

【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2年9月24日(2020.9.24)

【公表番号】特表2019-533007(P2019-533007A)

【公表日】令和1年11月14日(2019.11.14)

【年通号数】公開・登録公報2019-046

【出願番号】特願2019-535971(P2019-535971)

【国際特許分類】

C 0 7 C	237/06	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/14	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/167	(2006.01)
A 6 1 K	31/165	(2006.01)
A 6 1 K	31/351	(2006.01)
C 0 7 D	309/14	(2006.01)
C 0 7 D	309/04	(2006.01)
C 0 7 D	211/26	(2006.01)
A 6 1 K	31/445	(2006.01)
A 6 1 K	31/397	(2006.01)
C 0 7 D	205/04	(2006.01)
C 0 7 D	307/14	(2006.01)
A 6 1 K	31/341	(2006.01)
C 0 7 D	309/06	(2006.01)
A 6 1 K	31/472	(2006.01)
C 0 7 D	217/06	(2006.01)
C 0 7 D	213/40	(2006.01)
A 6 1 K	31/4409	(2006.01)
A 6 1 K	31/4406	(2006.01)
C 0 7 D	241/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/4965	(2006.01)
A 6 1 K	31/417	(2006.01)
C 0 7 D	233/64	(2006.01)
C 0 7 D	207/27	(2006.01)
A 6 1 K	31/4015	(2006.01)
A 6 1 K	31/42	(2006.01)
C 0 7 D	261/18	(2006.01)
A 6 1 K	31/18	(2006.01)
A 6 1 K	31/166	(2006.01)
A 6 1 K	31/45	(2006.01)
A 6 1 K	31/4412	(2006.01)
C 0 7 D	211/76	(2006.01)
C 0 7 D	213/76	(2006.01)
C 0 7 D	213/81	(2006.01)
C 0 7 D	213/82	(2006.01)
A 6 1 K	31/44	(2006.01)
C 0 7 D	295/15	(2006.01)
A 6 1 K	31/4453	(2006.01)

A 6 1 K 31/495 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
 C 0 7 D 401/12 (2006.01)
 C 0 7 D 403/12 (2006.01)
 A 6 1 K 31/497 (2006.01)
 A 6 1 K 31/427 (2006.01)
 C 0 7 D 417/12 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4196 (2006.01)
 C 0 7 D 405/12 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4025 (2006.01)
 C 0 7 D 403/06 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4035 (2006.01)
 C 0 7 D 405/06 (2006.01)
 C 0 7 D 409/06 (2006.01)
 C 0 7 D 413/12 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4245 (2006.01)
 A 6 1 K 31/422 (2006.01)
 A 6 1 K 31/454 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4155 (2006.01)
 A 6 1 K 31/506 (2006.01)
 A 6 1 K 31/55 (2006.01)
 C 0 7 D 417/06 (2006.01)
 A 6 1 K 31/403 (2006.01)
 C 0 7 C 237/20 (2006.01)
 C 0 7 C 237/12 (2006.01)
 C 0 7 C 237/04 (2006.01)
 C 0 7 C 235/74 (2006.01)
 C 0 7 C 311/06 (2006.01)
 C 0 7 C 311/19 (2006.01)
 C 0 7 C 311/13 (2006.01)
 C 0 7 C 237/08 (2006.01)
 C 0 7 C 237/14 (2006.01)
 C 0 7 C 311/29 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 237/06 C S P
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 31/00
 A 6 1 P 31/14
 A 6 1 P 3/04
 A 6 1 K 31/167
 A 6 1 K 31/165
 A 6 1 K 31/351
 C 0 7 D 309/14
 C 0 7 D 309/04
 C 0 7 D 211/26
 A 6 1 K 31/445
 A 6 1 K 31/397
 C 0 7 D 205/04
 C 0 7 D 307/14
 A 6 1 K 31/341

C 0 7 D	309/06	
A 6 1 K	31/472	
C 0 7 D	217/06	
C 0 7 D	213/40	
A 6 1 K	31/4409	
A 6 1 K	31/4406	
C 0 7 D	241/12	
A 6 1 K	31/4965	
A 6 1 K	31/417	
C 0 7 D	233/64	1 0 6
C 0 7 D	207/27	Z
A 6 1 K	31/4015	
A 6 1 K	31/42	
C 0 7 D	261/18	
A 6 1 K	31/18	
A 6 1 K	31/166	
A 6 1 K	31/45	
A 6 1 K	31/4412	
C 0 7 D	211/76	
C 0 7 D	213/76	
C 0 7 D	213/81	
C 0 7 D	213/82	
A 6 1 K	31/44	
C 0 7 D	295/15	
A 6 1 K	31/4453	
A 6 1 K	31/495	
A 6 1 K	31/4439	
C 0 7 D	401/12	
C 0 7 D	403/12	
A 6 1 K	31/497	
A 6 1 K	31/427	
C 0 7 D	417/12	
A 6 1 K	31/4196	
C 0 7 D	405/12	
A 6 1 K	31/4025	
C 0 7 D	403/06	
A 6 1 K	31/4035	
C 0 7 D	405/06	
C 0 7 D	409/06	
C 0 7 D	413/12	
A 6 1 K	31/4245	
A 6 1 K	31/422	
A 6 1 K	31/454	
A 6 1 K	31/4155	
A 6 1 K	31/506	
A 6 1 K	31/55	
C 0 7 D	417/06	
A 6 1 K	31/403	
C 0 7 C	237/20	
C 0 7 C	237/12	

C 0 7 C 237/04 A
 C 0 7 C 235/74
 C 0 7 C 311/06
 C 0 7 C 311/19
 C 0 7 C 311/13
 C 0 7 C 237/08
 C 0 7 C 237/14
 C 0 7 C 311/29

【手続補正書】

【提出日】令和2年8月17日(2020.8.17)

【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

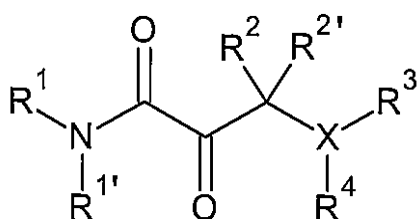
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 I

【化 1】



(式中、

R^1 は、H、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ 、 $-(\text{CH}_2)_n\text{C}(\text{O})\text{OR}^a$ であるか、あるいは $\text{C}_1 \sim 8$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim 6$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim 6$ アルキニル、 $\text{C}_3 \sim 10$ シクロアルキル、 $\text{C}_6 \sim 10$ アリール、3～8員のヘテロシクロアルキルおよび5～12員のヘテロアリールの中から互いに独立して選択される基であって1つまたは複数の同一または異なる R^a および/または R^b によって場合により置換されている基を表し、

$\text{R}^{1'}$ は、Hまたは $\text{C}_1 \sim 4$ アルキルを表すか、

または R^1 および $\text{R}^{1'}$ は、隣接する窒素原子と一緒にあって、4～10員の複素環式基を形成し、前記複素環式基は、1つまたは複数の同一または異なる R^a および/または R^b により場合により置換されていてもよく、

X は、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{N}-$ または O を表し、

R^2 は、H、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^a$ であるか、あるいは $\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim 6$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim 6$ アルキニル、 $\text{C}_3 \sim 10$ シクロアルキル、 $\text{C}_4 \sim 16$ シクロアルキルアルキル、 $\text{C}_6 \sim 10$ アリール、 $\text{C}_7 \sim 16$ アリールアルキル、3～8員のヘテロシクロアルキル、5～12員のヘテロアリールおよび6～18員のヘテロアリールアルキルの中から互いに独立して選択される基であって1つまたは複数の同一または異なる R^a および/または R^b によって場合により置換されている基を表すか、

または R^2 は、 X が $-\text{N}-$ を表す場合、 R^3 と一緒にあって、5～7員のヘテロシクロアルキル環を形成し、前記ヘテロシクロアルキル環は、オキソ基を有し、1つまたは複数の同一または異なる R^a および/または R^b により場合により置換されており、

$\text{R}^{2'}$ は、Hまたは $\text{C}_1 \sim 6$ アルキルを表し、

R^3 は、H、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^c$ または $-\text{SO}_2\text{R}^a$ を表し、

R^4 は、Hであるか、あるいは $\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim 6$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim 6$ アルキ

ニル、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、 $C_4 \sim 16$ シクロアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール、 $C_7 \sim 16$ アリールアルキル、3～8員のヘテロシクロアルキル、4～14員のヘテロシクロアルキルアルキル、5～12員のヘテロアリールおよび6～18員のヘテロアリールアルキルの中から互いに独立して選択される基であって1つまたは複数の同一または異なる R^a および/または R^b によって場合により置換されている基を表すか、

または R^4 は、Xが-N-を表す場合、 R^3 と一緒になって、4～6員のヘテロシクロアルキル環を形成し、前記ヘテロシクロアルキル環は、オキソ基を有し、1つまたは複数の同一または異なる R^a および/または R^b によって場合により置換されており、

nは、0、1、2または3を表し、

R^a はそれぞれ、互いに独立して、水素であるか、あるいは $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、 $C_4 \sim 16$ シクロアルキルアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール、 $C_7 \sim 16$ アリールアルキル、3～8員のヘテロシクロアルキル、4～14員のヘテロシクロアルキルアルキル、5～12員のヘテロアリールおよび6～18員のヘテロアリールアルキルの中から選択される基であって1つまたは複数の同一または異なる R^b および/または R^c によって場合により置換されている基を表し、

R^b はそれぞれ、好適な置換基であり、各場合において、 $=O$ 、 $-OR^c$ 、 $C_1 \sim 3$ ハロアルキルオキシ、 $-OCF_3$ 、 $=S$ 、 $-SR^c$ 、 $=NR^c$ 、 $=NOR^c$ 、 $=NNR^cR^c$ 、 $=NN(R^g)C(O)NR^cR^c$ 、 $-NR^cR^c$ 、 $-ONR^cR^c$ 、 $-N(OR^c)R^c$ 、 $-N(R^g)NR^cR^c$ 、ハロゲン、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NC$ 、 $-OCN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO$ 、 $-NO_2$ 、 $=N_2$ 、 $-N_3$ 、 $-S(O)R^c$ 、 $-S(O)OR^c$ 、 $-S(O)_2R^c$ 、 $-S(O)_2OR^c$ 、 $-S(O)NR^cR^c$ 、 $-S(O)_2NR^cR^c$ 、 $-OS(O)R^c$ 、 $-OS(O)_2R^c$ 、 $-OS(O)_2OR^c$ 、 $-OS(O)NR^cR^c$ 、 $-OS(O)_2NR^cR^c$ 、 $-O(CH_2)_p(CH_2)_pR^c$ 、 $-C(O)R^c$ 、 $-C(O)OR^c$ 、 $-C(O)SR^c$ 、 $-C(O)NR^cR^c$ 、 $-C(O)N(R^g)NR^cR^c$ 、 $-C(O)N(R^g)OR^c$ 、 $-C(NR^g)NR^cR^c$ 、 $-C(NO_2)R^c$ 、 $-C(NO_2)NR^cR^c$ 、 $-OC(O)R^c$ 、 $-OC(O)OR^c$ 、 $-OC(O)SR^c$ 、 $-OC(O)NR^cR^c$ 、 $-OC(NR^g)NR^cR^c$ 、 $-SC(O)R^c$ 、 $-SC(O)OR^c$ 、 $-SC(O)NR^cR^c$ 、 $-SC(NR^g)NR^cR^c$ 、 $-N(R^g)C(O)R^c$ 、 $-N[C(O)R^c]_2$ 、 $-N(OR^g)C(O)R^c$ 、 $-N(R^g)C(NR^g)R^c$ 、 $-N(R^g)N(R^g)C(O)R^c$ 、 $-N[C(O)R^c]NR^cR^c$ 、 $-N(R^g)C(S)R^c$ 、 $-N(R^g)S(O)R^c$ 、 $-N(R^g)S(O)OR^c$ 、 $-N(R^g)S(O)_2R^c$ 、 $-N[S(O)_2R^c]_2$ 、 $-N(R^g)S(O)_2OR^c$ 、 $-N(R^g)S(O)_2NR^cR^c$ 、 $-N(R^g)[S(O)_2]_2R^c$ 、 $-N(R^g)C(O)OR^c$ 、 $-N(R^g)C(O)SR^c$ 、 $-N(R^g)C(O)NR^cR^c$ 、 $-N(R^g)C(O)NR^gNR^cR^c$ 、 $-N(R^g)N(R^g)C(O)NR^cR^c$ 、 $-N(R^g)C(S)NR^cR^c$ 、 $-[N(R^g)C(O)]_2R^c$ 、 $-N(R^g)[C(O)]_2R^c$ 、 $-N\{[C(O)]_2R^c\}_2$ 、 $-N(R^g)[C(O)]_2OR^c$ 、 $-N(R^g)[C(O)]_2NR^cR^c$ 、 $-N\{[C(O)]_2OR^c\}_2$ 、 $-N\{[C(O)]_2NR^cR^c\}_2$ 、 $-[N(R^g)C(O)]_2OR^c$ 、 $-N(R^g)C(NR^g)OR^c$ 、 $-N(R^g)C(NO_2)R^c$ 、 $-N(R^g)C(NR^g)SR^c$ および $-N(R^g)C(NR^g)NR^cR^c$ の中から互いに独立して選択され、

R^c はそれぞれ、互いに独立して、水素であるか、あるいは $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、 $C_4 \sim 16$ シクロアルキルアルキル、 $C_6 \sim 10$ アリール、 $C_7 \sim 16$ アリールアルキル、3～8員のヘテロシクロアルキル、4～14員のヘテロシクロアルキルアルキル、5～12員のヘテロアリールおよび6～18員のヘテロアリールアルキルの中から選択される基であって1つまたは複数の同一または異なる R^d および/または R^e によって場合により置換されている基を表し、

R^d はそれぞれ、好適な置換基を表し、各場合において、 $=O$ 、 $-OR^e$ 、 $C_1 \sim 3$ ハロ

アルキルオキシ、 $-OCF_3$ 、 $=S$ 、 $-SR^e$ 、 $=NR^e$ 、 $=NOR^e$ 、 $=NNR^eR^e$ 、 $=NN(R^g)C(O)NR^eR^e$ 、 $-NR^eR^e$ 、 $-ONR^eR^e$ 、 $-N(OR^e)R^e$ 、 $-N(R^g)NR^eR^e$ 、ハロゲン、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NC$ 、 $-OCN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO$ 、 $-NO_2$ 、 $=N_2$ 、 $-N_3$ 、 $-S(O)R^e$ 、 $-S(O)OR^e$ 、 $-S(O)_2R^e$ 、 $-S(O)_2OR^e$ 、 $-S(O)NR^eR^e$ 、 $-S(O)_2NR^eR^e$ 、 $-OS(O)R^e$ 、 $-OS(O)_2R^e$ 、 $-OS(O)_2OR^e$ 、 $-OS(O)NR^eR^e$ 、 $-OS(O)_2NR^eR^e$ 、 $-C(O)R^e$ 、 $-C(O)OR^e$ 、 $-C(O)SR^e$ 、 $-C(O)NR^eR^e$ 、 $-C(O)N(R^g)NR^eR^e$ 、 $-C(O)N(R^g)OR^e$ 、 $-C(NR^g)NR^eR^e$ 、 $-C(NOH)R^e$ 、 $-C(NOH)NR^eR^e$ 、 $-OC(O)R^e$ 、 $-OC(O)OR^e$ 、 $-OC(O)SR^e$ 、 $-OC(O)NR^eR^e$ 、 $-OC(NR^g)NR^eR^e$ 、 $-SC(O)R^e$ 、 $-SC(O)OR^e$ 、 $-SC(O)NR^eR^e$ 、 $-SC(NR^g)NR^eR^e$ 、 $-N(R^g)C(O)R^e$ 、 $-N[C(O)R^e]_2$ 、 $-N(OR^g)C(O)R^e$ 、 $-N(R^g)C(NR^g)R^e$ 、 $-N(R^g)N(R^g)C(O)R^e$ 、 $-N[C(O)R^e]NR^eR^e$ 、 $-N(R^g)C(S)R^e$ 、 $-N(R^g)S(O)R^e$ 、 $-N(R^g)S(O)OR^e$ 、 $-N(R^g)S(O)_2R^e$ 、 $-N[S(O)_2R^e]_2$ 、 $-N(R^g)S(O)_2OR^e$ 、 $-N(R^g)S(O)_2NR^eR^e$ 、 $-N(R^g)[S(O)_2]_2R^e$ 、 $-N(R^g)C(O)OR^e$ 、 $-N(R^g)C(O)SR^e$ 、 $-N(R^g)C(O)NR^eR^e$ 、 $-N(R^g)C(O)NR^gNR^eR^e$ 、 $-N(R^g)N(R^g)C(O)NR^eR^e$ 、 $-N(R^g)C(S)NR^eR^e$ 、 $-[N(R^g)C(O)]_2R^e$ 、 $-N(R^g)[C(O)]_2R^e$ 、 $-N\{[C(O)]_2R^e\}_2$ 、 $-N(R^g)[C(O)]_2OR^e$ 、 $-N(R^g)[C(O)]_2NR^eR^e$ 、 $-N\{[C(O)]_2OR^e\}_2$ 、 $-N\{[C(O)]_2NR^eR^e\}_2$ 、 $-[N(R^g)C(O)]_2OR^e$ 、 $-N(R^g)C(NR^g)OR^e$ 、 $-N(R^g)C(NOH)R^e$ 、 $-N(R^g)C(NR^g)SR^e$ および $-N(R^g)C(NR^g)NR^eR^e$ の中から互いに独立して選択され、

R^e はそれぞれ、互いに独立して、水素、または C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{6-10} アリール、3～8員のヘテロシクロアルキルおよび5～12員のヘテロアリールの中から選択される基を表し、

R^g はそれぞれ、互いに独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{6-10} アリール、3～8員のヘテロシクロアルキルまたは5～12員のヘテロアリールを表し、

p は、互いに独立して、1、2、3または4を表し、

但し、 X が O である場合、 R^3 は存在せず、そして

但し、 X が $-N-$ を表す場合、

R^1 および $R^{1'}$ は水素を表し、 R^3 および R^4 は水素以外であり、そして

但し、 R^2 は、ベンジルではない)

の化合物、または場合により前記化合物の互変異性体、ラセミ体、鏡像異性体、ジアステレオマー、水和物、同位体もしくはそれらの混合物の形態、または場合によりそれらの薬理的に許容される塩の形態。

【請求項2】

X が N である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R^3 が $-C(O)R^c$ である、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

X が O である、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

R^4 が、場合により置換されている C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、フェニル、 C_{7-16} アリールアルキル、3～8員のヘテロシクロアルキル、4～14員のヘテロシクロアルキルアルキルおよび5～6員のヘテロアリールから選択される、請求項4に記載の化合物。

【請求項 6】

R^4 が $C_1 \sim 6$ アルキルである、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

R^2 が、 R^3 と一緒になって、オキソ含有ピロリジニル基を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

$R^{1'}$ が H である、請求項 1 から 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

R^1 が、場合により置換されている $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキルまたは $C_4 \sim 16$ シクロアルキルアルキルである、請求項 1 から 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

$R^{2'}$ が H である、請求項 1 から 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 11】

R^2 が、場合により置換されている $C_1 \sim 6$ アルキルである、請求項 1 から 10 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 12】

表 2 から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 13】

化合物 FP 1 ~ FP 349 から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 14】

請求項 1 から 13 のいずれか一項に記載の一般式 I の化合物、場合により前記化合物の互変異性体、ラセミ体、鏡像異性体、ジアステレオマー、水和物、同位体もしくはそれらの混合物の形態、またはそれらの薬理学的に許容される塩の形態を含有する、医薬調製物。

【請求項 15】

感染症、がんもしくは肥満の処置または予防に使用するための医薬調製物であって、請求項 1 から 13 のいずれか一項に記載の一般式 I の化合物、場合により前記化合物の互変異性体、ラセミ体、鏡像異性体、ジアステレオマー、水和物、同位体もしくはそれらの混合物の形態、またはそれらの薬理学的に許容される塩の形態を含有する、前記医薬調製物。

【請求項 16】

ピコルナウイルス感染の処置または予防のための医薬調製物であって、請求項 1 から 13 のいずれか一項に記載の一般式 I の化合物、場合により前記化合物の互変異性体、ラセミ体、鏡像異性体、ジアステレオマー、水和物、同位体もしくはそれらの混合物の形態、またはそれらの薬理学的に許容される塩の形態を含有する、前記医薬調製物。

【請求項 17】

活性物質として、請求項 1 から 13 のいずれか一項に記載の一般式 I の 1 つまたは複数の化合物、場合により前記化合物の互変異性体、ラセミ体、鏡像異性体、ジアステレオマー、水和物、同位体もしくはそれらの混合物の形態、またはそれらの薬理学的に許容される塩の形態を、場合により慣用的な賦形剤および / または担体と組み合わせて含有する、医薬調製物。

【請求項 18】

請求項 1 から 13 のいずれか一項に記載の一般式 I の化合物、および式 I とは異なる少なくとも 1 つのさらなる活性物質を含む医薬調製物であって、前記化合物が、場合により、互変異性体、ラセミ体、鏡像異性体、ジアステレオマー、水和物、同位体もしくはそれらの混合物の形態として存在するか、または上記の形態のすべての個々の薬理学的に許容される塩として存在する、前記医薬調製物。