

【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5年11月29日(2023.11.29)

【公開番号】特開2021-91671(P2021-91671A)

【公開日】令和3年6月17日(2021.6.17)

【年通号数】公開・登録公報2021-027

【出願番号】特願2020-196447(P2020-196447)

【国際特許分類】

A 6 1 K 3 1 / 5 3 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 3 8 3 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 3 8 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 1 / 1 8 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

10

【 F I 】

A 6 1 K 3 1 / 5 3

A 6 1 K 3 1 / 5 3 8 3

A 6 1 K 3 1 / 5 3 8 6

A 6 1 P 3 1 / 1 8

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1

20

【手続補正書】

【提出日】令和5年11月20日(2023.11.20)

【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】

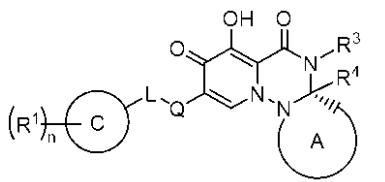
【特許請求の範囲】

【請求項1】

30

以下の式で示される化合物またはその製薬上許容される塩を含有する、医薬組成物。

【化1】



(式中、

A環は、置換もしくは非置換の非芳香族複素環であり；

40

C環は、ベンゼン環またはピリジン環であり；

Qは、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルキルオキシ、ハロアルキルオキシ、およびアルキルアミノからなる群から選択される1以上の置換基で置換されて置換されていてもよい5員または6員の芳香族複素環であり；

R¹は、それぞれ独立して、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルキルオキシ、シアノまたはハロアルキルオキシであり；

Lは、置換もしくは非置換のアルキレンであり；

R³は、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換の非芳香族炭素環式基または置換もしくは非置換の非芳香族複素環式基であり；

R⁴は、水素または置換もしくは非置換のアルキルであり；

50

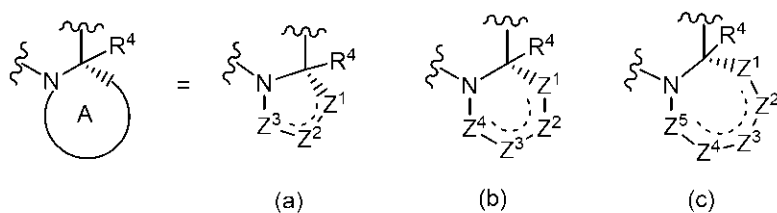
R^3 および R^4 、または R^3 および A 環上の置換基が、隣接する原子と一緒にあって、置換もしくは非置換の非芳香族複素環を形成してもよく；

n は、1 ~ 3 の整数である)

【請求項 2】

A 環が、以下のいずれかの環である請求項 1 記載の化合物またはその製薬上許容される塩を含有する、医薬組成物。

【化 2】



10

(式中、

R^4 は、水素または置換もしくは非置換のアルキルであり；

破線は、結合の存在または非存在を表し；

Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 Z^4 および Z^5 は、それぞれ独立して $CR^{5a}R^{5b}$ 、 CR^{5a} 、O、N、 NR^{5c} または S であり、ここで Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 Z^4 および Z^5 において A 環の環構造を構成するヘテロ原子の数は 0 または 1 個であり；

20

Z^1 と Z^3 、 Z^1 と Z^4 、 Z^1 と Z^5 、 Z^2 と Z^4 、 Z^2 と Z^5 、 Z^3 と Z^5 、 R^4 と Z^2 、 R^4 と Z^3 、 R^4 と Z^4 もしくは R^4 と Z^5 の間には、 NR^{5c} 、O および S から選択されるヘテロ原子が 1 個介在していてもよい置換もしくは非置換の C1 - C4 架橋が形成されていてもよく；

R^{5a} および R^{5b} は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、置換もしくは非置換のアルキルまたは置換もしくは非置換のアルキルオキシであり；

同一炭素原子上の R^{5a} および R^{5b} が一緒になって置換もしくは非置換の非芳香族炭素環または置換もしくは非置換の非芳香族複素環を形成してもよく；

R^{5c} は、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のアルキルカルボニル、置換もしくは非置換のアルキルオキシカルボニル、置換もしくは非置換のカルバモイル、置換もしくは非置換の芳香族炭素環式基、置換もしくは非置換の非芳香族炭素環式基、置換もしくは非置換の芳香族複素環式基または置換もしくは非置換の非芳香族複素環式基であり；

30

R^3 および R^4 が、隣接する原子と一緒にあって、置換もしくは非置換の非芳香族複素環を形成してもよい)

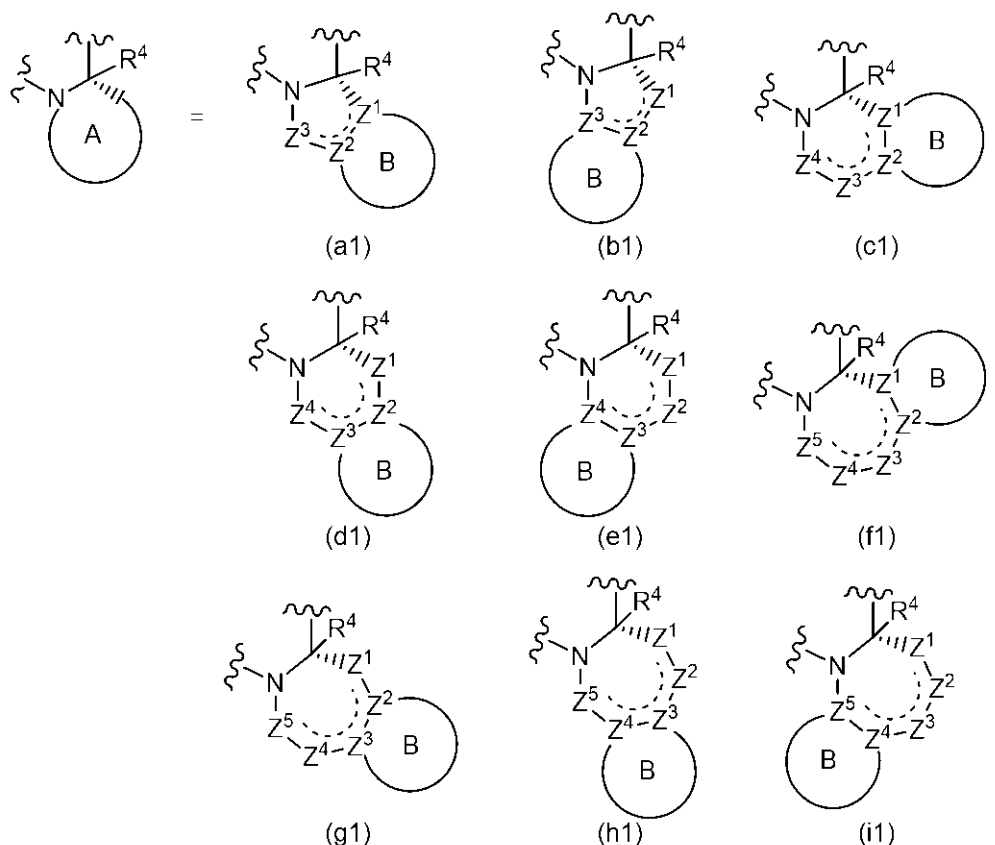
【請求項 3】

A 環が、以下のいずれかの環である、請求項 1 記載の化合物またはその製薬上許容される塩を含有する、医薬組成物。

40

50

【化 3】



10

20

(式中、

R⁴は、水素または置換もしくは非置換のアルキルであり；

破線は、結合の存在または非存在を表し；

B環は、置換もしくは非置換の炭素環または置換もしくは非置換の複素環であり；

Z¹、Z²、Z³、Z⁴およびZ⁵は、それぞれ独立してC R^{5 a} R^{5 b}、C R^{5 a}、C、O、N、N R^{5 c}またはSであり(ただし、B環の構成原子である場合は、C R^{5 a}、CまたはNである)；

30

Z¹とZ³、Z¹とZ⁴、Z¹とZ⁵、Z²とZ⁴、Z²とZ⁵、Z³とZ⁵、R⁴とZ²、R⁴とZ³、R⁴とZ⁴もしくはR⁴とZ⁵の間には、N R^{5 c}、OおよびSから選択されるヘテロ原子が1個介在していてもよい置換もしくは非置換のC₂-C₄架橋が形成されていても良く；

R^{5 a}およびR^{5 b}は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換のアルキルまたは置換もしくは非置換のアルキルオキシであり；

同一炭素原子上のR^{5 a}およびR^{5 b}が一緒になって置換もしくは非置換の非芳香族炭素環または置換もしくは非置換の非芳香族複素環を形成してもよく；

R^{5 c}は、水素、置換もしくは非置換のアルキル、置換もしくは非置換のアルキルカルボニル、置換もしくは非置換のアルキルオキシカルボニル、置換もしくは非置換のカルバモイル、置換もしくは非置換の芳香族炭素環式基、置換もしくは非置換の非芳香族炭素環式基、置換もしくは非置換の芳香族複素環式基または置換もしくは非置換の非芳香族複素環式基であり；

40

R³およびR⁴が、隣接する原子と一緒に、置換もしくは非置換の非芳香族複素環を形成してもよい)

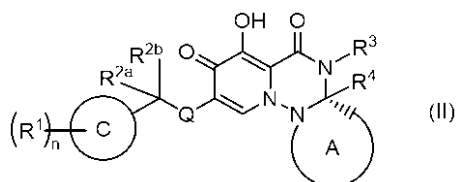
【請求項 4】

以下の式で示される請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩を含有する、医薬組成物。

式 (I I) :

50

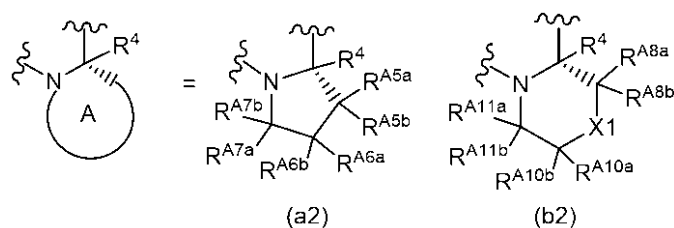
【化 4】



(式中、

A環は、以下の環であり；

【化 5】



X 1 は、C R A 9 a R A 9 b または O であり；

R A 5 a、R A 5 b、R A 6 a、R A 6 b、R A 7 a および R A 7 b は、それぞれ独立して、水素、アルキル、アルキルオキシまたはアルキルオキシアルキルであり；

R A 5 a および R A 6 a、または R A 6 a および R A 7 a が、隣接する原子と一緒にあって、ハロゲンで置換されていてもよい芳香族炭素環、ハロゲンで置換されていてもよい 3 - 6 員の非芳香族炭素環またはハロゲンで置換されていてもよい 4 - 6 員の非芳香族複素環を形成してもよく（ただし、芳香族炭素環を形成する場合は、R A 5 b および R A 6 b、または R A 6 b および R A 7 b は一緒になって結合を形成する）；

R A 5 b および R A 6 b は、一緒になって結合を形成してもよく；

R A 8 a、R A 8 b、R A 9 a、R A 9 b、R A 10 a、R A 10 b、R A 11 a および R A 11 b は、それぞれ独立して、水素、アルキル、アルキルオキシまたはアルキルオキシアルキルであり；

R A 8 a および R A 10 a は、一緒になって C 1 - C 3 架橋を形成してもよく；

R A 10 a および R A 11 a は、隣接する原子と一緒にあって、5 員の非芳香族炭素環を形成してもよく；

R A 9 a および R A 9 b は、隣接する原子と一緒にあって、4 員の非芳香族炭素環または 5 員の非芳香族複素環を形成してもよく；

R A 8 a および R A 9 a が、一緒になって結合を形成してもよく；

C 環は、ベンゼン環またはピリジン環であり；

Q は、5 員の芳香族複素環であり；

R 1 は、それぞれ独立して、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルキルオキシ、シアンまたはハロアルキルオキシであり；

R 2 a および R 2 b は、それぞれ独立して、水素、アルキルまたはハロアルキルであり；

R 3 は、アルキルまたはハロアルキルであり；

R 4 は、水素またはアルキルであり；

n は、1 ~ 3 の整数である）

【請求項 5】

R 3 がアルキルまたはハロアルキルである、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩を含有する、医薬組成物。

【請求項 6】

R 3 がアルキルである、請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩を含有する、医薬組成物。

10

20

30

40

50

【請求項 7】

R⁴ が水素またはアルキルである、請求項 1 ~ 3、5 または 6 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩を含有する、医薬組成物。

【請求項 8】

R¹ がそれぞれ独立して、ハロゲン、アルキルまたはハロアルキルである、請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩を含有する、医薬組成物。

【請求項 9】

R¹ がそれぞれ独立して、ハロゲンである、請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩を含有する、医薬組成物。

【請求項 10】

R^{2a} が水素であり、R^{2b} が水素またはアルキルである、請求項 4、6、8 および 9 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩を含有する、医薬組成物。

10

【請求項 11】

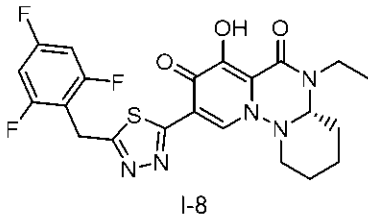
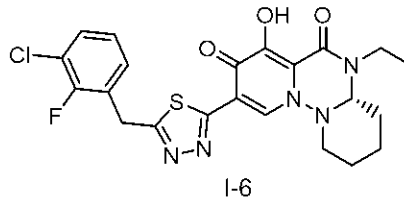
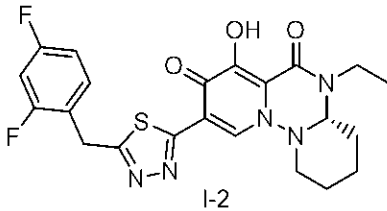
Q が 5 員の芳香族複素環である、請求項 1 ~ 3 または 5 ~ 9 のいずれかに記載の化合物またはその製薬上許容される塩。

【請求項 12】

以下の化合物 I - 2、I - 6、I - 8、II - 3、II - 18、II - 23、II - 24、II - 27、II - 29、II - 33、II - 37、II - 38、II - 44、II - 48、II - 50、II - 51、II - 52、II - 54、II - 55、II - 56、II - 57、II - 58、II - 61、II - 62、II - 63、II - 65、II - 67 および II - 68 ；

20

【化 6】

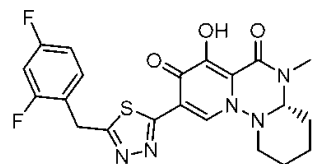


30

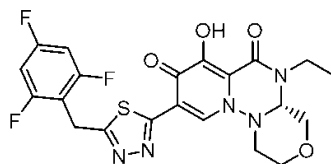
40

50

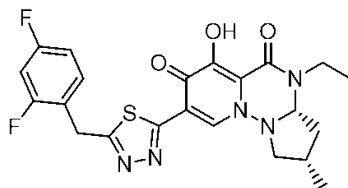
【化 7】



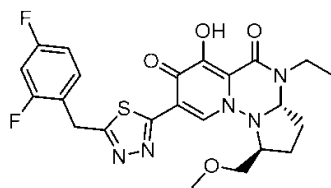
II-3



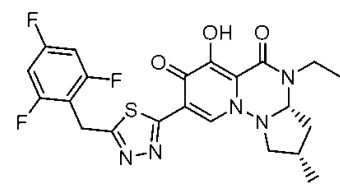
II-18



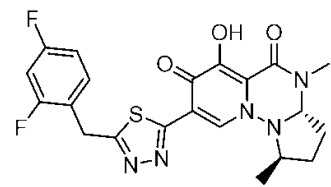
II-23



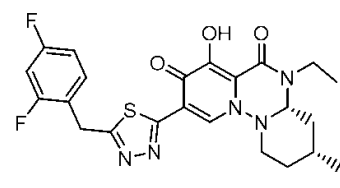
II-24



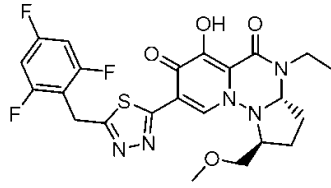
II-27



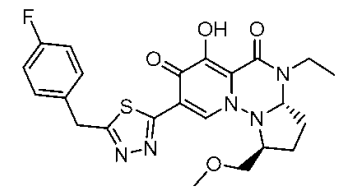
II-29



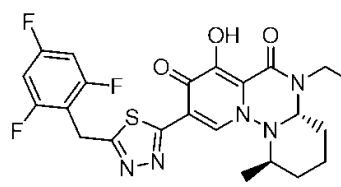
II-33



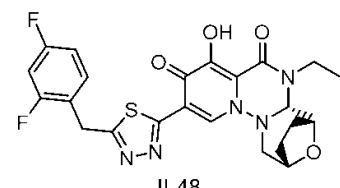
II-37



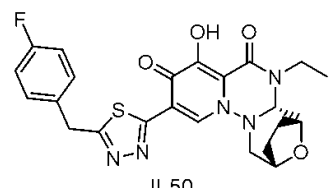
II-38



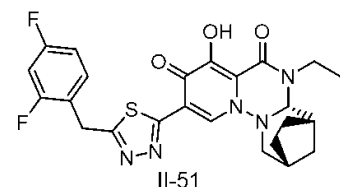
II-44



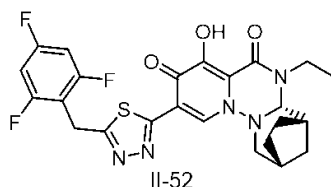
II-48



II-50



II-51



II-52

10

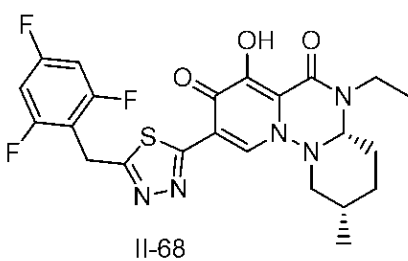
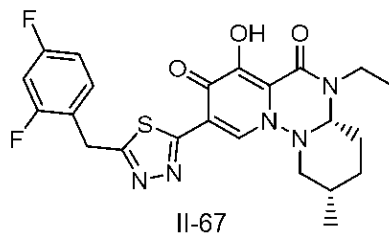
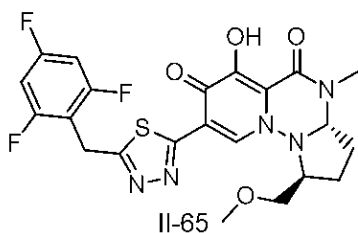
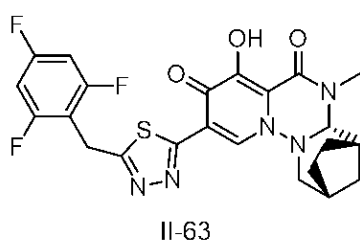
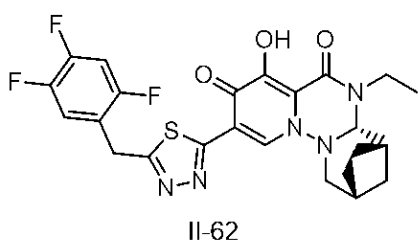
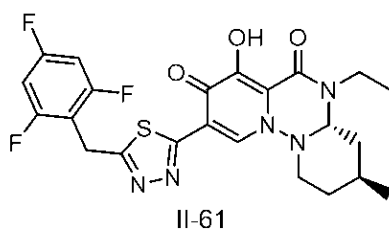
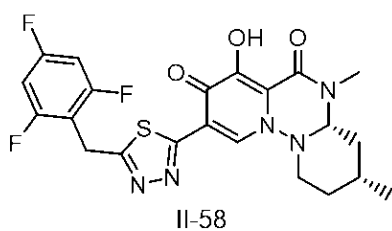
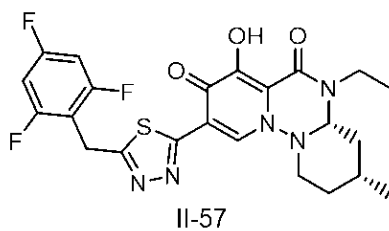
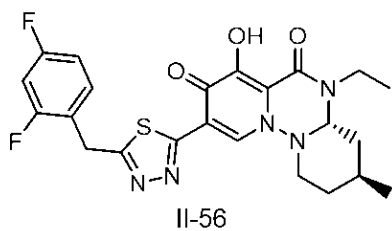
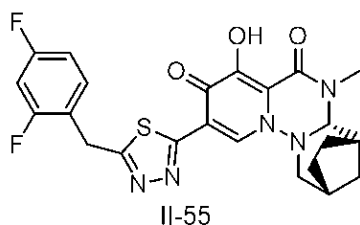
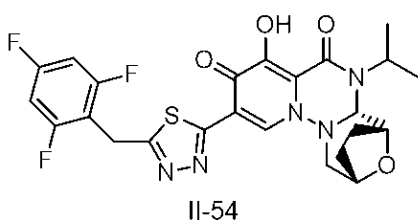
20

30

40

50

【化 8】



10

20

30

40

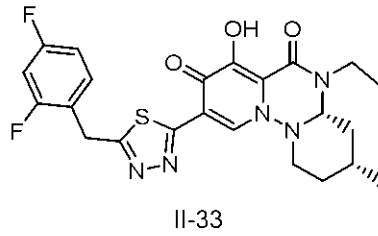
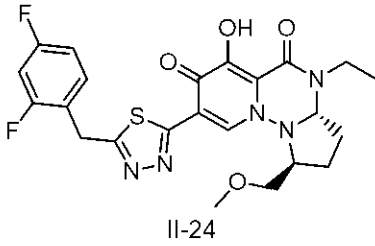
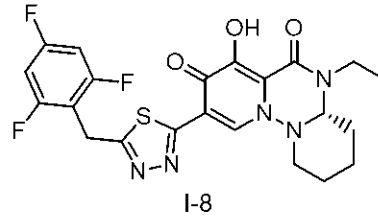
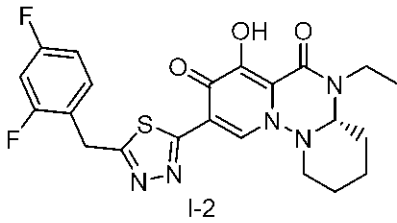
からなる群から選択される、請求項 1 記載の化合物またはその製薬上許容される塩を含有する、医薬組成物。

【請求項 1 3】

以下のいずれかの化合物またはその製薬上許容される塩を含有する、医薬組成物。

50

【化 9】



10

【請求項 1 4】

抗 HIV 剤である、請求項 1 ~ 1 3 のいずれかに記載の医薬組成物。

20

30

40

50