

【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 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/16 (2006.01)

A 6 1 K 31/4985 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 487/04 1 4 0

C 0 7 D 487/04 C S P

A 6 1 P 43/00 1 2 3

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 P 31/16

A 6 1 K 31/4985

C 0 7 D 519/00 3 1 1

C 0 7 D 519/00 3 0 1

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 45/00

A 6 1 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

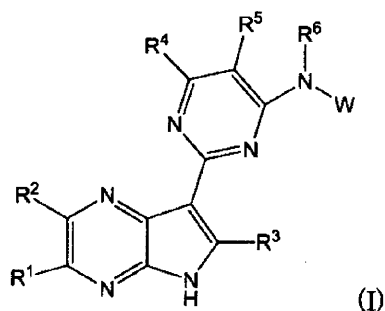
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$  及び  $R^3$  の各々は、独立に、 $H$ 、 $D$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)OR^b$ 、 $-C(=O)NR^cR^d$ 、 $OR^b$ 、 $-NR^cR^d$ 、 $R^bO-C_{1-4}$  アルキレン、 $R^dR^cN-C_{1-4}$  アルキレン、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、又は  $C_{2-6}$  アルキニルであるか、又は、 $R^1$  及び  $R^2$  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、5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、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{3-6}$  炭素環式環、5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  $D$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $CN$ 、 $OR^b$ 、 $-NR^cR^d$ 、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  ハロアルキル、 $R^bO-C_{1-4}$  アルキレン又は  $R^dR^cN-C_{1-4}$  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；

$R^4$  は、 $OR^b$ 、 $-NR^cR^d$ 、 $C_{2-6}$  アルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{3-12}$  カルボシクリル、 $C_{3-12}$  カルボシクリル- $C_{1-4}$  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)- $C_{1-4}$  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)- $C_{1-4}$  アルキレンであり、ここで、 $C_{2-6}$  アルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{3-12}$  カルボシクリル、 $C_{3-12}$  カルボシクリル- $C_{1-4}$  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)- $C_{1-4}$  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)- $C_{1-4}$  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、若しくは5個の  $R'$  で置換されており；

$R^5$  は、 $H$ 、 $D$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)OR^b$ 、 $-C(=O)NR^cR^d$ 、 $OR^b$ 、 $-NR^cR^d$ 、 $R^bO-C_{1-4}$  アルキレン、 $R^dR^cN-C_{1-4}$  アルキレン、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{3-12}$  シクロアルキル、 $C_{3-12}$  シクロアルキル- $C_{1-4}$  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)- $C_{1-4}$  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)- $C_{1-4}$  アルキレンであり、ここで、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{3-12}$  シクロアルキル、 $C_{3-12}$  シクロアルキル- $C_{1-4}$  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)- $C_{1-4}$  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)- $C_{1-4}$  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、若しくは5個の  $R'$  で置換されており、

或いは、 $R^4$  及び  $R^5$  は、それらが結合している炭素原子と一緒に  $C_{3-12}$  炭素環式環、3員から12員までのヘテロ環式環、 $C_{6-10}$  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、 $C_{3-12}$  炭素環式環、3員から12員までのヘテロ環式環、 $C_{6-10}$  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  $D$ 、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $OR^b$ 、 $-NR^cR^d$ 、 $R^bO-C_{1-4}$  アルキレン、 $R^dR^cN-C_{1-4}$  アルキレン、 $R^a-C(=O)-O-C_{1-4}$  アルキレン- $O-C_{1-4}$  アルキレン、 $R^bO-C(=O)-O-C_{1-4}$  アルキレン- $O-C_{1-4}$  アルキレン、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)OR^b$ 、 $-C(=O)NR^cR^d$ 、 $C_{1-12}$  アルキル、 $C_{1-6}$  ハロアルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル- $C_{1-4}$  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)- $C_{1-4}$  アルキレン、 $C_{6-10}$  アリール、 $C_{6-10}$

アリーール -  $C_{1-4}$  アルキレン、5員から10員までのヘテロアリーール又は(5員から10員までのヘテロアリーール) -  $C_{1-4}$  アルキレンであり、ここで、 $C_{1-12}$  アルキル、 $C_{1-6}$  ハロアルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル -  $C_{1-4}$  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)  $C_{1-4}$  アルキレン、 $C_{6-10}$  アリーール、 $C_{6-10}$  アリーール -  $C_{1-4}$  アルキレン、5員から10員までのヘテロアリーール及び(5員から10員までのヘテロアリーール) -  $C_{1-4}$  アルキレンの各々は、独立に無置換であるか、又はD、F、Cl、Br、CN、 $NO_2$ 、 $OR^b$ 、 $-NR^cR^d$ 、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  ハロアルキル、 $R^bO-C_{1-4}$  アルキレン、若しくは $R^dR^cN-C_{1-4}$  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、

$R^6$  は、H、D、又は $C_{1-6}$  アルキルであり、ここで、 $C_{1-6}$  アルキルは、任意に、D、F、Cl、Br、CN、 $NO_2$ 、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、 $C_{1-8}$  アルキル、 $C_{3-12}$  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、 $C_{1-8}$  アルキル、 $C_{3-12}$  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、Cl、Br、CN、 $NO_2$ 、 $=O$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)OR^b$ 、 $-C(=O)-O-C_{1-4}$  アルキレン -  $O-C(=O)-OR^b$ 、 $-C(=O)NR^cR^d$ 、 $-NR^eC(=O)R^a$ 、 $-NR^eC(=O)NR^cR^d$ 、 $-S(=O)_2R^f$ 、 $-S(=O)_2NR^eC(=O)R^a$ 、 $-S(=O)_2NR^cR^d$ 、 $(R^bO)_2P(=O)-C_{0-2}$  アルキレン、 $OR^b$ 、 $R^bO-C_{1-2}$  アルキレン、 $R^dR^cN-C_{1-2}$  アルキレン、 $C_{1-6}$  アルキル、5員から6員までのヘテロアリーール、又は5員から6員までのヘテロシクリルであり、ここで、 $C_{1-6}$  アルキル、5員から6員までのヘテロアリーール、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、Cl、Br、CN、 $N_3$ 、 $=O$ 、 $NO_2$ 、 $OR^b$ 、 $C_{1-6}$  アルキル又は $C_{1-6}$  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、 $C_{1-6}$  ハロアルキル、 $C_{1-6}$  アルキル、 $n$ -ヘブチル、 $C_{1-6}$  アルコキシ、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{3-6}$  カルボシクリル、 $C_{3-6}$  カルボシクリル -  $C_{1-4}$  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) -  $C_{1-4}$  アルキレン、 $C_{6-10}$  アリーール、 $C_{6-10}$  アリーール -  $C_{1-4}$  アルキレン、5員から10員までのヘテロアリーール又は(5員から10員までのヘテロアリーール) -  $C_{1-4}$  アルキレンであり、ここで、 $C_{1-6}$  アルキル、 $n$ -ヘブチル、 $C_{1-6}$  アルコキシ、 $C_{2-6}$  アルケニル、 $C_{2-6}$  アルキニル、 $C_{3-6}$  カルボシクリル、 $C_{3-6}$  カルボシクリル -  $C_{1-4}$  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) -  $C_{1-4}$  アルキレン、 $C_{6-10}$  アリーール、 $C_{6-10}$  アリーール -  $C_{1-4}$  アルキレン、5員から10員までのヘテロアリーール及び(5員から10員までのヘテロアリーール) -  $C_{1-4}$  アルキレンの各々は、独立に無置換であるか、又はD、F、Cl、CN、OH、 $NH_2$ 、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  ハロアルキル、 $C_{1-6}$  アルコキシ又は $C_{1-6}$  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ールの各々は、独立に無置換であるか、又はD、F、Cl、CN、OH、 $NH_2$ 、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  ハロアルキル、 $C_{1-6}$  アルコキシ又は $C_{1-6}$  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)

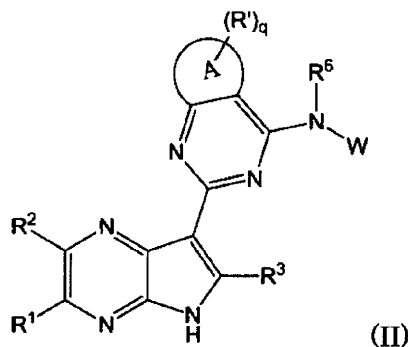
を有する化合物、又はその立体異性体、互変異性体、N-オキシド、溶媒和物、代謝物、

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 (II)

【化 2】



(式中、A は、 $C_{3-12}$  炭素環式環、3 員から 12 員までのヘテロ環式環、 $C_{6-10}$  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  $C_{3-6}$  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である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

A は  $C_{3-6}$  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、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】

$R^4$  は  $OR^b$ 、 $-NR^cR^d$ 、 $C_{2-4}$  アルキル、 $C_{2-4}$  アルケニル、 $C_{2-4}$  アルキニル、 $C_{3-6}$  カルボシクリル、 $C_{3-6}$  カルボシクリル- $C_{1-4}$  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)- $C_{1-4}$  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 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)- $C_{1-4}$  アルキレンであり、ここで、 $C_{2-4}$  アルキル、 $C_{2-4}$  アルケニル、 $C_{2-4}$  アルキニル、 $C_{3-6}$  カルボシクリル、 $C_{3-6}$  カルボシクリル- $C_{1-4}$  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)- $C_{1-4}$  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 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)- $C_{1-4}$  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、

$R^5$  は、H、D、F、Cl、Br、CN、 $NO_2$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)OR^b$ 、 $-C(=O)NR^cR^d$ 、 $OR^b$ 、 $-NR^cR^d$ 、 $C_{1-3}$  アルキル、 $C_{2-4}$  アルケニル、 $C_{2-4}$  アルキニル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル- $C_{1-4}$  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)- $C_{1-4}$  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、又は (5 員から 6 員までのヘテロアリール)- $C_{1-4}$  アルキレンであり、ここで、 $C_{1-3}$  アルキル、 $C_{2-4}$  アルケニル、 $C_{2-4}$  アルキニル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル- $C_{1-4}$  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)- $C_{1-4}$  アルキレン、

$C_1 - 4$  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、

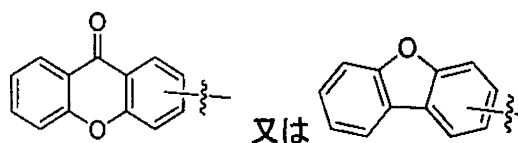
或いは、 $R^4$  及び  $R^5$  は、それらが結合している炭素原子と一緒に、 $C_3 - 6$  炭素環式環、3員から6員までのヘテロ環式環、 $C_6 - 10$  芳香環又は5員から6員までのヘテロ芳香環を形成し、ここで、 $C_3 - 6$  炭素環式環、3員から6員までのヘテロ環式環、 $C_6 - 10$  芳香環、及び5員から6員までのヘテロ芳香環の各々は、独立に無置換であるか、又は1、2、3、4又は5個の $R'$ で置換されている、

請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

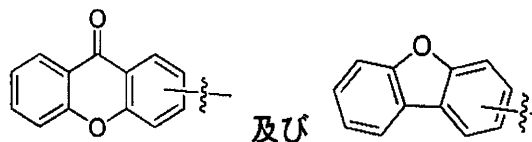
$R^4$  は  $OR^b$ 、 $-NR^cR^d$ 、エチニル、プロピニル、 $C_3 - 6$  カルボシクリル、ピロリジニル、ピラゾリジニル、イミダゾリジニル、テトラヒドロフリル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、テトラヒドロイソキノリル、ピペリジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、フェニル、ナフチル、フリル、ベンゾフリル、ピロリル、ピリジル、ピラゾリル、イミダゾリル、ベンズイミダゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、1,3,5-トリアジニル、チアゾリル、チアジアゾリル、チエニル、ベンゾチエニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、インドリル、プリニル、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、プリニル、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、

$R^5$  は、H、D、F、Cl、Br、CN、 $NO_2$ 、メチル、エチル、又は*i*-プロピルであり、

或いは、 $R^4$  及び  $R^5$  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、チオフエン、ベンゾチオフエン、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】

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup> 及び R<sup>3</sup> の各々は、独立に H、D、F、Cl、Br、CN、NO<sub>2</sub>、-C(=O)R<sup>a</sup>、-C(=O)OR<sup>b</sup>、-C(=O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>、OR<sup>b</sup>、-NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>、メチル、エチル、n - プロピル、又は i - プロピルであるか、又は、R<sup>1</sup> 及び R<sup>2</sup> は、それらが結合している炭素原子と一緒に、C<sub>5</sub> - 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、C<sub>5</sub> - 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<sup>b</sup>、-NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>、若しくは C<sub>1</sub> - 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】

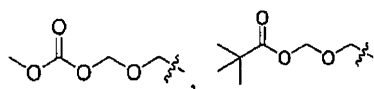
各 R' は、独立に D、F、Cl、Br、CN、NO<sub>2</sub>、OR<sup>b</sup>、-NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>、R<sup>a</sup>-C(=O)-O-C<sub>1</sub> - 2 アルキレン-O-C<sub>1</sub> - 2 アルキレン、R<sup>b</sup>O-C(=O)-O-C<sub>1</sub> - 2 アルキレン-O-C<sub>1</sub> - 2 アルキレン、-C(=O)R<sup>a</sup>、-C(=O)OR<sup>b</sup>、-C(=O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>、C<sub>1</sub> - 9 アルキル、C<sub>1</sub> - 3 ハロアルキル、C<sub>3</sub> - 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-C<sub>1</sub> - 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、C<sub>1</sub> - 9 アルキル、C<sub>1</sub> - 3 ハロアルキル、C<sub>3</sub> - 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-C<sub>1</sub> - 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、NO<sub>2</sub>、OR<sup>b</sup>、-NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>、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、NO<sub>2</sub>、OR<sup>b</sup>、-NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>、

【化 5】



-C(=O)R<sup>a</sup>、-C(=O)OR<sup>b</sup>、-C(=O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、n - ブチル、i - ブチル、t - ブチル、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、ペペリジル、モルホリニル、チオモルホリニル、ペペラジニル、フェニル、フェニル-C<sub>1</sub> - 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 - ブチル、i - ブチル、t - ブチル、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、テトラヒドロフラン、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-C<sub>1-2</sub>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、Cl、Br、CN、NO<sub>2</sub>、OH、-NH<sub>2</sub>、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】

R<sup>6</sup>はH、D、CF<sub>3</sub>、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。

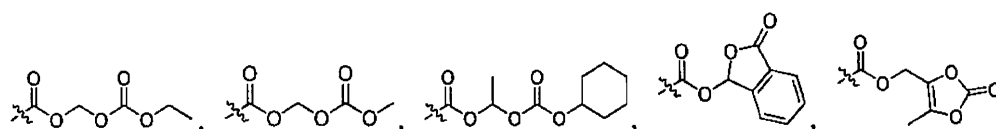
【請求項11】

WはC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>5-8</sub>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、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>5-8</sub>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<sup>W</sup>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<sup>W</sup>はD、F、Cl、Br、CN、NO<sub>2</sub>、=O、-C(=O)OCH<sub>3</sub>、-C(=O)OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-C(=O)OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-C(=O)O(CH<sub>2</sub>)<sub>6</sub>CH<sub>3</sub>、-C(=O)OH、

【化6】



-C(=O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>、-NHC(=O)R<sup>a</sup>、-NHC(=O)NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>R<sup>f</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>NHC(=O)R<sup>a</sup>、-S(=O)<sub>2</sub>NR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>、(R<sup>b</sup>O)<sub>2</sub>P(=O)-C<sub>0-2</sub>アルキレン、OR<sup>b</sup>、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、フリル、ピロリル、ピリジニル、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、ピリミジニル、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、ピリジニル、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、ピリミジニル、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、Cl、Br、CN、N<sub>3</sub>、=O、NO<sub>2</sub>、-OCH<sub>3</sub>、C<sub>1-3</sub>アルキル、若しくはC<sub>1-3</sub>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<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>e</sup>、及びR<sup>f</sup>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、C<sub>3-6</sub>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)-C<sub>1-4</sub>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、 $C_3 - 6$ 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、及び(5員から10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D、F、Cl、CN、OH、 $NH_2$ 、 $C_1 - 3$ アルキル、 $C_1 - 3$ 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、

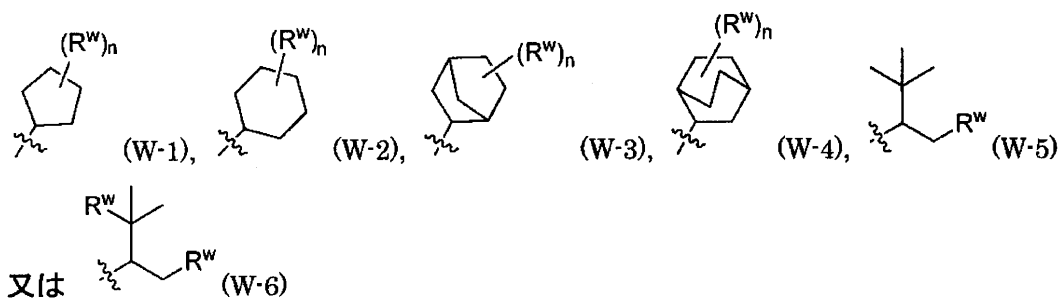
或いは、 $R^c$ 及び $R^d$ は、それらが結合している窒素原子と一緒に、5員から6員までのヘテロシクリル、又は5員から6員までのヘテロアリールを形成しており、ここで、5員から6員までのヘテロシクリル、及び5員から6員までのヘテロアリールの各々は、独立に無置換であるか、又はD、F、Cl、CN、OH、 $NH_2$ 、 $C_1 - 3$ アルキル、 $C_1 - 3$ ハロアルキル又はメトキシから独立に選択される1、2、3又は4個の置換基によって置換されている、

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、

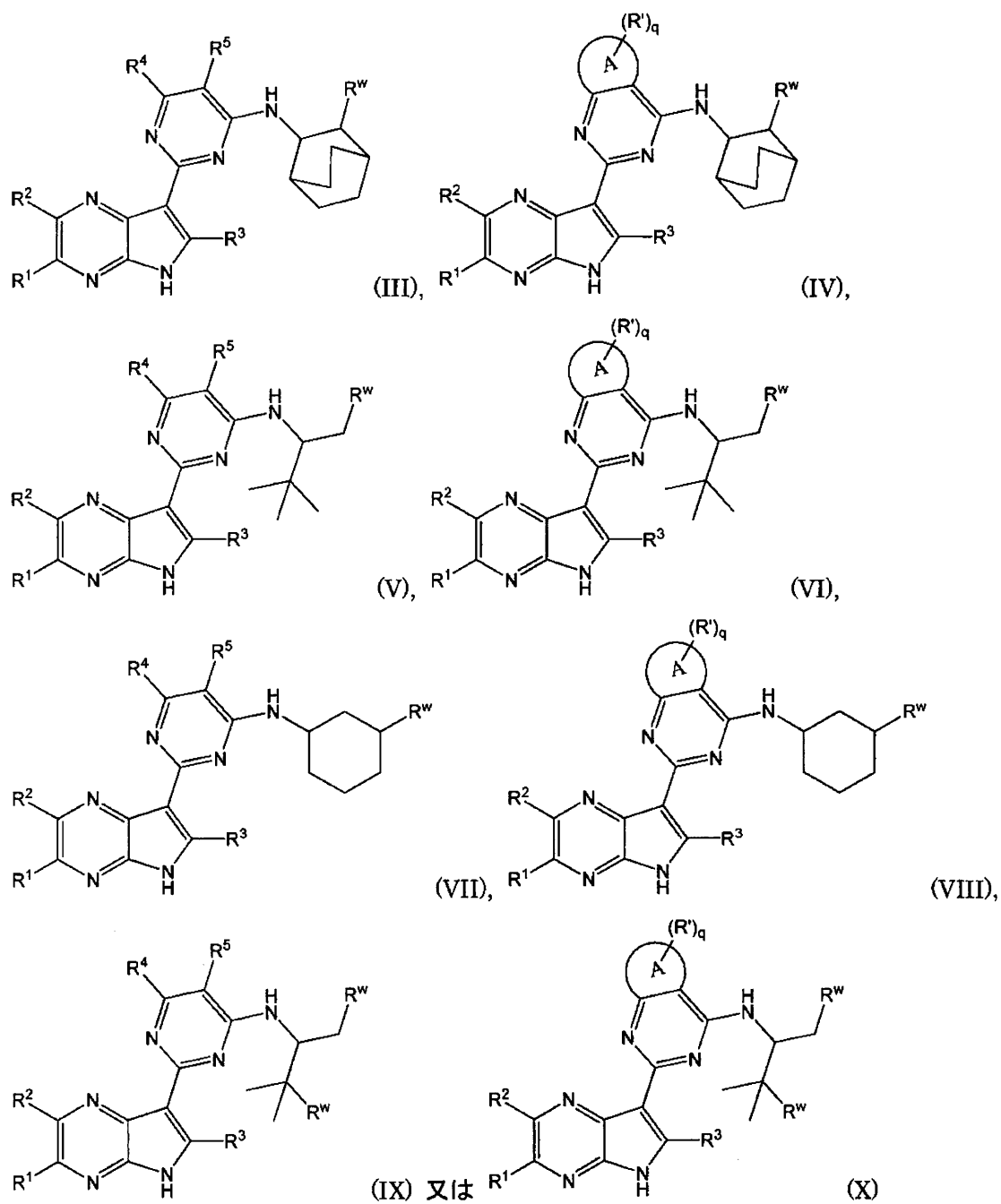
請求項1～13の何れか1項に記載の化合物。

【請求項15】

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



## 【化 8】

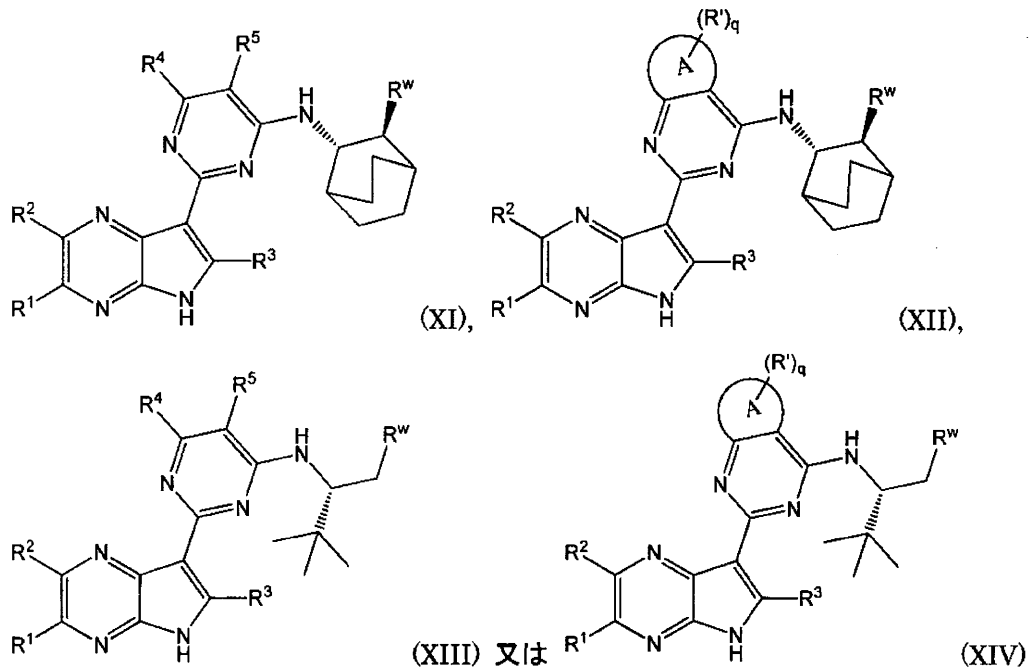


を有する請求項 1 ~ 14 の何れか 1 項に記載の化合物。

## 【請求項 16】

以下の化学式 (XI)、(XII)、(XIII)、又は (XIV) :

## 【化 9】

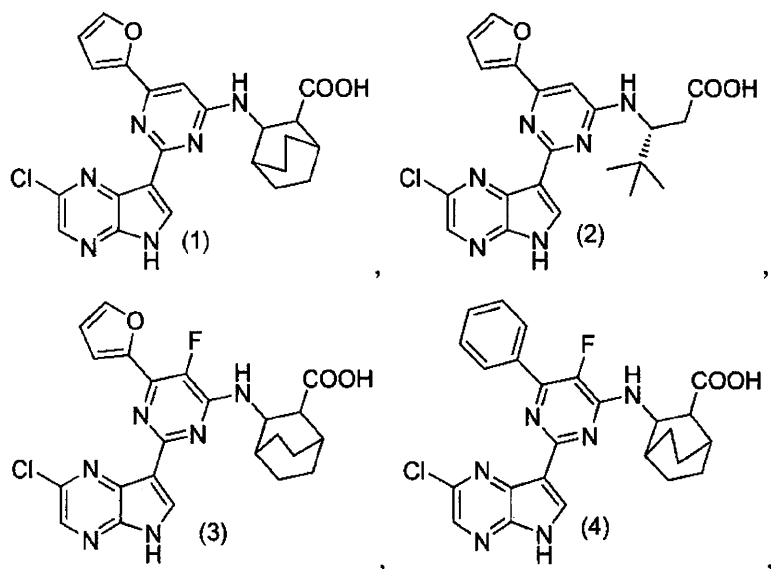


を有する請求項 1 ~ 15 の何れか 1 項に記載の化合物。

## 【請求項 17】

以下の化学構造：

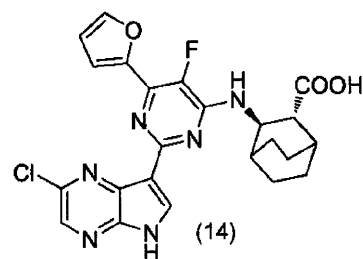
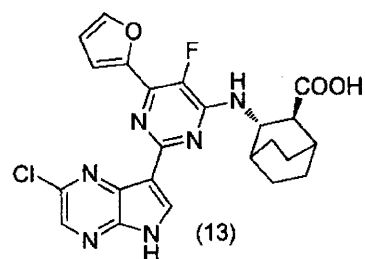
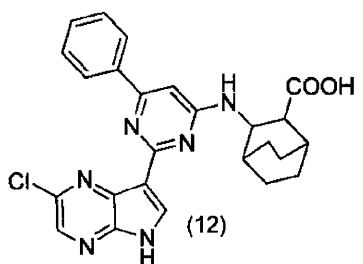
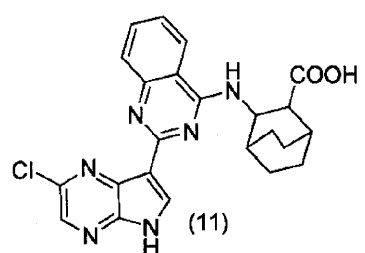
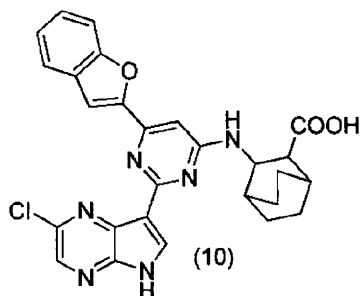
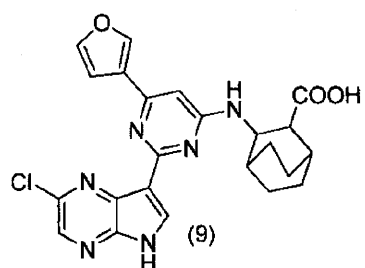
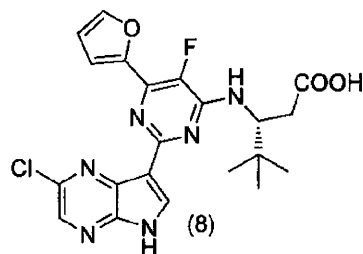
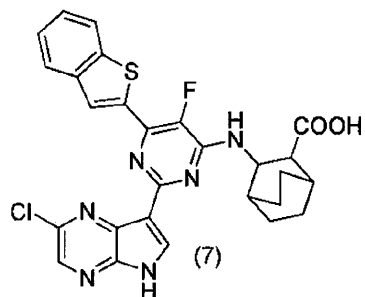
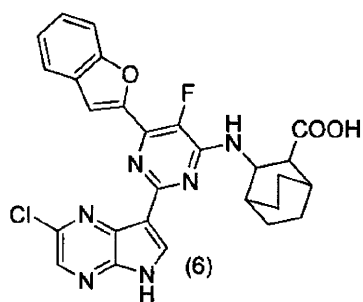
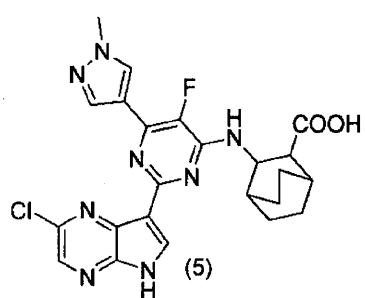
## 【化 10 - 1】



(つづく)

【化 10 - 2】

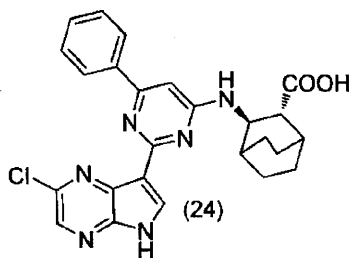
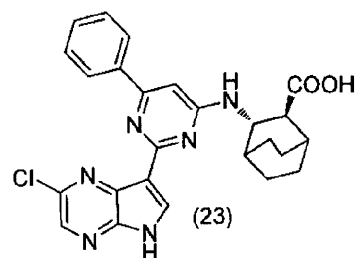
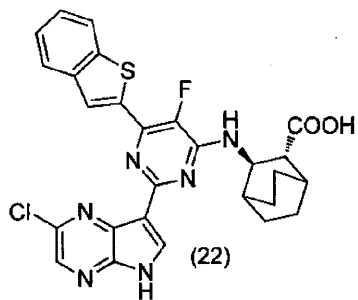
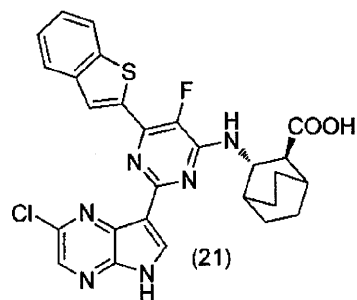
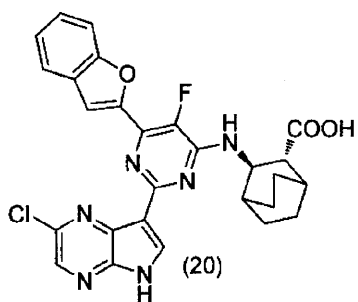
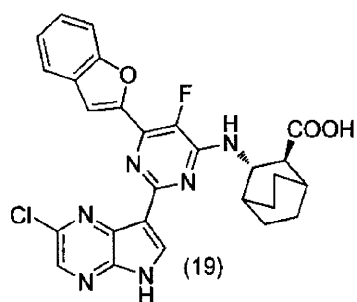
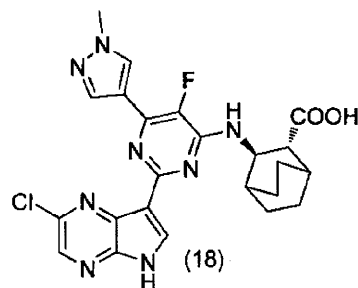
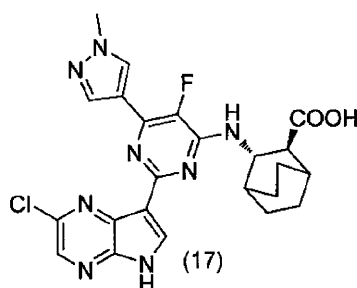
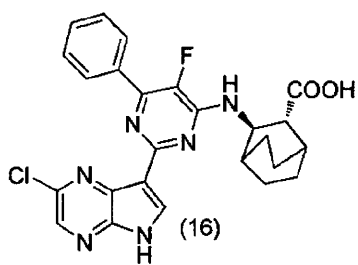
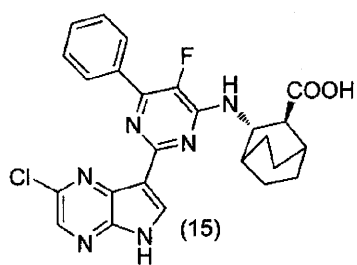
(つづき)



(つづく)

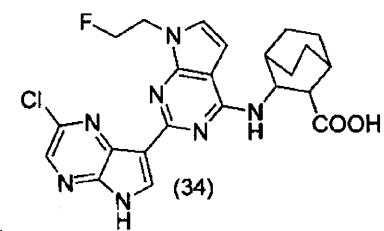
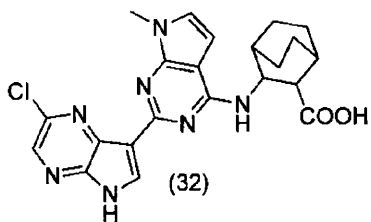
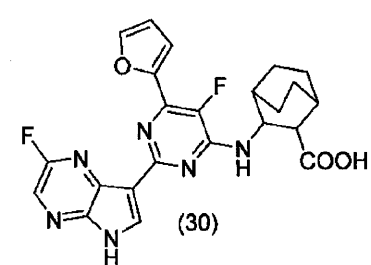
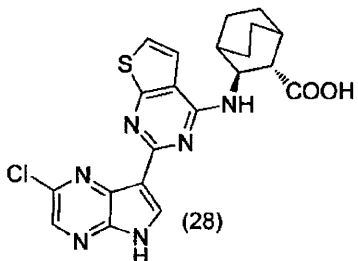
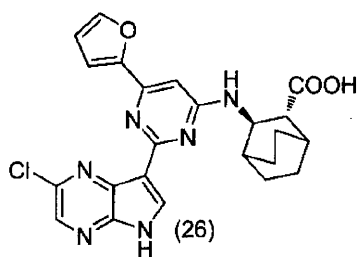
## 【化 10 - 3】

(つづき)



(つづく)

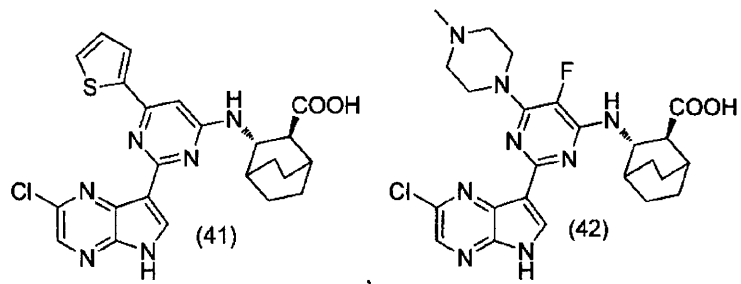
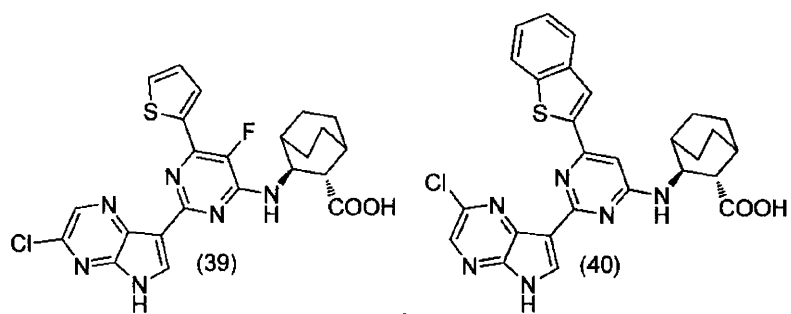
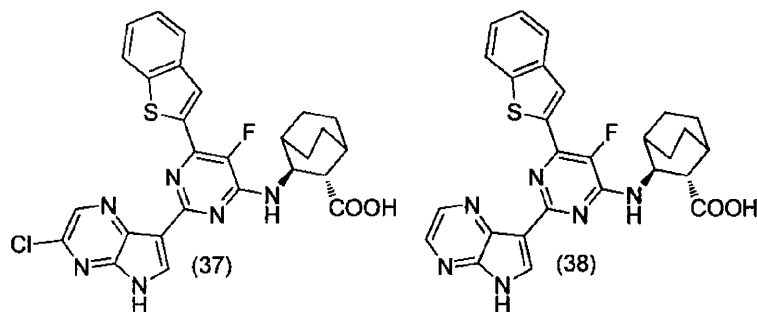
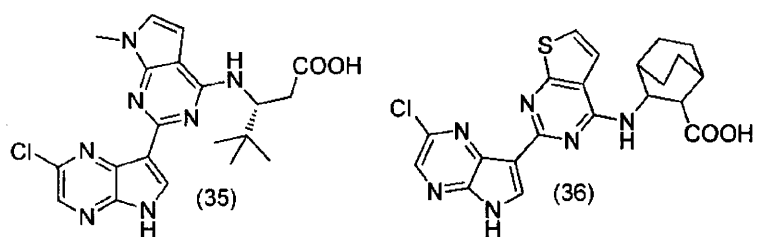
(つづき)



(つづく)

【化 10 - 5】

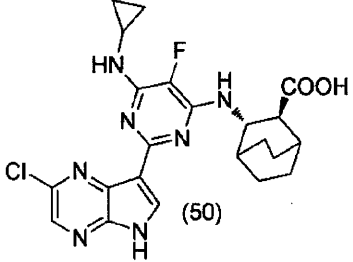
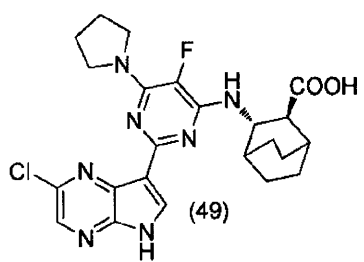
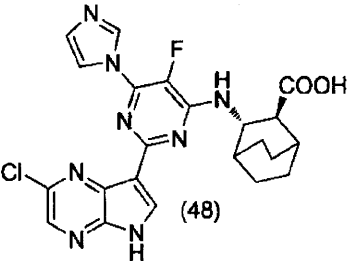
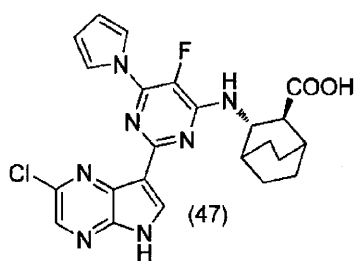
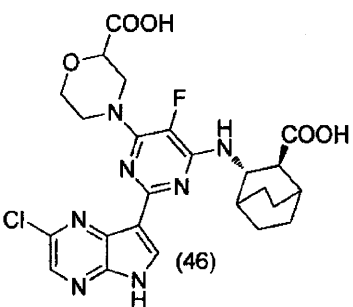
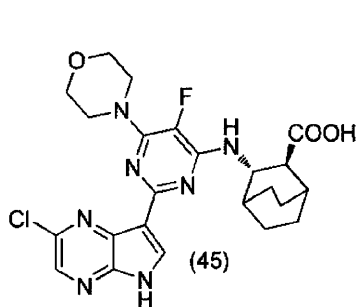
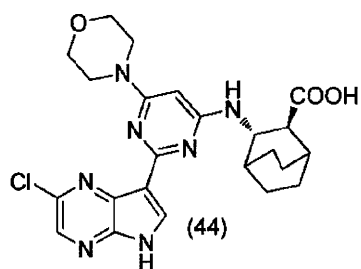
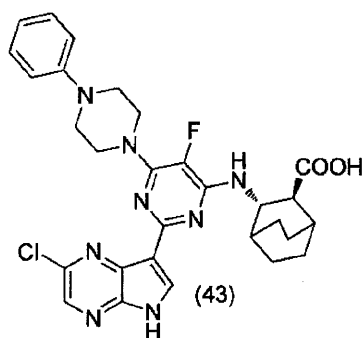
(つづき)



(つづく)

## 【化 10 - 6】

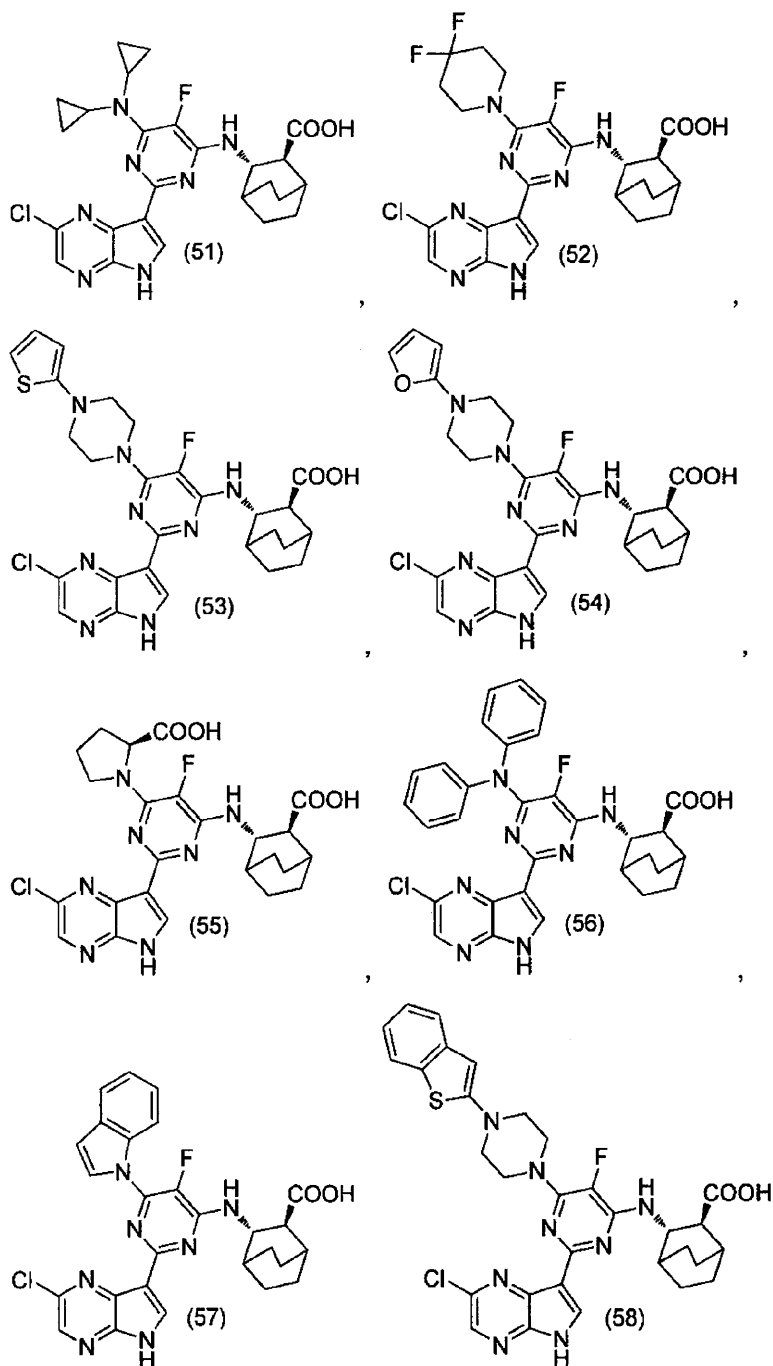
(つづき)



(つづく)

【化 10 - 7】

(つづき)

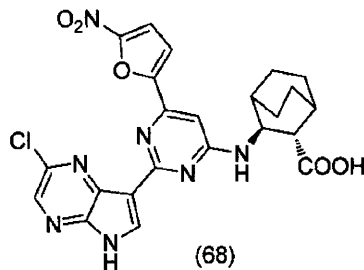
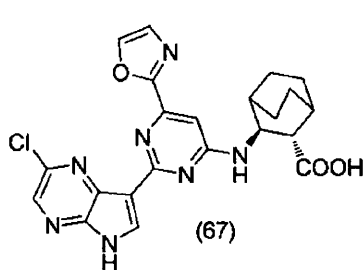
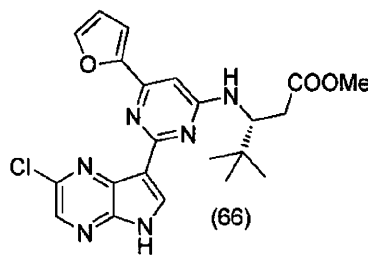
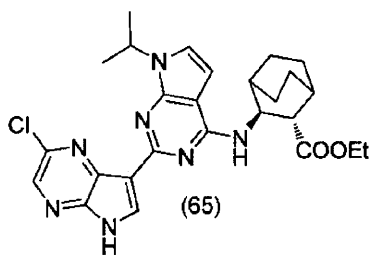
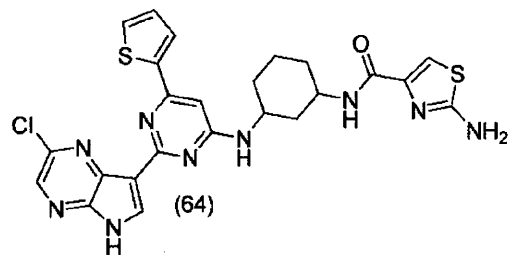
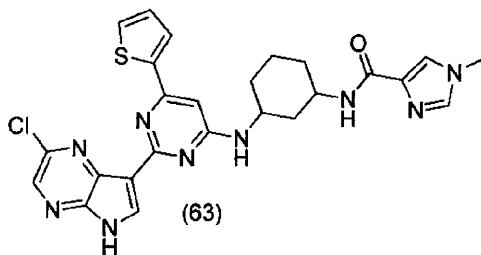
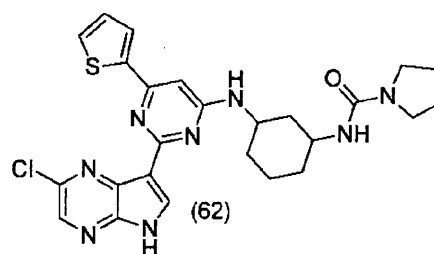
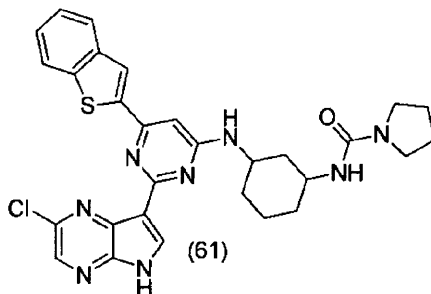
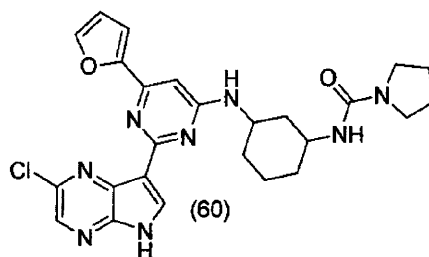
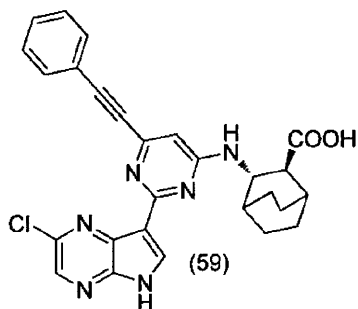


(つづく)



## 【化 10 - 8】

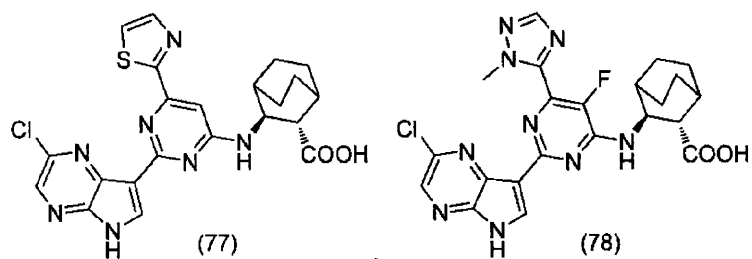
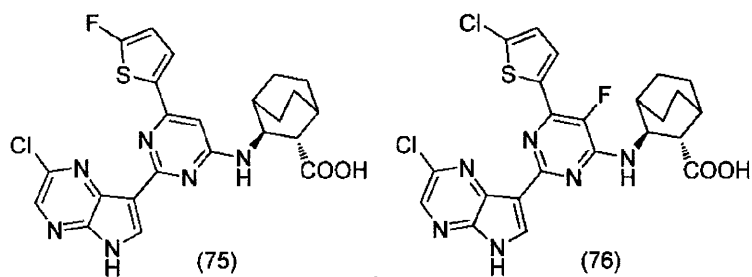
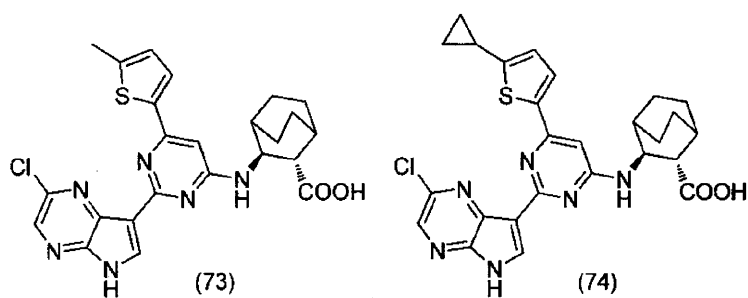
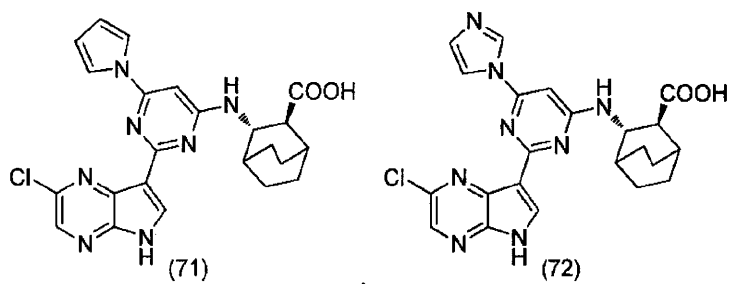
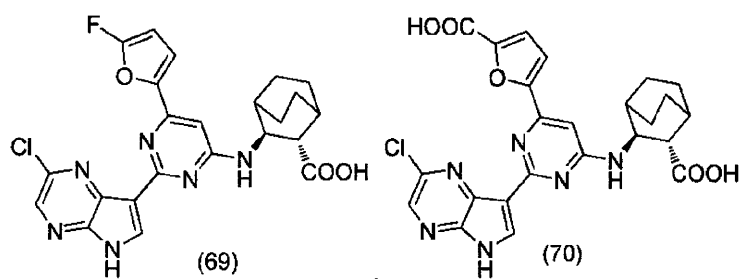
(つづき)



(つづく)

【化 10 - 9】

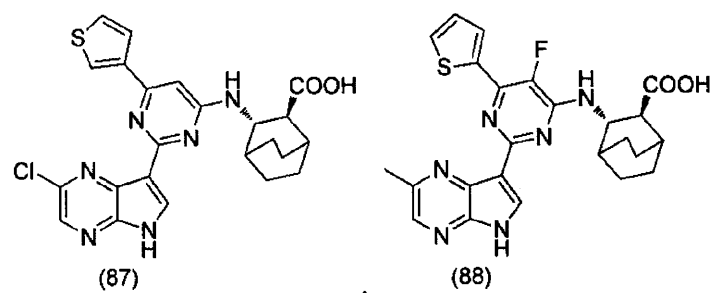
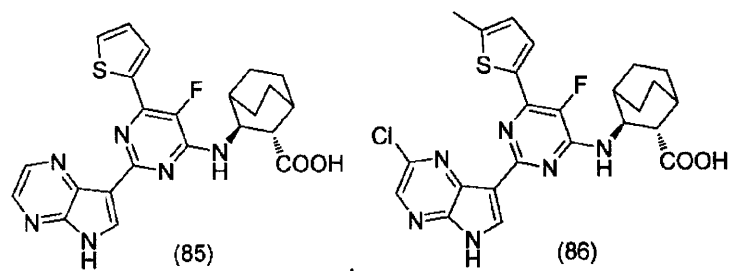
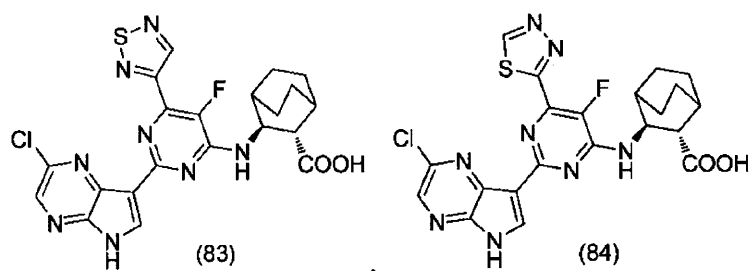
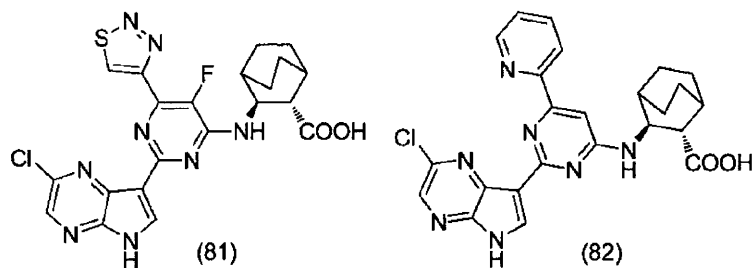
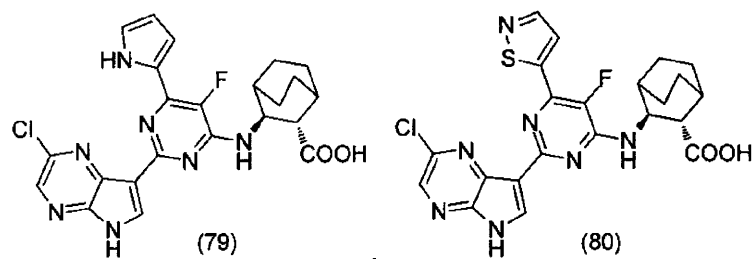
(つづき)



(つづく)

【化 10 - 10】

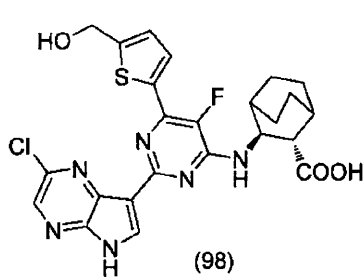
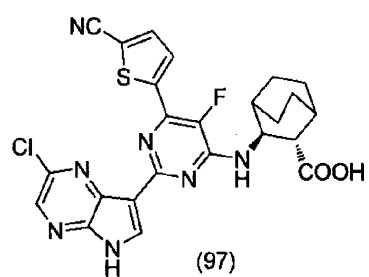
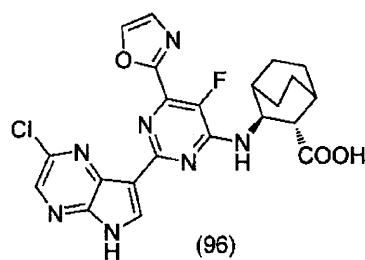
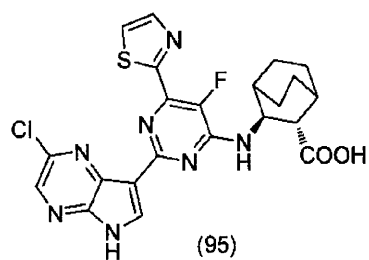
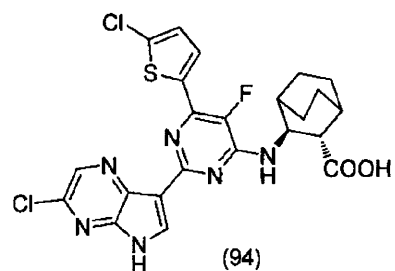
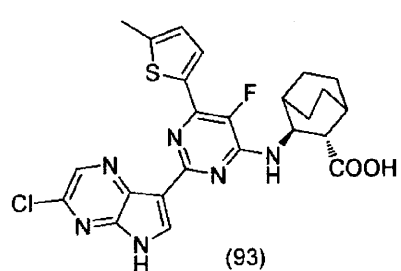
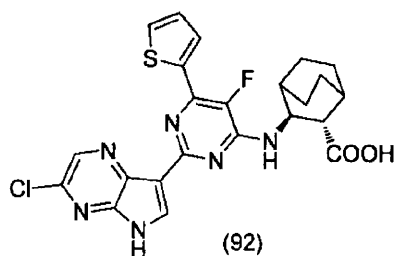
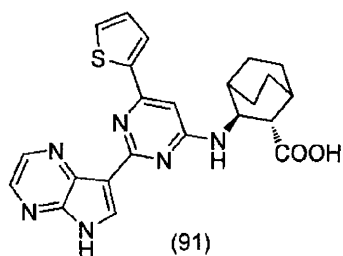
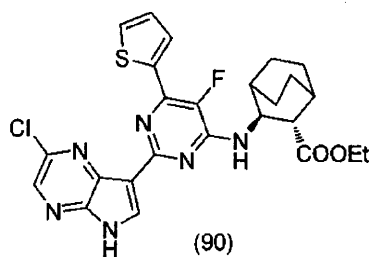
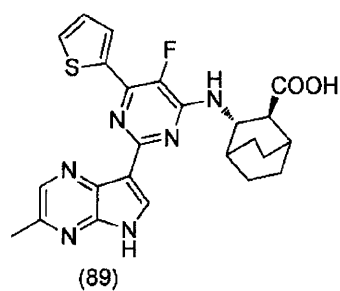
(つづき)



(つづく)

【化 1 0 - 1 1】

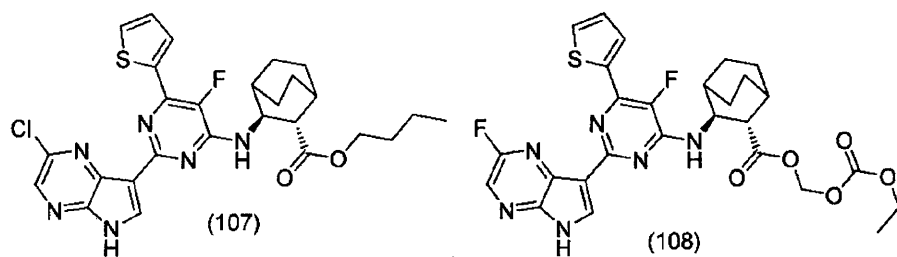
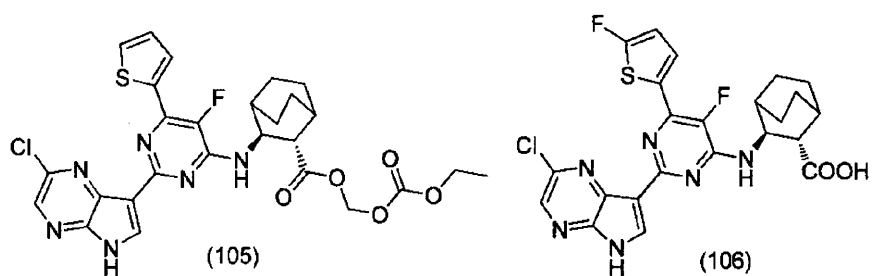
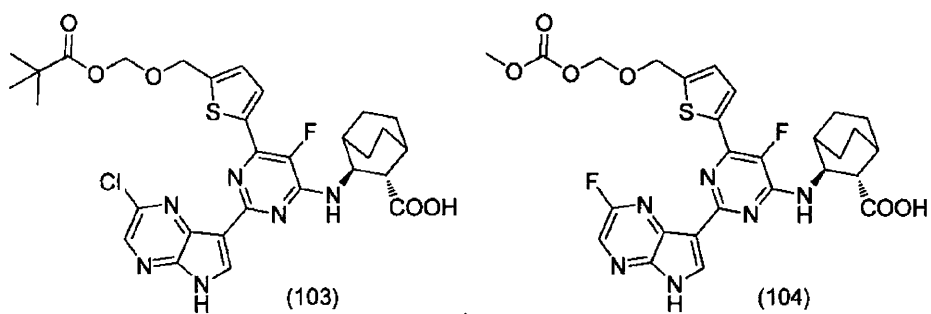
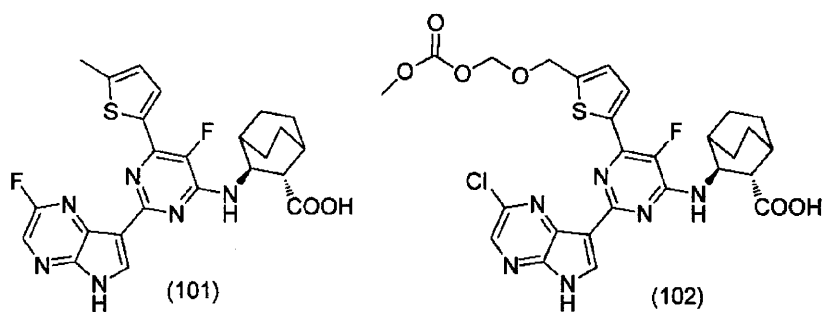
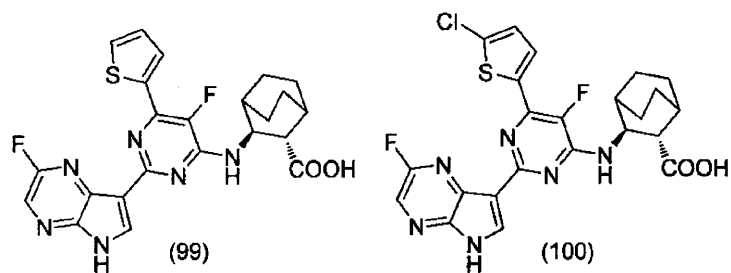
(つづき)



(つづく)

【化 10 - 12】

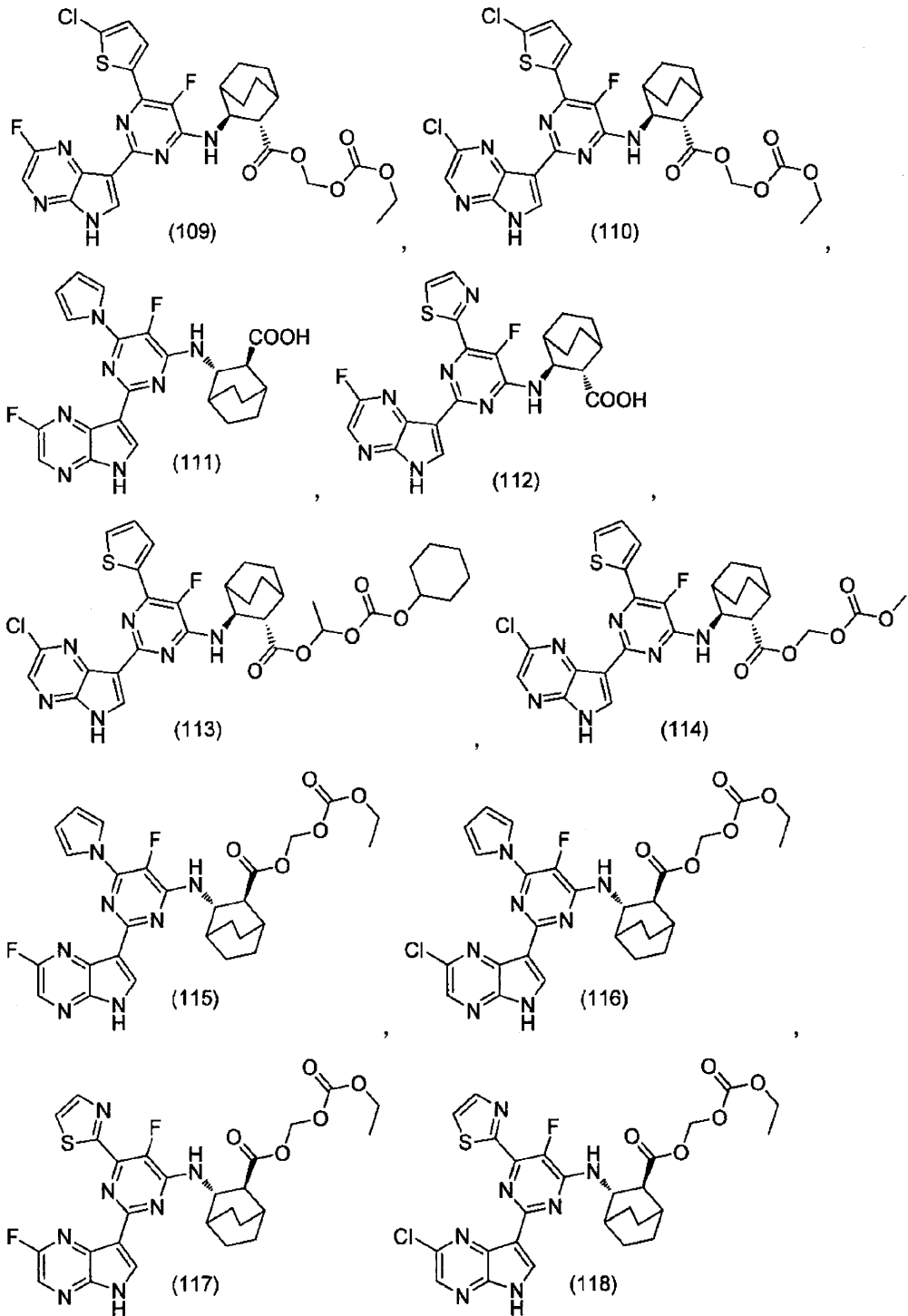
(つづき)



(つづく)

【化 10 - 13】

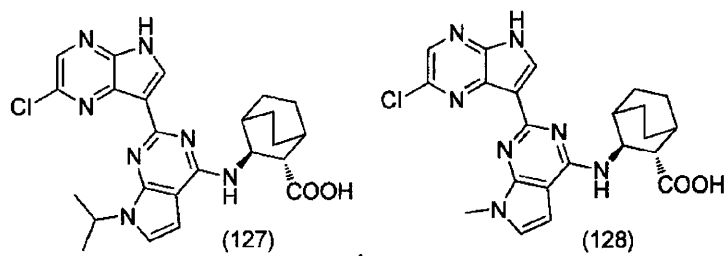
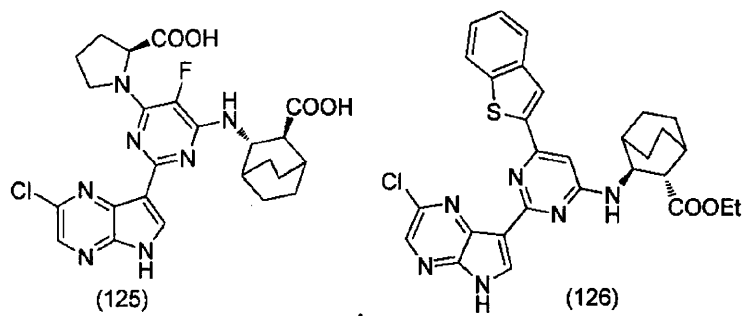
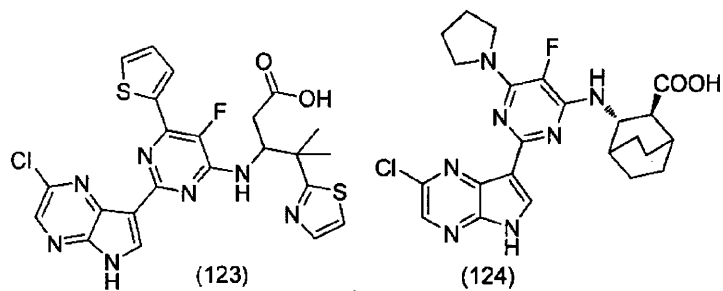
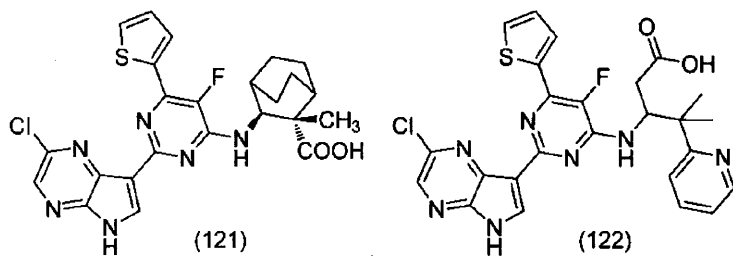
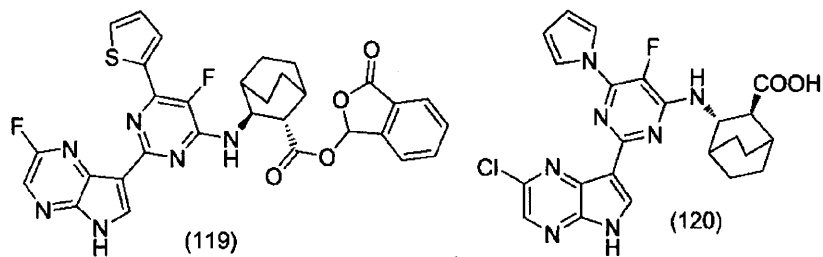
(つづき)



(つづく)

【化 1 0 - 1 4】

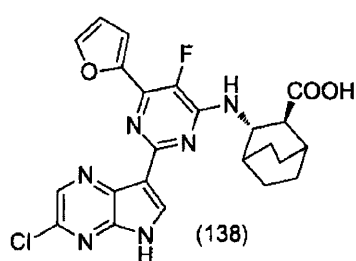
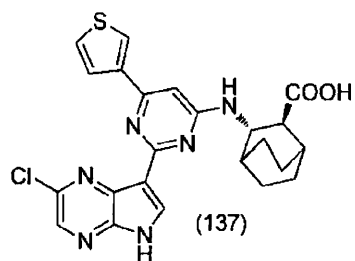
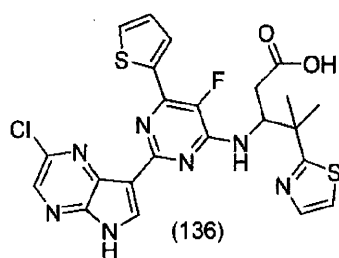
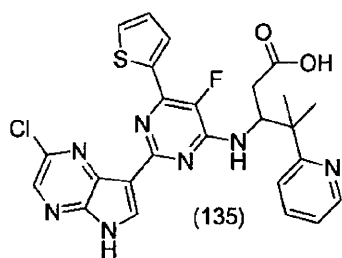
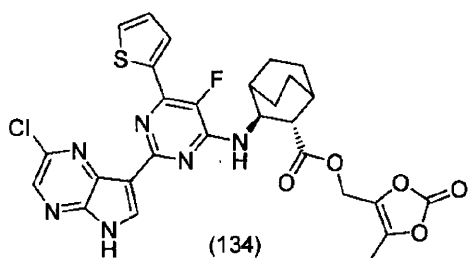
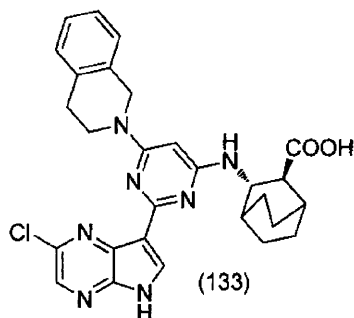
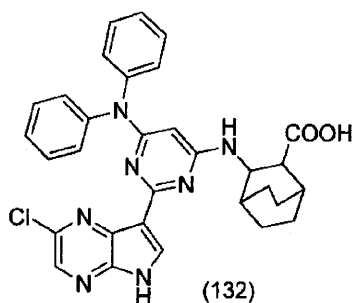
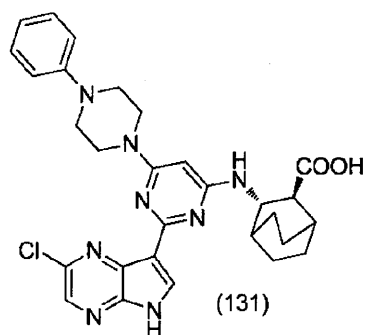
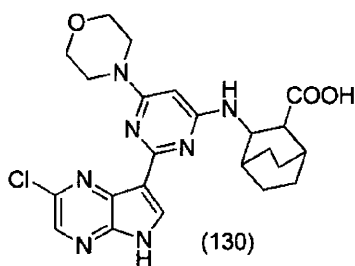
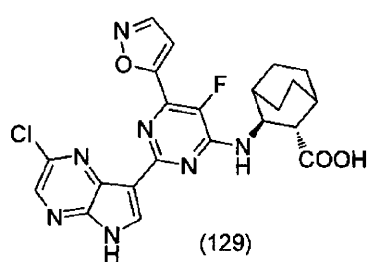
(つづき)



(つづく)

【化 10 - 15】

(つづき)

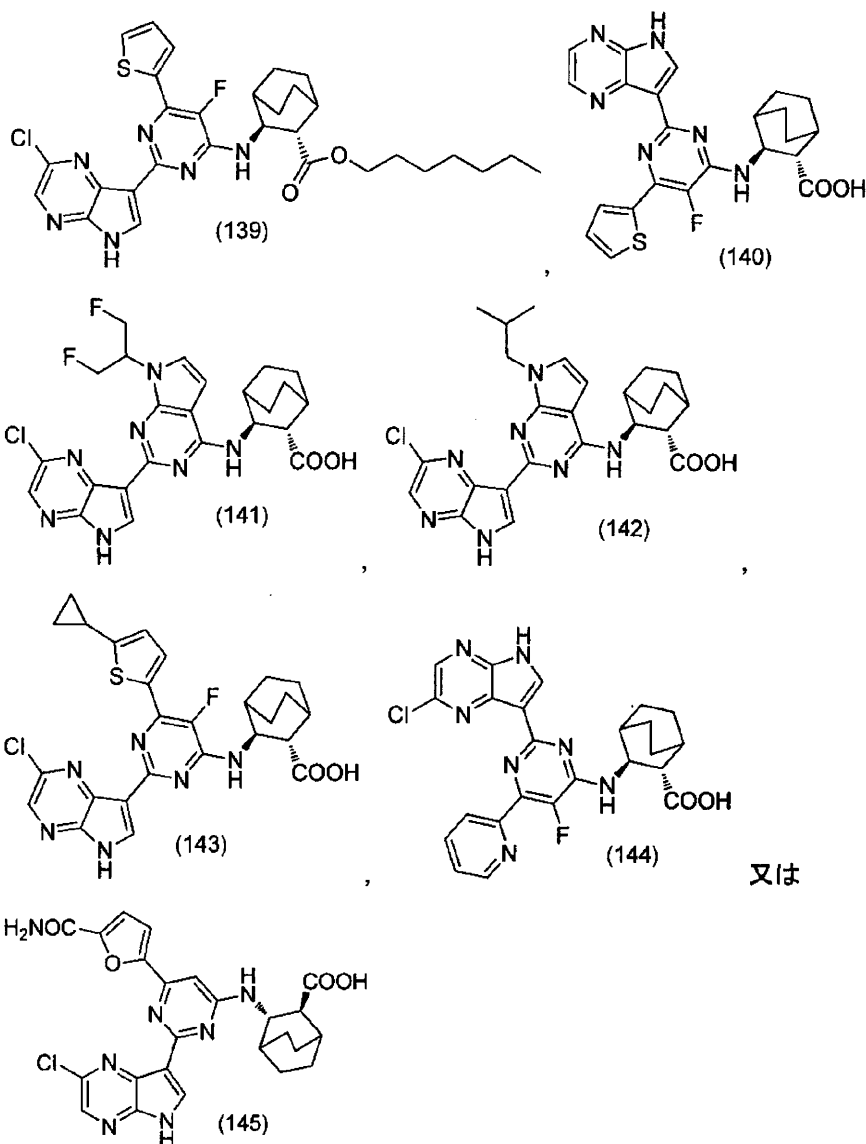


(つづく)



## 【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ン酸エステル水和物、ファビピラビル、アルビドール、リバビリン、スタキフリン、インガビリン、フルダーゼ、CAS no. 1422050-75-6、JNJ-872、S-033188、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 ~ 1 7 の何れか 1 項に記載の化合物、又は請求項 1 8 ~ 2 0 の何れか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

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 ~ 1 7 のうち何れか 1 項に記載の化合物、又は請求項 1 8 ~ 2 0 のうち何れか 1 項に記載の医薬組成物。