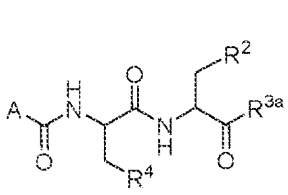
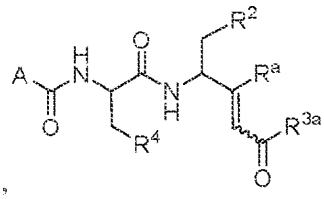
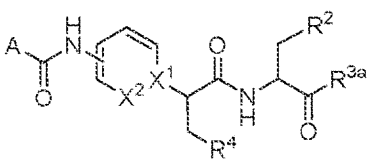
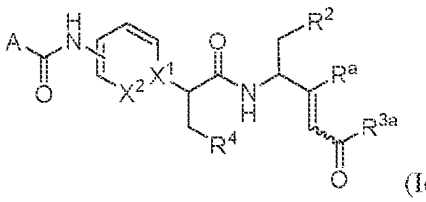
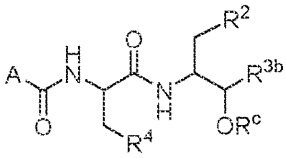
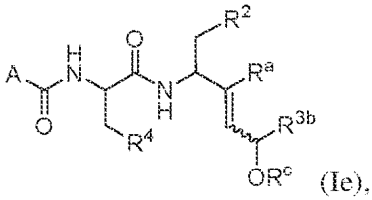
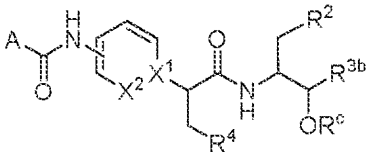
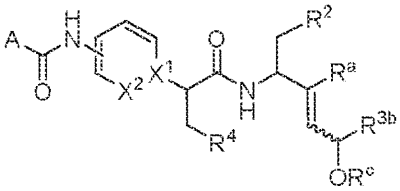
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和6年2月14日(2024.2.14)

【国際公開番号】WO2021/216195
【公表番号】特表2023-522990(P2023-522990A)
【公表日】令和5年6月1日(2023.6.1)
【年通号数】公開公報(特許)2023-101
【出願番号】特願2022-564281(P2022-564281)
【国際特許分類】
C07D493/04(2006.01)
A61P 31/14(2006.01)
A61P 11/00(2006.01)
A61K 31/428(2006.01)
C07F 9/09(2006.01)
【FI】
C07D493/04 101C
A61P 31/14
A61P 11/00
A61K 31/428
C07F 9/09 UCSP

【手続補正書】
【提出日】令和6年2月2日(2024.2.2)
【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)、(Ia)、(Ib)、(Ic)、(Id)、(Ie)、(If)、もしくは(Ig)：


(I),

(Ia),

(Ib),

(Ic),

(Id),

(Ie),

(If), もしくは

(Ig)

の化合物であって、

式中、

Aは、-N(R^a)-アルキル、-O-アルキル、ヘテロシクリル、-O-ヘテロシクリル、-O-アルキレン-ヘテロシクリル、-N(R^a)-アルキレン-ヘテロシクリル、-N(R^a)-アリール、-アルキレン-N(R^a)-C(O)-ヘテロシクリル、-アルキレン-N(R^a)-C(O)-O-ヘテロシクリル、もしくは-アルキレン-N(R^a)-C(O)-アルキレン-O-ヘテロシクリルであり；これらのそれぞれは、ハロ、アルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、およびアミノアルキルを含む任意の好適な置換基で置換されていてもよく；

R^2はヘテロシクロもしくはシクロアルキルであり；

R^{3a}は、H、アルキル、アルコキシ、アシル(例えば、C(O)CF_2Hを含むフルオロアルキルアシルなどのハロアルキルアシル)、-N(R^b)、アミド(例えば、-C(O)NR_2)、アリール、-アルキレン-O(R^d)、ベンズチアゾール(例えば、5-および6-フルオロベンズチアゾールを含むフルオロ置換ベンズチアゾールなどのハロ置換ベンズチアゾール)、ベンゾオキサゾール、ベンゾフラニル、もしくはインドリルであり；

R^{3b}はSO_3NaもしくはCNであり；

R^4は、天然アミノ酸側鎖(例えば、アラニン、バリン、イソロイシン、ロイシン、フェニルアラニン、チロシン、およびトリプトファンの側鎖などの疎水性天然アミノ酸側鎖)、非天然アミノ酸側鎖(例えば、ホモアラニン、ノルバリン、ノルロイシン、およびホモノルロイシンの側鎖などの疎水性非天然アミノ酸側鎖)、シクロアルキル、もしくはヘテロシクロであり；

R^aはHもしくはアルキルであり；

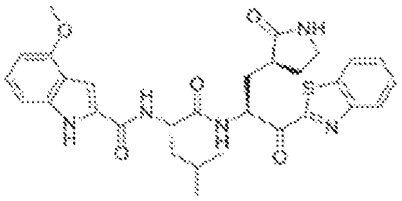
R^cはH、アルキル、-C(O)-アルキル、-C(O)-アルキレン-N(R^a)$_2$であり；

R^dはH、-P(O)$_3$(Li)$_2$、-P(O)$_3$(Na)$_2$、もしくは-P(O)(OH)$_2$であり；

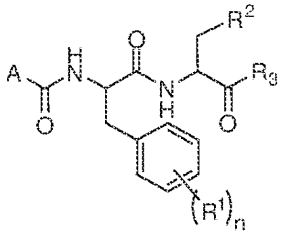
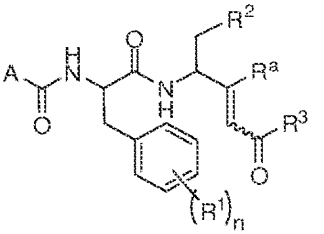
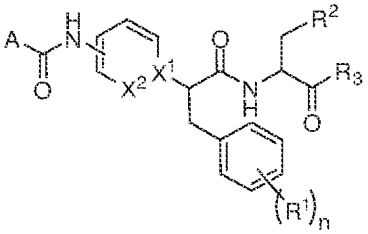
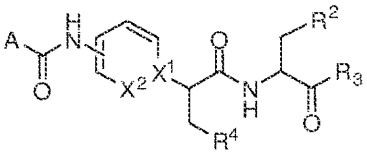
X^1はNもしくはCであり；

X^2はCH、N、もしくはC(O)であり、ここで、X^1とX^2の間の結合は、単結合であってもよいか、もしくはX^1がNである場合を除いて二重結合であってもよく；X^1およびX^2の

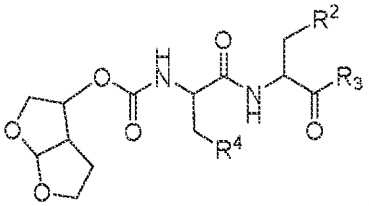
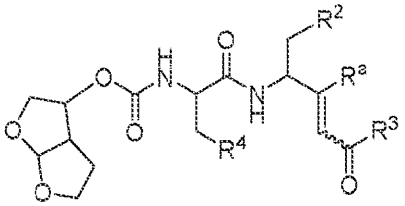
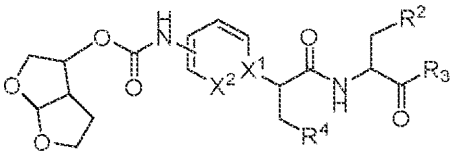
うちの一方のみがNであってもよく；かつ
nは0～3の整数であり；
かつ、
前記化合物が



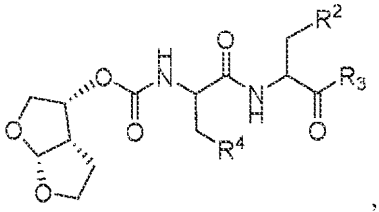
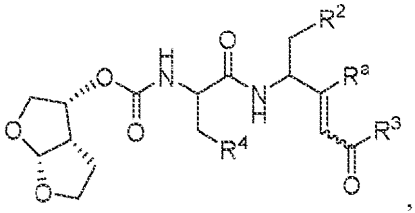
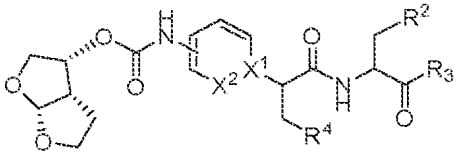
ではない、前記化合物、またはその薬学的に許容される塩。
【請求項２】
(i) 式(I)、(Ia)、および(Ib)の化合物が、式：


,

,

,および


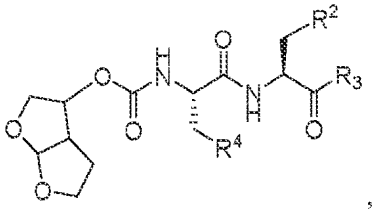
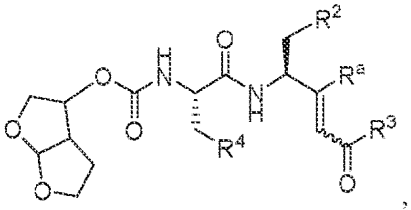
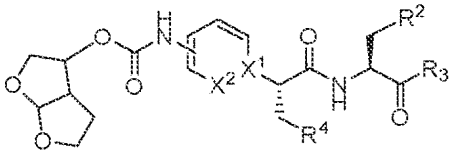
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、式中のR3はR3aである、または
(ii) 式(I)、(Ia)、および(Ib)の化合物が、式：


,

,および


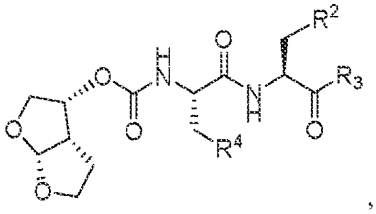
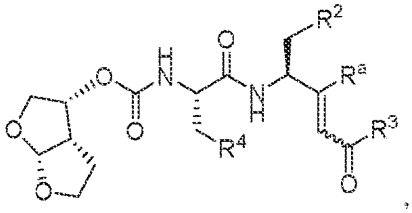
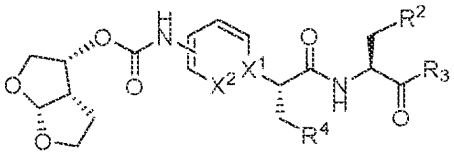
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、式中のR3はR3aであり、
例えば、式(I)、(Ia)、および(Ib)の化合物が、それぞれ式：


、

、および


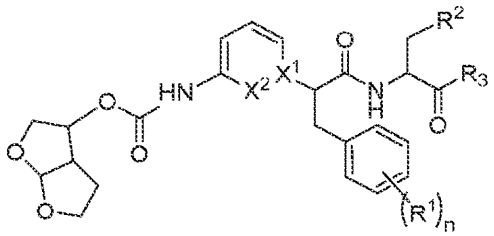
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、
例えば、式(I)、(Ia)、および(Ib)の化合物が、それぞれ式：


、

、および


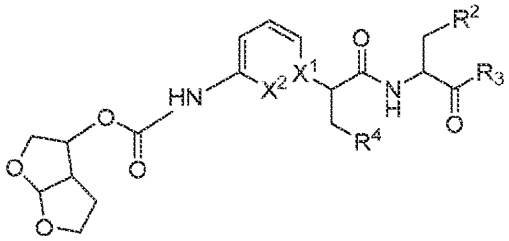
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、
例えば、式(I)、(Ia)、および(Ib)の化合物が、それぞれ式：


、

、および


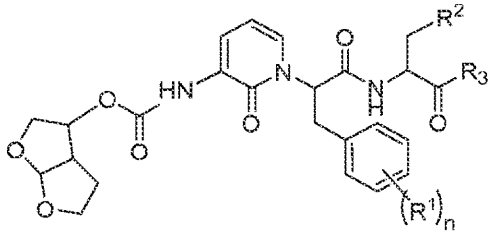
の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、
請求項1記載の化合物。
【請求項３】
式(Ib)の化合物が、それぞれ式：



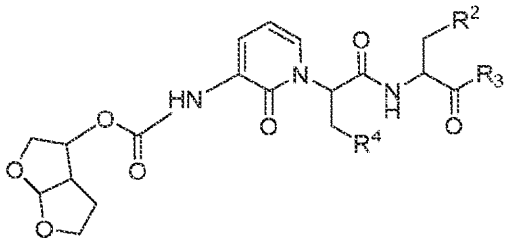
および



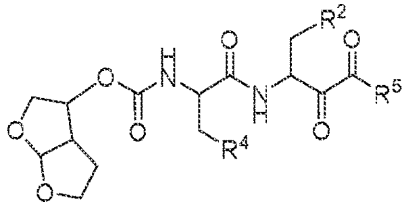
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、式中のR^{3}はR^{3a}であり、
例えば、式(Ib)の化合物が、それぞれ式：



および



の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、請求項1記載の化合物。
【請求項４】
(i) 式(I)の化合物が、式：

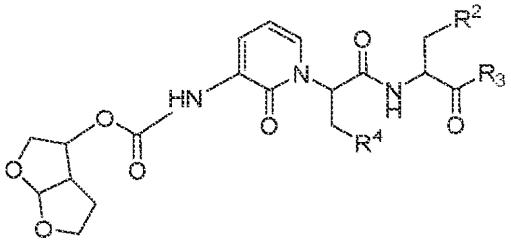


の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R^{5}は、式：

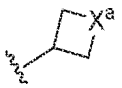


のヘテロシクロ基などのヘテロシクロであって、X^{3}が結合、CH$_2$、O、NR^a、もしくはS(O)$_p$であり、ここで、R^{a}がHもしくはアルキルであり、pが0、1、もしくは2であり、X^{3}を有する基がさらに置換されていてもよい、前記ヘテロシクロ；チアゾリル；またはベンズチアゾリルであるか；または

(ii) 式(Ib)の化合物が、式：



の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R^3はR^{3a}であり、R^2は、式：

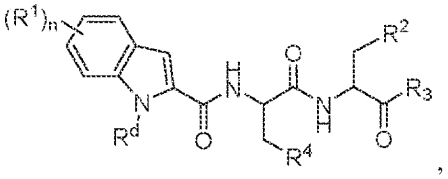


の基であり、式中、X^aは、結合、$(CH_2)_d$(ここで、dは1、2、または3である)、O、NR^a、または$S(O)_p$であり、ここで、R^aはHまたはアルキルであり、pは0、1、または2であり、X^aを有する基はOH、アルコキシ、アミノ、またはアミドでさらに置換されていてもよい、

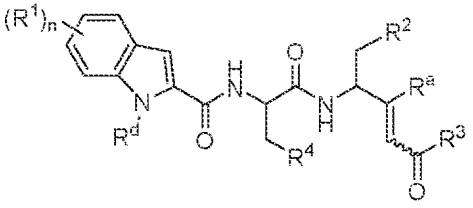
請求項1記載の化合物。

【請求項５】

式(I)、(Ia)、および(Ib)の化合物が、式：

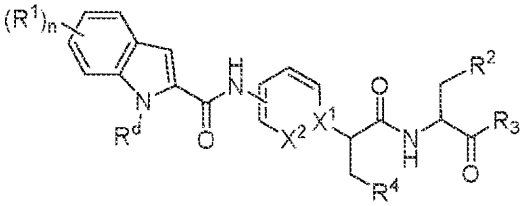


,



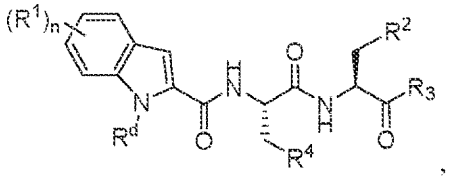
,

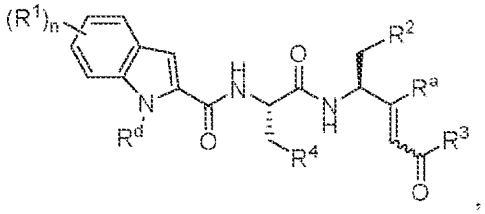
および



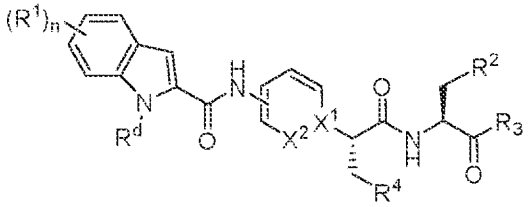
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R^3はR^{3a}であり、R^dはH、アルキル、アシル、および$S(O)_pR$であり、ここで、Rはアルキルまたはアリールアルキルであり、

例えば、式(I)、(Ia)、および(Ib)の化合物が、それぞれ式：





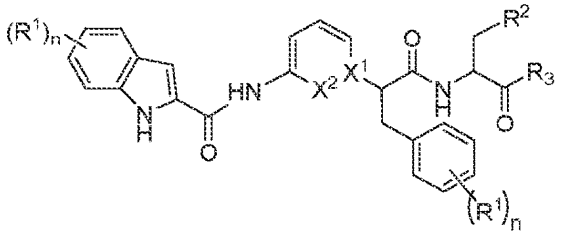
および



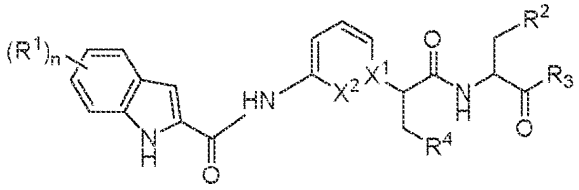
の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、
請求項1記載の化合物。

【請求項６】

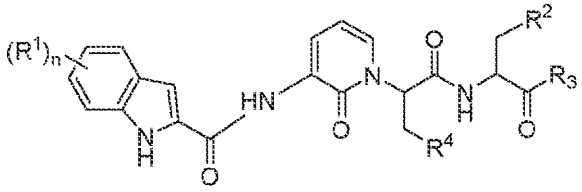
式(Ib)の化合物が、それぞれ式：



および



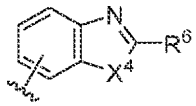
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、式中のR^3はR^{3a}であり、
例えば、式(I)の化合物が、式：



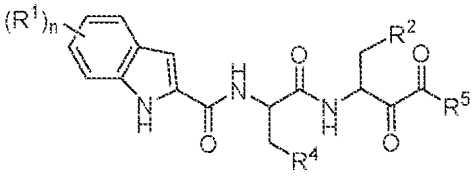
の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、
請求項1記載の化合物。

【請求項７】

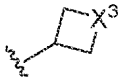
R^{3a}が、式：



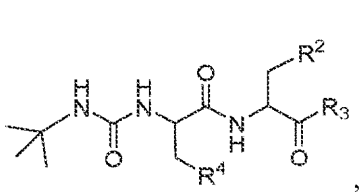
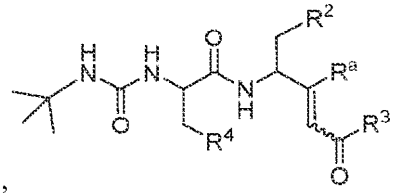
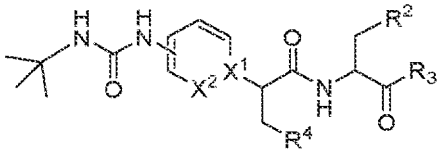
の基であり、
式中、
R^6は、アルキル、アルキルアミノ、シクロアルキルアミノ、シクロアルキルヘテロシクロアミノ、ヘテロシクロシクロアルキルアミノ、もしくはヘテロシクロアミノであり；かつ
X^4はS、O、もしくはNR^7であり、ここで、R^7はH、アルキル、シクロアルキル、もしくはアルキルアリールであり、例えば、X^4がSまたはOである、
請求項1記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。
【請求項８】
式(I)の化合物が、式：



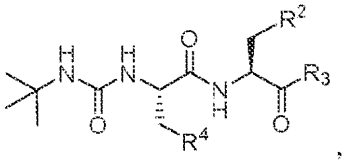
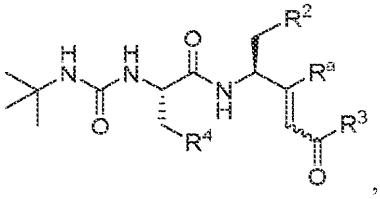
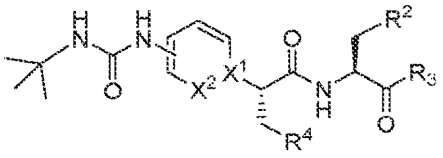
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R^5は、式：



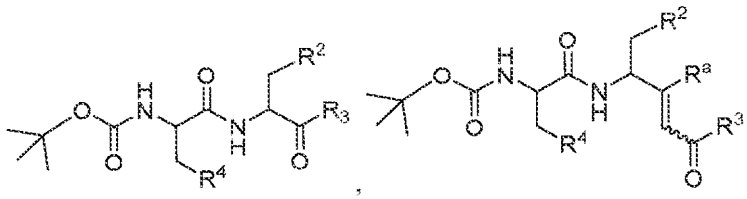
のヘテロシクロ基などのヘテロシクロであって、X^3が、結合、CH_2、O、NR^a、もしくは$S(O)_p$であり、ここで、R^aがHもしくはアルキルであり、pが0、1、もしくは2であり、X^3を有する基がさらに置換されていてもよい、前記ヘテロシクロ;チアゾリル;またはベンズチアゾリルである、請求項1記載の化合物。
【請求項９】
式(I)、(Ia)、および(Ib)の化合物が、それぞれ式：

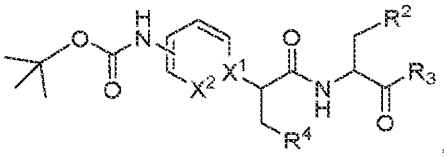

,

, および


の化合物であり、式中のR^3はR^{3a}であり、
例えば、式(I)、(Ia)、および(Ib)の化合物が、それぞれ式：

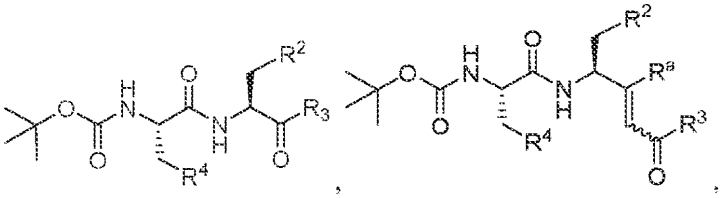

,


, および

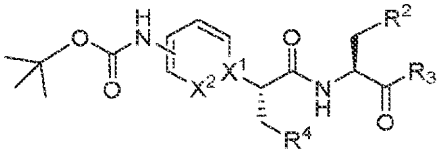
の化合物であるか；または
(ii) 式(I)、(Ia)、および(Ib)の化合物が、それぞれ式：


、および

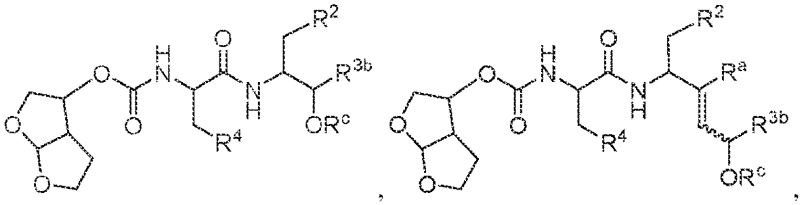


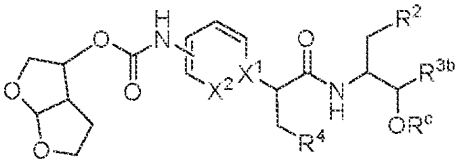
の化合物であり、
例えば、式(I)、(Ia)、および(Ib)の化合物が、それぞれ式：


、および

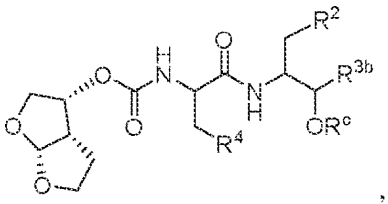
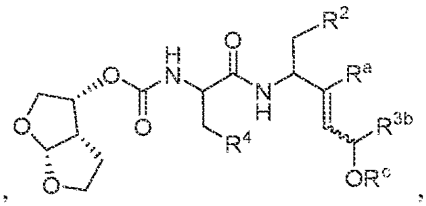
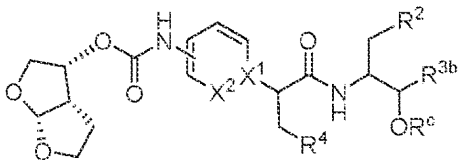


の化合物である、
請求項1記載の化合物。
【請求項１０】
式：

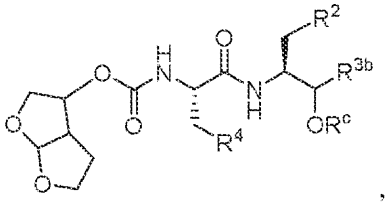
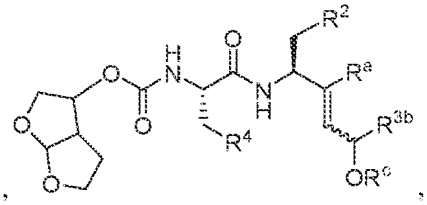
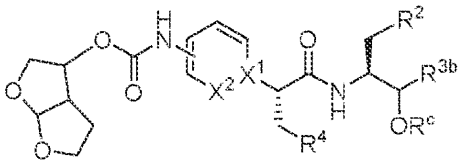

、もしくは



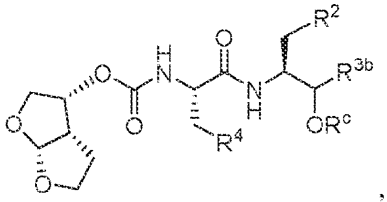
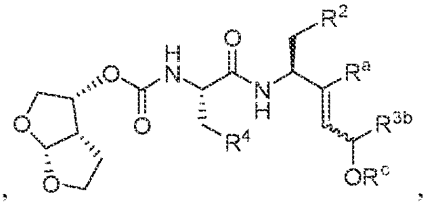
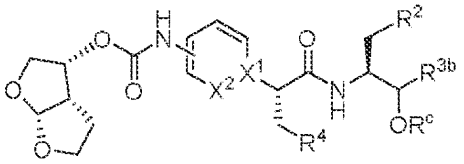
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、
例えば、それぞれ式：



,もしくは


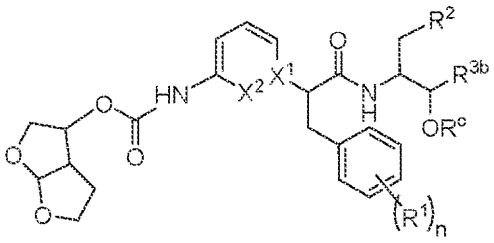
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、
例えば、それぞれ式：



,もしくは


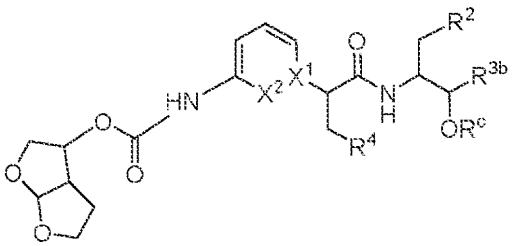
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、
例えば、それぞれ式：



,もしくは


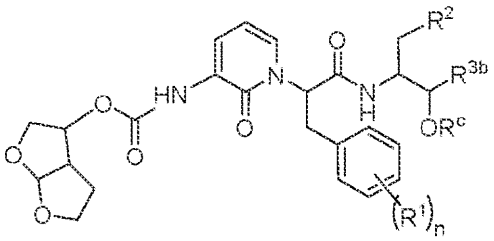
の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、
請求項1記載の化合物。
【請求項１１】
それぞれ式：



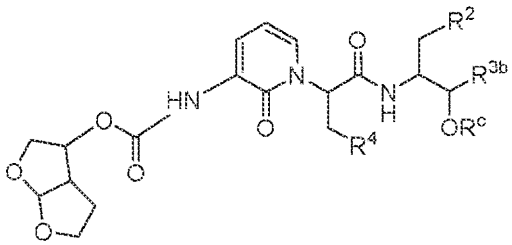
もしくは



の化合物、またはその薬学的に許容される塩、例えば、それぞれ式：



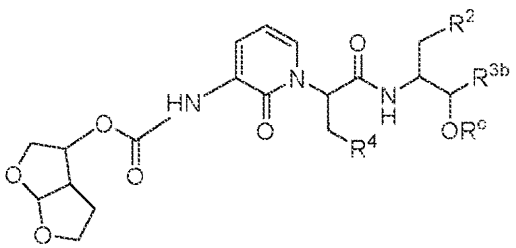
および



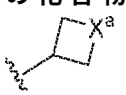
の化合物、またはそれらの薬学的に許容される塩である、請求項1記載の化合物。

【請求項１２】

式：

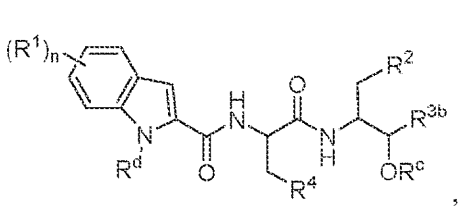
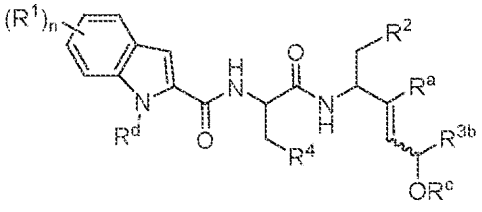
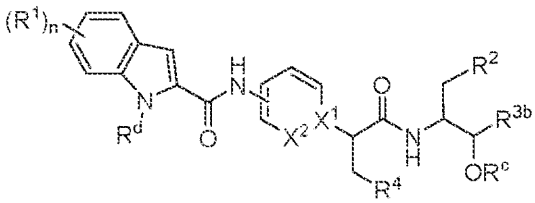


の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R^2は、式：

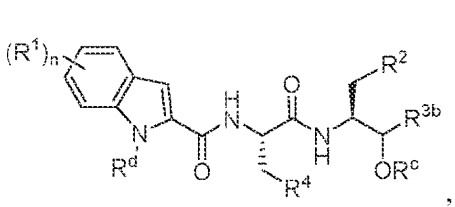
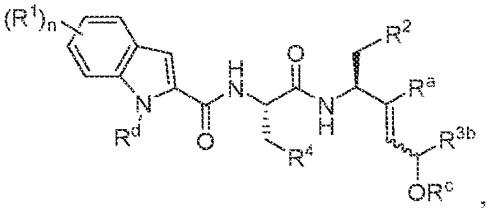
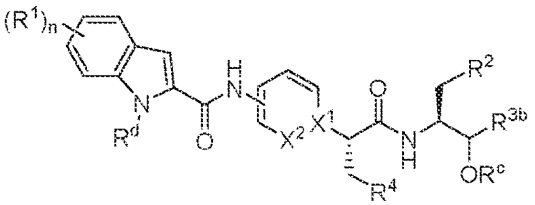


の基であり、式中、X^aは、結合、$(CH_2)_d$(ここで、dは1、2、または3である)、O、NR^a、または$S(O)_p$であり、ここで、R^aはHまたはアルキルであり、pは0、1、または2であり、X^aを有する基はOH、アルコキシ、アミノ、およびアミドなどの置換基でさらに置換されていてもよい、請求項1記載の化合物。

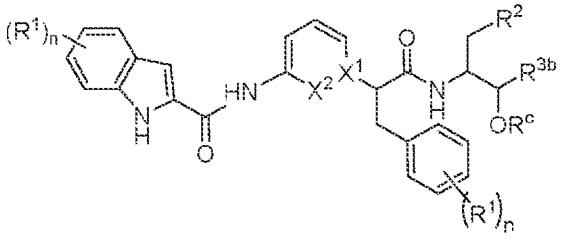
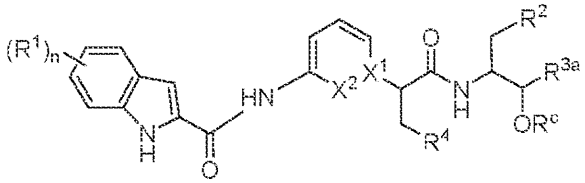
【請求項１３】
式：


,

,もしくは


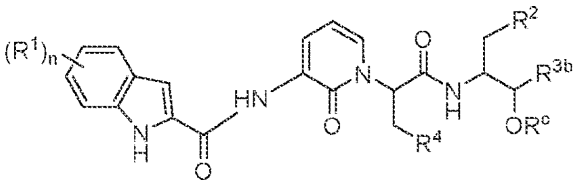
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R^dは、H、アルキル、アシル(例えば、C(O)R)、およびS(O)$_p$Rであり、ここで、Rはアルキルまたはアリールアルキルであり、
例えば、それぞれ式：


,

,もしくは


の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、請求項1記載の化合物。
【請求項１４】
式：


もしくは


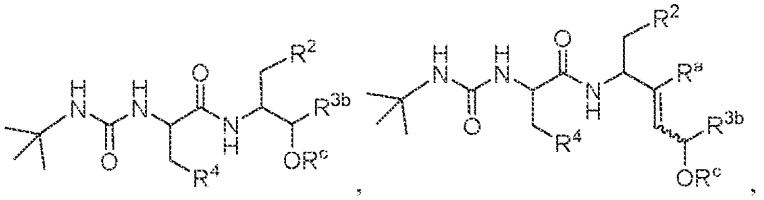
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、
例えば、式：

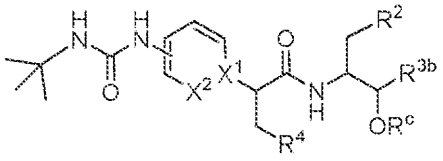


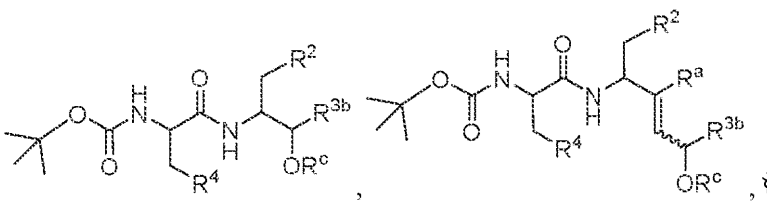
の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、請求項1記載の化合物。

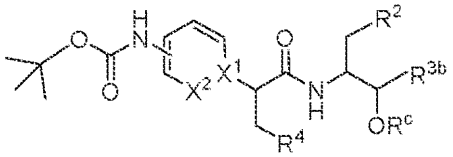
【請求項１５】

式：





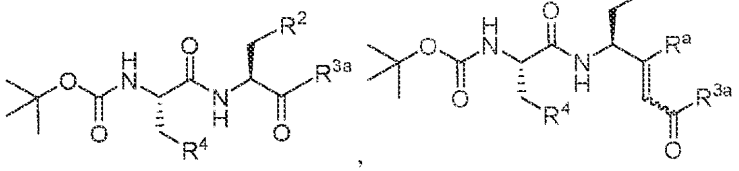




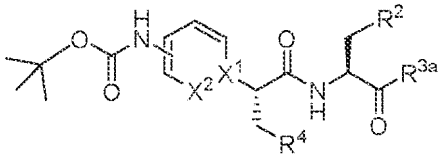
,もしくは

の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり

例えば、それぞれ式：

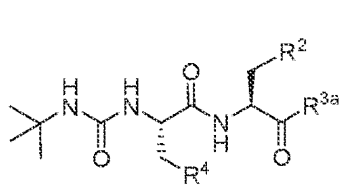
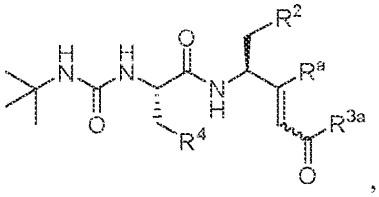
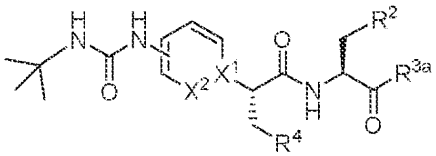


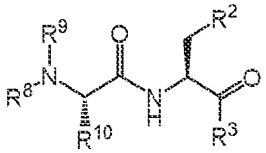
,もしくは



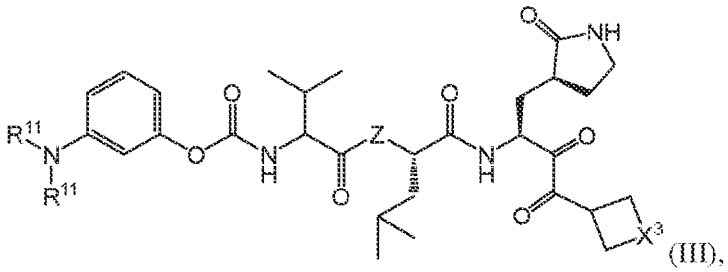
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、

例えば、それぞれ式：

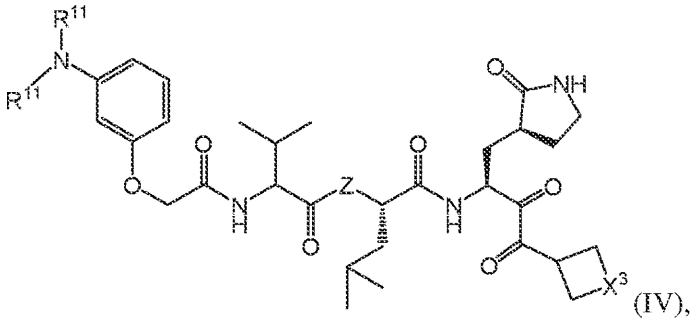

,

,もしくは


の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、
請求項1記載の化合物。
【請求項１６】
式(II)：


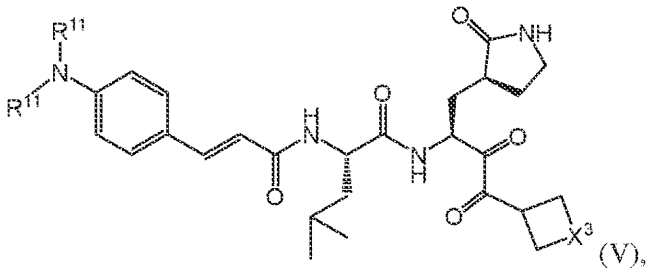
の化合物であって、
式中、
R^2はヘテロシクロであり；
R^{3a}は、アルキル、アルコキシ、アシル、アミド、アリール、ベンズチアゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾフラニル、もしくはインドリルであり；
R^8およびR^9は、独立してHもしくはアルキルであるか；またはそれらが結合する窒素原子と一緒になってヘテロシクリル基を形成してもよく；かつ
R^{10}はアルキルもしくはアルケニルである、
前記化合物、またはその薬学的に許容される塩。
【請求項１７】
式(III)～(X)：



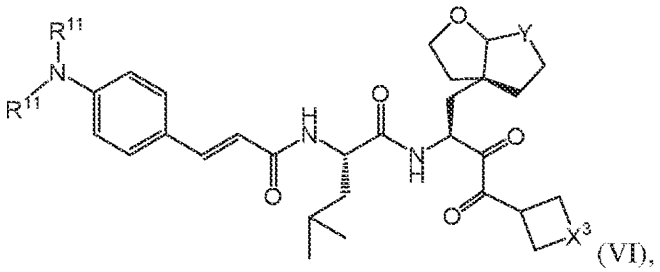
(III),



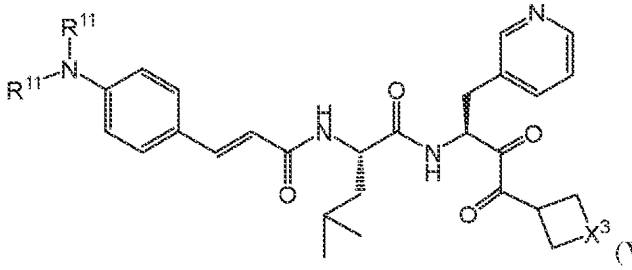
(IV),

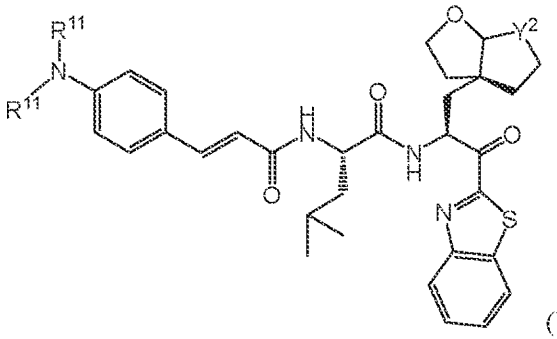


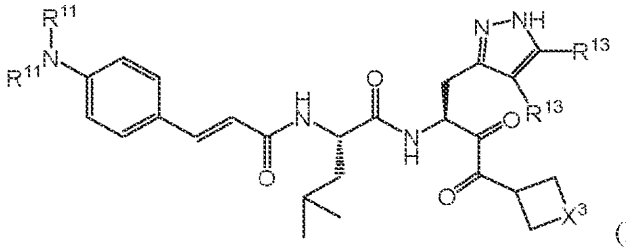
(V),

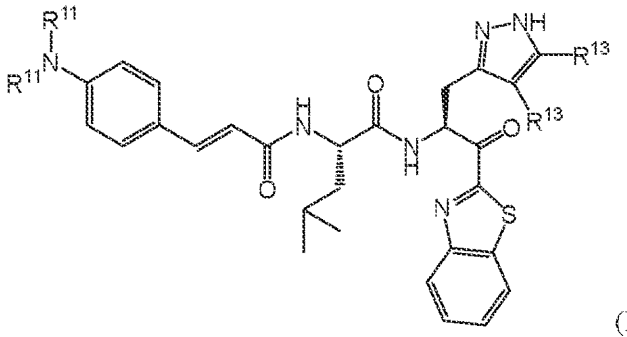


(VI),


(VII),


(VIII),


(IX), および


(X)

の化合物であって、

式中、

各R^{11}はH、アルキルであるか、もしくは各R^{11}はそれが結合する窒素原子と一緒になってヘテロシクリル基を形成し；

R^{12}はH、アミノ、OH、もしくはアルコキシであり；

R^{13}はH、アルキル、アミノであるか、または2つの隣接するR^{13}基はそれらが結合する炭素原子と一緒になって5もしくは6員アリールもしくはヘテロアリール基を形成し；

Y^2はOもしくはNR^aであり；

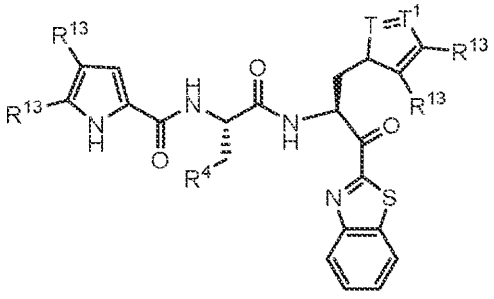
ZはNもしくはNR^aもしくはアルキルであり；かつ

R^aはHもしくはアルキルである、

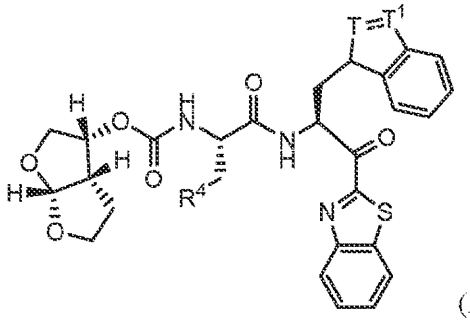
前記化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項１８】

式(XI)～(XII)：



(XI); および



(XII)

の化合物であって、

式中、

破線は単結合もしくは二重結合であり；

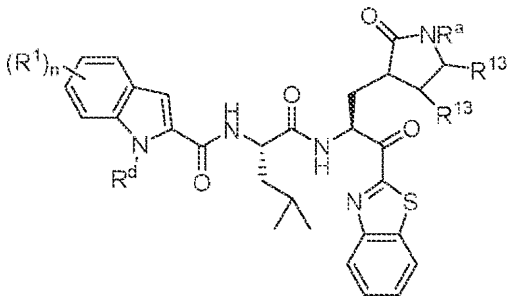
TおよびT^{1}はそれぞれ独立してNR^{a}もしくはC(O)であり；かつ

R^{a}はHもしくはアルキルである、

前記化合物、またはその薬学的に許容される塩。

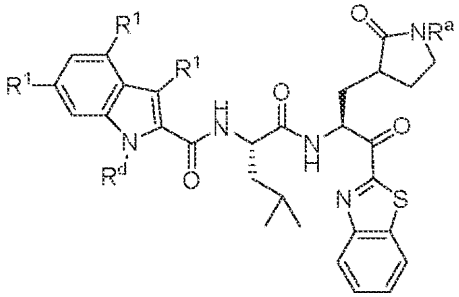
【請求項１９】

式：



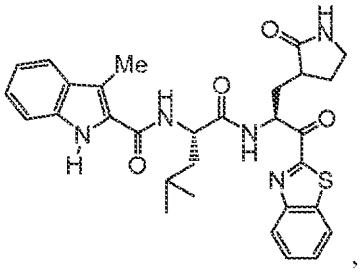
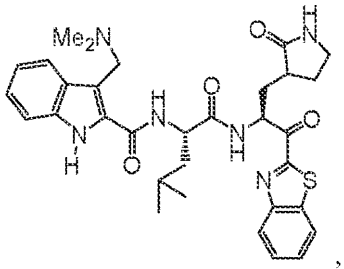
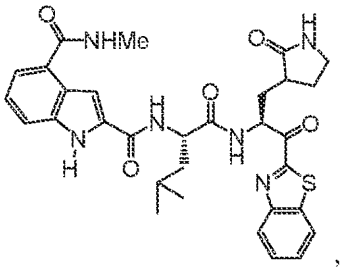
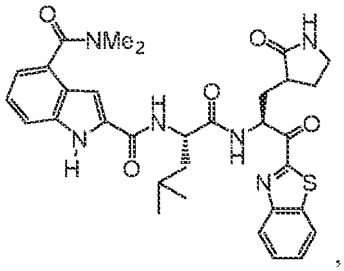
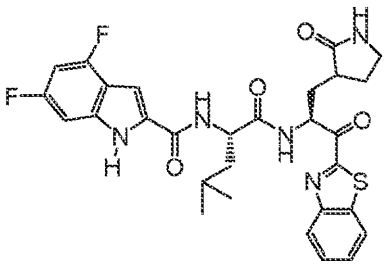
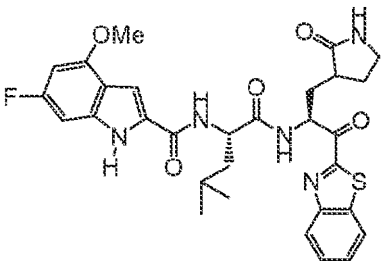
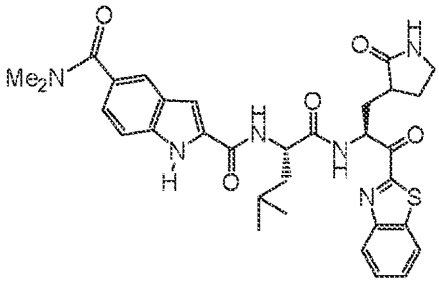
の化合物；あるいは

式：

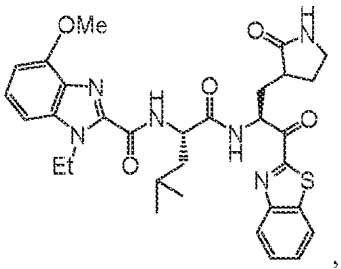


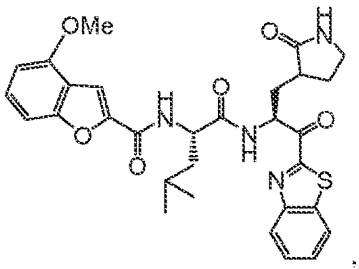
の化合物であり、式中、R^{a}はHまたはアルキルである、化合物；あるいは

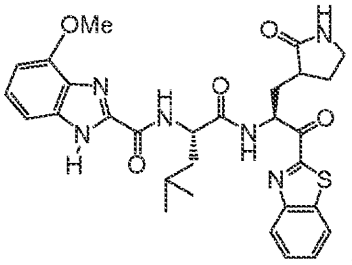
式：

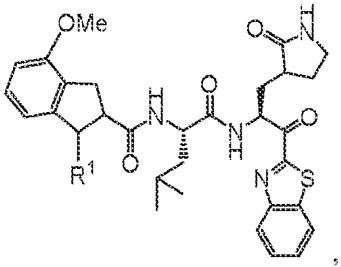

,

,

,

,

,

, もしくは


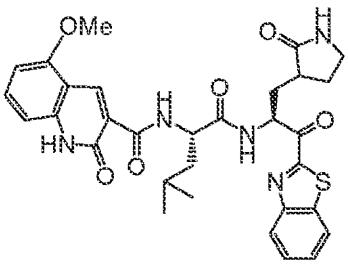
の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、化合物；あるいは

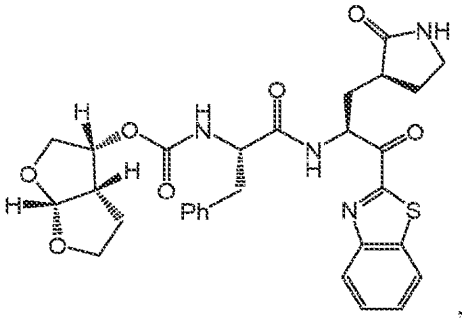

,

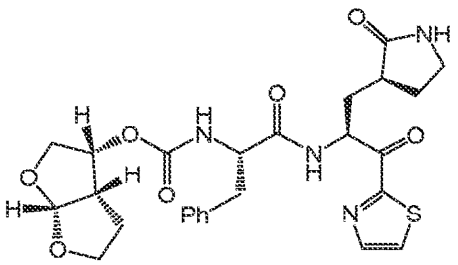

,

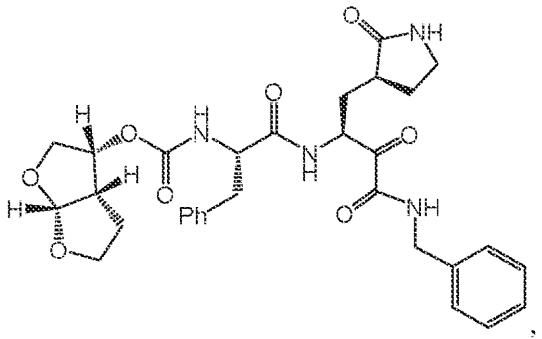

,


,

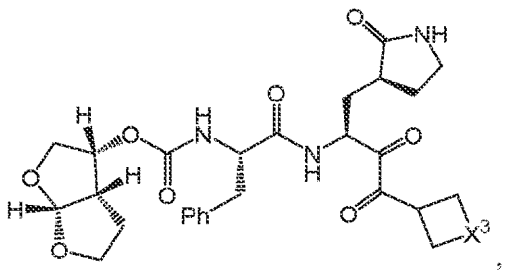

,


,

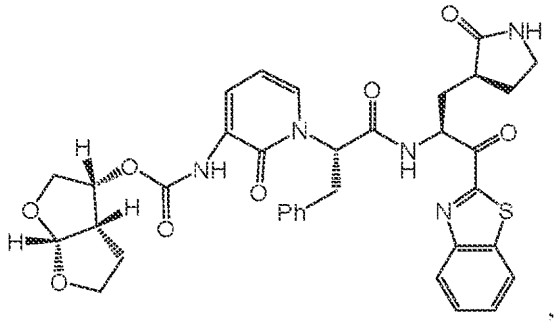

,



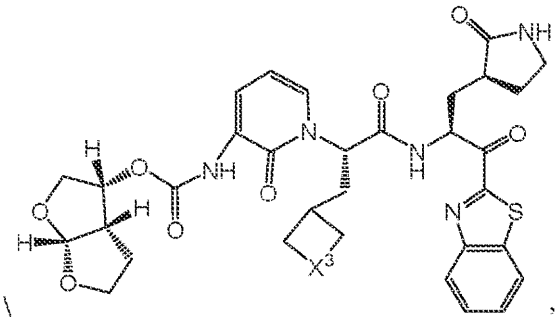
、



、

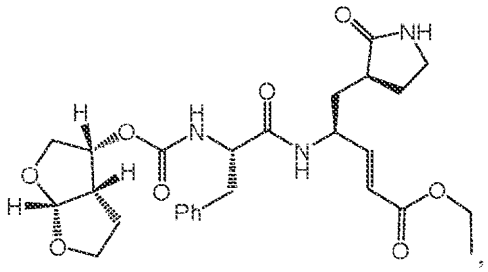


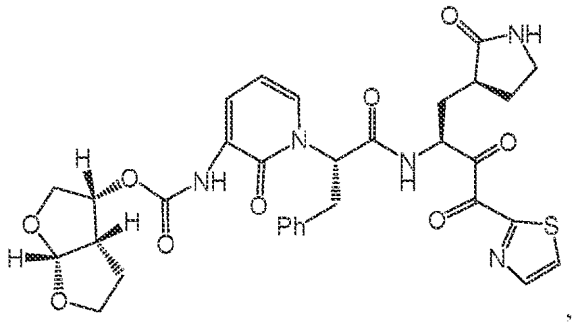
、

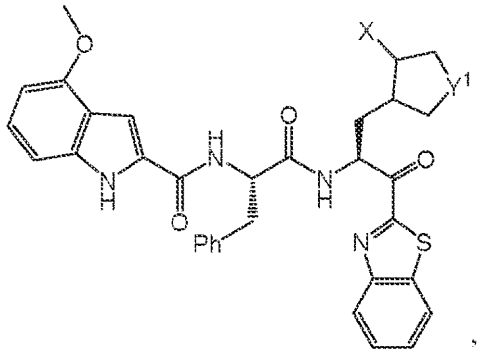


、

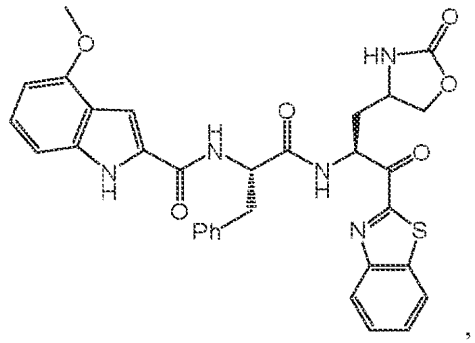
上記式中、X^3は結合、CH_2、O、NR^a、もしくは$S(O)_p$であり、ここで、R^aはHもしくはアルキルであり、pは0、1、または2であり、X^3を有する基は、さらに置換されていてもよいか；チアゾリルであってもよいか；またはベンズチアゾリルであってもよい；

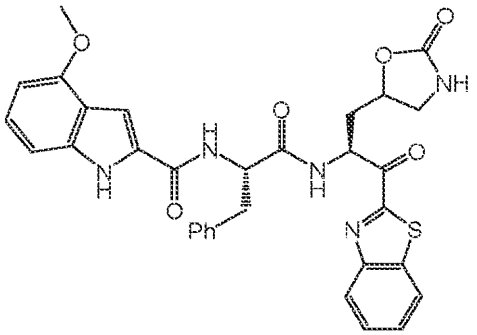


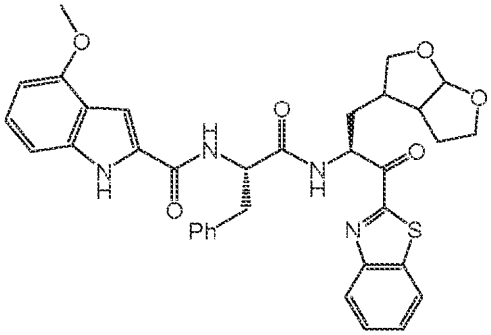


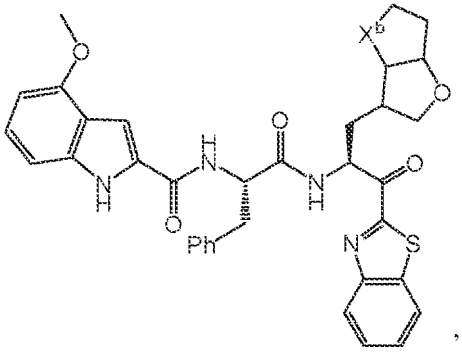


上記式中、Y^1はCH_2、O、もしくはNHであり、かつXはOH、OCH_3、NH_2、もしくは$NHCH_3$である；

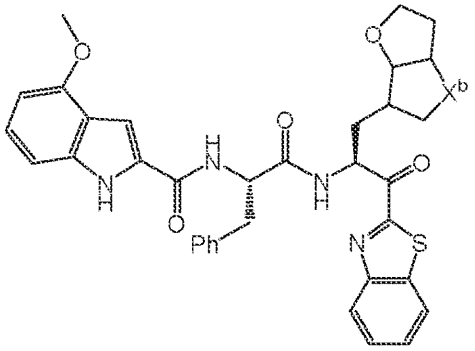

,

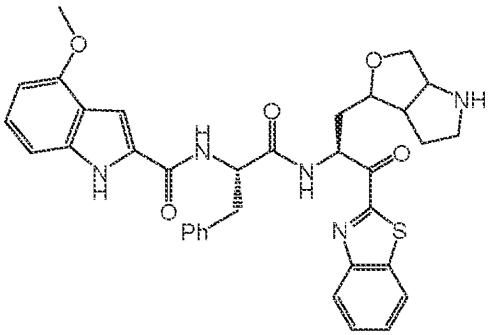


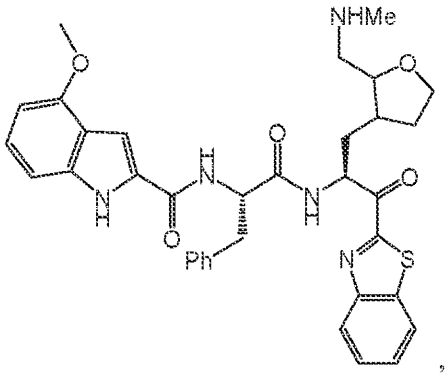

,

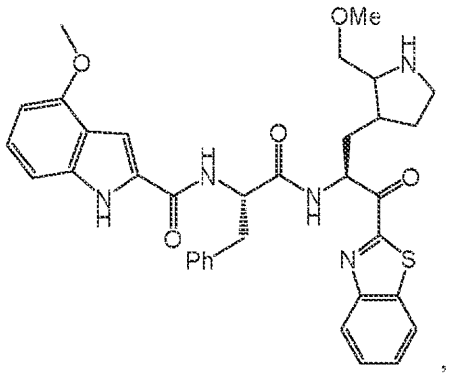

,

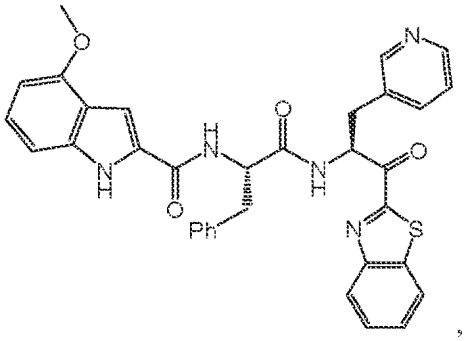
上記式中、X^bはOもしくはNR^aであり、かつR^aはHもしくはアルキルである；

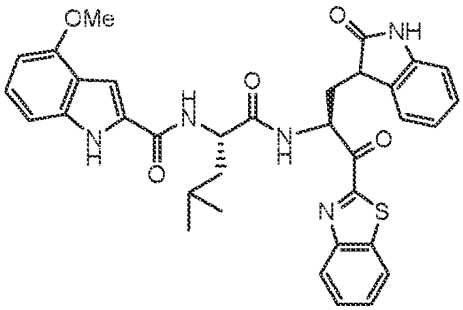

,

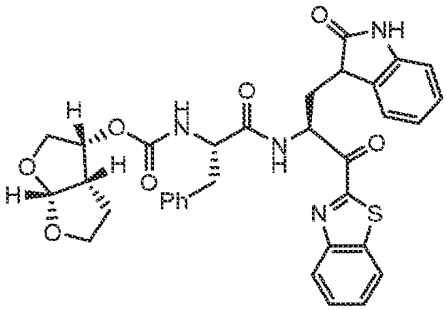

,

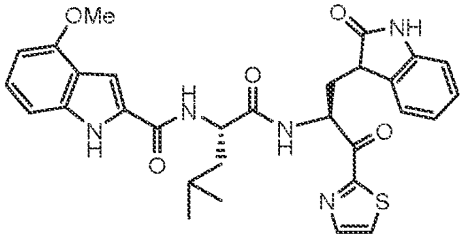

,

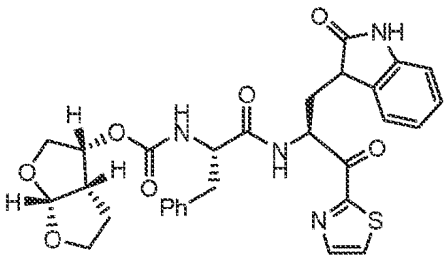

,

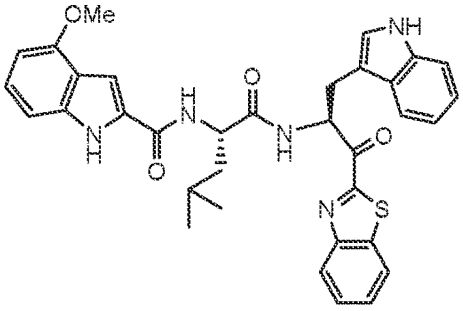

,

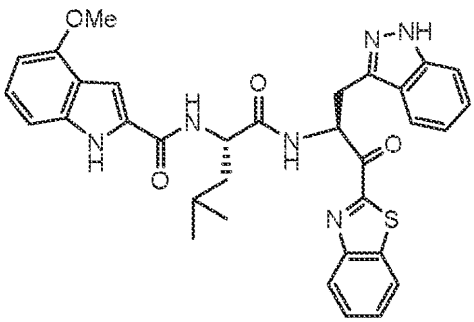

OMe
NH
O
N
H
S
,


NH
O
H
Ph
N
S
,

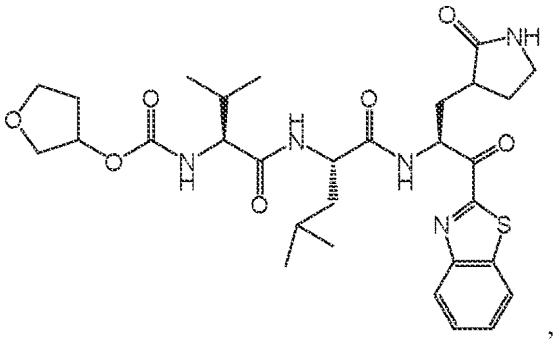

OMe
NH
O
N
H
S
,


NH
O
H
Ph
N
S
,

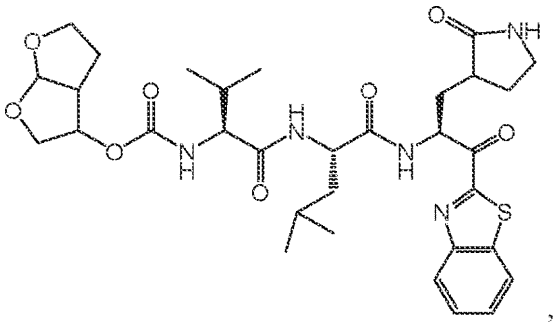

OMe
NH
O
N
H
S
,もしくは


OMe
N-NH
O
N
H
S

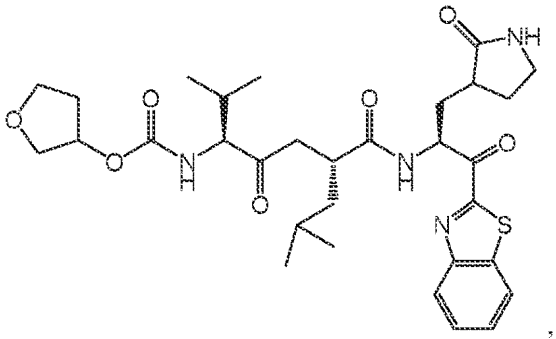
、またはその薬学的に許容される塩である、化合物；あるいは



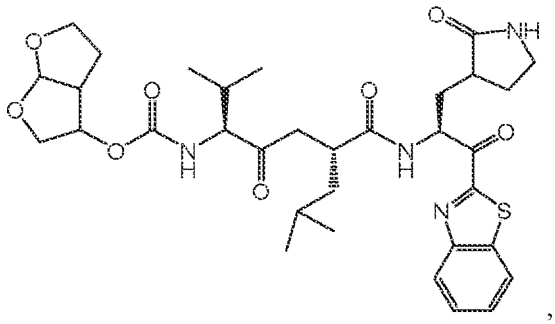
,

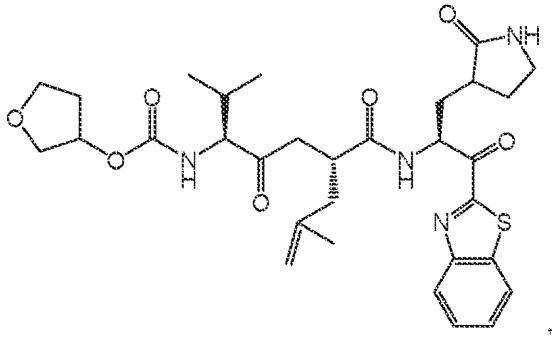


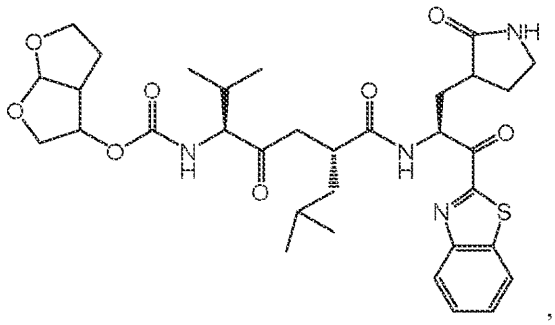
,

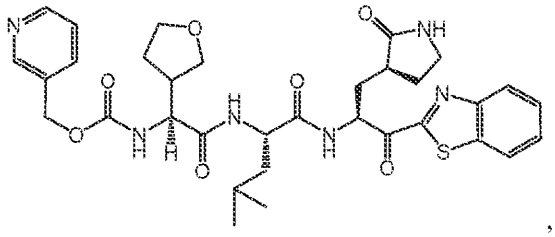


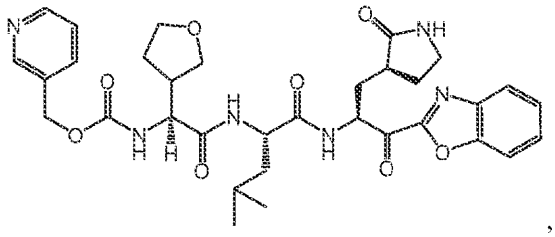
,

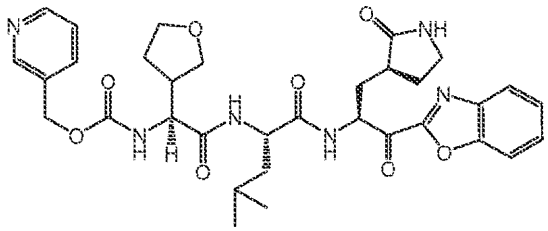

,

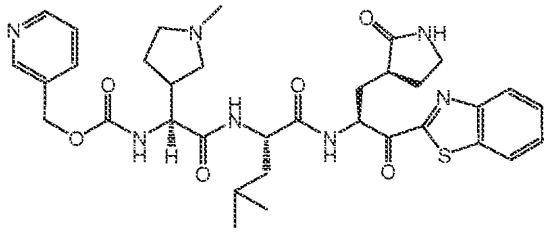

,

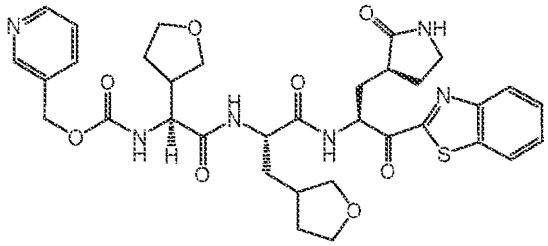

,

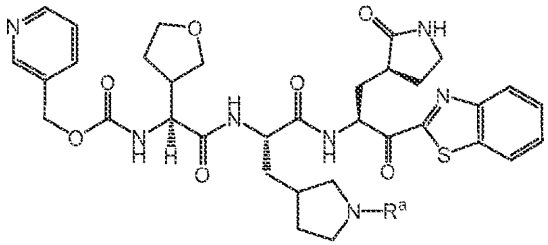

,

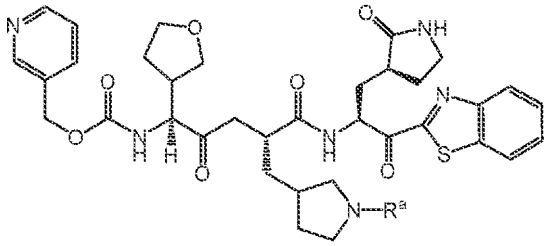

,

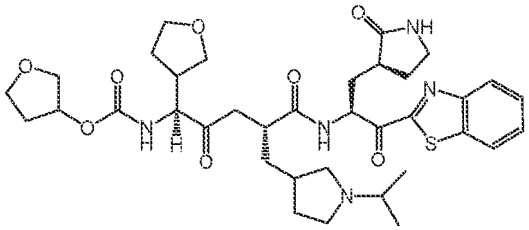

,

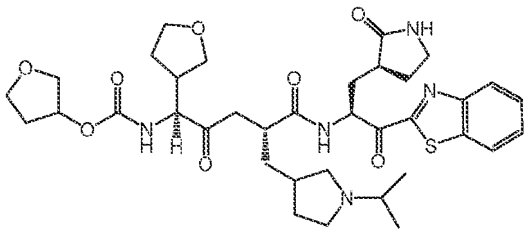

,

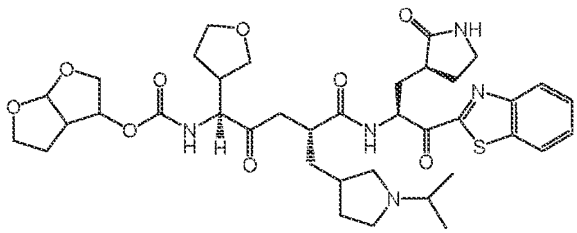

,

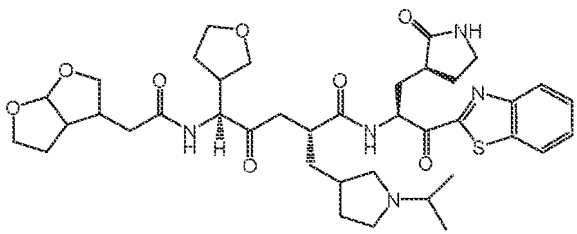

,

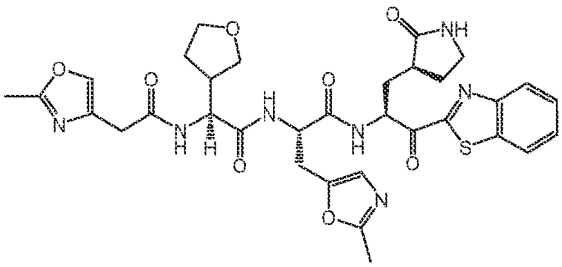

,

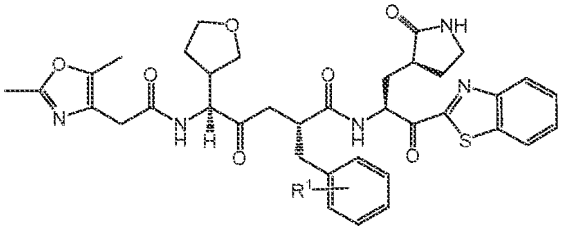

,


,


,


,

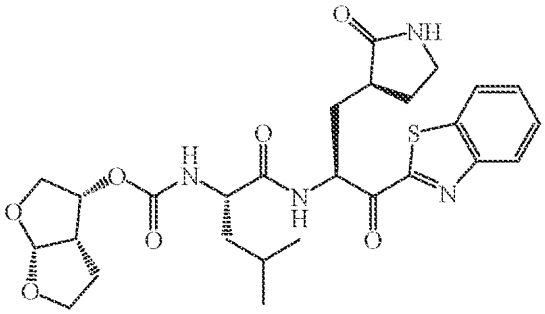
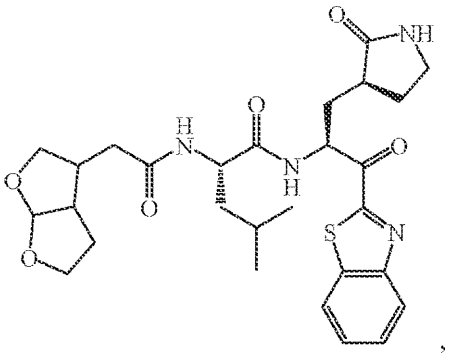
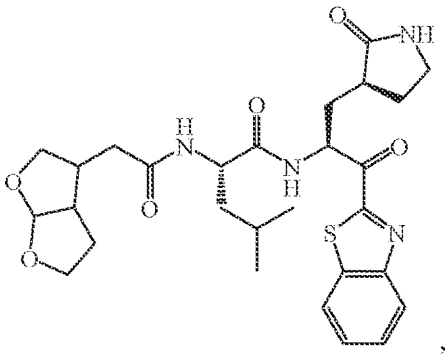
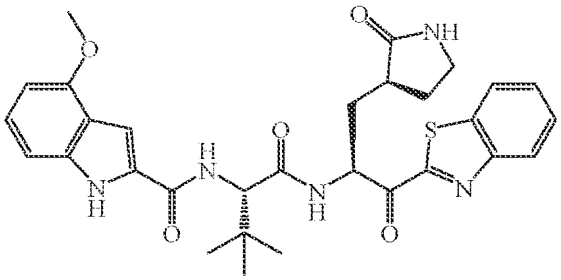
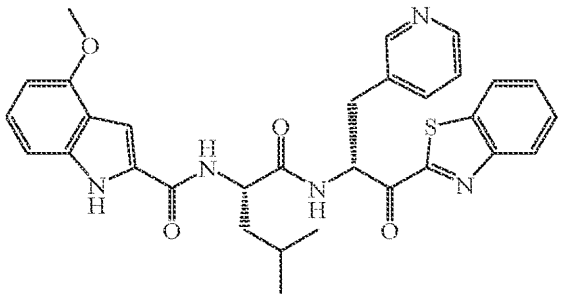

,もしくは

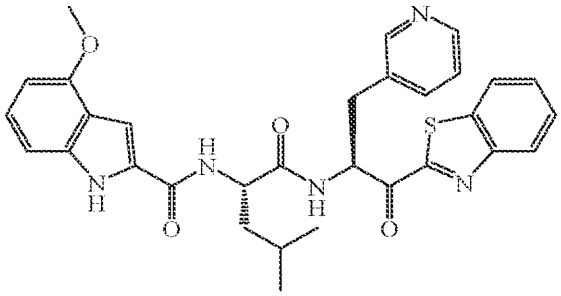

、またはその薬学的に許容される塩であり、

式中、

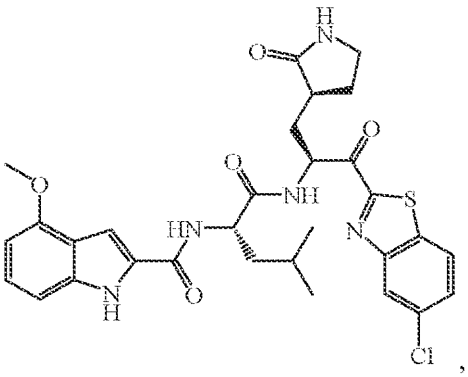
R^aはHまたはアルキルであり；かつ

各R^1は独立してアルキルまたはアルコキシである、化合物；あるいは

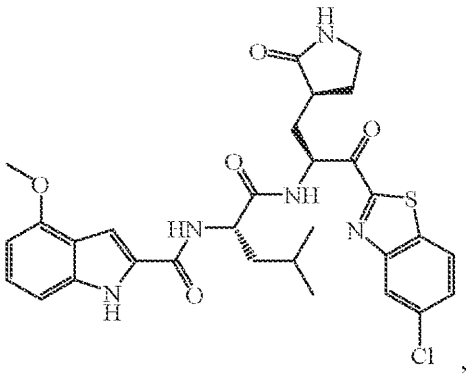

,

,

,

,

,



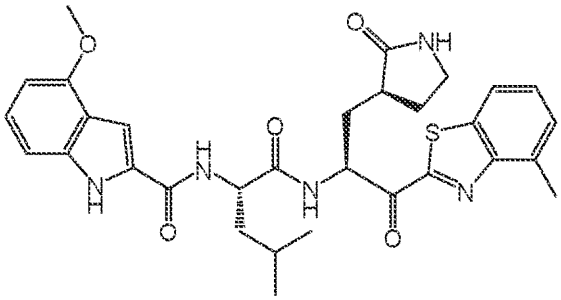
,



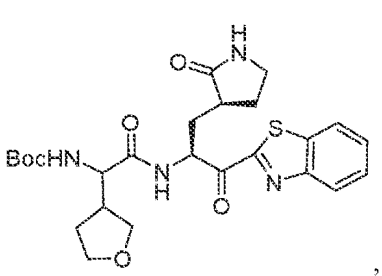
,



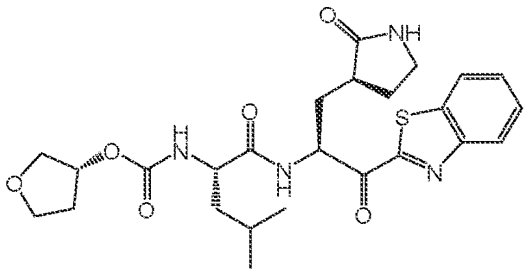
,



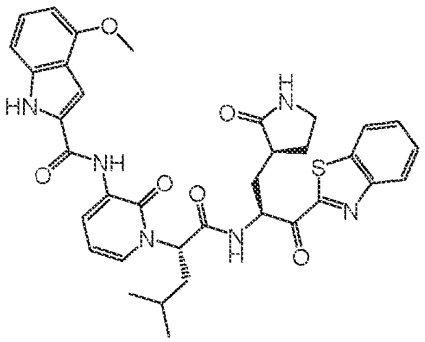
,


BocHN
H
N
O
S
N
O

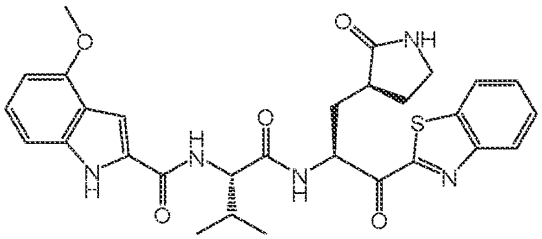
,


NH
O
O
N
H
O
S
N
O

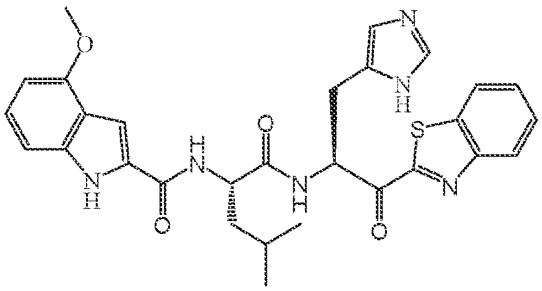
,


O
HN
NH
O
O
N
O
H
N
O
S
N
O

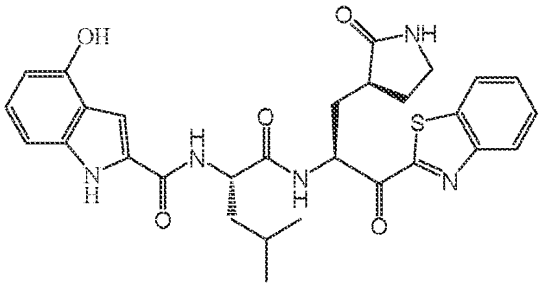
,


O
NH
O
N
H
N
H
O
S
N
O

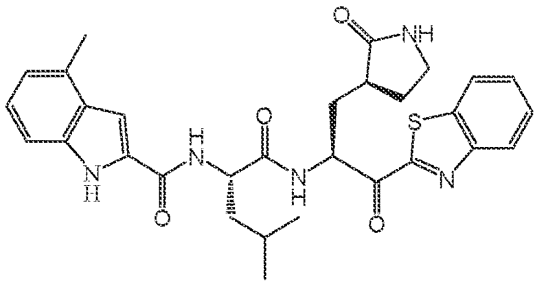
,


O
N
N
H
O
N
H
N
H
O
S
N
O

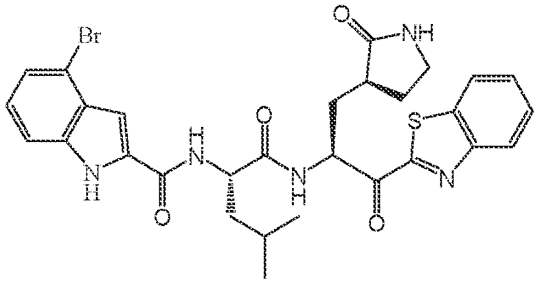
,


OH
NH
O
O
N
H
N
H
O
S
N
O

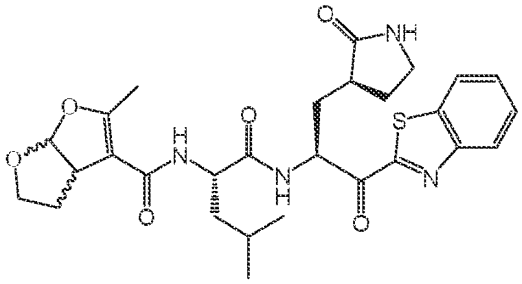
,



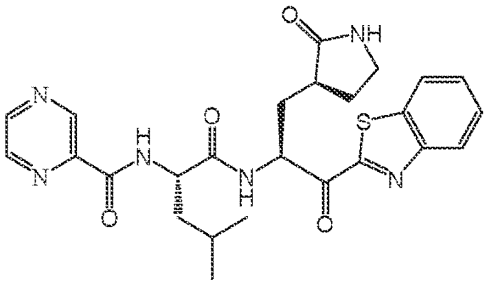
,



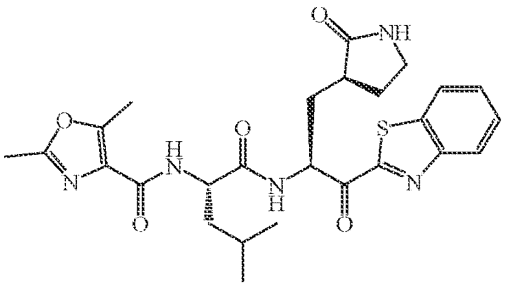
,



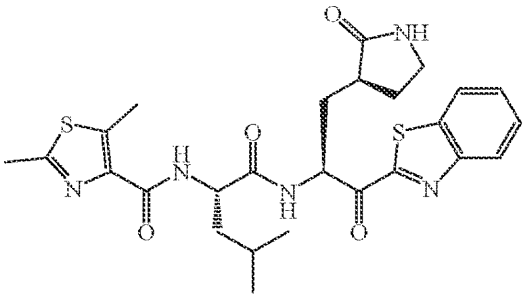
,

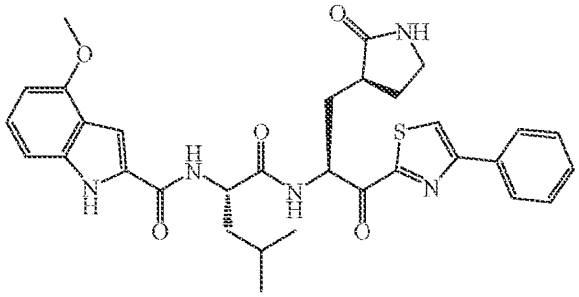


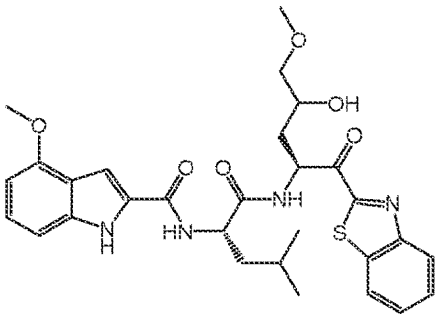
,

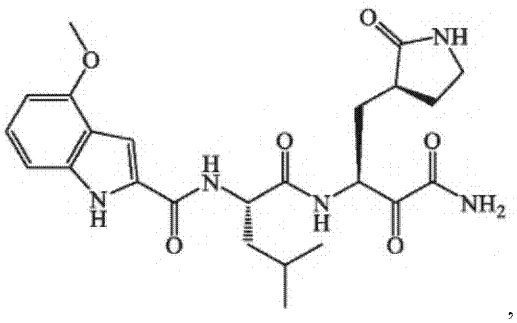


,

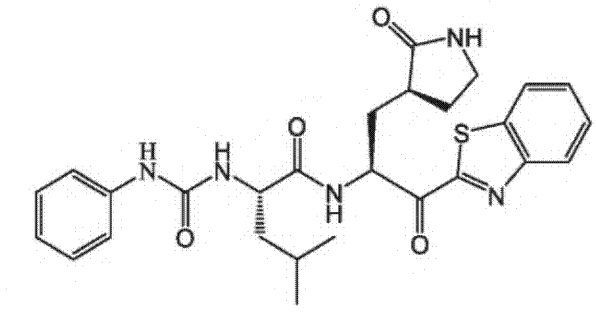

,


,

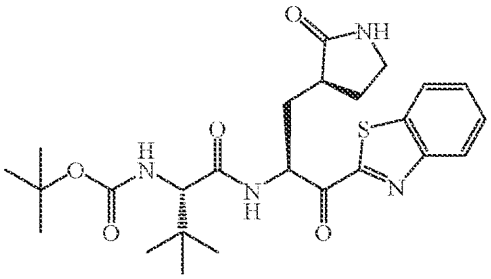

,


,

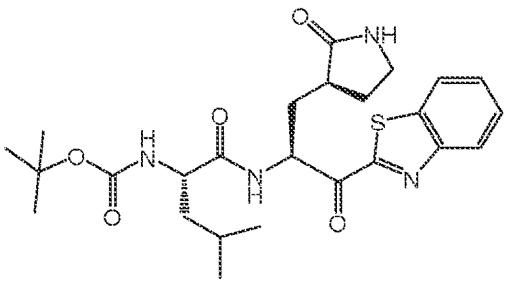
もしくは



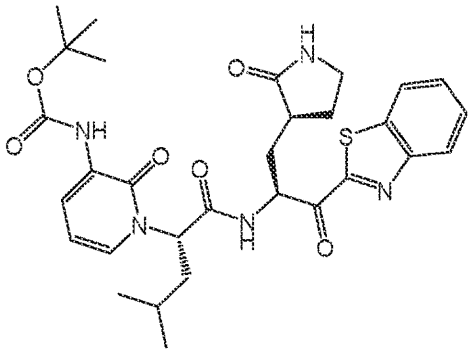
、またはその薬学的に許容される塩である、化合物；あるいは

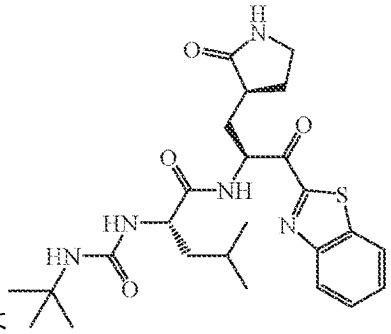


、



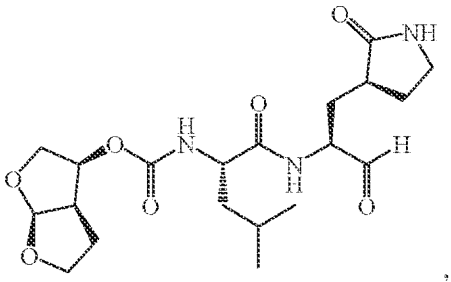
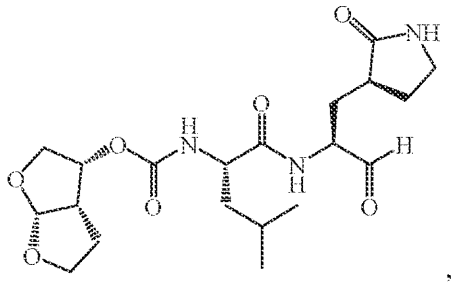
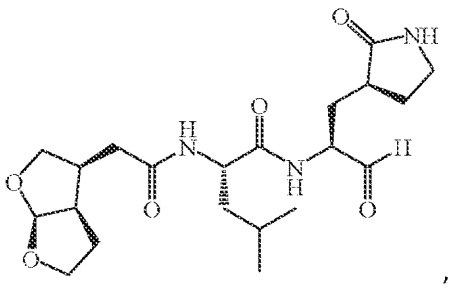
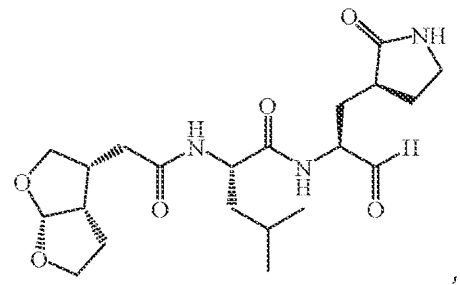
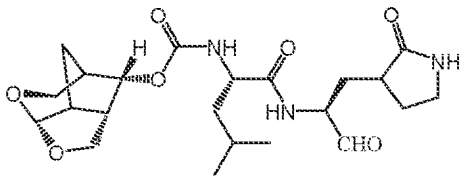
、



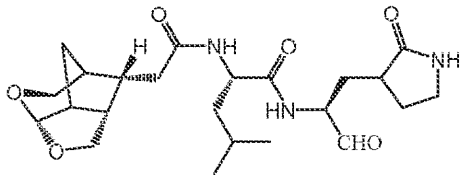


、もしくは

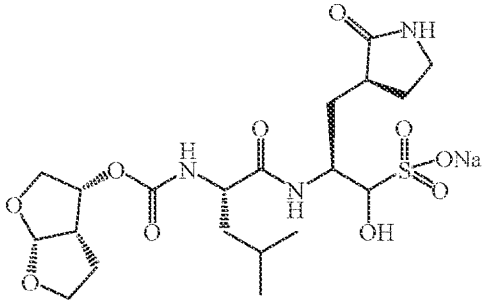
、またはその薬学的に許容される塩である、化合物；あるいは

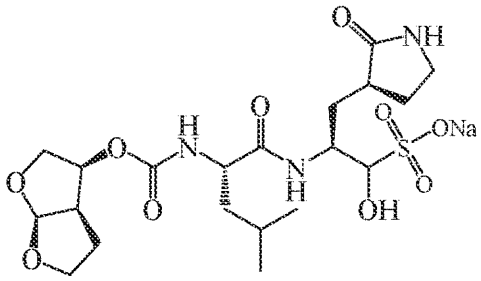

,

,

,

,


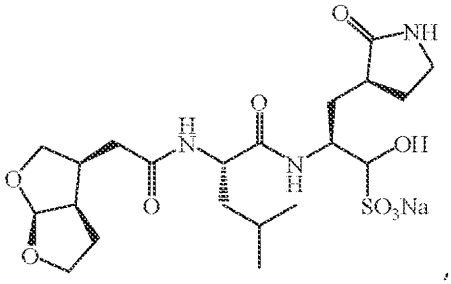
もしくは

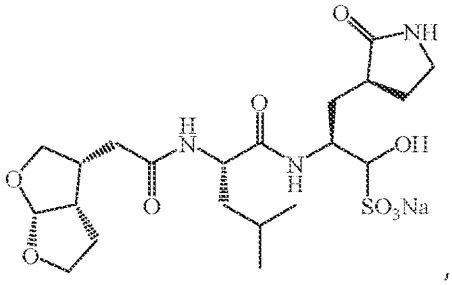


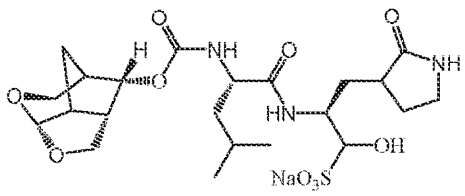
、またはその薬学的に許容される塩である、化合物；あるいは


,

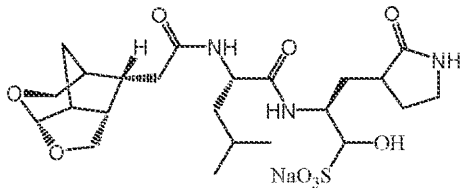

,


,

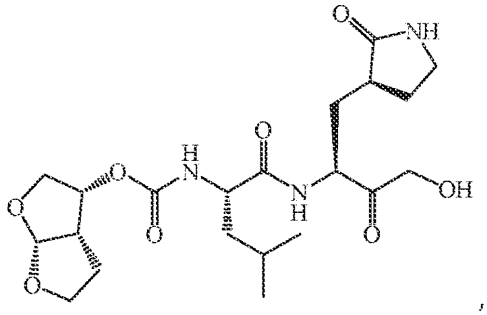

,


,

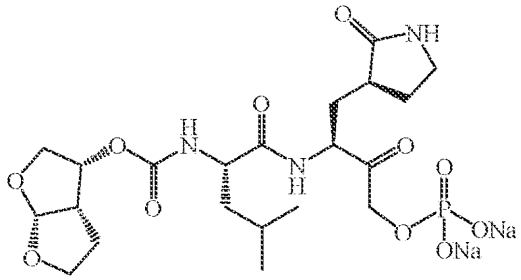
もしくは



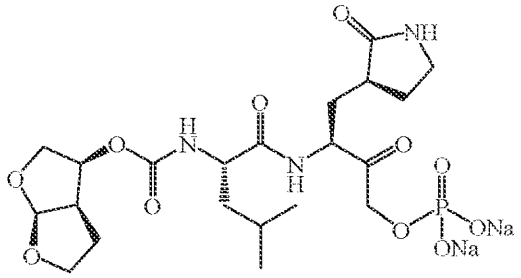
、またはその薬学的に許容される塩である、化合物；あるいは



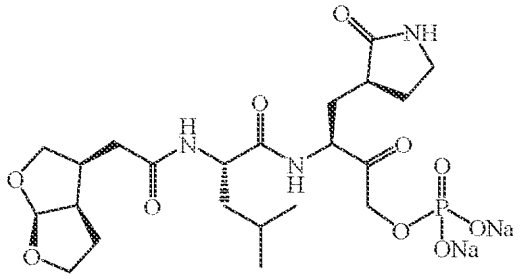
,



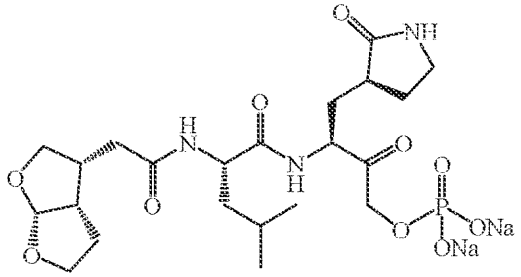
,



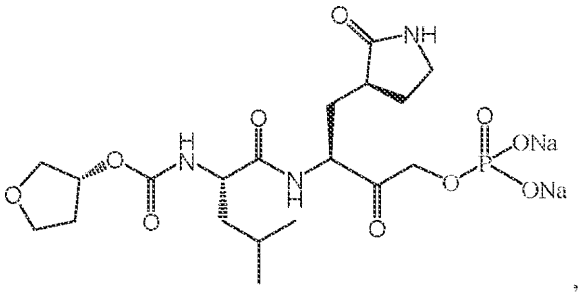
,



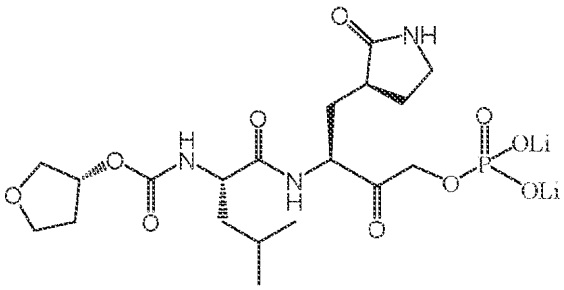
,



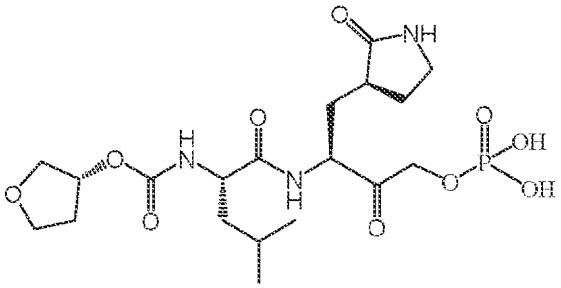
、またはその薬学的に許容される塩である、化合物；あるいは



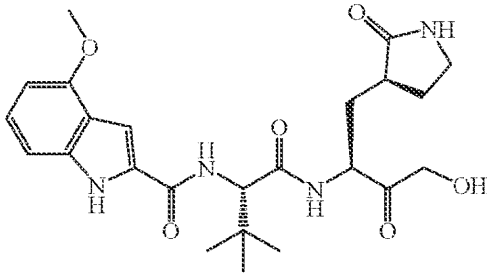
,



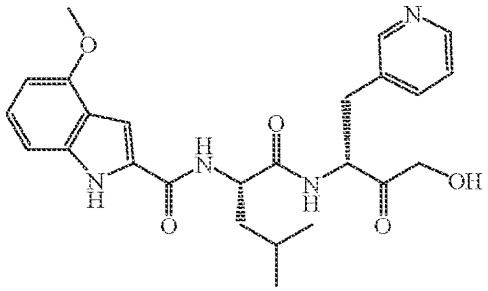
, もしくは



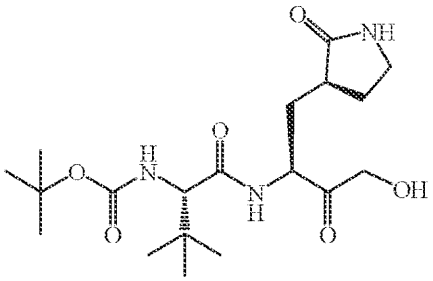
、またはその薬学的に許容される塩である、化合物；あるいは



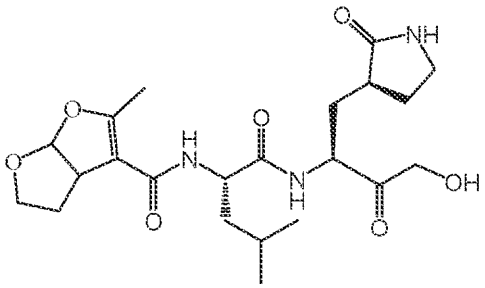
もしくは



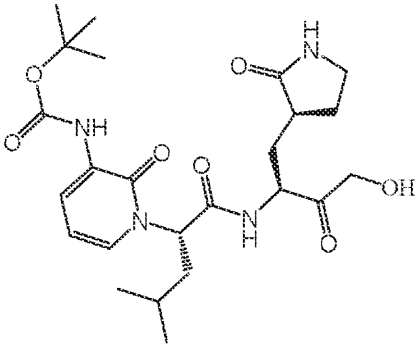
、またはその薬学的に許容される塩である、化合物；あるいは

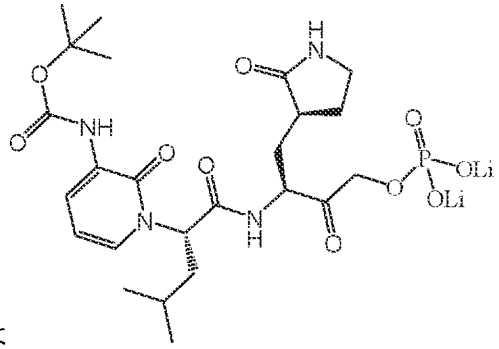


もしくは



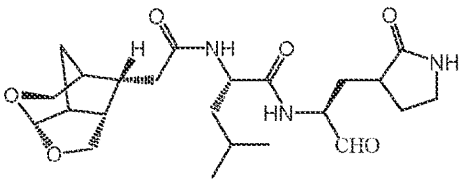
、またはその薬学的に許容される塩である、化合物；あるいは



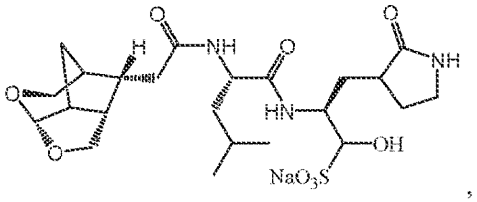


もしくは

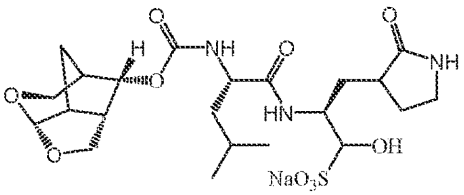
、またはその薬学的に許容される塩である、化合物；あるいは



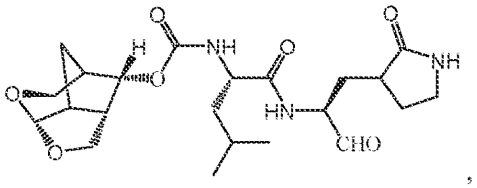
,



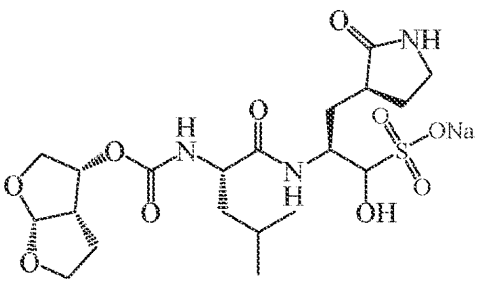
,



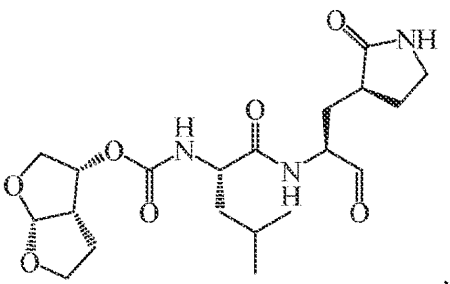
,



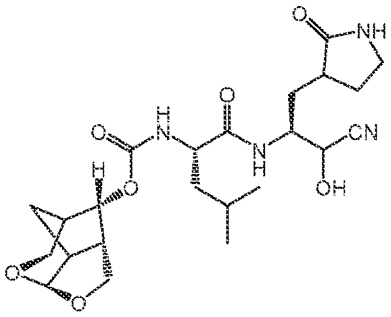
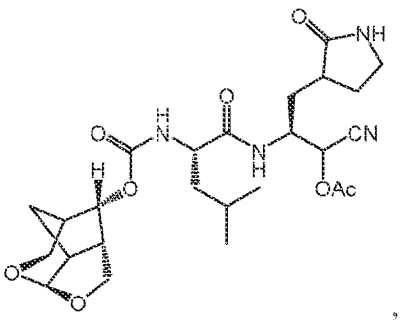
,

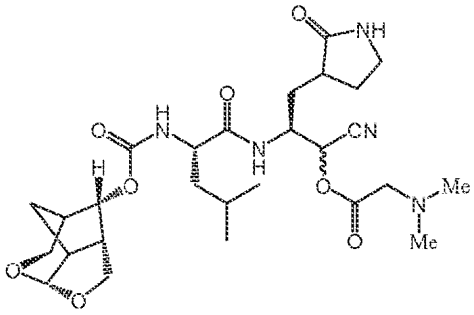
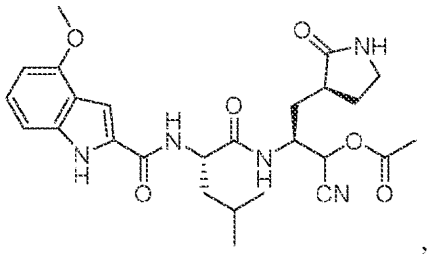


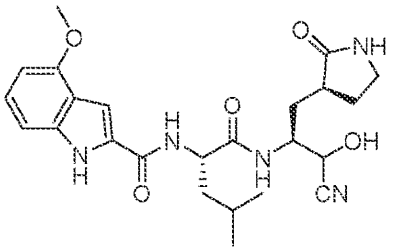
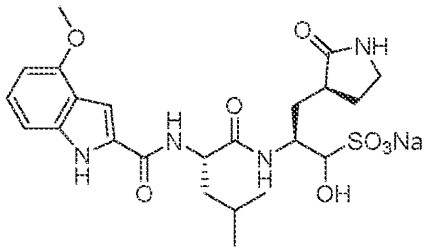
,



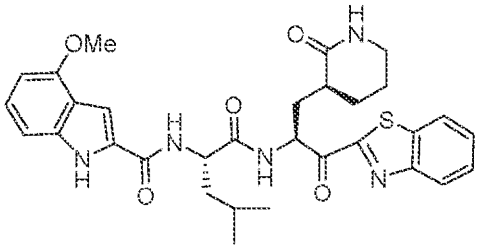
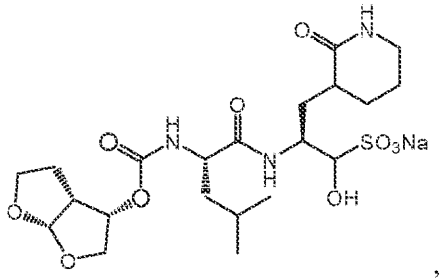
,

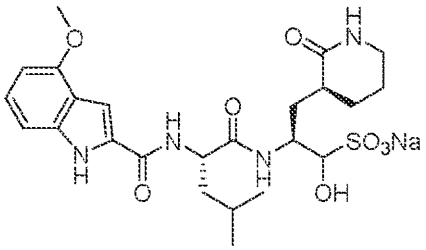
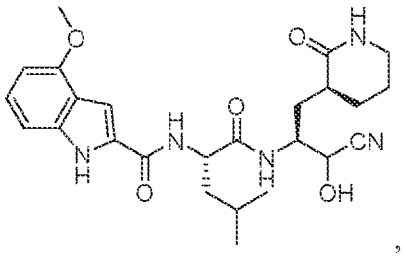

,

,

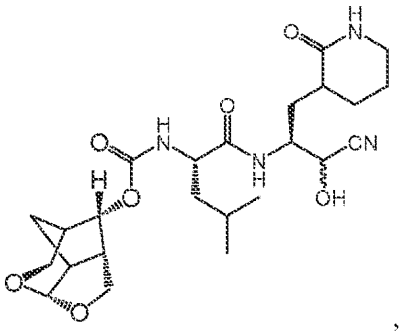
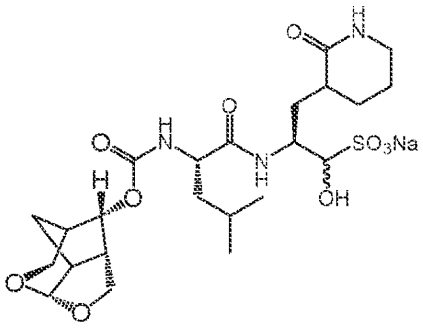
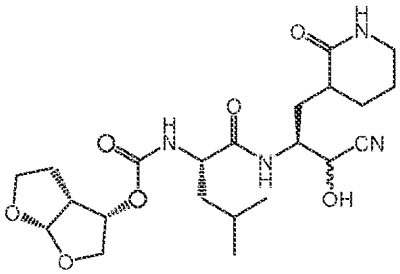
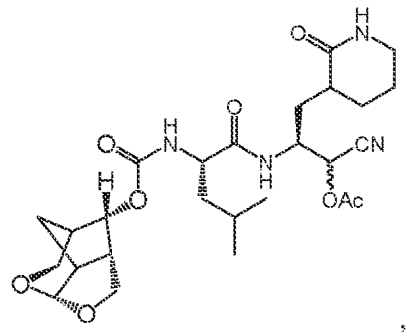
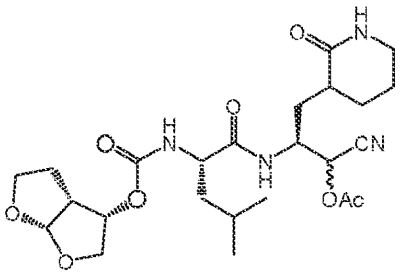
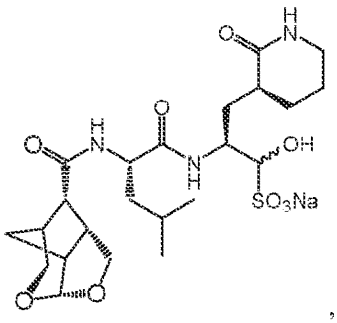
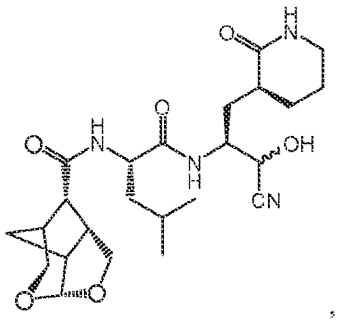
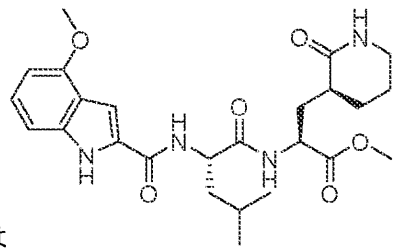

,

,



,もしくは

、またはその薬学的に許容される塩である、化合物；あるいは


,

,


,

,


,

,

,

,

,

,


,もしくは

、またはその薬学的に許容される塩である、化合物。

【請求項２０】

治療有効量の請求項1～19のいずれか一項記載の化合物の1つまたは複数と、少なくとも1つの薬学的に許容される賦形剤とを含む、薬学的組成物。

【請求項２１】

治療有効量の請求項1～19のいずれか一項記載の化合物の1つもしくは複数を含む、患者における重症急性呼吸器症候群を治療するための薬学的組成物であって、例えば、前記重症急性呼吸器症候群がCOVID-19である、薬学的組成物。

【手続補正２】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】００１１

【補正方法】変更

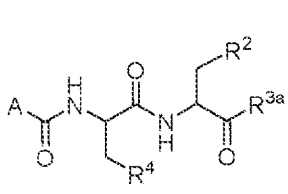
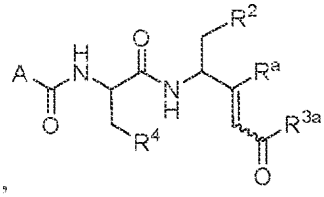
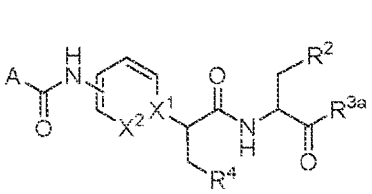
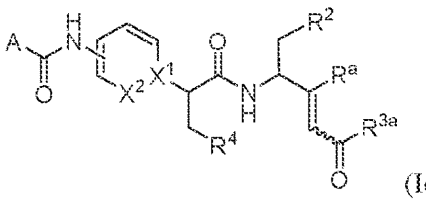
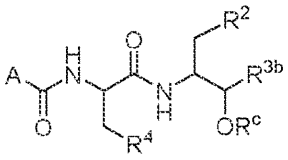
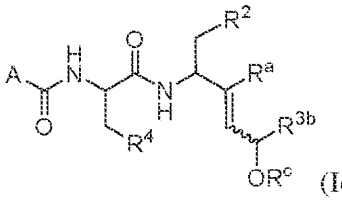
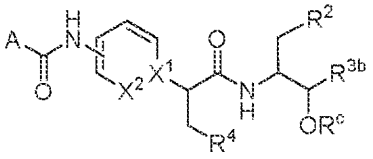
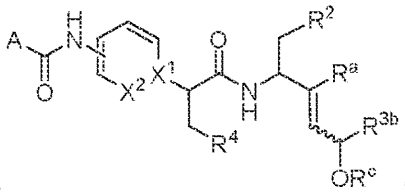
【補正の内容】

【００１１】

本開示は重症急性呼吸器症候群を治療するための方法にも関する。方法は、治療有効量の1つもしくは複数の化合物またはそれを含む薬学的組成物を、その必要のある患者に投与する工程を含む。

[本発明1001]

式(I)、(Ia)、(Ib)、(Ic)、(Id)、(Ie)、(If)、もしくは(Ig)：


(I),

(Ia),

(Ib),

(Ic),

(Id),

(Ie),

(If),もしくは

(Ig)

の化合物であって、

式中、

Aは、-N(R[a])-アルキル、-O-アルキル、ヘテロシクリル、-O-ヘテロシクリル、-O-アルキレン-ヘテロシクリル、-N(R[a])-アルキレン-ヘテロシクリル、-N(R[a])-アリール、-アルキレン-N(R[a])-C(O)-ヘテロシクリル、-アルキレン-N(R[a])-C(O)-O-ヘテロシクリル、もしくは-アルキレン-N(R[a])-C(O)-アルキレン-O-ヘテロシクリルであり；これらのそれぞれは、ハロ、アルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、およびアミノアルキルを含む任意の好適な置換基で置換されていてもよく；

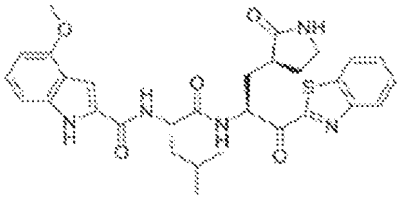
R[2]はヘテロシクロもしくはシクロアルキルであり；

R[3a]は、H、アルキル、アルコキシ、アシル(例えば、C(O)CF$_2$Hを含むフルオロアルキルアシルなどのハロアルキルアシル)、-N(R[b])、アミド(例えば、-C(O)NR$_2$)、アリール、-アルキレン-O(R[d])、ベンズチアゾール(例えば、5-および6-フルオロベンズチアゾールを含むフルオロ置換ベンズチアゾールなどのハロ置換ベンズチアゾール)、ベンゾオキサゾール、ベンゾフラニル、もしくはインドリルであり；

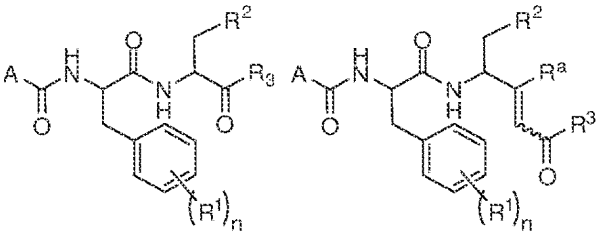
R[3b]はSO$_3$NaもしくはCNであり；

R[4]は、天然アミノ酸側鎖(例えば、アラニン、バリン、イソロイシン、ロイシン、フェニルアラニン、チロシン、およびトリプトファンの側鎖などの疎水性天然アミノ酸側鎖)、非天然アミノ酸側鎖(例えば、ホモアラニン、ノルバリン、ノルロイシン、およびホモノルロイシンの側鎖などの疎水性非天然アミノ酸側鎖)、シクロアルキル、もしくはヘテロシクロであり；

R^aはＨもしくはアルキルであり；
R^cはＨ、アルキル、-Ｃ(Ｏ)-アルキル、-Ｃ(Ｏ)-アルキレン-Ｎ(R^a)$_2$であり；
R^dはＨ、-Ｐ(Ｏ)$_3$(Ｌｉ)$_2$、-Ｐ(Ｏ)$_3$(Ｎａ)$_2$、もしくは-Ｐ(Ｏ)(ＯＨ)$_2$であり；
X^1はＮもしくはＣであり；
X^2はＣＨ、Ｎ、もしくはＣ(Ｏ)であり、ここで、X^1とX^2の間の結合は、単結合であってもよいか、もしくはX^1がＮである場合を除いて二重結合であってもよく；X^1およびX^2のうちの一方のみがＮであってもよく；かつ
ｎは０～３の整数であり；
かつ、
前記化合物が

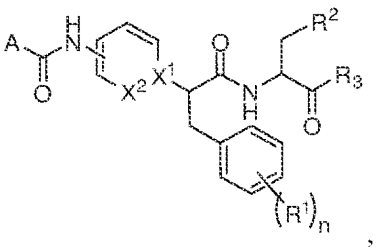


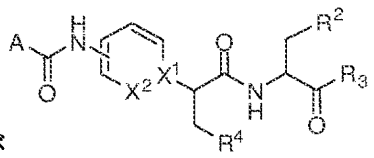
ではない、前記化合物、またはその薬学的に許容される塩。
[本発明１００２]
式(Ｉ)、(Ｉａ)、(Ｉｂ)、および(Ｉｃ)の化合物が、式：



,

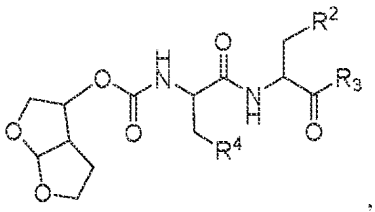
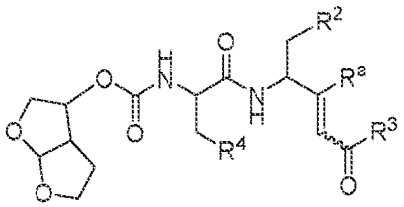
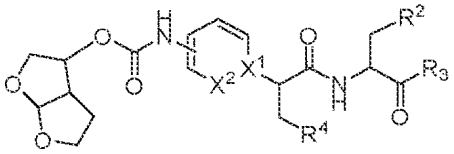
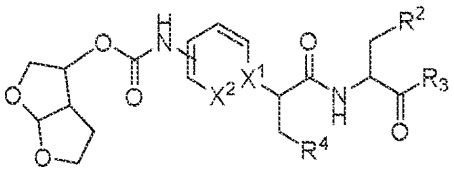
,





,および

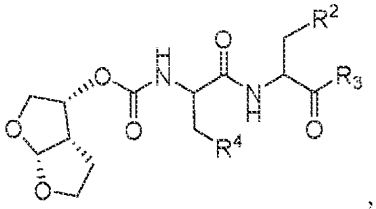
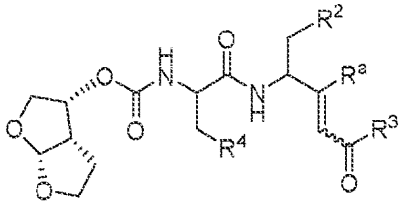
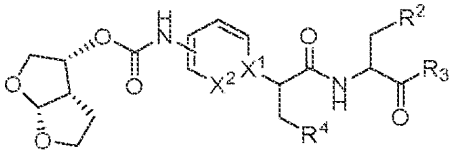
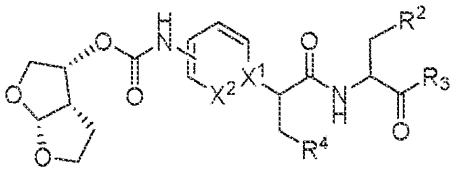
の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。
[本発明１００３]
式(Ｉ)、(Ｉａ)、(Ｉｂ)、および(Ｉｃ)の化合物が、式：


,

,

,
および


の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１００４]

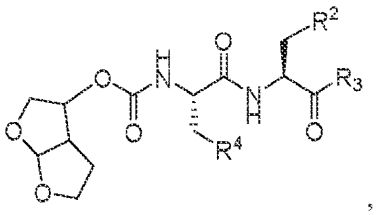
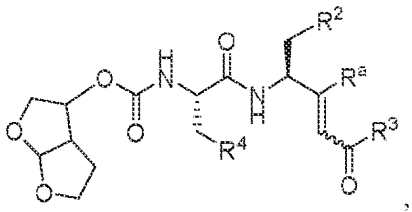
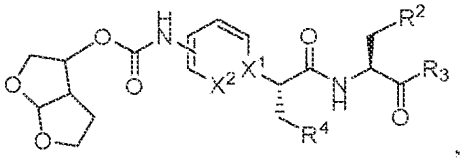
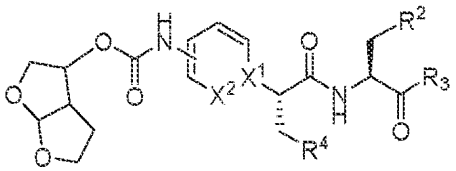
式(I)、(Ia)、(Ib)、および(Ic)の化合物が、それぞれ式：


,

,

,
および


の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１００５]

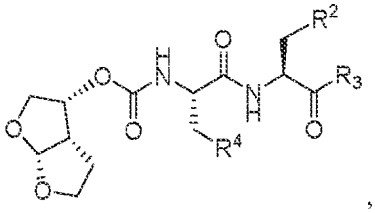
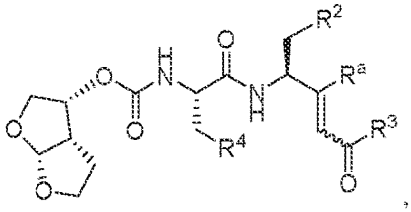
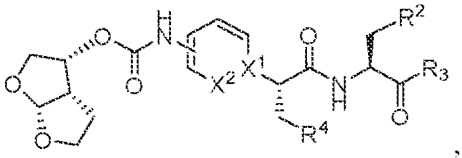
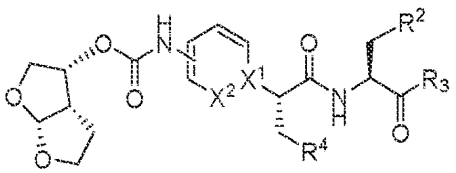
式(I)、(Ia)、(Ib)、および(Ic)の化合物が、それぞれ式：




および


の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１００６]

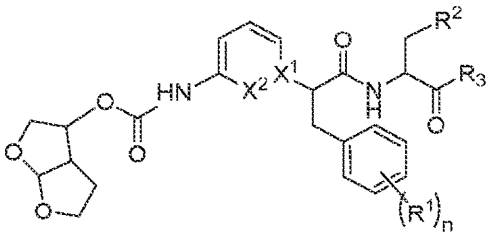
式(I)、(Ia)、(Ib)、および(Ic)の化合物が、それぞれ式：




および


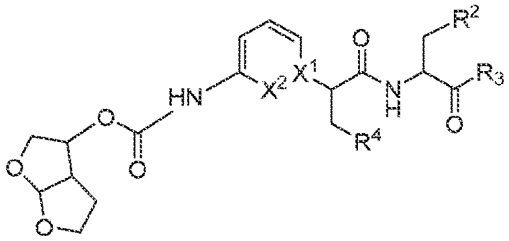
の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１００７]

式(Ib)および(Ic)の化合物が、それぞれ式：



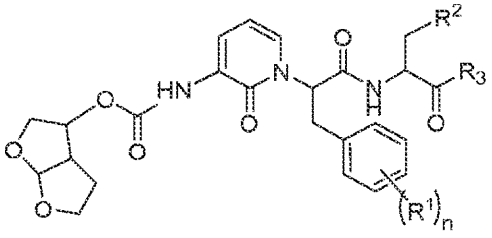
および



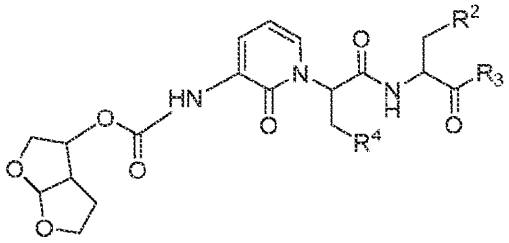
の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１００８]

式(Ib)および(Ic)の化合物が、それぞれ式：



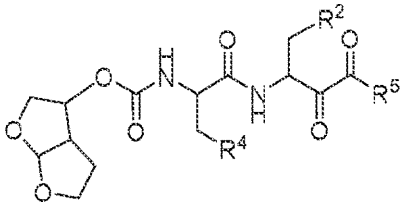
および



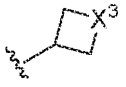
の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１００９]

式(I)の化合物が、式：



の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R^5は、式：

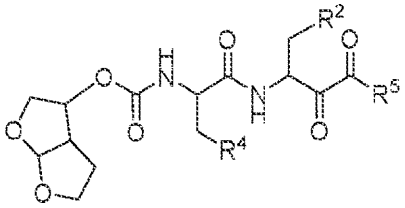


のヘテロシクロ基などのヘテロシクロであって、X^3が結合、CH_2、O、NR^a、もしくは$S(O)_p$であり、ここで、R^aがHもしくはアルキルであり、pが0、1、もしくは2であり、X^3を有する基がさらに置換されていてもよい、前記ヘテロシクロ；チアゾリル；またはベ

ンズチアゾリルである、本発明１００１の化合物。

[本発明１０１０]

式(I)の化合物が、式：



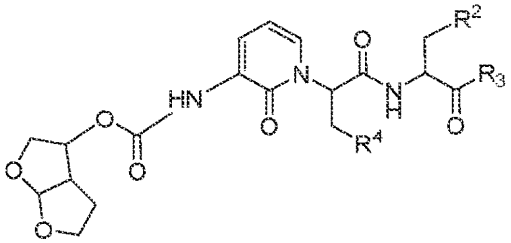
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R^5は、式：



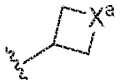
のヘテロシクロ基などのヘテロシクロであって、X^3が結合、CH_2、O、NR^a、もしくは$S(O)_p$であり、ここで、R^aがHもしくはアルキルであり、pが０、１、もしくは２であり、X^3を有する基がさらに置換されていてもよい、前記ヘテロシクロ；チアゾリル；またはベンズチアゾリルである、本発明１００１の化合物。

[本発明１０１１]

式(Ic)の化合物が、式：



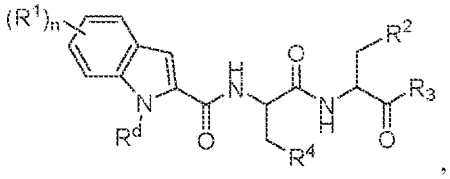
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R^2は、式：

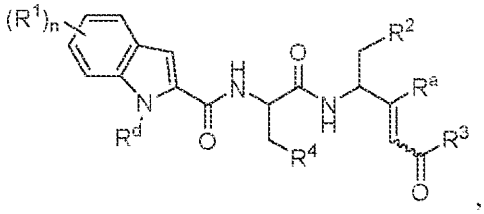


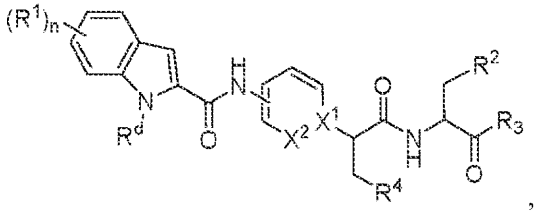
の基であり、式中、X^aは、結合、$(CH_2)_d$(ここで、dは１、２、または３である)、O、NR^a、または$S(O)_p$であり、ここで、R^aはHまたはアルキルであり、pは０、１、または２であり、X^aを有する基はOH、アルコキシ、アミノ、またはアミドでさらに置換されていてもよい、本発明１００１の化合物。

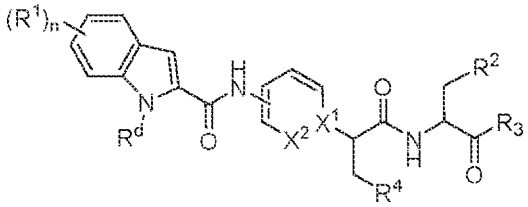
[本発明１０１２]

式(I)、(Ia)、(Ib)、および(Ic)の化合物が、式：


,


,

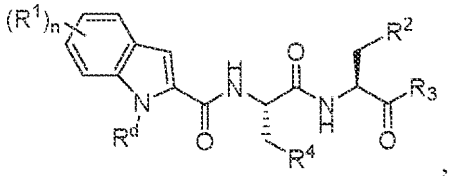

, および

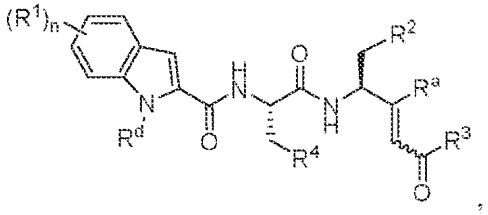


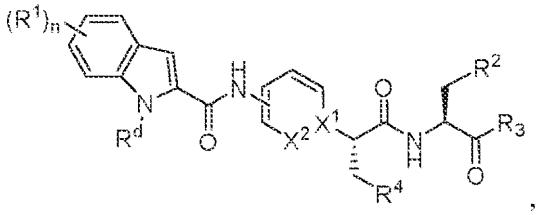
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R^dはH、アルキル、アシル、および$S(O)_pR$であり、ここで、Rはアルキルまたはアリールアルキルである、本発明1001の化合物。

[本発明1013]

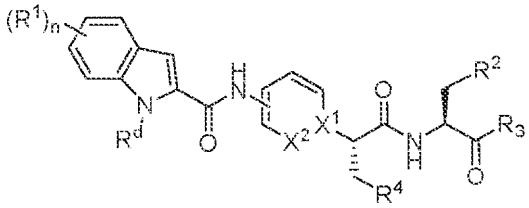
式(I)、(Ia)、(Ib)、および(Ic)の化合物が、それぞれ式：







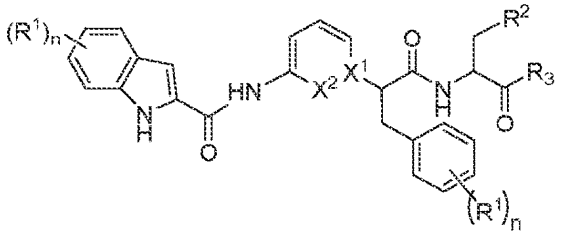
および



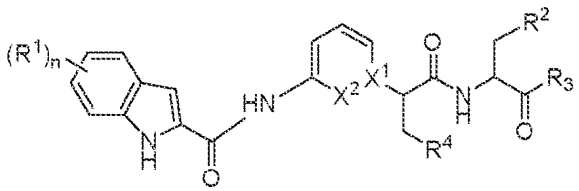
の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１０１４]

式(Ib)および(Ic)の化合物が、それぞれ式：



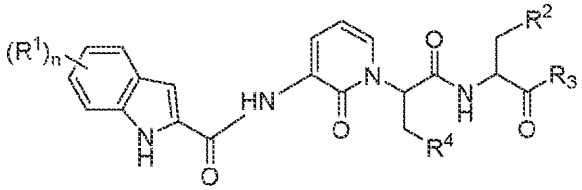
および



の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

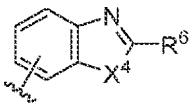
[本発明１０１５]

式(I)の化合物が、式：

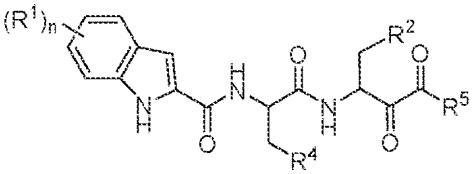


の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

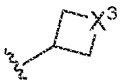
[本発明１０１６]
R^{3a}がベンズチアゾールまたはベンゾオキサゾールである、本発明１００１の化合物またはその薬学的に許容される塩。
[本発明１０１７]
R^{3a}が、式：



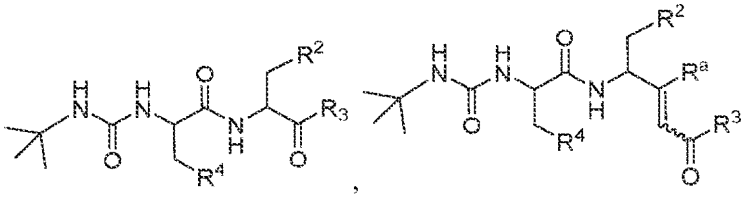
の基であり、
式中、
R^6は、アルキル、アルキルアミノ、シクロアルキルアミノ、シクロアルキルヘテロシクロアミノ、ヘテロシクロシクロアルキルアミノ、もしくはヘテロシクロアミノであり；かつ
X^4はS、O、もしくはNR^7であり、ここで、R^7はH、アルキル、シクロアルキル、もしくはアルキルアリールである、
本発明１０１６の化合物またはその薬学的に許容される塩。
[本発明１０１８]
X^4がSまたはOである、本発明１０１７の化合物またはその薬学的に許容される塩。
[本発明１０１９]
式(I)の化合物が、式：



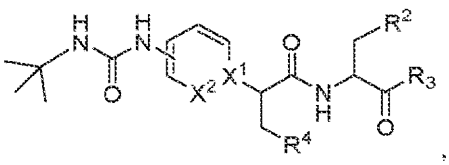
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R^5は、式：

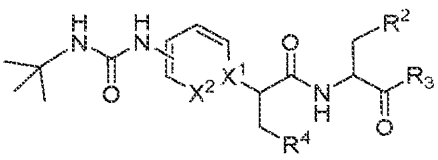


のヘテロシクロ基などのヘテロシクロであって、X^3が、結合、CH_2、O、NR^a、もしくは$S(O)_p$であり、ここで、R^aがHもしくはアルキルであり、pが0、1、もしくは2であり、X^3を有する基がさらに置換されていてもよい、前記ヘテロシクロ;チアゾリル;またはベンズチアゾリルである、本発明１００１の化合物。
[本発明１０２０]
式(I)、(Ia)、(Ib)、および(Ic)の化合物が、それぞれ式：



、

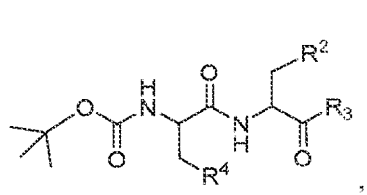
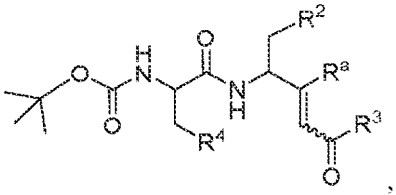
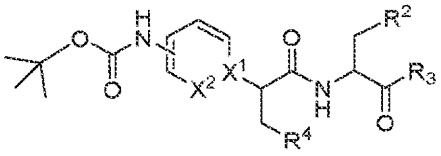
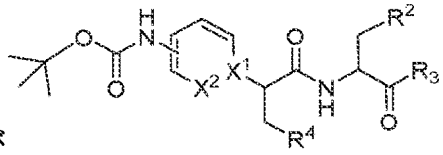




、および

の化合物である、本発明１００１の化合物。
[本発明１０２１]

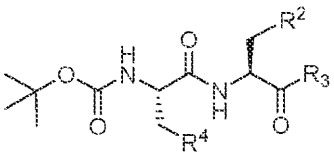
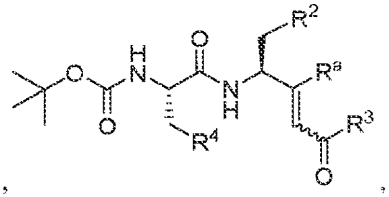
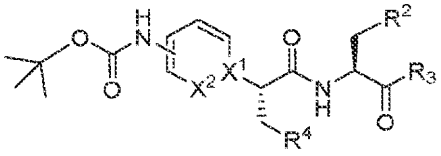
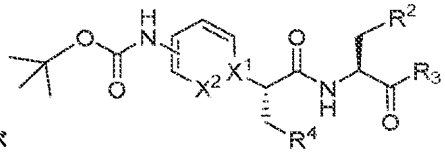
式(I)、(Ia)、(Ib)、および(Ic)の化合物が、それぞれ式：


,

,


, および

の化合物である、本発明1001の化合物。

[本発明1022]

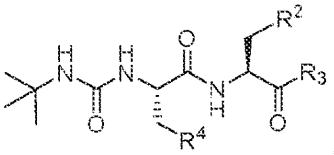
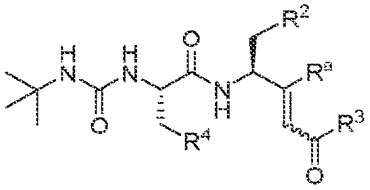
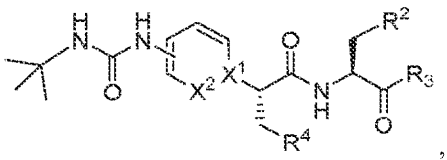
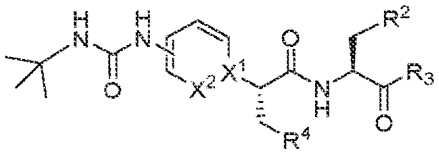
式(I)、(Ia)、(Ib)、および(Ic)の化合物が、それぞれ式：


,

,


, および

の化合物である、本発明1001の化合物。

[本発明1023]

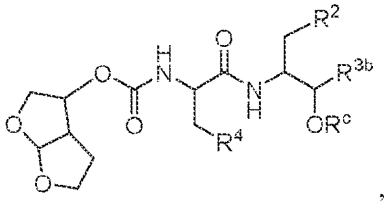
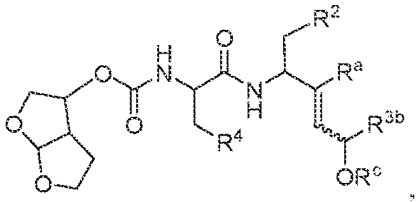
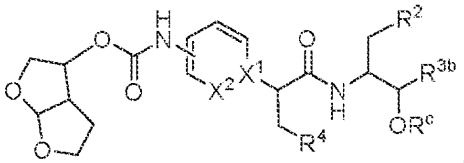
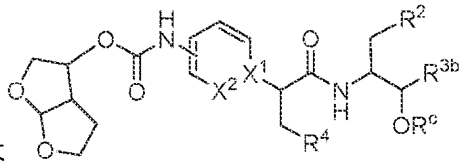
式(I)、(Ia)、(Ib)、および(Ic)の化合物が、それぞれ式：


,

,

, および


の化合物である、本発明1001の化合物。

[本発明1024]

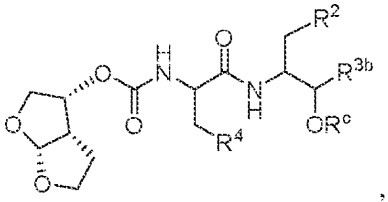
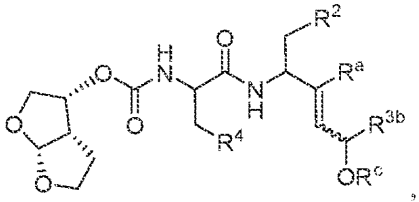
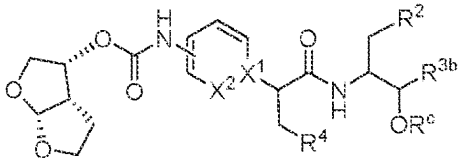
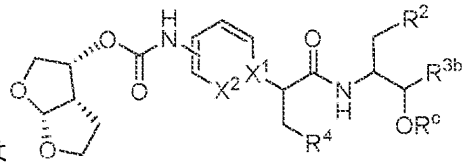
式：


,

,

,もしくは


の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１０２５]

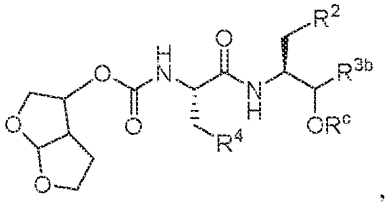
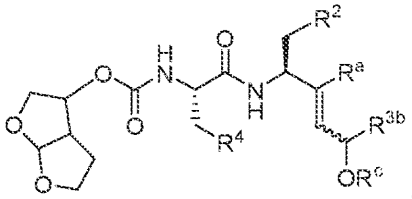
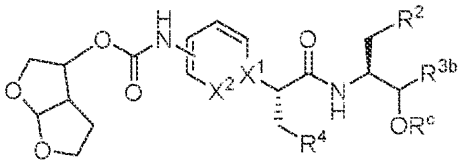
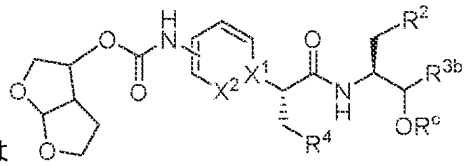
それぞれ式：


,

,

,もしくは


の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１０２６]

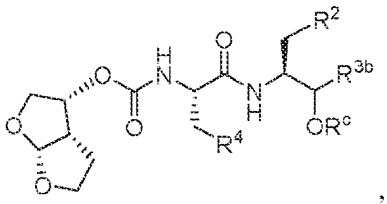
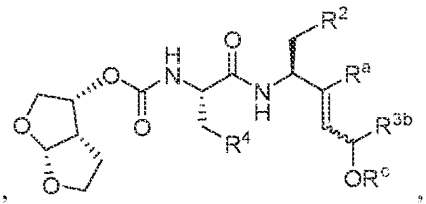
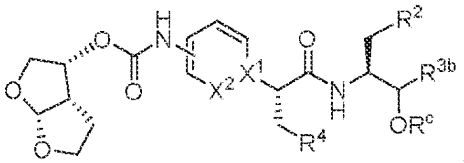
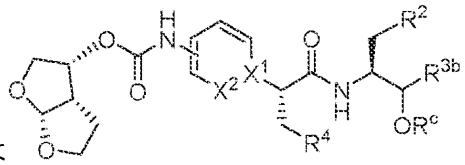
それぞれ式：


,

,

,もしくは


の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１０２７]

それぞれ式：

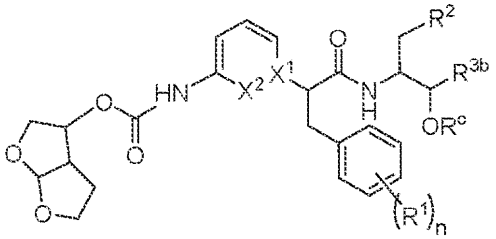





,もしくは

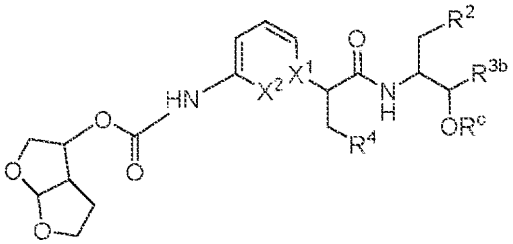
の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１０２８]

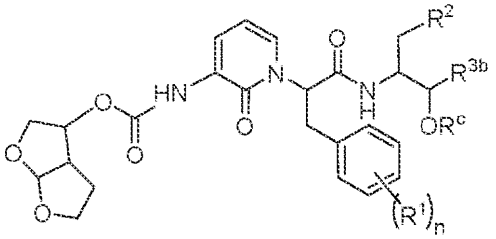
それぞれ式：



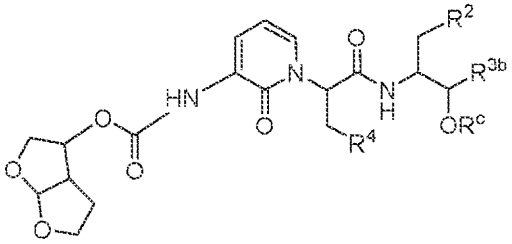
もしくは



の化合物、またはその薬学的に許容される塩、例えば、それぞれ式：



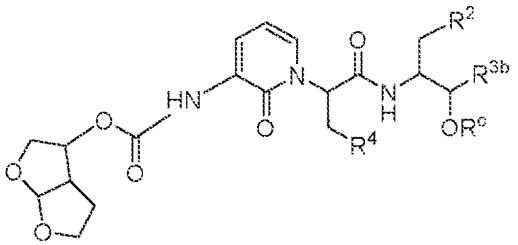
および



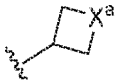
の化合物、またはそれらの薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１０２９]

式：



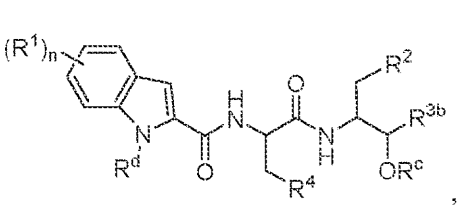
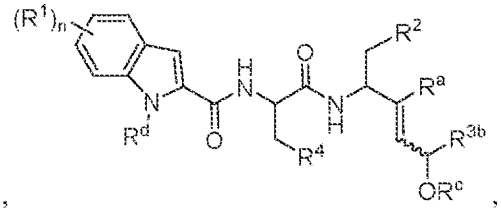
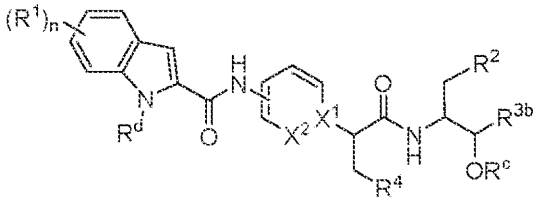
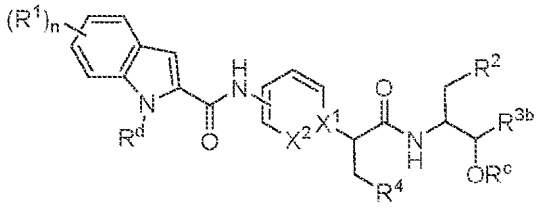
の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R^2は、式：



の基であり、式中、X^aは、結合、$(CH_2)_d$(ここで、dは1、2、または3である)、O、NR^a、または$S(O)_p$であり、ここで、R^aはHまたはアルキルであり、pは0、1、または2であり、X^aを有する基はOH、アルコキシ、アミノ、およびアミドなどの置換基でさらに置換されていてもよい、本発明1001の化合物。

[本発明1030]

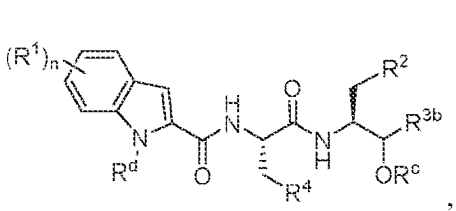
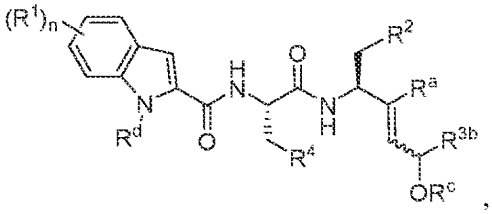
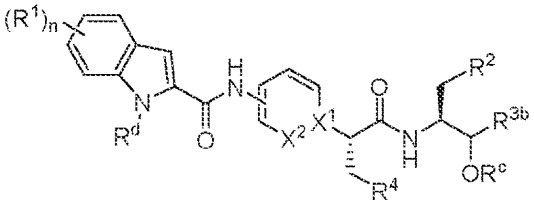
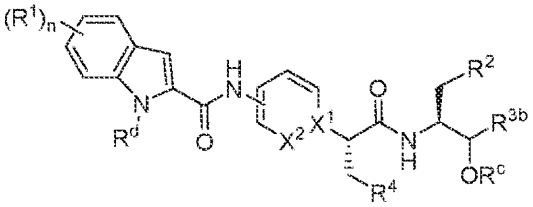
式：


,

,

,もしくは


の化合物、またはその薬学的に許容される塩であり、式中、R^dは、H、アルキル、アシル(例えば、C(O)R、ここで、Rは本明細書において定義されている)、および$S(O)_pR$(ここで、Rは本明細書において定義されている)である、本発明1001の化合物。

[本発明1031]

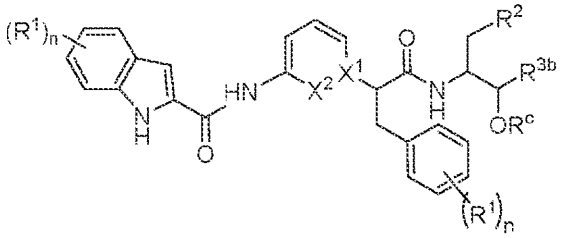
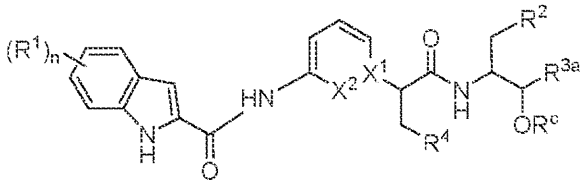
それぞれ式：


,

,

,もしくは


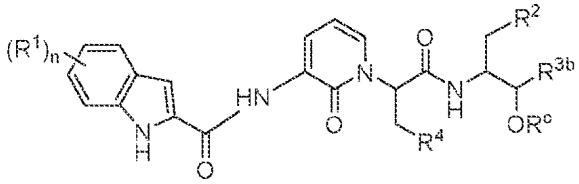
の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１０３２]

式：


もしくは


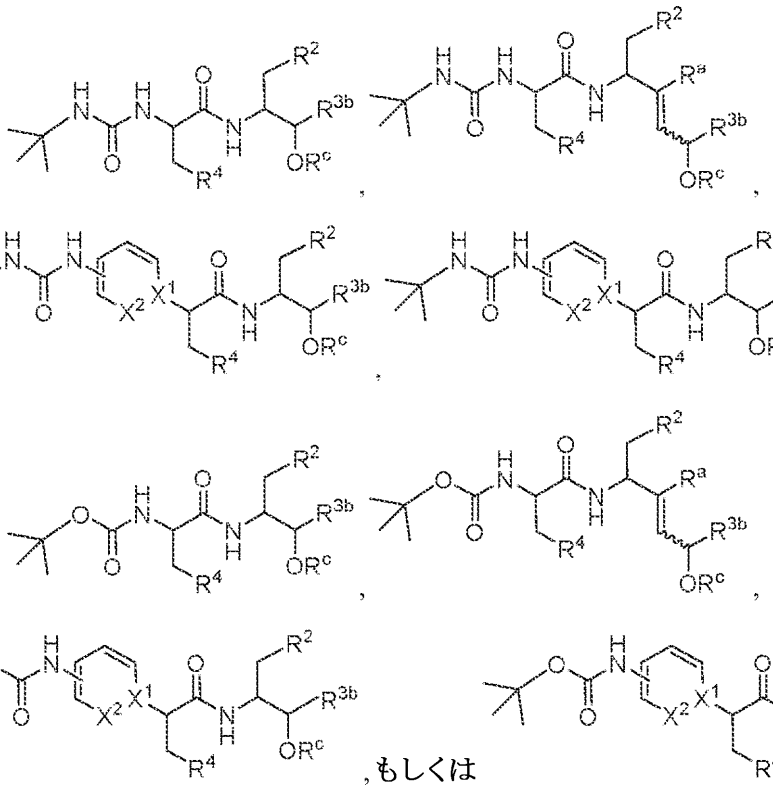
の化合物、またはその薬学的に許容される塩、例えば、式：



の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１０３３]

式：

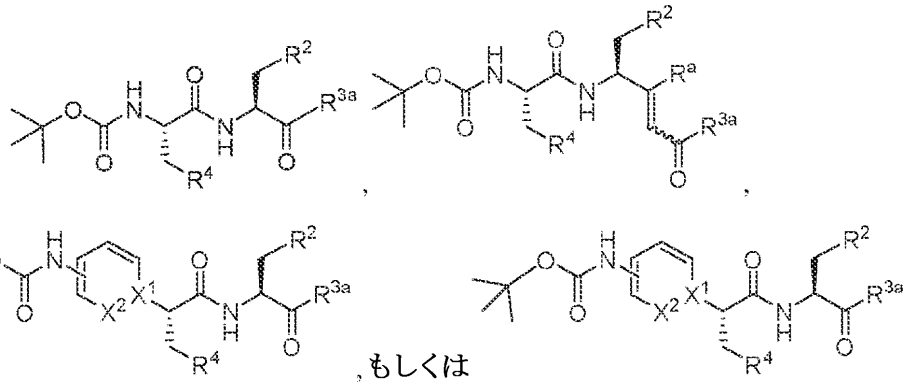


,もしくは

の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１０３４]

それぞれ式：

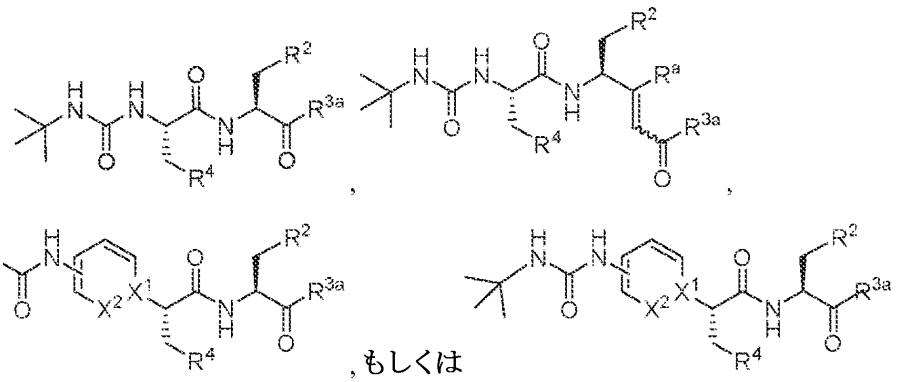


,もしくは

の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１０３５]

それぞれ式：

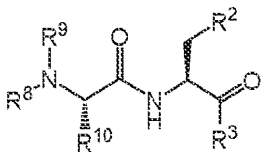


,もしくは

の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１０３６]

式(II)：



の化合物であって、

式中、

R^2はヘテロシクロであり；

R^{3a}は、アルキル、アルコキシ、アシル、アミド、アリール、ベンズチアゾール、ベンゾオキサゾール、ベンゾフラニル、もしくはインドリルであり；

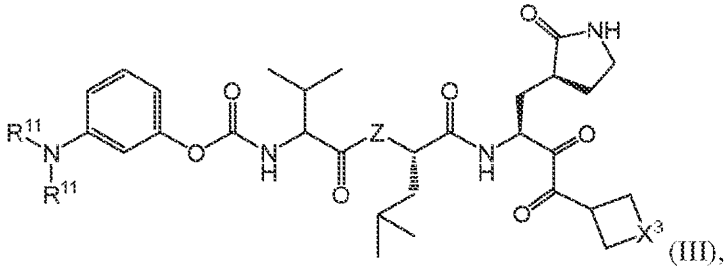
R^8およびR^9は、独立してHもしくはアルキルであるか；またはそれらが結合する窒素原子と一緒になってヘテロシクリル基を形成してもよく；かつ

R^{10}はアルキルもしくはアルケニルである、

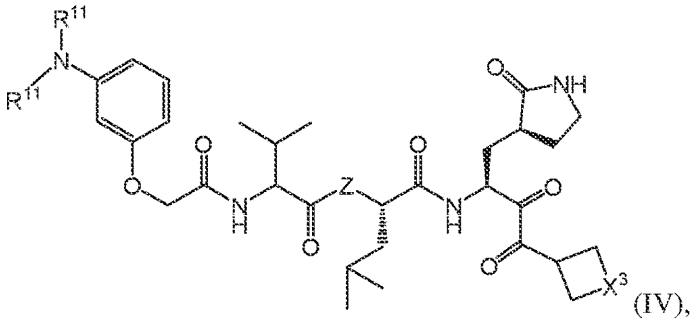
前記化合物、またはその薬学的に許容される塩。

[本発明１０３７]

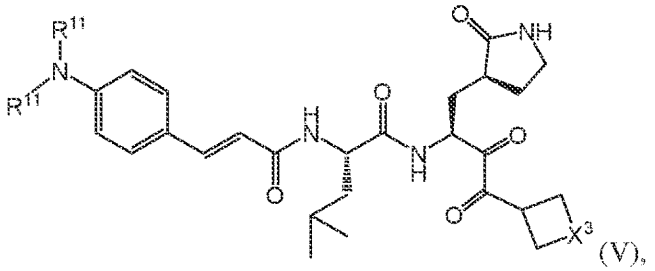
式(III)～(X)：



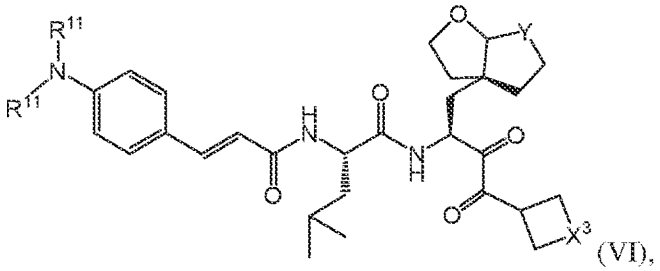
(III),



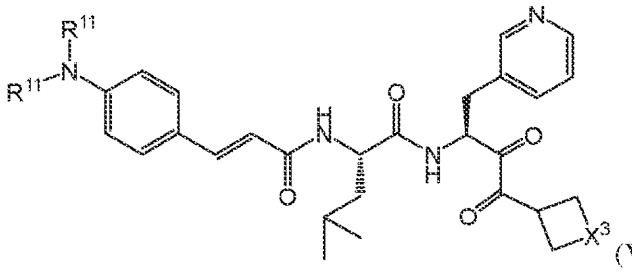
(IV),

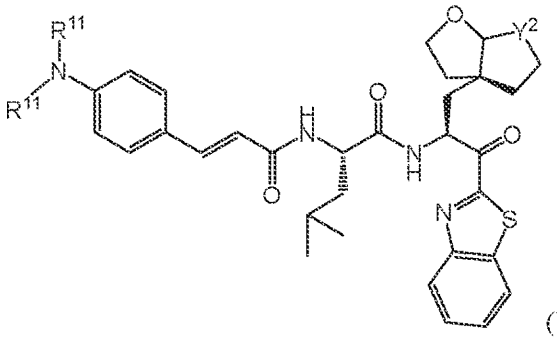


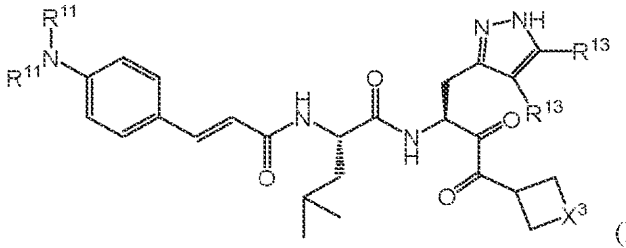
(V),

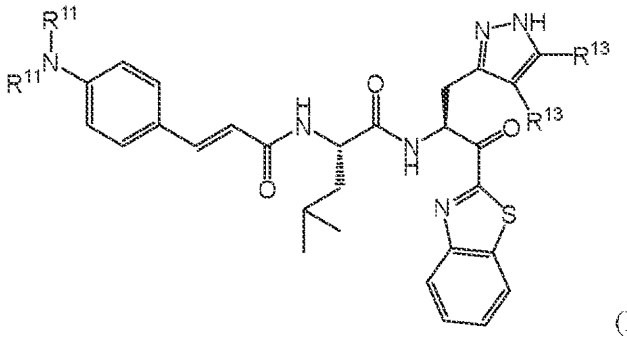


(VI),


(VII),


(VIII),


(IX), および


(X)

の化合物であって、

式中、

各R^{11}はH、アルキルであるか、もしくは各R^{11}はそれが結合する窒素原子と一緒になってヘテロシクリル基を形成し；

R^{12}はH、アミノ、OH、もしくはアルコキシであり；

R^{13}はH、アルキル、アミノであるか、または2つの隣接するR^{13}基はそれらが結合する炭素原子と一緒になって5もしくは6員アリールもしくはヘテロアリール基を形成し；

Y^2はOもしくはNR^aであり；

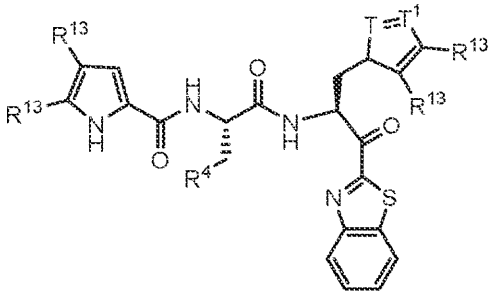
ZはNRaもしくはアルキルであり；かつ

R^aはHもしくはアルキルである、

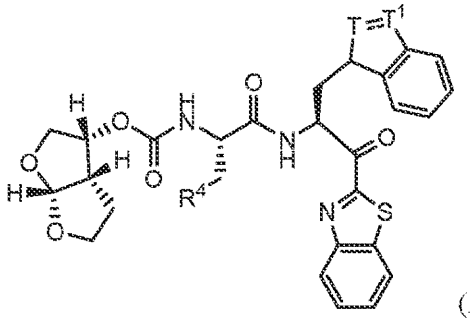
前記化合物、またはその薬学的に許容される塩。

[本発明1038]

式(XI)～(XII)：

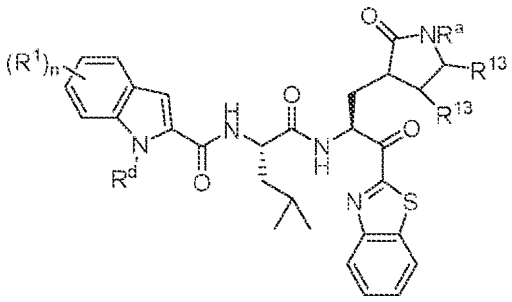


(XI); および

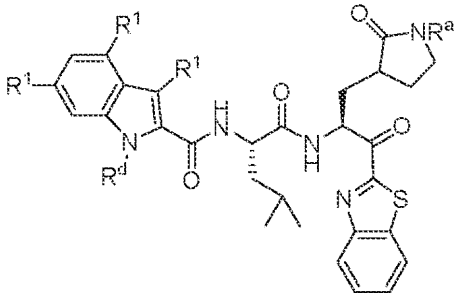


(XII)

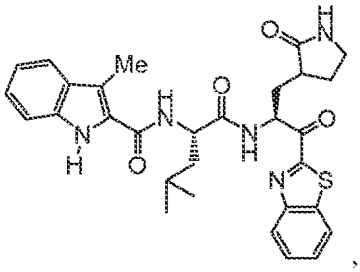
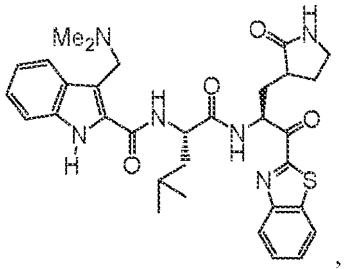
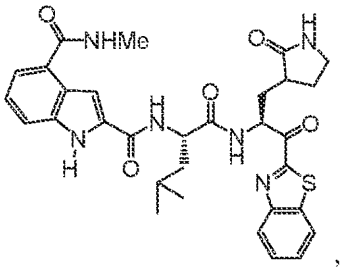
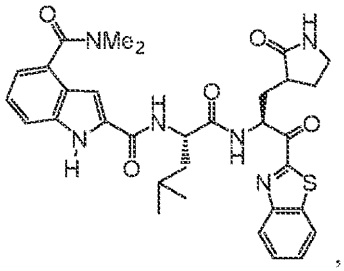
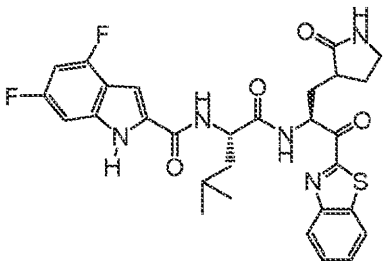
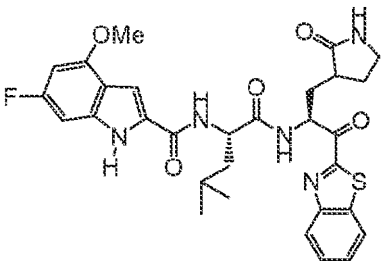
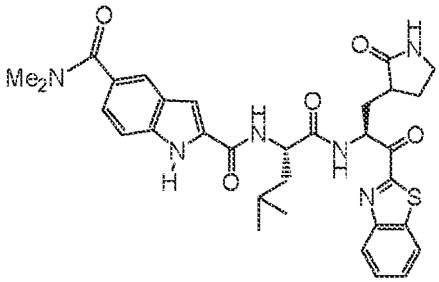
の化合物であって、
式中、
破線は単結合もしくは二重結合であり；
TおよびT[1]はそれぞれ独立してNR[a]もしくはC(O)であり；かつ
R[a]はHもしくはアルキルである、
前記化合物、またはその薬学的に許容される塩。
[本発明1039]
式：



の化合物である、本発明1001の化合物。
[本発明1040]
式：

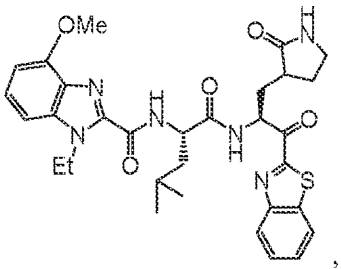
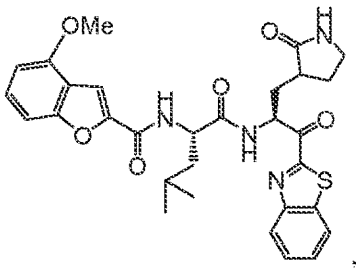
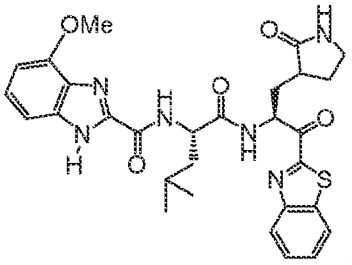
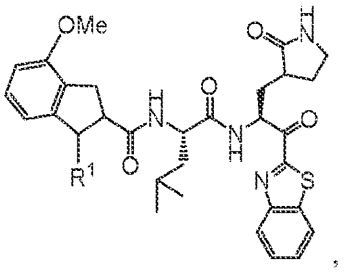
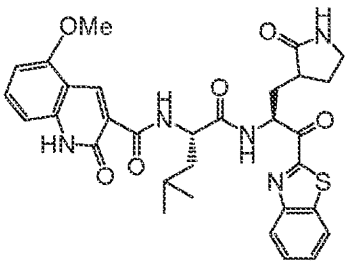
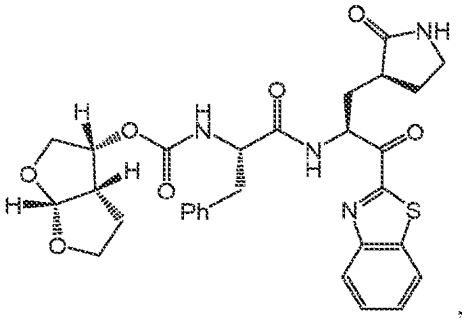
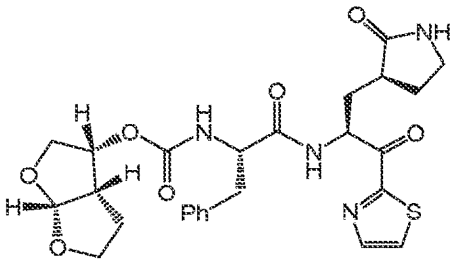


の化合物であり、式中、R[a]はHまたはアルキルである、本発明1001の化合物。
[本発明1041]
式：


,

,

,

,

,

, もしくは


の化合物、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１０４２]


,

,

,

,

,

,

,

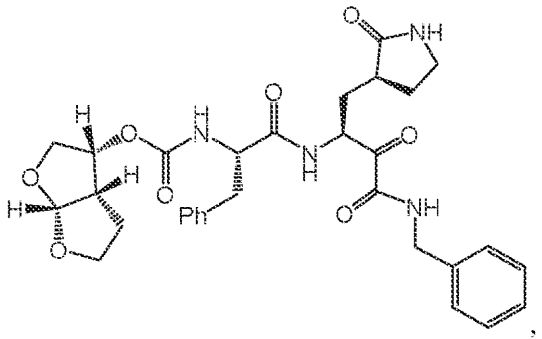
10

20

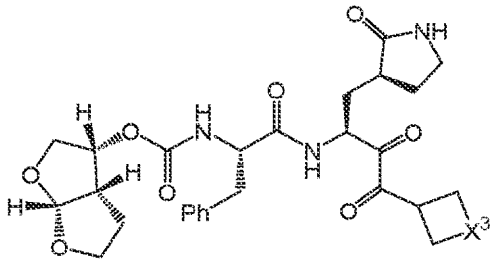
30

40

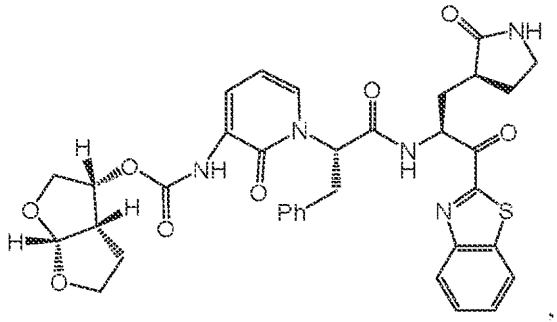
50



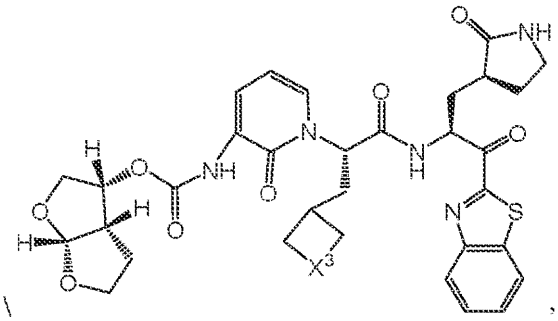
、



、

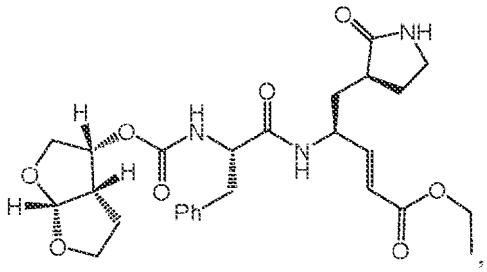


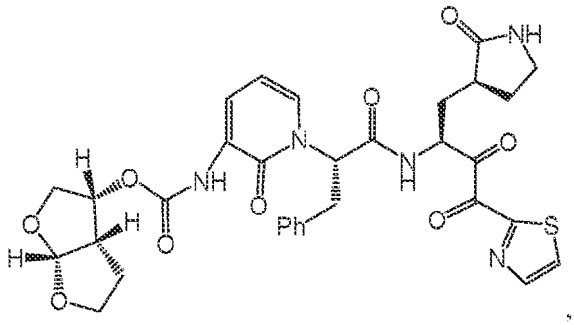
、

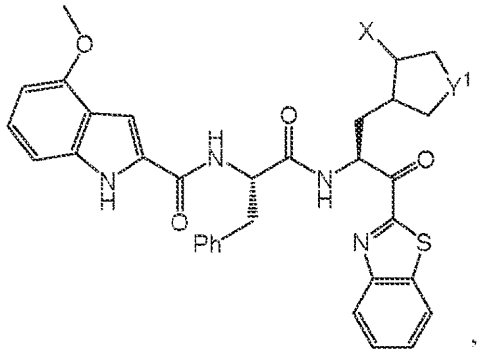


、

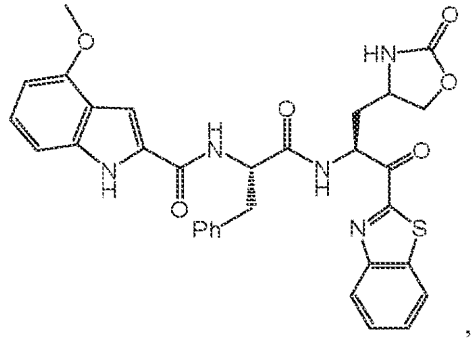
上記式中、X^3は結合、CH_2、O、NR^a、もしくは$S(O)_p$であり、ここで、R^aはHもしくはアルキルであり、pは0、1、または2であり、X^3を有する基は、さらに置換されていてもよいか；チアゾリルであってもよいか；またはベンズチアゾリルであってもよい；

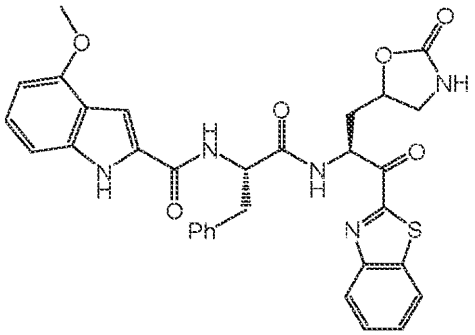


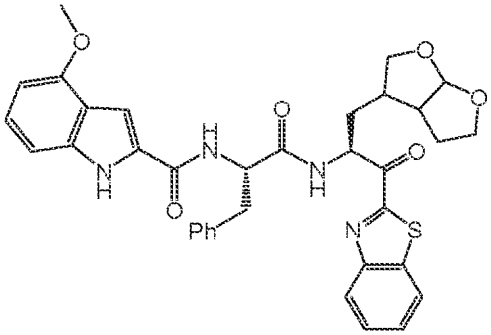


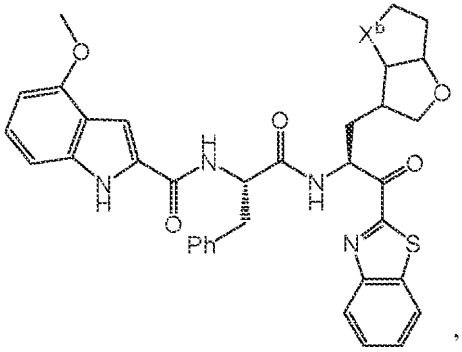


上記式中、Y^1はCH_2、O、もしくはNHであり、かつXはOH、OCH_3、NH_2、もしくは$NHCH_3$である；

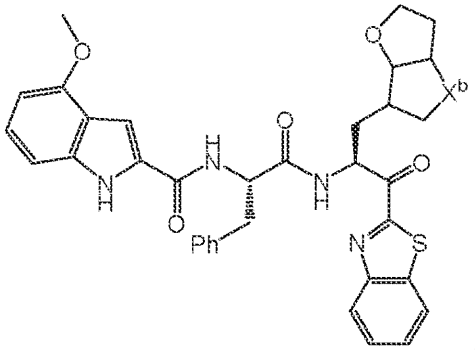

,

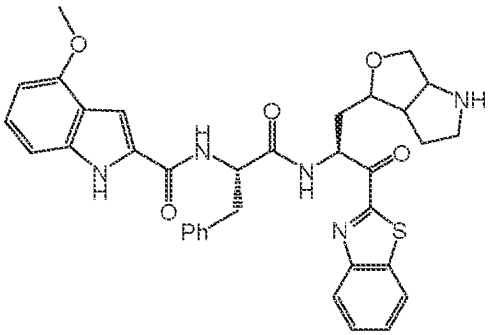


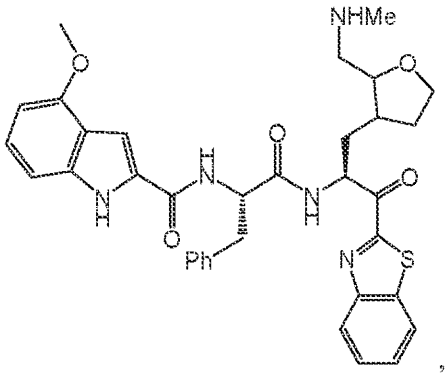

,

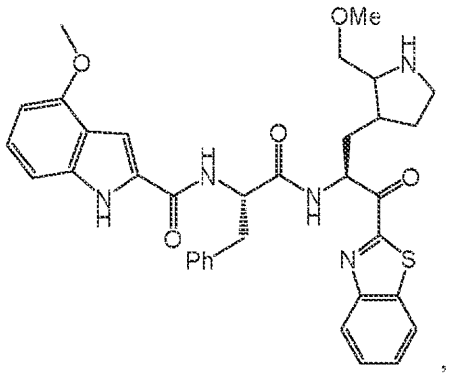

,

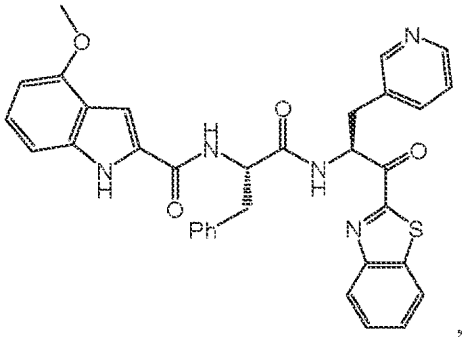
上記式中、X^bはOもしくはNR^aであり、かつR^aはHもしくはアルキルである；

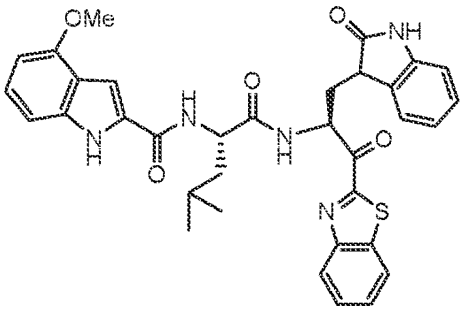

,


,

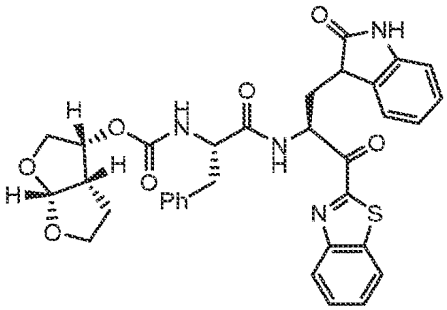

,


,

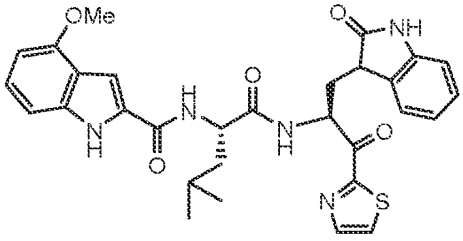

,



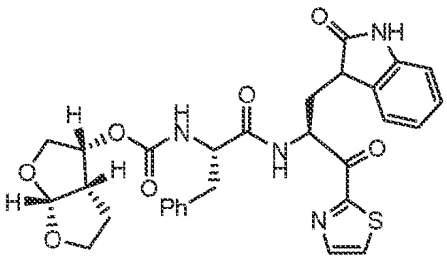
,



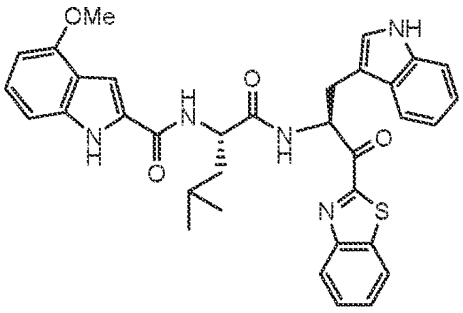
,



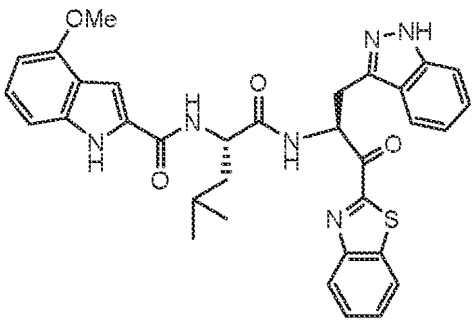
,



,

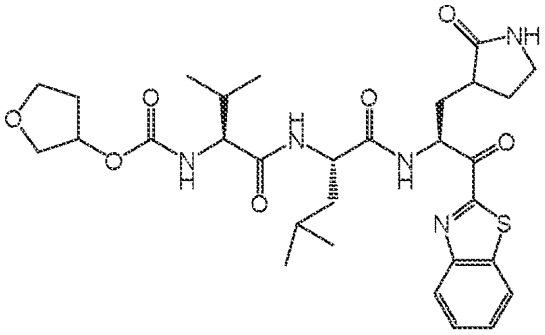


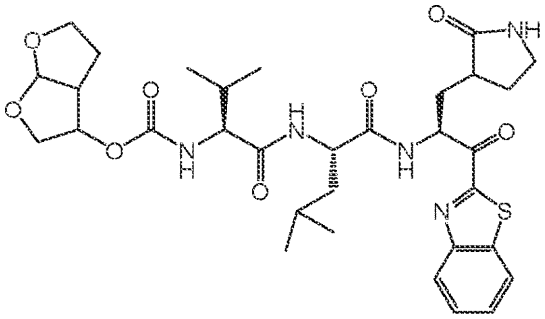
,もしくは

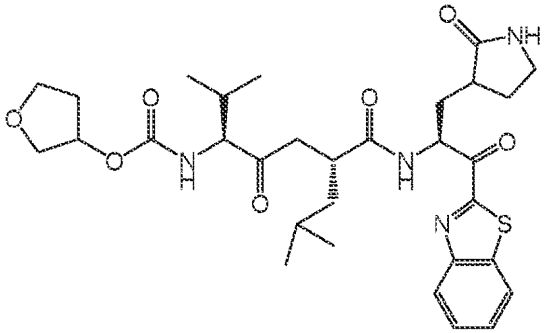


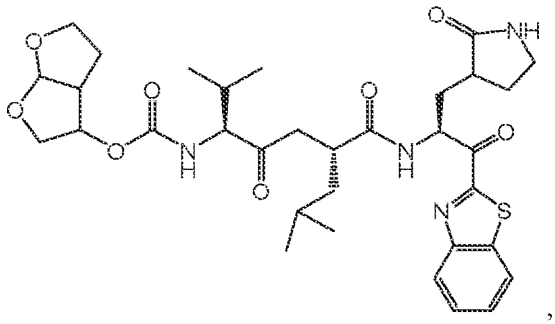
、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

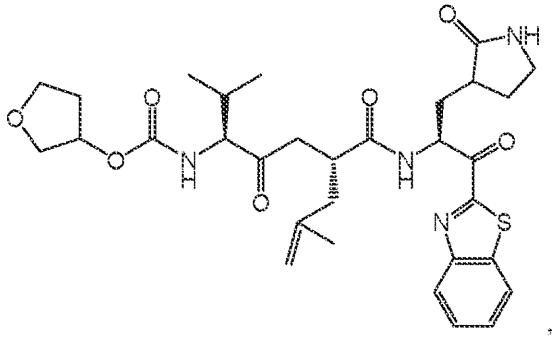
[本発明１０４３]

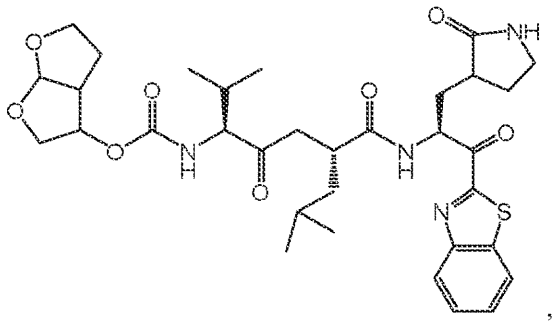

,

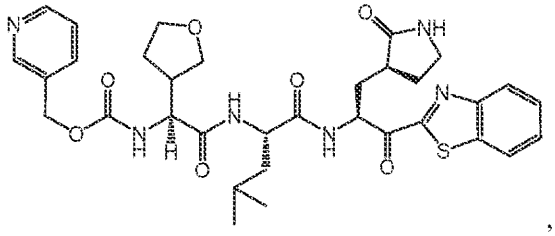

,

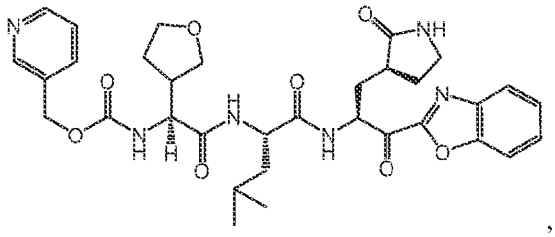

,

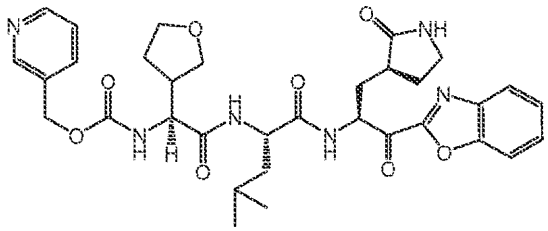

,

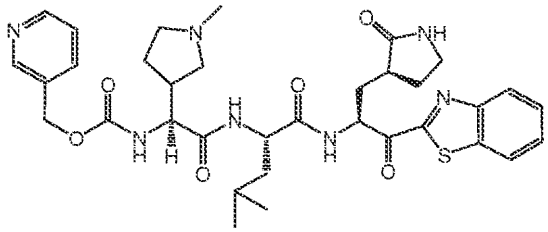

,

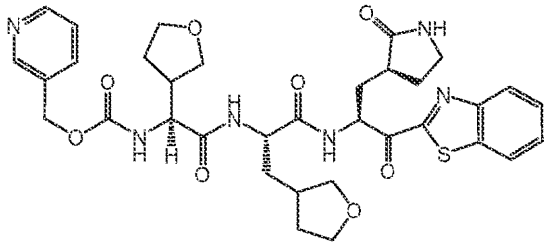

,

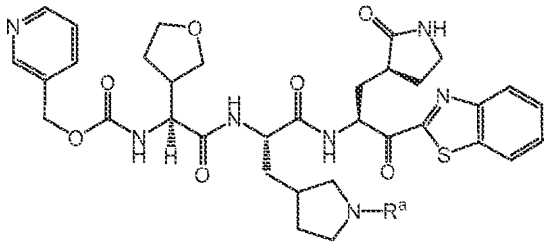

,

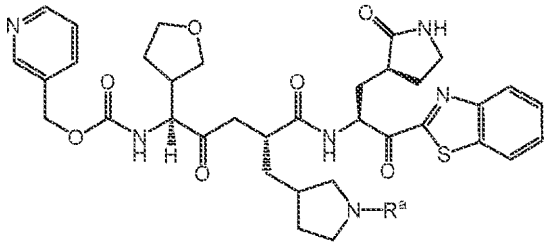

,

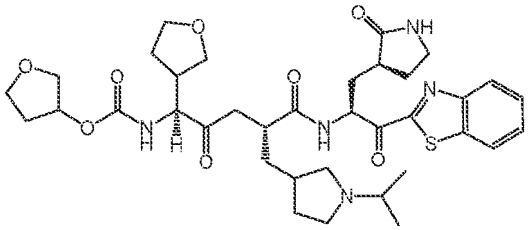

,

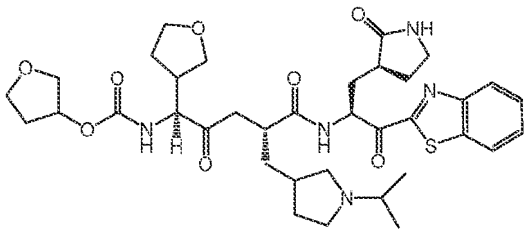

,

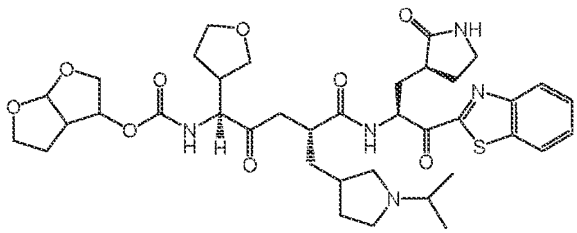

,

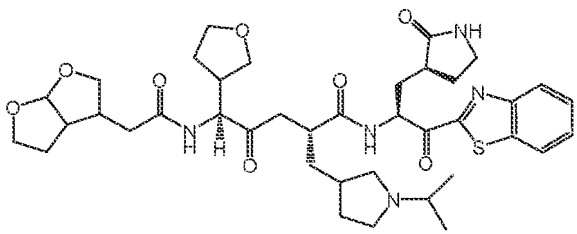

,

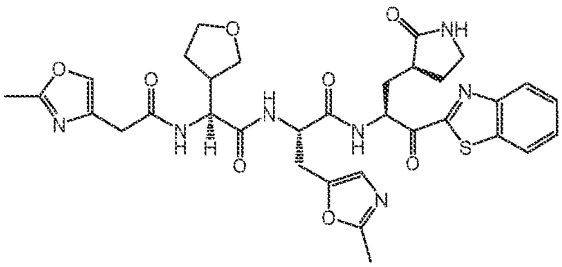

,

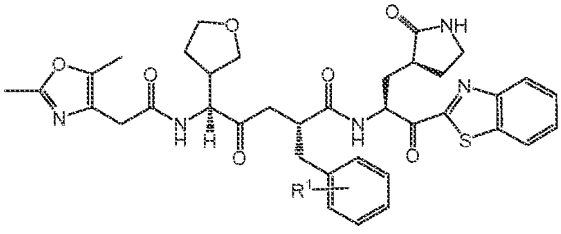

,


,

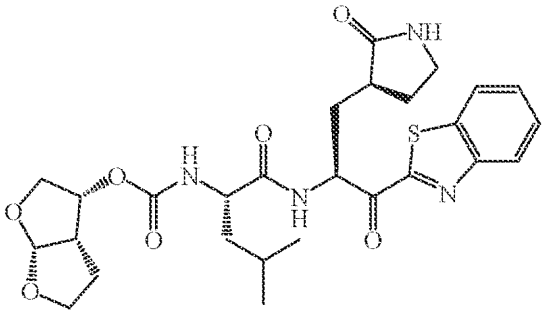
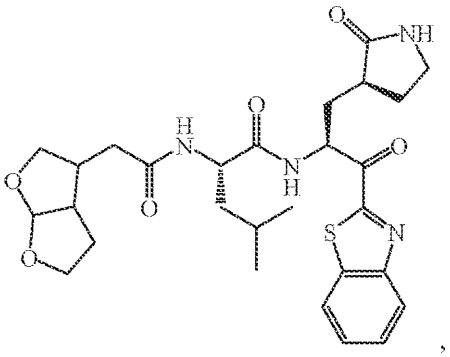
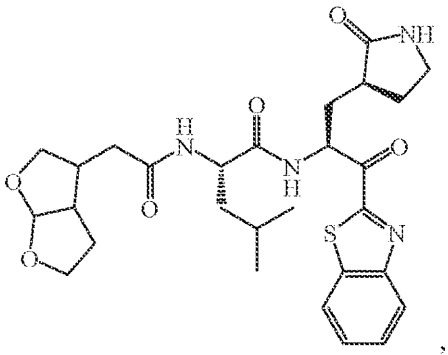
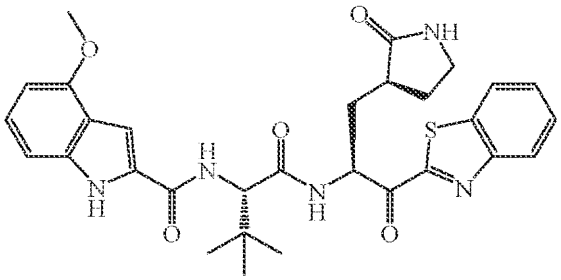
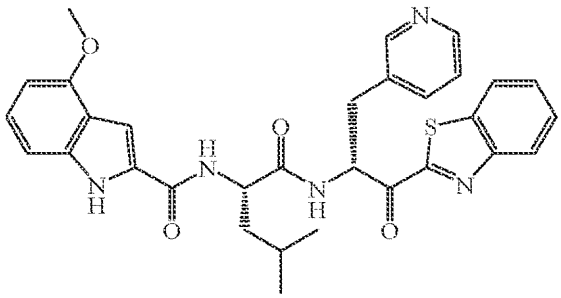

,

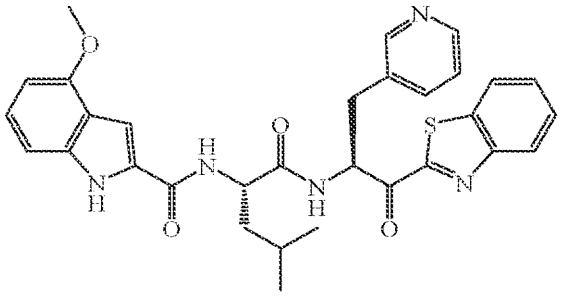

,


,もしくは

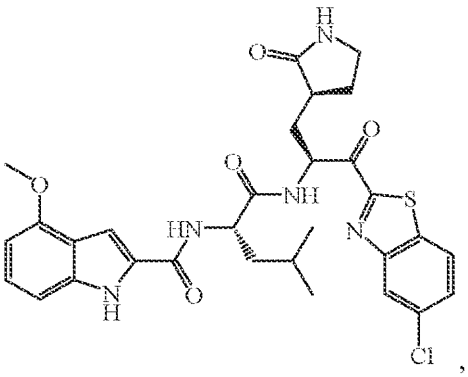


、またはその薬学的に許容される塩であり、
式中、
R^aはHまたはアルキルであり；かつ
各R^1は独立してアルキルまたはアルコキシである、
本発明１００１の化合物。
[本発明１０４４]

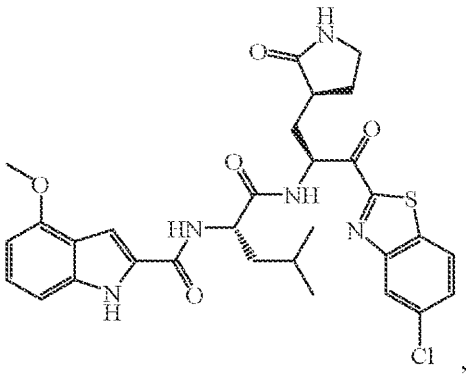

,

,

,

,

,



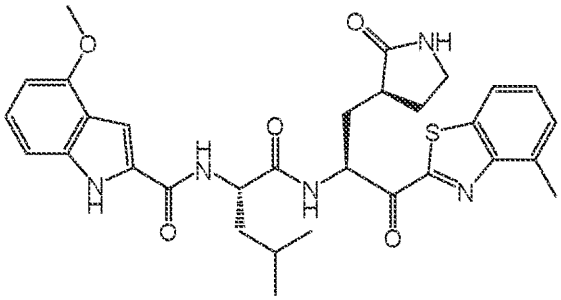
,



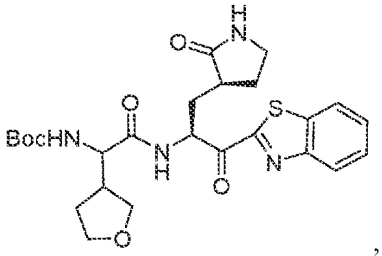
,



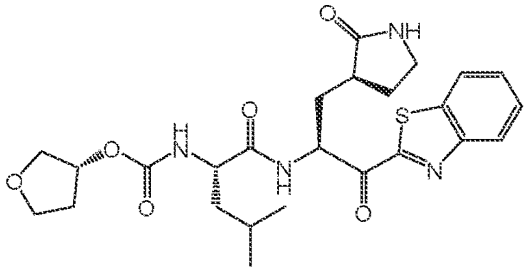
,



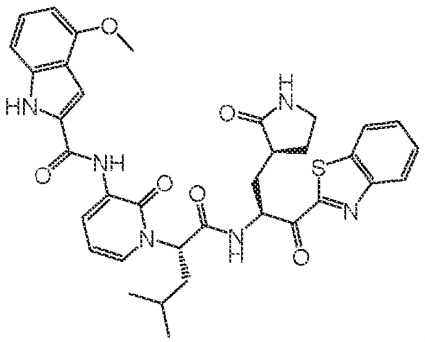
,


BocHN
H
N
O
S
N
O

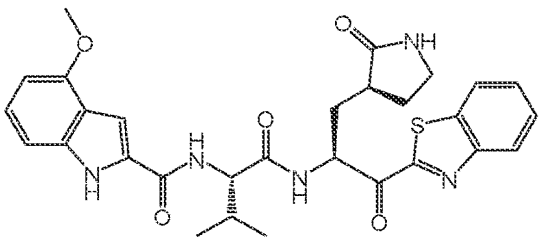
,


O
NH
O
O
H
N
O
N
H
S
N
O

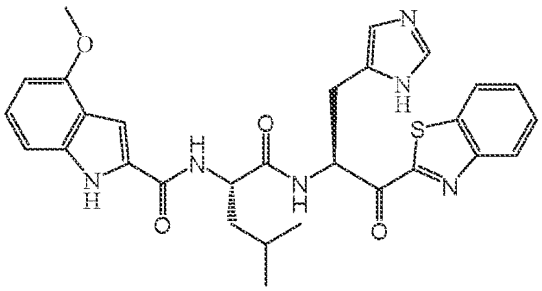
,


O
HN
H
O
NH
O
O
N
O
N
H
S
N
O

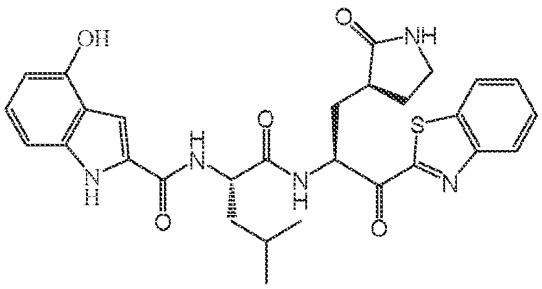
,


O
O
NH
H
N
N
H
O
N
H
S
N
O

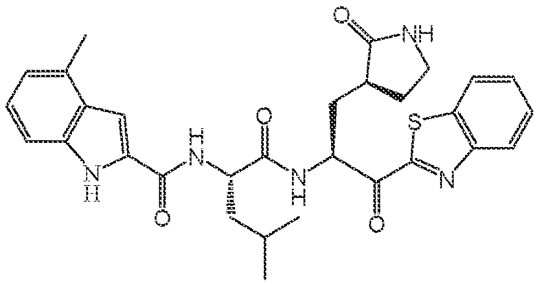
,


O
N
H
N
H
O
H
N
O
N
H
S
N
O

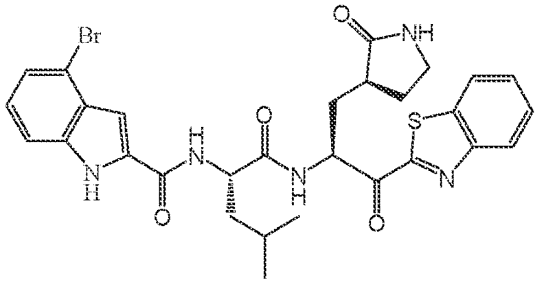
,


OH
O
NH
H
N
N
H
O
N
H
S
N
O

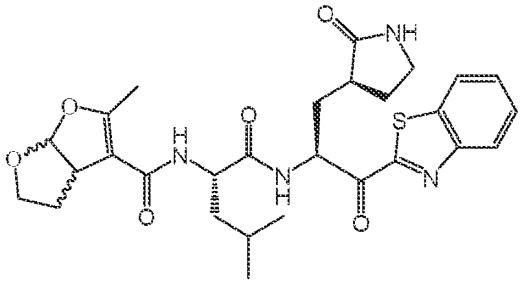
,



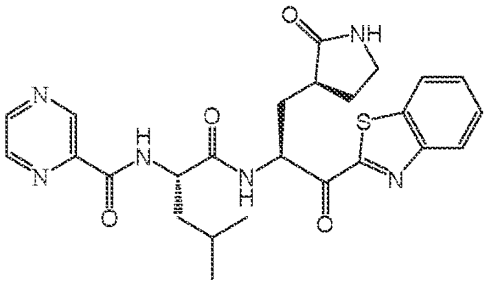
,



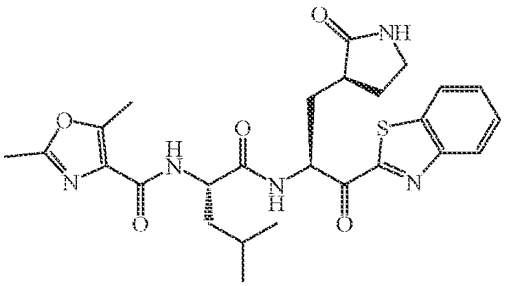
,



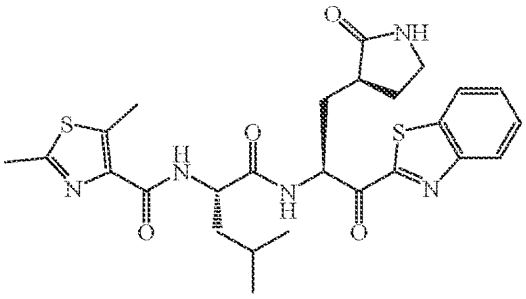
,



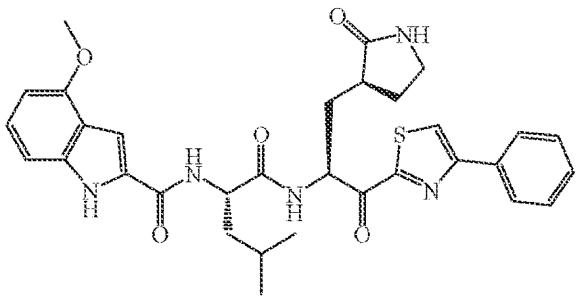
,



,

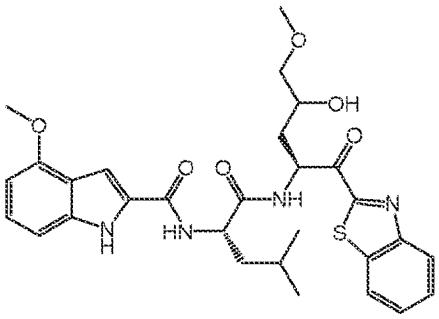


、



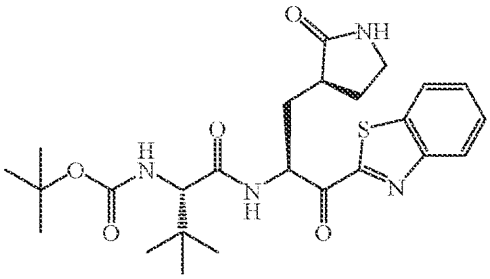
、

もしくは

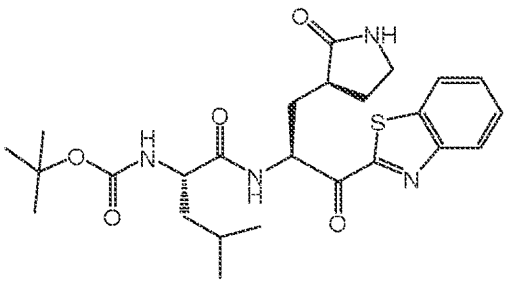


、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

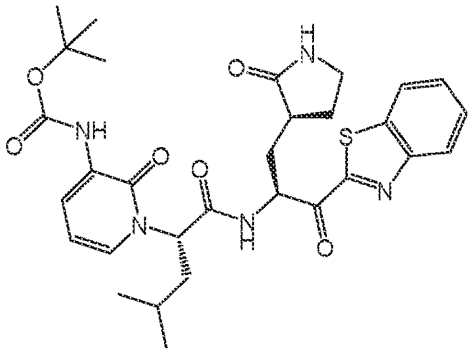
[本発明１０４５]

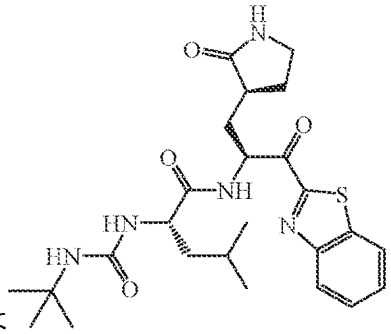


、



、

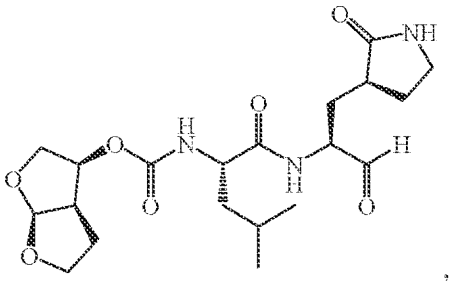
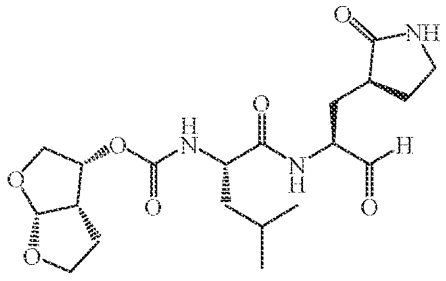


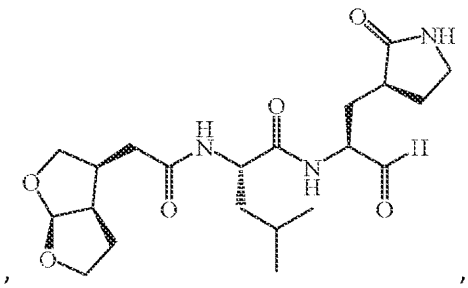
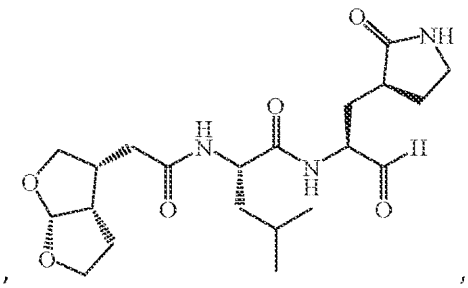


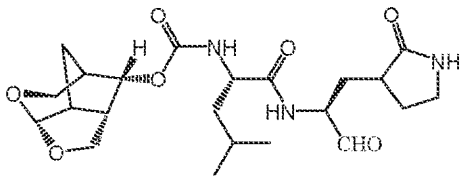
、もしくは

、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

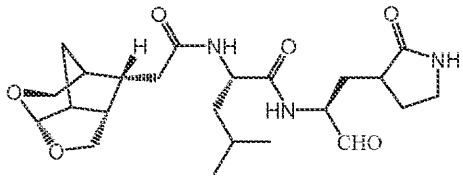
[本発明１０４６]


,

,


,

,

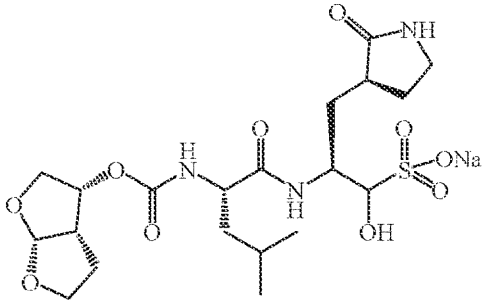


もしくは

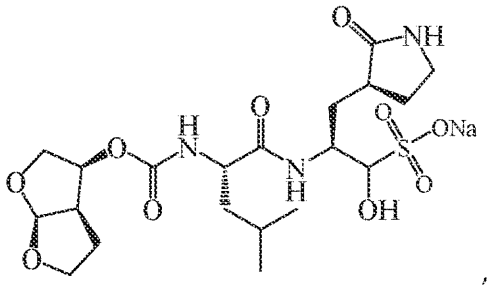


、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

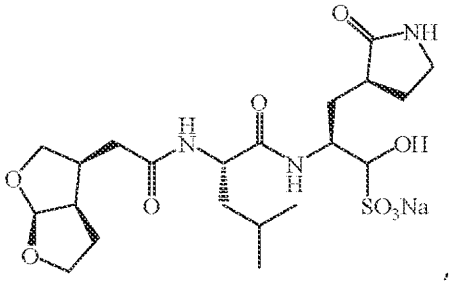
[本発明１０４７]



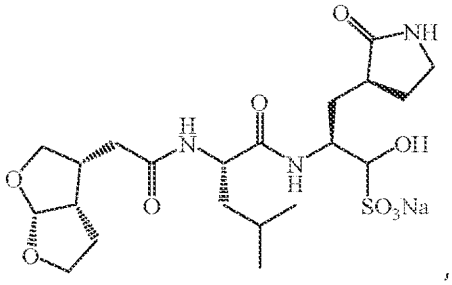
、



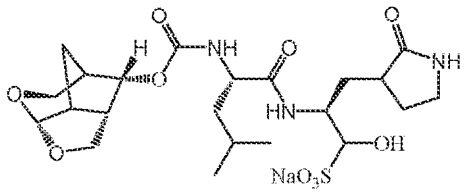
、



、

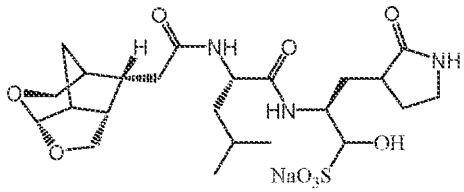


、



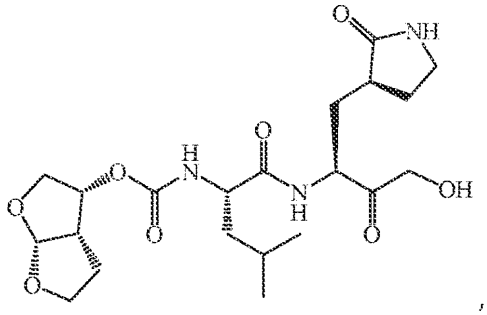
、

もしくは

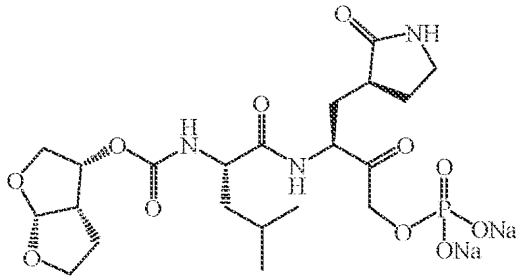


、または<u>その薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。</u>

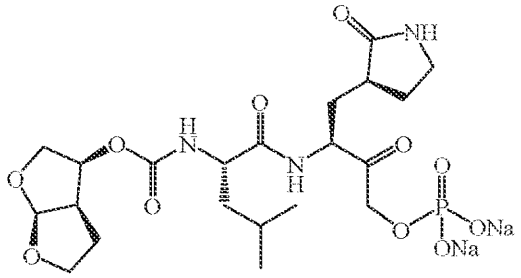
<u>[本発明１０４８]</u>



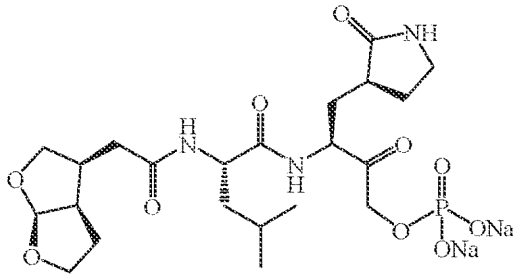
,



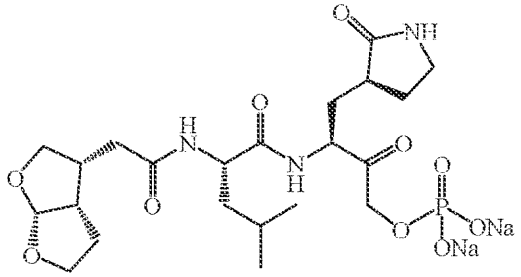
,



,

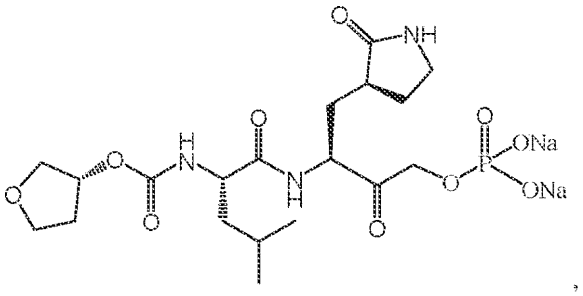


,

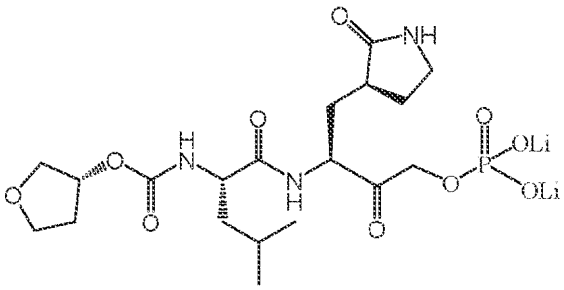


、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

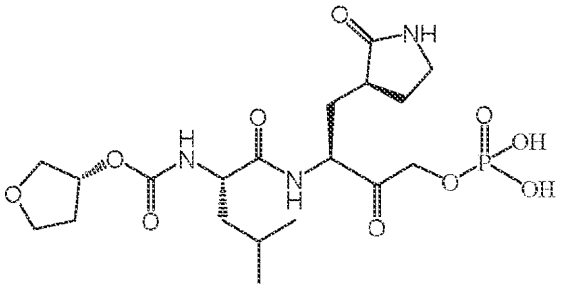
[本発明１０４９]



,

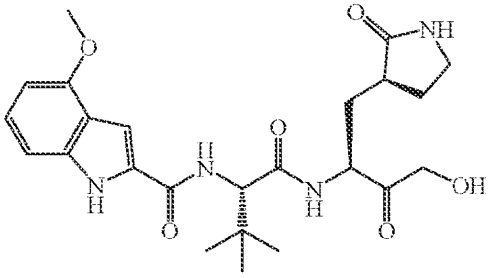


,もしくは

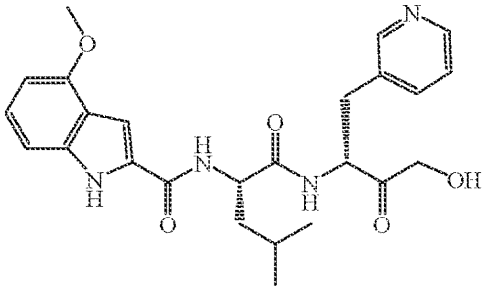


、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１０５０]

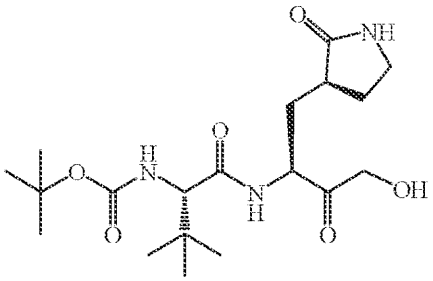


もしくは

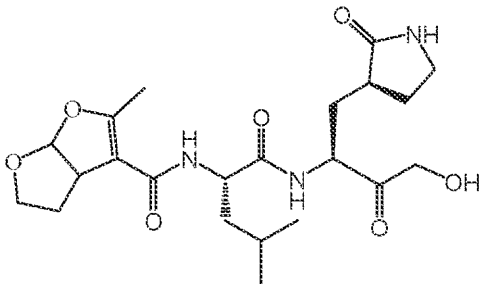


、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１０５１]

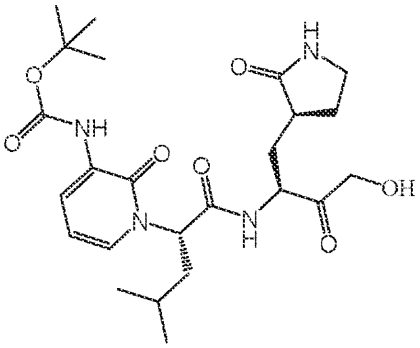


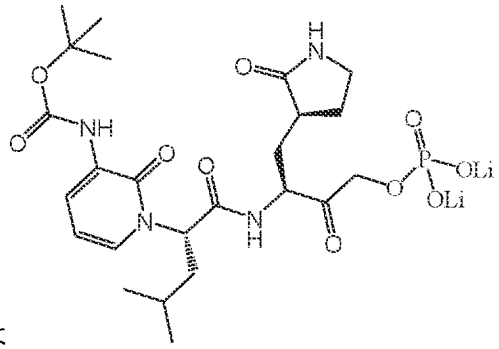
もしくは



、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１０５２]

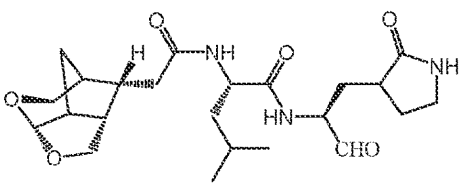




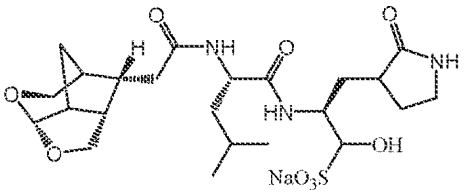
もしくは

、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

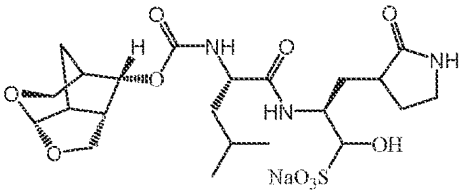
[本発明１０５３]



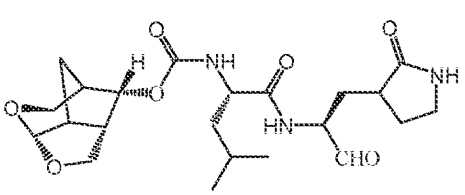
,



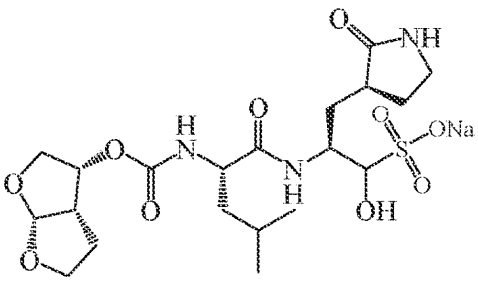
,



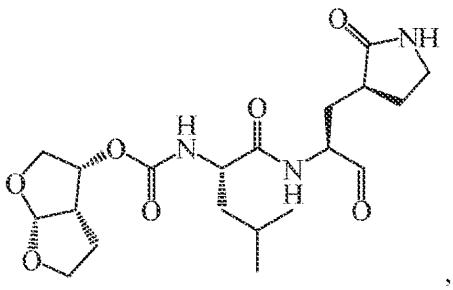
,



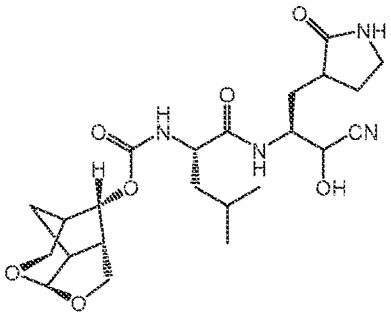
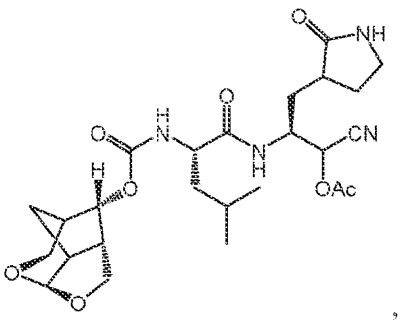
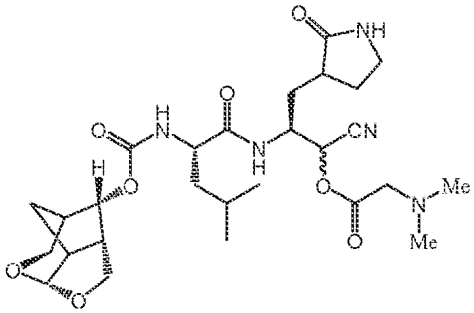
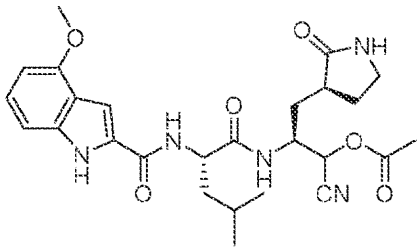
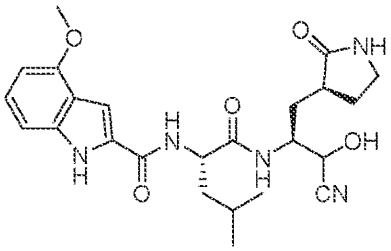
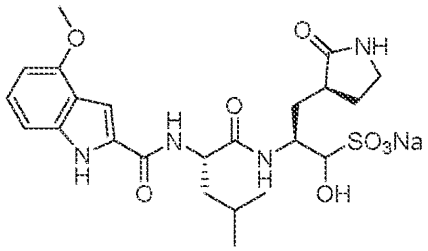
,



,

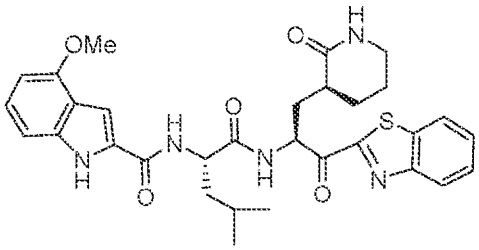
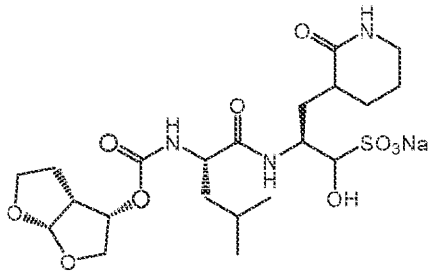
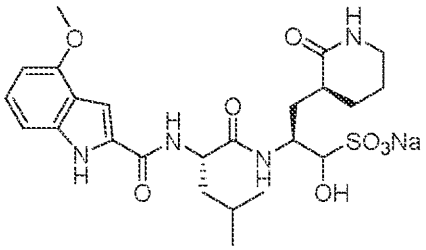
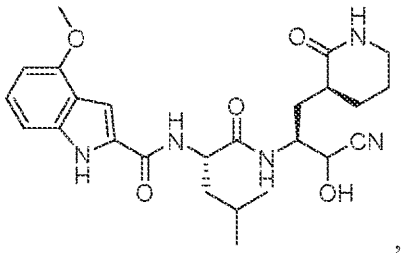


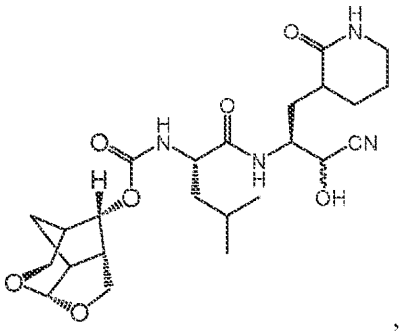
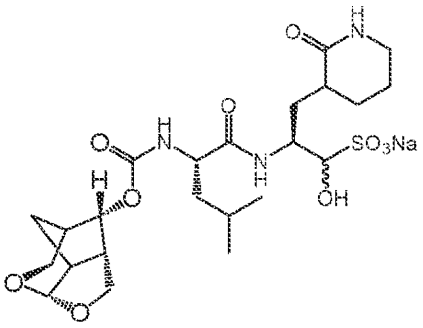
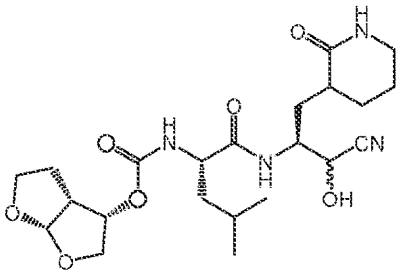
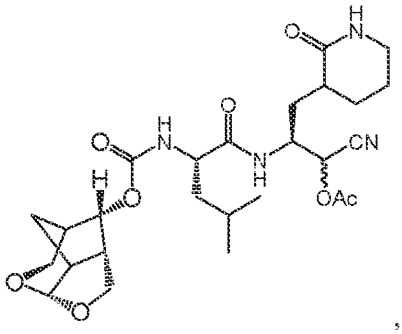
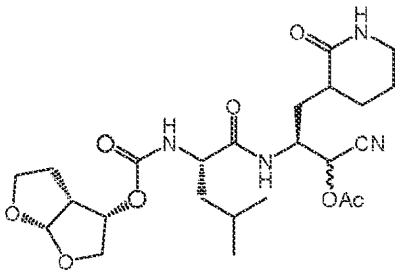
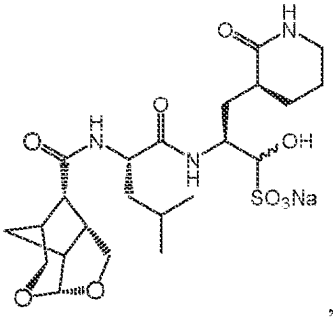
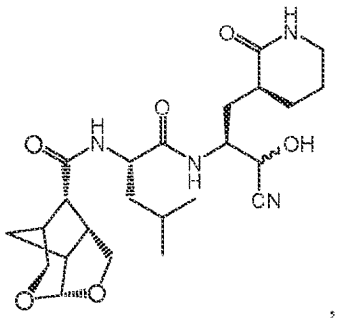
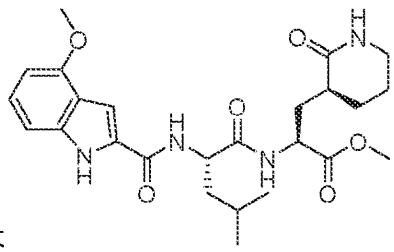
,


,

,

,

,


,もしくは

、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１０５４]


,

,

,

,

,もしくは

、またはその薬学的に許容される塩である、本発明１００１の化合物。

[本発明１０５５]

治療有効量の本発明１００１～１０５４のいずれかの化合物の１つまたは複数と、少なくとも１つの薬学的に許容される賦形剤とを含む、薬学的組成物。

[本発明１０５６]

重症急性呼吸器症候群を治療するための方法であって、

治療有効量の本発明１００１～１０５４のいずれかの化合物の１つもしくは複数または本発明１０５５の薬学的組成物を、その必要のある患者に投与する工程を含み、その結果、前記患者が重症急性呼吸器症候群に対して治療される、前記方法。

[本発明１０５７]

前記重症急性呼吸器症候群がＣＯＶＩＤ-１９である、本発明１０５６の方法。