

【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12月17日(2020.12.17)

【公表番号】特表2020-513415(P2020-513415A)

【公表日】令和2年5月14日(2020.5.14)

【年通号数】公開・登録公報2020-019

【出願番号】特願2019-533095(P2019-533095)

【国際特許分類】

C 07 D 487/04	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 31/16	(2006.01)
A 61 K 31/4985	(2006.01)
C 07 D 519/00	(2006.01)
A 61 K 31/519	(2006.01)
A 61 K 45/00	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)

【F I】

C 07 D 487/04	1 4 0
C 07 D 487/04	C S P
A 61 P 43/00	1 2 3
A 61 P 43/00	1 2 1
A 61 P 31/16	
A 61 K 31/4985	
C 07 D 519/00	3 1 1
C 07 D 519/00	3 0 1
A 61 K 31/519	
A 61 K 45/00	
A 61 K 31/5377	

【手続補正書】

【提出日】令和2年11月2日(2020.11.2)

【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

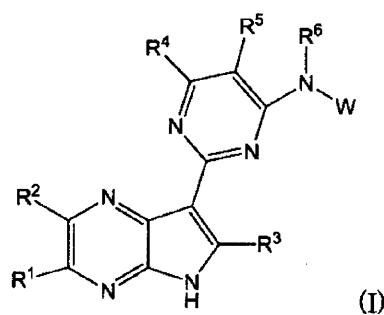
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



(式中、R¹、R²及びR³の各々は、独立に、H、D、F、C1、Br、CN、NO₂、-C(=O)R^a、-C(=O)OR^b、-C(=O)NR^cR^d、OR^b、-NR^cR^d、R^bO-C₁₋₄アルキレン、R^dR^cN-C₁₋₄アルキレン、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、又はC₂₋₆アルキニルであるか、又は、R¹及びR²は、それらが結合している炭素原子と一緒に、C₃₋₆炭素環式環、5員から6員までのヘテロ環式環、C₆₋₁₀芳香環又は5員から6員までのヘテロ芳香環を形成し、ここで、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆炭素環式環、5員から6員までのヘテロ環式環、C₆₋₁₀芳香環及び5員から6員までのヘテロ芳香環の各々は、独立に無置換であるか、又はD、F、C1、Br、CN、OR^b、-NR^cR^d、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、R^bO-C₁₋₄アルキレン又はR^dR^cN-C₁₋₄アルキレンから独立に選択される1、2、3、又は4個の置換基で置換されており；

R₄は、OR^b、-NR^cR^d、C₂₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₂カルボシクリル、C₃₋₁₂カルボシクリル-C₁₋₄アルキレン、3員から12員までのヘテロシクリル、(3員から12員までのヘテロシクリル)-C₁₋₄アルキレン、C₆₋₁₀アリール、C₆₋₁₀アリール-C₁₋₄アルキレン、5員から16員までのヘテロアリール、又は(5員から16員までのヘテロアリール)-C₁₋₄アルキレンであり、ここで、C₂₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₂カルボシクリル、C₃₋₁₂カルボシクリル-C₁₋₄アルキレン、3員から12員までのヘテロシクリル、(3員から12員までのヘテロシクリル)-C₁₋₄アルキレン、C₆₋₁₀アリール、C₆₋₁₀アリール-C₁₋₄アルキレン、5員から16員までのヘテロアリール及び(5員から16員までのヘテロアリール)-C₁₋₄アルキレンの各々は、独立に無置換であるか、又は1、2、3、4、若しくは5個のR'で置換されており；

R⁵は、H、D、F、C1、Br、CN、NO₂、-C(=O)R^a、-C(=O)OR^b、-C(=O)NR^cR^d、OR^b、-NR^cR^d、R^bO-C₁₋₄アルキレン、R^dR^cN-C₁₋₄アルキレン、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₂シクロアルキル、C₃₋₁₂シクロアルキル-C₁₋₄アルキレン、3員から12員までのヘテロシクリル、(3員から12員までのヘテロシクリル)-C₁₋₄アルキレン、C₆₋₁₀アリール、C₆₋₁₀アリ-ル-C₁₋₄アルキレン、5員から10員までのヘテロアリール、又は(5員から10員までのヘテロアリール)-C₁₋₄アルキレンであり、ここで、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₁₂シクロアルキル、C₃₋₁₂シクロアルキル-C₁₋₄アルキレン、3員から12員までのヘテロシクリル、(3員から12員までのヘテロシクリル)-C₁₋₄アルキレン、C₆₋₁₀アリ-ル、C₆₋₁₀アリール-C₁₋₄アルキレン、5員から10員までのヘテロアリール及び(5員から10員までのヘテロアリール)-C₁₋₄アルキレンの各々は、独立に無置換であるか、又は1、2、3、4、若しくは5個のR'で置換されており、

或いは、R⁴及びR⁵は、それらが結合している炭素原子と一緒にC₃₋₁₂炭素環式環、3員から12員までのヘテロ環式環、C₆₋₁₀芳香環又は5員から10員までのヘテロ芳香環を形成し、ここで、C₃₋₁₂炭素環式環、3員から12員までのヘテロ環式環、C₆₋₁₀芳香環及び5員から10員までの芳香族複素環の各々は、独立に無置換であるか、又は1、2、3、4、若しくは5個のR'で置換されており、

各R'は、独立にD、F、C1、Br、CN、NO₂、OR^b、-NR^cR^d、R^bO-C₁₋₄アルキレン、R^dR^cN-C₁₋₄アルキレン、R^a-C(=O)-O-C₁₋₄アルキレン-O-C₁₋₄アルキレン、-C(=O)R^a、-C(=O)OR^b、-C(=O)NR^cR^d、C₁₋₁₂アルキル、C₁₋₆ハロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₄アルキレン、3員から8員までのヘテロシクリル、(3員から8員までのヘテロシクリル)-C₁₋₄アルキレン、C₆₋₁₀アリール、C₆₋₁₀アリ-ル

アリール - C₁ - 4 アルキレン、5員から10員までのヘテロアリール又は(5員から10員までのヘテロアリール) - C₁ - 4 アルキレンであり、ここで、C₁ - 1₂ アルキル、C₁ - 6 ハロアルキル、C₃ - 6 シクロアルキル、C₃ - 6 シクロアルキル - C₁ - 4 アルキレン、3員から8員までのヘテロシクリル、(3員から8員までのヘテロシクリル) C₁ - 4 アルキレン、C₆ - 1₀ アリール、C₆ - 1₀ アリール - C₁ - 4 アルキレン、5員から10員までのヘテロアリール及び(5員から10員までのヘテロアリール) - C₁ - 4 アルキレンの各々は、独立に無置換であるか、又はD、F、C1、Br、CN、NO₂、OR^b、-NR^cR^d、C₁ - 6 アルキル、C₁ - 6 ハロアルキル、R^bO - C₁ - 4 アルキレン、若しくはR^dR^cN - C₁ - 4 アルキレンから独立に選択される1、2、3、又4個の置換基で置換されており、

R⁶は、H、D、又はC₁ - 6 アルキルであり、ここで、C₁ - 6 アルキルは、任意に、D、F、C1、Br、CN、NO₂、又はOR^bから独立に選択される1、2、3、又は4個の置換基で置換されていてもよく、

Wは、C₁ - 8 アルキル、C₃ - 1₂ カルボシクリル、又は3員から12員までのヘテロシクリルであり、ここで、C₁ - 8 アルキル、C₃ - 1₂ カルボシクリル、及び3員から12員までのヘテロシクリルの各々は、独立に無置換であるか、又は1、2、3又は4個のR^Wで置換されており；

各R^Wは、独立にD、F、C1、Br、CN、NO₂、=O、-C(=O)R^a、-C(=O)OR^b、-C(=O)-O-C₁ - 4 アルキレン-O-C(=O)-OR^b、-C(=O)NR^cR^d、-NR^eC(=O)R^a、-NR^eC(=O)NR^cR^d、-S(=O)₂R^f、-S(=O)₂NR^eC(=O)R^a、-S(=O)₂NR^cR^d、(R^bO)₂P(=O)-C₀ - 2 アルキレン、OR^b、R^bO-C₁ - 2 アルキレン、R^dR^cN - C₁ - 2 アルキレン、C₁ - 6 アルキル、5員から6員までのヘテロアリール、又は5員から6員までのヘテロシクリルであり、ここで、C₁ - 6 アルキル、5員から6員までのヘテロアリール、及び5員から6員までのヘテロシクリルの各々は、独立に無置換であるか、又はD、F、C1、Br、CN、N₃、=O、NO₂、OR^b、C₁ - 6 アルキル又はC₁ - 6 ハロアルキルから独立に選択される1、2、3又は4個の置換基によって置換されており、

各R^a、R^b、R^c、R^d、R^e、及びR^fは、独立にH、D、ヒドロキシ、C₁ - 6 ハロアルキル、C₁ - 6 アルキル、n-ヘプチル、C₁ - 6 アルコキシ、C₂ - 6 アルケニル、C₂ - 6 アルキニル、C₃ - 6 カルボシクリル、C₃ - 6 カルボシクリル - C₁ - 4 アルキレン、3員から12員までのヘテロシクリル、(3員から12員までのヘテロシクリル) - C₁ - 4 アルキレン、C₆ - 1₀ アリール、C₆ - 1₀ アリール - C₁ - 4 アルキレン、5員から10員までのヘテロアリール又は(5員から10員までのヘテロアリール) - C₁ - 4 アルキレンであり、ここで、C₁ - 6 アルキル、n-ヘプチル、C₁ - 6 アルコキシ、C₂ - 6 アルケニル、C₂ - 6 アルキニル、C₃ - 6 カルボシクリル、C₃ - 6 カルボシクリル - C₁ - 4 アルキレン、3員から12員までのヘテロシクリル、(3員から12員までのヘテロシクリル) - C₁ - 4 アルキレン、C₆ - 1₀ アリール、C₆ - 1₀ アリール - C₁ - 4 アルキレン、5員から10員までのヘテロアリール及び(5員から10員までのヘテロアリール) - C₁ - 4 アルキレンの各々は、独立に無置換であるか、又はD、F、C1、CN、OH、NH₂、C₁ - 6 アルキル、C₁ - 6 ハロアルキル、C₁ - 6 アルコキシ又はC₁ - 6 アルキルアミノから独立に選択される1、2、3又は4個の置換基によって置換されており、

或いは、R^c及びR^dは、それらが結合している窒素原子と一緒に、3員から8員までのヘテロシクリル、又は5員から8員までのヘテロアリールを形成し、ここで、3員から8員までのヘテロシクリル、及び5員から8員までのヘテロアリールの各々は、独立に無置換であるか、又はD、F、C1、CN、OH、NH₂、C₁ - 6 アルキル、C₁ - 6 ハロアルキル、C₁ - 6 アルコキシ又はC₁ - 6 アルキルアミノから独立に選択される1、2、3又は4個の置換基によって置換されている)

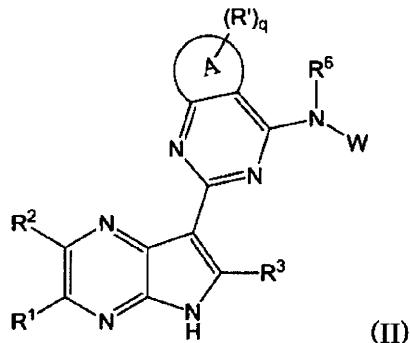
を有する化合物、又はその立体異性体、互変異性体、N-オキシド、溶媒和物、代謝物、

薬学的に許容され得る塩、若しくはプロドラッグ。

【請求項 2】

式 (I I)

【化 2】



(式中、Aは、C₃ - C₁₂炭素環式環、3員から12員までのヘテロ環式環、C₆ - C₁₀芳香環又は5員から10員までの芳香族複素環であり、

qは、0、1、2、3、4、又は5である)

を有する、

請求項1に記載の化合物。

【請求項 3】

AはC₃ - C₆炭素環式環、3員から6員までのヘテロ環式環、C₆ - C₁₀芳香環又は5員から6員までのヘテロ芳香環である、請求項2に記載の化合物。

【請求項 4】

AはC₃ - C₆炭素環式環、3員から6員までのヘテロ環式環、ベンゼン、ナフタレン、フラン、ベンゾフラン、ピロール、ピリジン、ピラゾール、イミダゾール、ベンズイミダゾール、トリアゾール、テトラゾール、オキサゾール、オキサジアゾール、1,3,5-トリアジン、チアゾール、チオフェン、ベンゾチオフェン、ピラジン、ピリダジン、ピリミジン、インドール、プリン、キノリン、又はイソキノリンである、請求項2又は3に記載の化合物。

【請求項 5】

R⁴はOR^b、-NR^cR^d、C₂ - C₄アルキル、C₂ - C₄アルケニル、C₂ - C₄アルキニル、C₃ - C₆カルボシクリル、C₃ - C₆カルボシクリル-C₁ - C₄アルキレン、5員から8員までのヘテロシクリル、(5員から8員までのヘテロシクリル)-C₁ - C₄アルキレン、C₆ - C₁₀アリール、C₆ - C₁₀アリール-C₁ - C₄アルキレン、5員から10員までのヘテロアリール又は(5員から10員までのヘテロアリール)-C₁ - C₄アルキレンであり、ここで、C₂ - C₄アルキル、C₂ - C₄アルケニル、C₂ - C₄アルキニル、C₃ - C₆カルボシクリル、C₃ - C₆カルボシクリル-C₁ - C₄アルキレン、5員から8員までのヘテロシクリル、(5員から8員までのヘテロシクリル)-C₁ - C₄アルキレン、C₆ - C₁₀アリール、C₆ - C₁₀アリール-C₁ - C₄アルキレン、5員から10員までのヘテロアリール及び(5員から10員までのヘテロアリール)-C₁ - C₄アルキレンの各々は、独立に無置換であるか、又は1、2、3、4又は5個のR'で置換されており、

R⁵は、H、D、F、C1、Br、CN、NO₂、-C(=O)R^a、-C(=O)OR^b、-C(=O)NR^cR^d、OR^b、-NR^cR^d、C₁ - C₃アルキル、C₂ - C₄アルケニル、C₂ - C₄アルキニル、C₃ - C₆シクロアルキル、C₃ - C₆シクロアルキル-C₁ - C₄アルキレン、5員から6員までのヘテロシクリル、(5員から6員までのヘテロシクリル)-C₁ - C₄アルキレン、C₆ - C₁₀アリール、C₆ - C₁₀アリール-C₁ - C₄アルキレン、5員から6員までのヘテロアリール、又は(5員から6員までのヘテロアリール)-C₁ - C₄アルキレンであり、ここで、C₁ - C₃アルキル、C₂ - C₄アルケニル、C₂ - C₄アルキニル、C₃ - C₆シクロアルキル、C₃ - C₆シクロアルキル-C₁ - C₄アルキレン、5員から6員までのヘテロシクリル、(5員から6員までのヘテロシクリル)-C

C_{1-4} アルキレン、 C_{6-10} アリール、 C_{6-10} アリール- C_{1-4} アルキレン、5員から6員までのヘテロアリール及び(5員から6員までのヘテロアリール)- C_{1-4} アルキレンの各々は、独立に無置換であるか、又は1、2、3、4又は5個のR'で置換されており、

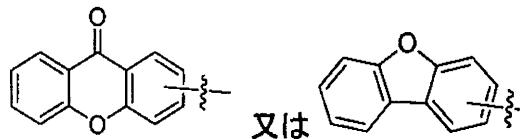
或いは、R⁴及びR⁵は、それらが結合している炭素原子と一緒に、 C_{3-6} 炭素環式環、3員から6員までのヘテロ環式環、 C_{6-10} 芳香環又は5員から6員までのヘテロ芳香環を形成し、ここで、 C_{3-6} 炭素環式環、3員から6員までのヘテロ環式環、 C_{6-10} 芳香環、及び5員から6員までのヘテロ芳香環の各々は、独立に無置換であるか、又は1、2、3、4又は5個のR'で置換されている、

請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

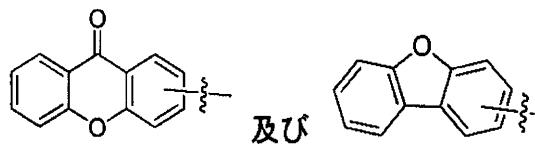
R⁴はOR^b、-NR^cR^d、エチニル、プロピニル、 C_{3-6} カルボシクリル、ピロリジニル、ピラゾリジニル、イミダゾリジニル、テトラヒドロフリル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、テトラヒドロイソキノリル、ピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、フェニル、ナフチル、フリル、ベンゾフリル、ピロリル、ピリジル、ピラゾリル、イミダゾリル、ベンズイミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、1,3,5-トリアジニル、チアゾリル、チアジアゾリル、チエニル、ベンゾチエニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、インドリル、ブリニル、キノリル、イソキノリル、フェノキサチニル、

【化3】



であり、ここで、エチニル、プロピニル、 C_{3-6} カルボシクリル、ピロリジニル、ピラゾリジニル、イミダゾリジニル、テトラヒドロフリル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、テトラヒドロイソキノリル、ピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、フェニル、ナフチル、フリル、ベンゾフリル、ピロリル、ピリジル、ピラゾリル、イミダゾリル、ベンズイミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、1,3,5-トリアジニル、チアゾリル、チアジアゾリル、チエニル、ベンゾチエニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、インドリル、ブリニル、キノリル、イソキノリル、フェノキサチニル、

【化4】



の各々は、独立に無置換であるか、又は1、2、3、4又は5個のR'で置換されており、

R⁵は、H、D、F、Cl、Br、CN、NO₂、メチル、エチル、又はi-プロピルであり、

或いは、R⁴及びR⁵は、それらが結合している炭素原子と一緒に、 C_{3-6} 炭素環式環、3員から6員までのヘテロ環式環、ベンゼン、ナフタレン、フラン、ベンゾフラン、ピロール、ピリジン、ピラゾール、イミダゾール、ベンズイミダゾール、トリアゾール、テトラゾール、オキサゾール、オキサジアゾール、1,3,5-トリアジン、チアゾール、チオフェン、ベンゾチオフェン、ピラジン、ピリダジン、ピリミジン、インドール、ブリン、キノリン、又はイソキノリンを形成しており、ここで、 C_{3-6} 炭素環式環、3員か

ら 6 員までのヘテロ環式環、ベンゼン、ナフタレン、フラン、ベンゾフラン、ピロール、ピリジン、ピラゾール、イミダゾール、ベンズイミダゾール、トリアゾール、テトラゾール、オキサゾール、オキサジアゾール、1, 3, 5 - トリアジン、チアゾール、チオフェン、ベンゾチオフェン、ピラジン、ピリダジン、ピリミジン、インドール、プリン、キノリン、及びイソキノリンの各々は、独立に無置換であるか、又は 1, 2, 3, 4 又は 5 個の R' で置換されている。

請求項 1 又は 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

R¹、R² 及び R³ の各々は、独立に H、D、F、Cl、Br、CN、NO₂、-C(=O)R^a、-C(=O)OR^b、-C(=O)NR^cR^d、OR^b、-NR^cR^d、メチル、エチル、n - プロピル、又は i - プロピルであるか、又は、R¹ 及び R² は、それらが結合している炭素原子と一緒に、C₅ - 6 炭素環式環、5 員から 6 員までのヘテロ環式環、ベンゼン環又は 5 員から 6 員までのヘテロ芳香環を形成しており、ここでメチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、C₅ - 6 炭素環式環、5 員から 6 員までのヘテロ環式環、ベンゼン環又は 5 員から 6 員までのヘテロ芳香環の各々は、独立に無置換であるか、又は D、F、Cl、Br、CN、OR^b、-NR^cR^d、若しくは C₁ - 3 ハロアルキルから独立に選択される 1, 2, 3、又は 4 個の置換基で置換されている。

請求項 1 ~ 6 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8】

各 R' は、独立に D、F、Cl、Br、CN、NO₂、OR^b、-NR^cR^d、R^a - C(=O) - O - C₁ - 2 アルキレン - O - C₁ - 2 アルキレン、R^b O - C(=O) - O - C₁ - 2 アルキレン - O - C₁ - 2 アルキレン、-C(=O)R^a、-C(=O)OR^b、-C(=O)NR^cR^d、C₁ - 9 アルキル、C₁ - 3 ハロアルキル、C₃ - 6 シクロアルキル、5 員から 6 員までのヘテロシクリル、フェニル、フェニル - C₁ - 2 アルキレン、又は 5 員から 10 員までのヘテロアリールであり、ここで、C₁ - 9 アルキル、C₁ - 3 ハロアルキル、C₃ - 6 シクロアルキル、5 員から 6 員までのヘテロシクリル、フェニル、フェニル - C₁ - 2 アルキレン、及び 5 員から 10 員までのヘテロアリールの各々は、独立に無置換であるか、又は D、F、Cl、Br、CN、NO₂、OR^b、-NR^cR^d、メチル、エチル、n - プロピル又は i - プロピルから独立に選択される 1, 2, 3 又は 4 個の置換基によって置換されている。

請求項 1 ~ 7 の何れか 1 項に記載の化合物

【請求項 9】

各 R' は独立に D、F、Cl、Br、CN、NO₂、OR^b、-NR^cR^d、
【化 5】



-C(=O)R^a、-C(=O)OR^b、-C(=O)NR^cR^d、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - プチル、i - プチル、t - プチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、モノフルオロメチル、2, 2 - ジフルオロエチル、1, 2 - ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、1 - フルオロエチル、2 - フルオロエチル、シクロプロピル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチアピラニル、ピペリジル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、フェニル、フェニル - C₁ - 2 アルキレン、フリル、ベンゾフラニル、ピロリル、ピリジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ベンズイミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、1, 3, 5 - トリアジニル、チアゾリル、チエニル、ベンゾチエニル、ピラジニル、ピリダジニル、又はピリミジニルであり、ここで、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - プチル、i - プチル、t - プチル、ジフルオロメチル、モノフルオロメチル、2, 2 - ジフルオロエチル、1, 2 - ジフルオロエチル

、トリフルオロエチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、シクロプロピル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチアピラニル、ペリジル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、フェニル、フェニル-C₁₋₂アルキレン、フリル、ベンゾフラニル、ピロリル、ピリジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ベンズイミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、1,3,5-トリアジニル、チアゾリル、チエニル、ベンゾチエニル、ピラジニル、ピリダジニル及びピリミジニルの各々は、独立に無置換であるか、又はD、F、C1、Br、CN、NO₂、OH、-NH₂、メチル、エチル、n-プロピル又はi-プロピルから独立に選択される1、2、3又は4個の置換基によって置換されている。

請求項1～8の何れか1項に記載の化合物。

【請求項10】

R⁶はH、D、CF₃、メチル、エチル、n-プロピル、又はi-プロピルである、請求項1～9の何れか1項に記載の化合物。

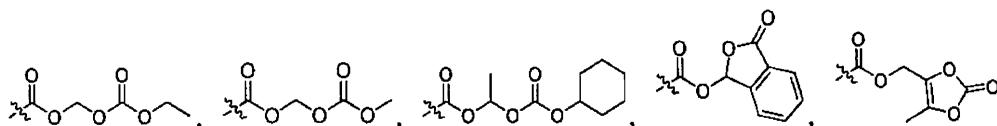
【請求項11】

WはC₁₋₆アルキル、C₅₋₈カルボシクリル、又は5員から8員までのヘテロシクリルであり、ここで、C₁₋₆アルキル、C₅₋₈炭素環、及び5員から8員までの複素環の各々は独立に無置換であるか、又は1、2、3又は4個のR^Wで置換されている、請求項1～10の何れか1項に記載の化合物。

【請求項12】

R^WはD、F、C1、Br、CN、NO₂、=O、-C(=O)OCH₃、-C(=O)OCH₂CH₃、-C(=O)OCH₂CH₂CH₂CH₂CH₃、-C(=O)O(CH₂)₆CH₃、-C(=O)OH、

【化6】



-C(=O)NR^cR^d、-NH₂C(=O)R^a、-NH₂C(=O)NR^cR^d、-S(=O)₂R^f、-S(=O)₂NH₂C(=O)R^a、-S(=O)₂NR^cR^d、(R^bO)₂P(=O)-C₀₋₂アルキレン、OR^b、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、フリル、ピロリル、ペリジル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、1,3,5-トリアジニル、チアゾリル、チエニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピリミジル、又は5員から6員までのヘテロシクリルであり、ここで、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、フリル、ピロリル、ペリジル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、1,3,5-トリアジニル、チアゾリル、チエニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピリミジル、及び5員から6員までのヘテロシクリルの各々は、独立に無置換であるか、又はD、F、C1、Br、CN、N₃、=O、NO₂、-OCH₃、C₁₋₃アルキル、若しくはC₁₋₃ハロアルキルから独立に選択される1、2、3又は4個の置換基によって置換されている。

請求項1～11の何れか1項に記載の化合物。

【請求項13】

各R^a、R^b、R^c、R^d、R^e、及びR^fは、独立にH、D、ヒドロキシ、トリフルオロメチル、メチル、エチル、i-プロピル、n-プロピル、n-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシル、n-ヘプチル、メトキシ、エトキシ、C₃₋₆カルボシクリル、5員から6員までのヘテロシクリル、フェニル、5員から10員までのヘテロアリール、又は(5員から10員までのヘテロアリール)-C₁₋₄アルキレンであり、ここで、メチル、エチル、i-プロピル、n-プロピル、n-ブチル、t-ブチル、n-ペン

チル、n-ヘキシル、n-ヘプチル、メトキシ、エトキシ、C₃～C₆カルボシクリル、5員から6員までのヘテロシクリル、フェニル、5員から10員までのヘテロアリール、及び(5員から10員までのヘテロアリール)-C₁～C₄アルキレンの各々は、独立に無置換であるか、又はD、F、C1、CN、OH、NH₂、C₁～C₃アルキル、C₁～C₃ハロアルキル又はメトキシから独立に選択される1、2、3又は4個の置換基によって置換されているか。

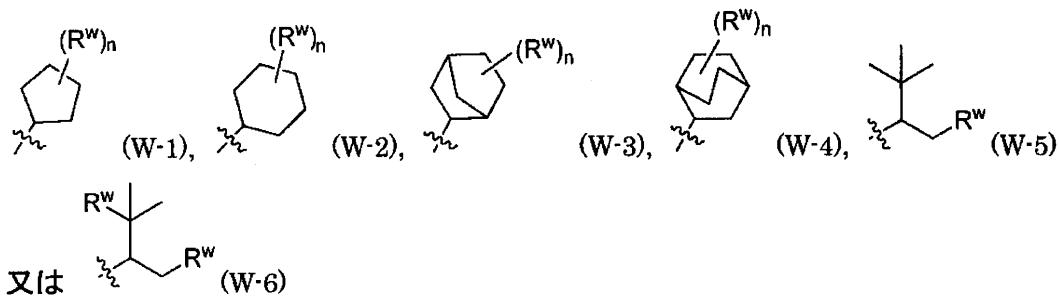
或いは、R^c及びR^dは、それらが結合している窒素原子と一緒に、5員から6員までのヘテロシクリル、又は5員から6員までのヘテロアリールを形成しており、ここで、5員から6員までのヘテロシクリル、及び5員から6員までのヘテロアリールの各々は、独立に無置換であるか、又はD、F、C1、CN、OH、NH₂、C₁～C₃アルキル、C₁～C₃ハロアルキル又はメトキシから独立に選択される1、2、3又は4個の置換基によって置換されている。

請求項1～12の何れか1項に記載の化合物。

【請求項14】

Wは以下のサブ式：

【化7】



のうちの何れか1つであり、

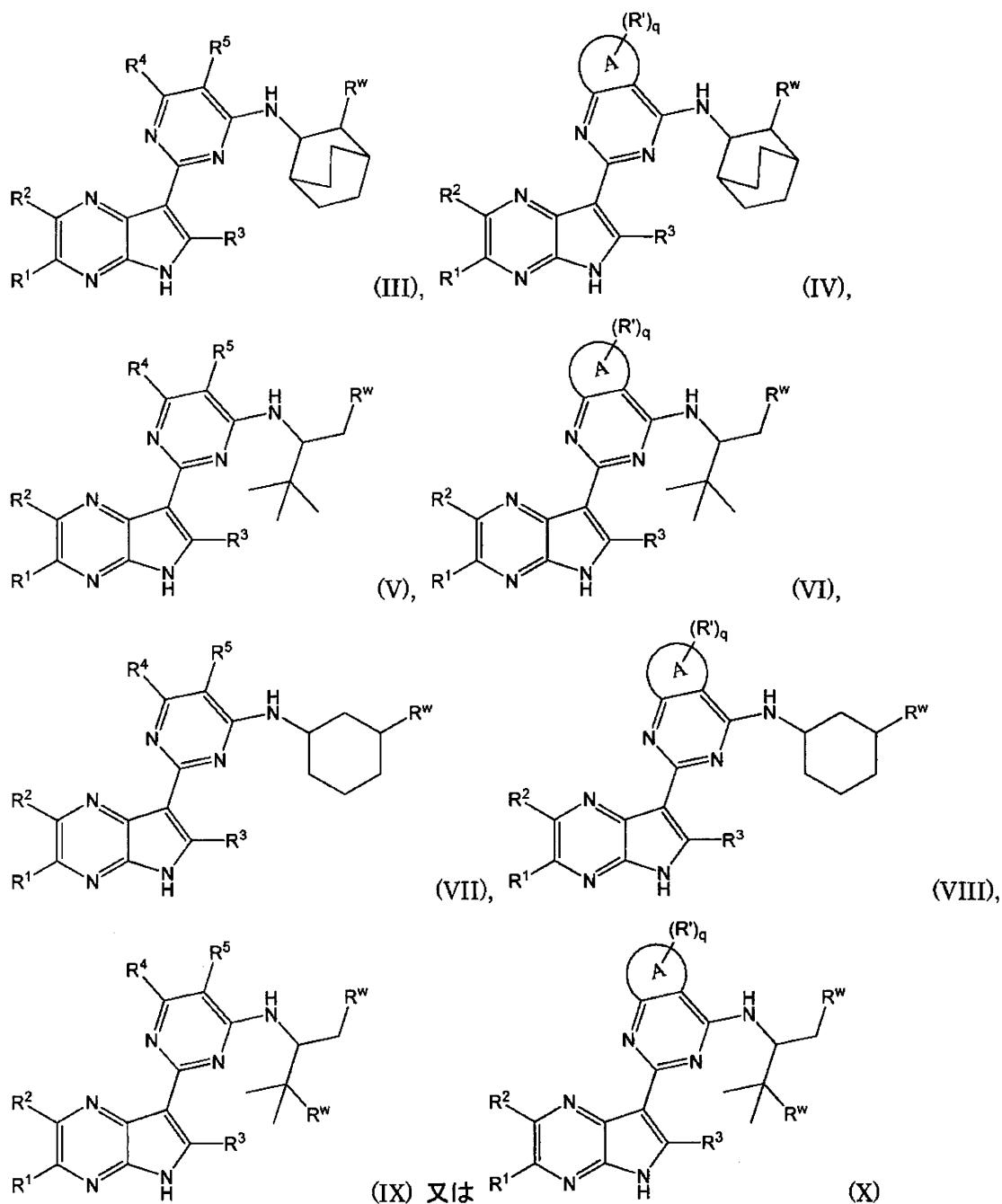
式中、nは0、1、2、3、又は4である、

請求項1～13の何れか1項に記載の化合物。

【請求項15】

以下の化学式(III)、(IV)、(V)、(VI)、(VII)、(VIII)、(IX)、又は(X)：

【化 8】

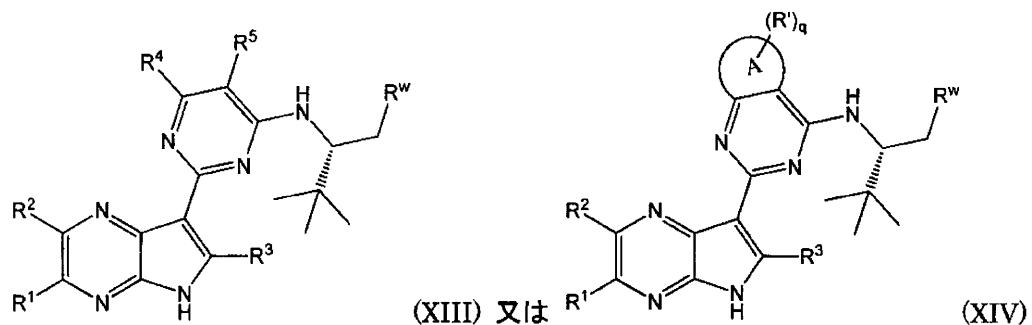
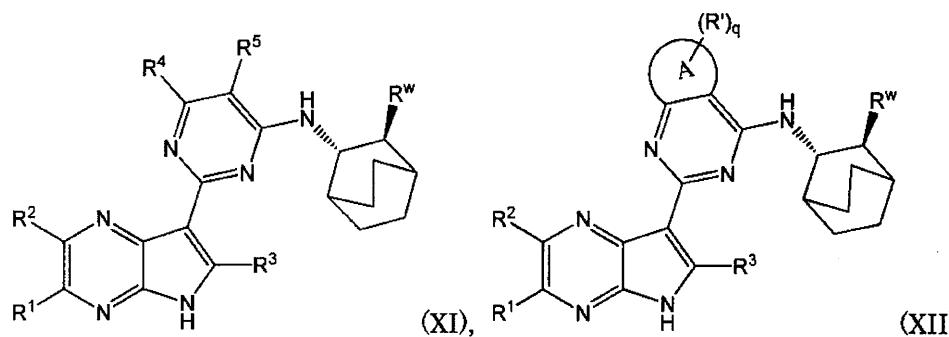


を有する請求項 1 ~ 14 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 16】

以下の化学式 (X I)、(X I I)、(X I I I)、又は (X I V) :

【化9】

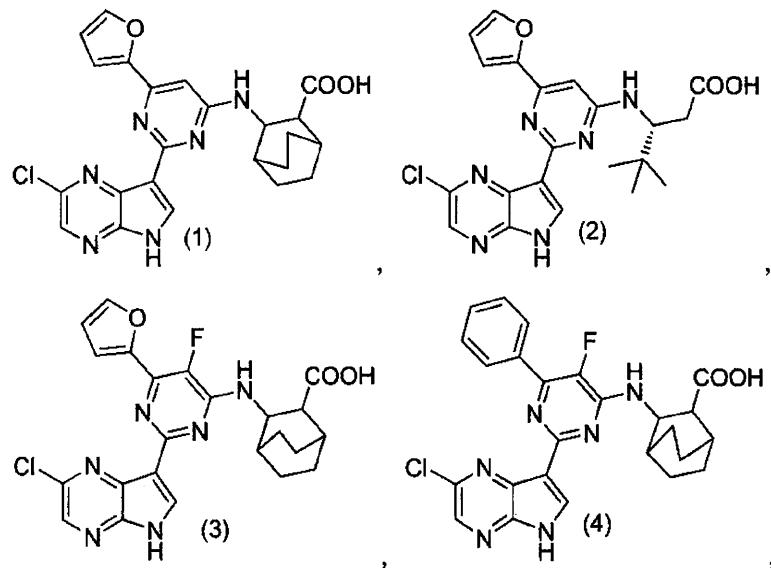


を有する請求項 1 ~ 15 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 17】

以下の化学構造 :

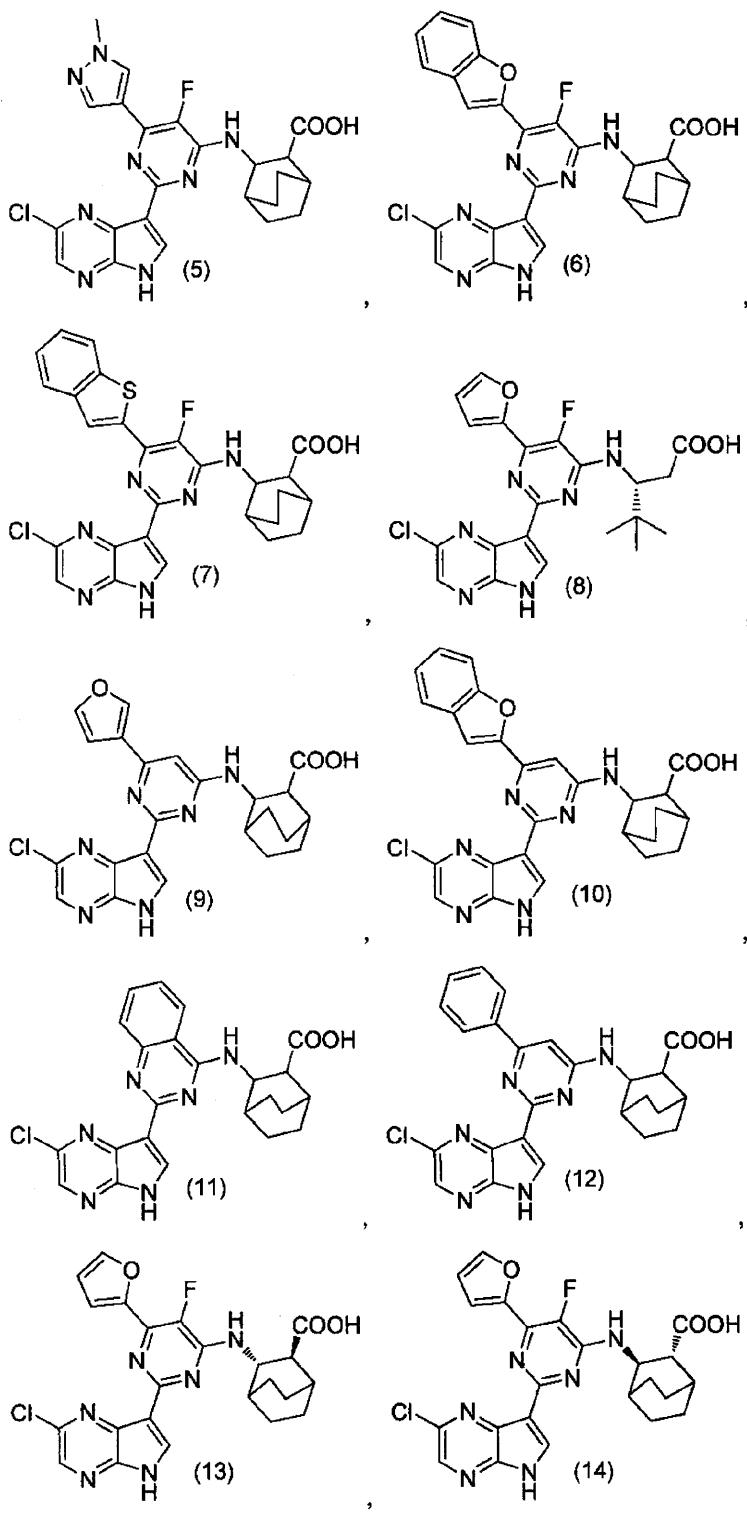
【化10-1】



(つづく)

【化10-2】

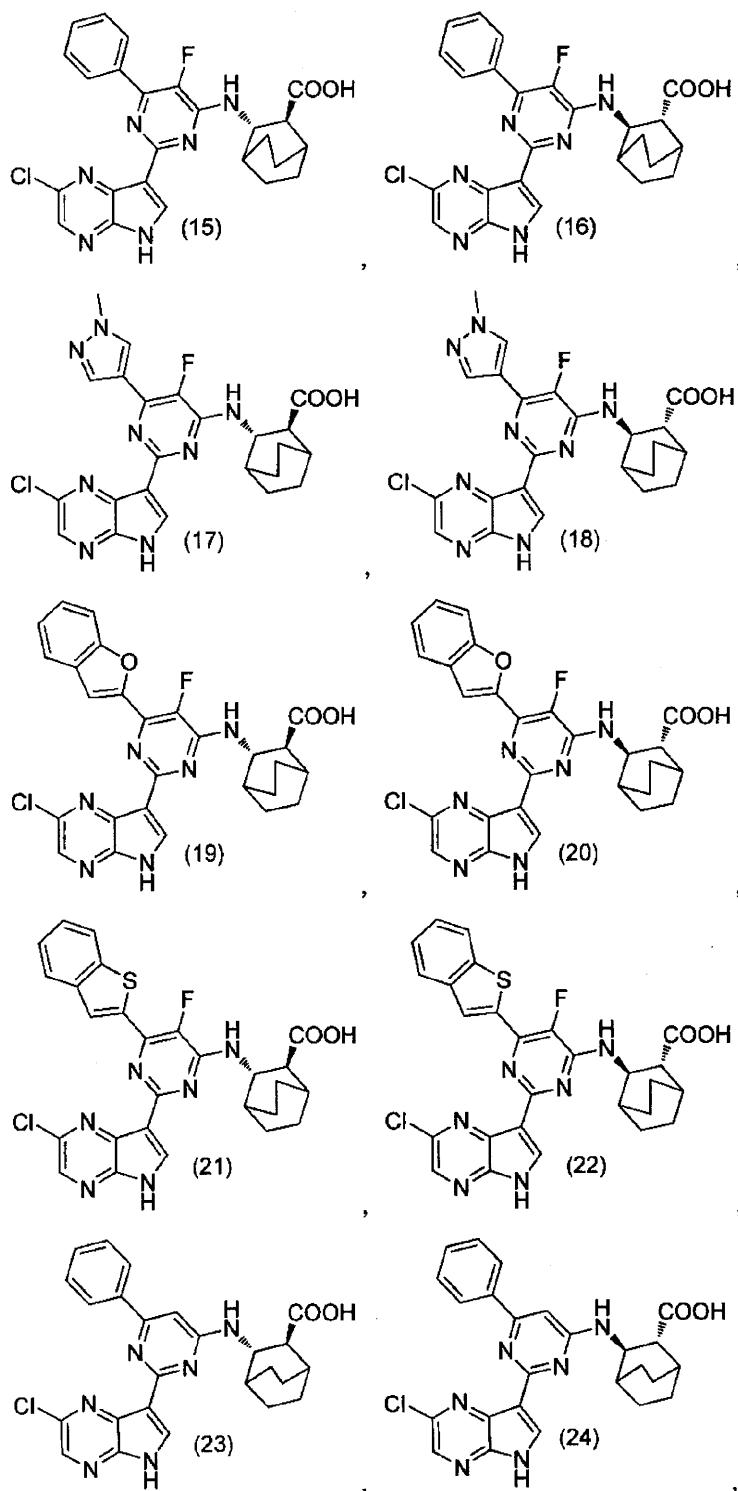
(つづき)



(つづく)

【化10-3】

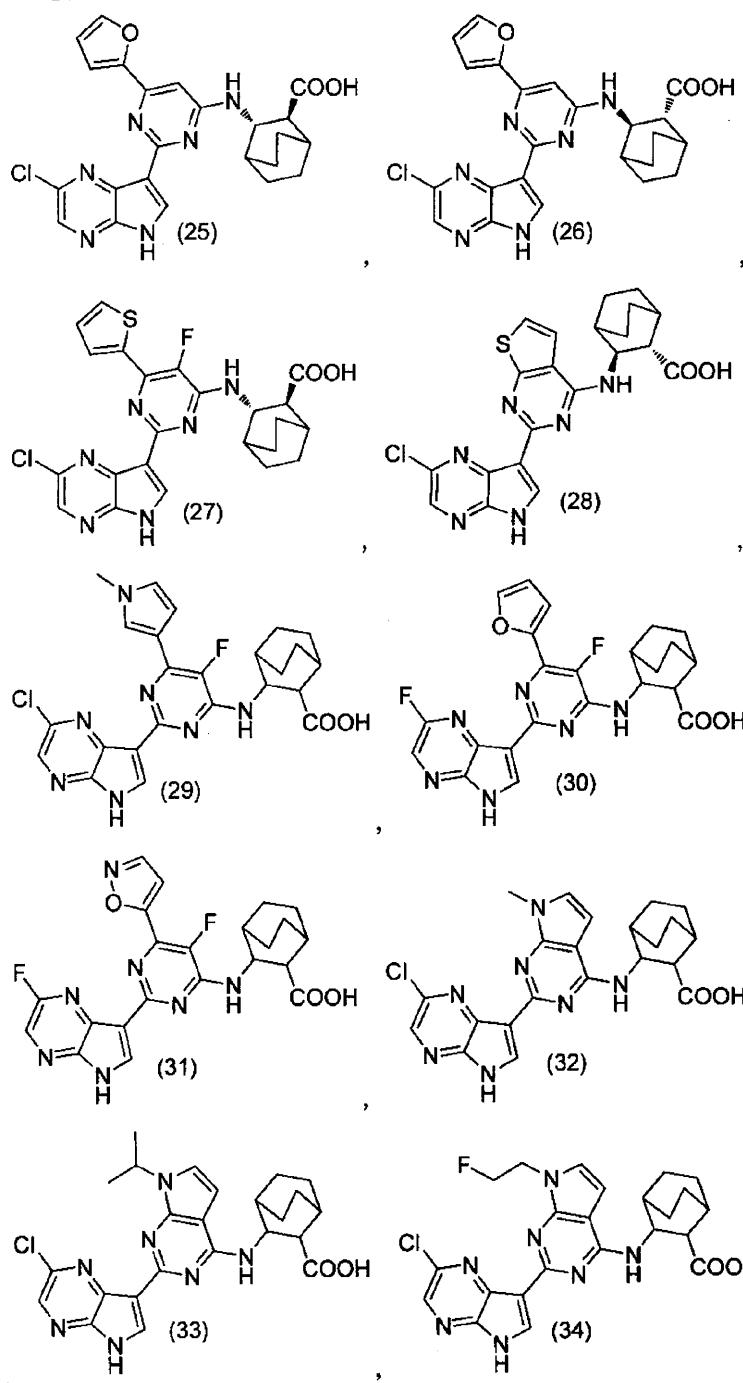
(つづき)



(つづく)

【化10-4】

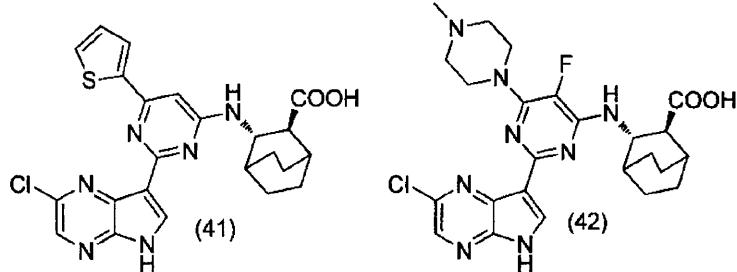
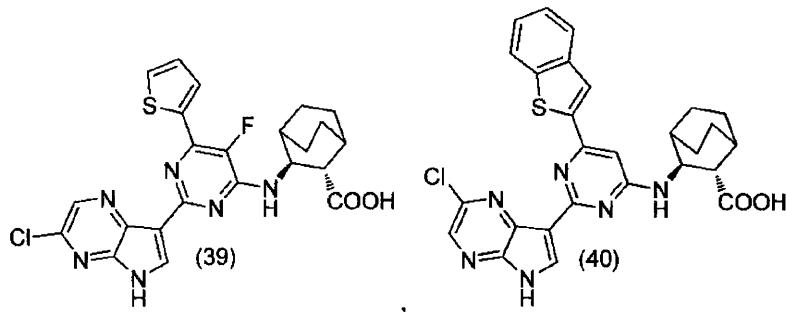
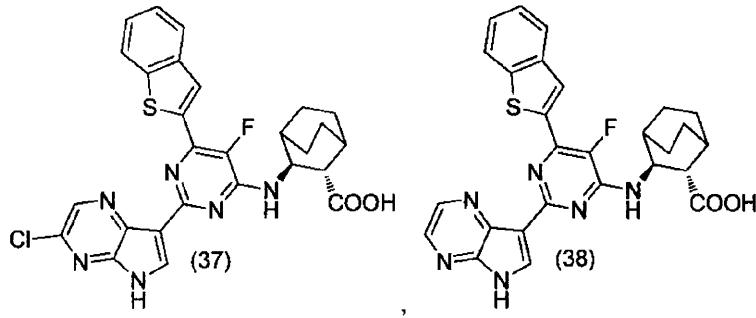
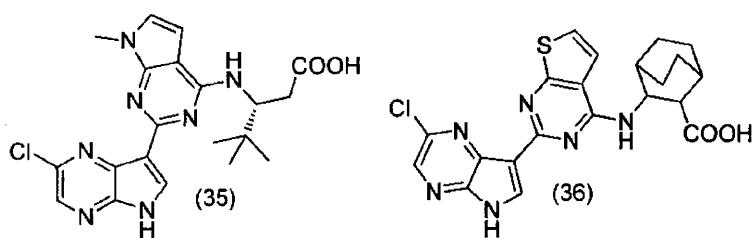
(つづき)



(つづく)

【化10-5】

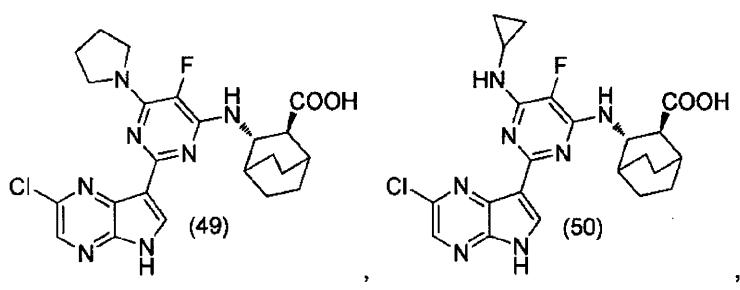
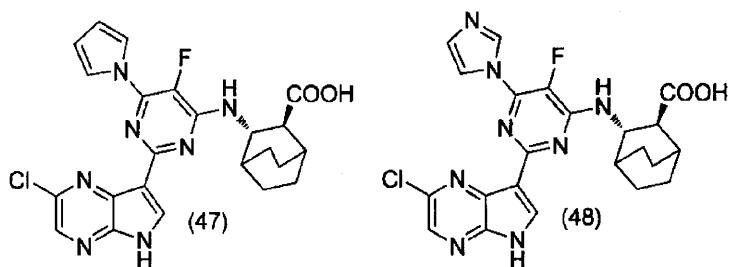
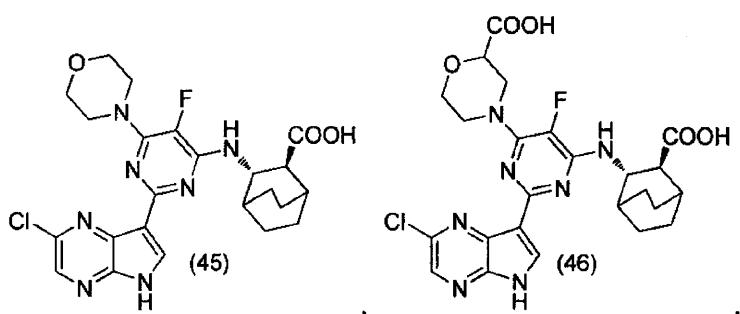
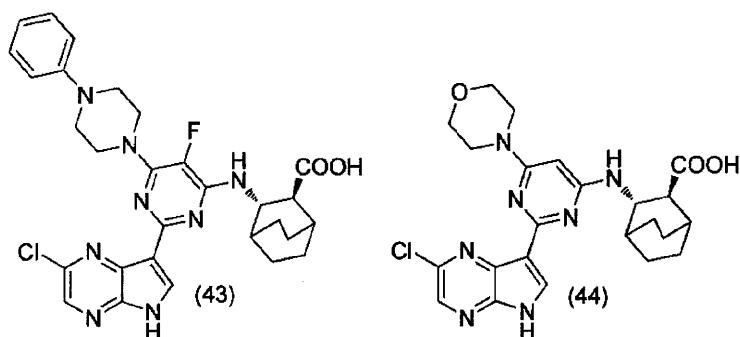
(つづき)



(つづく)

【化10-6】

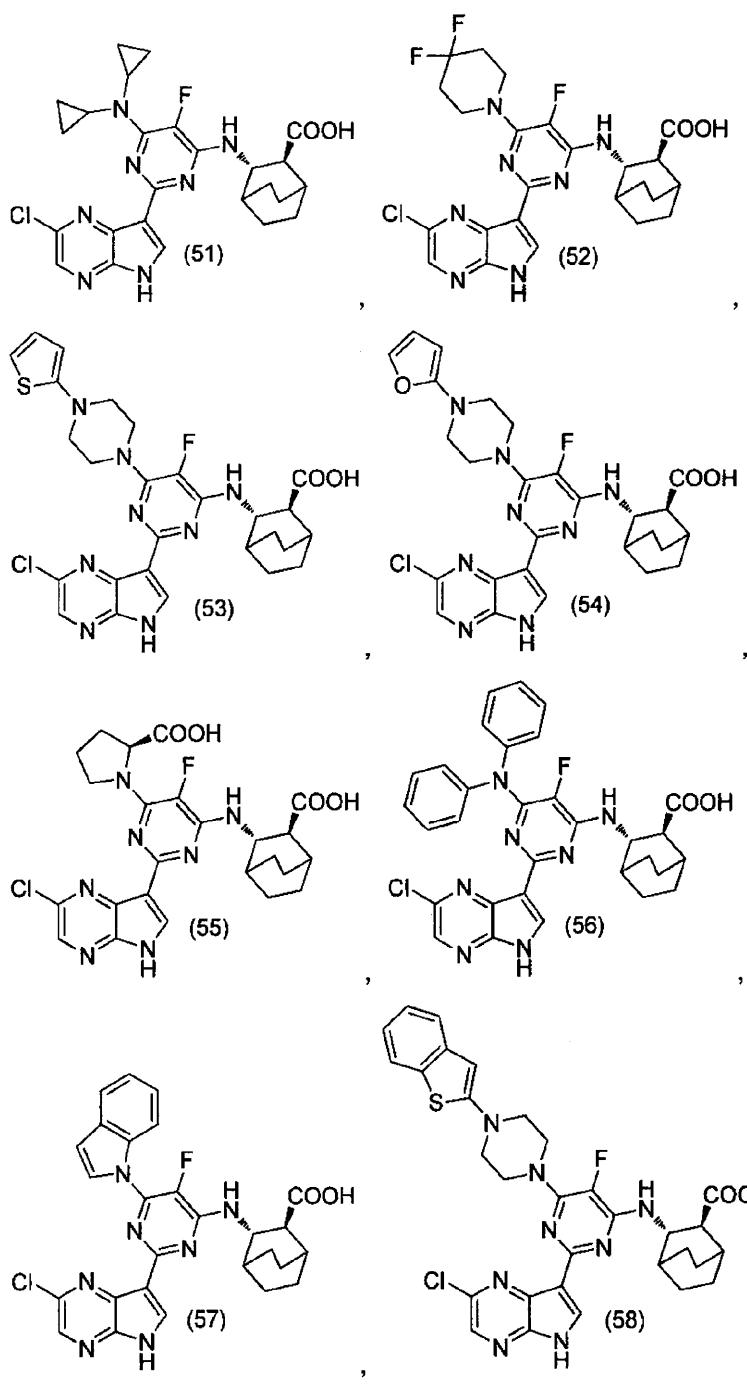
(つづき)



(つづく)

【化10-7】

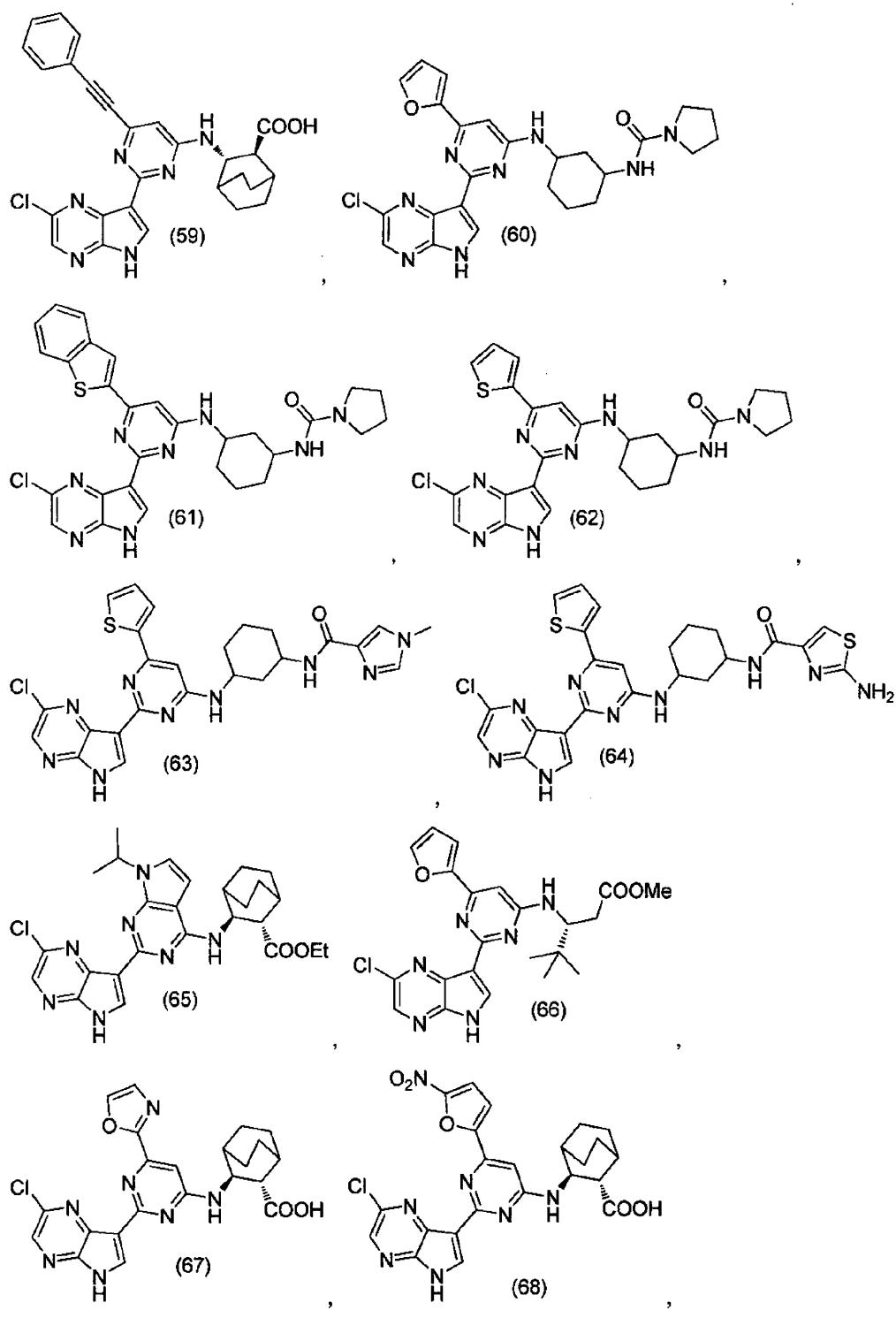
(つづき)



(つづく)

【化10-8】

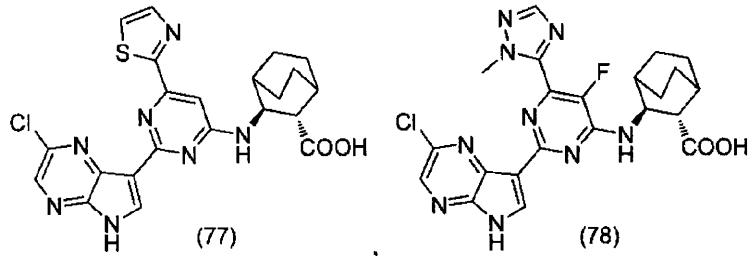
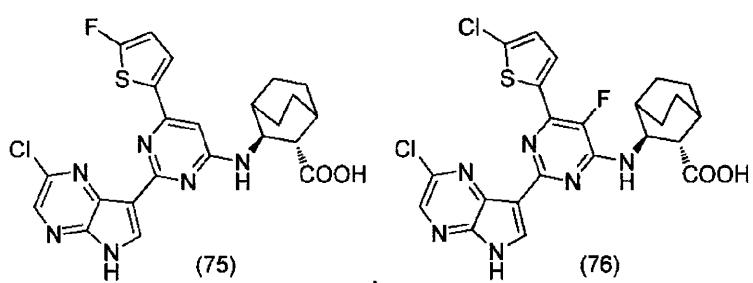
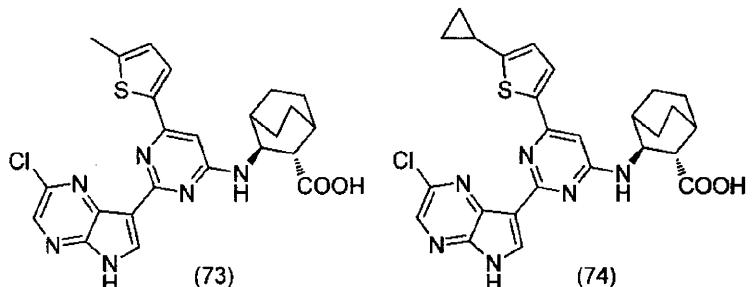
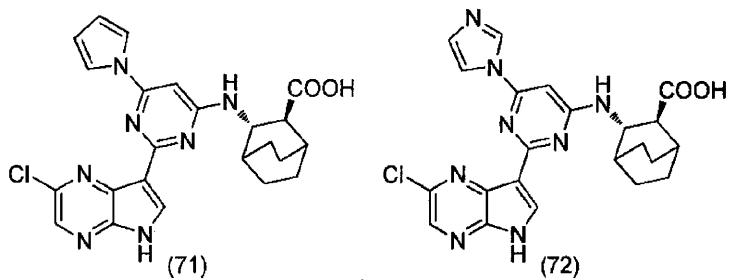
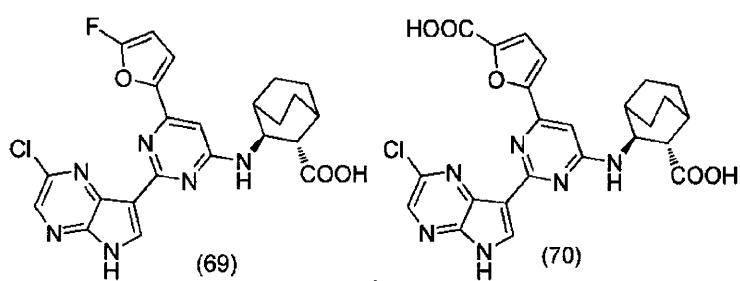
(つづき)



(つづく)

【化10-9】

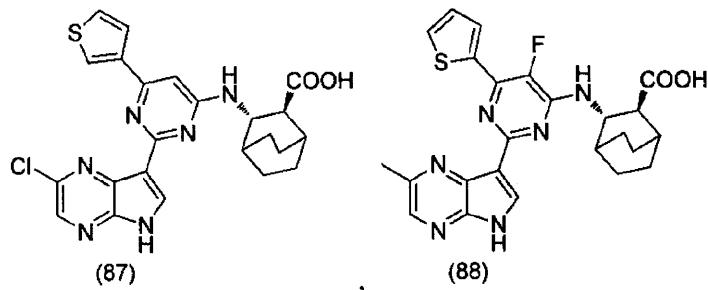
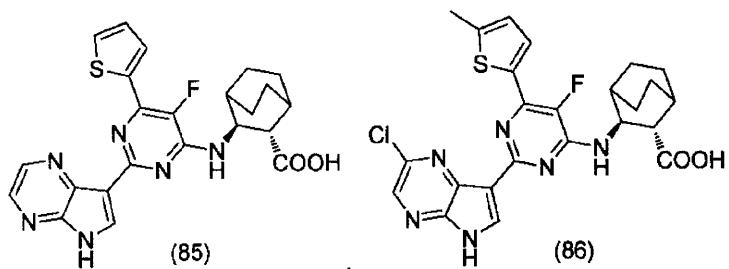
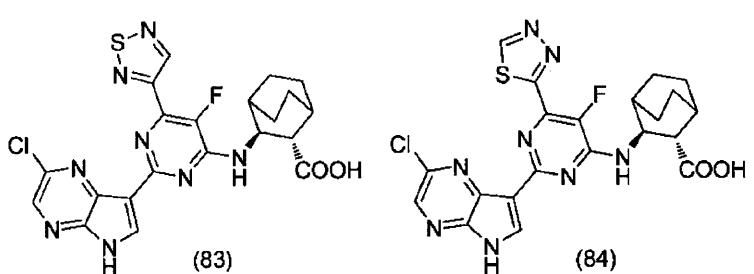
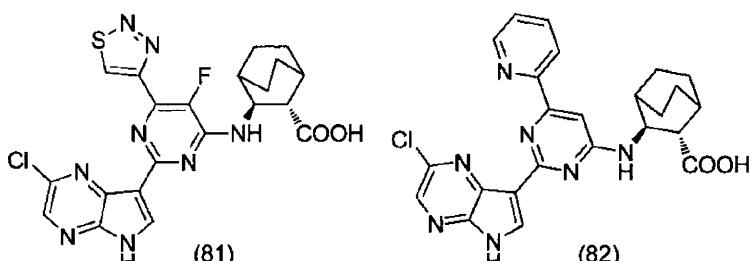
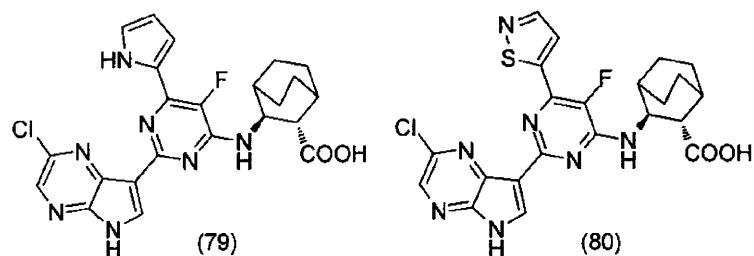
(つづき)



(つづく)

【化 1 0 - 1 0】

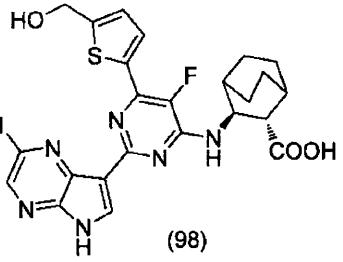
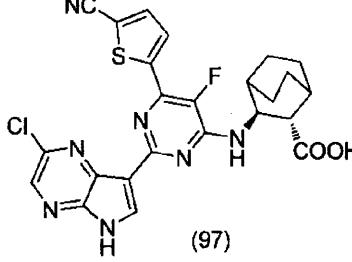
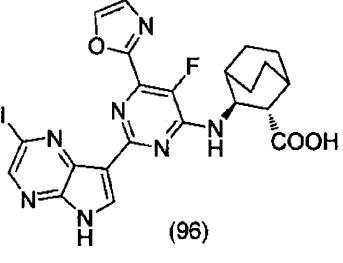
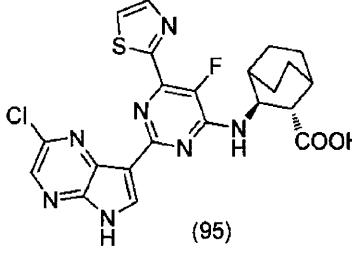
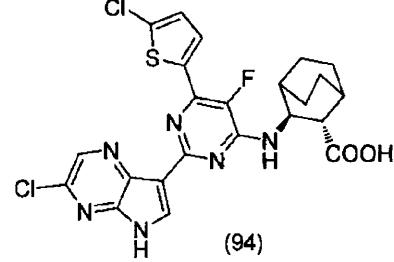
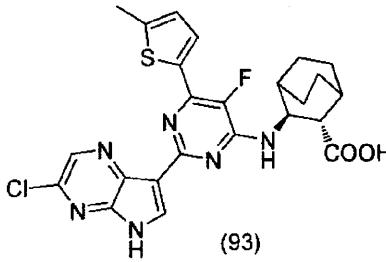
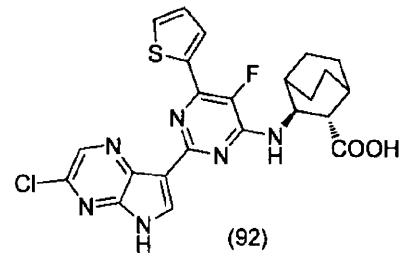
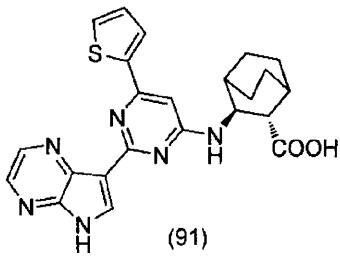
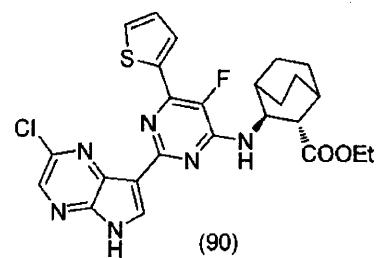
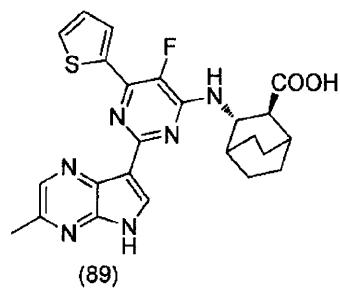
(つづき)



(つづく)

【化10-11】

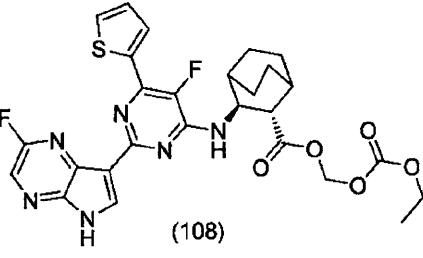
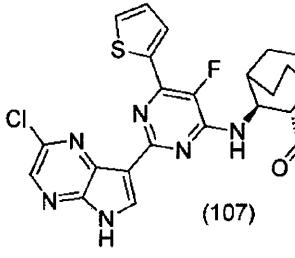
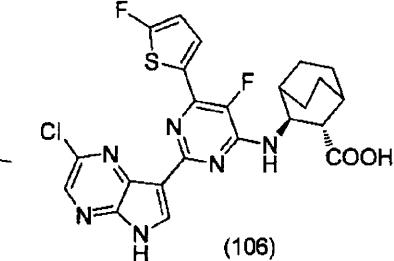
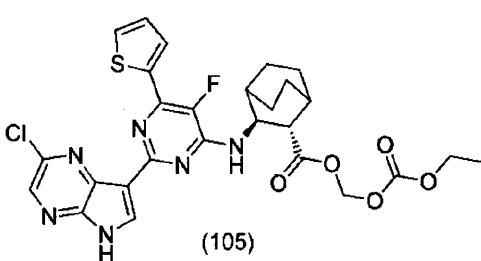
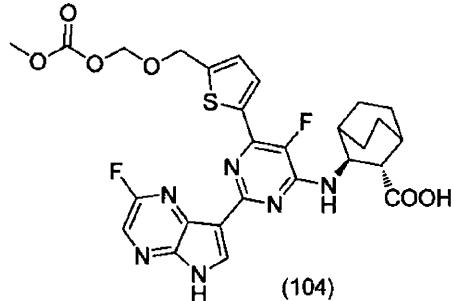
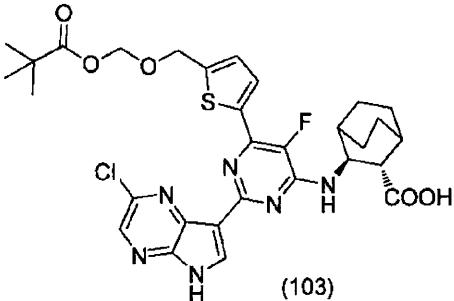
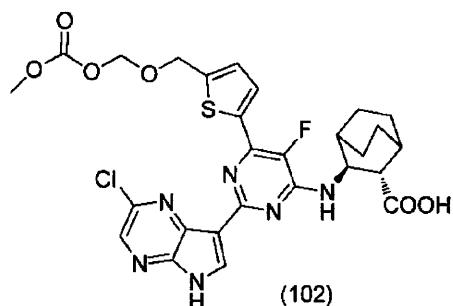
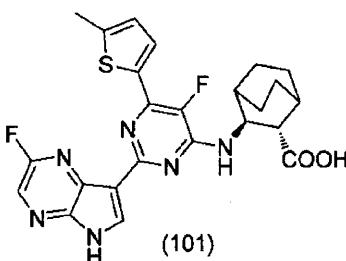
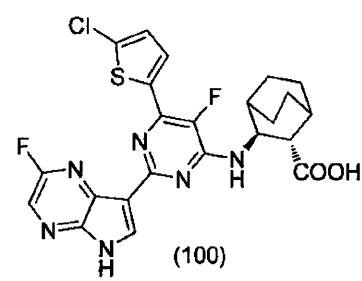
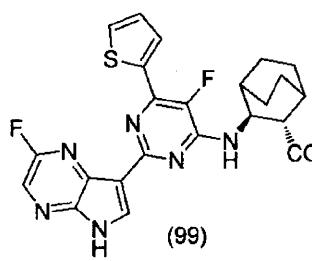
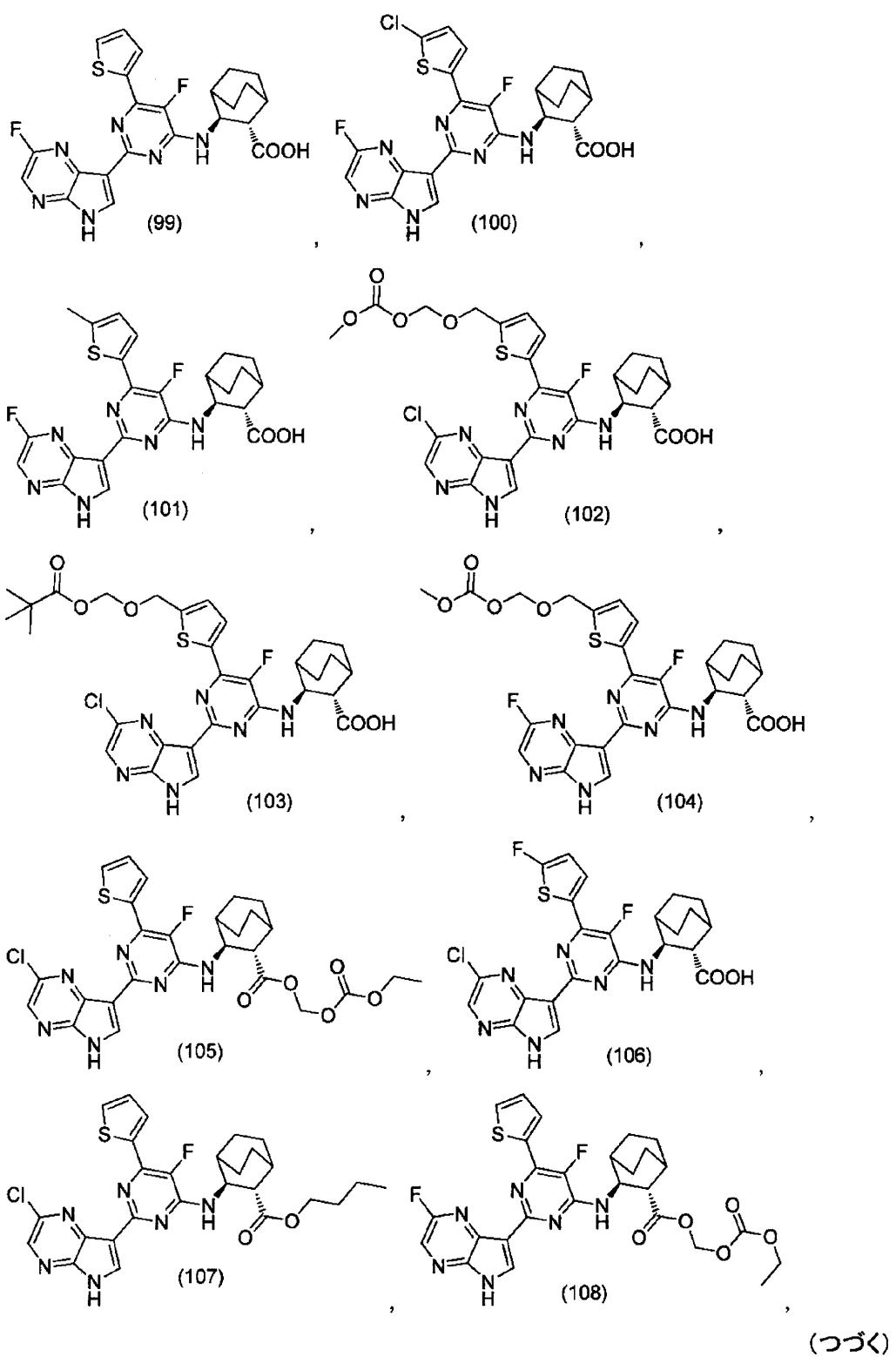
(つづき)



(つづく)

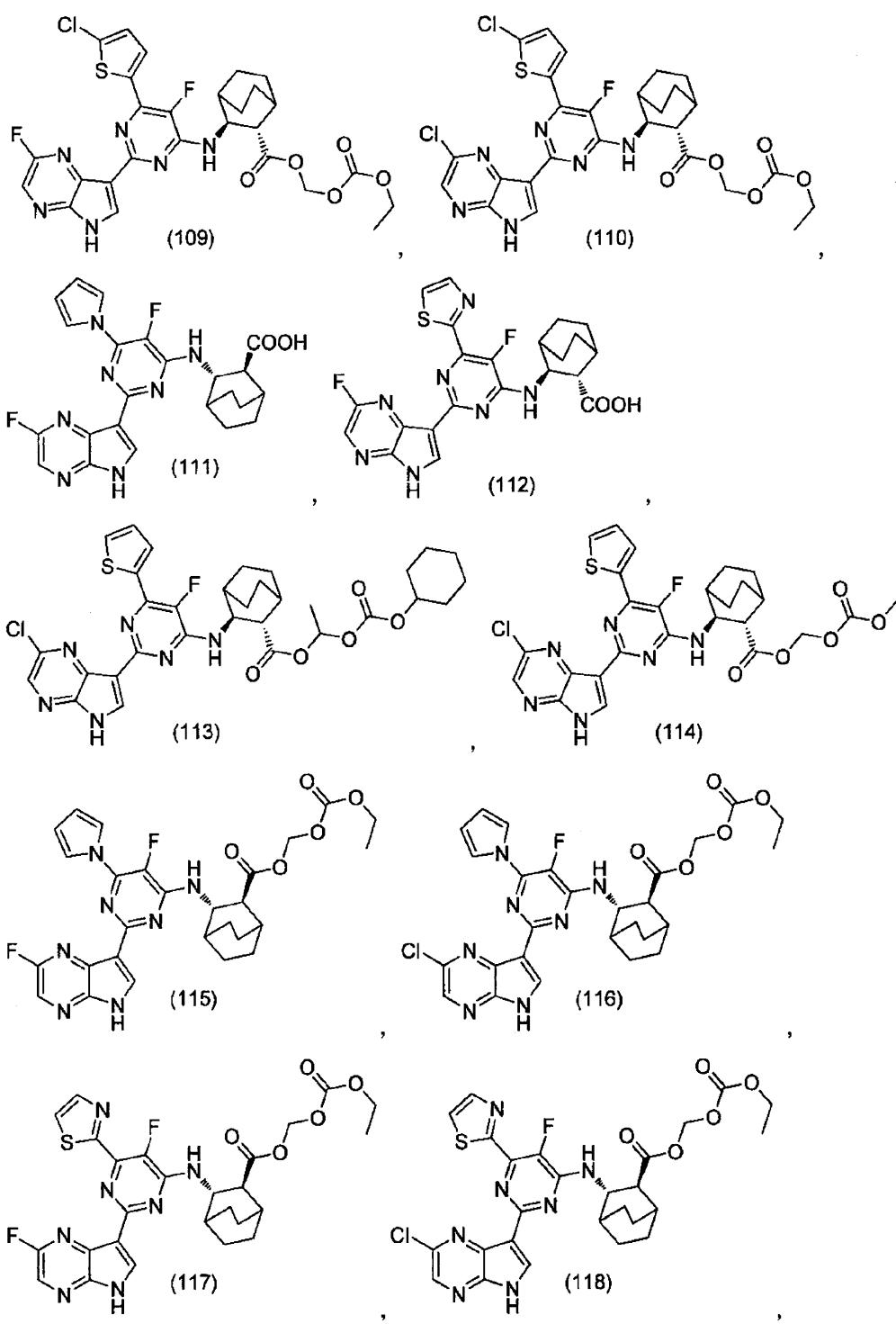
【化10-12】

(つづき)



【化 1 0 - 1 3】

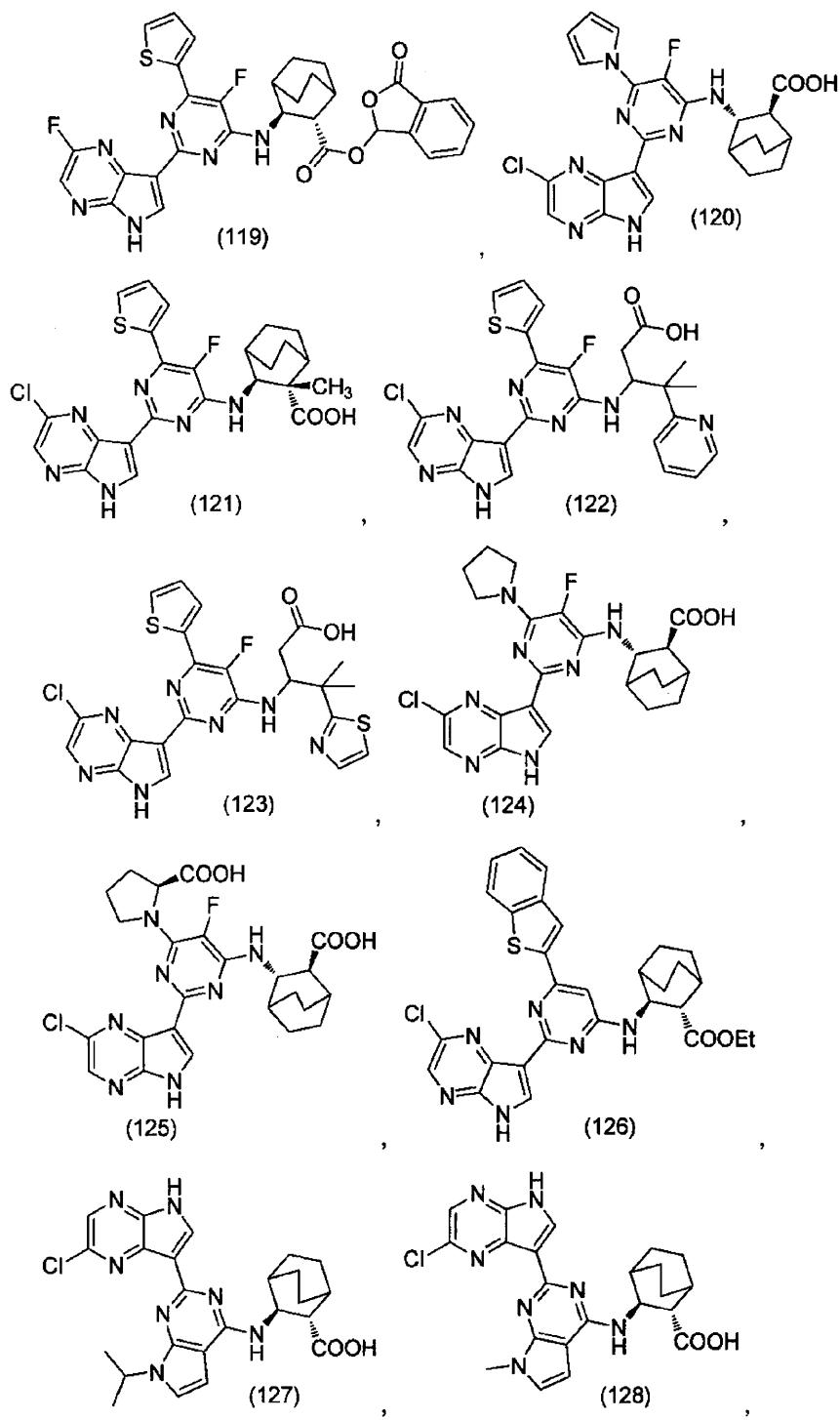
(つづき)



(つづく)

【化10-14】

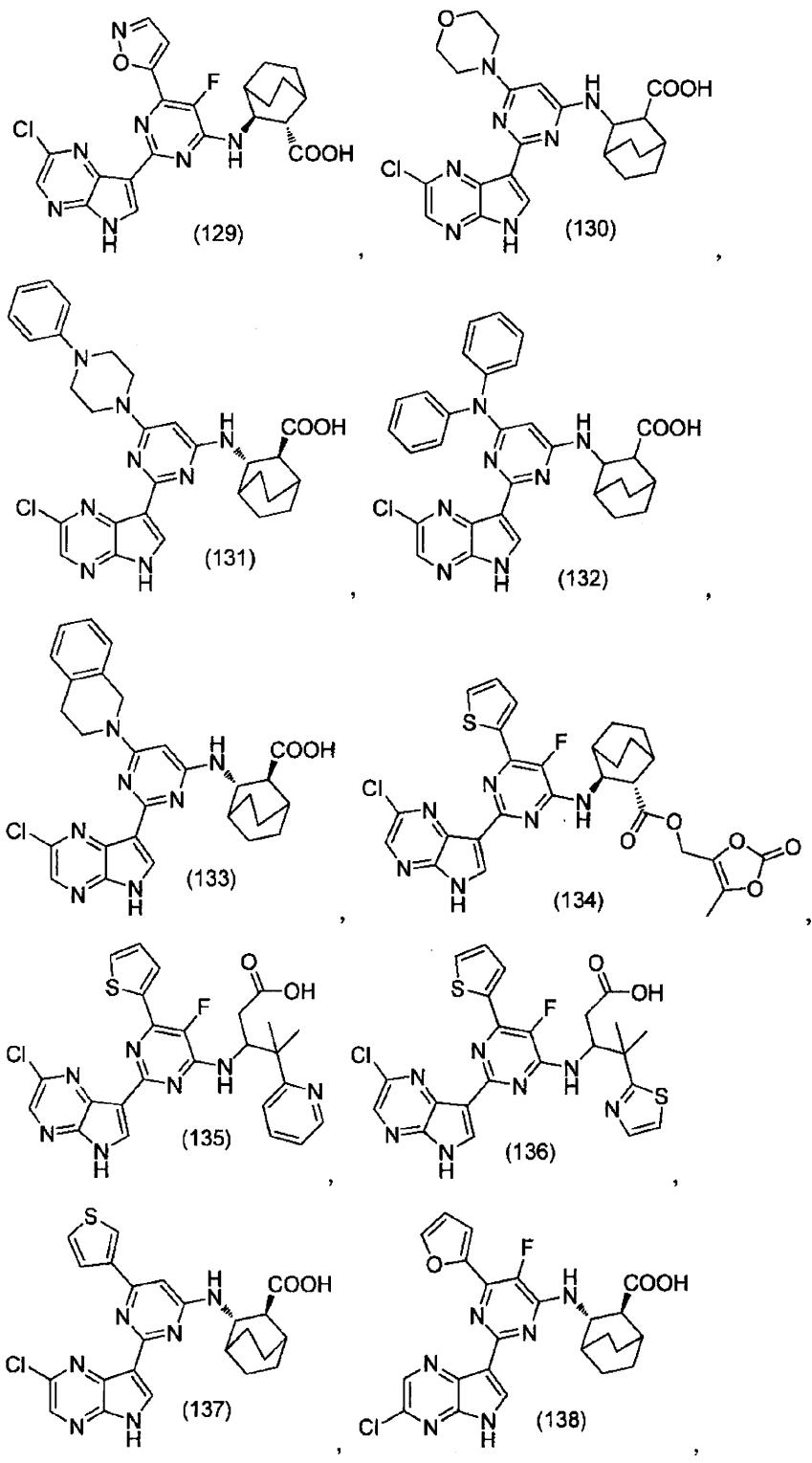
(つづき)



(つづく)

【化10-15】

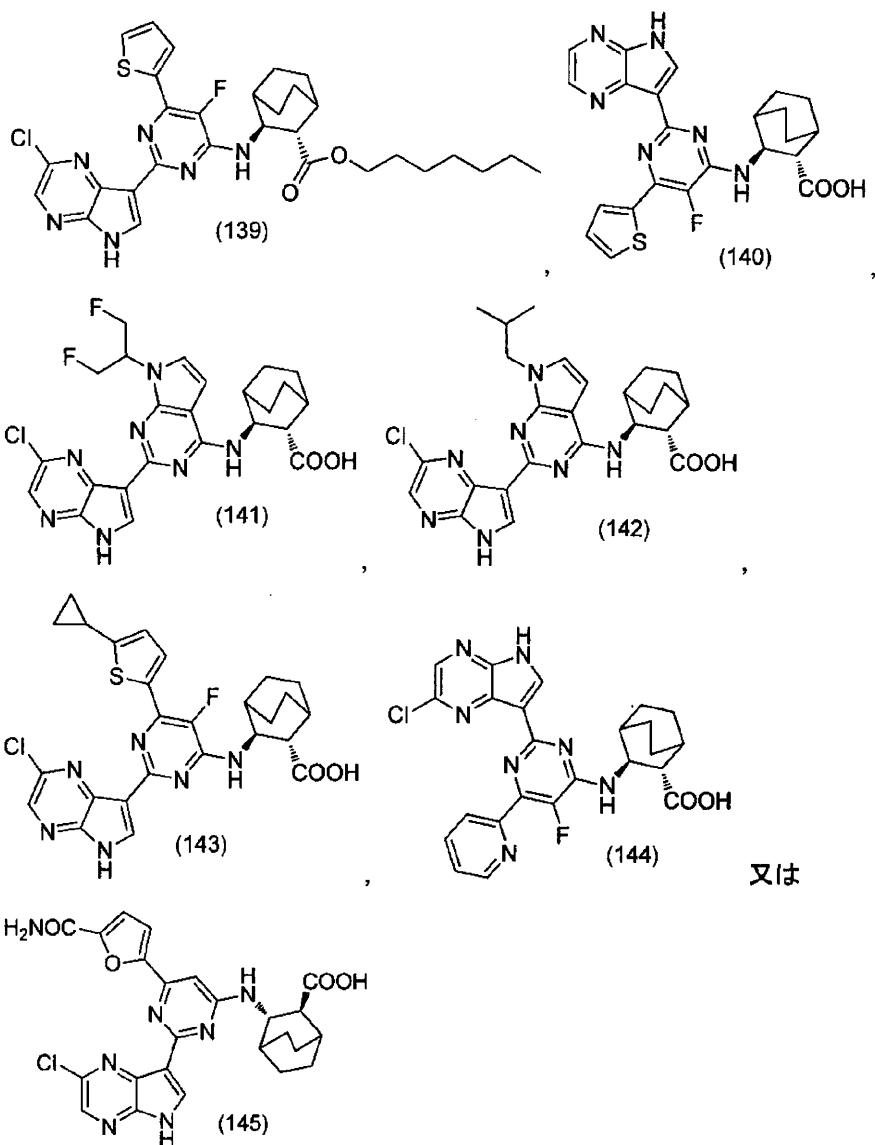
(つづき)



(つづく)

【化10-16】

(つづき)



のうち1つを有する請求項1～16の何れか1項に記載の化合物又はその立体異性体、互変異性体、N-オキシド、溶媒和物、代謝物、薬学的に許容され得る塩、若しくはプロドラッグ。

【請求項18】

請求項1～17の何れか1項に記載の化合物の有効量、および薬学的に許容され得る担体、賦形剤、ビヒクル又はその組み合わせを含む医薬組成物。

【請求項19】

1種以上の治療薬を更に含み、前記治療薬は抗インフルエンザウイルス薬、又は抗インフルエンザウイルスワクチンである、請求項18記載の医薬組成物。

【請求項20】

前記治療薬がアマンタジン、リマンタジン、オセルタミビル、ザナミビル、ペラミビル、ラニナミビル、ラニナミビルオクタノ酸エステル水和物、ファビピラビル、アルビドール、リバピリン、スタキフリン、インガビリン、フルダーゼ、C A S n o . 1 4 2 2 0 5 0 - 7 5 - 6、J N J - 8 7 2、S - 0 3 3 1 8 8、インフルエンザワクチン、又はその組み合わせである請求項19記載の医薬組成物。

【請求項21】

治療対象体のインフルエンザウイルス感染によって引き起こされる障害又は疾患を予防

し、管理し、治療し、又は緩和することにおける使用のための請求項 1 ~ 17 の何れか 1 項に記載の化合物、又は請求項 18 ~ 20 の何れか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

インフルエンザウイルスの R N A ポリメラーゼを阻害することにおける使用のための請求項 1 ~ 17 のうち何れか 1 項に記載の化合物、又は請求項 18 ~ 20 のうち何れか 1 項に記載の医薬組成物。