

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載  
 【部門区分】第3部門第2区分  
 【発行日】令和4年9月20日(2022.9.20)

【公開番号】特開2022-108241(P2022-108241A)  
 【公開日】令和4年7月25日(2022.7.25)  
 【年通号数】公開公報(特許)2022-134  
 【出願番号】特願2021-55886(P2021-55886)  
 【国際特許分類】

- C 0 7 D 2 1 7 / 2 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 ) 10
- A 6 1 P 3 1 / 1 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 1 1 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 1 1 / 1 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 2 9 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 1 1 / 1 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 2 1 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 1 1 / 0 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 1 1 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 1 / 1 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 P 2 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 ) 20
- A 6 1 P 4 3 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 K 3 1 / 4 9 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 K 3 1 / 4 7 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- C 0 7 D 4 0 1 / 0 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- A 6 1 K 3 1 / 4 7 2 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- C 0 7 D 4 0 1 / 1 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- C 0 7 D 4 9 1 / 1 0 7 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- C 1 2 N 9 / 9 9 ( 2 0 0 6 . 0 1 )
- C 1 2 N 7 / 0 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 ) 30

【 F I 】

- C 0 7 D 2 1 7 / 2 6 C S P
- A 6 1 P 3 1 / 1 2 Z N A
- A 6 1 P 1 1 / 0 0
- A 6 1 P 1 1 / 1 6
- A 6 1 P 2 9 / 0 0
- A 6 1 P 1 1 / 1 4
- A 6 1 P 2 1 / 0 0
- A 6 1 P 1 1 / 0 2
- A 6 1 P 1 1 / 0 4 40
- A 6 1 P 1 / 1 2
- A 6 1 P 2 5 / 0 0
- A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1
- A 6 1 K 3 1 / 4 9 6
- A 6 1 K 3 1 / 4 7 2
- C 0 7 D 4 0 1 / 0 6
- A 6 1 K 3 1 / 4 7 2 5
- C 0 7 D 4 0 1 / 1 2
- C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 3 7
- C 0 7 D 4 9 1 / 1 0 7 50

C 1 2 N 9 / 9 9

C 1 2 N 7 / 0 6

## 【手続補正書】

【提出日】令和4年9月9日(2022.9.9)

## 【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】

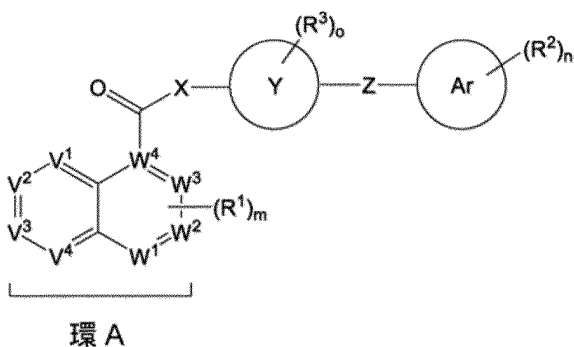
10

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の構造式I:

【化1】



式 I

20

の化合物、その互変異性体、前記化合物もしくは前記互変異性体の重水素化誘導体、または前述のものの薬学的に許容される塩(式中、

Arは、フェニルまたは6員のヘテロアリアルであり、

環Aは、9員または10員のヘテロアリアルであり、ここで、

V<sup>1</sup>、V<sup>2</sup>、V<sup>3</sup>、およびV<sup>4</sup>は、各々、不在であるか、-CH-、またはNであり、  
ここで、

30

V<sup>1</sup>、V<sup>2</sup>、V<sup>3</sup>、およびV<sup>4</sup>の1つ以下が不在であり得、

W<sup>1</sup>、W<sup>2</sup>、W<sup>3</sup>、およびW<sup>4</sup>の1つが不在である場合、V<sup>1</sup>、V<sup>2</sup>、V<sup>3</sup>、およびV<sup>4</sup>はいずれも、不在であり得ず、

W<sup>1</sup>、W<sup>2</sup>、W<sup>3</sup>、およびW<sup>4</sup>は、各々、不在であるか、-CH-、またはNであり、  
ここで、

W<sup>1</sup>、W<sup>2</sup>、W<sup>3</sup>、およびW<sup>4</sup>の1つ以下が不在であり得、

W<sup>1</sup>、W<sup>2</sup>、W<sup>3</sup>、およびW<sup>4</sup>の少なくとも1つは、Nでなければならず、

Xは、不在であるか、-NR<sup>a</sup>-、または-NR<sup>a</sup>(CR<sup>b</sup>R<sup>c</sup>)<sub>a</sub>-であり、

Yは、不在であるか、C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>カルボシクリル、3員から12員のヘテロシクリル、または5員から10員のヘテロアリアルであり、ここで、Yの前記C<sub>3</sub>~C<sub>12</sub>カルボシクリル、Yの前記3員から12員のヘテロシクリル、およびYの前記5員から10員のヘテロアリアルは、各々、o個のR<sup>3</sup>基で置換されており、

40

Zは、不在であるか、-NR<sup>d</sup>-、-(CR<sup>e</sup>R<sup>f</sup>)<sub>b</sub>NR<sup>d</sup>-、または-C(=O)NR<sup>d</sup>(CR<sup>g</sup>R<sup>h</sup>)<sub>c</sub>-であり、ここで、

R<sup>a</sup>およびR<sup>d</sup>は、各出現について、各々独立して、水素またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルであり、

R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、R<sup>e</sup>、およびR<sup>f</sup>は、各出現について、各々独立して、水素、または八口ゲン、シアノ、およびC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルコキシから選択される1から3個の基で任意選択で置換されているC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルであり、

50

$R^g$  および  $R^h$  は、各出現について、各々独立して、水素、またはハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$  アルコキシ、および  $-C(=O)NR^iR^j$  から選択される 1 から 3 個の基で任意選択で置換されている  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、ここで、

$R^i$  および  $R^j$  は、各出現について、各々独立して、水素または  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり、

a、b、および c は、各々独立して、1、2、3、および 4 から選択される整数であり、

$R^1$ 、 $R^2$ 、および  $R^3$  は、各出現について、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、 $-C(=O)(C_1 \sim C_6$  アルキル)、 $-C(=O)NR^pR^q$ 、 $-NR^pR^q$ 、 $-NR^pC(=O)R^s$ 、 $-NR^pC(=O)OR^s$ 、 $-NR^pC(=O)NR^qR^r$ 、 $-NR^pS(=O)_wR^s$ 、 $-NO_2$ 、 $-NO_2^+$ 、 $-NH(=O)OH$ 、 $-OR^s$ 、 $-OC(=O)R^s$ 、 $-OC(=O)OR^s$ 、 $-OC(=O)NR^pR^q$ 、 $-S(=O)_wR^s$ 、 $-S(=O)_wNR^pR^q$ 、 $-SO_3^-$ 、 $C_3 \sim C_{12}$  カルボシクリル、3員から 12員のヘテロシクリル、フェニル、および 5員から 10員のヘテロアリアルから各々独立して選択され、ここで、

$R^1$ 、 $R^2$ 、および  $R^3$  のいずれか 1つの前記  $C_1 \sim C_6$  アルキル、前記  $C_2 \sim C_6$  アルケニル、および前記  $C_1 \sim C_6$  アルコキシならびに  $-C(=O)(C_1 \sim C_6$  アルキル)の前記  $C_1 \sim C_6$  アルキルは、各々、ハロゲン、シアノ、 $-C(=O)R^s$ 、 $-C(=O)OR^s$ 、 $-C(=O)NR^pR^q$ 、 $-NR^pR^q$ 、 $-NR^pC(=O)R^s$ 、 $-NR^pC(=O)OR^s$ 、 $-NR^pC(=O)NR^qR^r$ 、 $-NR^pS(=O)_wR^s$ 、 $-OR^s$ 、 $-OC(=O)R^s$ 、 $-OC(=O)OR^s$ 、 $-OC(=O)NR^pR^q$ 、 $-S(=O)_wR^s$ 、 $-S(=O)_wNR^pR^q$ 、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、および 1 から 3 個のハロゲン原子で任意選択で置換されているフェニルから選択される 1 から 3 個の基で任意選択で置換されており、

$R^1$ 、 $R^2$ 、および  $R^3$  のいずれか 1つの前記  $C_3 \sim C_{12}$  カルボシクリル、前記 3員から 12員のヘテロシクリル、前記フェニル、前記 5員から 10員のヘテロアリアルは、各々、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $-NR^pR^q$ 、および  $-OR^s$  から選択される 1 から 3 個の基で任意選択で置換されており、

$R^p$ 、 $R^q$ 、および  $R^r$  は、各出現について、水素、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、および  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルから各々独立して選択され、ここで、

$R^p$ 、 $R^q$ 、および  $R^r$  のいずれか 1つの前記  $C_1 \sim C_4$  アルキルは、ハロゲン、シアノ、および  $-OH$  から選択される 1 から 3 個の基で任意選択で置換されており、

$R^s$  は、各出現について、水素、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、および  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルから各々独立して選択され、ここで、

$R^p$ 、 $R^q$ 、および  $R^r$  のいずれか 1つの前記  $C_1 \sim C_4$  アルキルは、ハロゲン、シアノ、および  $-OH$  から選択される 1 から 3 個の基で任意選択で置換されており、

w は、1 および 2 から選択される整数であり、

$R^1$  は、各出現について、原子価が許す限り、一緒に縮合して式 I 中の環 A を形成する 2つの単環式芳香族環のいずれかにおける環原子のいずれかに付着していてもよく、

m は、0、1、2、3、4、5、および 6 から選択される整数であり、

n は、1、2、3、4、および 5 から選択される整数であり、

o は、0、1、2、および 3 から選択される整数である)。

#### 【請求項 2】

以下の構造式 I I :

10

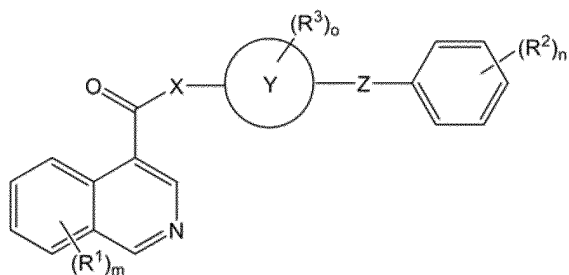
20

30

40

50

## 【化 2】



式 II

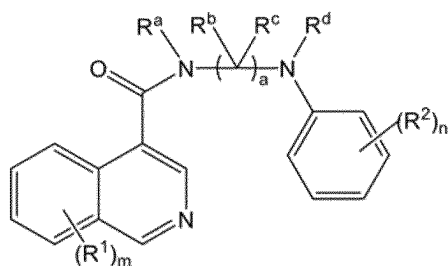
10

の化合物、その互変異性体、前記化合物もしくは前記互変異性体の重水素化誘導体、または前述のものの薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 3】

以下の構造式 III a :

## 【化 3】



式 IIIa

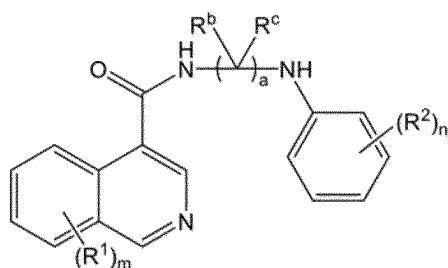
20

の化合物、その互変異性体、前記化合物もしくは前記互変異性体の重水素化誘導体、または前述のものの薬学的に許容される塩である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

以下の構造式 IV a :

## 【化 4】



式 IVa

30

の化合物、その互変異性体、前記化合物もしくは前記互変異性体の重水素化誘導体、または前述のものの薬学的に許容される塩（式中、

40

$R^b$  および  $R^c$  は、各出現について、各々独立して、水素、またはハロゲン、シアノ、および  $C_1 \sim C_4$  アルコキシから選択される 1 から 3 個の基で任意選択で置換されている  $C_1 \sim C_2$  アルキルであり、

$a$  は、1 および 2 から選択される整数である）

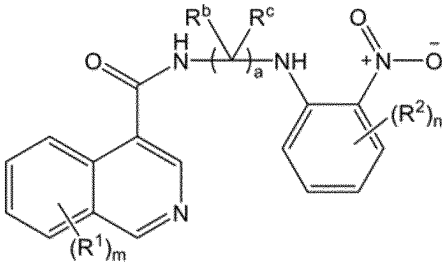
である、請求項 1 から 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

## 【請求項 5】

以下の構造式 V a :

50

## 【化 5】



式 Va

10

の化合物、その互変異性体、前記化合物もしくは前記互変異性体の重水素化誘導体、または前述のものの薬学的に許容される塩（式中、 $n$ は、1、2、3、および4から選択される整数である）である、請求項1から4のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項6】

$Y$ が、 $C_3 \sim C_{12}$ シクロアルキルまたは3員から12員のヘテロシクリルである、請求項1に記載の化合物、互変異性体、重水素化誘導体、または薬学的に許容される塩。

## 【請求項7】

$R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、および $R^f$ が、各出現について、各々独立して、水素または $C_1 \sim C_2$ アルキルであり、

$R^g$ および $R^h$ が、各出現について、各々独立して、水素、または $-C(=O)NR^i$  20

$R^j$ で任意選択で置換されている $C_1 \sim C_2$ アルキルであり、ここで、

$R^i$ および $R^j$ が、各出現について、各々独立して、水素または $C_1 \sim C_2$ アルキルであり、

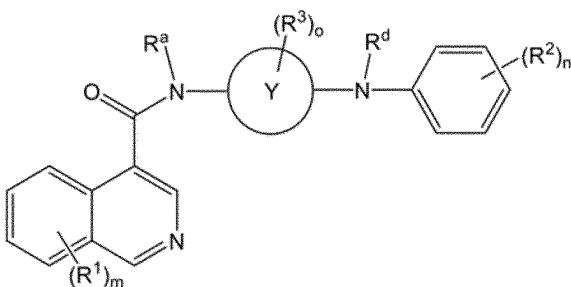
$a$ 、 $b$ 、および $c$ が、各々独立して、1および2から選択される整数である、

請求項1または6に記載の化合物、互変異性体、重水素化誘導体、または薬学的に許容される塩。

## 【請求項8】

以下の構造式 III b - 1 :

## 【化 6】



式 IIIb-1

30

の化合物、その互変異性体、前記化合物もしくは前記互変異性体の重水素化誘導体、または前述のものの薬学的に許容される塩（式中、

$Y$ は、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキルであり、  
 $o$ は、0および1から選択される整数である）

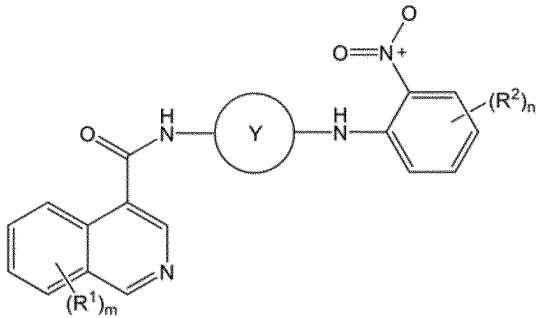
である、請求項1、6、および7のいずれか1項に記載の化合物。 40

## 【請求項9】

以下の構造式 IV b - 1 :

50

## 【化 7】



式 IVb-1

10

の化合物、その互変異性体、前記化合物もしくは前記互変異性体の重水素化誘導体、または前述のものの薬学的に許容される塩（式中、

Y は、 $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルであり、

n は、1、2、3、および 4 から選択される整数である）

である、請求項 1 および 6 から 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

## 【請求項 10】

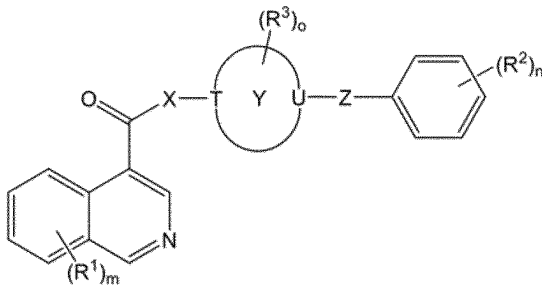
Y が、シクロヘキシルである、請求項 1 および 6 から 9 のいずれか 1 項に記載の化合物、互変異性体、重水素化誘導体、または薬学的に許容される塩。

20

## 【請求項 11】

以下の構造式 I I I b - 2 :

## 【化 8】



式 IIIb-2

30

の化合物、その互変異性体、前記化合物もしくは前記互変異性体の重水素化誘導体、または前述のものの薬学的に許容される塩（式中、

Y は、少なくとも 1 個の N 原子と、任意選択で O および S から選択される少なくとも 1 個の他のヘテロ原子とを含有する 3 員から 10 員のヘテロシクリルであり、

T および U の少なくとも 1 つは、N であり、

o は、0、1、および 2 から選択される整数である）

である、請求項 1、6、および 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

40

## 【請求項 12】

X が、不在であるか、 $-NH-$ 、または  $-NHCH_2-$  であり、

Z が、不在であるか、 $-NH-$ 、 $-[CH(CH(CH_3)_2)]NH-$ 、または  $-C(=O)NHCH[(CONHCH_3)]CH_2-$  である、

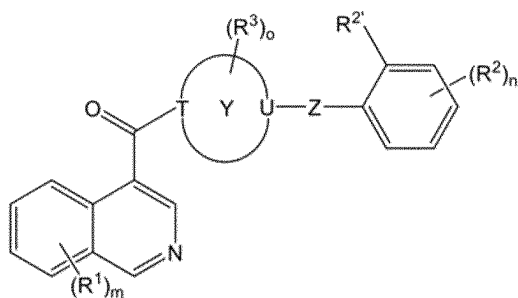
請求項 1、6、7、および 11 のいずれか 1 項に記載の化合物、互変異性体、重水素化誘導体、または薬学的に許容される塩。

## 【請求項 13】

以下の構造式 I V b - 2 :

50

## 【化 9】



式IVb-2

10

の化合物、その互変異性体、前記化合物もしくは前記互変異性体の重水素化誘導体、または前述のものの薬学的に許容される塩（式中、

Yは、少なくとも1個のN原子と、任意選択で少なくとも1個のO原子とを含有する4員から9員のヘテロシクリルであり、

TおよびUの少なくとも1つは、Nであり、

R<sup>2'</sup>は、ハロゲン、シアノ、-NO<sub>2</sub><sup>+</sup>、-NH(=O)OH、または-SO<sub>3</sub><sup>-</sup>であり、

nは、1、2、3、および4から選択される整数であり、

oは、0および1から選択される整数である）

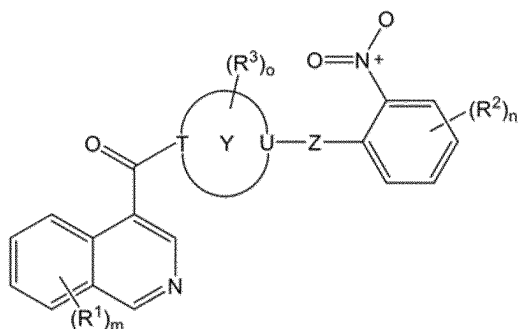
20

である、請求項1、6、7、11、および12のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項14】

以下の構造式Vb-2：

## 【化10】



式Vb-2

30

の化合物、その互変異性体、前記化合物もしくは前記互変異性体の重水素化誘導体、または前述のものの薬学的に許容される塩である、請求項1、6、7、および11から13のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項15】

Yが、アゼチジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、2,7-ジアザスピロ[4.4]ノナニル、オクタヒドロシクロペンタ[c]ピロリル、2-オキサ-6-アザスピロ[3.4]オクタニル、またはオクタヒドロ-1H-イソインドリルである、請求項1、6、7、および11から14のいずれか1項に記載の化合物、互変異性体、重水素化誘導体、または薬学的に許容される塩。

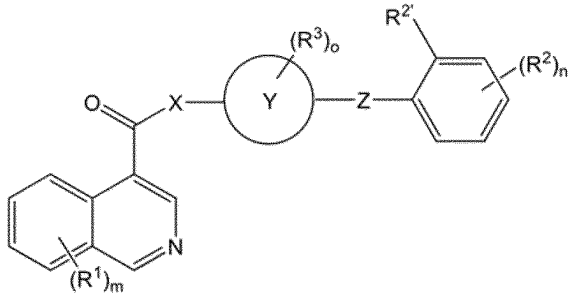
40

## 【請求項16】

以下の構造式IIIc：

50

## 【化 1 1】



式IIIc

10

の化合物、その互変異性体、前記化合物もしくは前記互変異性体の重水素化誘導体、または前述のものの薬学的に許容される塩（式中、

$R^{2'}$  は、ハロゲン、シアノ、 $-NO_2^+$ 、 $-NH(=O)OH$ 、または $-SO_3^-$ であり、

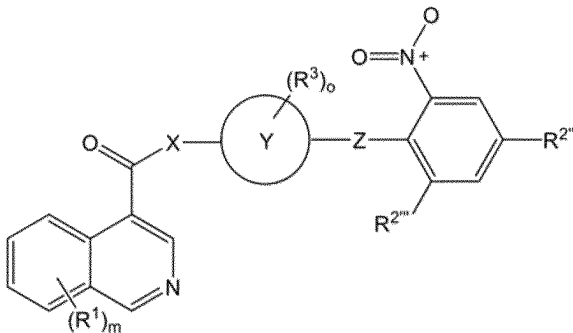
$n$  は、1、2、3、および4から選択される整数である）

である、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項17】

以下の構造式IVc：

## 【化 1 2】



式IVc

20

30

の化合物、その互変異性体、前記化合物もしくは前記互変異性体の重水素化誘導体、または前述のものの薬学的に許容される塩（式中、

$R^{2'}$  は、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、

$R^{2''}$  は、 $-C(=O)NR^pR^q$ であり、ここで、

$R^p$ および $R^q$ は、各々独立して、水素または $C_1 \sim C_4$ アルキルである）

である、請求項1または16に記載の化合物。

## 【請求項18】

$R^{2'}$  が、F、Cl、Brまたは $C_1 \sim C_2$ アルキルであり、

$R^{2''}$  が、 $-C(=O)NR^pR^q$ であり、ここで、

$R^p$ および $R^q$ が、各々独立して、水素または $C_1 \sim C_2$ アルキルである、

請求項17に記載の化合物、互変異性体、重水素化誘導体、または薬学的に許容される塩。

40

## 【請求項19】

$R^{2'}$  が、Brまたは $-CH_3$ であり、

$R^{2''}$  が、 $-C(=O)NHCH_3$ である、

請求項17または18に記載の化合物、互変異性体、重水素化誘導体、または薬学的に許容される塩。

## 【請求項20】

$R^1$  が、各出現について、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコ

50

キシ、 $-C(=O)(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-C(=O)NR^pR^q$ 、 $-NR^pR^q$ 、  
および $-OR^s$ から独立して選択され、ここで、

$R^1$ の前記 $C_1 \sim C_4$ アルキルおよび前記 $C_1 \sim C_4$ アルコキシならびに $-C(=O)$   
( $C_1 \sim C_4$ アルキル)の前記 $C_1 \sim C_4$ アルキルが、各々、ハロゲン、シアノ、および  
 $-OR^s$ から選択される1から3個の基で任意選択で置換されており、

$R^p$ および $R^q$ が、各出現について、水素および $C_1 \sim C_2$ アルキルから各々独立して  
選択され、

$R^s$ が、各出現について、水素および $C_1 \sim C_2$ アルキルから独立して選択される、  
請求項1から19のいずれか1項に記載の化合物、互変異性体、重水素化誘導体、または  
薬学的に許容される塩。

10

【請求項21】

$R^1$ が、各出現について、F、Cl、Br、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、および $-OR^s$ から  
独立して選択され、ここで、

$R^1$ の前記 $C_1 \sim C_2$ アルキルが、1から3個のハロゲン基で任意選択で置換されてお  
り、

$R^s$ が、各出現について、水素および $C_1 \sim C_2$ アルキルから独立して選択される、  
請求項1から20のいずれか1項に記載の化合物、互変異性体、重水素化誘導体、または  
薬学的に許容される塩。

【請求項22】

$R^1$ が、各出現について、Fおよび $-OH$ から独立して選択される、請求項1から20  
のいずれか1項に記載の化合物、互変異性体、重水素化誘導体、または薬学的に許容され  
る塩。

20

【請求項23】

$R^3$ が、各出現について、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコ  
キシ、 $-C(=O)(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ 、 $-C(=O)NR^pR^q$ 、 $-NR^pR^q$ 、  
 $-OR^s$ 、およびフェニルから独立して選択され、ここで、

$R^3$ の前記 $C_1 \sim C_4$ アルキルおよび前記 $C_1 \sim C_4$ アルコキシならびに $-C(=O)$   
( $C_1 \sim C_4$ アルキル)の前記 $C_1 \sim C_4$ アルキルが、各々、ハロゲン、シアノ、 $-OR^s$ 、  
 $-OR^s$ 、および1から3個のハロゲン原子で任意選択で置換されているフェニルから選択され  
る1から3個の基で任意選択で置換されており、

30

$R^3$ の前記フェニルが、ハロゲン、シアノ、および $C_1 \sim C_2$ アルキルから選択される  
1から3個の基で任意選択で置換されており、

$R^p$ および $R^q$ が、各出現について、水素および $C_1 \sim C_2$ アルキルから各々独立して  
選択され、

$R^s$ が、各出現について、水素および $C_1 \sim C_2$ アルキルから独立して選択される、  
請求項1、6から8、および10から22のいずれか1項に記載の化合物、互変異性体、  
重水素化誘導体、または薬学的に許容される塩。

【請求項24】

$R^3$ が、各出現について、F、Cl、Br、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $-OR^s$ 、およびフ  
ェニルから独立して選択され、ここで、

40

$R^3$ の前記 $C_1 \sim C_2$ アルキルが、ハロゲン、シアノ、および1から3個のハロゲン原  
子で任意選択で置換されているフェニルから選択される1から3個の基で任意選択で置換  
されており、

$R^s$ が、各出現について、水素および $C_1 \sim C_2$ アルキルから独立して選択される、  
請求項1、6から8、および10から23のいずれか1項に記載の化合物、互変異性体、  
重水素化誘導体、または薬学的に許容される塩。

【請求項25】

$R^3$ が、各出現について、 $-OH$ 、フェニルおよび2,4-ジクロロ-1-メチルベン  
ゼンから独立して選択される、請求項1、6から8、および10から24のいずれか1項  
に記載の化合物、互変異性体、重水素化誘導体、または薬学的に許容される塩。

50

## 【請求項 26】

$R^2$  が、各出現について、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルコキシ、 $-C(=O)(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-C(=O)NR^pR^q$ 、 $-NR^pR^q$ 、 $-NO_2$ 、 $-NO_2^+$ 、 $-NH(=O)OH$ 、 $-OR^s$ 、および  $-SO_3^-$  から独立して選択され、ここで、

$R^2$  の前記  $C_1 \sim C_4$  アルキルおよび前記  $C_1 \sim C_4$  アルコキシならびに  $-C(=O)(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  の前記  $C_1 \sim C_4$  アルキルが、各々、ハロゲン、シアノ、および  $-OR^s$  から選択される 1 から 3 個の基で任意選択で置換されており、

$R^p$  および  $R^q$  が、各出現について、水素および  $C_1 \sim C_2$  アルキルから各々独立して選択され、

10

$R^s$  が、各出現について、水素および  $C_1 \sim C_2$  アルキルから独立して選択される、請求項 1 から 4、6 から 8、10 から 12、15、および 20 から 25 のいずれか 1 項に記載の化合物、互変異性体、重水素化誘導体、または薬学的に許容される塩。

## 【請求項 27】

$R^2$  が、各出現について、F、Cl、Br、シアノ、 $C_1 \sim C_2$  アルキル、 $-C(=O)NR^pR^q$ 、 $-NO_2$ 、 $-NO_2^+$ 、 $-NH(=O)OH$ 、 $-OR^s$ 、および  $-SO_3^-$  から独立して選択され、ここで、

$R^2$  の前記  $C_1 \sim C_2$  アルキルが、1 から 3 個のハロゲン基で任意選択で置換されており、

$R^p$  および  $R^q$  が、各出現について、水素および  $-CH_3$  から各々独立して選択され、

20

$R^s$  が、各出現について、水素および  $C_1 \sim C_2$  アルキルから独立して選択される、請求項 1 から 4、6 から 8、10 から 12、15、および 20 から 26 のいずれか 1 項に記載の化合物、互変異性体、重水素化誘導体、または薬学的に許容される塩。

## 【請求項 28】

$R^2$  が、各出現について、Br、 $-CH_3$ 、 $-C(=O)NHCH_3$ 、 $-NO_2^+$ 、 $-NH(=O)OH$ 、および  $-SO_3^-$  から独立して選択される、請求項 1 から 4、6 から 8、10 から 12、15、および 20 から 27 のいずれか 1 項に記載の化合物、互変異性体、重水素化誘導体、または薬学的に許容される塩。

## 【請求項 29】

$R^2$  が、各出現について、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、 $C_1 \sim C_4$  アルコキシ、 $-C(=O)(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$ 、 $-C(=O)NR^pR^q$ 、 $-NR^pR^q$ 、および  $-OR^s$  から独立して選択され、ここで、

30

$R^2$  の前記  $C_1 \sim C_4$  アルキルおよび前記  $C_1 \sim C_4$  アルコキシならびに  $-C(=O)(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  の前記  $C_1 \sim C_4$  アルキルが、各々、ハロゲン、シアノ、および  $-OR^s$  から選択される 1 から 3 個の基で任意選択で置換されており、

$R^p$  および  $R^q$  が、各出現について、水素および  $C_1 \sim C_2$  アルキルから各々独立して選択され、

$R^s$  が、各出現について、水素および  $C_1 \sim C_2$  アルキルから独立して選択される、請求項 5、9、13 から 16、および 21 から 25 のいずれか 1 項に記載の化合物、互変異性体、重水素化誘導体、または薬学的に許容される塩。

40

## 【請求項 30】

$R^2$  が、各出現について、F、Cl、Br、シアノ、 $C_1 \sim C_2$  アルキル、 $-C(=O)NR^pR^q$ 、および  $-OR^s$  から独立して選択され、ここで、

$R^2$  の前記  $C_1 \sim C_2$  アルキルが、1 から 3 個のハロゲン基で任意選択で置換されており、

$R^p$  および  $R^q$  が、各出現について、水素および  $-CH_3$  から各々独立して選択され、

$R^s$  が、各出現について、水素および  $C_1 \sim C_2$  アルキルから独立して選択される、請求項 5、9、13 から 16、20 から 25、および 29 のいずれか 1 項に記載の化合物、互変異性体、重水素化誘導体、または薬学的に許容される塩。

## 【請求項 31】

50

R<sup>2</sup> が、各出現について、Br、-CH<sub>3</sub>、および -C(=O)NHCH<sub>3</sub> から独立して選択される、請求項 5、9、13 から 16、20 から 25、29、および 30 のいずれか 1 項に記載の化合物、互変異性体、重水素化誘導体、または薬学的に許容される塩。

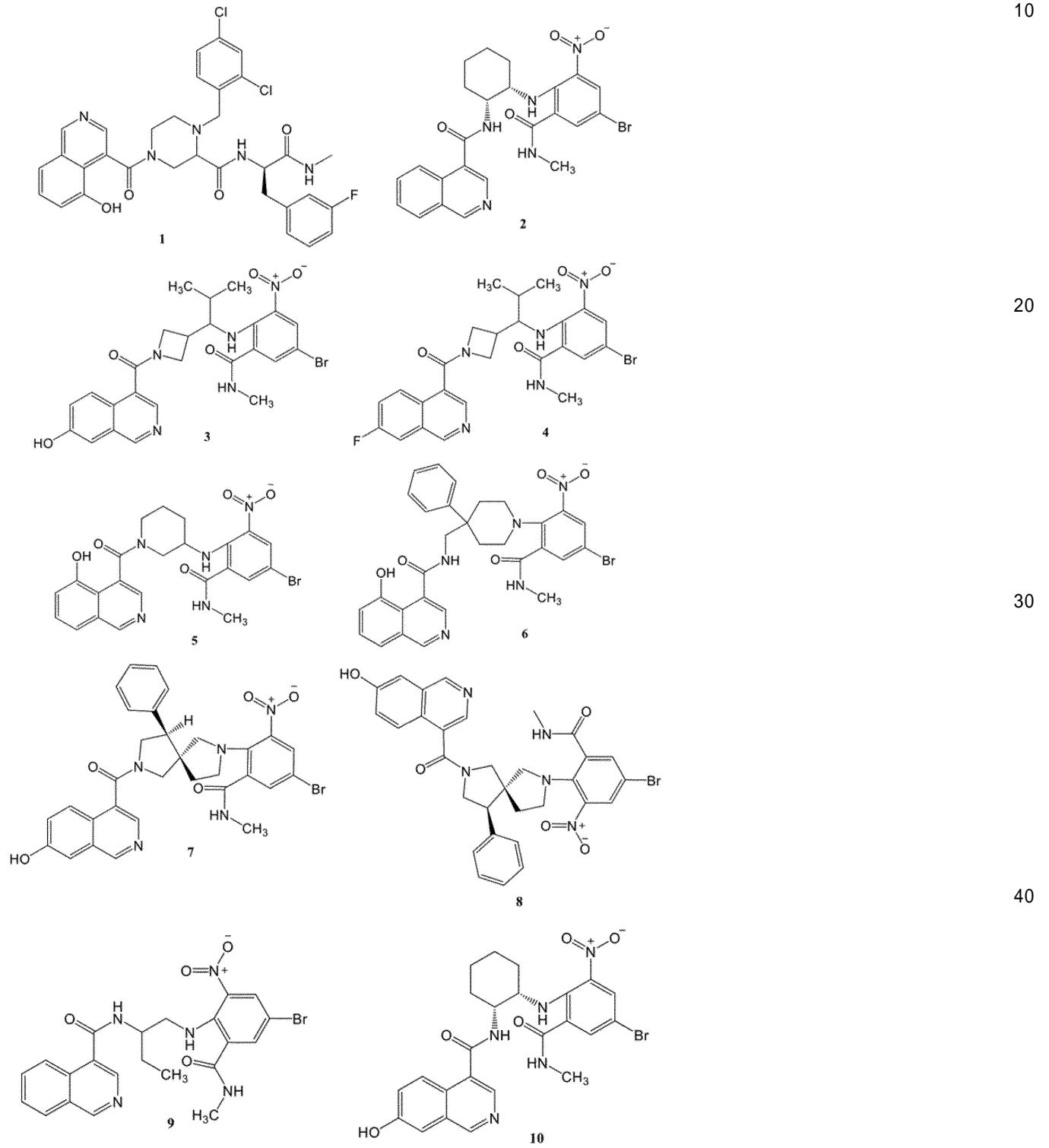
【請求項 3 2】

m が、0 および 1 から選択される整数である、請求項 1 から 31 のいずれか 1 項に記載の化合物、互変異性体、重水素化誘導体、または薬学的に許容される塩。

【請求項 3 3】

前記化合物が、

【化 1 3】



10

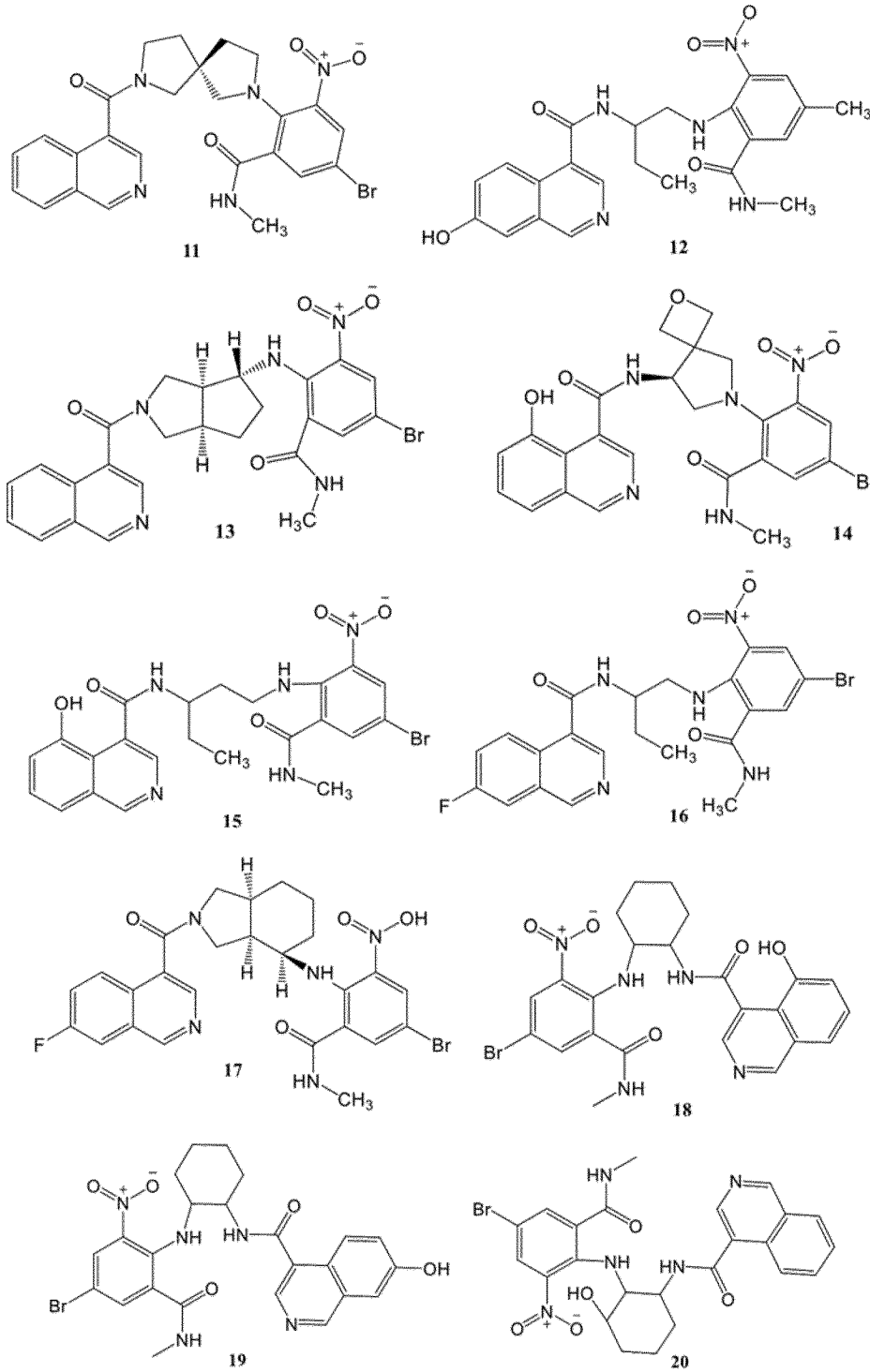
20

30

40

50

【化 1 4】



10

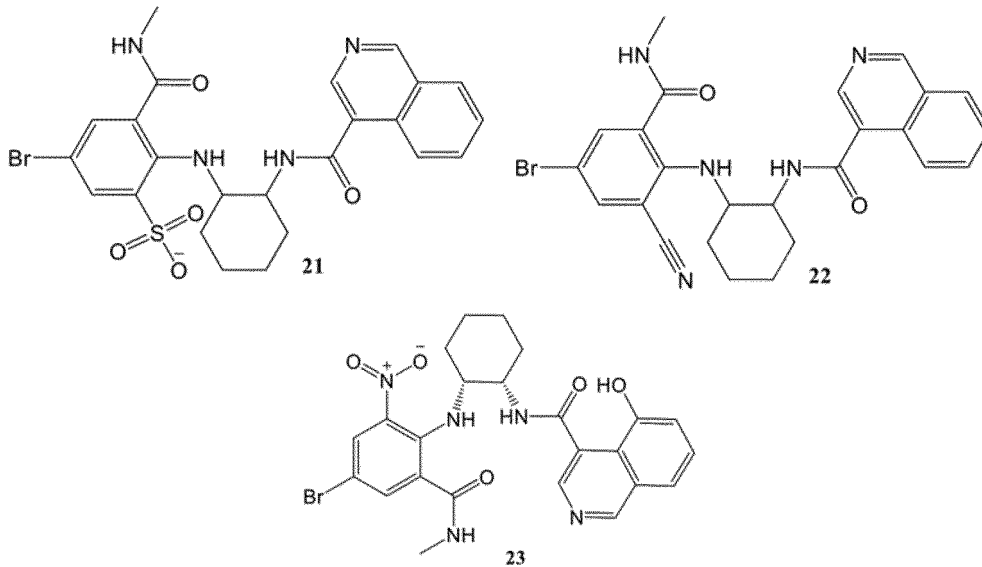
20

30

40

50

## 【化 1 5】



10

、その互変異性体、前記化合物もしくは互変異性体の重水素化誘導体、または前述のものの薬学的に許容される塩から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

20

## 【請求項 3 4】

請求項 1 から 3 3 のいずれか 1 項に記載の化合物と、少なくとも 1 種の薬学的に許容される担体とを含む、医薬組成物。

## 【請求項 3 5】

コロナウイルスにより引き起こされる疾患または疾患の症状の処置用の医薬組成物を製造するための請求項 1 から 3 3 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

## 【請求項 3 6】

前記疾患が、気道感染性疾患である、請求項 3 5 に記載の使用。

## 【請求項 3 7】

前記気道感染性疾患が、重症急性呼吸器症候群である、請求項 3 6 に記載の使用。

## 【請求項 3 8】

前記症状が、発熱または悪寒、咳、息切れまたは呼吸困難、疲労、筋肉または全身痛、頭痛、新たな味覚または嗅覚消失、咽喉痛、鼻閉または鼻汁、悪心または嘔吐、下痢、胸部の持続性疼痛または圧迫感、新たな錯乱、覚醒または覚醒維持不能、青みがかった唇または顔、およびそれらの組合せから選択される、請求項 3 5 に記載の使用。

30

## 【請求項 3 9】

前記コロナウイルスが、重症急性呼吸器症候群コロナウイルス 2 (SARS-CoV-2) である、請求項 3 5 から 3 8 のいずれか 1 項に記載の使用。

## 【請求項 4 0】

コロナウイルスのプロテアーゼの活性の低減または阻害用の医薬組成物を製造するための請求項 1 から 3 3 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用であって、医薬組成物は、前記プロテアーゼと接触されるものである、使用。

40

## 【請求項 4 1】

前記プロテアーゼが、3C 様プロテアーゼである、請求項 4 0 に記載の使用。

## 【請求項 4 2】

前記コロナウイルスが、重症急性呼吸器症候群コロナウイルス 2 (SARS-CoV-2) である、請求項 4 0 または 4 1 に記載の使用。

## 【請求項 4 3】

コロナウイルスの複製の低減または阻害用の医薬組成物を製造するための請求項 1 から 3 3 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用であって、医薬組成物は、前記コロナウイルスと接触されるものである、使用。

50

【請求項 4 4】

前記コロナウイルスが、重症急性呼吸器症候群コロナウイルス 2 ( S A R S - C o V - 2 ) である、請求項 4 3 に記載の使用。

10

20

30

40

50