

【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 07D 207/34 (2006.01)

A 61K 31/40 (2006.01)

A 61P 31/20 (2006.01)

A 61P 31/14 (2006.01)

A 61P 31/12 (2006.01)

A 61K 9/14 (2006.01)

A 61K 45/00 (2006.01)

C 07D 403/12 (2006.01)

A 61K 31/4192 (2006.01)

C 07D 207/36 (2006.01)

C 07D 249/04 (2006.01)

A 61K 31/5377 (2006.01)

A 61K 31/4439 (2006.01)

C 07D 401/12 (2006.01)

A 61K 31/506 (2006.01)

C 07D 417/12 (2006.01)

A 61K 31/427 (2006.01)

A 61K 31/4184 (2006.01)

A 61K 31/4178 (2006.01)

A 61K 31/395 (2006.01)

【F I】

C 07D 207/34 C S P

A 61K 31/40

A 61P 31/20

A 61P 31/14

A 61P 31/12

A 61K 9/14

A 61K 45/00

C 07D 403/12

A 61K 31/4192

C 07D 207/36

C 07D 249/04 5 0 3

A 61K 31/5377

A 61K 31/4439

C 07D 401/12

A 61K 31/506

C 07D 417/12

A 61K 31/427

A 61K 31/4184

A 61K 31/4178

A 61K 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

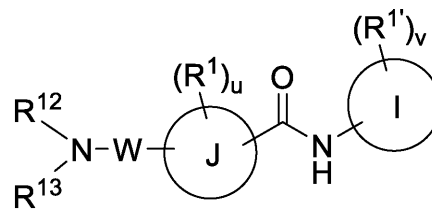
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の式：

【化1】



(V)

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、炭素と結合するとき、それらは、独立して、水素、ハロゲン、 SF_5 、 CF_3 、ヒドロキシ、 $N(R')S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')$ 、 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、または C_{1-6} ヒドロキシアルキルであり、

R^1 及び $R^{1'}$ が、窒素と結合するとき、それらは、独立して、水素、 C_{2-6} アルコキシ、 C_{3-6} アルコキシアルキル、 C_{2-6} 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、 C_{1-6} アルキル、ヘテロシクリルアルキル、 C_{2-6} 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、任意選択でN、O、またはSヘテロ原子を含有する C_{3-6} 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、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} 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、

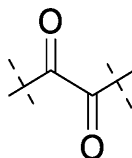
I は、フェニル、1、2、または3個の窒素原子を含有する6員ヘテロ芳香族環、独立して、N、O、もしくはSである1、2、もしくは3個のヘテロ原子を含有する5員ヘテロ芳香族環、 C_{4-14} 二環式環、アルキルヘテロアリール、またはアルキルアリールで

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^{12} 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、

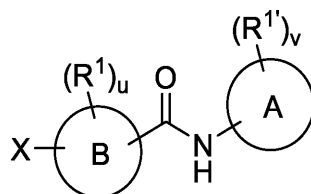
R^{13} は、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、アリールアルキル、 C_{4-14} 二環式環、または独立して、N、O、もしくはSである0、1、もしくは2個のヘテロ原子を含有する6員架橋もしくはスピロ縮合環であり、

R^{13} は、任意選択で、各々が、独立して、水素、ハロゲン、 CF_3 、 SF_5 、ヒドロキシ、 $N(R')S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')_2$ 、 $C(O)R'$ 、 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、 SF_5 、 CF_3 、ヒドロキシ、 $N(R')S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')_2$ 、 $C(O)R'$ 、 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^{12} 及び R^{13} 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、 CF_3 、ヒドロキシ、 $N(R')S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')_2$ 、 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、 C_{4-14} 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 C_{4-14} 二環式環であり、

R^1 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、 SF_5 、 CF_3 、ヒドロキシ、 $N(R')SO_2R'$ 、 SO_2R' 、 $SO_2N(R')$ 、 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、または C_{1-6} ヒドロキシアルキルであり、

R^1 及び $R^{1'}$ が、窒素と結合するとき、それらは、独立して、水素、 C_{2-6} アルコキシ、 C_{3-6} アルコキシアルキル、 C_{2-6} 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、 C_{1-6} アルキル、ヘテロシクリルアルキル、 C_{2-6} ヒドロキシアルキル、または SO_2R' であり、

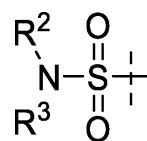
各 R' は、独立して、H、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、もしくはアリールアルキルであるか、または2つの R' が同じ窒素原子上に存在する場合、それらは、一緒に、任意選択でN、O、またはSヘテロ原子を含有する C_{3-6} 環を形成することができ、

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、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{1-6} 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、

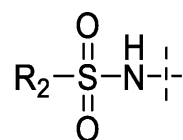
X は、

【化4】



または

【化5】



であり、

R^3 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、

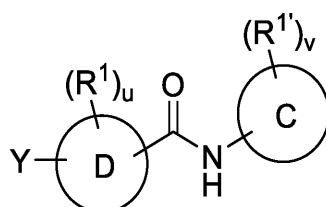
R^2 は、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-8} アルコキシアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、アリールアルキル、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する、6員環、または6員架橋もしくはスピロ縮合環、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する7員架橋もしくはスピロ縮合環、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する5員環、独立して、N、O、またはSである0、1、または2個のヘテロ原子を含有する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、 CF_3 、 SF_5 、ヒドロキシ、 $N(R')S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')_2$ 、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、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、アルコシカルボニル、アルコシカルボニルアルキル、 C_{1-6} アルキル、アリールアルコシカルボニル、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、もしくは C_{1-6} 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、 $N(R')S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')_2$ 、 $C(O)R'$ 、 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、アルコシカルボニル、アルコ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^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、 $N(R')S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')_2$ 、 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、アルコシカルボニル、アルコシカルボニルアルキル、 C_{1-6} アルキル、アリールアルコシカルボニル、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、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、

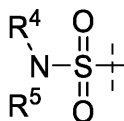
C は、フェニル、1、2、または3個の窒素原子を含有する6員ヘテロ芳香族環、独立して、N、O、もしくはSである1、2、もしくは3個のヘテロ原子を含有する5員ヘテロ芳香族環、 C_{4-14} 二環式環、アルキルアリール、またはアルキルヘテロアリールで

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、

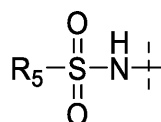
Yは、

【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、

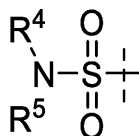
R⁵は、アルキルアリール、アリールアルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、アリール、ヘテロアリール、または独立して、N、O、もしくはSである0、1、もしくは2個のヘテロ原子を含有する6員架橋もしくはスピロ縮合環であり、

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')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、シアノ、アジド、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆アルコキシアルキル、アルコシカルボニル、アルコ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')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、アルコシカルボニル、アルコ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】

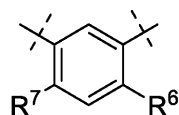


であるとき、R⁴及びR⁵は、それらが結合する窒素と一緒に、任意選択で、1つ以上の置換基で置換された3～4員環を形成し、それらの各々が、独立して、ハロゲン、CF₃、ヒドロキシ、N(R')S(O)₂R'、S(O)₂R'、S(O)₂N(R')₂、C₁₋₆アルコキシ、シアノ、アジド、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆アルコキシアルキル、アルコシカルボニル、アルコシカルボニルアルキル、C₁₋₆アルキル、アリールアルコシカルボニル、カルボキシ、C₁₋₆ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル

、または C_{1-6} ヒドロキシアルキルであり

D は、任意選択で、

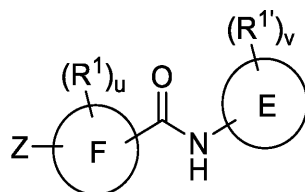
【化 10】



であり、式中、 R^6 は、H、Cl、F、または Br であり、 R^7 は、H、メチル、F、または Cl 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、 R^1 及び $R^{1'}$ は、式 I に関して定義される通りであり、

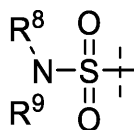
u 及び v は、独立して、0、1、2、3、4、または 5 であり、

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、 C_{4-14} 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 C_{4-14} 二環式環であり、

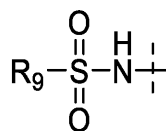
Z は、

【化 12】



または

【化 13】



であり、

R^8 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、

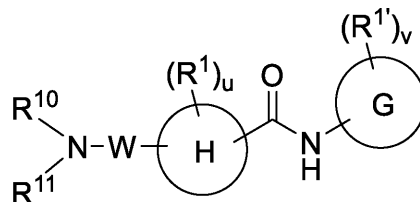
R^9 は、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-8} アルコキシアルキル、独立して、N、O、または S である 0、1、または 2 個のヘテロ原子を含有する、6 員環、または 6 員架橋もしくはスピロ縮合環、独立して、N、O、または S である 0、1、または 2 個のヘテロ原子を含有する 7 員架橋もしくはスピロ縮合環、独立して、N、O、または S である 0、1、または 2 個のヘテロ原子を含有する 5 員環、独立して、N、O、また

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、
 R^9 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、 CF_3 、 SF_5 、ヒドロキシ、 $N(R')S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')_2$ 、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、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、 C_{1-6} ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、もしくは C_{1-6} ヒドロキシアルキルであり、または R^9 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、 $N(R')S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')_2$ 、 $C(O)R'$ 、 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、あるいは

R^8 及び R^9 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、 CF_3 、ヒドロキシ、 $N(R')S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')_2$ 、 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、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、 C_{4-14} 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 C_{4-14} 二環式環であり、

R^1 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、 CF_3 、ヒドロキシ、 SF_5 、 $N(R')S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')_2$ 、 C_{1-6} アルコキシ、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、または C_{1-6} ヒドロキシアルキルであり、

R^1 及び $R^{1'}$ が、窒素と結合するとき、それらは、独立して、水素、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{3-6} 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、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{2-6} アルケニル、ヘテロ

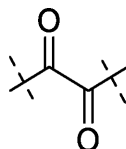
シクリルアルキル、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル、または $S(O)_2 R'$ であり、

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、

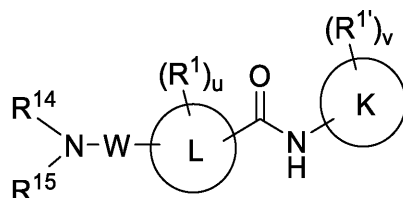
R^{11} は、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 C_{2-8} アルコキシアルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、アリールアルキル、フェニル、1、2、または3個の窒素原子を含有する6員ヘテロ芳香族環、独立して、 N 、 O 、または S である0、1、または2個のヘテロ原子を含有する、6員環、または6員架橋もしくはスピロ縮合環、独立して、 N 、 O 、または S である0、1、または2個のヘテロ原子を含有する7員架橋もしくはスピロ縮合環、独立して、 N 、 O 、または S である1、2、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、 $N(R')S(O)_2 R'$ 、 $S(O)_2 R'$ 、 $S(O)_2 N(R')_2$ 、 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、 $N(R')S(O)_2 R'$ 、 $S(O)_2 R'$ 、 $S(O)_2 N(R')_2$ 、 $C(O)R'$ 、 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、 $N(R')S(O)_2 R'$ 、 $S(O)_2 R'$ 、 $S(O)_2 N(R')_2$ 、 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 1 6】



(VI)

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、

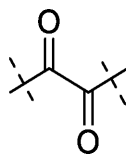
u 及び v は、独立して、0、1、2、3、4、または5であり、

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、 C_{4-14} 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 C_{4-14} 二環式環であり、

W は、

【化 1 7】



であり、

R^{1-4} 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^{1-5} 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、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、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員環であり、

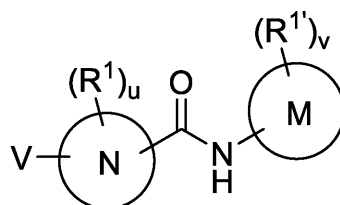
R^{1-5} は、任意選択で、独立して、ハロゲン、 SF_5 、 CF_3 、ヒドロキシ、 $N(R')$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')$ 、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、シアノ、アジド、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} アルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキル、 C_{1-6} アルキル、シクロアルキル、アリールアルコキシカルボニル、カルボキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、もしくは C_{1-6} ヒドロキシアルキルである、1つ以上の置換基で置換されるか、または R^{1-5} 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、 $N(R')$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')$ 、 $C(O)R'$ 、 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^{14} 及び R^{15} 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、 CF_3 、ヒドロキシ、 $N(R')$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')$ 、 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} アルコシアルキル、アルコシカルボニル、アルコシカルボニルアルキル、 C_{1-6} アルキル、アリアルアルコシカルボニル、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】



(VII)

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、

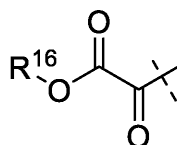
u 及び v は、独立して、0、1、2、3、4、または5であり、

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、 C_{4-14} 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 C_{4-14} 二環式環であり、

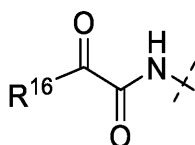
Vは、

【化19】



または

【化20】



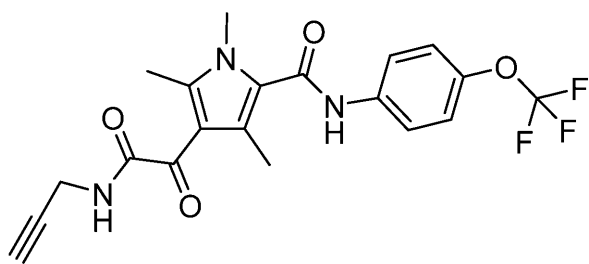
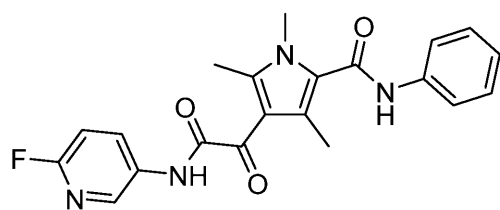
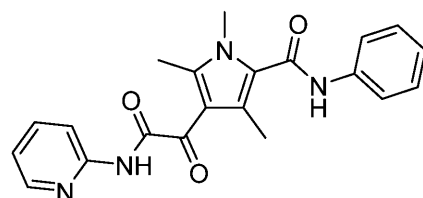
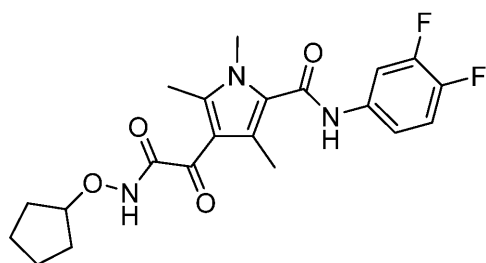
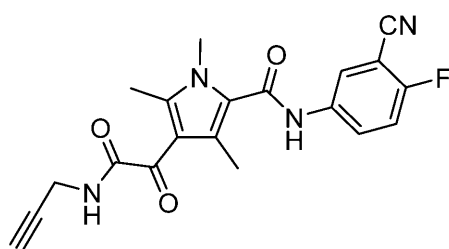
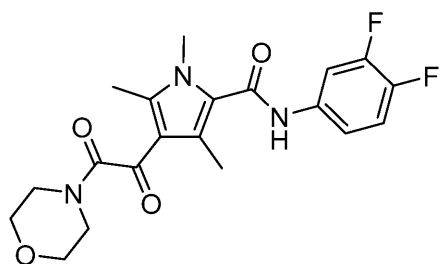
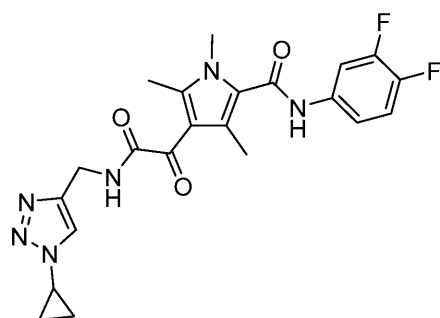
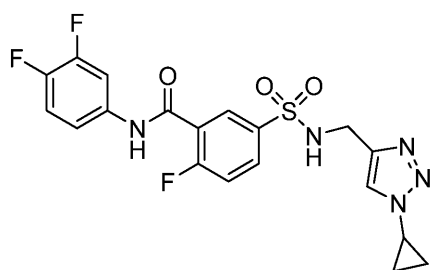
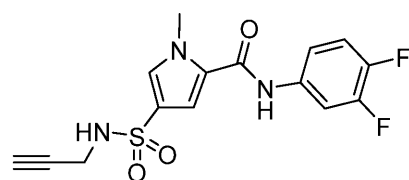
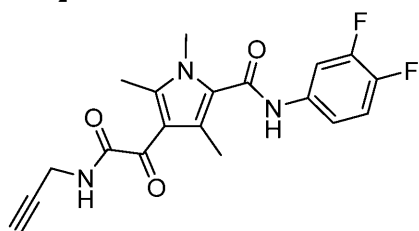
であり、

R^{1-6} 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、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、

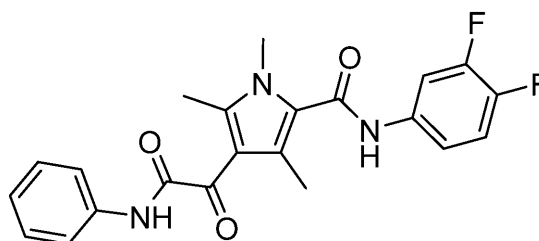
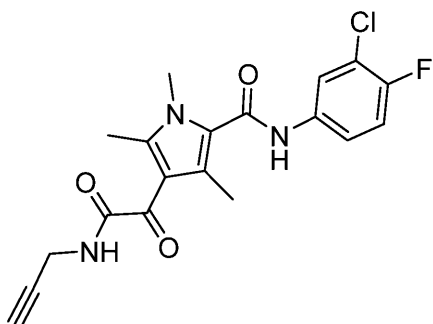
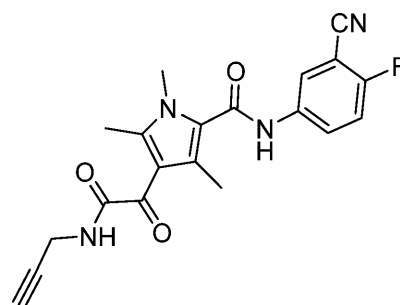
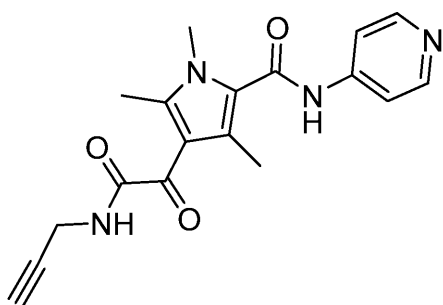
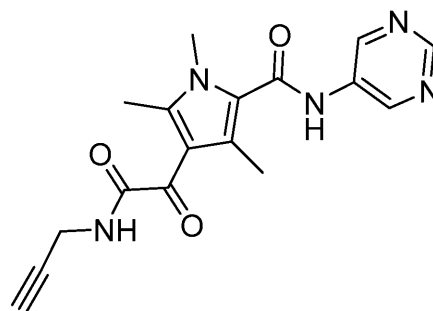
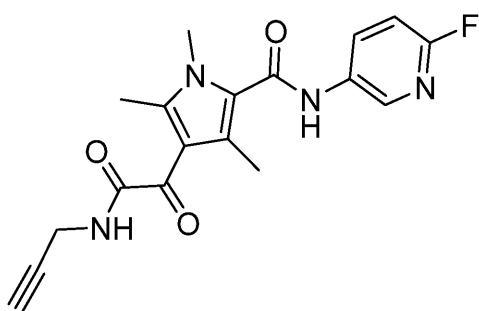
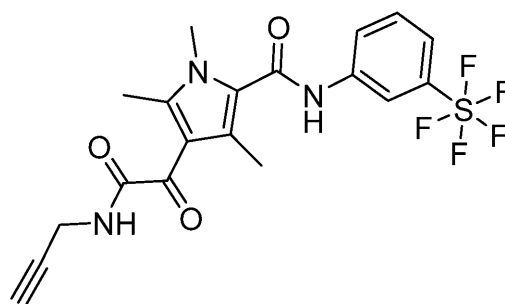
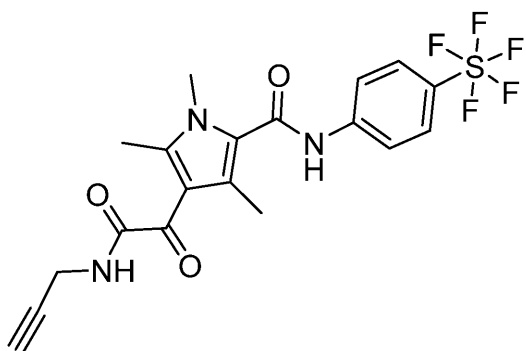
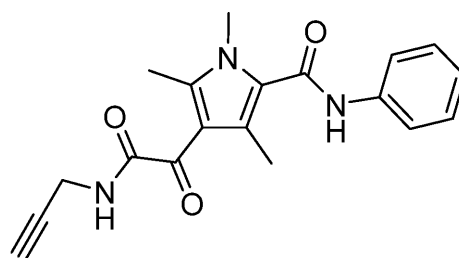
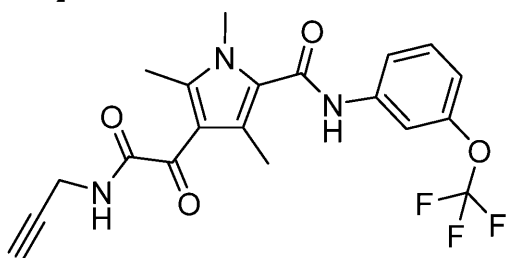
R^{1-6} は、任意選択で、ハロゲン、 SF_5 、 CF_3 、ヒドロキシ、 $N(R')S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')_2$ 、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} ハロアルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、シアノ、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-6} アルコキシアルキル、アルコシカルボニル、アルコシカルボニルアルキル、 C_{1-6} アルキル、アリールアルコシカルボニル、カルボキシ、 C_{1-6} ハロアルキル、ヘテロシクリルアルキル、 C_{1-6} ヒドロキシアルキル、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、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、 $N(R')S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2R'$ 、 $S(O)_2N(R')_2$ 、 $C(O)R'$ 、 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、アルコシカルボニル、アルコ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、化合物。

【請求項2】

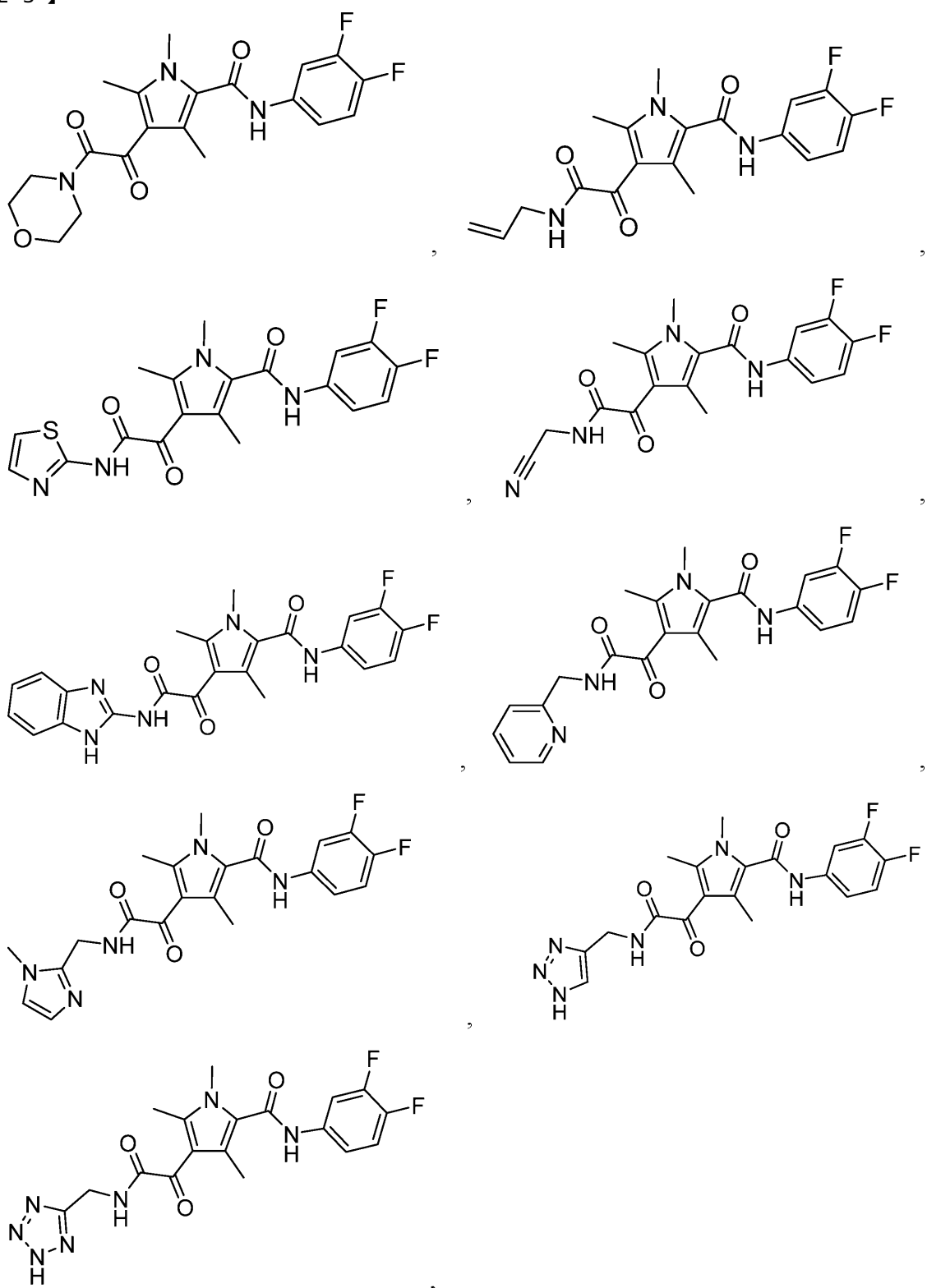
【化 2 1】



【化 2 2】



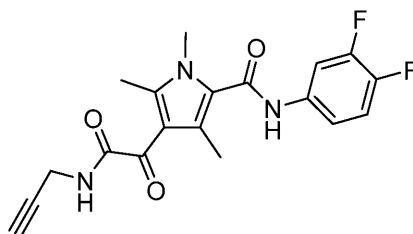
【化 2 3】



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】

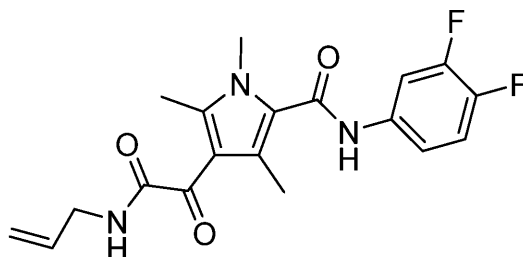
【化 2 4】



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】

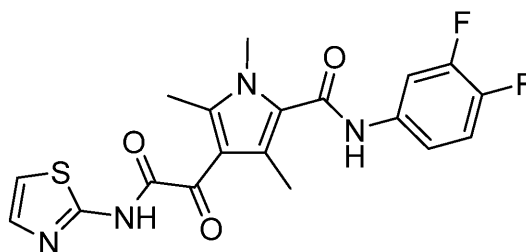
【化 2 5】



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】

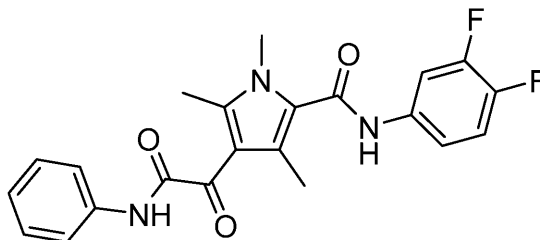
【化 2 6】



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】

$R^{1,2}$ が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

$R^{1,3}$ が C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} 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】

$R^{1,3}$ が C_{2-6} アルケニルである、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

R¹³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11】

R¹³がアリールである、請求項8に記載の化合物。

【請求項12】

R¹³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13】

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14】

Jがピロリルである、請求項13に記載の化合物。

【請求項15】

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16】

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17】

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18】

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19】

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20】

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21】

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20に記載の薬学的組成物。

【請求項22】

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23】

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22に記載の薬学的組成物。

【請求項24】

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、flaviviridaeウイ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25】

別の抗flaviviridae剤との組み合わせで使用することができる、請求項24に記載の薬学的組成物。

【請求項26】

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24又は25に記載の薬学的組成物。

【請求項27】

HDV感染を抑制する、請求項20に記載の薬学的組成物。

【請求項28】

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、H C V 及び休眠 H B V 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 H C V 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 사용할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、I M P D H 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、T L R アゴニスト、s i R N A、s h R N A、T a l e n、C r i s p e r / C a s 9、m i r (マイクロ R N A)、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。