

【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4年8月1日(2022.8.1)

【国際公開番号】WO2020/023710

【公表番号】特表2021-531320(P2021-531320A)

【公表日】令和3年11月18日(2021.11.18)

【出願番号】特願2021-504466(P2021-504466)

【国際特許分類】

C 0 7 D 209/52(2006.01)

10

A 6 1 P 1/16(2006.01)

A 6 1 P 43/00(2006.01)

A 6 1 K 45/00(2006.01)

A 6 1 P 31/20(2006.01)

A 6 1 P 31/14(2006.01)

C 0 7 D 403/12(2006.01)

C 0 7 D 401/12(2006.01)

C 0 7 D 413/12(2006.01)

C 0 7 D 209/44(2006.01)

C 0 7 D 487/04(2006.01)

20

A 6 1 K 31/403(2006.01)

A 6 1 K 31/4196(2006.01)

A 6 1 K 31/4439(2006.01)

A 6 1 K 31/4155(2006.01)

A 6 1 K 31/4192(2006.01)

A 6 1 K 31/422(2006.01)

C 0 7 D 405/14(2006.01)

C 0 7 D 401/14(2006.01)

A 6 1 K 31/4035(2006.01)

【F I】

30

C 0 7 D 209/52 C S P

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 31/20

A 6 1 P 31/14

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 209/44

C 0 7 D 487/04 1 3 7

A 6 1 K 31/403

A 6 1 K 31/4196

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/4155

A 6 1 K 31/4192

A 6 1 K 31/422

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 401/14

A 6 1 K 31/4035

50

【手続補正書】

【提出日】令和4年7月22日(2022.7.22)

【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

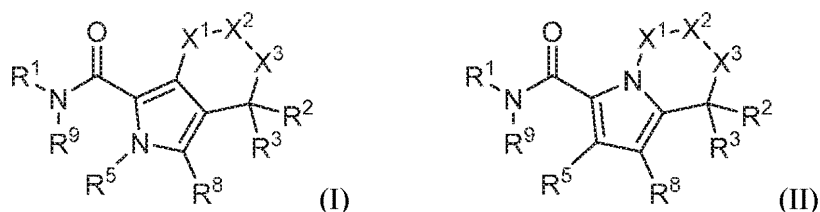
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

10

式(I)もしくは(II)の化合物、またはその塩、溶媒和物、プロドラッグ、立体異性体、互変異性体、もしくは同位体標識誘導体、あるいはそれらの任意の混合物:



式(I)または(II)中、独立して、

20

-X<sup>1</sup>-X<sup>2</sup>-は-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-\*、-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)-\*、-CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-\*、-CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>-\*、-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-\*、-CH(CH<sub>3</sub>)CH(CH<sub>3</sub>)-\*、-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)-\*、および-CH(CH<sub>3</sub>)C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-\*からなる群より選択され、ここで「\*」と示される単結合はX<sup>3</sup>との間で形成され;

-X<sup>3</sup>-は結合、-CH<sub>2</sub>-、-CH(CH<sub>3</sub>)-、-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、\*-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)-、\*-CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-、\*-CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>-、\*-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH(CH<sub>3</sub>)CH(CH<sub>3</sub>)-、\*-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)-\*、および\*-CH(CH<sub>3</sub>)C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-からなる群より選択され、ここで「\*」と示される単結合はX<sup>1</sup>-X<sup>2</sup>-との間で形成され;

R<sup>1</sup>は置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよいベンジル、置換されていてもよいヘテロアリール、および-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>(置換されていてもよいヘテロアリール)からなる群より選択され;

30

R<sup>2</sup>はH、-OH、-OR<sup>6</sup>、-NH<sub>2</sub>、-NHR<sup>6</sup>、-NR<sup>6</sup>R<sup>6a</sup>、-OC(=O)OR<sup>6</sup>、-OC(=O)N(R<sup>4</sup>)R<sup>6</sup>、-N(R<sup>3</sup>)C(=O)OR<sup>6</sup>、-NR<sup>7</sup>C(=O)N(R<sup>6</sup>)(R<sup>7</sup>)、-N(R<sup>4</sup>)C(=O)R<sup>6</sup>、および-NR<sup>4</sup>S(=O)<sub>1-2</sub>R<sup>6</sup>からなる群より選択され;

R<sup>3</sup>はHまたはC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルであり;

あるいは、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は一緒になって=Oを形成し;

各R<sup>4</sup>は、独立して、HおよびC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルからなる群より選択され;

R<sup>5</sup>はHおよびC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルからなる群より選択され;

各R<sup>6</sup>は、独立して、置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、置換されていてもよいC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、置換されていてもよいフェニル、および置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択され;

40

各R<sup>6a</sup>は、独立して、H、置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、置換されていてもよいC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、置換されていてもよいフェニル、および置換されていてもよいヘテロアリールからなる群より選択され;

各R<sup>7</sup>は、独立して、Hおよび置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルからなる群より選択され;

あるいは、R<sup>6</sup>およびR<sup>7</sup>が同じN原子に結合している場合、R<sup>6</sup>およびR<sup>7</sup>は、両者が結合しているN原子と一緒に、置換されていてもよい3~7員複素環を形成してもよく;

50

R<sup>8</sup>はH、ハロ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、および置換されていてもよいフェニルからなる群より選択され;

R<sup>9</sup>はHおよびC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルからなる群より選択される。

【請求項2】

各R<sup>6</sup>およびR<sup>6a</sup>が、独立して、-(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~3-(置換されていてもよいヘテロアリール)、-(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~3-(置換されていてもよいヘテロシクリル)、および-(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~3-(置換されていてもよいアリール)からなる群より選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

以下の少なくとも1つが適用される、請求項1記載の化合物:

(a) 置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいヘテロシクリル、または置換されていてもよいシクロアルキルがそれぞれの場合、独立して、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、ハロ、シアノ、-OR<sup>a</sup>、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいヘテロシクリル、-N(R<sup>a</sup>)C(=O)R<sup>a</sup>、-C(=O)OH、-C(=O)OR<sup>a</sup>、-C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>a</sup>、および-N(R<sup>a</sup>)(R<sup>a</sup>)からなる群より選択される少なくとも1個の置換基

で置換されていてもよく、ここでR<sup>a</sup>がそれぞれの場合、独立して、H、置換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、置換されていてもよいC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、置換されていてもよいアリール、もしくは置換されていてもよいヘテロアリールであるか、または、2個のR<sup>a</sup>基が、それらが結合しているNと一緒にって複素環を形成する;および

(b) 置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールがそれぞれの場合、独立して、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、ヘテロシクリル、ハロ、-CN、-OR<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)(R<sup>b</sup>)、-NO<sub>2</sub>、-S(=O)<sub>2</sub>N(R<sup>b</sup>)(R<sup>b</sup>)、アシル、およびC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシカルボニルからなる群より選択される少なくとも1個の置換基で置換されていてもよく、ここでR<sup>b</sup>がそれぞれの場合、独立して、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、またはC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキルである。

【請求項4】

以下の少なくとも1つが適用される、請求項1記載の化合物:

(a) R<sup>1</sup>が、置換されていてもよいフェニル、置換されていてもよいベンジル、および-(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~3-(置換されていてもよいヘテロアリール)からなる群より選択され、ここで該フェニル、ベンジル、またはヘテロアリールがC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、ハロ、C<sub>1</sub>~C<sub>3</sub>ハロアルキル、および-CNからなる群より選択される少なくとも1つで置換されていてもよい;および

(b) R<sup>1</sup>がフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、3,4-ジフルオロフェニル、3,5-ジフルオロフェニル、2,4,5-トリフルオロフェニル、3,4,5-トリフルオロフェニル、3,4-ジクロロフェニル、3-クロロ-4-フルオロフェニル、4-クロロ-3-フルオロフェニル、4-クロロ-3-メチルフェニル、3-クロロ-4-メチルフェニル、4-フルオロ-3-メチルフェニル、3-フルオロ-4-メチルフェニル、4-クロロ-3-メトキシフェニル、3-クロロ-4-メトキシフェニル、4-フルオロ-3-メトキシフェニル、3-フルオロ-4-メトキシフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチル-4-フルオロフェニル、4-トリフルオロメチル-3-フルオロフェニル、ベンゾ[d][1,3]ジオキサソール-5-イル、2,3-ジヒドロベンゾ[b][1,4]ジオキシン-6-イル、ベンジル、3-フルオロベンジル、4-フルオロベンジル、3-クロロベンジル、4-クロロベンジル、2-ピリジル、4-メチル-2-ピリジル、5-メチル-2-ピリジル、6-メチル-2-ピリジル、3-ピリジル、2-メチル-3-ピリジル、3-メチル-3-ピリジル、4-ピリジル、2-メチル-4-ピリジル、2-クロロ-4-ピリジル、2-フルオロ-4-ピリジル、2-フルオロメチル-4-ピリジル、2-ジフルオロメチル-4-ピリジル、2-トリフルオロメチル-4-ピリジル、および6-メチル-4-ピリジルからなる群より選択される。

## 【請求項5】

R<sup>2</sup>が-NHS(=O)<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル); -NHS(=O)<sub>2</sub>(C<sub>3</sub>~C<sub>6</sub>シクロアルキル); -NHC(=O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル); -NHC(=O)(C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル); -NHC(=O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル); -NHC(=O)O(C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル); -NHC(=O)O(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル); -NHC(=O)O(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(ピリジニル); -NHC(=O)O(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(ピラジニル); -NHC(=O)O(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(ピリミジニル); -NHC(=O)O(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(イソオキサゾリル); -NHC(=O)O(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(オキサゾリル); -NHC(=O)O(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(オキサジアゾリル); -NHC(=O)O(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(トリアゾリル); -NHC(=O)O(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(チアゾリル); -NHC(=O)O(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(イミダゾリル); -NHC(=O)O(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(ピラゾリル); -NHC(=O)NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル); -NHC(=O)NH(C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル); -NHC(=O)NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル); -NHC(=O)NH(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(ピリジニル); -NHC(=O)NH(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(ピラジニル); -NHC(=O)NH(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(ピリミジニル); -NHC(=O)NH(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(イソオキサゾリル); -NHC(=O)NH(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(オキサゾリル); -NHC(=O)NH(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(オキサジアゾリル); -NHC(=O)NH(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(トリアゾリル); -NHC(=O)NH(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(チアゾリル); -NHC(=O)NH(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(イミダゾリル); および-NHC(=O)NH(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>~<sub>3</sub>(ピラゾリル)からなる群より選択される、請求項1記載の化合物。

10

## 【請求項6】

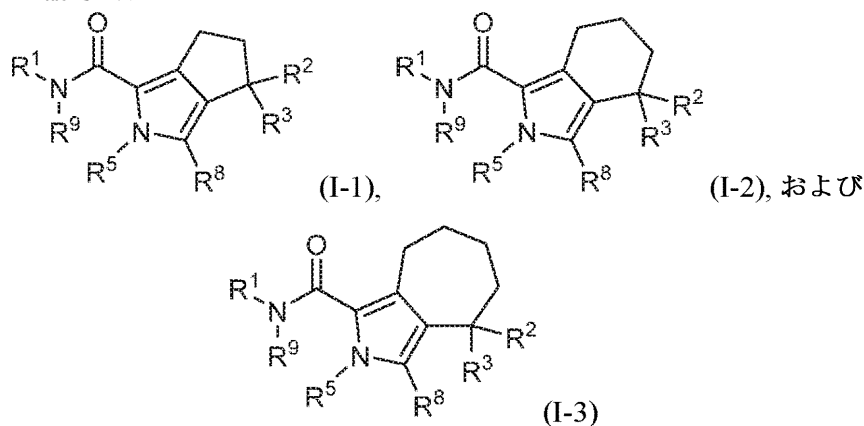
R<sup>3</sup>がHまたはCH<sub>3</sub>である、請求項1記載の化合物。

## 【請求項7】

各R<sup>4</sup>が、独立して、Hおよびメチルからなる群より選択される、請求項1記載の化合物。

20

## 【請求項8】



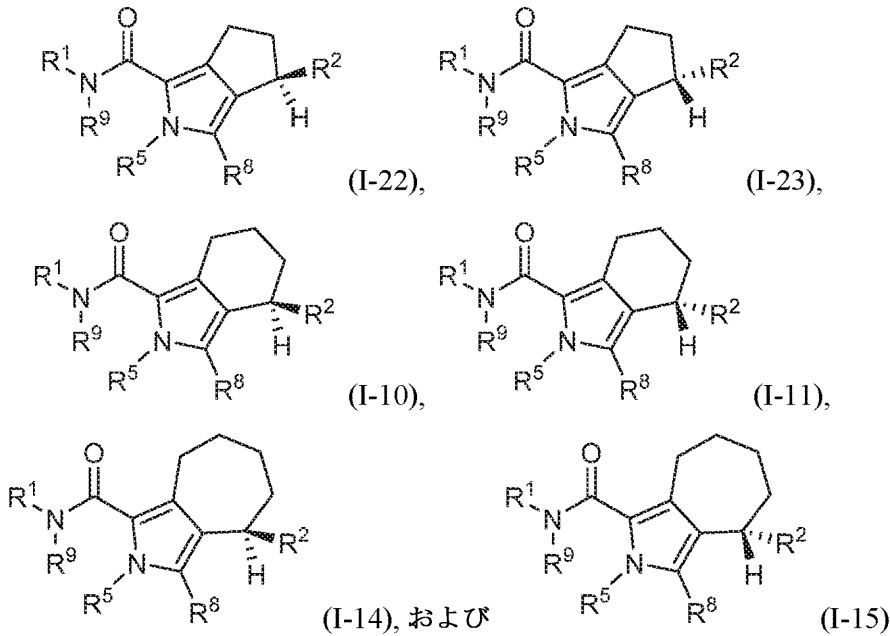
30

からなる群より選択される、請求項1記載の化合物。

## 【請求項9】

40

50



10

20

30

40

50

からなる群より選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項10】

メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

ピリジン-2-イルメチル (1-((3,4-ジフルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

N-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-2-メチル-4-(3-メチルウレイド)-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-1-カルボキサミド;

N-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-4-(3-メチルウレイド)-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-1-カルボキサミド;

メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

N-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-4-(シクロプロパンスルホンアミド)-2-エチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-1-カルボキサミド;

N-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-4-(シクロプロパンスルホンアミド)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-1-カルボキサミド;

N-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-4-(シクロプロパンカルボキサミド)-2-エチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-1-カルボキサミド;

(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-エチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

N-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-4-(シクロプロパンカルボキサミド)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-1-カルボキサミド;

(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-エチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

- メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-イソインドール-4-イル)カルバメート;
- N-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-4-(シクロプロパンスルホンアミド)-2-メチル-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-イソインドール-1-カルボキサミド;
- (1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-イソインドール-4-イル)カルバメート;
- (1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-イソインドール-4-イル)カルバメート;
- オキサゾール-2-イルメチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート; 10
- オキサゾール-5-イルメチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;
- メチル (5-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2,3-ジヒドロ-1H-ピロリジン-1-イル)カルバメート;
- (1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (5-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2,3-ジヒドロ-1H-ピロリジン-1-イル)カルバメート;
- ピリジン-2-イルメチル (5-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2,3-ジヒドロ-1H-ピロリジン-1-イル)カルバメート;
- N-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-2-メチル-4-オキソ-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-1-カルボキサミド; 20
- N-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-2-メチル-4-オキソ-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-イソインドール-1-カルボキサミド;
- イソプロピル 1-((((1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバモイル)オキシ)メチル)-3,3-ジフルオロシクロブタン-1-カルボキシレート;
- (1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (3-ブromo-1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;
- 2-シアノエチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート; 30
- (1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (3-クロロ-1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;
- 1-((((1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバモイル)オキシ)メチル)-3,3-ジフルオロシクロブタン-1-カルボン酸;
- (1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート; 40
- (1-カルバモイル-3,3-ジフルオロシクロブチル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;
- (1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;
- (1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2,3-ジメチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;
- (1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((4-フルオロ-3-メチルフェ 50

ニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-2-イル)-1H-ピラゾール-3-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((3,4-ジフルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

10

(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((3-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((3-シアノ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((2-クロロピリジン-4-イル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

20

(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((3-(トリフルオロメチル)-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((3-(ジフルオロメチル)-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (2-メチル-1-((3,4,5-トリフルオロフェニル)カルバモイル)-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

N-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-2-メチル-4-オキソ-2,4,5,6,7,8-ヘキサヒドロシクロヘプタ[c]ピロール-1-カルボキサミド;

30

(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (2-メチル-1-((2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル)カルバモイル)-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

4-アミノ-N-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-2-メチル-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-イソインドール-1-カルボキサミド;

N-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-4-(シクロプロパンカルボキサミド)-2-メチル-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-イソインドール-1-カルボキサミド;

メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6,7,8-ヘキサヒドロシクロヘプタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

40

4-アミノ-N-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-2-メチル-2,4,5,6,7,8-ヘキサヒドロシクロヘプタ[c]ピロール-1-カルボキサミド;

(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((2-(ジフルオロメチル)ピリジン-4-イル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

N-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-2-メチル-4-(3-((1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル)ウレイド)-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-イソインドール-1-カルボキサミド;

(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6,7,8-ヘキサヒドロシクロヘプタ[c]ピロール-4-

50

イル)カルバメート;

(1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-イソインドール-4-イル)カルバメート;

(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-3-シクロプロピル-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2,3-ジメチル-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-イソインドール-4-イル)カルバメート;

(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (3-クロロ-1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-イソインドール-4-イル)カルバメート;

10

(1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-3-シクロプロピル-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-3-シクロブチル-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

4-アミノ-N-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-1-カルボキサミド;

20

プロパ-2-イン-1-イル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (3-クロロ-1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル (3-クロロ-1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(2-メチル-2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-3-フェニル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

30

ブタ-2-イン-1-イル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

ペンタ-2-イン-1-イル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

3-シクロプロピルプロパ-2-イン-1-イル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(1-メチル-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

40

((S)-5-オキソピロリジン-2-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

((R)-5-オキソピロリジン-2-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-3-(トリフルオロメチル)-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

50

(1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (3-プロモ-1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-3-(トリフルオロメチル)-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(2-メチル-2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2,3-ジメチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-3-(トリフルオロメチル)-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル (3-クロロ-1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-イソインドール-4-イル)カルバメート;

(2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル (3-クロロ-1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-4,5,6,7-テトラヒドロ-2H-イソインドール-4-イル)カルバメート;

(5-メチル-2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(5-エチル-2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(5-シクロプロピル-2H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート;

(1H-テトラゾール-5-イル)メチル (1-((3-クロロ-4-フルオロフェニル)カルバモイル)-2-メチル-2,4,5,6-テトラヒドロシクロペンタ[c]ピロール-4-イル)カルバメート  
 からなる群より選択される少なくとも1つ、またはその塩、溶媒和物、プロドラッグ、同位体標識誘導体、立体異性体、もしくは互変異性体、あるいはそれらの任意の混合物である、請求項1記載の化合物。

【請求項11】

立体配置がC(R<sup>2</sup>)(R<sup>3</sup>)中心において(R)または(S)である、請求項1記載の化合物。

【請求項12】

請求項1記載の少なくとも1つの化合物と薬学的に許容される担体とを含み、任意で肝炎感染症を処置するために有用な少なくとも1つのさらなる剤をさらに含む、薬学的組成物。

【請求項13】

少なくとも1つのさらなる剤が逆転写酵素阻害剤、カプシド阻害剤、cccDNA形成阻害剤、RNA不安定化剤、HBVゲノムを標的とするオリゴマーヌクレオチド、免疫賦活剤、

10

20

30

40

50

およびHBV遺伝子転写物を標的とするGalNAc-siRNAコンジュゲートからなる群より選択される少なくとも1つを含む、請求項12記載の薬学的組成物。

【請求項14】

治療有効量の請求項1記載の少なくとも1つの化合物を含む、対象においてB型肝炎ウイルス(HBV)感染症を処置または予防するための薬学的組成物であって、任意で該対象がD型肝炎ウイルス(HDV)感染症にさらに罹患しているか、またはD型肝炎ウイルス(HDV)感染症を発症しうる、薬学的組成物。

【請求項15】

HBVおよび/またはHDV感染症を処置するために有用な少なくとも1つのさらなる剤と組み合わせて対象に投与され、任意で該少なくとも1つのさらなる剤が逆転写酵素阻害剤、カプシド阻害剤、cccDNA形成阻害剤、RNA不安定化剤、HBVゲノムを標的とするオリゴヌクレオチド、免疫賦活剤、およびHBV遺伝子転写物を標的とするGalNAc-siRNAコンジュゲートからなる群より選択される少なくとも1つを含む、請求項14記載の薬学的組成物。

10

【請求項16】

前記少なくとも1つのさらなる剤と同時に対象に投与され、任意で前記少なくとも1つのさらなる剤をさらに含む、請求項15記載の薬学的組成物。

【請求項17】

治療有効量の請求項1記載の少なくとも1つの化合物を含む、B型肝炎ウイルス(HBV)感染対象においてウイルスカプシドタンパク質の発現および/または機能を直接的または間接的に阻害するための薬学的組成物であって、任意で該対象がD型肝炎ウイルス(HDV)感染症にさらに罹患しているか、またはD型肝炎ウイルス(HDV)感染症を発症しうる、薬学的組成物。

20

【請求項18】

HBVおよび/またはHDV感染症を処置するために有用な少なくとも1つのさらなる剤と組み合わせて対象に投与され、任意で該少なくとも1つのさらなる剤が逆転写酵素阻害剤、カプシド阻害剤、cccDNA形成阻害剤、RNA不安定化剤、HBVゲノムを標的とするオリゴヌクレオチド、免疫賦活剤、およびHBV遺伝子転写物を標的とするGalNAc-siRNAコンジュゲートからなる群より選択される少なくとも1つを含む、請求項17記載の薬学的組成物。

30

【請求項19】

前記少なくとも1つのさらなる剤と同時に対象に投与され、任意で前記少なくとも1つのさらなる剤をさらに含む、請求項18記載の薬学的組成物。

【請求項20】

対象が哺乳動物であり、任意で該哺乳動物がヒトである、請求項14または17記載の薬学的組成物。

40

50