

【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4月23日(2020.4.23)

【公表番号】特表2019-507774(P2019-507774A)

【公表日】平成31年3月22日(2019.3.22)

【年通号数】公開・登録公報2019-011

【出願番号】特願2018-546884(P2018-546884)

【国際特許分類】

C 07 D 207/34	(2006.01)
A 61 K 31/40	(2006.01)
A 61 P 31/20	(2006.01)
A 61 P 31/14	(2006.01)
A 61 P 31/12	(2006.01)
A 61 K 9/14	(2006.01)
A 61 K 45/00	(2006.01)
C 07 D 403/12	(2006.01)
A 61 K 31/4192	(2006.01)
C 07 D 207/36	(2006.01)
C 07 D 249/04	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 K 31/4439	(2006.01)
C 07 D 401/12	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
C 07 D 417/12	(2006.01)
A 61 K 31/427	(2006.01)
A 61 K 31/4184	(2006.01)
A 61 K 31/4178	(2006.01)
A 61 K 31/395	(2006.01)

【F I】

C 07 D 207/34	C S P
A 61 K 31/40	
A 61 P 31/20	
A 61 P 31/14	
A 61 P 31/12	
A 61 K 9/14	
A 61 K 45/00	
C 07 D 403/12	
A 61 K 31/4192	
C 07 D 207/36	
C 07 D 249/04	5 0 3
A 61 K 31/5377	
A 61 K 31/4439	
C 07 D 401/12	
A 61 K 31/506	
C 07 D 417/12	
A 61 K 31/427	
A 61 K 31/4184	
A 61 K 31/4178	
A 61 K 31/395	

【手続補正書】

【提出日】令和2年3月9日(2020.3.9)

【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

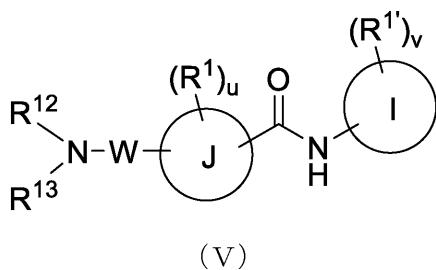
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の式:

【化1】



の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくはプロドラッグであって、

R¹及びR^{1'}は、炭素と結合するとき、それらは、独立して、水素、ハロゲン、S F₅、C F₃、ヒドロキシ、N(R')S(O)₂R'、S(O)₂R'、S(O)₂N(R')₂、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₂₋₆アルケニル、シアノ、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、C₁₋₆アルキル、アリールアルコキシカルボニル、カルボキシ、C₁₋₆ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、またはC₁₋₆ヒドロキシアルキルであり、

R¹及びR^{1'}が、窒素と結合するとき、それらは、独立して、水素、C₂₋₆アルコキシ、C₃₋₆アルコキシアルキル、C₂₋₆アルケニル、アルコキシカルボニル、カルボニルアルキル、カルボニルアリール、C₁₋₆アルキル、ヘテロシクリルアルキル、C₂₋₆ヒドロキシアルキル、またはS(O)₂R'であり、

各R'は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、もしくはアリールアルキルであるか、または2つのR'が同じ窒素原子上に存在する場合、それらは、一緒に、任意選択でN、O、またはSヘテロ原子を含有するC₃₋₆環を形成することができ、

H以外の前記R'基は、任意選択で、1つ以上の置換基で置換されてもよく、これらの置換基は、独立して、ハロ、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆ヒドロキシアルキル、ヒドロキシル、カルボキシル、アシル、アリール、アシルオキシ、アミノ、アミド、カルボキシル誘導体、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、アルコキシ、アルコキシアルキル、アリールオキシ、ニトロ、シアノ、スルホン酸、チオール、イミン、スルホニル、スルファニル、スルフィニル、スルファモニル、エステル、カルボン酸、アミド、ホスホニル、ホスフィニル、ホスホリル、ホスフィン、チオエステル、チオエーテル、酸ハロゲン化物、無水物、オキシム、ヒドロジン、カルバメート、ホスホン酸、またはホスホネートであり、

u及びvは、独立して、0、1、2、3、4、または5であり、

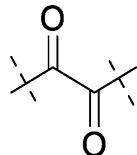
Iは、フェニル、1、2、または3個の窒素原子を含有する6員ヘテロ芳香族環、独立して、N、O、もしくはSである1、2、もしくは3個のヘテロ原子を含有する5員ヘテロ芳香族環、C₄₋₁₄二環式環、アルキルヘテロアリール、またはアルキルアリールで

あり、

Jは、独立して、N、O、またはSである1、2、または3個のヘテロ原子を含有する5員ヘテロ芳香族環、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する6もしくは7員非芳香族環、または6もしくは7員架橋もしくはスピロ縮合環、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する5員非芳香族環、あるいは独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する4員環であり、

Wは、

【化2】



であり、

R^{1~2}は、H、C_{1~6}アルキル、C_{1~6}ハロアルキル、C_{2~6}アルケニル、またはC_{2~6}アルキニルであり、

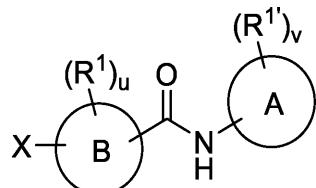
R^{1~3}は、C_{2~6}アルケニル、C_{2~6}アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、アリールアルキル、C_{4~14}二環式環、または独立して、N、O、もしくはSである0、1、もしくは2個のヘテロ原子を含有する6員架橋もしくはスピロ縮合環であり、

R^{1~3}は、任意選択で、各々が、独立して、水素、ハロゲン、CF₃、SF₅、ヒドロキシ、N(R')₂S(O)₂R'、S(O)₂R'、S(O)₂N(R')₂、C(O)R'、C_{1~6}アルコキシ、C_{1~6}ハロアルコキシ、シアノ、アジド、C_{2~6}アルキニル、C_{3~6}アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、C_{1~6}アルキル、シクロアルキル、アリールアルコキシカルボニル、カルボキシル、ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、C_{1~6}ヒドロキシアルキル、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、及び置換ヘテロアリールからなる群から選択される、1つ以上の置換基で置換され、前記置換アリール及び置換ヘテロアリール上の置換基は、ハロゲン、SF₅、CF₃、ヒドロキシ、N(R')₂S(O)₂R'、S(O)₂R'、S(O)₂N(R')₂、C(O)R'、C_{1~6}アルコキシ、シアノ、アジド、C_{2~6}アルキニル、C_{3~6}アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、及びC_{1~6}アルキルからなる群から選択されるか、

あるいはR^{1~2}及びR^{1~3}は、それらが結合する窒素と一緒に、任意選択で、各々が、独立して、水素、ハロゲン、CF₃、ヒドロキシ、N(R')₂S(O)₂R'、S(O)₂R'、S(O)₂N(R')₂、C_{1~6}アルコキシ、シアノ、アジド、C_{2~6}アルキニル、C_{3~6}アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、C_{1~6}アルキル、アリールアルコキシカルボニル、カルボキシ、C_{1~6}ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、及びC_{1~6}ヒドロキシアルキルからなる群から選択される、1つ以上の置換基で置換された3~4員環を形成する、化合物、あるいは

以下の式：

【化3】



(I)

の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくはプロドラッグであって、式中、

A は、フェニル、1、2、または3個の窒素原子を含有する6員ヘテロ芳香族環、独立して、N、O、またはSである1、2、または3個の窒素原子を含有する5員ヘテロ芳香族環、C₄₋₁₄二環式環、アルキルヘテロアリール、及びアルキルアリールからなる群から選択され、

B は、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する6もしくは7員環、または6もしくは7員架橋もしくはスピロ縮合環、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する5員環、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する4員環、あるいはC₄₋₁₄二環式環であり、

R¹ 及び R^{1'} が、炭素と結合するとき、それらは、独立して、水素、ハロゲン、SF₅、CF₃、ヒドロキシ、N(R')₂S(O)₂R'、S(O)₂R'、S(O)₂N(R')₂、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₂₋₆アルケニル、シアノ、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、C₁₋₆アルキル、アリールアルコキシカルボニル、カルボキシ、C₁₋₆ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、またはC₁₋₆ヒドロキシアルキルであり、

R¹ 及び R^{1'} が、窒素と結合するとき、それらは、独立して、水素、C₂₋₆アルコキシ、C₃₋₆アルコキシアルキル、C₂₋₆アルケニル、アルコキシカルボニル、カルボニルアルキル、カルボニルアリール、C₁₋₆アルキル、ヘテロシクリルアルキル、C₂₋₆ヒドロキシアルキル、またはS(O)₂R' であり、

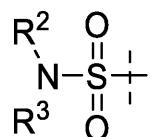
各R'は、独立して、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、もしくはアリールアルキルであるか、または2つのR'が同じ窒素原子上に存在する場合、それらは、一緒に、任意選択でN、O、またはSヘテロ原子を含有するC₃₋₆環を形成することができ、

H以外の前記R'基は、任意選択で、1つ以上の置換基で置換されてもよく、これらの置換基は、独立して、ハロ、C₁₋₆ハロアルキル、C₁₋₆ヒドロキシアルキル、ヒドロキシリル、カルボキシリル、アシル、アリール、アシルオキシ、アミノ、アミド、カルボキシリル誘導体、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、アルコキシ、アルコキシアルキル、アリールオキシ、ニトロ、シアノ、スルホン酸、チオール、イミン、スルホニル、スルファニル、スルフィニル、スルファモニル、エステル、カルボン酸、アミド、ホスホニル、ホスフィニル、ホスホリル、ホスフィン、チオエステル、チオエーテル、酸ハロゲン化物、無水物、オキシム、ヒドロジン、カルバメート、ホスホン酸、またはホスホネートであり、

u 及び v は、独立して、0、1、2、3、4、または5であり、

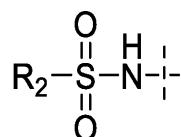
X は、

【化4】



または

【化5】



であり、

R^3 は、H、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{1\sim6}$ ハロアルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、または $C_{2\sim6}$ アルキニルであり、

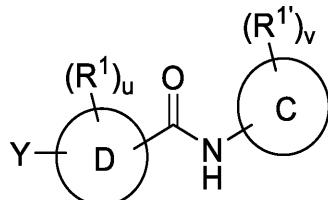
R^2 は、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{1\sim6}$ ハロアルキル、 $C_{2\sim8}$ アルコキシアルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、アリールアルキル、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する、6員環、または6員架橋もしくはスピロ縮合環、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する7員架橋もしくはスピロ縮合環、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する5員環、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する4員環、シクロアルキル、アルキルヘテロアリール、あるいはアルキルアリールであり、

R^2 は、任意選択で、1つ以上の置換基で置換され、これらは各々、独立して、ハロゲン、 SF_3 、 SF_5 、ヒドロキシ、 $N(R')_2S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')_2$ 、 $C_{1\sim6}$ アルコキシ、 $C_{1\sim6}$ ハロアルコキシ、シアノ、アジド、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、 $C_{3\sim6}$ アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、 $C_{1\sim6}$ アルキル、アリールアルコキシカルボニル、カルボキシ、 $C_{1\sim6}$ ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、もしくは $C_{1\sim6}$ ヒドロキシアルキルであり、または R^2 は、任意選択で、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、もしくは置換ヘテロアリールで置換され、前記置換アリール及び置換ヘテロアリール上の置換基は、ハロゲン、 SF_5 、 CF_3 、ヒドロキシ、 $N(R')_2S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')_2$ 、 $C(O)R'$ 、 $C_{1\sim6}$ アルコキシ、シアノ、アジド、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、 $C_{3\sim6}$ アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、及び $C_{1\sim6}$ アルキルからなる群から選択され、あるいは

R^2 及び R^3 は、それらが結合する窒素と一緒に、6~10員二環式もしくは架橋環、3~8飽和環、または5員不飽和環を形成することができ、かかる二環式、架橋、飽和、及び不飽和環は、任意選択で、1つ以上の追加のヘテロ原子を含有し、ここで、各々が、独立して、O、S、またはNであり、任意選択で、1つ以上の置換基で置換され、各々が、独立して、ハロゲン、 CF_3 、ヒドロキシ、 $N(R')_2S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')_2$ 、 $C_{1\sim6}$ アルコキシ、シアノ、アジド、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、 $C_{3\sim6}$ アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、 $C_{1\sim6}$ アルキル、アリールアルコキシカルボニル、カルボキシ、 $C_{1\sim6}$ ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、または $C_{1\sim6}$ ヒドロキシアルキルである、化合物、あるいは

以下の式：

【化6】



(I I)

の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくはプロドラッグであって、

R^1 及び $R^{1'}$ は、式Iに関して定義される通りであり、

u 及び v は、独立して、0、1、2、3、4、または5であり、

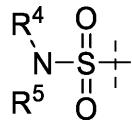
C は、フェニル、1、2、または3個の窒素原子を含有する6員ヘテロ芳香族環、独立して、N、O、もしくはSである1、2、もしくは3個のヘテロ原子を含有する5員ヘテロ芳香族環、 $C_{4\sim14}$ 二環式環、アルキルアリール、またはアルキルヘテロアリールで

あり、

Dは、フェニル、1、2、または3個の窒素原子を含有する6員ヘテロ芳香族環、独立して、N、O、もしくはSである1、2、もしくは3個のヘテロ原子を含有する5員ヘテロ芳香族環、またはC₄₋₁₄二環式環であり、

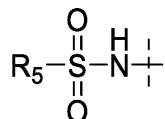
Yは、

【化7】



または

【化8】



であり、

R⁴は、H、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₆アルケニル、又はC₂₋₆アルキニルであり、

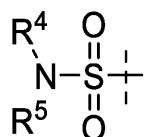
R⁵は、アルキルアリール、アリールアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、アリール、ヘテロアリール、または独立して、N、O、もしくはSである0、1、もしくは2個のヘテロ原子を含有する6員架橋もしくはスピロ縮合環であり、

R⁵は、任意選択で、1つ以上の置換基で置換され、これらの各々が、独立して、ハロゲン、CF₃、SF₅、ヒドロキシ、N(R')₂S(O)₂R'、S(O)₂R'、S(O)₂N(R')₂、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルコキシ、シアノ、アジド、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、C₁₋₆アルキル、シクロアルキル、アリールアルコキシカルボニル、カルボキシ、C₁₋₆ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、もしくはC₁₋₆ヒドロキシアルキルであり、またはR⁵は、任意選択で、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、もしくは置換ヘテロアリールで置換され、前記置換アリール及び置換ヘテロアリール上の置換基は、ハロゲン、SF₅、CF₃、ヒドロキシ、N(R')₂S(O)₂R'、S(O)₂R'、S(O)₂N(R')₂、C(O)R'、C₁₋₆アルコキシ、シアノ、アジド、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、及びC₁₋₆アルキルからなる群から選択され、

Cがフェニルである場合、Dは、フェニルもしくは5員環ヘテロアリールではないか、またはCがフェニルであり、Dがフェニルまたは5員環ヘテロアリールである場合、R⁵は、アルキルアリール、アルケニル、または6員架橋環ではないか、

あるいはYが、

【化9】

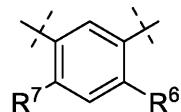


であるとき、R⁴及びR⁵は、それらが結合する窒素と一緒に、任意選択で、1つ以上の置換基で置換された3~4員環を形成し、これらの各々が、独立して、ハロゲン、CF₃、ヒドロキシ、N(R')₂S(O)₂R'、S(O)₂R'、S(O)₂N(R')₂、C₁₋₆アルコキシ、シアノ、アジド、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、C₁₋₆アルキル、アリールアルコキシカルボニル、カルボキシ、C₁₋₆ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル

、またはC₁-₆ヒドロキシアルキルであり

Dは、任意選択で、

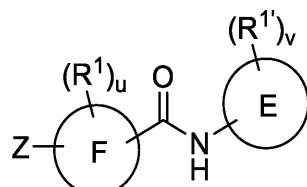
【化10】



であり、式中、R⁶は、H、C1、F、またはBrであり、R⁷は、H、メチル、F、またはC1である、化合物、あるいは

以下の式：

【化11】



(III)

の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくはそのプロドラッグであって、式中、R¹及びR^{1'}は、式Iに関して定義される通りであり、

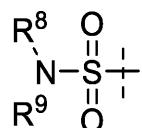
u及びvは、独立して、0、1、2、3、4、または5であり、

Eは、1、2、または3個の窒素原子を含有する6員ヘテロ芳香族環、各々が、独立して、N、O、もしくはSである、1、2、もしくは3個のヘテロ原子を含有する5員ヘテロ芳香族環、C₄-₁₄二環式環、アルキルヘテロアリール、またはアルキルアリールであり、

Fは、独立して、N、O、もしくはSである1、2、もしくは3個のヘテロ原子を含有する5員ヘテロ芳香族環、またはC₄-₁₄二環式環であり、

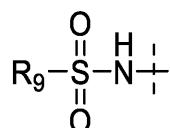
Zは、

【化12】



または

【化13】



であり、

R⁸は、H、C₁-₆アルキル、C₁-₆ハロアルキル、C₂-₆アルケニル、またはC₂-₆アルキニルであり、

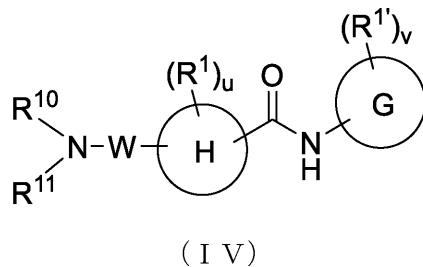
R⁹は、C₁-₆アルキル、C₁-₆ハロアルキル、C₂-₈アルコキシアルキル、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する、6員環、または6員架橋もしくはスピロ縮合環、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する7員架橋もしくはスピロ縮合環、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する5員環、独立して、N、O、また

はSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する4員環、あるいは3員環であり、
R⁹は、任意選択で、1つ以上の置換基で置換され、これらの各々が、独立して、ハロゲン、CF₃、SF₅、ヒドロキシ、N(R')₂S(O)₂R'、S(O)₂R'、S(O)₂N(R')₂、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルコキシ、シアノ、アジド、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、C₁₋₆アルキル、シクロアルキル、アリールアルコキシカルボニル、カルボキシ、C₁₋₆ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、もしくはC₁₋₆ヒドロキシアルキルであり、またはR⁹は、任意選択で、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、もしくは置換ヘテロアリールで置換され、前記置換アリール及び置換ヘテロアリール上の置換基は、ハロゲン、SF₅、CF₃、ヒドロキシ、N(R')₂S(O)₂R'、S(O)₂R'、S(O)₂N(R')₂、C(O)R'、C₁₋₆アルコキシ、シアノ、アジド、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、及びC₁₋₆アルキルからなる群から選択され、あるいは

R⁸及びR⁹は、それらが結合する窒素と一緒に、6~10員二環式もしくは架橋環、または3~8飽和環を形成することができ、かかる二環式、架橋、及び飽和環部分は、任意選択で、独立して、O、S、またはNである1つ以上の追加のヘテロ原子を含有し、かつ任意選択で、各々が、独立して、ハロゲン、CF₃、ヒドロキシ、N(R')₂S(O)₂R'、S(O)₂R'、S(O)₂N(R')₂、C₁₋₆アルコキシ、シアノ、アジド、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、C₁₋₆アルキル、アリールアルコキシカルボニル、カルボキシ、C₁₋₆ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、またはC₁₋₆ヒドロキシアルキルである1つ以上の置換基で置換される、化合物、あるいは

以下の式：

【化14】



(IV)

の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくはプロドラッグであって、

Gは、フェニル、1、2、または3個の窒素原子を含有する6員ヘテロ芳香族環、独立して、N、O、もしくはSである1、2、もしくは3個のヘテロ原子を含有する5員ヘテロ芳香族環、C₄₋₁₄二環式環、アルキルヘテロアリール、またはアルキルアリールであり、

Hは、フェニル、1、2、または3個の窒素原子を含有する6員ヘテロ芳香族環、独立して、N、O、もしくはSである、1、2、もしくは3個のヘテロ原子を任意選択で含有する6員非ヘテロ芳香族環、またはC₄₋₁₄二環式環であり、

R¹及びR^{1'}が、炭素と結合するとき、それらは、独立して、水素、ハロゲン、CF₃、ヒドロキシ、SF₅、N(R')₂S(O)₂R'、S(O)₂R'、S(O)₂N(R')₂、C₁₋₆アルコキシ、シアノ、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、C₁₋₆アルキル、アリールアルコキシカルボニル、カルボキシ、C₁₋₆ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、またはC₁₋₆ヒドロキシアルキルであり、

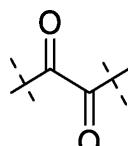
R¹及びR^{1'}が、窒素と結合するとき、それらは、独立して、水素、C₁₋₆アルコキシ、C₃₋₆アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、カルボニルアルキル、カルボニルアリール、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルキニル、C₂₋₆アルケニル、ヘテロ

シクリルアルキル、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル、または $S(O)_2R'$ であり、各 R' は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、もしくはアリールアルキルであるか、または2つの R' が同じ窒素原子上に存在する場合、それらは、一緒に、N、O、またはSを任意選択で含有する C_{3-6} アルキル環を形成することができ、H以外の R' 基は、1つ以上の C_{1-6} ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、またはアルコキシアルキル置換基で置換されてもよく、

u 及び v は、独立して、0、1、2、3、4、または5であり、

W は、

【化15】



であり、

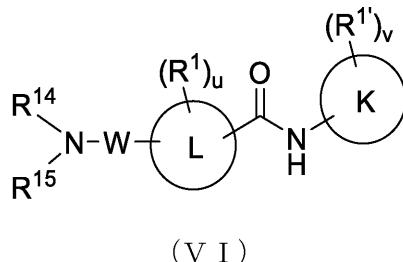
R^{10} は、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-6} アルケニル、または C_{2-6} アルキニルであり、

R^{11} は、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-8} アルコキシアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、アリールアルキル、フェニル、1、2、または3個の窒素原子を含有する6員ヘテロ芳香族環、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する、6員環、または6員架橋もしくはスピロ縮合環、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する7員架橋もしくはスピロ縮合環、独立して、N、O、またはSである1、2、または3個のヘテロ原子を含有する5員ヘテロ芳香族環、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する5員環、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する4員環、3員環、アルキルヘテロアリール、あるいはアルキルアリールであり、

R^{11} は、任意選択で、ハロゲン、 SF_5 、 CF_3 、ヒドロキシ、 $N(R')_2S(O)$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')_2$ 、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、シアノ、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、 C_{1-6} アルキル、アリールアルコキシカルボニル、カルボキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、及び置換ヘテロアリールからなる群から選択される1つ以上の置換基で置換され、前記置換アリール及び置換ヘテロアリール上の置換基は、ハロゲン、 SF_5 、 CF_3 、ヒドロキシ、 $N(R')_2S(O)$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')_2$ 、 $C(O)R'$ 、 C_{1-6} アルコキシ、シアノ、アジド、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、及び C_{1-6} アルキルからなる群から選択され、あるいは

R^{10} 及び R^{11} は、それらが結合する窒素と一緒に、6～10員二環式もしくは架橋環、または3～8飽和環を形成することができ、かかる二環式、架橋、または飽和環部分は、任意選択で、各々、独立して、O、S、またはNである1つ以上の追加のヘテロ原子を含有し、かつ任意選択で、それらの各々が、独立して、ハロゲン、 CF_3 、ヒドロキシ、 $N(R')_2S(O)$ 、 R' 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')_2$ 、 C_{1-6} アルコキシ、シアノ、アジド、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、 C_{1-6} アルキル、アリールアルコキシカルボニル、カルボキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、または C_{1-6} ヒドロキシアルキルである1つ以上の置換基で置換される、化合物、あるいは

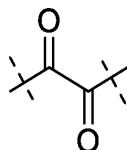
以下の式：
【化16】



の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくはプロドラッグであって、
R¹ 及び R^{1'} は、式 I に関して定義される通りであり、
u 及び v は、独立して、0、1、2、3、4、または5 であり、
K は、1、2、または3 個の窒素原子を含有する6員ヘテロ芳香族環、独立して、N、
O、もしくはS である1、2、もしくは3 個のヘテロ原子を含有する5員ヘテロ芳香族環、
C₄₋₁₄ 二環式環、アルキルヘテロアリール、またはアルキルアリールであり、
L は、独立して、N、O、またはS である1、2、または3 個のヘテロ原子を含有する
5員ヘテロ芳香族環、独立して、N、O、またはS である0、1、または2 個のヘテロ原
子を含有する6 もしくは7 員環、または6 もしくは7 品架橋もしくはスピロ縮合環、独立
して、N、O、またはS である0、1、または2 個のヘテロ原子を含有する5 員環、独立
して、N、O、またはS である0、1、または2 個のヘテロ原子を含有する4 員環、ある
いはC₄₋₁₄ 二環式環であり、

W は、

【化17】



であり、

R¹₄ は、H、C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ ハロアルキル、C₂₋₆ アルケニル、また
はC₂₋₆ アルキニルであり、

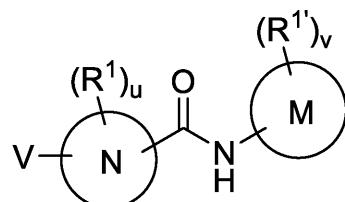
R¹₅ は、C₁₋₆ アルキル、C₁₋₆ ハロアルキル、C₂₋₈ アルコキシアルキル、
独立して、N、O、またはS である0、1、または2 個のヘテロ原子を含有する、6 員環、
または6 品架橋もしくはスピロ縮合環、独立して、N、O、S、またはSe である0、
1、または2 個のヘテロ原子を含有する7 品架橋もしくはスピロ縮合環、独立して、N、
O、S、またはSe である0、1、または2 個のヘテロ原子を含有する5 員環、独立して、
N、O、S、またはSe である0、1、または2 個のヘテロ原子を含有する4 員環であ
り、

R¹₅ は、任意選択で、独立して、ハロゲン、SF₅、CF₃、ヒドロキシ、N(R')
)S(O)₂R'、S(O)₂R'、S(O)₂N(R')₂、C₁₋₆ アルコキシ、C
₁₋₆ ハロアルコキシ、シアノ、アジド、C₂₋₆ アルキニル、C₃₋₆ アルコキシアル
キル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、C₁₋₆ アルキル、シク
ロアルキル、アリールアルコキシカルボニル、カルボキシ、C₁₋₆ ハロアルキル、ヘテ
ロシクリルアルキル、もしくはC₁₋₆ ヒドロキシアルキルである、1つ以上の置換基で
置換されるか、またはR¹₅ は、任意選択で、アリール、置換アリール、ヘテロアリール
、もしくは置換ヘテロアリールで置換され、前記置換アリール及び置換ヘテロアリール上
の置換基は、ハロゲン、SF₅、CF₃、ヒドロキシ、N(R')S(O)₂R'、S(O)₂R'、S
(O)₂R'、S(O)₂N(R')₂、C(O)R'、C₁₋₆ アルコキシ、シアノ、アジド、C₂₋₆ アル
キニル、C₃₋₆ アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アル

コキシカルボニルアルキル、及びC₁~₆アルキルからなる群から選択されるか、あるいはR^{1~4}及びR^{1~5}は、それらが結合する窒素と一緒に、6~10員二環式もしくは架橋環、または3~8員飽和環を形成することができ、かかる二環式、架橋、及び飽和環部分は、任意選択で、独立して、O、S、またはNである1つ以上の追加のヘテロ原子を含有し、かつ任意選択で、各々、独立して、ハロゲン、CF₃、ヒドロキシ、N(R')₂S(O)、R'、S(O)、R'、S(O)、N(R')₂、C₁~₆アルコキシ、シアノ、アジド、C₂~₆アルキニル、C₃~₆アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、C₁~₆アルキル、アリールアルコキシカルボニル、カルボキシ、C₁~₆ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、及びC₁~₆ヒドロキシアルキルからなる群から選択される1つ以上の置換基で置換される、化合物、あるいは

以下の式：

【化18】



(VIII)

の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくはプロドラッグであって、

R¹及びR^{1'}は、式Iに関して定義される通りであり、

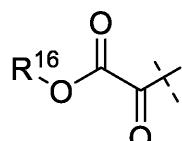
u及びvは、独立して、0、1、2、3、4、または5であり、

Mは、フェニル、1、2、または3個の窒素原子を含有する6員ヘテロ芳香族環、独立して、N、O、S、もしくはSeである1、2、もしくは3個のヘテロ原子を含有する5員ヘテロ芳香族環、C₄~₁₄二環式環、アルキルヘテロアリール、またはアルキルアリールであり、

Nは、フェニル、1、2、または3個の窒素原子を含有する6員ヘテロ芳香族環、独立して、N、O、S、及びSeからなる群から選択される1、2、または3個のヘテロ原子を含有する5員ヘテロ芳香族環、独立して、N、O、S、またはSeである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する6もしくは7員環、または6もしくは7員架橋もしくはスピロ縮合環、独立して、N、O、S、またはSeである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する5員環、独立して、N、O、S、またはSeである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する4員環、あるいはC₄~₁₄二環式環であり、

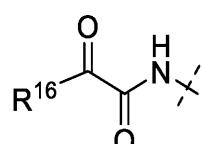
Vは、

【化19】



または

【化20】



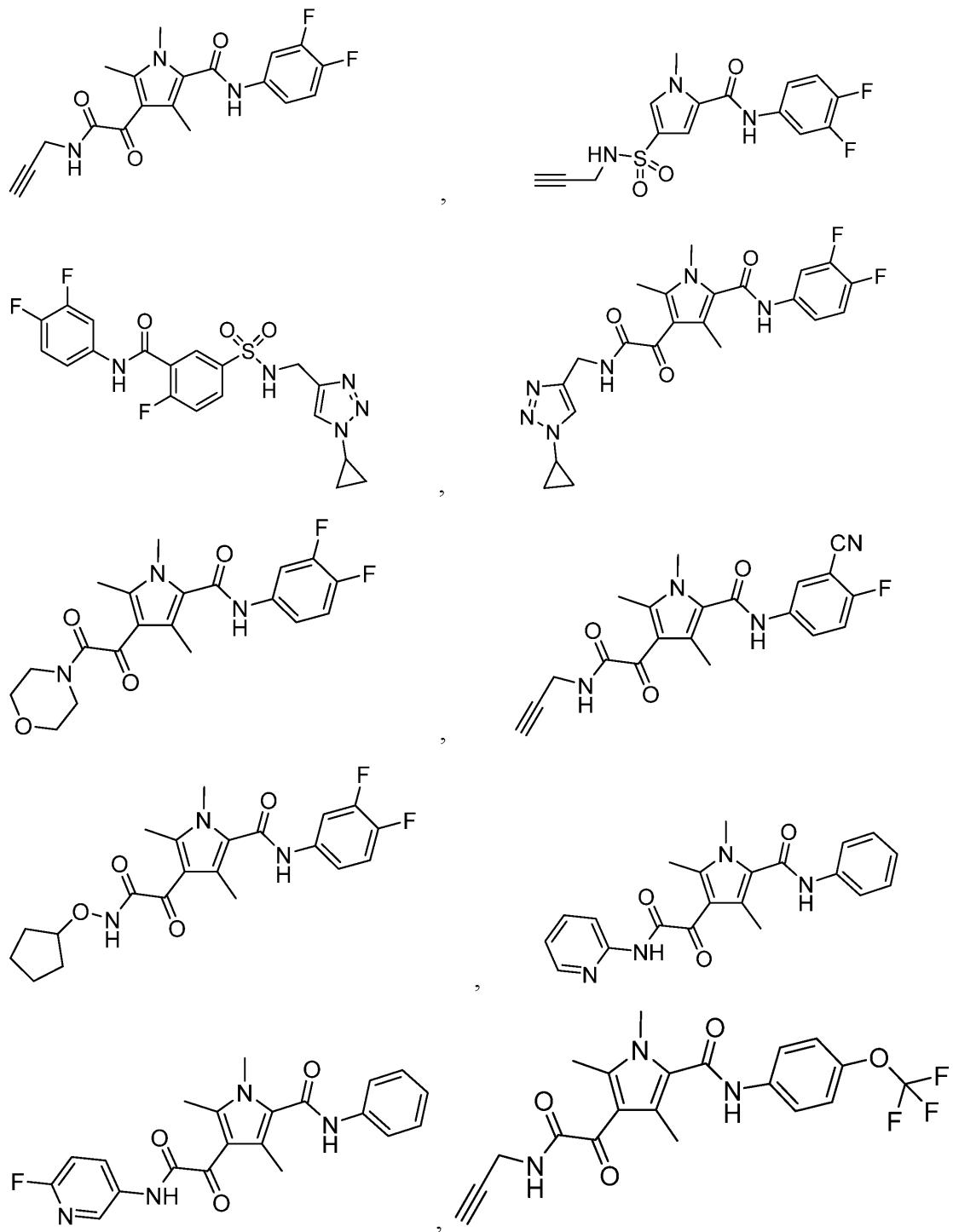
であり、

R¹⁻⁶は、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₂₋₈アルコキシアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、アリール、ヘテロアリール、独立して、N、O、S、またはSeである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する、6員環、または6員架橋もしくはスピロ縮合環、独立して、N、O、S、またはSeである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する5員環、独立して、N、O、S、またはSeである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する4員環、アルキルアリール、アリールアルキル、アルキルヘテロアリール、あるいはアルキルアリールであり、

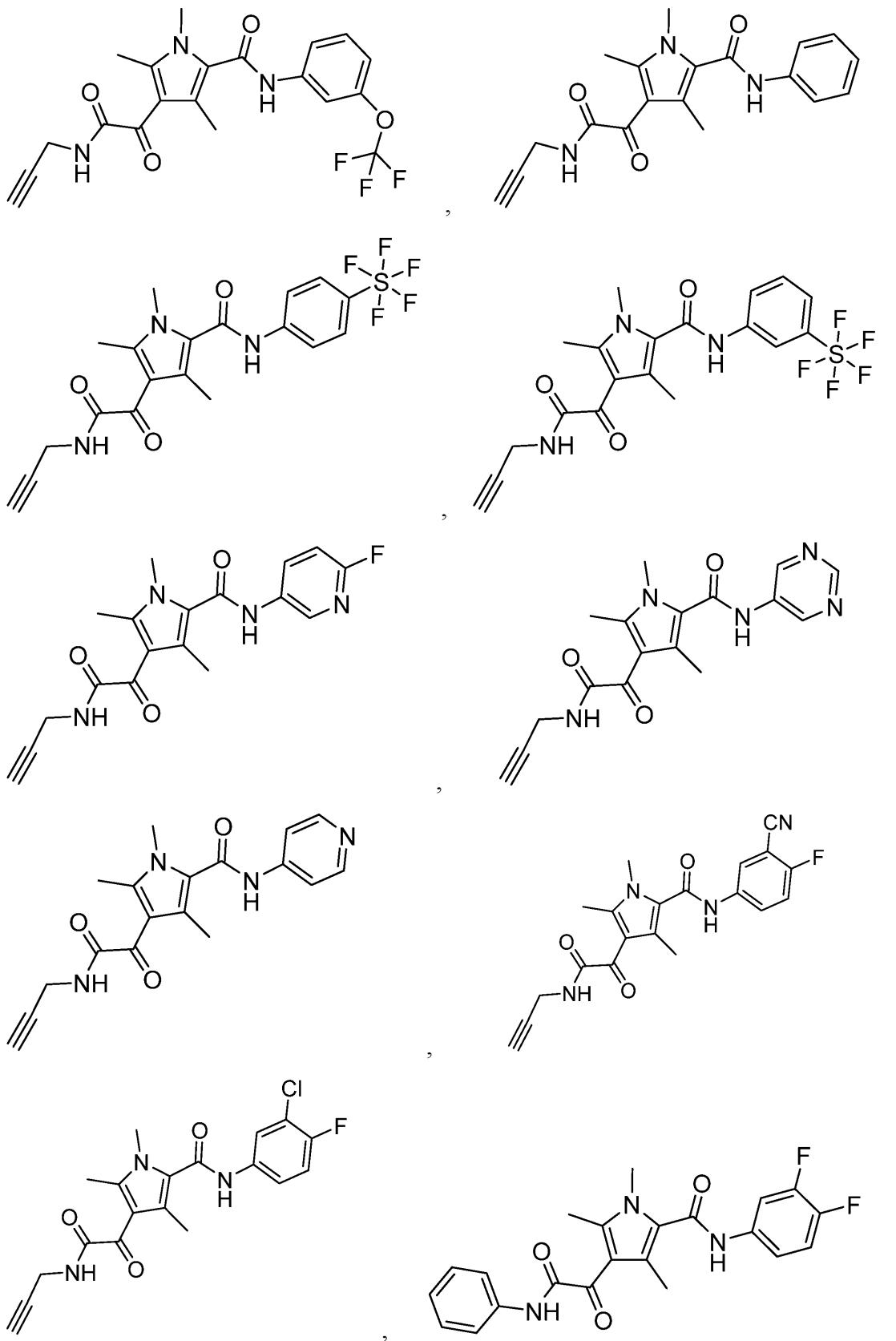
R¹⁻⁶は、任意選択で、ハロゲン、SF₅、CF₃、ヒドロキシ、N(R')S(O)R'、S(O)R'、S(O)₂N(R')₂、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆ハロアルコキシ、C₂₋₆アルケニル、シアノ、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、C₁₋₆アルキル、アリールアルコキシカルボニル、カルボキシ、C₁₋₆ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、C₁₋₆ヒドロキシアルキル、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、及び置換ヘテロアリールからなる群から選択される1つ以上の置換基で置換され、前記置換アリール及び置換ヘテロアリール上の置換基は、ハロゲン、SF₅、CF₃、ヒドロキシ、N(R')S(O)R'、S(O)R'、S(O)₂N(R')₂、C(O)R'、C₁₋₆アルコキシ、シアノ、アジド、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、及びC₁₋₆アルキルからなる群から選択される、化合物。

【請求項2】

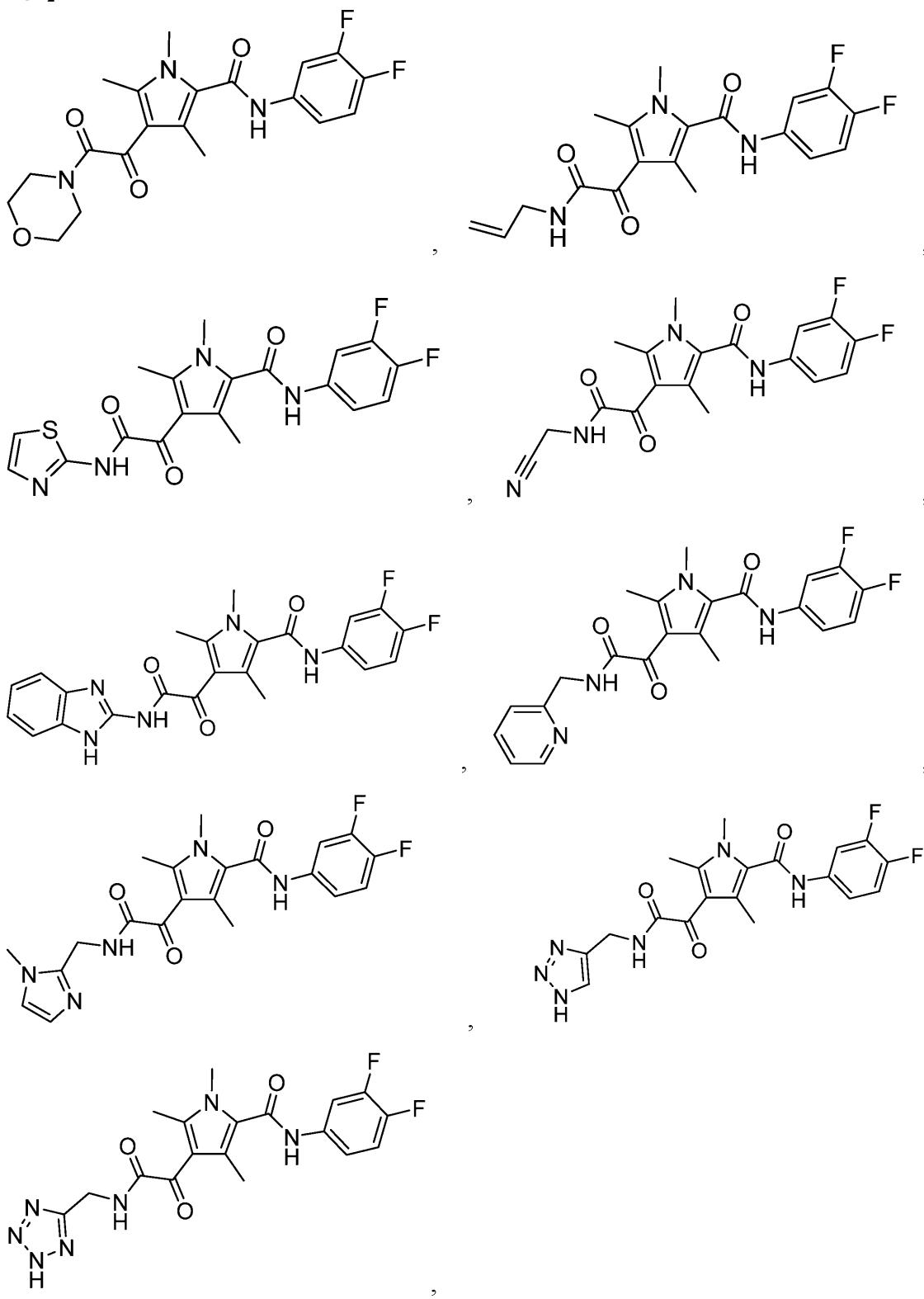
【化 2 1】



【化 2 2】

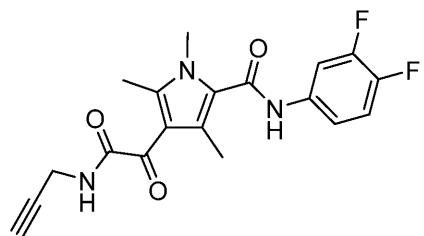


【化 2 3】



からなる群から選択される化合物、
 ならびにその薬学的に許容される塩またはプロドラッグ。
 【請求項 3】

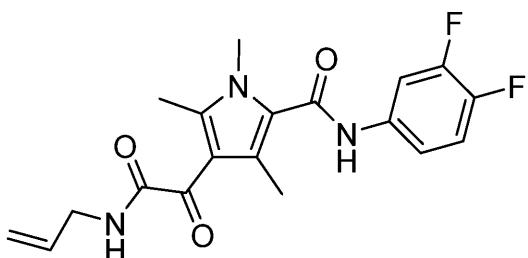
【化 2 4】



である、請求項 2 に記載の化合物、ならびにその薬学的に許容される塩またはプロドラッグ。

【請求項 4】

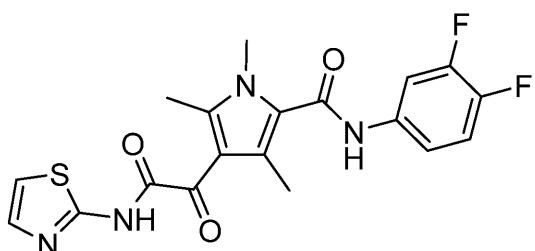
【化 2 5】



である、請求項 2 に記載の化合物、ならびにその薬学的に許容される塩またはプロドラッグ。

【請求項 5】

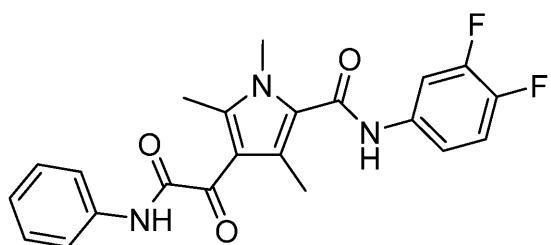
【化 2 6】



である、請求項 2 に記載の化合物、ならびにその薬学的に許容される塩またはプロドラッグ。

【請求項 6】

【化 2 7】



である、請求項 2 に記載の化合物、ならびにその薬学的に許容される塩またはプロドラッグ。

【請求項 7】

R¹~² が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

R¹~³ が C₂~₆ アルケニル、C₂~₆ アルキニル、アリール又はヘテロアリールである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

R¹~³ が C₂~₆ アルケニルである、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

R¹~³ が C₂~₆ アルキニルである、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 1 1】

R¹~³ がアリールである、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 1 2】

R¹~³ がヘテロアリールである、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

J が、1、2、または 3 個のヘテロ原子を含有する 5 員ヘテロ芳香族環である、請求項 1~12 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 4】

J がピロリルである、請求項 1 3 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

I がフェニルである、請求項 1~14 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 6】

U が 3 である、請求項 1~15 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 7】

R¹ が C₁~₆ アルキルである、請求項 1~16 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 8】

V が 2 である、請求項 1~17 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 9】

R¹ がハロゲンである、請求項 1~18 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 0】

請求項 1~19 のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくはプロドラッグを含む、薬学的組成物であって、HBV 感染の治療、HBV 感染の予防、または HBV による感染の生物学的活性の低減のための薬学的組成物。

【請求項 2 1】

別の HBV ウイルス剤との組み合わせで使用することができる、請求項 2 0 に記載の薬学的組成物。

【請求項 2 2】

請求項 1~19 のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくはプロドラッグを含む、薬学的組成物であって、ウエストナイルウイルス感染を治療する、ウエストナイルウイルス感染を予防する、またはウエストナイルウイルスによる感染の生物学的活性を低減するための薬学的組成物。

【請求項 2 3】

別の抗ウエストナイルウイルス剤との組み合わせで使用することができる、請求項 2 2 に記載の薬学的組成物。

【請求項 2 4】

請求項 1~19 のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくはプロドラッグを含む、薬学的組成物であって、f l a v i v i r i d a e ウィルスに感染した宿主を治療する、1つもしくはこれらのウイルスによる感染を予防する、または宿主におけるこれらのウイルスのうちの1つによる感染の生物学的活性を低減するための薬学的組成物。

【請求項 2 5】

別の抗 f l a v i v i r i d a e 剤との組み合わせで使用することができる、請求項 2 4 に記載の薬学的組成物。

【請求項 2 6】

前記ウイルスが、C型肝炎ウイルス (HCV)、デング熱、ジカウイルス、及び黄熱からなる群から選択される、請求項 2 4 又は 2 5 に記載の薬学的組成物。

【請求項 2 7】

HDV 感染を抑制する、請求項 2 0 に記載の薬学的組成物。

【請求項 2 8】

請求項 1 ~ 19 のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩もしくはプロドラッグを含む、HCV 及び休眠HBV 感染の治療に使用するための、薬学的組成物であって、前記使用が更に 1 つ以上の抗 HCV 治療薬の使用を含む、薬学的組成物。

【請求項 29】

経皮用組成物またはナノ粒子組成物である、請求項 20 ~ 28 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 30】

第 2 の抗ウイルス剤との組み合わせで使用することができる、請求項 20 ~ 29 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 31】

前記第 2 の抗ウイルス剤が、ポリメラーゼ阻害剤、ウイルス侵入阻害剤、ウイルス成熟阻害剤、文献に記載されるカプシド集合調節薬、IMPDH 阻害剤、プロテアーゼ阻害剤、免疫系治療薬、逆転写酵素阻害剤、TLR アゴニスト、siRNA、shRNA、Talen、Crisper/Cas9、mir (マイクロ RNA)、明確なまたは不明の機序の薬剤、及びこれらの組み合わせからなる群から選択される、請求項 30 に記載の薬学的組成物。