

【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 12 日 (2015.2.12)

【公表番号】特表 2013-545817 (P2013-545817A)

【公表日】平成 25 年 12 月 26 日 (2013.12.26)

【年通号数】公開・登録公報 2013-069

【出願番号】特願 2013-544809 (P2013-544809)

【国際特許分類】

C 07 D 471/04 (2006.01)

A 61 K 31/444 (2006.01)

A 61 K 31/497 (2006.01)

A 61 K 31/53 (2006.01)

A 61 K 45/00 (2006.01)

A 61 P 31/16 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 471/04 1 0 6

C 07 D 471/04 C S P

A 61 K 31/444

A 61 K 31/497

A 61 K 31/53

A 61 K 45/00

A 61 P 31/16

A 61 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】平成 26 年 12 月 16 日 (2014.12.16)

【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

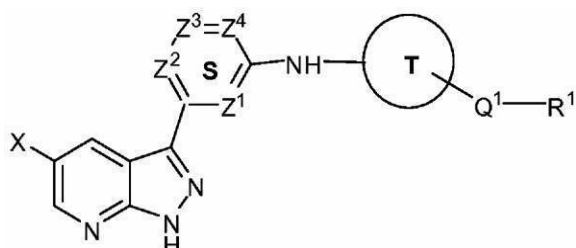
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

構造式 (I) :

【化 1】



で表わされる化合物、又はその製薬上許容される塩であり、式中、

X は - C₁、- Br、- F、- CN、- O (C₁ ~ C₄ アルキル)、若しくは C₁ ~ C₆ 脂肪族であって、所望により 1 つ以上のインスタンスの J¹ で置換されている C₁ ~ C₆ 脂肪族であり、

Z¹、Z²、Z³、及び Z⁴ はそれぞれ独立に C R² 若しくは N であり、ただし Z¹、

Z^2 、 Z^3 、及び Z^4 には最高3つまでのNが選択され、かつ Z^3 及び Z^4 が両方ともC
R²である場合、 Z^1 と Z^2 は両方とも同時にNとはならず、

環Sは六員芳香環であり、

環TはC₃～C₁₀炭素環であって、所望により更に1つ以上のインスタンスのJ^Tで
置換されているC₃～C₁₀炭素環であり、

Q¹は - C(O) -、- CO₂ -、- OC(O) -、- O(CR^tR^s)_k - C(O)
O -、- C(O)NR' -、- C(O)N(R') - O -、- C(O)NRC(O)O -
、- NRC(O) -、- NRC(O)NR' -、- NRCO₂ -、- OC(O)NR' -
、- OSO₂NR' -、- S(O) -、- SO₂ -、- SO₂NR' -、- NRSO₂ -
、- NRSO₂NR' -、- P(O)(OR)O -、- OP(O)(OR^a)O -、- P
(O)₂O -、- CO₂SO₂ -、- B(O)₂ -、若しくは - (CR^tR^s)_p - Y¹
- であり、

Y¹は - C(O) -、- CO₂ -、- OC(O) -、- O(CR^tR^s)_k - C(O)
O -、- C(O)NR' -、- C(O)N(R') - O -、- C(O)NRC(O)O -
、- NRC(O) -、- NRC(O)NR' -、- NRCO₂ -、- OC(O)NR' -
、- OSO₂NR' -、- S(O) -、- SO₂ -、- SO₂NR' -、- NRSO₂ -
、- NRSO₂NR' -、- P(O)(OR)O -、- OP(O)(OR^a)O -、- P
(O)₂O -、- B(O)₂ -、若しくは - CO₂SO₂ - であり、

R¹は、i) - H、ii) C₁～C₆脂肪族基であって、所望により1つ以上のインス
タンスのJ^Aで置換されているC₁～C₆脂肪族基、iii) C₃～C₁₀炭素環基若し
くは4～10員の複素環基であって、それぞれ所望によりかつ独立に1つ以上のインス
タンスのJ^Bで置換されているC₃～C₁₀炭素環基若しくは4～10員の複素環基、又は
iv) 6～10員のアリール基若しくは5～10員のヘテロアリール基であって、それぞ
れ所望によりかつ独立に1つ以上のインスタンスのJ^Cで置換されている6～10員のア
リール基若しくは5～10員のヘテロアリール基であり、

所望によりR¹は、R'、及びそれらが結合している窒素と合わせて4～8員の複素環
基を形成し、これは所望により1つ以上のインスタンスのJ²で置換されており、又は、

所望により - Q¹ - R¹は、環Tと合わせて、4～10員の非芳香族スピロ環を形成し
、これは所望により1つ以上のインスタンスのJ⁴で置換されており、並びに

R²は、- H、ハロゲン、- CN、- NO₂、- C(O)NH₂、- C(O)NH(CH₃)、
- C(O)N(CH₃)₂、若しくはC₁～C₆脂肪族基であって、所望により1
つ以上のインスタンスのJ¹で置換されているC₁～C₆脂肪族基であり、

J^A、J^B、及びJ^Tはそれぞれ独立に、オキソ若しくはJ^Cであり、

J^Cはそれぞれ独立に、ハロゲン、シアノ、M、R^a、若しくはR^a - Mからなる群か
ら選択され、

Mは独立に、- OR^b、- SR^b、- S(O)R^a、- SO₂R^a、- NR^bR^c、-
C(O)R^a、- C(=NR)R^c、- C(=NR)NR^bR^c、- NRC(=NR)N
R^bR^c、- C(O)OR^b、- OC(O)R^b、- NRC(O)R^b、- C(O)NR^b
R^c、- NRC(O)NR^bR^c、- NRC(O)OR^b、- OCONR^bR^c、- C
(O)NRCO₂R^b、- NRC(O)NRC(O)OR^b、- C(O)NR(OR^b)
、- OSO₂NR^bR^c、- SO₂NR^cR^b、- NRSO₂R^b、- NRSO₂NR^c
R^b、- P(O)(OR^b)₂、- OP(O)(OR^b)₂、- P(O)₂OR^b及び -
CO₂SO₂R^b、若しくは

所望により、2つのJ^T、2つのJ^A、2つのJ^B、及び2つのJ^C、がそれぞれ、そ
れらが結合している原子と合わせて、所望により1つ以上のインスタンスのJ⁴で置換さ
れた4～10員環を独立に形成し、並びに

R^aは独立に、

i) C₁～C₆脂肪族基であって、所望によりハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ
、- NH₂、- NH(C₁～C₄アルキル)、- N(C₁～C₄アルキル)₂、- OCO
(C₁～C₄アルキル)、- CO(C₁～C₄アルキル)、- CO₂H、- CO₂(C₁

～C₄アルキル)、-O(C₁～C₄アルキル)、C₃～C₈炭素環基(所望により1つ以上のインスタンスのJ²で置換されている)、4～8員の複素環基(所望により1つ以上のインスタンスのJ²で置換されている)、5～10員のヘテロアリール基(所望により1つ以上のインスタンスのJ³で置換されている)、及び6～10員のアリール基(所望により1つ以上のインスタンスのJ³で置換されている)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ているC₁～C₆脂肪族基、

i i) C₃～C₈炭素環基、若しくは4～8員の複素環基であって、このそれぞれが所望によりかつ独立に1つ以上のインスタンスのJ²で置換されているC₃～C₈炭素環基、若しくは4～8員の複素環基、又は

i i i) 5～10員のヘテロアリール基、若しくは6～10員のアリール基であって、このそれぞれが所望によりかつ独立に1つ以上のインスタンスのJ³で置換されている5～10員のヘテロアリール基、若しくは6～10員のアリール基、であり、並びに

R^b及びR^cはそれぞれ独立に、R^a若しくは-Hであり、又は所望によりR^b及びR^cは、それらが結合している窒素原子と合わせて、所望により1つ以上のインスタンスのJ²で置換された4～8員の複素環基をそれぞれ形成し、

R^t及びR^sはそれぞれ独立に、-H、ハロゲン、若しくはC₁～C₆アルキル基であって、所望により1つ以上のインスタンスのJ¹で置換されているC₁～C₆アルキルであり、又は所望により、R^t及びR^sは、それらが結合している炭素原子と合わせて、シクロプロパン環を形成し、これは所望により、1つ以上のメチルインスタンスで置換されており、

R及びR'はそれぞれ独立に、-H若しくはC₁～C₆アルキルであって、これは所望によりかつ独立に1つ以上のインスタンスのJ¹で置換されているC₁～C₆アルキルであり、又は所望により、R及びR'は、それらが結合している窒素と合わせて、4～8員の複素環基を形成し、これは所望により、1つ以上のインスタンスのJ²で置換されており、

各J¹は独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、-NH₂、-NH(C₁～C₄アルキル)、-N(C₁～C₄アルキル)₂、-OCO(C₁～C₄アルキル)、-CO(C₁～C₄アルキル)、-CO₂H、-CO₂(C₁～C₄アルキル)、-O(C₁～C₄アルキル)、及びフェニルからなる群から選択され、

各J²は独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、-NH₂、-NH(C₁～C₄アルキル)、-N(C₁～C₄アルキル)₂、-OCO(C₁～C₄アルキル)、-CO(C₁～C₄アルキル)、-CO₂H、-CO₂(C₁～C₄アルキル)、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、及び-O(C₁～C₄アルキル)からなる群から選択され、

各J³及びJ⁴は独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、-NH₂、-NH(C₁～C₄アルキル)、-N(C₁～C₄アルキル)₂、-OCO(C₁～C₄アルキル)、-CO(C₁～C₄アルキル)、-CO₂H、-CO₂(C₁～C₄アルキル)、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、及び-O(C₁～C₄アルキル)からなる群から選択され、

pは独立に1、2、3若しくは4であり、並びに

kは独立に1、2、3若しくは4であり、並びに

Q¹-R¹は、環Sに結合している-NH基が結合している同じ炭素原子のところにはないことを条件とする。

【請求項2】

Z¹～Z⁴のうち少なくとも1つがNである、請求項1に記載の化合物。

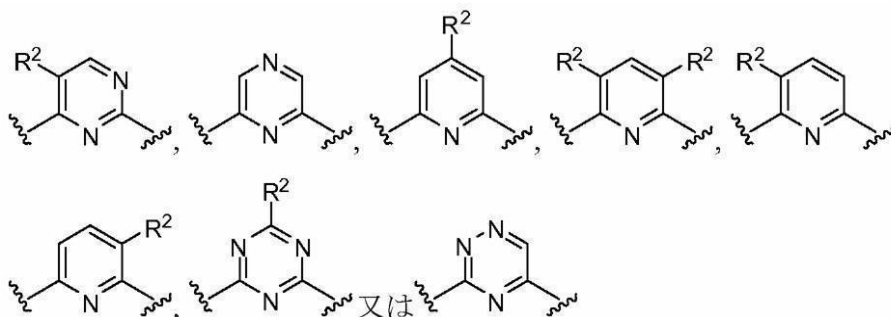
【請求項3】

Xが-C1、-Br、-F、-CN、-O(C₁～C₄アルキル)、C₁～C₆アルキル、又はC₁～C₆ハロアルキルである、請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項4】

環Sが、

【化 2】



から選択される、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

R² が - F、- Cl、- CN、C₁ ~ C₄ 脂肪族、又は C₁ ~ C₄ ハロアルキルである、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

X が - Cl、- Br、- F、- CN、- CH₃、又は CF₃ である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

Q¹ R¹ が - C(O)NH₂ 以外である、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8】

環 T が所望により置換された、架橋 C₅ ~ C₁₀ 炭素環基である、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

環 T が所望により置換された、単環 C₅ ~ C₈ 炭素環基である、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

R¹ は独立に、i) - H、ii) C₁ ~ C₆ 脂肪族基であって、所望により 1 つ以上のインスタンスの J^A で置換されている C₁ ~ C₆ 脂肪族基、iii) C₃ ~ C₈ 炭素環基若しくは 4 ~ 8 員の複素環基であって、それぞれ所望によりかつ独立に 1 つ以上のインスタンスの J^B で置換されている C₃ ~ C₈ 炭素環基若しくは 4 ~ 8 員の複素環基、iv) フェニル基若しくは 5 ~ 6 員のヘテロアリール基であって、それぞれ所望によりかつ独立に 1 つ以上のインスタンスの J^C で置換されているフェニル基若しくは 5 ~ 6 員のヘテロアリール基、又は

所望により R¹ は、R' 及びそれらが結合している窒素と合わせて、所望により置換されている 4 ~ 8 員の複素環基を形成しており、若しくは所望により、- Q¹ - R¹ は、環 T と合わせて、所望により置換されている 4 ~ 10 員の非芳香スピロ環を形成している、並びに

J^A、J^B、及び J^T はそれぞれ独立に、オキソ若しくは J^C であり、

J^C は、ハロゲン、シアノ、R^a、- OR^b、- SR^b、- S(O)R^a、- SO₂R^a、- NHR^c、- C(O)R^b、- C(O)OR^b、- OC(O)R^b、- NHC(O)R^b、- C(O)NHR^c、- NHC(O)NHR^c、- NHC(O)OR^b、- OC(O)NHR^c、- NHC(O)NHC(O)OR^b、- N(CH₃)R^c、- N(CH₃)C(O)R^b、- C(O)N(CH₃)R^c、- N(CH₃)C(O)NHR^c、- N(CH₃)C(O)OR^b、- OCON(CH₃)R^c、- C(O)NHCO₂R^b、- C(O)N(CH₃)CO₂R^b、- N(CH₃)C(O)NHC(O)OR^b、- NHSO₂R^b、- SO₂NHR^b、- SO₂N(CH₃)R^b、及び - N(CH₃)SO₂R^b からなる群から選択され、

所望により、2 つの J^T、2 つの J^A、2 つの J^B、及び 2 つの J^C がそれぞれ、それ

らが結合している原子と合わせて独立に、所望により置換されている 4 ~ 10 員の非芳香環を形成する、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 11】

R^a は独立に、i) $C_1 \sim C_6$ アルキル基であって、所望によりハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、所望により置換された $C_3 \sim C_8$ 炭素環基、所望により置換された 4 ~ 8 員の複素環基、所望により置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリール基、及び所望により置換されたフェニル基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ている $C_1 \sim C_6$ アルキル基、ii) 所望により置換された $C_3 \sim C_8$ 炭素環基、iii) 所望により置換された 4 ~ 8 員の複素環基、iv) 所望により置換された 5 ~ 6 員のヘテロアリール基、v) 又は所望により置換されたフェニル基であり、

R^b 及び R^c はそれぞれ独立に R^a 若しくは $-H$ 、又は所望により、 R^b 及び R^c は、それらが結合している窒素原子と合わせて、所望により置換された 4 ~ 8 員の複素環基をそれぞれ形成し、並びに

R 及び R' はそれぞれ独立に、 $-H$ 又は $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、あるいは所望により R 及び R' は、それらが結合している窒素と合わせて、4 ~ 8 員の複素環基を形成し、あるいは所望により R' は、 R^1 及びそれらが結合している窒素と合わせて、所望により置換された 4 ~ 8 員の複素環基を形成している、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 12】

Q^1 が、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OC(O)-$ 、 $-O(CR^tR^s)_k-C(O)O-$ 、 $-C(O)NR'-$ 、 $-C(O)N(R')-O-$ 、 $-C(O)NRC(O)O-$ 、 $-NRC(O)-$ 、 $-NRC(O)NR'-$ 、 $-NRCO_2-$ 、 $-OC(O)NR'-$ 、 $-OSO_2NR'-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-SO_2NR'-$ 、 $-NRSO_2-$ 、 $-NRSO_2NR'-$ 、 $-B(O_2)-$ 、又は $-(CR^tR^s)_p-Y^1-$ 、及び Y^1 が $-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OC(O)-$ 、 $-O(CR^tR^s)_k-C(O)O-$ 、 $-C(O)NR'-$ 、 $-C(O)N(R')-O-$ 、 $-C(O)NRC(O)O-$ 、 $-NRC(O)-$ 、 $-NRC(O)NR'-$ 、 $-NRCO_2-$ 、 $-OC(O)NR'-$ 、 $-OSO_2NR'-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-SO_2NR'-$ 、 $-NRSO_2-$ 、 $-B(O_2)-$ 、又は $-NRSO_2NR'-$ である、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 13】

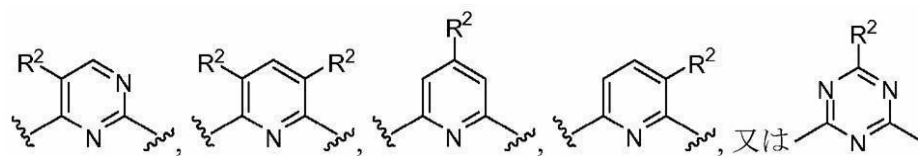
Q^1 は、 $-CO_2-$ 、 $-O(CR^tR^s)_k-C(O)O-$ 、 $-P(O)(OR)O-$ 、 $-OP(O)(OR^a)O-$ 、 $-P(O)_2O-$ 、 $-CO_2SO_2-$ 、又は $-(CR^tR^s)_p-Y^1-$ 、並びに

Y^1 は、 $-CO_2-$ 、 $-O(CR^tR^s)_k-C(O)O-$ 、 $-P(O)(OR)O-$ 、 $-OP(O)(OR^a)O-$ 、 $-P(O)_2O-$ 、又は $-CO_2SO_2-$ である、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 14】

環 S が、

【化 3】

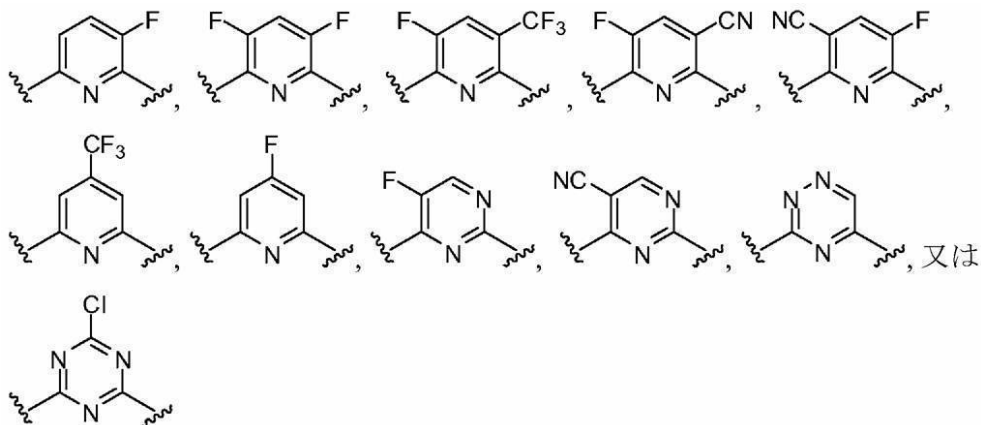


である、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 15】

環 S が、

【化 4】

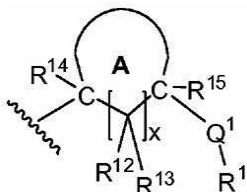


から選択される、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 16】

環 T が、

【化 5】



であり、式中、

環 A は 5 ~ 10 員の炭素環基であって、所望により更に 1 つ以上のインスタンスの J^T で置換される 5 ~ 10 員の炭素環基であり、又は所望により環 A と R^{15} 、環 A と R^{14} 、若しくは環 A と R^{13} は、独立にかつ所望により 5 ~ 10 員の架橋炭素環を形成し、これは所望により更に 1 つ以上のインスタンスの J^T で置換され、

R^{12} 、 R^{13} 、及び R^{14} はそれぞれ独立に、-H、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、-O($C_1 \sim C_6$ アルキル)、-NH₂、-NH($C_1 \sim C_6$ アルキル)、-N($C_1 \sim C_6$ アルキル)₂、-OCO($C_1 \sim C_6$ アルキル)、-CO($C_1 \sim C_6$ アルキル)、-CO₂H、又は -CO₂($C_1 \sim C_6$ アルキル)であり、ここにおいて前記の各 $C_1 \sim C_6$ アルキルは所望によりかつ独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、-NH₂、-NH($C_1 \sim C_4$ アルキル)、-N($C_1 \sim C_4$ アルキル)₂、-OCO($C_1 \sim C_4$ アルキル)、-CO($C_1 \sim C_4$ アルキル)、-CO₂H、-CO₂($C_1 \sim C_4$ アルキル)、及び -O($C_1 \sim C_4$ 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、

各 R^{15} は独立に、-H、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、又は $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、所望によりかつ独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、-NH₂、-NH($C_1 \sim C_4$ アルキル)、-N($C_1 \sim C_4$ アルキル)₂、-OCO($C_1 \sim C_4$ アルキル)、-CO($C_1 \sim C_4$ アルキル)、-CO₂H、-CO₂($C_1 \sim C_4$ アルキル)、及び -O($C_1 \sim C_4$ 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ている $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、並びに

X は 0、1 又は 2 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】

J^A 、 J^B 、 J^C 、及び J^T はそれぞれ独立に、ハロゲン、シアノ、 R^a 、-OR^b、

- NHR^c、- C(O)R^b、- C(O)OR^b、- OC(O)R^b、- NHC(O)R^b、- C(O)NHR^c、- NHC(O)NHR^c、- NHC(O)OR^b、- OCONHR^c、- N(CH₃)R^c、- N(CH₃)C(O)R^b、- C(O)N(CH₃)R^c、- N(CH₃)C(O)NHR^c、- N(CH₃)C(O)OR^b、- NH₂SO₂R^b、- SO₂NHR^b、- SO₂N(CH₃)R^b、及び - N(CH₃)SO₂R^b からなる群から選択され、又は

所望により、2つのJ^T、2つのJ^A、2つのJ^B、及び2つのJ^Cがそれぞれ独立に、それらが結合している原子と合わせて、所望によりハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、- NH₂、- NH(C₁ ~ C₄ アルキル)、- N(C₁ ~ C₄ アルキル)₂、- OC(O)(C₁ ~ C₄ アルキル)、- CO(C₁ ~ C₄ アルキル)、- CO₂H、- CO₂(C₁ ~ C₄ アルキル)、及び - O(C₁ ~ C₄ 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4 ~ 10員環を形成する、請求項1 ~ 16のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項18】

R^aが独立に、i) C₁ ~ C₆ アルキル基であって、所望によりハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、- NH₂、- NH(C₁ ~ C₄ アルキル)、- N(C₁ ~ C₄ アルキル)₂、- OC(O)(C₁ ~ C₄ アルキル)、- CO(C₁ ~ C₄ アルキル)、- CO₂H、- CO₂(C₁ ~ C₄ アルキル)、- O(C₁ ~ C₄ アルキル)、C₃ ~ C₈ 炭素環基、4 ~ 8員の複素環基、5 ~ 6員のヘテロアリール基、及びフェニ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ているC₁ ~ C₆ アルキル基、ii) C₃ ~ C₈ 炭素環基若しくは4 ~ 8員の複素環基であって、これらはそれぞれ独立にかつ所望により、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、- NH₂、- NH(C₁ ~ C₄ アルキル)、- N(C₁ ~ C₄ アルキル)₂、- OC(O)(C₁ ~ C₄ アルキル)、- CO(C₁ ~ C₄ アルキル)、- CO₂H、- CO₂(C₁ ~ C₄ アルキル)、C₁ ~ C₄ アルキル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、及び - O(C₁ ~ C₄ 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ているC₃ ~ C₈ 炭素環基若しくは4 ~ 8員の複素環基、又はiii) 5 ~ 6員のヘテロアリール基若しくはフェニル基であって、これらは独立にかつ所望により、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、- NH₂、- NH(C₁ ~ C₄ アルキル)、- N(C₁ ~ C₄ アルキル)₂、- OC(O)(C₁ ~ C₄ アルキル)、- CO(C₁ ~ C₄ アルキル)、- CO₂H、- CO₂(C₁ ~ C₄ アルキル)、C₁ ~ C₄ アルキル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、及び - O(C₁ ~ C₄ 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ている5 ~ 6員のヘテロアリール基若しくはフェニル基、であり、

R^b及びR^cはそれぞれ独立に、R^a若しくは - Hであり、又は所望により、R^b及びR^cは、それらが結合している窒素原子と合わせて、独立に4 ~ 8員の複素環基をそれぞれ形成し、これは所望により、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、- NH₂、- NH(C₁ ~ C₄ アルキル)、- N(C₁ ~ C₄ アルキル)₂、- OC(O)(C₁ ~ C₄ アルキル)、- CO(C₁ ~ C₄ アルキル)、- CO₂H、- CO₂(C₁ ~ C₄ アルキル)、C₁ ~ C₄ アルキル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、及び - O(C₁ ~ C₄ 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ている、請求項1 ~ 17のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項19】

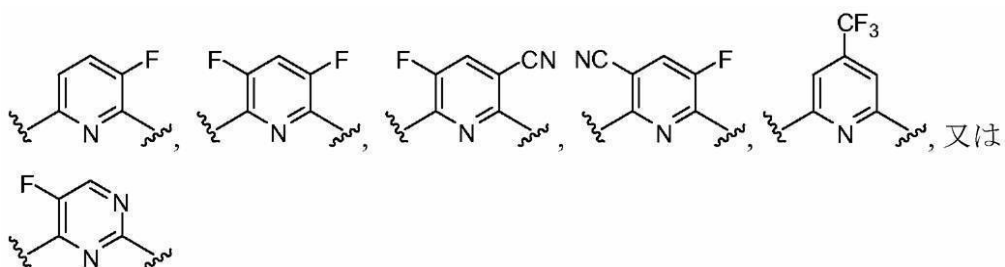
Q¹が - C(O)O -、- NRC(O) -、- C(O)NR -、- NRC(O)NR' -、又は - (CR^tR^s)₁、₂ - Y¹ -、及び

Y¹が - C(O)O -、- NRC(O) -、- C(O)NR -、又は - NRC(O)NR' - である、請求項16 ~ 18のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項20】

環Sが、

【化 6】



から選択される、請求項 1 ~ 19 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 21】

R^{12} 、 R^{13} 、及び R^{14} がそれぞれ独立に、- H、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、
- O ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、又は所望により置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、
 R^{15} が、- H 又は所望により置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、
 R^t 及び R^s はそれぞれ独立に、- H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、又は $C_1 \sim C_6$
ハロアルキルである、請求項 1 ~ 20 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 22】

R^{12} 及び R^{13} がそれぞれ独立に、- H、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、
 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、又は - O ($C_1 \sim C_6$ アルキル) であり、
 R^{14} 及び R^{15} がそれぞれ独立に、- H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、又は $C_1 \sim C_6$ ハロ
アルキルであり、並びに
 R^t 及び R^s はそれぞれ独立に、- H 又は $C_1 \sim C_6$ アルキルである、請求項 1 ~ 21
のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 23】

R^1 は独立に、i) - H、ii) $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基であって、所望によりハロゲン、
シアノ、ヒドロキシ、オキソ、- O ($C_1 \sim C_4$ アルキル)、- NH₂、- NH ($C_1 \sim C_4$
アルキル)、- N ($C_1 \sim C_4$ アルキル)₂、- C (O) ($C_1 \sim C_4$ アルキル)、
- O C (O) ($C_1 \sim C_4$ アルキル)、- C (O) O ($C_1 \sim C_4$ アルキル)、- CO₂
H、 $C_3 \sim C_8$ 炭素環基、4 ~ 8 員の複素環基、フェニル、及び 5 ~ 6 員のヘテロアリール
からなる群から独立に選択される 1 つ以上の置換基で置換されている $C_1 \sim C_6$ 脂肪族
基、iii) $C_3 \sim C_7$ 炭素環基、iv) 4 ~ 7 員の複素環基、v) フェニル基、又は vi)
5 ~ 6 員のヘテロアリール基であり、

所望により R^1 は、 R' 、及びそれらが結合している窒素と合わせて所望により置換さ
れている 4 ~ 8 員の複素環基を形成し、並びに

R^1 で表わされる、及び、 R^1 で表わされる $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基の置換基についての、
前記炭素環基、フェニル基、複素環基、及びヘテロアリール基のそれぞれと、 R^1 及び R'
で形成される前記複素環基は、独立にかつ所望により、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ
、オキソ、- NH₂、- NH ($C_1 \sim C_4$ アルキル)、- N ($C_1 \sim C_4$ アルキル)₂、
- O C O ($C_1 \sim C_4$ アルキル)、- C O ($C_1 \sim C_4$ アルキル)、- CO₂ H、- CO
₂ ($C_1 \sim C_4$ アルキル)、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、及び - O ($C_1 \sim C_4$
アルキル) からなる群から独立に選択される 1 つ以上の置換基で置換される、
請求項 1 ~ 22 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 24】

環 A が所望によりかつ独立に、更にハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、- NH₂
、- NH ($C_1 \sim C_4$ アルキル)、- N ($C_1 \sim C_4$ アルキル)₂、- O C O ($C_1 \sim C_4$
アルキル)、- C O ($C_1 \sim C_4$ アルキル)、- CO₂ H、- CO₂ ($C_1 \sim C_4$ アル
キル)、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、及び - O ($C_1 \sim C_4$ 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ており、又は、環 A と R^{15} 、
環 A と R^{14} 、若しくは環 A と R^{13} は独立にかつ所望により架橋炭素環基を形成し、こ

れらはそれぞれ所望によりかつ独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-\text{OCO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CO}_2(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ ハロアルキル}$ 、及び $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 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ている、請求項1～23のいずれか一項に記載の化合物。

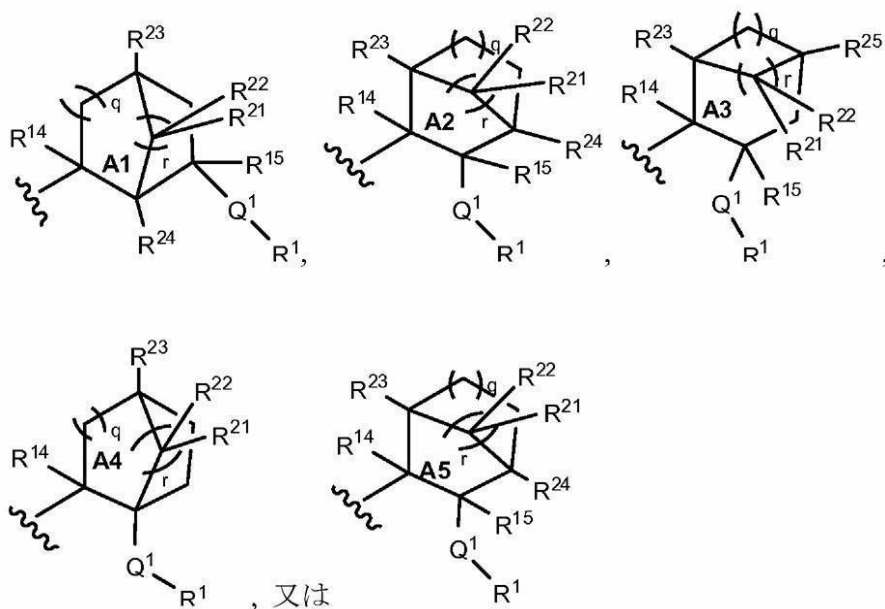
【請求項25】

環Aと R^{15} 、環Aと R^{14} 、又は環Aと R^{13} が独立に、所望により置換された、架橋炭素環を形成する、請求項1～24のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項26】

環Tが、

【化7】



であり、式中、

環A1～A5はそれぞれ独立に、5～10員の架橋炭素環であり、これは所望により更に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-\text{OCO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CO}_2(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ ハロアルキル}$ 、及び $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 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、

各 R^{14} は独立に、 $-\text{H}$ 、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル}$ 、 $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})_2$ 、 $-\text{OCO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、又は $-\text{CO}_2(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ であり、ここにおいて前記の各 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル}$ は所望によりかつ独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-\text{OCO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CO}_2(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、及び $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 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、

各 R^{15} は独立に、 $-\text{H}$ 、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル}$ であって、所望によりかつ独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-\text{OCO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CO}_2(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、及び $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ からなる群から選択される1つ以上の置換基で置換

されている $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、並びに

R^{21} 、 R^{22} 、 R^{23} 、 R^{24} 、及び R^{25} はそれぞれ独立に、 $-H$ 、ハロゲン、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、又は $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、所望によりハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、及び $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ からなる群から独立に選択される 1 つ以上の置換基で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

q は 0、1 又は 2 であり、並びに

r は 1 又は 2 である、請求項 1 ～ 25 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 27】

R^{14} 及び各 R^{15} がそれぞれ独立に、 $-H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであり、並びに

R^{21} 、 R^{22} 、 R^{23} 、 R^{24} 、及び R^{25} はそれぞれ独立に、 $-H$ 、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルである、請求項 26 に記載の化合物。

【請求項 28】

Q^1 が独立に、 $-C(O)O-$ 、 $-NRC(O)-$ 、 $-C(O)NR-$ 、 $-NRC(O)NR'-$ 、又は $-(CH_2)_{1,2}-Y^1-$ であり、及び

Y^1 が独立に、 $-C(O)O-$ 、 $-NRC(O)-$ 、 $-C(O)NR-$ 、又は $-NRC(O)NR'-$ である、請求項 26 又は 27 に記載の化合物。

【請求項 29】

Q^1 が独立に $-C(O)O-$ 、 $-NRC(O)-$ 、又は $-C(O)NR-$ である、請求項 28 に記載の化合物。

【請求項 30】

R^1 は独立に、 $-H$ 又は所望により置換された $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基であり、並びに

R 及び R' はそれぞれ独立に、 $-H$ 若しくは $-CH_3$ であり、又は

所望により R^1 は、 R' 、及びそれらが結合している窒素と合わせて所望により置換されている 4 ～ 8 員の複素環基を形成している、請求項 25 ～ 29 のいずれか一項に記載の化合物。

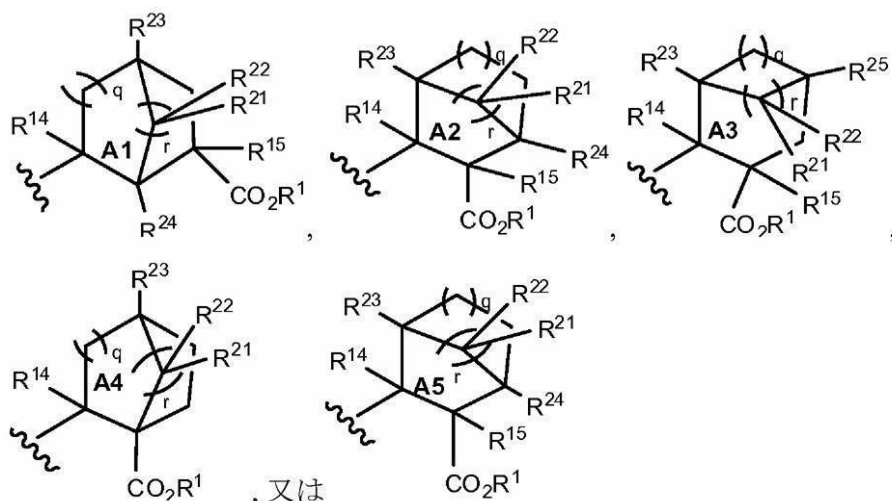
【請求項 31】

Q^1 が独立に $-C(O)O-$ 、 $-NHC(O)-$ 、又は $-C(O)NH-$ である、請求項 29 に記載の化合物。

【請求項 32】

環 T が、

【化 8】



であり、

式中、環 A 1 ~ A 5 はそれぞれ独立にかつ所望により更に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C₁ ~ C₄ アルキル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、及び - O (C₁ ~ C₄ 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、請求項 2 6 ~ 3 1 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 3 3】

R^{1 4} 及び各 R^{1 5} がそれぞれ独立に、- H 又は C₁ ~ C₆ アルキルであり、並びに R^{2 1}、R^{2 2}、R^{2 3}、R^{2 4}、及び R^{2 5} はそれぞれ独立に、- H 又は C₁ ~ C₆ アルキルである、請求項 2 6 ~ 3 2 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 3 4】

R¹ が H、又は所望により置換された C₁ ~ C₆ アルキルであり、並びに R^{1 4}、R^{1 5}、R^{2 1}、R^{2 2}、R^{2 3}、R^{2 4}、及び R^{2 5} はそれぞれ独立に - H である、請求項 2 6 ~ 3 2 のいずれか一項に記載の化合物。

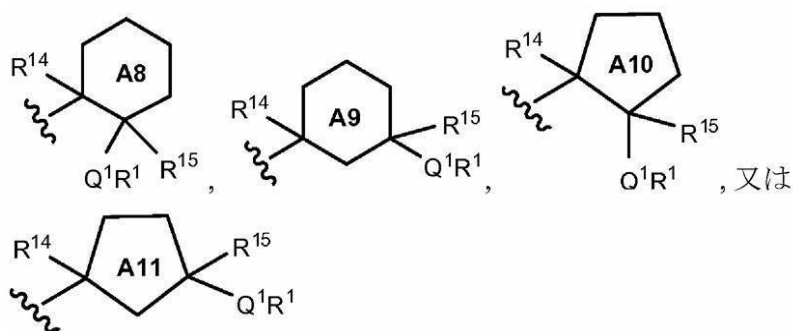
【請求項 3 5】

q が 1 である、請求項 2 6 ~ 3 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 3 6】

環 T が、

【化 9】



から選択され、式中、

R^{1 4} 及び各 R^{1 5} がそれぞれ独立に、- H、C₁ ~ C₆ アルキル、又は C₁ ~ C₆ ハロアルキルであり、並びに

環 A 8 ~ A 1 1 はそれぞれ独立にかつ所望により、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、- NH₂、- NH (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (C₁ ~ C₄ アルキル)₂、- OCO (C₁ ~ C₄ アルキル)、- CO (C₁ ~ C₄ アルキル)、- CO₂ H、- CO₂ (C₁ ~ C₄ アルキル)、C₁ ~ C₄ アルキル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、及び - O (C₁ ~ C₄ 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ている、請求項 1 ~ 2 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 3 7】

Q¹ が独立に、- C (O) -、- C (O) O -、- NRC (O) -、- C (O) NR -、- NRC (O) NR' -、又は - (CH₂)_{1, 2} - Y -、及び

Y¹ は独立に、- C (O) -、- C (O) O -、- NRC (O) -、- C (O) NR -、又は - NRC (O) NR' - である、請求項 3 6 に記載の化合物。

【請求項 3 8】

R^{1 4} 及び各 R^{1 5} はそれぞれ独立に、- H 又は C₁ ~ C₆ アルキルであり、並びに各環 A 8 ~ A 1 1 が独立にかつ所望により、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C₁ ~ C₄ アルキル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、及び - O (C₁ ~ C₄ 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、請求項 3 6 又は 3 7 に記載の化合物。

【請求項 3 9】

R 及び R' がそれぞれ独立に - H 又は - CH₃ である、請求項 3 6 ~ 3 8 のいずれか一

項に記載の化合物。

【請求項 40】

Q^1 が独立に

-NRC(O)-、-C(O)NR-、又は-NRC(O)NR'-である、請求項 36～38 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 41】

R 及び R' がそれぞれ独立に、-H 若しくは -CH₃ であり、並びに

R¹ は独立に、4～7 員の複素環基、フェニル基、若しくは 5～6 員のヘテロアリール基であり、ここにおいて前記複素環基、フェニル基、及びヘテロアリール基は独立にかつ所望により、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、-NH₂、-NH(C₁～C₄アルキル)、-N(C₁～C₄アルキル)₂、-OCO(C₁～C₄アルキル)、-CO(C₁～C₄アルキル)、-CO₂H、-CO₂(C₁～C₄アルキル)、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、及び-O(C₁～C₄アルキル)からなる群から独立に選択される 1 つ以上の置換基で置換され、又は

所望により R¹ と R' は、それらが結合している窒素原子と合わせて所望により置換されている 4～8 員の複素環基を形成する、請求項 40 に記載の化合物。

【請求項 42】

p が 1 又は 2 であり、並びに k が 1 又は 2 である、請求項 1～18 及び 36 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 43】

X が -F 又は -Cl である、請求項 1～42 のいずれか一項に記載の化合物。

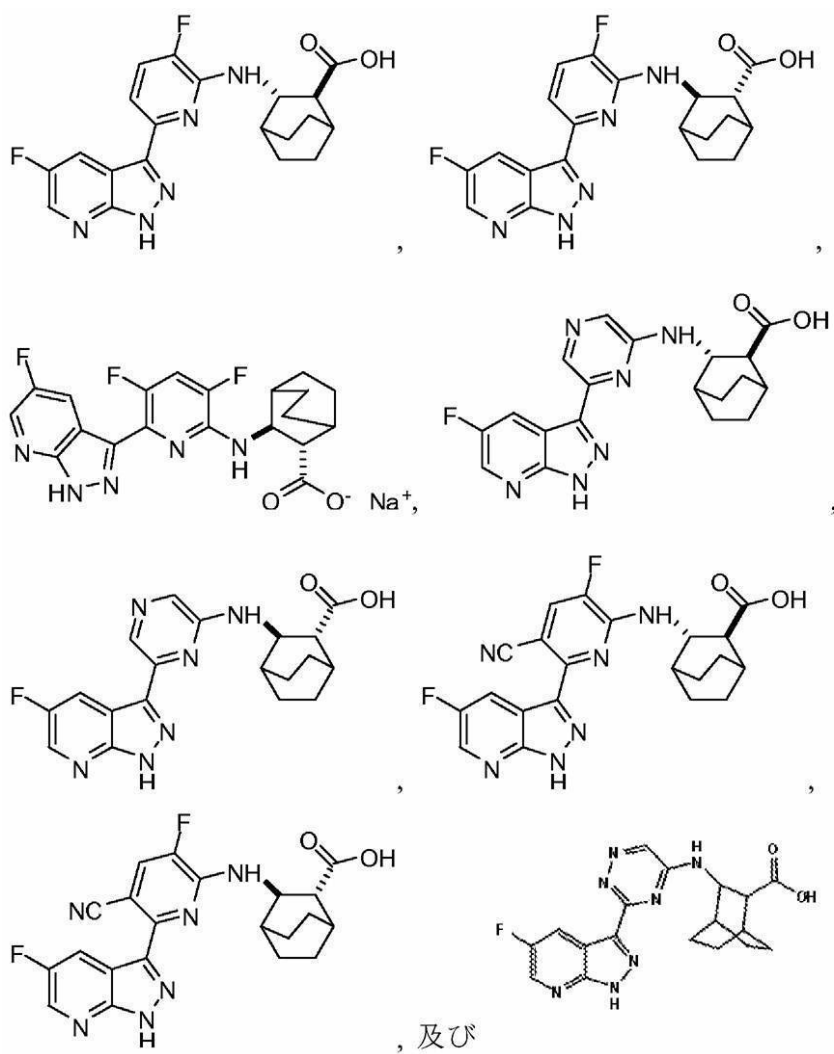
【請求項 44】

下記に示される構造、

The image displays a collection of chemical structures, primarily quinazolinones and their derivatives, arranged in a grid. The structures are as follows:

- Top Row:**
 - Structure 1: A quinazolinone derivative with a 2-fluorophenyl group at position 4 and a 2-(2-(2-methoxyacetoxy)cyclohexyl)amino group at position 2.
 - Structure 2: A quinazolinone derivative with a 2-fluorophenyl group at position 4 and a 2-(2-hydroxycyclohexyl)amino group at position 2.
 - Structure 3: A quinazolinone derivative with a 2-fluorophenyl group at position 4 and a 2-(2-(2-methyl-1H-imidazol-1-yl)acetoxy)cyclohexylamino group at position 2.
- Second Row:**
 - Structure 4: A quinazolinone derivative with a 2,4-difluorophenyl group at position 4 and a 2-(2-(2-hydroxycyclohexyl)amino) group at position 2.
 - Structure 5: A quinazolinone derivative with a 2,4-difluorophenyl group at position 4 and a 2-(2-(2-hydroxycyclohexyl)amino) group at position 2.
- Third Row:**
 - Structure 6: A quinazolinone derivative with a 2,4-difluorophenyl group at position 4 and a 2-(2-(2-(2-oxo-2H-pyridin-1-yl)acetoxy)cyclohexyl)amino group at position 2.
 - Structure 7: A quinazolinone derivative with a 2,4-difluorophenyl group at position 4 and a 2-(2-(2-(2-oxo-2H-pyridin-1-yl)acetoxy)cyclohexyl)amino group at position 2.
- Fourth Row:**
 - Structure 8: A quinazolinone derivative with a 2,4-difluorophenyl group at position 4 and a 2-(2-(2-(2-oxo-2H-pyridin-1-yl)acetoxy)cyclohexyl)amino group at position 2.
 - Structure 9: A quinazolinone derivative with a 2,4-difluorophenyl group at position 4 and a 2-(2-(2-(2-oxo-2H-pyridin-1-yl)acetoxy)cyclohexyl)amino group at position 2.
- Fifth Row:**
 - Structure 10: A quinazolinone derivative with a 2-chloro-4-fluorophenyl group at position 4 and a 2-(2-(2-(2-oxo-2H-pyridin-1-yl)acetoxy)cyclohexyl)amino group at position 2.
 - Structure 11: A quinazolinone derivative with a 2-chloro-4-fluorophenyl group at position 4 and a 2-(2-(2-(2-oxo-2H-pyridin-1-yl)acetoxy)cyclohexyl)amino group at position 2.
- Sixth Row:**
 - Structure 12: A quinazolinone derivative with a 2-chloro-4-fluorophenyl group at position 4 and a 2-(2-(2-(2-oxo-2H-pyridin-1-yl)acetoxy)cyclohexyl)amino group at position 2.
 - Structure 13: A quinazolinone derivative with a 2-chloro-4-fluorophenyl group at position 4 and a 2-(2-(2-(2-oxo-2H-pyridin-1-yl)acetoxy)cyclohexyl)amino group at position 2.

【化 1 1】

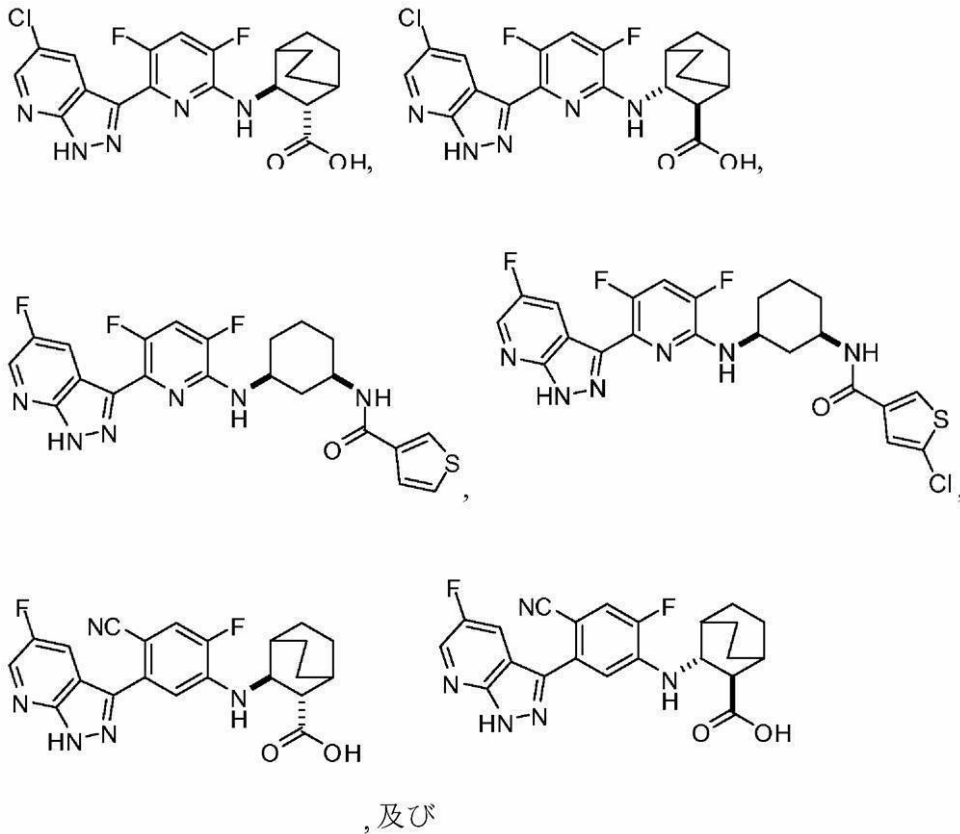


のうち任意の 1 つから選択される化合物、又はその製薬上許容される塩。

【請求項 4 5】

下記に示される構造、

【化 1 2】



のうち任意の 1 つから選択される化合物、又はその製薬上許容される塩。

【請求項 4 6】

請求項 1 ～ 4 5 のいずれか一項に記載の化合物と、製薬上許容される担体、補助剤、又は賦形剤とを含む、医薬組成物。

【請求項 4 7】

請求項 1 ～ 4 5 のいずれか一項に記載の化合物を含む、生物学的サンプル又は患者におけるインフルエンザウイルスの複製を阻害するための組成物。

【請求項 4 8】

前記組成物が追加治療薬と併用投与されることを特徴とする、請求項 4 7 に記載の組成物。

【請求項 4 9】

前記追加治療薬が、抗ウイルス剤若しくはインフルエンザワクチンから選択される、又はその両方である、請求項 4 8 に記載の組成物。

【請求項 5 0】

請求項 1 ～ 4 5 のいずれか一項に記載の化合物を含む、生物学的サンプル又は患者におけるインフルエンザウイルスの量を低減するための組成物。

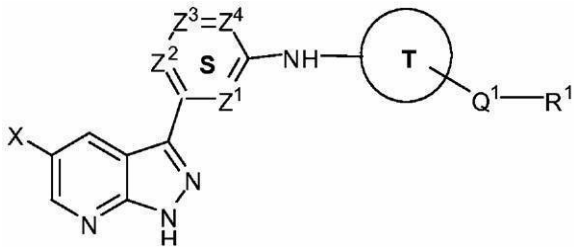
【請求項 5 1】

請求項 1 ～ 4 5 のいずれか一項に記載の化合物を含む、患者におけるインフルエンザの治療のための組成物。

【請求項 5 2】

構造式 (I) :

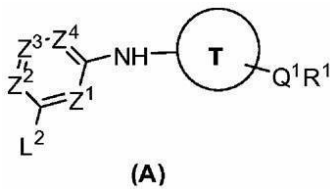
【化 1 3】



で表わされる化合物又はその製薬上許容される塩の調製方法であって、該方法が、

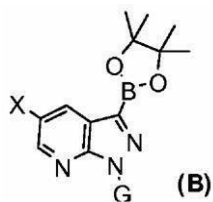
i) 化合物 A :

【化 1 4】



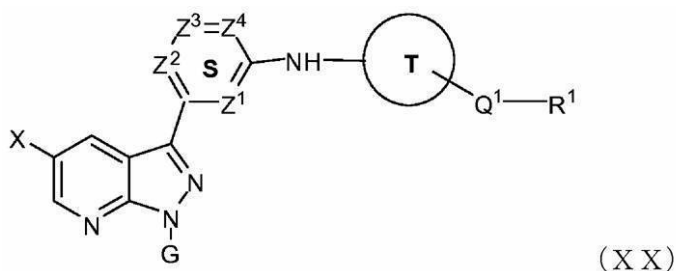
を化合物 (B) :

【化 1 5】



と反応させて、構造式 (X X) :

【化 1 6】



で表わされる化合物を形成する工程と、

i i) 好適な条件下で構造式 (X X) の化合物の G 基を脱保護して、構造式 (I) の化合物を形成する工程と、を含み、ここにおいて、

構造式 (I) 及び (X X)、並びに化合物 (A) 及び (B) の可変部分は独立に、請求項 1 ~ 45 のいずれか一項で定義されている通りであり、並びに

L² はハロゲンであり、並びに

G はトリチルである、方法。

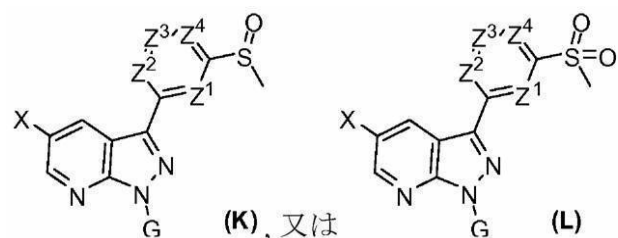
【請求項 5 3】

L² が Br 又は Cl である、請求項 5 2 に記載の方法。

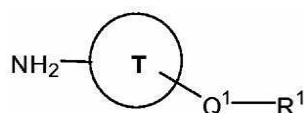
【請求項 5 4】

構造式 (I) :

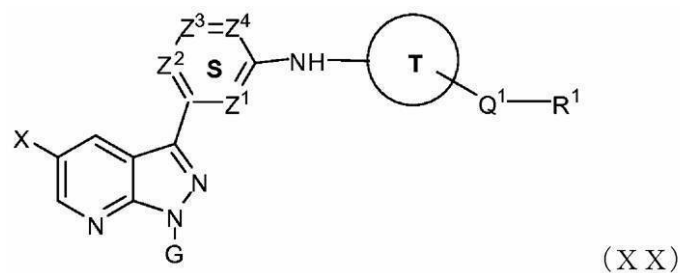
【化 1 8】



【化 1 9】



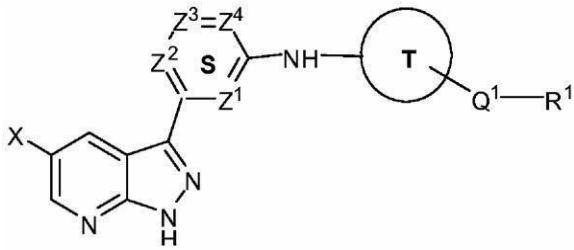
【化 2 0】



【請求項 55】

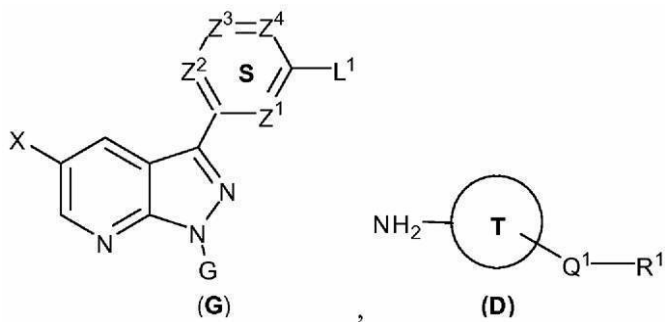
構造式 (I) :

【化 2 1】



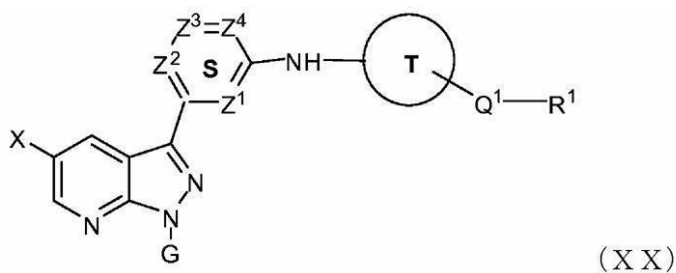
で表わされる化合物又はその製薬上許容される塩の調製方法であって、該方法が、
i) 化合物 (G) を化合物 (D) :

【化 2 2】



と好適な条件下で反応させて、構造式 (XX) :

【化 2 3】



で表わされる化合物を形成する工程と、

ii) 好適な条件下で構造式 (XX) の化合物の G 基を脱保護して、構造式 (I) の化合物を形成する工程と、を含み、ここにおいて、

構造式 (I) 及び (XX)、並びに化合物 (G) 及び (D) の可変部分はそれぞれ独立に、請求項 1 ~ 45 のいずれか一項で定義されている通りであり、並びに

L¹ はハロゲンであり、並びに

G はトリチルである、方法。

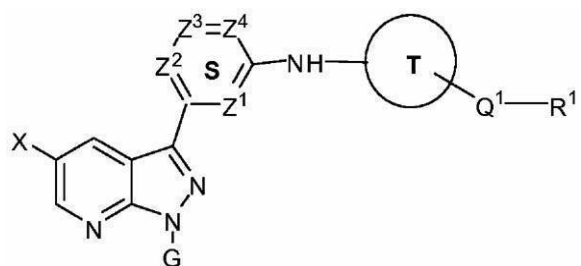
【請求項 56】

L¹ が Br または Cl である、請求項 55 に記載の方法。

【請求項 57】

構造式 (XX) :

【化 2 4】

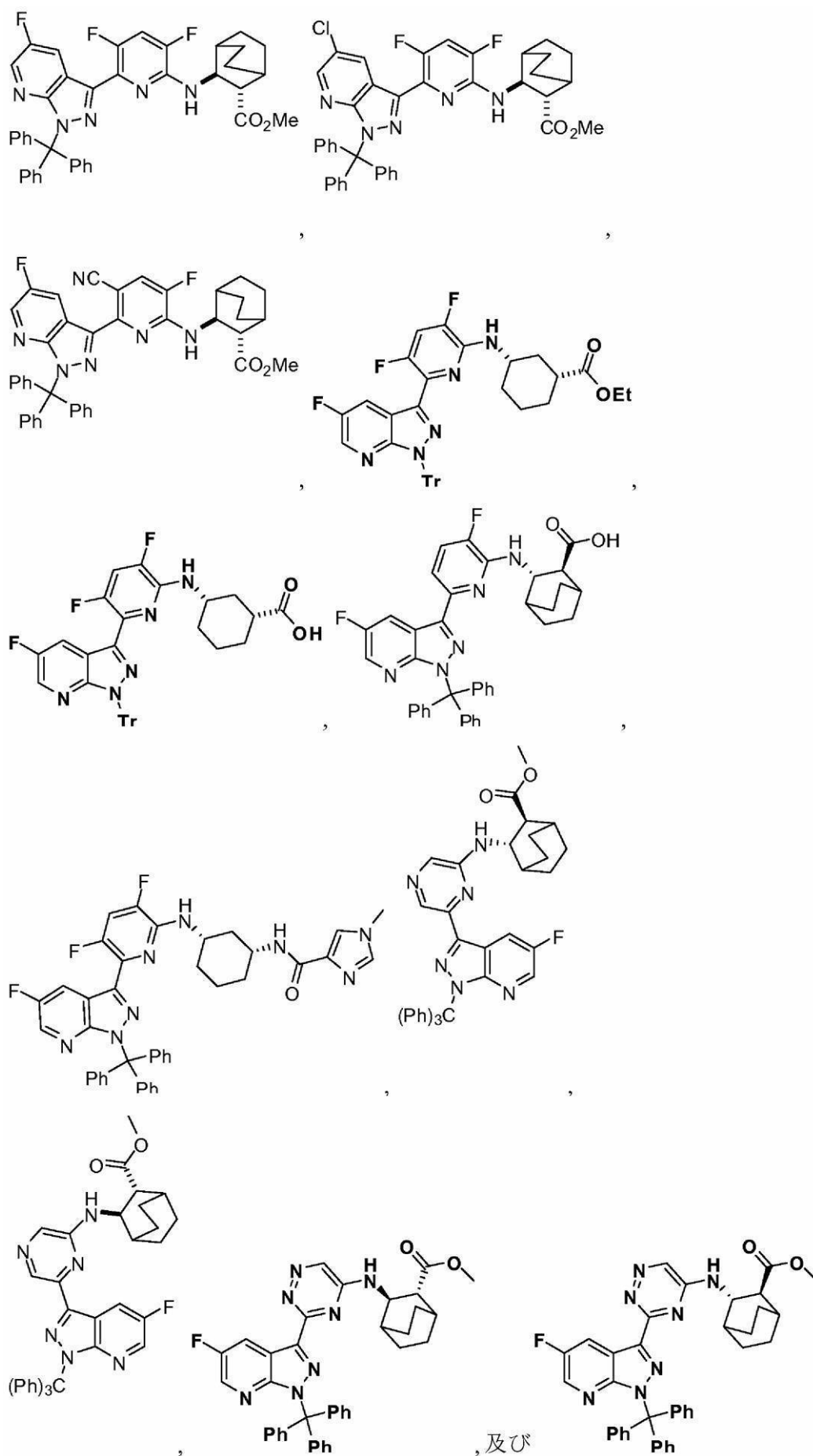


で表わされる化合物であって、構造式 (X X) の可変部分はそれぞれ独立に請求項 1 ~ 4 5 のいずれか一項で定義されている通りであり、及び
G はトリチルである、方法。

【請求項 5 8】

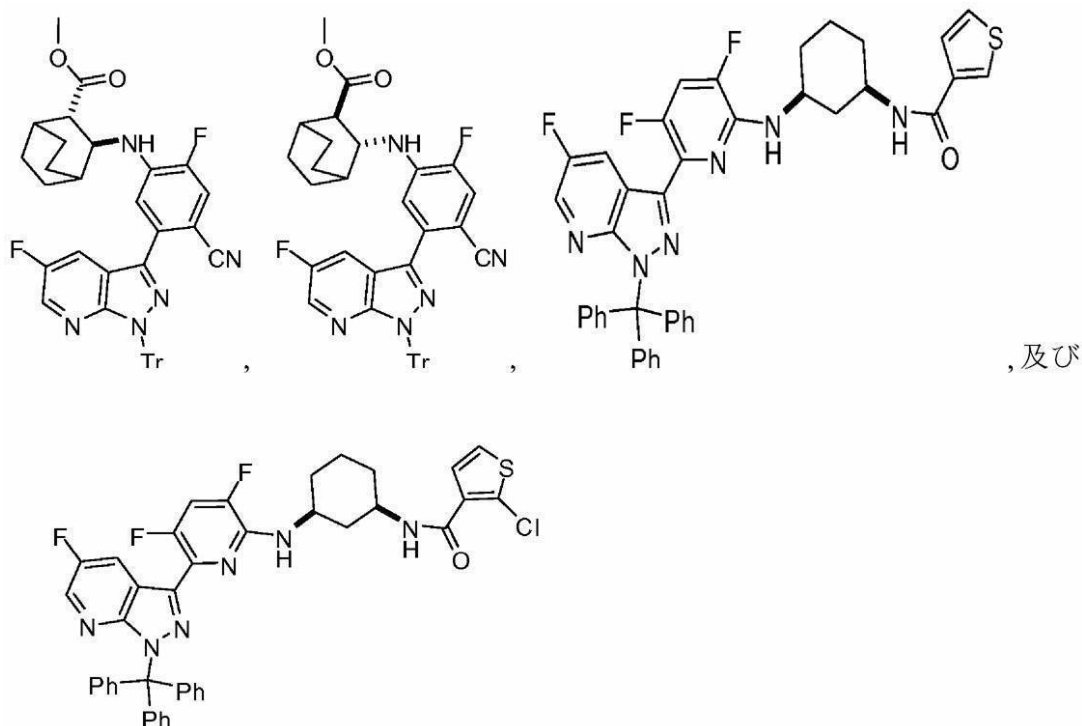
下記の構造式、

【化 2 5】



【請求項 59】

【化 2 6】



【手續補正2】

【補正対象項目名】 0 0 4 2

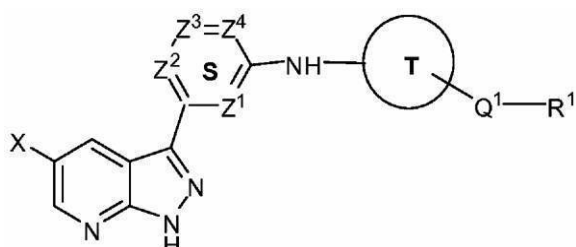
【補正の内容】

【 0 0 4 2 】

一実施形態において、たとえば、以下の項目が提供される。

構造式 (I) :

【化 1】



で表わされる化合物、又はその製薬上許容される塩であり、式中、

Xは - Cl、- Br、- F、- CN、- O(C₁ ~ C₆ アルキル)、若しくは C₁ ~ C₆ 脂肪族であって、所望により1つ以上のインスタンスの J¹ で置換されている C₁ ~ C₆ 脂肪族であり、

Z¹、Z²、Z³、及び Z⁴ はそれぞれ独立に CR² 若しくは N であり、ただし Z¹、Z²、Z³、及び Z⁴ には最高3つまでの N が選択され、かつ Z³ 及び Z⁴ が両方とも CR² である場合、Z¹ と Z² は両方とも同時に N とはならず、

環 S は六員芳香環であり、

環 T は C₃ ~ C₁₀ 炭素環であって、所望により更に1つ以上のインスタンスの J^T で置換されている C₃ ~ C₁₀ 炭素環であり、

Q¹ は - C(O)-、- CO₂-、- OC(O)-、- O(CR^tR^s)_k-C(O)O-、- C(O)NR'-、- C(O)N(R')-O-、- C(O)NRC(O)O-、- NRC(O)-、- NRC(O)NR'-、- NRCO₂-、- OC(O)NR'-、- OSO₂NR'-、- S(O)-、- SO₂-、- SO₂NR'-、- NRSO₂-、- NRSO₂NR'-、- P(O)(OR)O-、- OP(O)(OR^a)O-、- P(O)₂O-、- CO₂SO₂-、- B(O)₂-、若しくは - (CR^tR^s)_p-Y¹- であり、

Y¹ は - C(O)-、- CO₂-、- OC(O)-、- O(CR^tR^s)_k-C(O)O-、- C(O)NR'-、- C(O)N(R')-O-、- C(O)NRC(O)O-、- NRC(O)-、- NRC(O)NR'-、- NRCO₂-、- OC(O)NR'-、- OSO₂NR'-、- S(O)-、- SO₂-、- SO₂NR'-、- NRSO₂-、- NRSO₂NR'-、- P(O)(OR)O-、- OP(O)(OR^a)O-、- P(O)₂O-、- B(O)₂-、若しくは - CO₂SO₂- であり、

R¹ は、i) - H、ii) C₁ ~ C₆ 脂肪族基であって、所望により1つ以上のインスタンスの J^A で置換されている C₁ ~ C₆ 脂肪族基、iii) C₃ ~ C₁₀ 炭素環基若しくは4 ~ 10員の複素環基であって、それぞれ所望によりかつ独立に1つ以上のインスタンスの J^B で置換されている C₃ ~ C₁₀ 炭素環基若しくは4 ~ 10員の複素環基、又はiv) 6 ~ 10員のアリール基若しくは5 ~ 10員のヘテロアリール基であって、それぞれ所望によりかつ独立に1つ以上のインスタンスの J^C で置換されている6 ~ 10員のアリール基若しくは5 ~ 10員のヘテロアリール基であり、

所望により R¹ は、R'、及びそれらが結合している窒素と合わせて4 ~ 8員の複素環基を形成し、これは所望により1つ以上のインスタンスの J² で置換されており、又は、

所望により - Q¹ - R¹ は、環 T と合わせて、4 ~ 10員の非芳香族スピロ環を形成し、これは所望により1つ以上のインスタンスの J⁴ で置換されており、並びに

R² は、- H、ハロゲン、- CN、- NO₂、- C(O)NH₂、- C(O)NH(CH₃)、- C(O)N(CH₃)₂、若しくは C₁ ~ C₆ 脂肪族であって、所望により1つ以上のインスタンスの J¹ で置換されている C₁ ~ C₆ 脂肪族であり、

J^A、J^B、及び J^T はそれぞれ独立に、オキソ若しくは J^C であり、

J^C はそれぞれ独立に、ハロゲン、シアノ、M、R^a、若しくは R^a - M からなる群から選択され、

M は独立に、- OR^b、- SR^b、- S(O)R^a、- SO₂R^a、- NR^bR^c、- C(O)R^a、- C(=NR)R^c、- C(=NR)NR^bR^c、- NRC(=NR)NR^bR^c、- C(O)OR^b、- OC(O)R^b、- NRC(O)R^b、- C(O)NR^bR^c、- NRC(O)NR^bR^c、- NRC(O)OR^b、- OCONR^bR^c、- C(O)NRCO₂R^b、- NRC(O)NRC(O)OR^b、- C(O)NR(OR^b)、- OSO₂NR^bR^c、- SO₂NR^cR^b、- NRSO₂R^b、- NRSO₂NR^cR^b、- P(O)(OR^b)₂、- OP(O)(OR^b)₂、- P(O)₂OR^b 及び - CO₂SO₂R^b、若しくは

所望により、2つの J^T、2つの J^A、2つの J^B、及び2つの J^C、がそれぞれ、そ

れらが結合している原子と合わせて、所望により 1 つ以上のインスタンスの J^4 で置換された 4 ~ 10 員環を独立に形成し、並びに

R^a は独立に、

i) $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基であって、所望によりハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $C_3 \sim C_8$ 炭素環基（所望により 1 つ以上のインスタンスの J^2 で置換されている）、4 ~ 8 員の複素環基（所望により 1 つ以上のインスタンスの J^2 で置換されている）、5 ~ 10 員のヘテロアリール基（所望により 1 つ以上のインスタンスの J^3 で置換されている）、及び 6 ~ 10 員のアリール基（所望により 1 つ以上のインスタンスの J^3 で置換されている）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ている $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基、

i i) $C_3 \sim C_8$ 炭素環基、若しくは 4 ~ 8 員の複素環基であって、このそれぞれが所望によりかつ独立に 1 つ以上のインスタンスの J^2 で置換されている $C_3 \sim C_8$ 炭素環基、若しくは 4 ~ 8 員の複素環基、又は

i i i) 5 ~ 10 員のヘテロアリール基、若しくは 6 ~ 10 員のアリール基であって、このそれぞれが所望によりかつ独立に 1 つ以上のインスタンスの J^3 で置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリール基、若しくは 6 ~ 10 員のアリール基、であり、並びに

R^b 及び R^c はそれぞれ独立に、 R^a 若しくは $-H$ であり、又は所望により R^b 及び R^c は、それらが結合している窒素原子と合わせて、所望により 1 つ以上のインスタンスの J^2 で置換された 4 ~ 8 員の複素環基をそれぞれ形成し、

R^t 及び R^s はそれぞれ独立に、 $-H$ 、ハロゲン、若しくは $C_1 \sim C_6$ アルキル基であって、所望により 1 つ以上のインスタンスの J^1 で置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、又は所望により、 R^t 及び R^s は、それらが結合している炭素原子と合わせて、シクロプロパン環を形成し、これは所望により、1 つ以上のメチルインスタンスで置換されており、

R 及び R' はそれぞれ独立に、 $-H$ 若しくは $C_1 \sim C_6$ アルキル基であって、これは所望によりかつ独立に 1 つ以上のインスタンスの J^1 で置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、又は所望により、 R 及び R' は、それらが結合している窒素と合わせて、4 ~ 8 員の複素環基を形成し、これは所望により、1 つ以上のインスタンスの J^2 で置換されており、

各 J^1 は独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、及びフェニルからなる群から選択され、

各 J^2 は独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、及び $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ からなる群から選択され、

各 J^3 及び J^4 は独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、及び $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ からなる群から選択され、

p は独立に 1、2、3 若しくは 4 であり、並びに

k は独立に 1、2、3 若しくは 4 であり、並びに

$Q^1 - R^1$ は、環 S に結合している $-NH$ 基が結合している同じ炭素原子のところにはないことを条件とする。

(項目 2)

(項目 3)

(項目 4)

(項目 5)

(項目 6)

(項目 7)

(項目 8)

(項目 9)

(項目 1 0)

所望により R^1 は、 R^1 及びそれらが結合している窒素と合わせて、所望により置換されている 4 ~ 8 員の複素環基を形成しており、若しくは所望により、 $-Q^1-R^1$ は、環 T と合わせて、所望により置換されている 4 ~ 10 員の非芳香スピロ環を形成している、並びに

[illegible]

$\text{CH}_3) \text{C}(\text{O}) \text{OR}^b$ 、 $-\text{OCON}(\text{CH}_3) \text{R}^c$ 、 $-\text{C}(\text{O}) \text{NHCO}_2 \text{R}^b$ 、 $-\text{C}(\text{O}) \text{N}(\text{CH}_3) \text{CO}_2 \text{R}^b$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3) \text{C}(\text{O}) \text{NHC}(\text{O}) \text{OR}^b$ 、 $-\text{NHSO}_2 \text{R}^b$ 、 $-\text{SO}_2 \text{NHR}^b$ 、 $-\text{SO}_2 \text{N}(\text{CH}_3) \text{R}^b$ 、及び $-\text{N}(\text{CH}_3) \text{SO}_2 \text{R}^b$ からなる群から選択され、

所望により、2つの J^T 、2つの J^A 、2つの J^B 、及び2つの J^C がそれぞれ、それらが結合している原子と合わせて独立に、所望により置換されている4～10員の非芳香環を形成する、項目1～9のいずれか一項に記載の化合物。

(項目11)

R^a は独立に、i) $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル基であって、所望によりハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-\text{OCO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}_2 \text{H}$ 、 $-\text{CO}_2(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、所望により置換された $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ 炭素環基、所望により置換された4～8員の複素環基、所望により置換された5～6員のヘテロアリール基、及び所望により置換されたフェニル基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ている $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル基、ii) 所望により置換された $\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ 炭素環基、iii) 所望により置換された4～8員の複素環基、iv) 所望により置換された5～6員のヘテロアリール基、v) 又は所望により置換されたフェニル基であり、

R^b 及び R^c はそれぞれ独立に R^a 若しくは $-\text{H}$ 、又は所望により、 R^b 及び R^c は、それらが結合している窒素原子と合わせて、所望により置換された4～8員の複素環基をそれぞれ形成し、並びに

R 及び R' はそれぞれ独立に、 $-\text{H}$ 又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルであり、あるいは所望により R 及び R' は、それらが結合している窒素と合わせて、4～8員の複素環基を形成し、あるいは所望により R' は、 R^1 及びそれらが結合している窒素と合わせて、所望により置換された4～8員の複素環基を形成している、項目1～10のいずれか一項に記載の化合物。

(項目12)

Q^1 が、 $-\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{CO}_2-$ 、 $-\text{OC}(\text{O})-$ 、 $-\text{O}(\text{CR}^t \text{R}^s)_k - \text{C}(\text{O}) \text{O}-$ 、 $-\text{C}(\text{O}) \text{NR}'-$ 、 $-\text{C}(\text{O}) \text{N}(\text{R}')-\text{O}-$ 、 $-\text{C}(\text{O}) \text{NRC}(\text{O}) \text{O}-$ 、 $-\text{NRC}(\text{O})-$ 、 $-\text{NRC}(\text{O}) \text{NR}'-$ 、 $-\text{NRCO}_2-$ 、 $-\text{OC}(\text{O}) \text{NR}'-$ 、 $-\text{OSO}_2 \text{NR}'-$ 、 $-\text{S}(\text{O})-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{SO}_2 \text{NR}'-$ 、 $-\text{NRSO}_2-$ 、 $-\text{NRSO}_2 \text{NR}'-$ 、 $-\text{B}(\text{O}_2)-$ 、又は $-(\text{CR}^t \text{R}^s)_p - \text{Y}^1-$ 、及び Y^1 が $-\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{CO}_2-$ 、 $-\text{OC}(\text{O})-$ 、 $-\text{O}(\text{CR}^t \text{R}^s)_k - \text{C}(\text{O}) \text{O}-$ 、 $-\text{C}(\text{O}) \text{NR}'-$ 、 $-\text{C}(\text{O}) \text{N}(\text{R}')-\text{O}-$ 、 $-\text{C}(\text{O}) \text{NRC}(\text{O}) \text{O}-$ 、 $-\text{NRC}(\text{O})-$ 、 $-\text{NRC}(\text{O}) \text{NR}'-$ 、 $-\text{NRCO}_2-$ 、 $-\text{OC}(\text{O}) \text{NR}'-$ 、 $-\text{OSO}_2 \text{NR}'-$ 、 $-\text{S}(\text{O})-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{SO}_2 \text{NR}'-$ 、 $-\text{NRSO}_2-$ 、 $-\text{B}(\text{O}_2)-$ 、又は $-\text{NRSO}_2 \text{NR}'-$ である、項目1～11のいずれか一項に記載の化合物。(項目13)

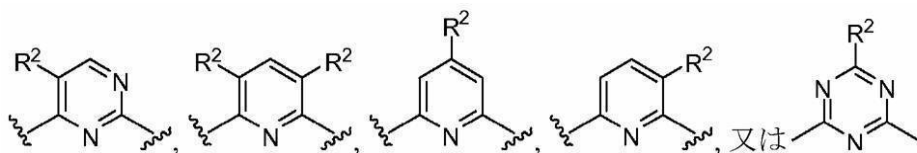
Q^1 は、 $-\text{CO}_2-$ 、 $-\text{O}(\text{CR}^t \text{R}^s)_k - \text{C}(\text{O}) \text{O}-$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}) \text{O}-$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}^a) \text{O}-$ 、 $-\text{P}(\text{O})_2 \text{O}-$ 、 $-\text{CO}_2 \text{SO}_2-$ 、又は $-(\text{CR}^t \text{R}^s)_p - \text{Y}^1-$ 、並びに

Y^1 は、 $-\text{CO}_2-$ 、 $-\text{O}(\text{CR}^t \text{R}^s)_k - \text{C}(\text{O}) \text{O}-$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}) \text{O}-$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}^a) \text{O}-$ 、 $-\text{P}(\text{O})_2 \text{O}-$ 、又は $-\text{CO}_2 \text{SO}_2-$ である、項目1～11のいずれか一項に記載の化合物。

(項目14)

環Sが、

【化 3】

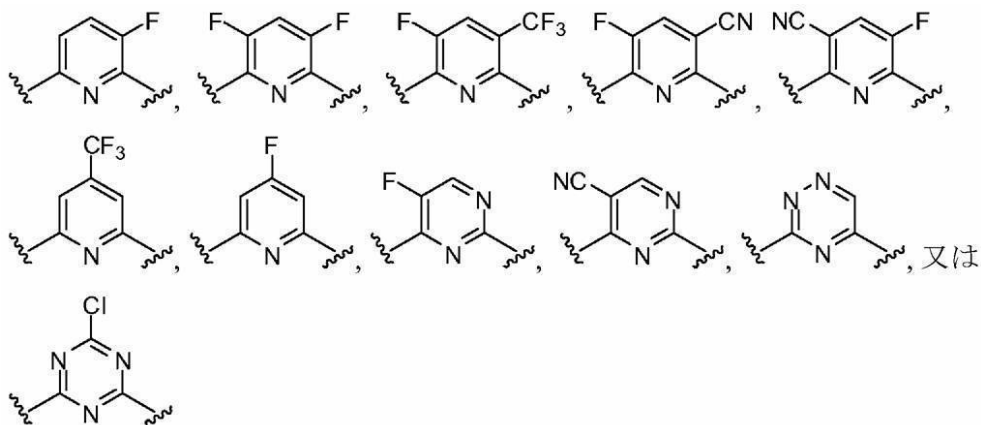


である、項目 1 ~ 1 3 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 1 5)

環 S が、

【化 4】

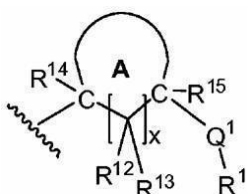


から選択される、項目 1 ~ 1 4 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 1 6)

環 T が、

【化 5】



であり、式中、

環 A は 5 ~ 10 員の炭素環基であって、所望により更に 1 つ以上のインスタンスの J^T で置換される 5 ~ 10 員の炭素環基であり、又は所望により環 A と R^{15} 、環 A と R^{14} 、若しくは環 A と R^{13} は、独立にかつ所望により 5 ~ 10 員の架橋炭素環を形成し、これは所望により更に 1 つ以上のインスタンスの J^T で置換され、

R^{12} 、 R^{13} 、及び R^{14} はそれぞれ独立に、 $-H$ 、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-O(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-CO(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、又は $-CO_2(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ であり、ここにおいて前記の各 $C_1 \sim C_6$ アルキルは所望によりかつ独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、及び $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 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、

各 R^1 ⁵ は独立に、 $-H$ 、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、又は $C_1 \sim C_6$ アルキルであって、所望によりかつ独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、及び $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 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ている $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、並びに

X は 0、1 又は 2 である、項目 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 17)

J^A 、 J^B 、 J^C 、及び J^T はそれぞれ独立に、ハロゲン、シアノ、 R^a 、 $-OR^b$ 、 $-NHR^c$ 、 $-C(O)R^b$ 、 $-C(O)OR^b$ 、 $-OC(O)R^b$ 、 $-NHC(O)R^b$ 、 $-C(O)NHR^c$ 、 $-NHC(O)NHR^c$ 、 $-NHC(O)OR^b$ 、 $-OCONHR^c$ 、 $-N(CH_3)R^c$ 、 $-N(CH_3)C(O)R^b$ 、 $-C(O)N(CH_3)R^c$ 、 $-N(CH_3)C(O)NHR^c$ 、 $-N(CH_3)C(O)OR^b$ 、 $-NH SO_2 R^b$ 、 $-SO_2 NHR^b$ 、 $-SO_2 N(CH_3)R^b$ 、及び $-N(CH_3)SO_2 R^b$ からなる群から選択され、又は

所望により、2 つの J^T 、2 つの J^A 、2 つの J^B 、及び 2 つの J^C がそれぞれ独立に、それらが結合している原子と合わせて、所望によりハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、及び $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 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 4 ~ 10 員環を形成する、項目 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 18)

R^a が独立に、i) $C_1 \sim C_6$ アルキル基であって、所望によりハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $C_3 \sim C_8$ 炭素環基、4 ~ 8 員の複素環基、5 ~ 6 員のヘテロアリール基、及びフェニ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ている $C_1 \sim C_6$ アルキル基、ii) $C_3 \sim C_8$ 炭素環基若しくは 4 ~ 8 員の複素環基であって、これらはそれぞれ独立にかつ所望により、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、及び $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 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ている $C_3 \sim C_8$ 炭素環基若しくは 4 ~ 8 員の複素環基、又は iii) 5 ~ 6 員のヘテロアリール基若しくはフェニル基であって、これらは独立にかつ所望により、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、及び $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 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ている 5 ~ 6 員のヘテロアリール基若しくはフェニル基、であり、

R^b 及び R^c はそれぞれ独立に、 R^a 若しくは $-H$ であり、又は所望により、 R^b 及び R^c は、それらが結合している窒素原子と合わせて、独立に 4 ~ 8 員の複素環基をそれぞれ形成し、これは所望により、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、及び $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 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ている、項目 1 ~ 17 のいずれか一項に記載の化合物。

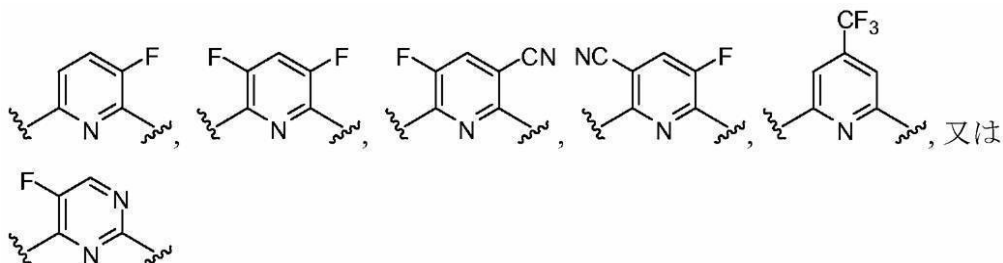
(項目 19)

Q^1 が $-C(O)O-$ 、 $-NRC(O)-$ 、 $-C(O)NR-$ 、 $-NRC(O)NR'$ 、
 -、又は $-(CR^tR^s)_1$ 、 $-Y^1-$ 、及び
 Y^1 が $-C(O)O-$ 、 $-NRC(O)-$ 、 $-C(O)NR-$ 、又は $-NRC(O)NR'$ 、
 R' - である、項目 16 ~ 18 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 20)

環 S が、

【化 6】



から選択される、項目 1 ~ 19 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 21)

R^{12} 、 R^{13} 、及び R^{14} がそれぞれ独立に、 $-H$ 、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、
 $-O(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、又は所望により置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、
 R^{15} が、 $-H$ 又は所望により置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、
 R^t 及び R^s はそれぞれ独立に、 $-H$ 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルである、項目 1 ~ 20 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 22)

R^{12} 及び R^{13} がそれぞれ独立に、 $-H$ 、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、
 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、又は $-O(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ であり、
 R^{14} 及び R^{15} がそれぞれ独立に、 $-H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであり、並びに

R^t 及び R^s はそれぞれ独立に、 $-H$ 又は $C_1 \sim C_6$ アルキルである、項目 1 ~ 21 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 23)

R^1 は独立に、i) $-H$ 、ii) $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基であって、所望によりハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-C(O)(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-OC(O)(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-C(O)O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $C_3 \sim C_8$ 炭素環基、4 ~ 8 員の複素環基、フェニル、及び 5 ~ 6 員のヘテロアリールからなる群から独立に選択される 1 つ以上の置換基で置換されている $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基、iii) $C_3 \sim C_7$ 炭素環基、iv) 4 ~ 7 員の複素環基、v) フェニル基、又は vi) 5 ~ 6 員のヘテロアリール基であり、

所望により R^1 は、 R' 、及びそれらが結合している窒素と合わせて所望により置換されている 4 ~ 8 員の複素環基を形成し、並びに

R^1 で表わされる、及び、 R^1 で表わされる $C_1 \sim C_6$ 脂肪族基の置換基についての、前記炭素環基、フェニル基、複素環基、及びヘテロアリール基のそれぞれと、 R^1 及び R' で形成される前記複素環基は、独立にかつ所望により、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、及び $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ からなる群から独立に選択される 1 つ以上の置換基で置換される、項目 1 ~ 22 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 2 4)

環 A が所望によりかつ独立に、更にハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-\text{OCO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CO}_2(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ ハロアルキル}$ 、及び $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 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ており、又は、環 A と R^{15} 、環 A と R^{14} 、若しくは環 A と R^{13} は独立にかつ所望により架橋炭素環基を形成し、これらはそれぞれ所望によりかつ独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-\text{OCO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CO}_2(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ ハロアルキル}$ 、及び $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 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ている、項目 1 ~ 2 3 のいずれか一項に記載の化合物。

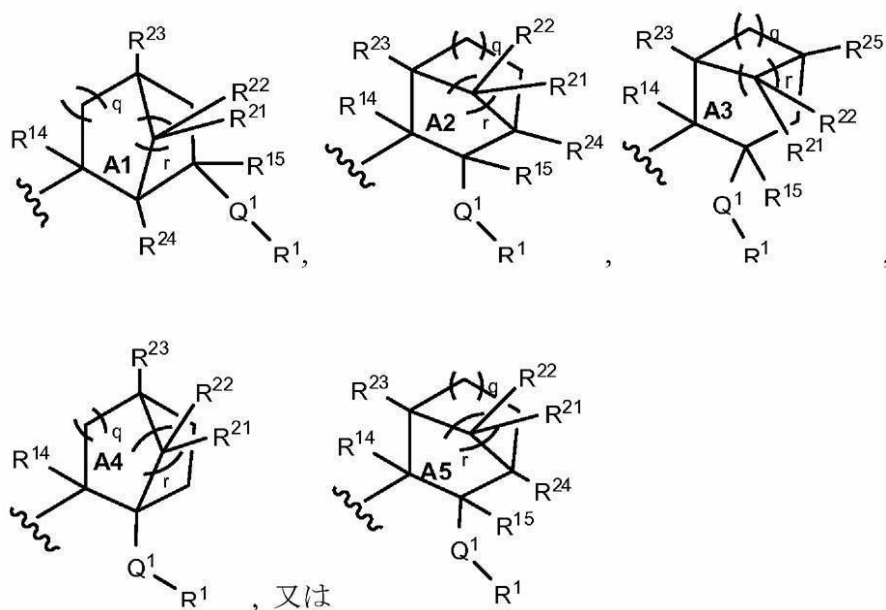
(項目 2 5)

環 A と R^{15} 、環 A と R^{14} 、又は環 A と R^{13} が独立に、所望により置換された、架橋炭素環を形成する、項目 1 ~ 2 4 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 2 6)

環 T が、

【化 7】



であり、式中、

環 A 1 ~ A 5 はそれぞれ独立に、5 ~ 10 員の架橋炭素環であり、これは所望により更に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-\text{OCO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CO}_2(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ ハロアルキル}$ 、及び $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 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、

各 R^{14} は独立に、 $-\text{H}$ 、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル}$ 、 $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})_2$ 、 $-\text{OCO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、又は $-\text{CO}_2(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})$ であり、ここにおいて前記の各 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル}$ は所望によりかつ独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-\text{OCO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CO}_2(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ ハロアルキル}$ 、及び $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{ アルキル})$ 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ている。

ル)、及び - O (C₁ ~ C₄ 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、

各 R^{1 5} は独立に、- H、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、又は C₁ ~ C₆ アルキルであって、所望によりかつ独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、- NH₂、- NH (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (C₁ ~ C₄ アルキル)₂、- OCO (C₁ ~ C₄ アルキル)、- CO (C₁ ~ C₄ アルキル)、- CO₂ H、- CO₂ (C₁ ~ C₄ アルキル)、及び - O (C₁ ~ C₄ 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ている C₁ ~ C₆ アルキルであり、並びに

R^{2 1}、R^{2 2}、R^{2 3}、R^{2 4}、及び R^{2 5} はそれぞれ独立に、- H、ハロゲン、- OH、C₁ ~ C₆ アルコキシ、又は C₁ ~ C₆ アルキルであって、所望によりハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、- NH₂、- NH (C₁ ~ C₄ アルキル)、- N (C₁ ~ C₄ アルキル)₂、- OCO (C₁ ~ C₄ アルキル)、- CO (C₁ ~ C₄ アルキル)、- CO₂ H、- CO₂ (C₁ ~ C₄ アルキル)、C₁ ~ C₄ アルキル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、及び - O (C₁ ~ C₄ アルキル) からなる群から独立に選択される 1 つ以上の置換基で置換された C₁ ~ C₆ アルキルであり、

q は 0、1 又は 2 であり、並びに

r は 1 又は 2 である、項目 1 ~ 2 5 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 2 7)

R^{1 4} 及び各 R^{1 5} がそれぞれ独立に、- H、C₁ ~ C₆ アルキル、又は C₁ ~ C₆ ハロアルキルであり、並びに

R^{2 1}、R^{2 2}、R^{2 3}、R^{2 4}、及び R^{2 5} はそれぞれ独立に、- H、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁ ~ C₆ アルコキシ、C₁ ~ C₆ アルキル、又は C₁ ~ C₆ ハロアルキルである、項目 2 6 に記載の化合物。

(項目 2 8)

Q¹ が独立に、- C (O) O -、- NRC (O) -、- C (O) NR -、- NRC (O) NR' -、又は - (CH₂)_{1, 2} - Y¹ - であり、及び

Y¹ が独立に、- C (O) O -、- NRC (O) -、- C (O) NR -、又は - NRC (O) NR' - である、項目 2 6 又は 2 7 に記載の化合物。

(項目 2 9)

Q¹ が独立に - C (O) O -、- NRC (O) -、又は - C (O) NR - である、項目 2 8 に記載の化合物。

(項目 3 0)

R¹ は独立に、- H 又は所望により置換された C₁ ~ C₆ 脂肪族基であり、並びに

R 及び R' はそれぞれ独立に、- H 若しくは - CH₃ であり、又は

所望により R¹ は、R'、及びそれらが結合している窒素と合わせて所望により置換されている 4 ~ 8 員の複素環基を形成している、項目 2 5 ~ 2 9 のいずれか一項に記載の化合物。

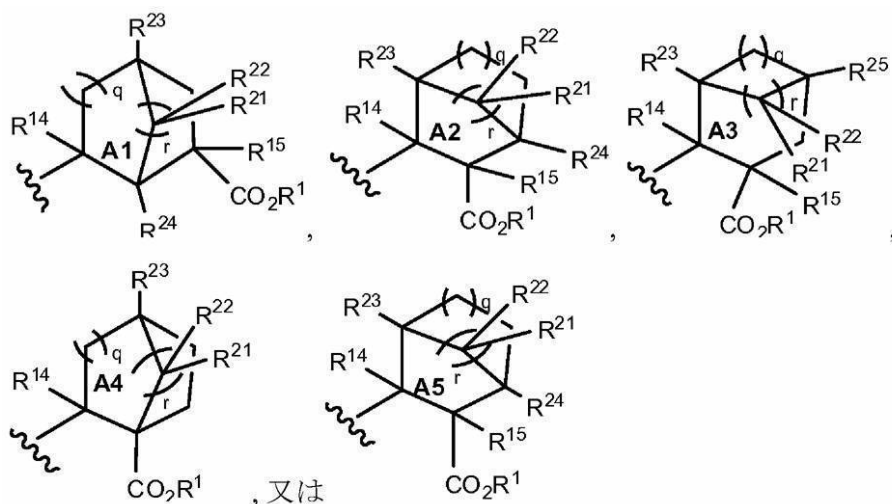
(項目 3 1)

Q¹ が独立に - C (O) O -、- NHC (O) -、又は - C (O) NH - である、項目 2 9 に記載の化合物。

(項目 3 2)

環 T が、

【化 8】



であり、

式中、環 A 1 ~ A 5 はそれぞれ独立にかつ所望により更に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、C₁ ~ C₄ アルキル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、及び - O (C₁ ~ C₄ 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、項目 2 6 ~ 3 1 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 3 3)

R^{1 4} 及び各 R^{1 5} がそれぞれ独立に、- H 又は C₁ ~ C₆ アルキルであり、並びに R^{2 1}、R^{2 2}、R^{2 3}、R^{2 4}、及び R^{2 5} はそれぞれ独立に、- H 又は C₁ ~ C₆ アルキルである、項目 2 6 ~ 3 2 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 3 4)

R¹ が H、又は所望により置換された C₁ ~ C₆ アルキルであり、並びに R^{1 4}、R^{1 5}、R^{2 1}、R^{2 2}、R^{2 3}、R^{2 4}、及び R^{2 5} はそれぞれ独立に - H である、項目 2 6 ~ 3 2 のいずれか一項に記載の化合物。

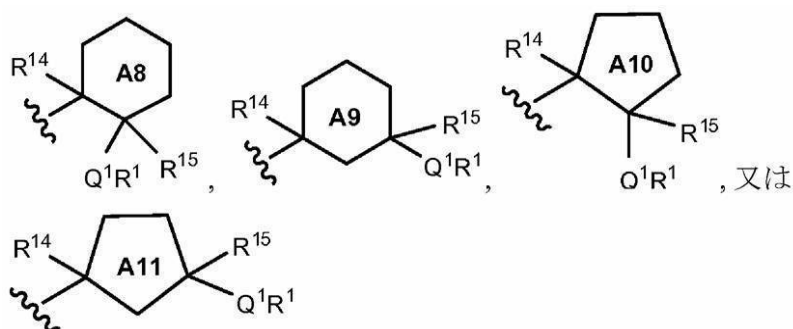
(項目 3 5)

q が 1 である、項目 2 6 ~ 3 4 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 3 6)

環 T が、

【化 9】



から選択され、式中、

R^{1 4} 及び各 R^{1 5} がそれぞれ独立に、- H、C₁ ~ C₆ アルキル、又は C₁ ~ C₆ ハロアルキルであり、並びに

環 A 8 ~ A 1 1 はそれぞれ独立にかつ所望により、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オ

キソ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-O$
 $CO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}$ 、 $C_1 \sim C_4 \text{ ハロアルキル}$ 、及び $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 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ている、項目1
 ~ 25のいずれか一項に記載の化合物。

(項目37)

Q^1 が独立に、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-NRC(O)-$ 、 $-C(O)NR-$ 、
 $-NRC(O)NR'-$ 、又は $-(CH_2)_1, 2-Y-$ 、及び
 Y^1 は独立に、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-NRC(O)-$ 、 $-C(O)NR-$ 、
 又は $-NRC(O)NR'-$ である、項目36に記載の化合物。

(項目38)

$R^{1,4}$ 及び各 $R^{1,5}$ はそれぞれ独立に、 $-H$ 又は $C_1 \sim 6 \text{ アルキル}$ であり、並びに
 各環A8~A11が独立にかつ所望により、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}$ 、 $C_1 \sim C_4 \text{ ハロアルキル}$ 、及び $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 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、項目36又は37に記載の化合物。

(項目39)

R及び R' がそれぞれ独立に $-H$ 又は $-CH_3$ である、項目36~38のいずれか一項
 に記載の化合物。

(項目40)

Q^1 が独立に
 $-NRC(O)-$ 、 $-C(O)NR-$ 、又は $-NRC(O)NR'-$ である、項目36
 ~38のいずれか一項に記載の化合物。

(項目41)

R及び R' がそれぞれ独立に、 $-H$ 若しくは $-CH_3$ であり、並びに
 R^1 は独立に、4~7員の複素環基、フェニル基、若しくは5~6員のヘテロアリール
 基であり、ここにおいて前記複素環基、フェニル基、及びヘテロアリール基は独立にかつ
 所望により、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、オキソ、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $C_1 \sim C_4 \text{ アルキル}$ 、 $C_1 \sim C_4 \text{ ハロアルキル}$ 、及び $-O(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ からなる群から独立に
 選択される1つ以上の置換基で置換され、又は
 所望により R^1 と R' は、それらが結合している窒素原子と合わせて所望により置換さ
 れている4~8員の複素環基を形成する、項目40に記載の化合物。

(項目42)

pが1又は2であり、並びにkが1又は2である、項目1~18及び36のいずれか一
 項に記載の化合物。

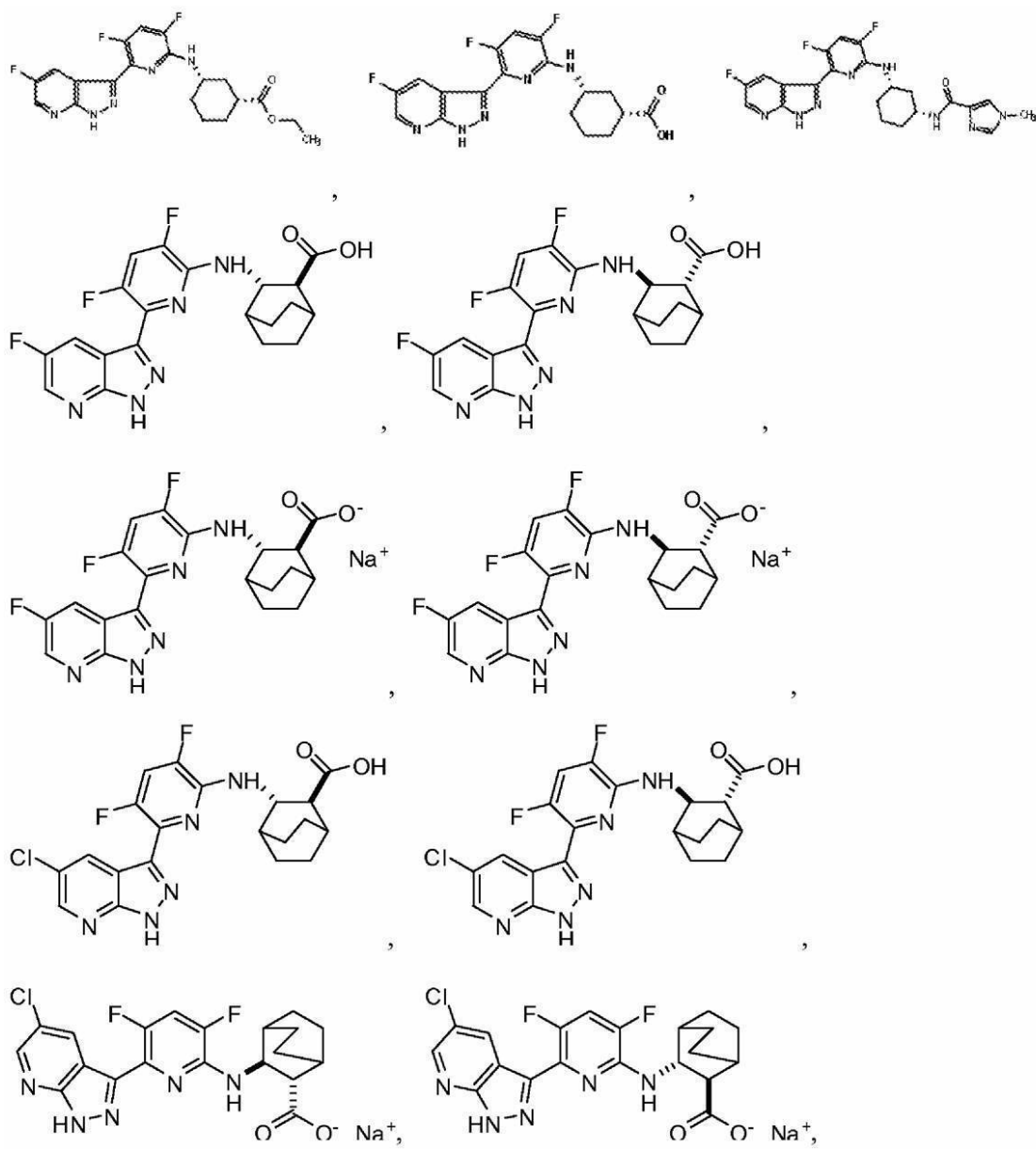
(項目43)

Xが $-F$ 又は $-Cl$ である、項目1~42のいずれか一項に記載の化合物。

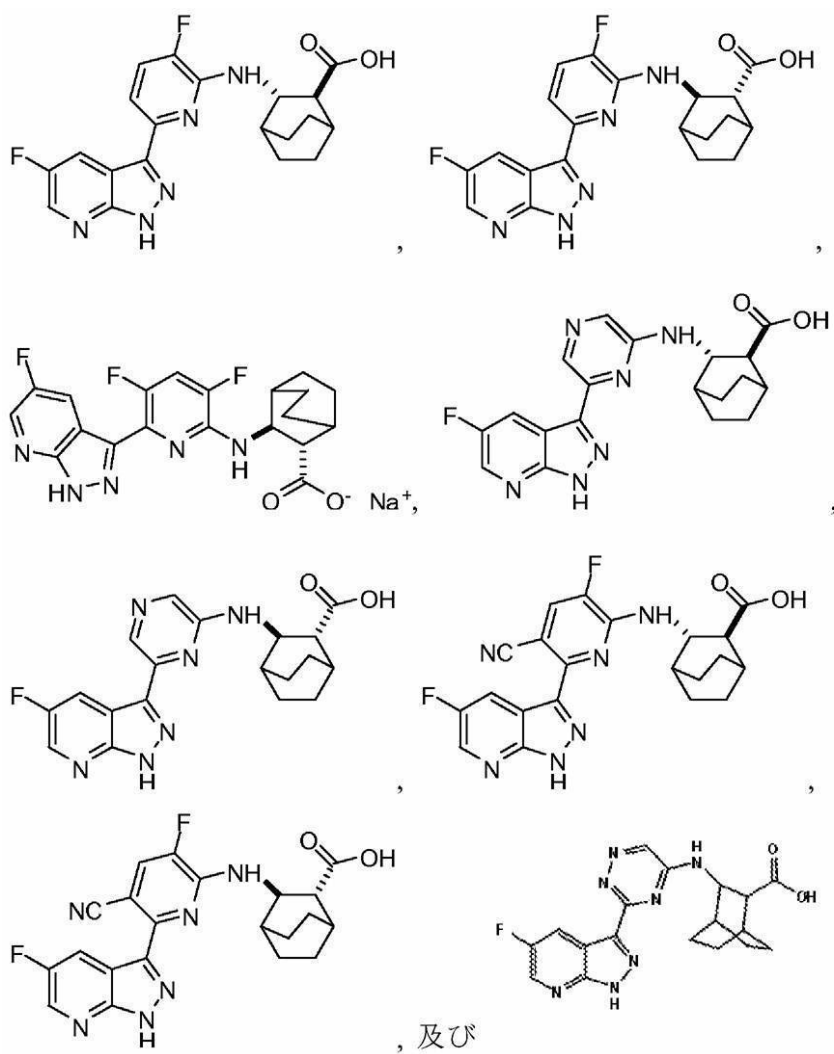
(項目44)

下記に示される構造、

【化 10】

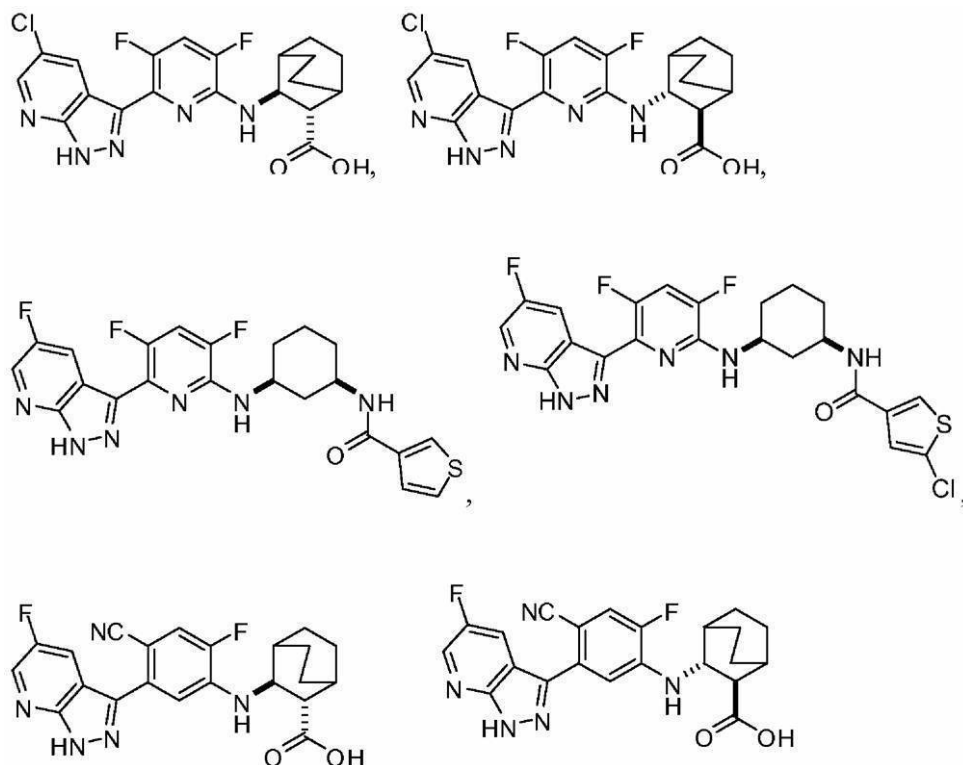


【化 1 1】



のうちの任意の 1 つから選択される化合物、又はその製薬上許容される塩。
 (項目 4 5)
 下記に示される構造、

【化 1 2】



,及び

のうち任意の 1 つから選択される化合物、又はその製薬上許容される塩。

(項目 4 6)

項目 1 ~ 4 5 のいずれか一項に記載の化合物と、製薬上許容される担体、補助剤、又は賦形剤とを含む、医薬組成物。

(項目 4 7)

項目 1 ~ 4 5 のいずれか一項に記載の化合物の有効量を、生物学的サンプル又は患者に投与する工程を含む、該生物学的サンプル又は該患者におけるインフルエンザウイルスの複製を阻害する方法。

(項目 4 8)

追加治療薬を併用投与する工程を更に含む、項目 4 7 に記載の方法。

(項目 4 9)

前記追加治療薬が、抗ウイルス剤若しくはインフルエンザワクチンから選択される、又はその両方である、項目 4 8 に記載の方法。

(項目 5 0)

項目 1 ~ 4 5 のいずれか一項に記載の化合物の有効量を、生物学的サンプル又は患者に投与する工程を含む、該生物学的サンプル又は該患者におけるインフルエンザウイルスの量を低減する方法。

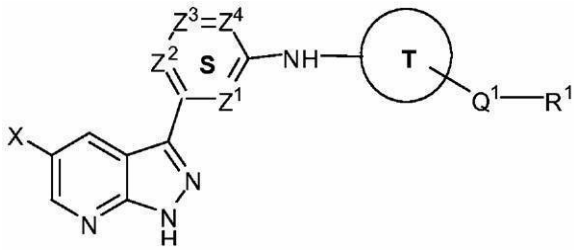
(項目 5 1)

項目 1 ~ 4 5 のいずれか一項に記載の化合物の有効量を、患者に投与する工程を含む、該患者におけるインフルエンザの治療方法。

(項目 5 2)

構造式 (I) :

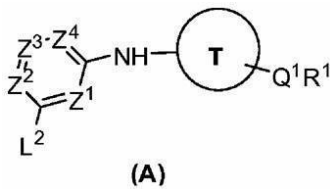
【化 1 3】



で表わされる化合物又はその製薬上許容される塩の調製方法であって、該方法が、

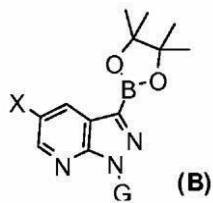
i) 化合物 A :

【化 1 4】



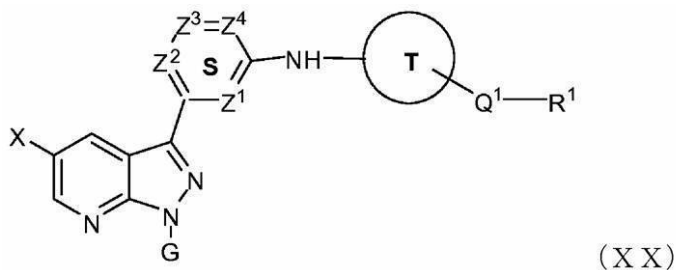
を化合物 (B) :

【化 1 5】



と反応させて、構造式 (XX) :

【化 1 6】



で表わされる化合物を形成する工程と、

i i) 好適な条件下で構造式 (XX) の化合物の G 基を脱保護して、構造式 (I) の化合物を形成する工程と、を含み、ここにおいて、

構造式 (I) 及び (XX)、並びに化合物 (A) 及び (B) の可変部分は独立に、項目 1 ~ 45 のいずれか一項で定義されている通りであり、並びに

L² はハロゲンであり、並びに

G はトリチルである、方法。

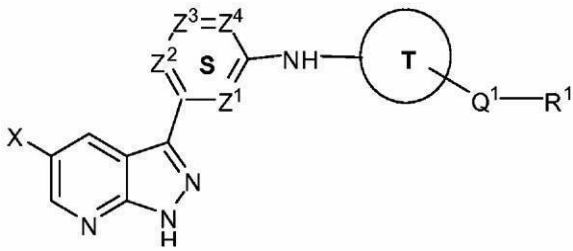
(項目 53)

L^2 が Br または Cl である、項目 52 に記載の方法。

(項目 54)

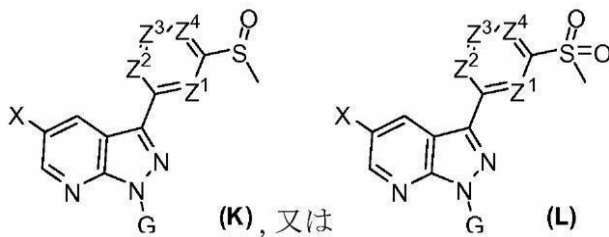
構造式 (I) :

【化 17】



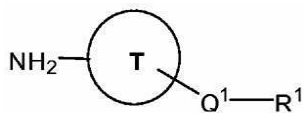
で表わされる化合物又はその製薬上許容される塩の調製方法であって、該方法が、
i) 化合物 (K) 又は (L) :

【化 18】



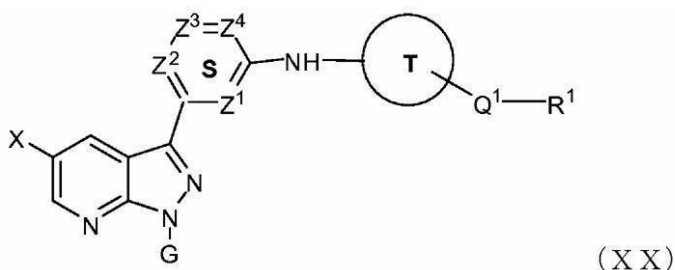
を、化合物 (D) :

【化 19】



と反応させて、構造式 (XX) :

【化 20】



で表わされる化合物を形成する工程と、

ii) 好適な条件下で構造式 (XX) の化合物の G 基を脱保護して、構造式 (I) の化合物を形成する工程と、を含み、ここにおいて、

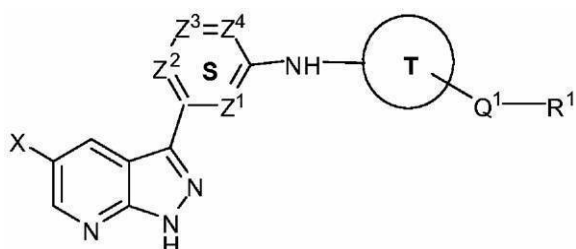
構造式 (I) 及び (XX)、並びに化合物 (K)、(L)、及び (D) の可変部分は独立に、項目 1 ~ 45 のいずれか一項で定義されている通りであり、並びに

G はトリチルである、方法。

(項目 5 5)

構造式 (I) :

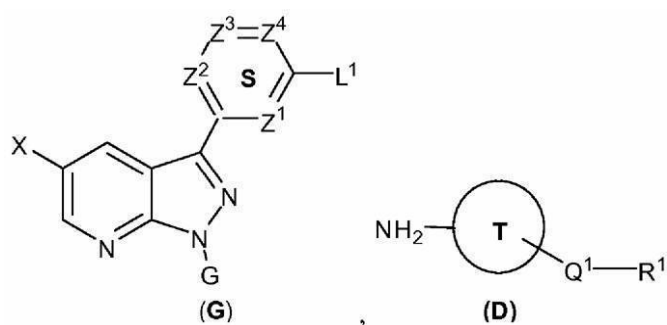
【化 2 1】



で表わされる化合物又はその製薬上許容される塩の調製方法であって、該方法が、

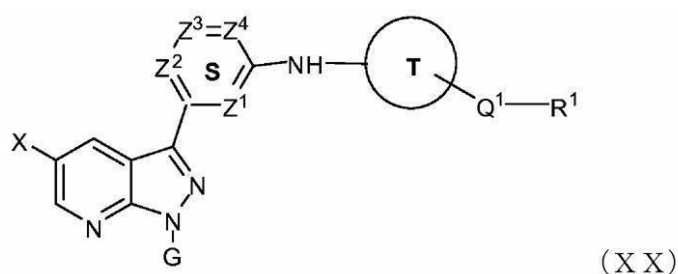
i) 化合物 (G) を化合物 (D) :

【化 2 2】



と好適な条件下で反応させて、構造式 (X X) :

【化 2 3】



で表わされる化合物を形成する工程と、

i i) 好適な条件下で構造式 (X X) の化合物の G 基を脱保護して、構造式 (I) の化合物を形成する工程と、を含み、ここにおいて、

構造式 (I) 及び (X X)、並びに化合物 (G) 及び (D) の可変部分はそれぞれ独立に、項目 1 ~ 4 5 のいずれか一項で定義されている通りであり、並びに

L¹ はハロゲンであり、並びに

G はトリチルである、方法。

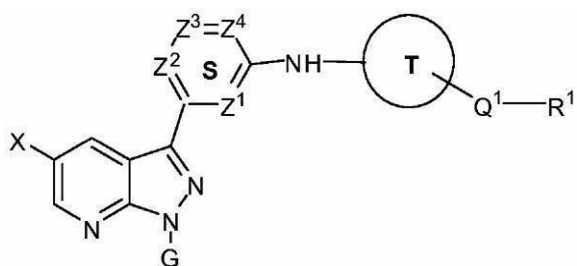
(項目 5 6)

L¹ が Br 又は Cl である、項目 5 5 に記載の方法。

(項目 5 7)

構造式 (X X) :

【化 2 4】



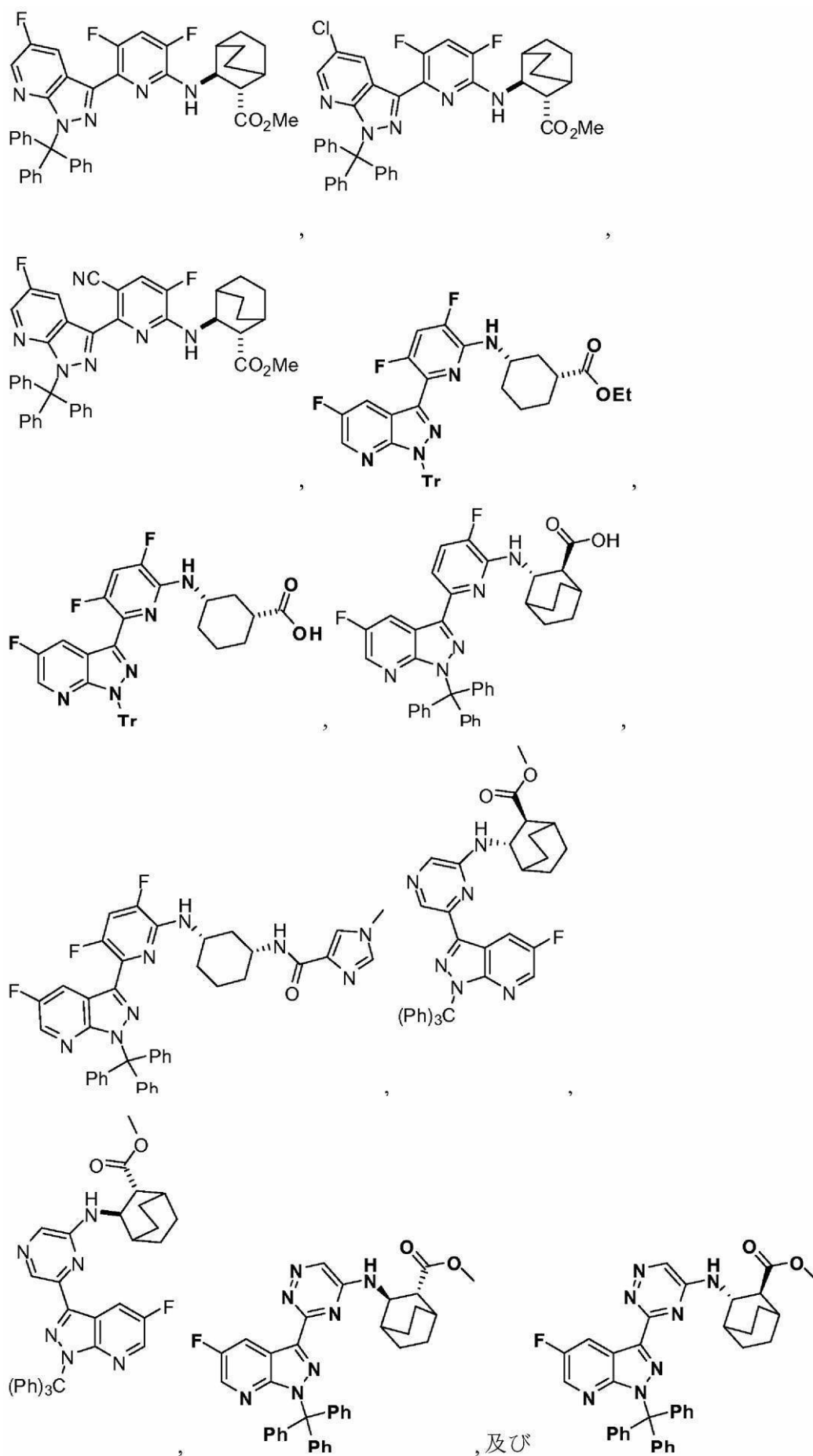
で表わされる化合物であって、構造式 (X X) の可変部分はそれぞれ独立に項目 1 ~ 4
5 のいずれか一項で定義されている通りであり、及び

G はトリチルである、方法。

(項目 5 8)

下記の構造式、

【化 25】

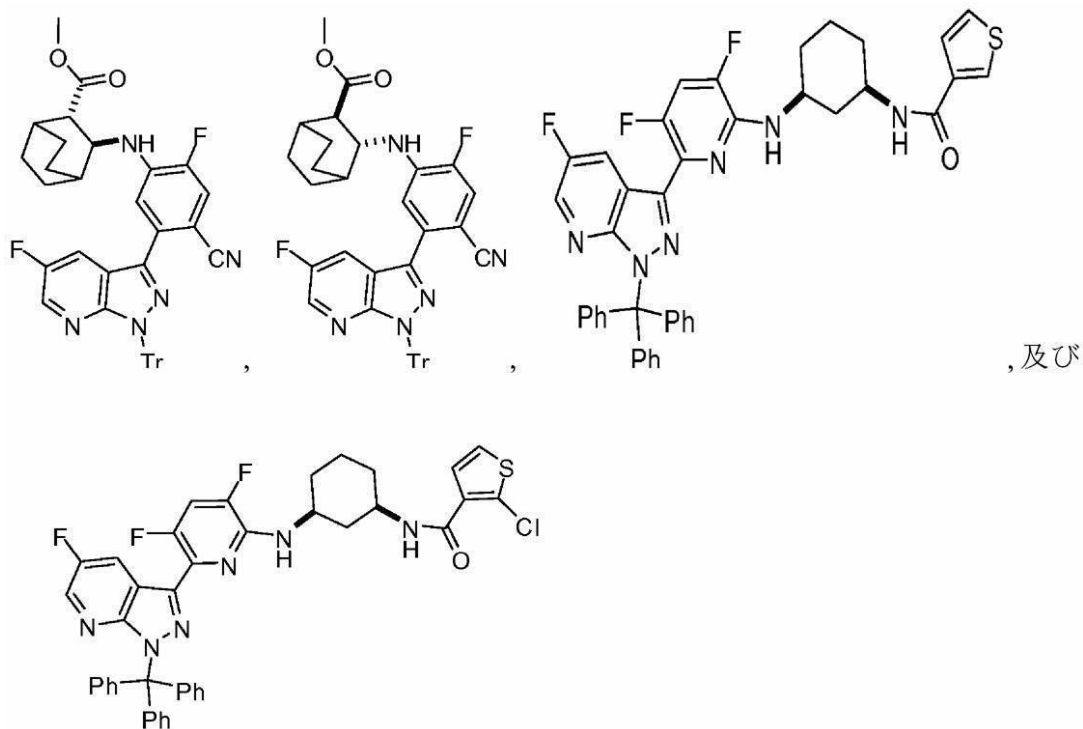


のうち任意の 1 つで表わされる化合物、又はその製薬上許容される塩であって、式中、
T r はトリチルである、項目 5 7 に記載の化合物。

(項目 5 9)

下記の構造式、

【化 2 6 】



のうち任意の 1 つで表わされる化合物、又はその製薬上許容される塩であって、式中、
T r はトリチルである、項目 5 7 に記載の化合物。