

【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 27 年 2 月 26 日 (2015.2.26)

【公開番号】特開 2014-55161 (P2014-55161A)

【公開日】平成 26 年 3 月 27 日 (2014.3.27)

【年通号数】公開・登録公報 2014-016

【出願番号】特願 2013-234011 (P2013-234011)

【国際特許分類】

C 07 C 235/40 (2006.01)

C 07 C 237/06 (2006.01)

C 07 C 311/51 (2006.01)

C 07 D 215/22 (2006.01)

C 07 D 417/04 (2006.01)

C 07 D 401/12 (2006.01)

C 07 D 417/14 (2006.01)

C 07 D 245/04 (2006.01)

A 61 K 31/47 (2006.01)

A 61 K 31/4709 (2006.01)

A 61 P 31/12 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【FI】

C 07 C 235/40 C S P

C 07 C 237/06

C 07 C 311/51

C 07 D 215/22

C 07 D 417/04

C 07 D 401/12

C 07 D 417/14

C 07 D 245/04

A 61 K 31/47

A 61 K 31/4709

A 61 P 31/12

A 61 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成 27 年 1 月 5 日 (2015.1.5)

【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

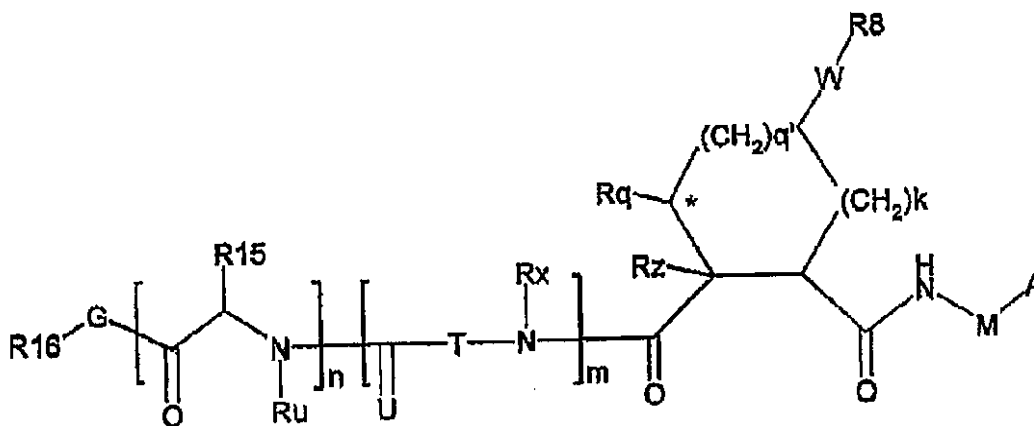
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 VI :

## 【化 1】



VI

[ 式中、

A は、 $C(=O)OR^1$ 、または  $C(=O)NHSO_2R^2$  であり；

ここで、 $R^1$  は、水素、または  $C_1 - C_6$  アルキルであり；

$R^2$  は、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_3 - C_7$  シクロアルキル、またはフェニルであり、ここで該シクロアルキルおよびフェニルは、ハロ、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、カルボキシ、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  アルコキシ、 $C_1 - C_6$  アルコキシ  $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  アルカノイル、アミノ、アジド、オキソ、およびメルカプトから選択される 1 ~ 3 の置換基のより置換されていてもよく；

M は、 $CR^7R^{7'}$  であり；

$R^{7'}$  および  $R^7$  は一緒になって、 $R^{7'a}$  で置換される  $C_3 - C_6$  シクロアルキル環を形成し；

ここで、 $R^{7'a}$  は、J であり；

$q'$  は、0 であり、および  $k$  は、1 であり；

$R_z$  は、H であり；

$R_q$  は、H であり；

W は、 $-O-$  であり；

$R^8$  は、アリーールまたはヘテロアリーールであり、いずれの場合も  $R^8$  基は  $R^9$  でモノ、ジまたはトリ置換されていてもよく；

ここで、 $R^9$  は独立して、ハロ、オキソ、ニトリル、アジド、ニトロ、 $C_1 - C_6$  アルキル、トリフルオロメチル、(アリーール)  $C_0 - C_3$  アルキル、( $C_3 - C_7$  シクロアルキル)  $C_0 - C_3$  アルキル、(ヘテロシクリル)  $C_0 - C_3$  アルキル、 $NH_2C(=O)-$ 、 $Y-NRaRb$ 、 $Y-O-Rb$ 、 $Y-C(=O)Rb$ 、 $Y-(C(=O))NRaRb$ 、 $Y-NRaC(=O)Rb$ 、 $Y-NHSO_pRb$ 、 $Y-S(=O)_pRb$ 、 $Y-S(=O)_pNRaRb$ 、 $Y-C(=O)ORb$  および  $Y-NRaC(=O)ORb$  から選ばれ；ここで、アリーール、シクロアルキル、またはヘテロシクリル部分は  $R^{10}$  で置換されていてもよく；

ここで、 $R^{10}$  は、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_3 - C_7$  シクロアルキル、 $C_1 - C_6$  アルコキシ、アミノ(該アミノ基は  $C_1 - C_6$  アルキルによりモノ置換またはジ置換されていてもよい)、( $C_1 - C_3$  アルキル)スルホニル、 $NO_2$ 、OH、SH、ハロ、ハロアルキル、カルボキシル、アミド、または  $C_1 - C_6$  アルキルアミドであり；

Y は独立して、結合または  $C_1 - C_3$  アルキレンであり；

$R_a$  は独立して、H、または  $C_1 - C_3$  アルキルであり；

$R_b$  は独立して、H、または  $C_1 - C_6$  アルキルであり；

p は独立して、1 または 2 であり；

J は、 $R^7/R^{7'}$  シクロアルキルから、 $R_j$ 、または  $R_y$  の 1 つへ伸びて、マクロ環を形成する、単一の 4 - 7 員の飽和またはモノ不飽和アルキレン鎖であり；

m は、0 であり；n は、0 であり；

G は、-NR<sub>y</sub>-、または -NR<sub>j</sub>NR<sub>j</sub>- であり；

R<sub>y</sub> は、J であり；

一方の R<sub>j</sub> は H であり、他方の R<sub>j</sub> は J であり；

R<sup>16</sup> は、H であり；または R<sup>16</sup> は、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、または C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub> シクロアルキルであり、そのいずれも、ハロ、オキソ、ニトリル、アジド、ニトロ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、(アリール)C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub> シクロアルキル)C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、(ヘテロシクリル)C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、NH<sub>2</sub>CO-、Y-NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>、Y-O-R<sub>b</sub>、Y-C(=O)R<sub>b</sub>、Y-(C=O)NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>、Y-NR<sub>a</sub>C(=O)R<sub>b</sub>、Y-NHSO<sub>p</sub>R<sub>b</sub>、Y-S(=O)<sub>p</sub>R<sub>b</sub>、Y-S(=O)<sub>p</sub>NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>、Y-C(=O)OR<sub>b</sub>、Y-NR<sub>a</sub>C(=O)OR<sub>b</sub> で置換されていてもよく；

アリールまたはアリール部分は、フェニル、ナフチルおよび C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub> シクロアルキルに縮合したフェニルであり；

ヘテロシクリルまたはヘテロシクリル部分は、ピペリジニル、モルホリニル、ピペラジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアジノリル、イソチアジノリル、チアゾリル、オキサジアゾリル、1, 2, 3 - トリアゾリル、1, 2, 4 - トリアゾリル、テトラゾリル、フラニル、チエニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラゾリル、キノリニル、ベンズイミダゾリル、ベンズオキサゾリル、ベンズイソキサゾリル、ベンゾチアジノリル、ベンズイソチアジノリル、ベンゾチアゾリル、ベンズオキサジアゾリル、ベンゾ - 1, 2, 3 - トリアゾリル、ベンゾ - 1, 2, 4 - トリアゾリル、ベンゾテトラゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、ベンゾピリミジル、ベンゾピリダジニル、ベンゾピラゾリル、イソキノリニル、キナゾリニル、およびキノキサリニルから選択され；

ヘテロアリールまたはヘテロアリール部分は、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアジノリル、イソチアジノリル、チアゾリル、オキサジアゾリル、1, 2, 3 - トリアゾリル、1, 2, 4 - トリアゾリル、テトラゾリル、フラニル、チエニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラゾリル、キノリニル、ベンズイミダゾリル、ベンズオキサゾリル、ベンズイソキサゾリル、ベンゾチアジノリル、ベンズイソチアジノリル、ベンゾチアゾリル、ベンズオキサジアゾリル、ベンゾ - 1, 2, 3 - トリアゾリル、ベンゾ - 1, 2, 4 - トリアゾリル、ベンゾテトラゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、ベンゾピリミジル、ベンゾピリダジニル、ベンゾピラゾリル、イソキノリニル、キナゾリニル、およびキノキサリニルから選択される]

で示される化合物またはその医薬的に許容しうる塩を含む、抗 HCV 剤。

#### 【請求項 2】

さらに、ヌクレオシド類縁体、ポリマーゼインヒビター、プロテアーゼインヒビター、リバビリンおよびインターフェロンから選ばれる、さらなる HCV 抗ウイルス薬を含む、請求項 1 に記載の抗 HCV 剤。

#### 【請求項 3】

R<sup>9</sup> は、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ、NO<sub>2</sub>、OH、ハロ、トリフルオロメチル、アミノまたはアミド(該アミノおよびアミドは、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルでモノ - またはジ - 置換されていてもよい)、(アリール)C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、(ヘテロアリール)C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、またはカルボキシルであり、ここで当該アリールまたはヘテロアリール部分は R<sup>10</sup> で置換されていてもよく；

R<sup>10</sup> は、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ、アミノ(該アミノ基は C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルでモノ - またはジ - 置換されていてもよい)、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルアミド、アミド、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルスルホニル、NO<sub>2</sub>、OH、ハロ、トリフルオロメチル、またはカルボキシルである、請求項 1 または 2 に記載の抗 HCV 剤。

#### 【請求項 4】

R<sup>9</sup> が、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ、アミノ、ジ - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アル

キル) アミノ、 $C_1 - C_3$  アルキルアミド、アリールまたはヘテロアリールであり、当該アリールまたはヘテロアリールは  $R^{10}$  で置換されていてもよく；

ここで、 $R^{10}$  は、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_3 - C_7$  シクロアルキル、 $C_1 - C_6$  アルコキシ、アミノ、モノ - またはジ -  $C_1 - C_3$  アルキルアミノ、アミド、 $C_1 - C_3$  アルキルアミド、ハロ、またはトリフルオロメチルである、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の抗 HCV 剤

【請求項 5】

$R^{10}$  が、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  アルコキシ、アミノ (該アミノは  $C_1 - C_3$  アルキルでモノ - またはジ置換されていてもよい)、アミド、 $C_1 - C_3$  アルキルアミド、またはハロである、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の抗 HCV 剤。

【請求項 6】

$R^{10}$  が、メチル、エチル、イソプロピル、tert - ブチル、メトキシ、クロロ、アミノ (該アミノは  $C_1 - C_3$  アルキルでモノ - またはジ置換されていてもよい)、アミド、または  $C_1 - C_3$  アルキルアミドである、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の抗 HCV 剤。

【請求項 7】

$R^8$  が、1 - ナフチル、2 - ナフチルまたはキノリニルであり、そのいずれも、非置換であるか、前記の  $R^9$  でモノまたはジ置換される、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の抗 HCV 剤。

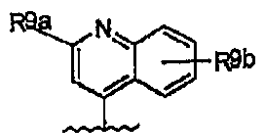
【請求項 8】

$R^8$  がキノリニルであり、該基は、非置換であるか、前記の  $R^9$  でモノまたはジ置換される、請求項 7 に記載の抗 HCV 剤。

【請求項 9】

$R^8$  が：

【化 2】



[ 式中、 $R^{9a}$  は、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  アルコキシ、アミノ (該アミノは  $C_1 - C_6$  アルキルでモノ - またはジ置換されていてもよい)、(アリール)  $C_0 - C_3$ 、または (ヘテロアリール)  $C_0 - C_3$  アルキルであり、当該アリールまたはヘテロアリール部分は  $R^{10}$  で置換されていてもよく；

ここで、 $R^{10}$  は、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_3 - C_7$  シクロアルキル、 $C_1 - C_6$  アルコキシ、アミノ (該アミノは、 $C_1 - C_6$  アルキルでモノ - またはジ - 置換されていてもよい)、アミド、または  $C_1 - C_3$  アルキルアミドであり；および

$R^{9b}$  は、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  アルコキシ、アミノ、ジ ( $C_1 - C_3$  アルキル) アミノ、( $C_1 - C_3$  アルキル) アミド、 $NO_2$ 、OH、ハロ、トリフルオロメチル、またはカルボキシルである ]

である、請求項 8 に記載の抗 HCV 剤。

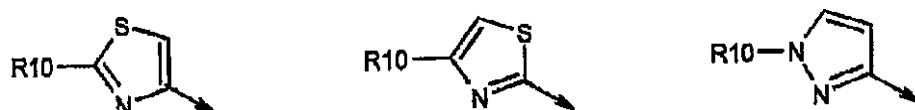
【請求項 10】

$R^{9a}$  が、アリールまたはヘテロアリールであり、そのいずれも前記の  $R^{10}$  で置換されていてもよい、請求項 9 に記載の抗 HCV 剤。

【請求項 11】

$R^{9a}$  が：

【化 3】



[ 式中、 $R^{10}$  は、H、 $C_1 - C_6$  アルキル、または  $C_3 - C_7$  シクロアルキル、アミノ

( $C_1 - C_6$  アルキルでモノ - またはジ - 置換されていてもよい)、アミド、または( $C_1 - C_3$  アルキル)アミドである]

からなる群から選ばれる、請求項 10 に記載の抗 HCV 剤。

【請求項 12】

$R^{9a}$  が置換されていてもよいフェニルである、請求項 10 に記載の抗 HCV 剤。

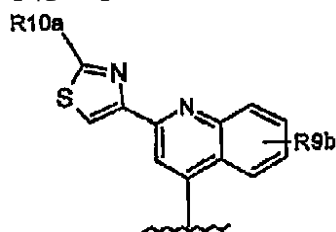
【請求項 13】

$R^{9a}$  が、 $C_1 - C_6$  アルキルで置換されたフェニル、 $C_1 - C_6$  アルコキシで置換されたフェニル、またはハロで置換されたフェニルである、請求項 10 に記載の抗 HCV 剤。

【請求項 14】

$R^8$  が：

【化 4】



[ 式中、 $R^{10a}$  は、H、 $C_1 - C_6$  アルキル、または  $C_3 - C_7$  シクロアルキル、アミノ (該アミノは、 $C_1 - C_6$  アルキルでモノ - またはジ - 置換されていてもよい)、アミド、または( $C_1 - C_3$  アルキル)アミドであり；および  $R^{9b}$  は、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  アルコキシ、アミノ、ジ( $C_1 - C_3$  アルキル)アミノ、( $C_1 - C_3$  アルキル)アミド、 $NO_2$ 、OH、ハロ、トリフルオロメチル、またはカルボキシルである ]

【請求項 15】

$R^{9b}$  が、 $C_1 - C_6$  アルコキシである、請求項 10 に記載の抗 HCV 剤。

【請求項 16】

$R^{9b}$  が、メトキシである、請求項 10 に記載の抗 HCV 剤。

【請求項 17】

A が、 $C(=O)NH SO_2 R^2$  である、請求項 1 または 2 に記載の抗 HCV 剤。

【請求項 18】

$R^2$  が、シクロプロピルである、請求項 17 に記載の抗 HCV 剤。

【請求項 19】

$R^7$  および  $R^{7'}$  が一緒になって、シクロプロピルを形成し、該環が  $R^{7'a}$  で置換されており、 $R^{7'a}$  は J である請求項 1 または 2 に記載の使用。

【請求項 20】

J が、14 または 15 個の環原子のマクロ環を提供する大きさである請求項 1 または 2 に記載の使用。