

【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22年9月16日(2010.9.16)

【公表番号】特表2010-500978(P2010-500978A)

【公表日】平成22年1月14日(2010.1.14)

【年通号数】公開・登録公報2010-002

【出願番号】特願2009-524051(P2009-524051)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/71 (2006.01)
C 0 7 D 309/12 (2006.01)
A 6 1 K 31/351 (2006.01)
C 0 7 D 213/68 (2006.01)
A 6 1 K 31/44 (2006.01)
C 0 7 D 333/32 (2006.01)
A 6 1 K 31/381 (2006.01)
C 0 7 D 213/74 (2006.01)
A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
C 0 7 D 241/20 (2006.01)
C 0 7 D 235/12 (2006.01)
A 6 1 K 31/4184 (2006.01)
C 0 7 D 213/84 (2006.01)
C 0 7 D 401/12 (2006.01)
A 6 1 K 31/497 (2006.01)
C 0 7 D 401/06 (2006.01)
C 0 7 D 231/12 (2006.01)
A 6 1 K 31/415 (2006.01)
A 6 1 K 31/444 (2006.01)
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
C 0 7 D 307/20 (2006.01)
A 6 1 K 31/341 (2006.01)
C 0 7 D 213/80 (2006.01)
C 0 7 D 237/14 (2006.01)
A 6 1 K 31/50 (2006.01)
C 0 7 D 217/24 (2006.01)
A 6 1 K 31/472 (2006.01)
C 0 7 D 215/22 (2006.01)
A 6 1 K 31/47 (2006.01)
A 6 1 K 31/53 (2006.01)
C 0 7 D 413/06 (2006.01)
C 0 7 D 417/12 (2006.01)
C 0 7 D 471/04 (2006.01)
A 6 1 K 31/541 (2006.01)
A 6 1 K 31/4545 (2006.01)
A 6 1 K 31/496 (2006.01)
C 0 7 D 405/12 (2006.01)
A 6 1 K 31/4433 (2006.01)
C 0 7 D 413/12 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
A 6 1 P 31/14 (2006.01)

C 0 7 D 213/64 (2006.01)

C 0 7 D 213/79 (2006.01)

C 1 2 N 7/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 213/71 C S P

C 0 7 D 309/12

A 6 1 K 31/351

C 0 7 D 213/68

A 6 1 K 31/44

C 0 7 D 333/32

A 6 1 K 31/381

C 0 7 D 213/74

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 241/20

C 0 7 D 235/12

A 6 1 K 31/4184

C 0 7 D 213/84 Z

C 0 7 D 401/12

A 6 1 K 31/497

C 0 7 D 401/06

C 0 7 D 231/12 D

A 6 1 K 31/415

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/4439

C 0 7 D 307/20

A 6 1 K 31/341

C 0 7 D 213/80

C 0 7 D 237/14

A 6 1 K 31/50

C 0 7 D 217/24

A 6 1 K 31/472

C 0 7 D 215/22

A 6 1 K 31/47

A 6 1 K 31/53

C 0 7 D 413/06

C 0 7 D 417/12

C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z

C 0 7 D 471/04 1 0 8 Z

A 6 1 K 31/541

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 K 31/496

C 0 7 D 405/12

A 6 1 K 31/4433

C 0 7 D 413/12

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 31/14

C 0 7 D 213/64

C 0 7 D 213/84

C 0 7 D 213/79

C 1 2 N 7/00

【手続補正書】

【提出日】平成22年8月2日(2010.8.2)

【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

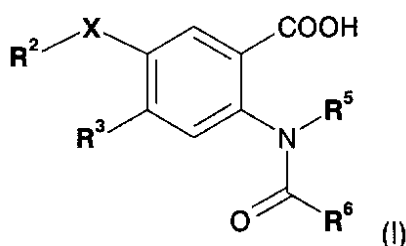
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式(I)の化合物又はその塩若しくはエステル。

【化1】



(式中：

XはO及びSから選択され；

R²は、任意に1~5個のR²⁰置換基で置換されていてもよいHetであり、ここで、R²⁰は各場合独立に下記基：

a)ハロ、シアノ又はニトロ；

b)R⁷、-C(=O)-R⁷、-C(=O)-O-R⁷、-O-R⁷、-S-R⁷、-SO-R⁷、-SO₂-R⁷、-(C₁₋₆)アルキレン-R⁷、-(C₁₋₆)アルキレン-C(=O)-R⁷、-(C₁₋₆)アルキレン-C(=O)-O-R⁷、-(C₁₋₆)アルキレン-O-R⁷、-(C₁₋₆)アルキレン-S-R⁷、-(C₁₋₆)アルキレン-SO-R⁷又は-(C₁₋₆)アルキレン-SO₂-R⁷ (ここで、R⁷は各場合独立にH、(C₁₋₆)アルキル、(C₂₋₆)アルケニル、(C₂₋₆)アルキニル、(C₁₋₆)ハロアルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、アリール及びHetから選択され；

前記(C₁₋₆)アルキルは任意に、-OH、-O-(C₁₋₆)アルキル、シアノ、COOH、-NH₂、-NH(C₁₋₄)アルキル、-NH(C₃₋₇)シクロアルキル、-N((C₁₋₄)アルキル)(C₃₋₇)シクロアルキル及び-N((C₁₋₄)アルキル)₂からそれぞれ独立に選択される1又は2個の置換基で置換されていてもよく；かつ

前記各アリール及びHetは任意に、下記基：

i)ハロ、シアノ、オキソ、チオキソ、イミノ、-OH、-O-(C₁₋₆)アルキル、-O-(C₁₋₆)ハロアルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、(C₁₋₆)ハロアルキル、-C(=O)-(C₁₋₆)アルキル、-SO₂(C₁₋₆)アルキル、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH(C₁₋₄)アルキル、-C(=O)-N((C₁₋₄)アルキル)₂、-C(=O)-NH(C₃₋₇)シクロアルキル、-C(=O)-N((C₁₋₄)アルキル)(C₃₋₇)シクロアルキル、-NH₂、-NH(C₁₋₄)アルキル、-N((C₁₋₄)アルキル)₂、-NH(C₃₋₇)シクロアルキル、-N((C₁₋₄)アルキル)(C₃₋₇)シクロアルキル又は-NH-C(=O)(C₁₋₄)アルキル；

ii)任意に-OH、-O-(C₁₋₆)ハロアルキル、又は-O-(C₁₋₆)アルキルで置換されていてもよい(C₁₋₆)アルキル；及び

iii)アリール又はHet(各アリール及びHetは任意にハロ又は(C₁₋₆)アルキルで置換されていてもよい)

からそれぞれ独立に選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)；及び

c)-N(R⁸)R⁹、-C(=O)-N(R⁸)R⁹、-O-C(=O)-N(R⁸)R⁹、-SO₂-N(R⁸)R⁹、-(C₁₋₆)アルキレン-N(R⁸)R⁹、-(C₁₋₆)アルキレン-C(=O)-N(R⁸)R⁹、-(C₁₋₆)アルキレン-O-C(=O)-N(R⁸)R⁹、又は-(C₁₋₆)アルキレン-SO₂-N(R⁸)R⁹(ここで、

R⁸は、各場合独立にH、(C₁₋₆)アルキル及び(C₃₋₇)シクロアルキルから選択され；かつ

R⁹は、各場合独立にR⁷、-(C₁₋₆)アルキレン-R⁷、-SO₂-R⁷、-C(=O)-R⁷、-C(=O)OR⁷及び-C(

=O)N(R⁸)R⁷から選択され；R⁷及びR⁸は前記定義どおりである)
から選択され；

R³は、H、ハロ、(C₁₋₄)アルキル、-O-(C₁₋₄)アルキル、-S-(C₁₋₄)アルキル、-NH₂、-NH(C₁₋₄)アルキル、-NH(C₃₋₇)シクロアルキル、-N((C₁₋₄)アルキル)(C₃₋₇)シクロアルキル及び-N((C₁₋₄)アルキル)₂から選択され；

R⁵は、H、(C₁₋₆)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル又はHetであり；該(C₁₋₆)アルキル及びHetはそれぞれ任意に、(C₁₋₆)アルキル、Het、-OH、-COOH、-C(=O)-(C₁₋₆)アルキル、-C(=O)-O-(C₁₋₆)アルキル、-SO₂(C₁₋₆)アルキル及び-C(=O)-N(R⁵¹)R⁵²からそれぞれ独立に選択される1~4個の置換基で置換されていてもよく

(ここで、R⁵¹はH、(C₁₋₆)アルキル又は(C₃₋₇)シクロアルキルであり；かつ

R⁵²はH、(C₁₋₆)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、アリール、Het、アリール-(C₁₋₃)アルキル-又はHet-(C₁₋₃)アルキル-であり；

該(C₁₋₆)アルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、アリール、Het、アリール-(C₁₋₃)アルキル-及びHet-(C₁₋₃)アルキル-はそれぞれ任意に、(C₁₋₆)アルキル、(C₁₋₆)ハロアルキル、ハロ、オキソ、-OH、-O(C₁₋₆)アルキル、-NH₂、-NH(C₁₋₆)アルキル、-N((C₁₋₆)アルキル)₂、-NH(C₃₋₇)シクロアルキル、-N((C₁₋₄)アルキル)(C₃₋₇)シクロアルキル、-C(=O)(C₁₋₆)アルキル及び-NHC(=O)-(C₁₋₆)アルキル(前記(C₁₋₆)アルキルは任意にOHで置換されていてもよい)からそれぞれ独立に選択される1~3個の置換基で置換されていてもよく；

或いはR⁵¹とR⁵²が、それらが結合しているNと一緒に結合して、任意にさらにそれぞれ独立にN、O及びSから選択される1~3個のヘテロ原子を含有してよい4員~7員のヘテロ環を形成し(ここで、各Sヘテロ原子は独立に、かつ可能な場合、さらに1又は2個の酸素原子に結合して基SO又はSO₂を形成するように酸化状態で存在してよく；

前記ヘテロ環は任意に、(C₁₋₆)アルキル、(C₁₋₆)ハロアルキル、ハロ、オキソ、-OH、-O(C₁₋₆)アルキル、-NH₂、-NH(C₁₋₆)アルキル、-N((C₁₋₆)アルキル)₂、-NH(C₃₋₇)シクロアルキル、-N((C₁₋₄)アルキル)(C₃₋₇)シクロアルキル、-C(=O)(C₁₋₆)アルキル及び-NHC(=O)-(C₁₋₆)アルキル(前記(C₁₋₆)アルキルは任意にOHで置換されていてもよい)からそれぞれ独立に選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)；

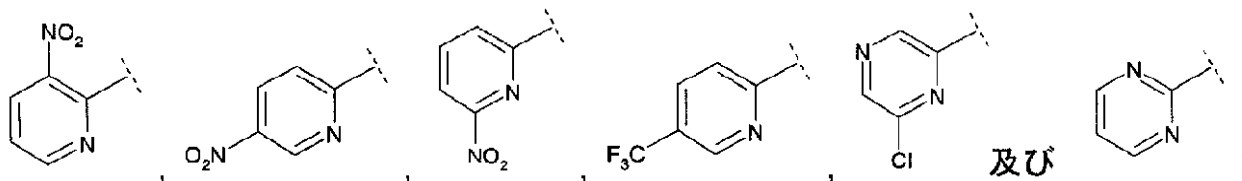
R⁶は(C₃₋₇)シクロアルキル又はアリールであり；

該(C₃₋₇)シクロアルキル及びアリールはそれぞれ任意、ハロ、(C₁₋₆)アルキル、(C₁₋₆)ハロアルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、-OH、-SH、-O-(C₁₋₄)アルキル及び-S-(C₁₋₄)アルキルからそれぞれ独立に選択される1~5個の置換基で置換されていてもよく；かつ

Hetは、O、N及びSからそれぞれ独立に選択される1~4個のヘテロ原子を有する4員~7員の飽和、不飽和若しくは芳香族ヘテロ環、又は可能な限り、O、N及びSからそれぞれ独立に選択される1~5個のヘテロ原子を有する7員~14員の飽和、不飽和若しくは芳香族ヘテロ多環であり；ここで、各Nヘテロ原子は独立に、かつ可能な場合、さらに酸素原子に結合してN-オキシド基を形成するように酸化状態で存在してよく、各Sヘテロ原子は独立に、かつ可能な場合、さらに1又は2個の酸素原子に結合して基SO又はSO₂を形成するように酸化状態で存在してよく；

但し、R²が下記基：

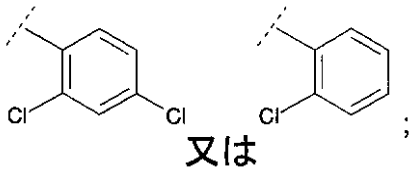
【化2】



から選択され；

XがOであり；R³がHであり；かつR⁵がHである場合、R⁶は下記基でない。))

【化3】



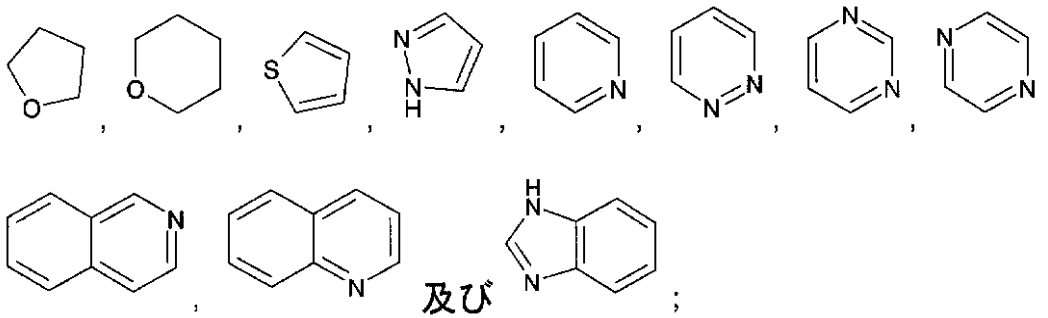
【請求項2】

Xが0である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R²が下記式

【化4】



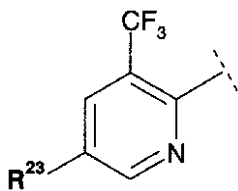
から選択されるHetであり；

このときHetは、任意に1~3個のR²⁰置換基（R²⁰は請求項1の定義どおり）で置換されていてもよい、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

R²が下記式：

【化5】



の基であり、式中、R²³はR²⁰であり；かつ

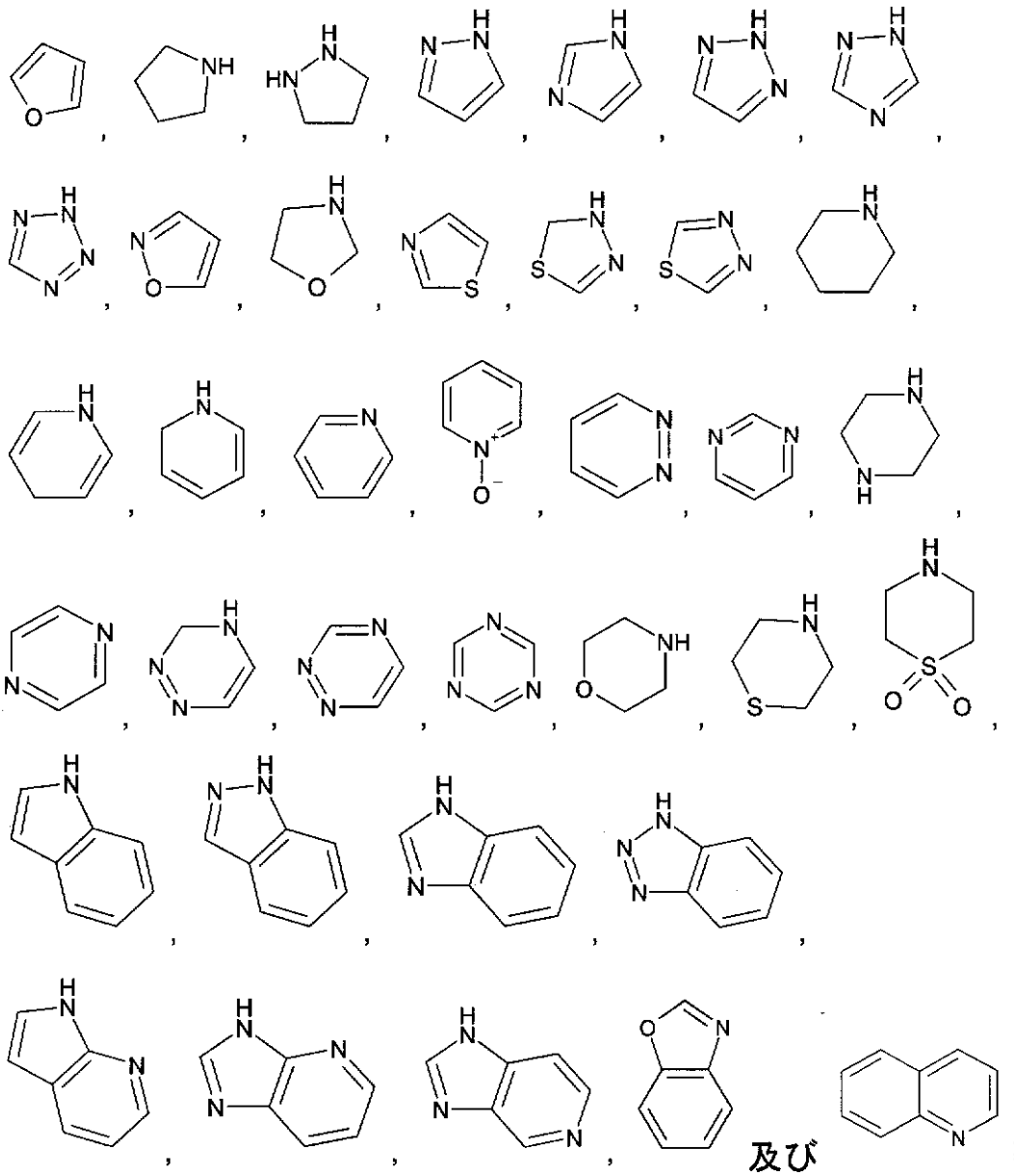
R²⁰が下記基：

a) ハロ又はシアノ；

b) R⁷、-CH₂-R⁷、-C(=O)-R⁷、-CH₂-O-R⁷、-SO₂-R⁷、-CH₂-S-R⁷又は-CH₂-SO₂-R⁷

（ここで、R⁷は各場合独立にH、(C₁₋₆)アルキル、(C₂₋₆)アルケニル、(C₁₋₆)ハロアルキル、(C₃₋₇)シクロアルキル、フェニル及びHetから選択され；前記Hetは下記基：

【化6】

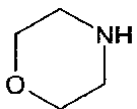


から選択され；かつ

前記(C₁₋₆)アルキルは任意に、-OH、-O-(C₁₋₆)アルキル及びCOOHからそれぞれ独立に選択される1又は2個の置換基で置換されていてもよく；かつ

前記フェニル及びHetはそれぞれ任意に、ハロ、シアノ、オキソ、イミノ、-OH、-O-(C₁₋₆)アルキル、-NH₂、-NH(C₁₋₄)アルキル、-N((C₁₋₄)アルキル)₂、-NH-C(=O)(C₁₋₄)アルキル、(C₁₋₆)アルキル及び下記式

【化7】



で表される基からそれぞれ独立に選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)；及び

c) -CH₂-N(R⁸)R⁹又は-CH₂-C(=O)-N(R⁸)R⁹

(式中、R⁸は各場合独立にH及び(C₁₋₆)アルキルから選択され；かつ

R⁹は各場合独立にR⁷、-SO₂-R⁷、-C(=O)-R⁷、-C(=O)OR⁷及び-C(=O)N(R⁸)R⁷から選択され；

このとき R^7 と R^8 は前記定義どおりである)
から選択される、請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

R^3 がH及びハロから選択される、請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項6】

R^3 がHである、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

R^5 が (C_{1-6}) アルキルである、請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項8】

R^5 が1-メチルエチルである、請求項7に記載の化合物。

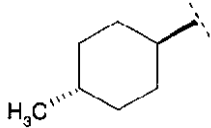
【請求項9】

R^6 が、任意に、ハロ、 (C_{1-6}) アルキル、 (C_{1-6}) ハロアルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-O-(C_{1-4})$ アルキル及び $-S-(C_{1-4})$ アルキルからそれぞれ独立に選択される1～5個の置換基で置換されていてもよい (C_{3-7}) シクロアルキルである、請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項10】

R^6 が下記基である、請求項9に記載の化合物。

【化8】

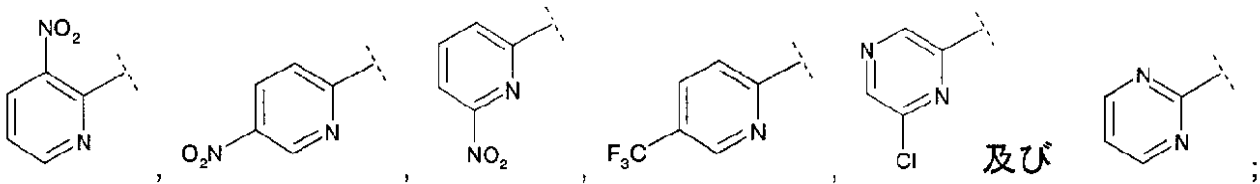


【請求項11】

R^6 が、任意に、ハロ、 (C_{1-6}) アルキル、 (C_{3-7}) シクロアルキル及び $-S-(C_{1-4})$ アルキルからそれぞれ独立に選択される1～3個の置換基で置換されていてもよいフェニルである、請求項1～10のいずれか1項に記載の化合物。

(但し、 R^2 が下記基：

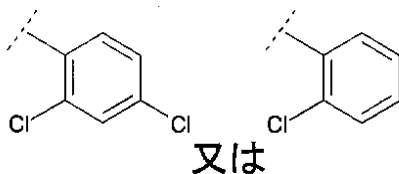
【化9】



から選択され；

XがOであり； R^3 がHであり；かつ R^5 がHである場合、 R^6 は下記基でない。)

【化10】



【請求項12】

治療的に有効な量の請求項1～11のいずれか1項に記載の化合物、又はその医薬的に許容しうる塩若しくはエステル；及び1種以上の医薬的に許容しうる担体を含んでなる医薬組成物。

【請求項13】

さらに少なくとも1種の他の抗ウイルス薬を含んでなる請求項12に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

請求項1～1.1のいずれか1項に記載の化合物、又はその医薬的に許容しうる塩若しくはエステルの、C型肝炎ウイルスに感染しているか又は感染している危険のある哺乳動物のC型肝炎ウイルス感染症の治療用薬物の製造のための使用。