_{1-24}$ アルキル、任意置換された $-O-$ アリール、任意置換された $-O-$ ヘテロアリール、任意置換された $-O-$ 単環式ヘテロシクリル、及び

【化 7】



からなる群から選択され、

R^{25A} 及び R^{29A} は、独立して、水素、任意置換された C_{1-24} アルキル、及び任意置換されたアリールからなる群から選択され、

R^{26A} 及び R^{27A} は、独立して、 $-C \equiv N$ であるか、又は C_{2-8} オルガニルカルボニル、 C_{2-8} アルコキシカルボニル、及び C_{2-8} オルガニルアミノカルボニルからなる群から選択される任意置換された置換基であり、

R^{28A} は、水素、任意置換された C_{1-24} アルキル、任意置換された C_{2-24} アルケニル、任意置換された C_{2-24} アルキニル、任意置換された C_{3-6} シクロアルキ

ル、及び任意置換された $C_3 \sim 6$ シクロアルケニルからなる群から選択され、

R^{30A} 及び R^{31A} は、独立して、水素、任意置換された $C_1 \sim 24$ アルキル、任意置換された $C_2 \sim 24$ アルケニル、任意置換された $C_2 \sim 24$ アルキニル、任意置換された $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、及び任意置換された $C_3 \sim 6$ シクロアルケニルからなる群から選択され、

m 及び t は、独立して、0 又は 1 であり、

p 及び q は、独立して、1、2、及び 3 からなる群から選択され、

r は、1 又は 2 であり、

s は、0、1、2、又は 3 であり、

u は、1 又は 2 であり、 Z^{1A} 、 Z^{2A} 、 Z^{3A} 、及び Z^{4A} は、独立して、0 又は S である、化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

R^{1A} がシアノである、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 3】

R^{4A} が、フルオロ、シアノ、アジド、及び置換されていない $C_1 \sim 4$ アルキルからなる群から選択される、請求項 1 又は 2 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 4】

R^{4A} が前記置換された $C_1 \sim 4$ アルキルである、請求項 3 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 5】

前記置換された $C_1 \sim 4$ アルキルが、 $-(CH_2)_{1 \sim 4}Cl$ 、 $-(CH_2)_{1 \sim 4}F$ 及び $-CHF_2$ からなる群から選択される、請求項 4 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 6】

前記置換された $C_1 \sim 4$ アルキルが、クロロメチル、フルオロメチル、及びジフルオロメチルからなる群から選択される、請求項 5 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

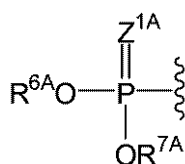
【請求項 7】

R^{5A} が水素である、請求項 1 ～ 6 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 8】

R^{5A} が

【化 8】



である、請求項 1 ～ 6 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 9】

R^{6A} 及び R^{7A} が水素である、請求項 8 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 10】

R^{6A} が

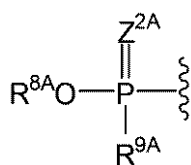
$$\text{R}^{12}\text{A}-\text{O}-\text{P}\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{OR}^{13}\text{A} \end{array}\right)-\left[\text{O}-\text{P}\left(\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{OR}^{14}\text{A} \end{array}\right)\right]_m$$

【請求項 1 1】

【請求項 1 2】

【請求項 13】

【化 1 0】



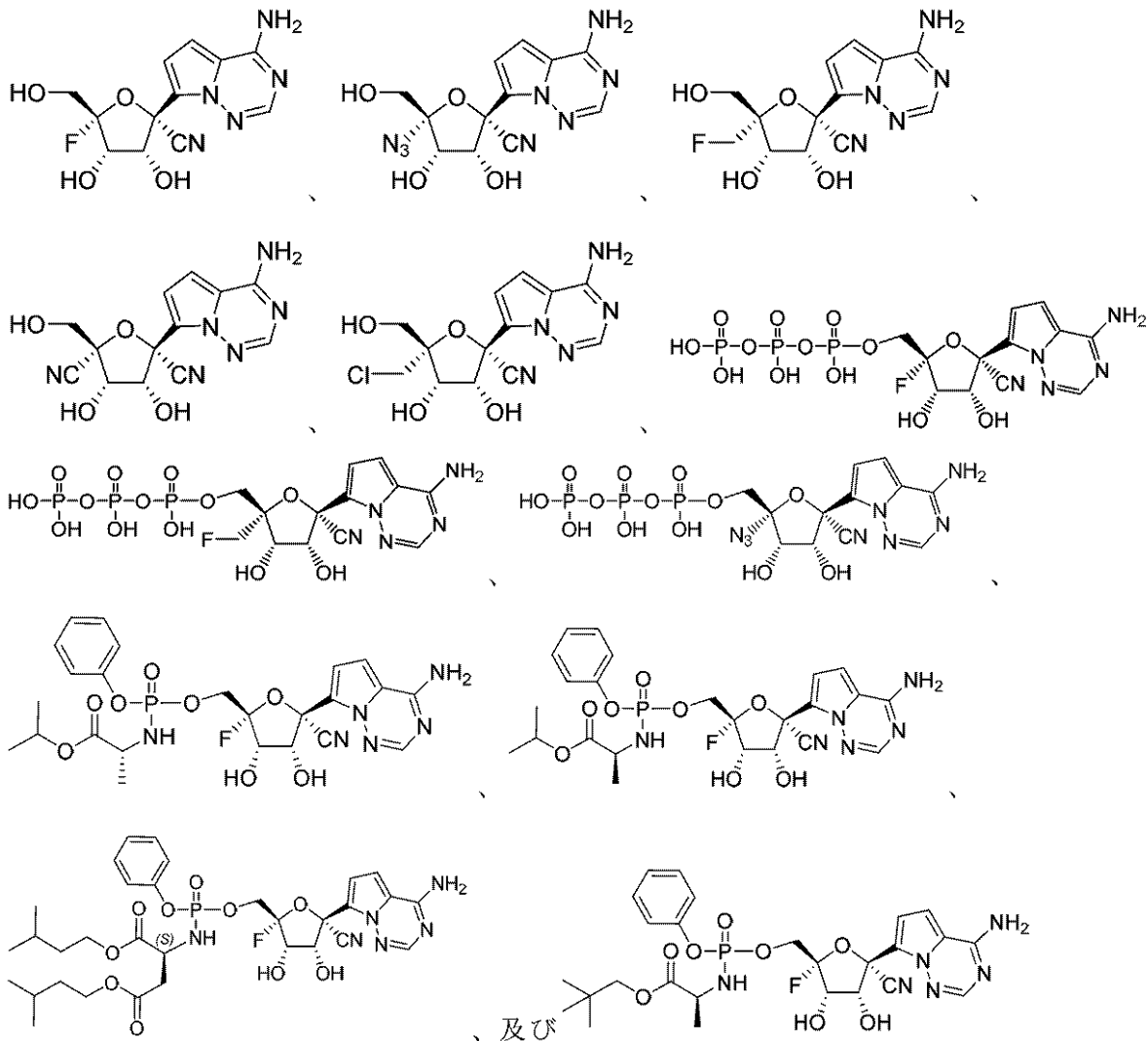
【請求項 14】

【請求項 15】

【請求項 16】

前記式（Ⅰ）の化合物が、

【化 1 1】



又はそれらのうちのいずれかの薬学的に許容される塩からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 7】

有効量の請求項 1 ~ 1 6 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される担体、希釈剤、賦形剤、又はこれらの組み合わせと、を含む、医薬組成物。

【請求項 1 8】

ピコルナウイルス科ウイルス感染症、フラビウイルス科ウイルス感染症、フィロウィルス科ウイルス感染症、ニューモウィルス科ウイルス感染症、又はコロナウィルス科ウイルス感染症を寛解させる又は治療するための医薬の調製における、有効量の請求項 1 ~ 1 6 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩の使用。

【請求項 1 9】

前記ピコルナウイルス科ウイルス感染症が、ライノウイルス感染症である、請求項 1 8 に記載の使用。

【請求項 2 0】

前記フラビウイルス科ウイルス感染症が、デング熱ウイルス感染症又はヘパシウイルス感染症である、請求項 1 8 に記載の使用。

【請求項 2 1】

前記フィロウィルス科ウイルス感染症が、エボラウイルス感染症である、請求項 1 8 に記載の使用。

【請求項 2 2】

前記ニューモウイルス科ウイルス感染症が、ヒト呼吸器合胞体ウイルス（HRSV）感染症である、請求項 18 に記載の使用。

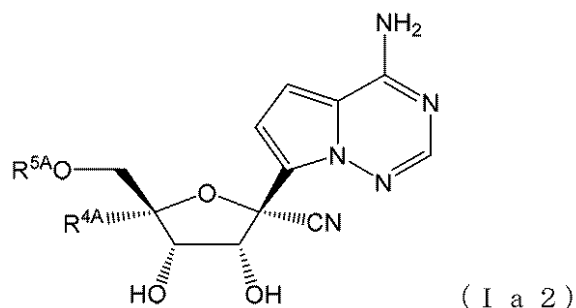
【請求項 23】

前記コロナウイルス科ウイルス感染症が、ヒト - コロナウイルス又は - コロナウイルス感染症である、請求項 18 に記載の使用。

【請求項 24】

以下の構造を有する式（I a 2）の化合物又はその薬学的に許容される塩であって、

【化 12】

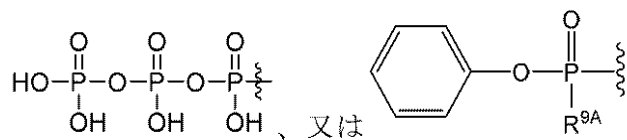


式中、

R^{4A} は、フルオロ、シアノ、アジド、並びにフルオロ及びクロロから選択される 1 つ以上の置換基で置換された C₁ ~ 4 アルキルからなる群から選択され、

R^{5A} は、水素、

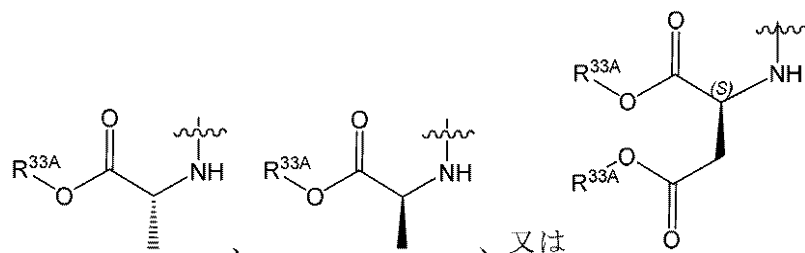
【化 13】



であり、

R^{9A} は、

【化 14】



であり、

R^{33A} は、C₁ ~ 6 アルキルである、化合物又はその薬学的に許容される塩。