

【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】平成20年2月7日(2008.2.7)

【公表番号】特表2007-516983(P2007-516983A)
 【公表日】平成19年6月28日(2007.6.28)
 【年通号数】公開・登録公報2007-024
 【出願番号】特願2006-545846(P2006-545846)
 【国際特許分類】

C 0 7 D 471/14 (2006.01)
 C 0 7 D 487/04 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4188 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4985 (2006.01)
 A 6 1 K 31/55 (2006.01)
 A 6 1 K 31/437 (2006.01)
 C 0 7 D 487/14 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
 A 6 1 K 31/422 (2006.01)
 A 6 1 K 31/433 (2006.01)
 A 6 1 K 31/427 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4196 (2006.01)
 A 6 1 K 31/454 (2006.01)
 A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
 A 6 1 K 31/506 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4709 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4725 (2006.01)
 A 6 1 K 31/428 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4245 (2006.01)
 A 6 1 P 31/14 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/14 1 0 2
 C 0 7 D 487/04 1 3 8
 A 6 1 K 31/4188
 C 0 7 D 487/04 1 4 0
 A 6 1 K 31/4985
 C 0 7 D 487/04 1 5 2
 A 6 1 K 31/55
 A 6 1 K 31/437
 C 0 7 D 487/14 C S P
 A 6 1 K 31/4439
 A 6 1 K 31/422
 A 6 1 K 31/433
 A 6 1 K 31/427
 A 6 1 K 31/4196
 A 6 1 K 31/454
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 K 31/506
 A 6 1 K 31/4709
 A 6 1 K 31/4725
 A 6 1 K 31/428

A 6 1 K 31/4245

A 6 1 P 31/14

【手続補正書】

【提出日】平成19年12月14日(2007.12.14)

【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

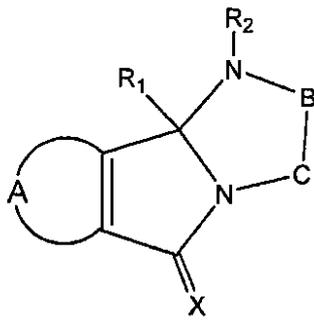
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

ニューモウイルス亜科 (Pneumovirinae) のウイルスが関与する感染の処置のための医薬を製造する際の、式 I の化合物、及び薬学的に許容されるそれらの塩又は誘導体の使用：

【化1】



式 I

[式中、

A は、それが結合している原子と一緒に場合によって置換された芳香環を形成し；

リンカー B - C は、それが結合している原子と一緒に場合によって置換された複素環を形成し；

R₁ は、C₁₋₁₂ アルキル、C₂₋₁₂ アルケニル、C₂₋₁₂ アルキニル、-(CH₂)_nC₃₋₇ シクロアルキル、-(CH₂)_nC₄₋₇ シクロアルケニル、-(CH₂)_n アリール、-(CH₂)_n アリール C₁₋₁₂ アルキル、-(CH₂)_n アリール C₂₋₁₂ アルケニル、-(CH₂)_n アリール C₂₋₁₂ アルキニル及び -(CH₂)_n ヘテロシクリルから選択され、ここで、n は 0 ~ 6 であり、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール及びヘテロシクリル基は場合によって置換されており；

R₂ は、-CH₂R₃、-C(Y)R₃、-C(Y)OR₃、-C(Y)N(R₄)R₃、-C(Y)CH₂N(R₄)R₃、-C(Y)CH₂SR₃ 及び -S(O)_wR₅ から選択され、ここで、R₃ は、水素、C₁₋₁₂ アルキル、C₂₋₁₂ アルケニル、C₂₋₁₂ アルキニル、-(CH₂)_mC₃₋₇ シクロアルキル、-(CH₂)_mC₄₋₇ シクロアルケニル、-(CH₂)_m アリール、-(CH₂)_m アリール C₁₋₁₂ アルキル、-(CH₂)_m アリール C₂₋₁₂ アルケニル、-(CH₂)_m アリール C₂₋₁₂ アルキニル及び -(CH₂)_m ヘテロシクリルから選択され、R₂ が -CH₂R₃ 又は -C(Y)R₃ である場合は、R₃ はさらに -S-R₅ 及び -O-R₅ から選択され、m は 0 ~ 6 であり、R₄ は水素又は C₁₋₆ アルキルであり、R₅ は、C₁₋₆ アルキル、C₂

~ 6 アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim 7$ シクロアルケニル、ベンジル、アリール又はヘテロシクリルであり、 w は 0、1 又は 2 であり、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール及びヘテロシクリル基は場合によって置換されており；

X 及び Y は、 O 、 S 及び NR_6 から独立して選択され、ここで、 R_6 は、水素、低級アルキル、ヒドロキシ及び低級アルコキシから独立して選択される]。

【請求項 2】

R_2 は、非置換の $-C_1 \sim 6$ アルキルでも、非置換の $-C(O)-C_1 \sim 6$ アルキルでもない、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 3】

環 A は、場合によって置換されたアリール環である、請求項 1 又は 2 に記載の使用。

【請求項 4】

環 A は、場合によって置換されたフェニル環である、請求項 3 に記載の使用。

【請求項 5】

環 A は、場合によって置換されたヘテロアリール環である、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 6】

環 A は、場合によって置換された、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピロリル、フリル、チエニル、イミダゾリル、オキサゾリル又はイソキサゾリル環を表す、請求項 1 又は 2 に記載の使用。

【請求項 7】

環 A は、場合によって置換された、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル又はピラジニル環である、請求項 6 に記載の使用。

【請求項 8】

環 A は、場合によって置換されたピリジル環である、請求項 7 に記載の使用。

【請求項 9】

環 A は、ハロ、 $-NH_2$ 、 NO_2 、 $C_1 \sim 6$ アルキル、アリール及びヘテロシクリルから独立して選択される 1 つ又は複数の置換基で場合によって置換されており、前記アリール及びヘテロシクリル基は、ハロ、 $C_1 \sim 6$ アルキル又はハロ置換 $C_1 \sim 6$ アルキルで場合によって置換されており、環 A が 1 つ又は複数の環窒素を含む場合は、前記場合による置換基には 1 つ又は複数の環窒素の N -オキッド及びそのピリジニウム塩からさらに選択される、請求項 1 から 8 の何れか 1 項に記載の使用。

【請求項 10】

環 A は、ハロ、アルキル、 C_6H_5- 、 $CH_3-C_6H_4-$ 、 $CF_3-C_6H_4-$ 、ピリジル、 NO_2 から選択される置換基で場合によって置換されており、環 A が 1 つ又は複数の環窒素を含む場合には、前記場合による置換基は環窒素の N -オキッド形態及び環窒素のピリジニウム塩からさらに選択される、請求項 9 に記載の使用。

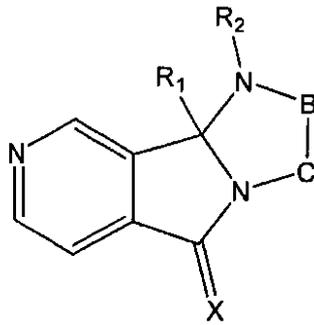
【請求項 11】

環 A は置換されていない、請求項 1 から 8 の何れか 1 項に記載の使用。

【請求項 12】

式 I V の化合物、又はその薬学的に許容される塩、 N -オキッド又は誘導体の請求項 1 に記載の使用：

【化 2】



式 IV

[式中、B - C、X、R₁ 及び R₂ は請求項 1 で定義した通りである]。

【請求項 1 3】

R₂ は、-CH₂R₃、-C(Y)R₃、-C(Y)OR₃、-C(Y)N(R₄)R₃、-C(Y)CH₂N(R₄)R₃、-C(Y)CH₂SR₃ 及び -S(O)_wR₅ から選択され、ここで、R₃ は、水素、-C₁₋₁₂アルキル、-C₂₋₁₂アルケニル、-C₂₋₁₂アルキニル、-(CH₂)_mC₃₋₇シクロアルキル、-(CH₂)_mC₄₋₇シクロアルケニル、-(CH₂)_mアリール、-(CH₂)_mアリールC₁₋₁₂アルキル、-(CH₂)_mアリールC₂₋₁₂アルケニル、-(CH₂)_mアリールC₂₋₁₂アルキニル、-(CH₂)_mヘテロシクリルから選択され、R₂ が -CH₂R₃ 又は -C(Y)R₃ である場合は、R₃ はさらに -S-R₅ 及び -O-R₅ から選択され、m は 0 ~ 6 であり、R₄ は水素又は C₁₋₆アルキルであり、R₅ は C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₇シクロアルキル、C₄₋₇シクロアルケニル、ベンジル、アリール及びヘテロシクリルから選択され、w は 0、1 又は 2 であり、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール及びヘテロシクリル基は、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、ハロ、(CF₃を含めた)ハロ-C₁₋₆アルキル、ヒドロキシ、メルカプト、ニトロ、シアノ、NH₂、モノ若しくはジ(C₁₋₆アルキル)アミノ、フェニル、ベンジル及びヘテロシクリルから選択される 1 つ又は複数の置換基で場合によって置換されている、請求項 1 から 1 2 までのいずれか一項に記載の使用。

【請求項 1 4】

R₂ は -CH₂-R₃ であり、R₃ は -(CH₂)_mアリール又は -(CH₂)_mヘテロシクリルであり、m は 0 から 3 であり、前記アリール又はヘテロシクリル環は、場合によって置換されている、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 1 5】

R₂ は -COR₃ であり、R₃ はアリール又はヘテロシクリルであり、かつ場合によって置換されている、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 1 6】

R₃ は場合によって置換されたフェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、H-ピロリル、ピロリニル、ピロリジニル、オキサゾリル、(1, 2, 3-及び1, 2, 4-オキサジアゾリルを含めた)オキサジアゾリル、チアゾリル、イソキサゾリル、フラザニル、イソチアゾリル、ピラゾリル、ピラゾリニル、ピラゾリジニル、イミダゾリル、イミダゾリニル、(1, 2, 3-及び1, 3, 4-トリアゾリルを含めた)トリアゾリル、テトラゾリル、(1, 2, 3-及び1, 3, 4-チアジアゾリルを含めた)チアジアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラニル、ピラジニル、ペペリジニル、1, 4-ジオキサニル、モルホリニル、1, 4-ジチアニル、チオモルホリニル、ペペラジニル、1, 3, 5-トリチアニル、トリアジニル、1H-チエノ[2, 3-c]ピラゾリ

ル、チエノ[2, 3-b]フリル、インドリル、イソインドリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、ベンゾキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイソキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、イソキノリニル、キノリニル、キノキサリニル、ウリジニル、プリニル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ベンゾトリアジニル、ナフチリジニル又はプテリジニルである、請求項14又は15に記載の使用。

【請求項17】

R_3 は、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、ハロ、(CF₃を含めた)ハロ- C_{1-6} アルキル、ヒドロキシ、メルカプト、ニトロ、シアノ、NH₂、モノ又はジ(C_{1-6} アルキル)アミノ、フェニル、ベンジル及びヘテロシクリルから選択される1つ又は複数の置換基で場合によって置換されている、請求項16に記載の使用。

【請求項18】

R_2 は、-CON(H) R_3 であり、 R_3 は-(CH₂)_mアリアル又は-(CH₂)_mヘテロアリアルであり、mは0から2であり、前記アリアル又はヘテロアリアル環は、ハロ、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ及びフェニルから独立して選択される1つ又は複数の置換基で場合によって置換されている、請求項1に記載の使用。

【請求項19】

連結-B-C-は、式-CH₂-(CH₂)_z-の場合によって置換された連結であり、ここで、zは1~4である、請求項1から18の何れか1項に記載の使用。

【請求項20】

zは1又は2である、請求項19に記載の使用。

【請求項21】

-B-C-は式-CH₂CH₂-のリンカーである、請求項1から18の何れか1項に記載の使用。

【請求項22】

リンカー-B-C-は、場合によって置換された3つ以下の場合による置換基であり、前記置換基はハロ、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、フェニル及びベンジルから選択される、請求項1から18の何れか1項に記載の使用。

【請求項23】

リンカー-B-C-は置換されていない、請求項1から18の何れか1項に記載の使用。

【請求項24】

Xは酸素又は硫黄である、請求項1から23のいずれか一項に記載の使用。

【請求項25】

R_1 は、場合によって置換されたアリアル又はヘテロシクリル基である、請求項1から24の何れか1項に記載の使用。

【請求項26】

R_1 は、フェニル、チエニル、ピロリル若しくはピリジル環又は- C_{1-6} アルキルフェニル基を表し、前記環はハロ、ヒドロキシ、ニトロ、-NR'R''(ここで、R'及びR''は、水素、低級アルキル及び-C(O)Rから独立して選択され、ここで、Rは、 C_{1-6} アルキル、フェニル又はヘテロシクリルである)、 C_{1-12} アルキル、フェニル及び-O-R_aで場合によって置換されており、ここで、R_aは、- C_{1-12} アルキル、- C_{3-7} シクロアルキル、- C_{1-12} アルキル C_{3-7} シクロアルキル、フェニル又は- C_{1-12} アルキルフェニルであり；前記 C_{1-12} アルキル、フェニル又はR_a基は、ハロ、-CN、-NR¹⁰R¹¹、-CO₂R¹²又は-CONR¹⁰R¹¹で場合によって置換され、ここで、R¹⁰、R¹¹及びR¹²は、水素又は低級アルキルから独立して選択される、請求項1に記載の使用。

【請求項27】

R_1 は、ハロ、- C_{1-6} アルキル、- C_{1-6} アルキルハロ、- C_{1-6} アルキルC

N、 $-OC_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキルハロ、 $-OC_{1-6}$ アルキル CO_2NH_2 、 $-OC_{1-6}$ アルキルCN、 $-OC_{1-6}$ アルキル C_{3-7} シクロアルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル C_6H_5 、 $-OC_{1-6}$ アルキル OCH_3 、 $-OC_6H_5$ 、 $-OC_6H_4$ ハロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-NR'R''$ (ここで、 R' 及び R'' は、水素、 $-C(O)C_{1-6}$ アルキル、 $-C(O)C_6H_5$ 、 $-C(O)CH=CHCO_2H$ 、 $-C(O)C_{1-6}$ アルキル CO_2H 、 $-C(O)C_{1-6}$ アルキル CO_2CH_3 、 $-C(O)C_{1-6}$ アルキル C_6H_5 、 $-C(O)C_{1-6}$ アルキル $C_6H_4CH_3$ 、 $-C(O)C_{1-6}$ アルキル $C_6H_4OCH_3$ 及び $-C(O)C_{1-6}$ アルキル C_6H_4 ハロから独立して選択される)、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2C_{1-6}$ アルキル、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $-C_6H_5$ 、 $-C_6H_4C_{1-6}$ アルキル、 $-C_6H_4$ ハロ及び $-OC(O)C_{1-6}$ アルキルから選択される置換基で場合によって置換されたフェニルである、請求項 1 から 24 の何れか 1 項に記載の使用。

【請求項 28】

R_1 は、ハロ、 $-OC_{1-6}$ アルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキルハロ、 $-OC_{1-6}$ アルキル CO_2NH_2 、 $-OC_{1-6}$ アルキルCN、 $-OC_{1-6}$ アルキル C_{3-7} シクロアルキル、 $-OC_{1-6}$ アルキル C_6H_5 又は $-OC_{1-6}$ アルキル OCH_3 で置換されたフェニルである、請求項 27 に記載の使用。

【請求項 29】

R_1 は 4-クロロフェニルである、請求項 28 に記載の使用。

【請求項 30】

請求項 1 から 29 までのいずれか一項に記載の式 I の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体の、ニューモウイルス亜科 (Pneumovirinae) のウイルスが関与する感染の処置のための医薬の製造における使用。

【請求項 31】

請求項 1 から 29 までのいずれか一項に記載の式 I の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体の、ウイルスの融合過程の阻害によりニューモウイルス亜科 (Pneumovirinae) のウイルスが関与する感染を処置するための医薬の製造における使用。

【請求項 32】

請求項 1 から 29 までのいずれか一項に記載の式 I の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体の、ニューモウイルス亜科 (Pneumovirinae) のウイルスに感染した哺乳動物を処置するための医薬の製造における使用。

【請求項 33】

請求項 1 から 29 までのいずれか一項に記載の式 I の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体の、哺乳動物へのニューモウイルス亜科 (Pneumovirinae) のウイルスの感染を予防するための医薬の製造における使用。

【請求項 34】

ニューモウイルス属 (Pneumovirus) 又はメタニューモウイルス属 (Metapneumovirus) のウイルスが関与する感染の処置のための医薬の製造における、請求項 1 から 33 までのいずれか一項に記載の使用。

【請求項 35】

呼吸器合胞体ウイルス (RSV) の処置のための医薬の製造における請求項 1 から 33 までのいずれか一項に記載の使用。

【請求項 36】

ヒト RSV 又はヒトメタニューモウイルス (Metapneumovirus) の処置のための医薬の製造における請求項 1 から 33 までのいずれか一項に記載の使用。

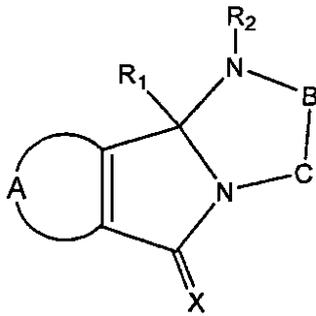
【請求項 37】

請求項 1 から 29 までのいずれか一項に記載の式 I の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体を含む、ニューモウイルス亜科 (Pneumovirinae) のウイルスが関与する感染の処置のための医薬製剤。

【請求項 38】

式 I の化合物、その塩及び薬学的に許容されるそれらの誘導体：

【化 3】



式 I

[式中、

A は、それが結合している原子と一緒に、場合によって置換された、フェニル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル又はピラジニル環を表し；

B - C は、式 $-CH_2 - (CH_2)_z -$ の場合によって置換された連結であり、ここで、z は 1 ~ 4 であり；

R₁ は、C₁ ~ C₁₂ アルキル、C₂ ~ C₁₂ アルケニル、C₂ ~ C₁₂ アルキニル、 $-(CH_2)_n C_3$ ~ C₇ シクロアルキル、 $-(CH_2)_n C_4$ ~ C₇ シクロアルケニル、 $-(CH_2)_n$ アリール、 $-(CH_2)_n$ アリール C₁ ~ C₁₂ アルキル、 $-(CH_2)_n$ アリール C₂ ~ C₁₂ アルケニル、 $-(CH_2)_n$ アリール C₂ ~ C₁₂ アルキニル、及び $-(CH_2)_n$ ヘテロシクリルから選択され、n は 0 ~ 6 であり、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール及びヘテロシクリル基は場合によって置換されており；

R₂ は、 $-CH_2 R_3$ 、 $-C(Y)R_3$ 、 $-C(Y)OR_3$ 、 $-C(Y)N(R_4)R_3$ 及び $-S(O)_w R_5$ から選択され、ここで、R₃ は、水素、C₁ ~ C₁₂ アルキル、C₂ ~ C₁₂ アルケニル、C₂ ~ C₁₂ アルキニル、 $-(CH_2)_m C_3$ ~ C₇ シクロアルキル、 $-(CH_2)_m C_4$ ~ C₇ シクロアルケニル、 $-(CH_2)_m$ アリール、 $-(CH_2)_m$ アリール C₁ ~ C₁₂ アルキル、 $-(CH_2)_m$ アリール C₂ ~ C₁₂ アルケニル、 $-(CH_2)_m$ アリール C₂ ~ C₁₂ アルキニル及び $-(CH_2)_m$ ヘテロシクリルから選択され、R₅ は、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₂ ~ C₆ アルキニル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₄ ~ C₇ シクロアルケニル、ベンジル又はヘテロシクリルであり；R₂ が $-CH_2 R_3$ 又は $-C(Y)R_3$ である場合は、R₃ はさらに $-S-R_5$ 及び $-O-R_5$ から選択され、R₅ は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₂ ~ C₆ アルキニル、C₃ ~ C₇ シクロアルキル、C₄ ~ C₇ シクロアルケニル、ベンジル、アリール又はヘテロシクリルであり；m は 0 ~ 6 であり；R₄ は水素又は C₁ ~ C₆ アルキルであり；w は 0、1 又は 2 であり；前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール及びヘテロシクリル基は場合によって置換されており；但し、R₂ は非置換 $-C_1$ ~ C₆ アルキルではなく；

X 及び Y は、O、S 及び NR₆ から独立して選択され、ここで、R₆ は水素、低級アルキル、ヒドロキシ及び低級アルコキシから独立して選択され；

但し、A がフェニルであり、かつ R₁ が 4-クロロフェニル又は非置換フェニルである場合には、

(i) R₂ が COR₃ である場合は、R₃ は非置換シクロプロピルでも、ハロメチルでも、非置換 C₃ アルケニルでもなく、非置換フェニルでもなく、ハロ、 $-CH_3$ 及び / 又は $-OCH_3$ 置換基のみを有するフェニルでもなく；

(i i) R_2 が $C(O)NHR_3$ である場合は、 R_3 は非置換フェニルでもなく、八口、 $-CH_3$ 、 $-OCH_3$ 及び / 又は $-C(O)OCH_2CH_3$ 置換基のみを有するフェニルでもなく；

(i i i) R_2 が $C(S)NHR_3$ である場合は、 R_3 は非置換フェニルでもなく、八口、 $-CH_3$ 、 $-OCH_3$ 及び / 又は $-C(O)OCH_2CH_3$ 置換基のみを有するフェニルでもなく；

但し、

(i v) A がフェニルであり、かつ R_2 が CH_2R_3 である場合は、 R_3 は水素でも、非置換フェニルでも、非置換 C_{1-6} アルキルでもなく、 OH 、 NH_2 、モノ又はジ C_{1-6} アルキルアミノ基のみで置換された C_{1-6} アルキルでもなく；

(v) A がフェニルであり、かつ R_1 が 4 - メトキシフェニルである場合は、 R_2 は CHO ではなく；

(v i) A がフェニルであり、 R_1 が八口、 C_{1-6} アルキル及び / 又は C_{1-6} アルコキシでのみ場合によって置換されたフェニルであり、かつ R_2 が COR_3 である場合は、 R_3 は C_{1-6} アルキル、八口、 N - ピペリジニル、 N - モルホリニル、 N - メチルピペラジニル及び $NR'R''$ から選択される 1 以上の置換基で場合によって置換されたメチルではなく、ここで、 R' 及び R'' はそれぞれ独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、ヒドロキシエチル、 p - ヒドロキシフェニル、3, 4 - メチレンジオキシベンジル、及び 1 以上の八口又は C_{1-6} アルコキシで場合によって置換されたベンジルから選択される；

(v i i) A がフェニルであり、かつ R_1 が 3 - CH_3 、4 - $CH_3CH_2CH_2NHC(O)CH_2O$ - フェニルである場合は、 R_2 は $-S(O)_2CH_2SO_2CH_3$ でも、 $-CHO$ でも、 $-COCH_2CH_3$ でも、 $-CH_2CH_2OH$ でも、 $-CH_2CH_2OCH_3$ でも、 $-CH_2CO_2C(CH_3)_3$ でも、 C_{1-6} アルキルでもなく；

(v i i i) A がピリジルであり、かつ R_1 が 3 - CH_3 、4 - $CH_3CH_2CH_2NHC(O)CH_2O$ - フェニルである場合は、 R_2 は CH_3 ではない]。

【請求項 39】

環 A がフェニルである場合、

(i) R_2 が $-CH_2R_3$ 又は $-COR_3$ である場合は、 R_3 は水素でも、場合によって置換された C_{1-6} アルキルでもなく；

(i i) R_2 が $-COR_3$ であり、かつ R_1 が 4 - クロロフェニル、4 - メトキシフェニル又は非置換フェニルである場合は、 R_3 は $(CH_2)_m$ ヘテロシクリル (ここで、 m は 1 又は 2 であり、前記ヘテロシクリル環はピペリジニル、モルホリニル、ピロリジニル、ピペラジニル、チオモルホリニルである) ではなく；

(i i i) R_2 はベンジルではなく；

但し、

(i v) A がピリジルである場合は、 R_2 は $-CH_3$ ではない、

請求項 38 に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項 40】

A はフェニルであり、 R_2 は $-CH_2R_3$ 又は $-C(O)R_3$ であり、 R_3 は、 C_{7-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル、 $-(CH_2)_mC_{3-7}$ シクロアルキル、 $-(CH_2)_mC_{4-7}$ シクロアルケニル、 $-(CH_2)_m$ アリール、 $-(CH_2)_m$ アリール C_{1-12} アルキル、 $-(CH_2)_m$ アリール C_{2-12} アルケニル、 $-(CH_2)_m$ アリール C_{2-12} アルキニル、 $-(CH_2)_m$ ヘテロシクリル、 $-SR_5$ 及び $-OR_5$ から選択される、請求項 38 に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項 41】

環 A は、八口、 $-NH_2$ 、 NO_2 、 C_{1-6} アルキル、アリール及びヘテロシクリルから独立して選択される 1 つ又は複数の置換基で場合によって置換されており、前記アリール及びヘテロシクリル基は、八口、 C_{1-6} アルキル又は八口置換された C_{1-6} アルキルで場合によって置換されており、環 A が 1 つ又は複数の環窒素を含む場合には、前記場

合による置換基の両方は、1つ又は複数の環窒素のN - オキシドからさらに選択される、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項42】

環Aは、ハロ、アルキル、 C_6H_5- 、 $CH_3-C_6H_4-$ 、 $CF_3-C_6H_4-$ 、ピリジル及び NO_2 から選択される置換基で場合によって置換されており、環Aが1つ又は複数の環窒素を含む場合は、その場合による置換基は環窒素のN - オキシド形態からさらに選択される、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項43】

環Aは置換されていない、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項44】

R_2 は、 $-CH_2R_3$ 、 $-C(Y)R_3$ 、 $-C(Y)OR_3$ 、 $-C(Y)N(R_4)R_3$ 、 $-C(Y)CH_2N(R_4)R_3$ 、 $-C(Y)CH_2SR_3$ 及び $-S(O)_wR_5$ から選択され、ここで、 R_3 は、水素、 $-C_{1-12}$ アルキル、 $-C_{2-12}$ アルケニル、 $-C_{2-12}$ アルキニル、 $-(CH_2)_mC_{3-7}$ シクロアルキル、 $-(CH_2)_mC_{4-7}$ シクロアルケニル、 $-(CH_2)_m$ アリール、 $-(CH_2)_m$ アリール C_{1-12} アルキル、 $-(CH_2)_m$ アリール C_{2-12} アルケニル、 $-(CH_2)_m$ アリール C_{2-12} アルキニル、 $-(CH_2)_m$ ヘテロシクリルから選択され、 R_5 は、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、 C_{4-7} シクロアルケニル、ベンジル又はヘテロシクリルであり； R_2 が $-CH_2R_3$ 又は $-C(Y)R_3$ である場合は、 R_3 は $-S-R_5$ 及び $-O-R_5$ からさらに選択され、 R_5 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_{3-7} シクロアルキル、 C_{4-7} シクロアルケニル、ベンジル、アリール又はヘテロシクリルであり； m は0~6であり； R_4 は水素又は C_{1-6} アルキルであり； w は0、1又は2であり；前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール及びヘテロシクリル基は、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、ハロ、 $(CF_3$ を含めた)ハロ $-C_{1-6}$ アルキル、ヒドロキシ、メルカプト、ニトロ、シアノ、 NH_2 、モノ又はジ(C_{1-6} アルキル)アミノ、フェニル、ベンジル及びヘテロシクリルから選択される1つ又は複数の置換基で場合によって置換されており、ここで、前記1以上の置換基は場合によって置換されている、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項45】

R_2 は $-CH_2-R_3$ であり、 R_3 は $-(CH_2)_m$ アリール又は $-(CH_2)_m$ ヘテロシクリルであり、 m は0から3であり、前記アリール又はヘテロシクリル環は場合によって置換されている、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項46】

R_2 は $-COR_3$ であり、 R_3 はアリール又はヘテロシクリルであり、かつ場合によって置換されている、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項47】

R_3 は、場合によって置換された、フェニル、ナフチル、フリル、チエニル、ピロリル、H - ピロリル、ピロリニル、ピロリジニル、オキサゾリル、(1, 2, 3 - 及び1, 2, 4 - オキサジアゾリルを含めた)オキサジアゾリル、チアゾリル、イソキサゾリル、フラザニル、イソチアゾリル、ピラゾリル、ピラゾリニル、ピラゾリジニル、イミダゾリル、イミダゾリニル、(1, 2, 3 - 及び1, 3, 4 - トリアゾリルを含めた)トリアゾリル、テトラゾリル、(1, 2, 3 - 及び1, 3, 4 - チアジアゾリルを含めた)チアジアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラニル、ピラジニル、ペペリジニル、1, 4 - ジオキサニル、モルホリニル、1, 4 - ジチアニル、チオモルホリニル、ピペ

ラジニル、1, 3, 5 - トリチアニル、トリアジニル、1H - チエノ[2, 3 - c]ピラゾリル、チエノ[2, 3 - b]フリル、インドリル、イソインドリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、ベンゾキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイソキサゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、イソキノリニル、キノリニル、キノキサリニル、ウリジニル、プリニル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ベンゾトリアジニル、ナフチリジニル又はプテリジニルである、請求項45又は46に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項48】

R_3 は、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、ハロ、(CF_3 を含めた)ハロ - C_{1-6} アルキル、ヒドロキシ、メルカプト、ニトロ、シアノ、 NH_2 、モノ又はジ(C_{1-6} アルキル)アミノ、フェニル、ベンジル及びヘテロシクリルから選択される1つ又は複数の置換基で場合によって置換されており、前記フェニル、ベンジル及びヘテロシクリル基は場合によって置換されている、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項49】

R_2 は - $CON(H)R_3$ であり、 R_3 は - $(CH_2)_m$ アリール又は - $(CH_2)_m$ ヘテロアリールであり、 m は0から2であり、前記アリール又はヘテロアリール環は、ハロ、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ及びフェニルから独立して選択される1つ又は複数の置換基で場合によって置換されている、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項50】

z は1又は2である、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項51】

- B - C - は式 - CH_2CH_2 - のリンカーである、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項52】

前記リンカー - B - C - は場合によって置換された3つを超えない場合による置換基であり、前記置換基はハロ、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、フェニル及びベンジルから選択される、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項53】

前記リンカー - B - C - は置換されていない、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項54】

Xは酸素又は硫黄である、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項55】

Xは酸素である、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項56】

R_1 は場合によって置換されたアリール又は場合によって置換されたヘテロシクリル基である、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項57】

R_1 は、フェニル、チエニル、ピロリル、ピリジル環又は - C_{1-6} アルキルフェニル基を表し、前記環は、ハロ、ヒドロキシ、ニトロ、- $NR'R''$ (ここで、 R' 及び R'' は水素、低級アルキル及び - $C(O)R$ から独立して選択され、ここで R は C_{1-6} アルキル、フェニル又はヘテロシクリルである)、 C_{1-12} アルキル、フェニル及び - $O-R_a$ で場合によって置換されており、ここで、 R_a は、- C_{1-12} アルキル、- C_{3-7} シクロアルキル、- C_{1-12} アルキル C_{3-7} シクロアルキル、フェニル又は - C_1

$\sim 1,2$ アルキルフェニルであり、前記 $C_{1 \sim 1,2}$ アルキル、フェニル又は R_a 基は、ハロ、 $-CN$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-CO_2R^{12}$ 又は $-CONR^{10}R^{11}$ で場合によって置換されているもよく、ここで、 R^{10} 、 R^{11} 及び R^{12} は水素又は低級アルキルから独立して選択される、請求項 38 に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項 58】

R_1 は、ハロ、 $-C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $-C_{1 \sim 6}$ アルキルハロ、 $-C_{1 \sim 6}$ アルキル CN 、 $-OC_{1 \sim 6}$ アルキル、 $-OC_{1 \sim 6}$ アルキルハロ、 $-OC_{1 \sim 6}$ アルキル CO_2N H_2 、 $-OC_{1 \sim 6}$ アルキル CN 、 $-OC_{1 \sim 6}$ アルキル $C_{3 \sim 7}$ シクロアルキル、 $-OC_{1 \sim 6}$ アルキル C_6H_5 、 $-OC_{1 \sim 6}$ アルキル OCH_3 、 $-OC_6H_5$ 、 $-OC_6H_4$ ハロ、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-NR'R''$ (ここで、 R 及び R'' は、水素、 $-C(O)C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $-C(O)C_6H_5$ 、 $-C(O)CH=CHCO_2H$ 、 $-C(O)C_{1 \sim 6}$ アルキル CO_2H 、 $-C(O)C_{1 \sim 6}$ アルキル CO_2CH_3 、 $-C(O)C_{1 \sim 6}$ アルキル C_6H_5 、 $-C(O)C_{1 \sim 6}$ アルキル $C_6H_4CH_3$ 、 $-C(O)C_{1 \sim 6}$ アルキル $C_6H_4OCH_3$ 及び $-C(O)C_{1 \sim 6}$ アルキル C_6H_4 ハロから独立して選択される)、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $-C_6H_5$ 、 $-C_6H_4C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $-C_6H_4$ ハロ及び $-OC(O)C_{1 \sim 6}$ アルキルから選択される置換基で場合によって置換されたフェニルである、請求項 38 に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項 59】

R_1 はハロ-フェニルである、請求項 38 に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項 60】

R_1 は 4-クロロフェニルである、請求項 38 に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項 61】

A は場合によって置換されたフェニル環である、請求項 38 に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

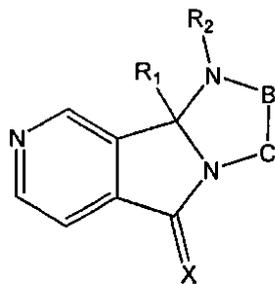
【請求項 62】

R_2 は $C(O)-R_3$ であり、 R_3 は $-(CH_2)_m$ -アリール又は $(CH_2)_m$ -ヘテロアリールであり、ここで、 m は 0 から 6 であり、前記アリール又はヘテロアリール基は場合によって置換されている、請求項 38 に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項 63】

式 IV の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体、又はその N-オキシド形態若しくはピリジウム塩

【化 4】



式 IV

[式中、

$B-C$ は、式 $-CH_2-(CH_2)_7-$ の場合によって置換された連結であり、ここで

、 z は 1 ~ 4 であり；

R_1 は、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル、 $-(CH_2)_n C_{3-7}$ シクロアルキル、 $-(CH_2)_n C_{4-7}$ シクロアルケニル、 $-(CH_2)_n$ アリール、 $-(CH_2)_n$ アリール C_{1-12} アルキル、 $-(CH_2)_n$ アリール C_{2-12} アルケニル、 $-(CH_2)_n$ アリール C_{2-12} アルキニル、及び $-(CH_2)_n$ ヘテロシクリルから選択され、 n は 0 ~ 6 であり、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール及びヘテロシクリル基は場合によって置換されており；

R_2 は、 $-CH_2 R_3$ 、 $-C(Y)R_3$ 、 $-C(Y)OR_3$ 、 $-C(Y)N(R_4)R_3$ 及び $-S(O)_w R_5$ から選択され、ここで、 R_3 は、水素、 C_{1-12} アルキル、 C_{2-12} アルケニル、 C_{2-12} アルキニル、 $-(CH_2)_m C_{3-7}$ シクロアルキル、 $-(CH_2)_m C_{4-7}$ シクロアルケニル、 $-(CH_2)_m$ アリール、 $-(CH_2)_m$ アリール C_{1-12} アルキル、 $-(CH_2)_m$ アリール C_{2-12} アルケニル、 $-(CH_2)_m$ アリール C_{2-12} アルキニル及び $-(CH_2)_m$ ヘテロシクリルから選択され、 R_2 が $-CH_2 R_3$ 又は $-C(Y)R_3$ である場合は、 R_3 は $-S-R_5$ 及び $-O-R_5$ から選択することもでき、 m は 0 ~ 6 であり、 R_4 は水素又は C_{1-6} アルキルであり、 R_5 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_{3-7} シクロアルキル、 C_{4-7} シクロアルケニル、ベンジル、アリール又はヘテロシクリルであり、 w は 0、1 又は 2 であり、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール及びヘテロシクリル基は場合によって置換されており；

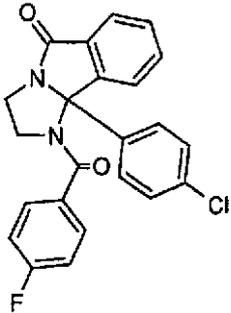
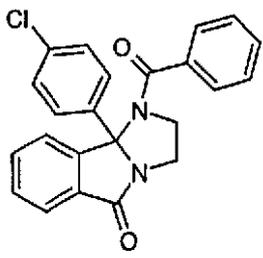
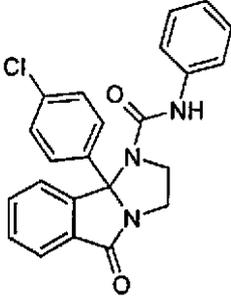
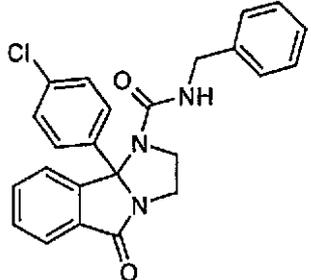
X 及び Y は、 O 、 S 及び $N R_6$ から独立して選択され、ここで、 R_6 は水素、低級アルキル、ヒドロキシ及び低級アルコキシから独立して選択される]。

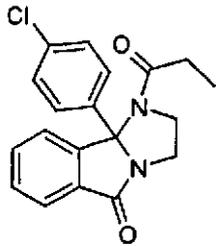
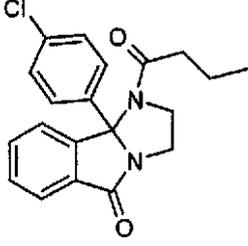
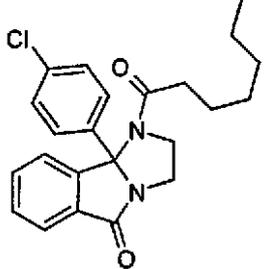
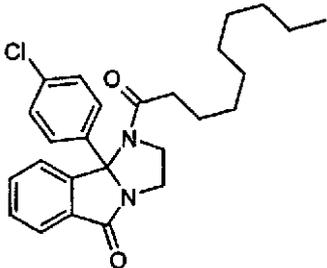
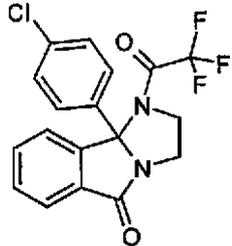
【請求項 6 4】

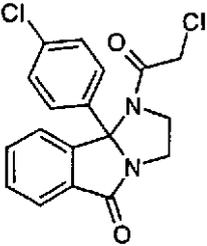
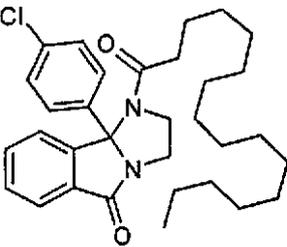
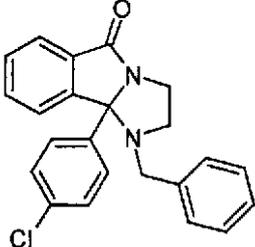
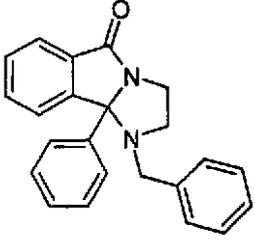
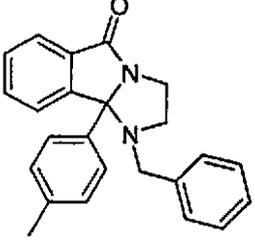
R_2 は $C(O)R_3$ であり、 R_3 は $-(CH_2)_m$ - アリール又は $(CH_2)_m$ - ヘテロアリールであり、ここで、 m は 0 から 6 であり、前記アリール又はヘテロアリール基は場合によって置換されている、請求項 6 3 に記載の化合物、又はその N - オキシド形態若しくはピリジウム塩。

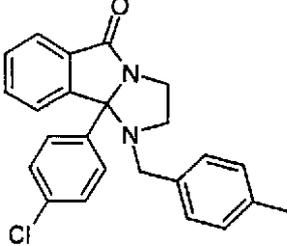
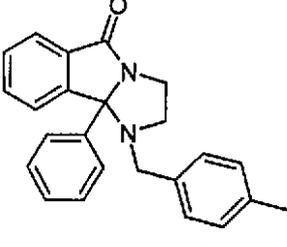
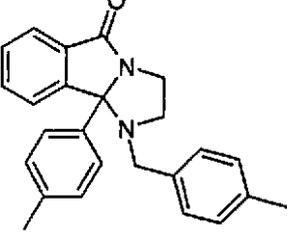
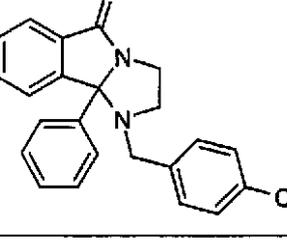
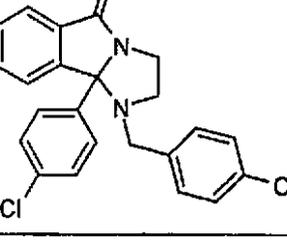
【請求項 6 5】

以下に示す 1 2 番から 5 0 2 番に示す化学構造の何れか 1 つを有する化合物。

No.	構造
12	
13	
14	
15	

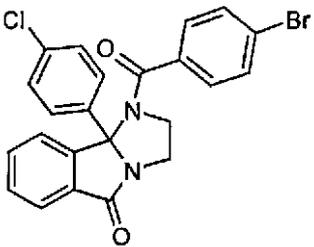
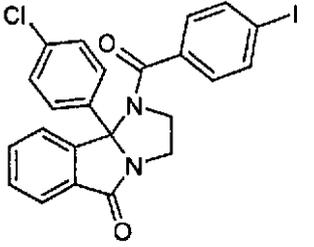
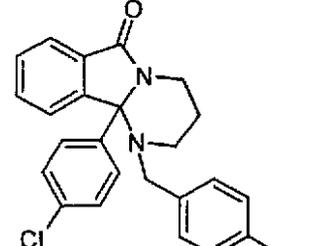
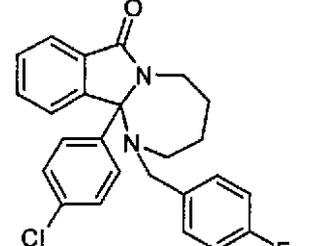
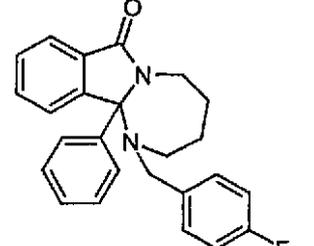
No.	構造
16	
17	
18	
19	
20	

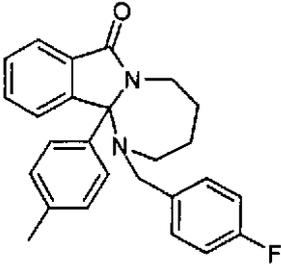
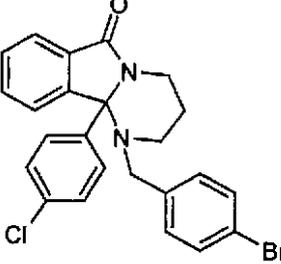
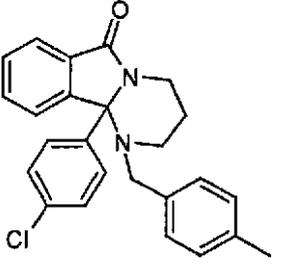
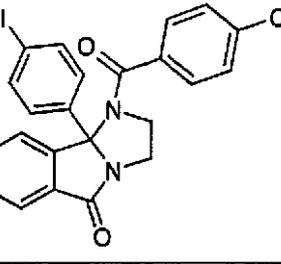
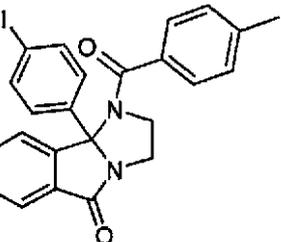
No.	構造
21	
22	
23	
24	
25	

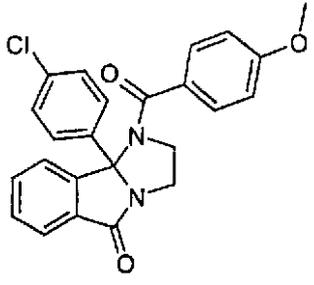
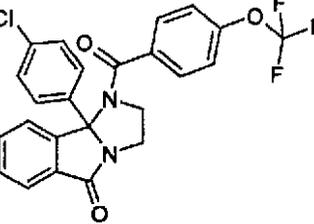
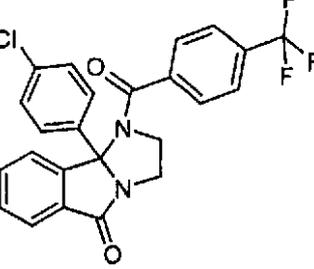
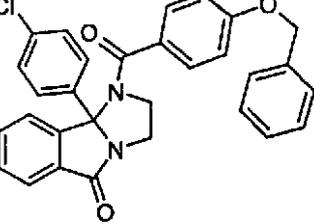
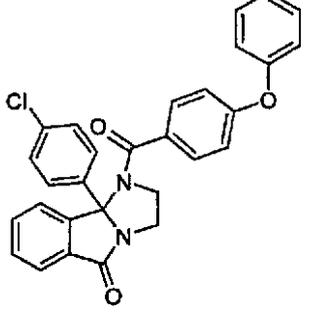
No.	構造
26	
27	
28	
29	
30	

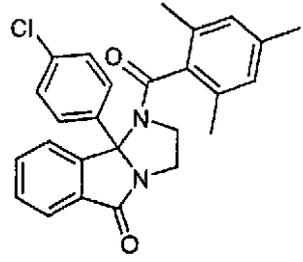
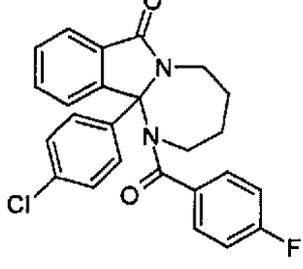
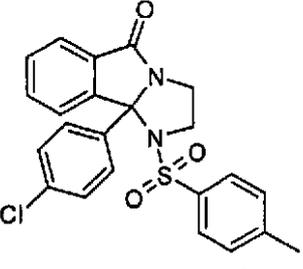
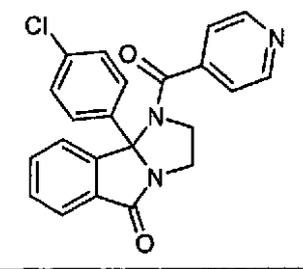
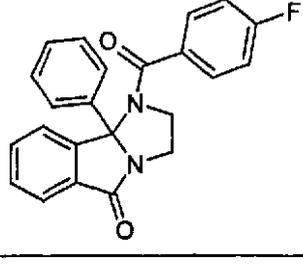
No.	構造
31	
32	
33	
34	
35	

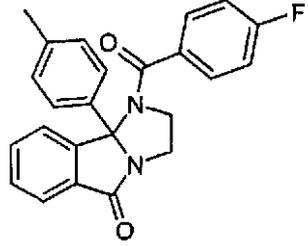
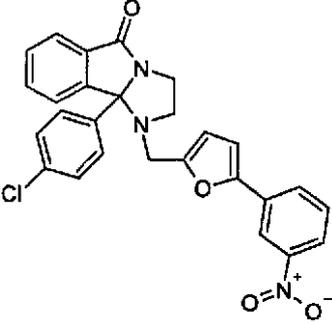
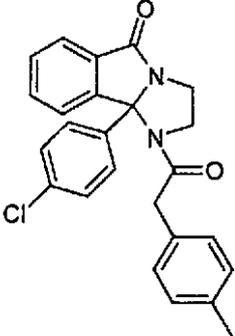
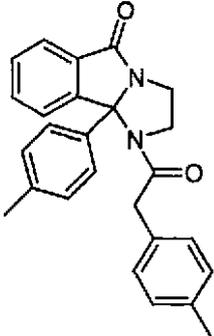
No.	構造
36	
37	
38	
39	
40	

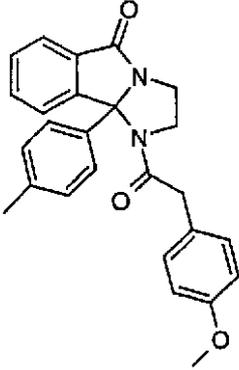
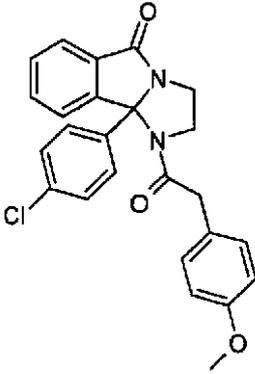
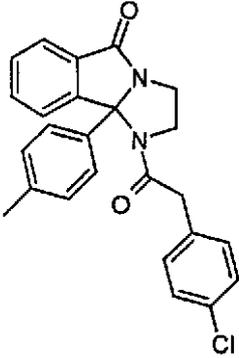
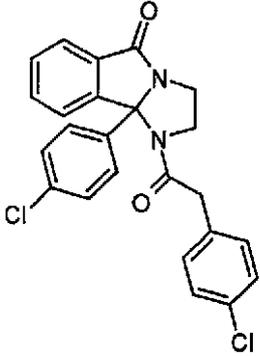
No.	構造
41	
42	
43	
44	
45	

No.	構造
46	
47	
48	
49	
50	

No.	構造
51	
52	
53	
54	
55	

No.	構造
56	
57	
58	
59	
60	

No.	構造
61	
62	
64	
65	

No.	構造
66	
67	
68	
69	

No.	構造
70	
71	
72	
73	

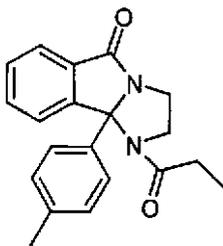
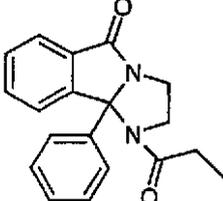
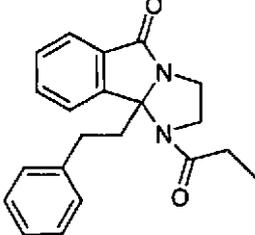
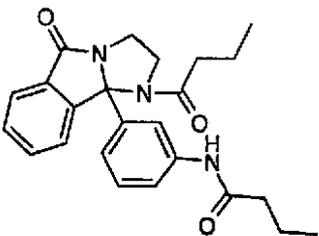
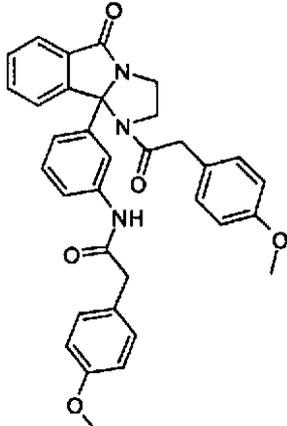
No.	構造
74	
75	
76	
77	
79	

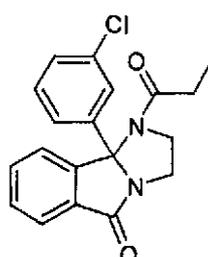
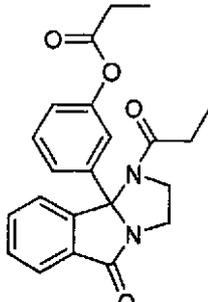
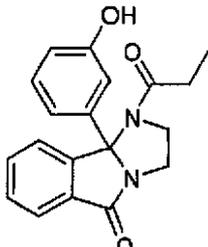
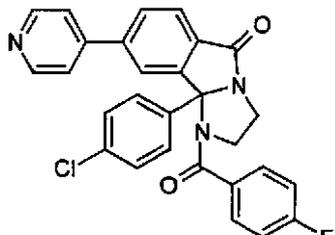
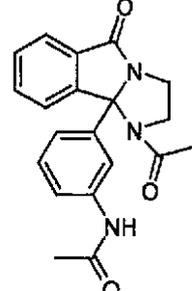
No.	構造
80	
81	
82	
83	
84	

No.	構造
85	
86	
87	
88	
89	

No.	構造
91	
94	
98	
99	
101	

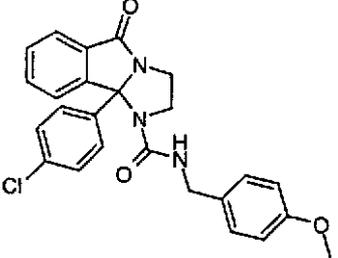
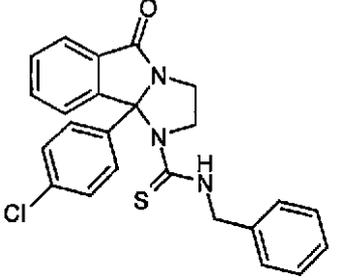
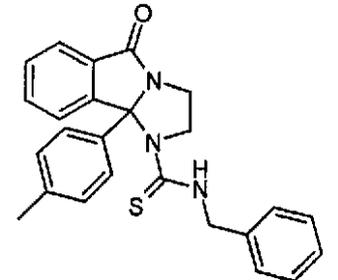
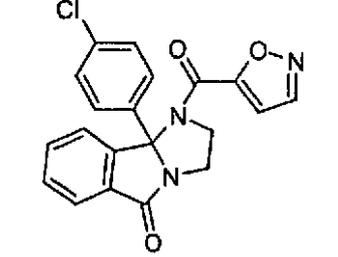
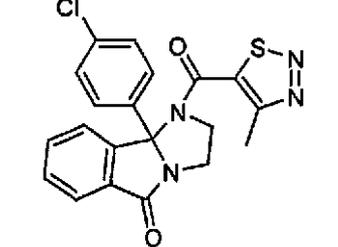
No.	構造
104	
105	
108	
109	
114	

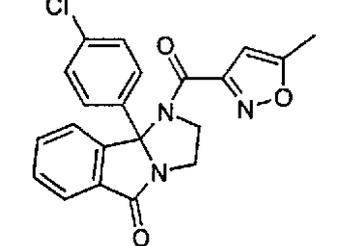
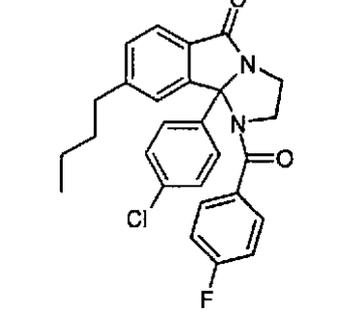
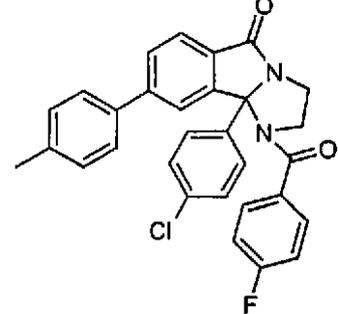
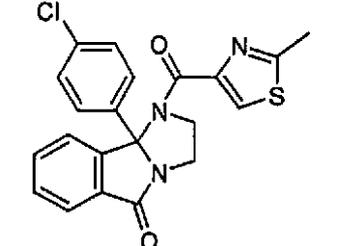
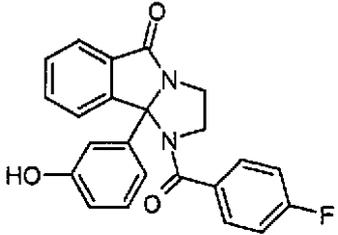
No.	構造
117	
118	
124	
125	
129	

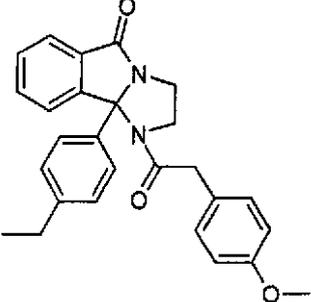
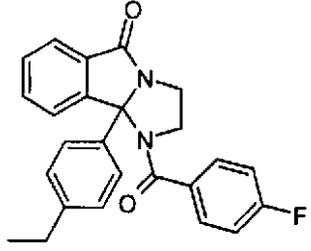
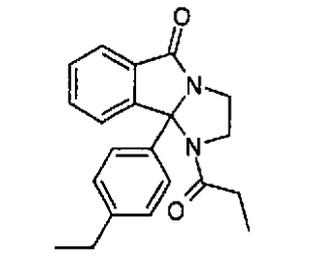
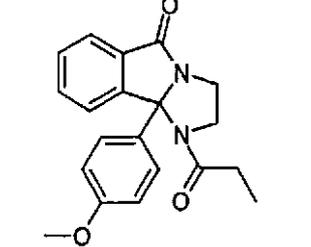
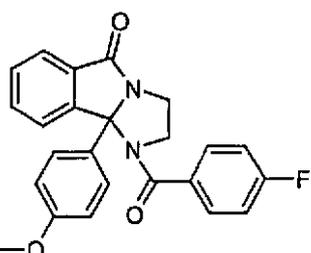
No.	構造
135	
137	
138	
139	
143	

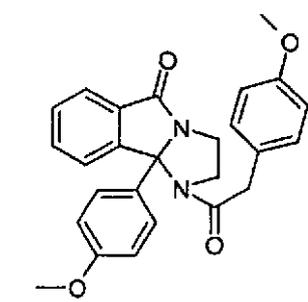
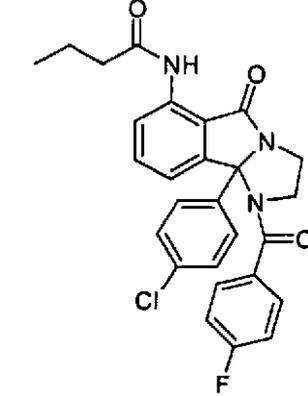
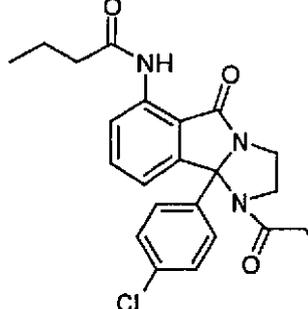
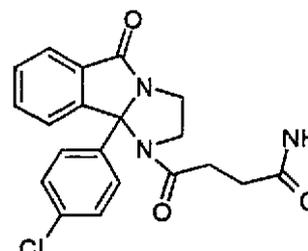
No.	構造
144	
145	
146	
147	
172	

No.	構造
173	
174	
175	
178	
179	

No.	構造
180	
181	
182	
183	
184	

No.	構造
185	
186	
187	
188	
189	

No.	構造
190	
191	
192	
193	
194	

No.	構造
195	
196	
197	
198	

No.	構造
199	
200	
201	
202	
203	

No.	構造
204	
205	
206	
207	
208	

No.	構造
209	
210	
211	
212	
213	

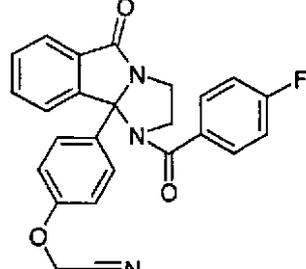
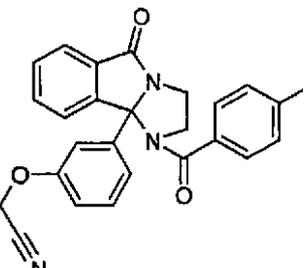
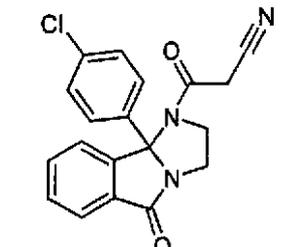
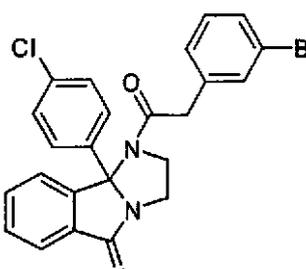
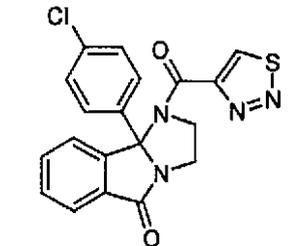
No.	構造
214	
215	
216	
217	
218	

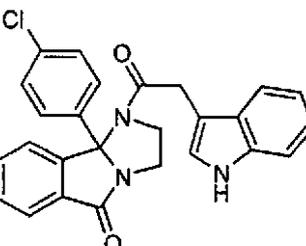
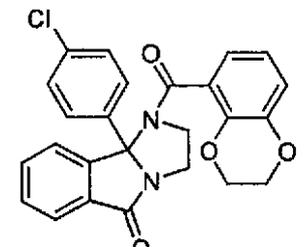
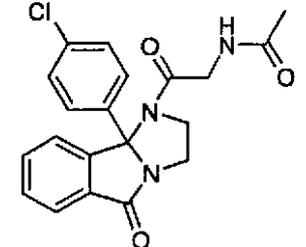
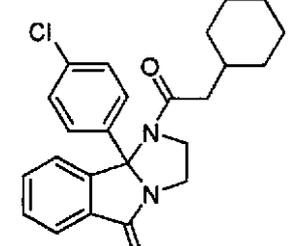
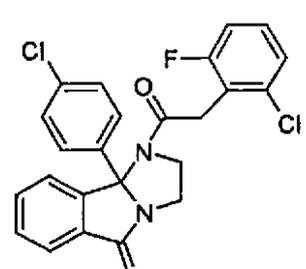
No.	構造
219	
220	
221	
222	
223	

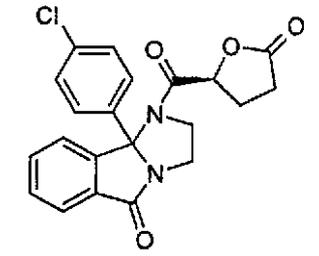
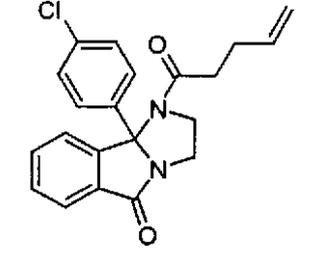
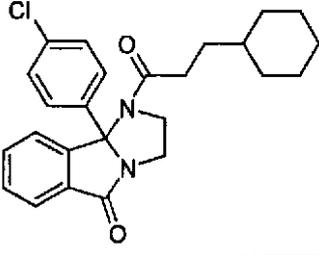
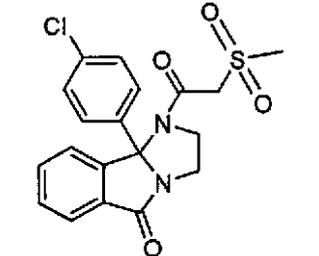
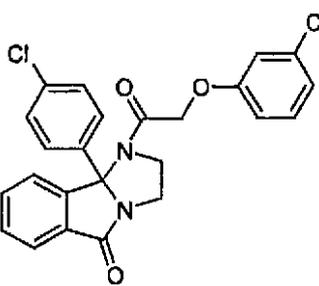
No.	構造
224	
225	
226	
227	
228	

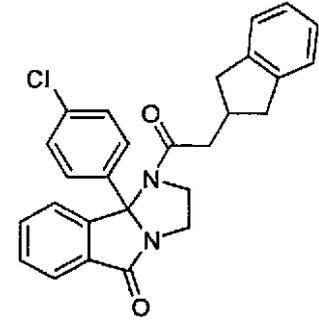
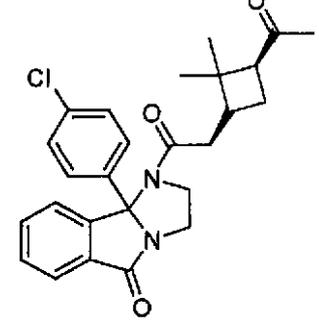
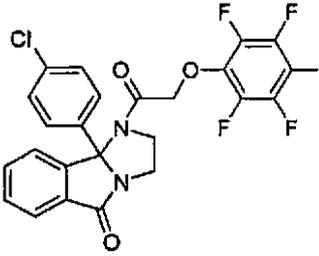
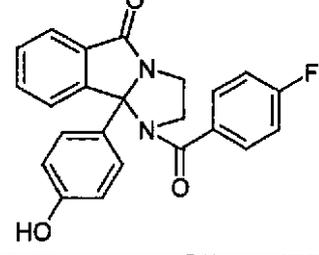
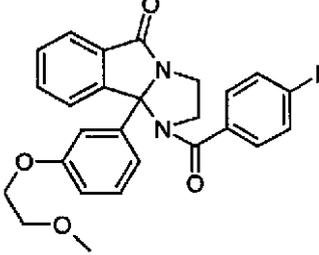
No.	構造
229	
230	
231	
232	
233	

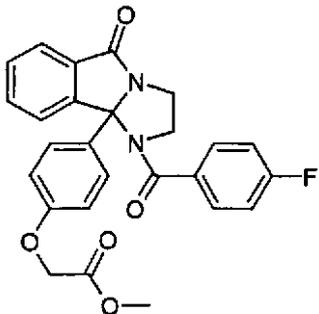
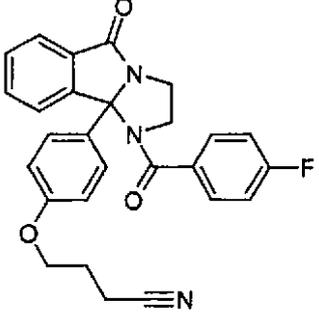
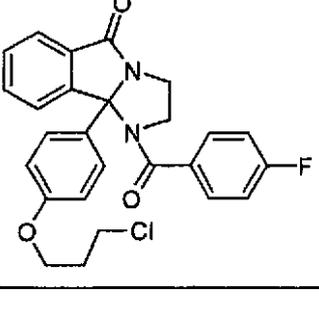
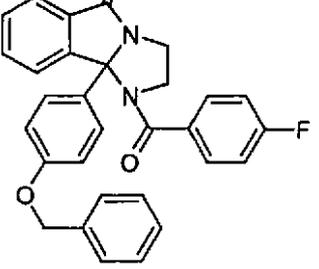
No.	構造
234	
235	
236	
237	
238	

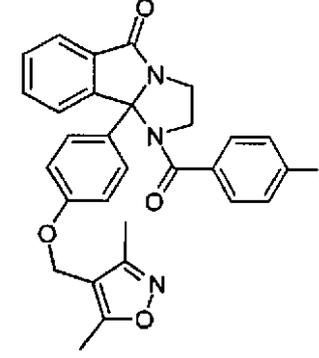
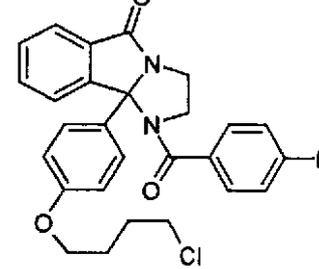
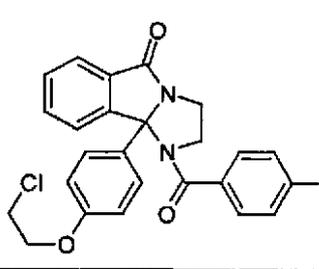
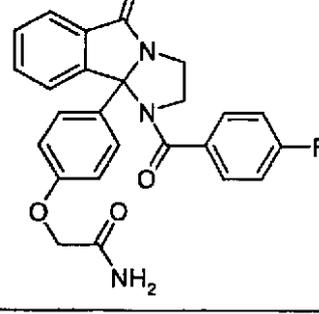
No.	構造
239	
240	
241	
242	
243	

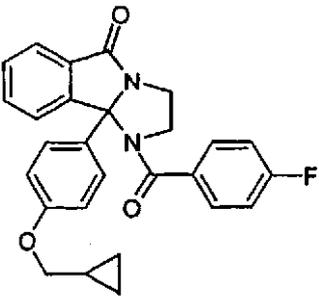
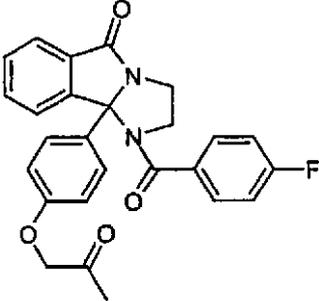
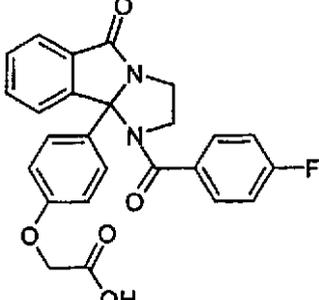
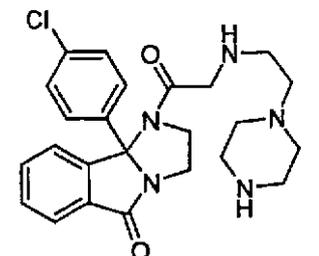
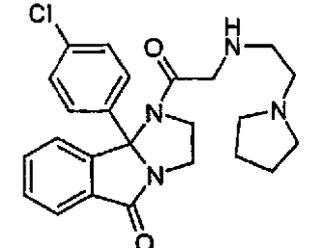
No.	構造
244	
245	
246	
247	
248	

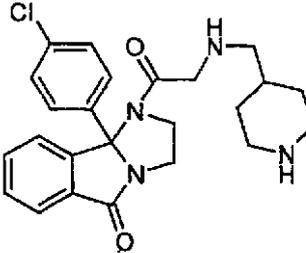
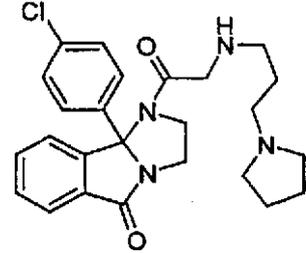
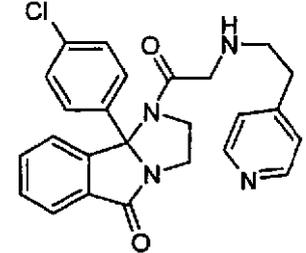
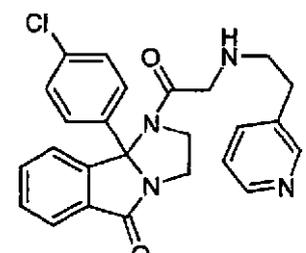
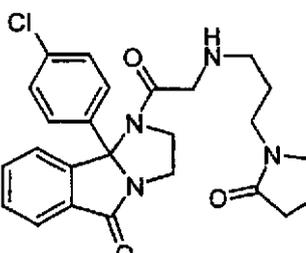
No.	構造
249	
250	
251	
252	
253	

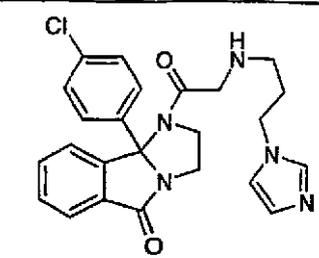
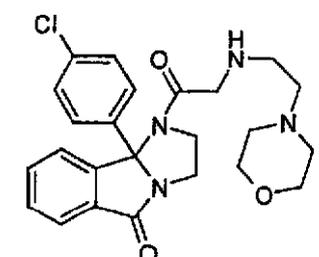
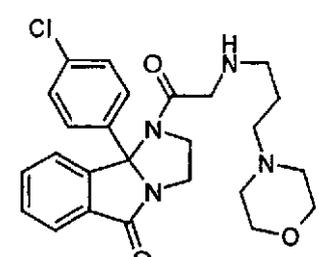
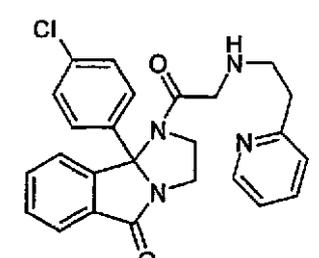
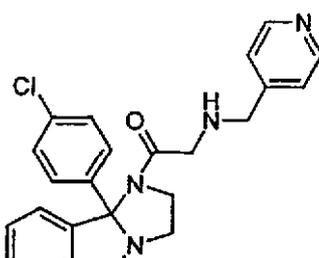
No.	構造
254	
255	
256	
257	
258	

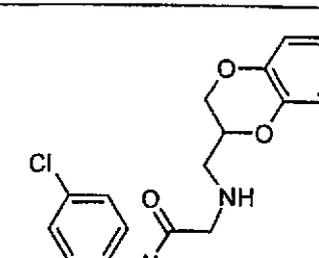
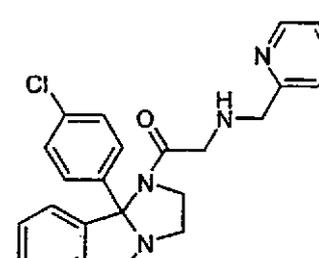
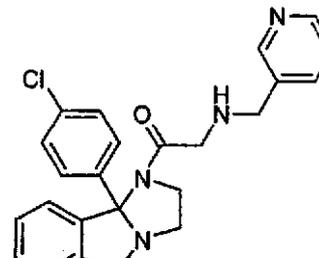
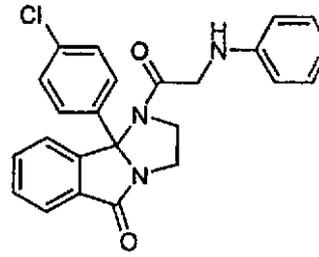
No.	構造
259	
260	
261	
262	

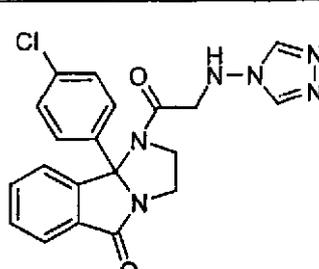
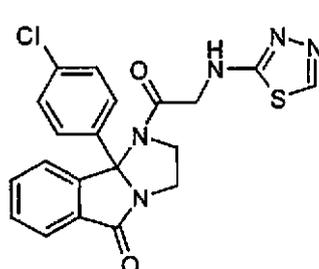
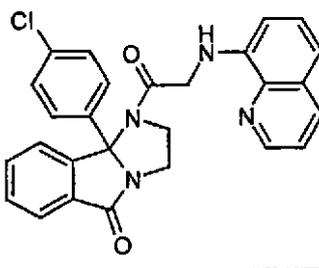
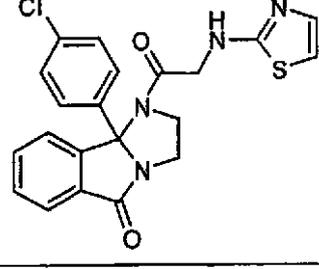
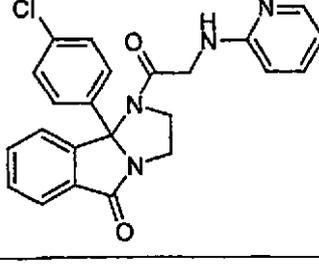
No.	構造
263	
264	
265	
266	

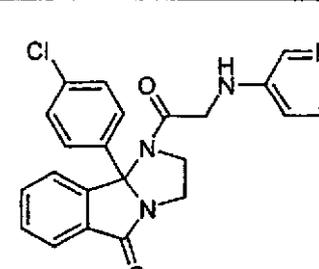
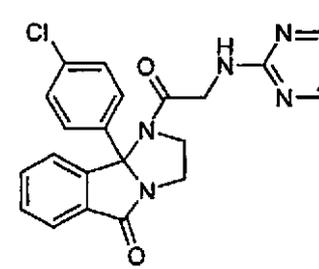
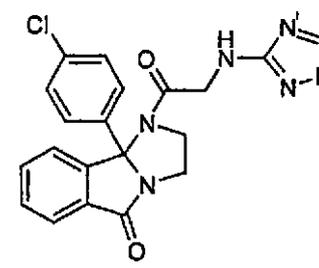
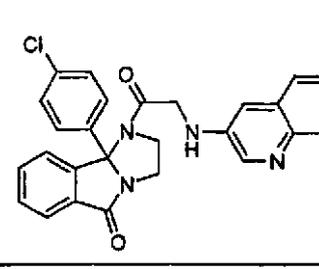
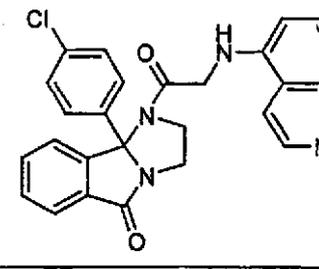
No.	構造
267	
268	
269	
270	
271	

No.	構造
272	
273	
274	
275	
276	

No.	構造
277	
278	
279	
280	
281	

No.	構造
282	
283	
284	
285	

No.	構造
286	
287	
288	
289	
290	

No.	構造
291	
292	
293	
294	
295	

No.	構造
296	
297	
298	
299	
300	

No.	構造
301	
302	
303	
304	
305	

No.	構造
306	
307	
308	
309	
310	

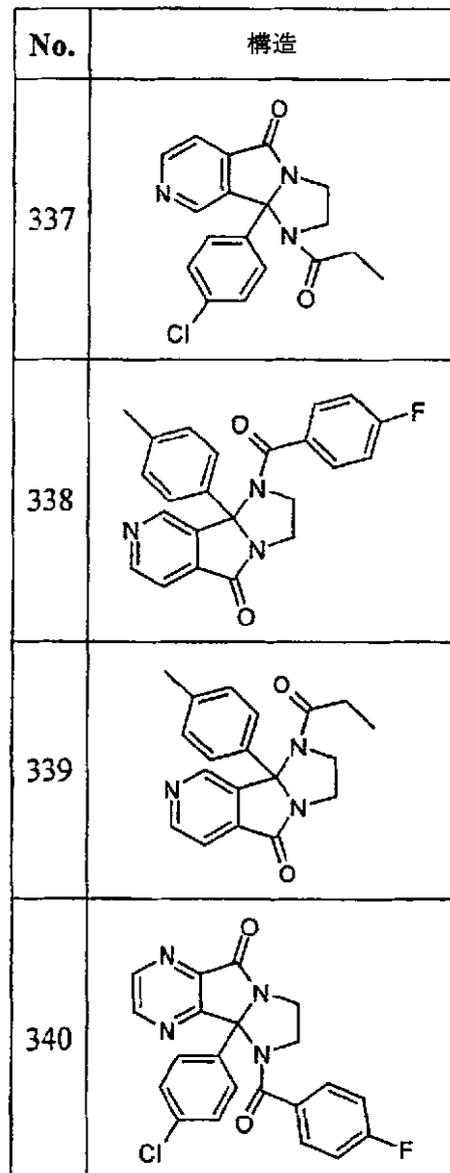
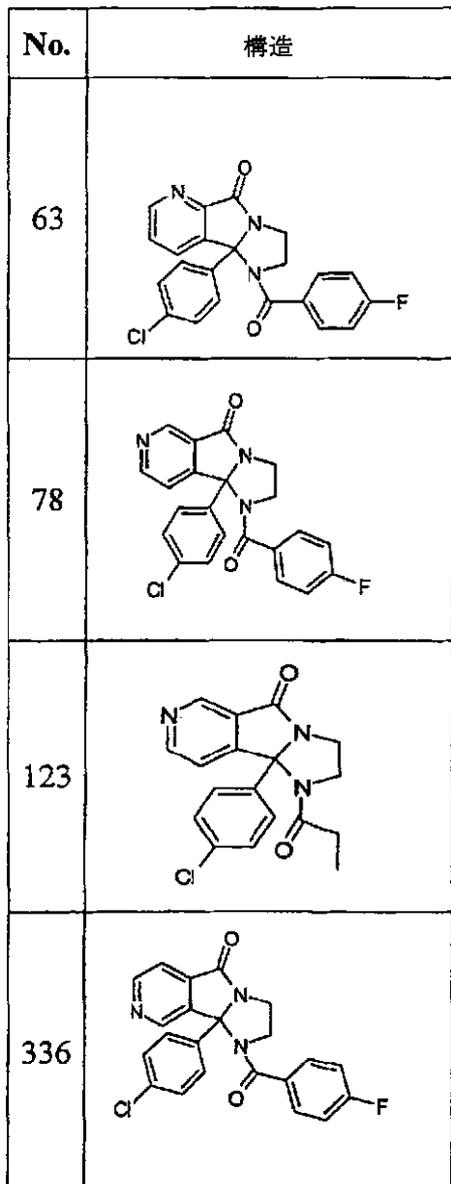
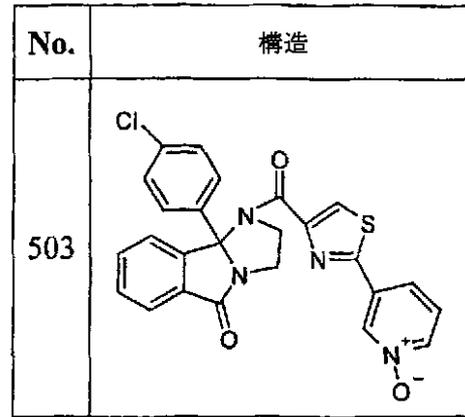
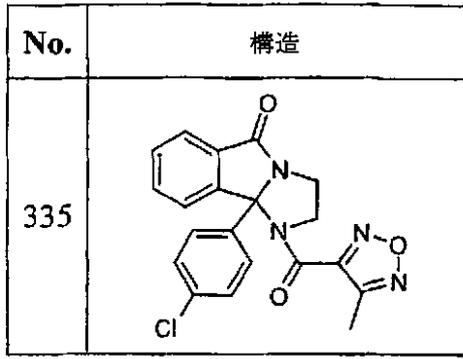
No.	構造
311	
312	
313	
314	
315	

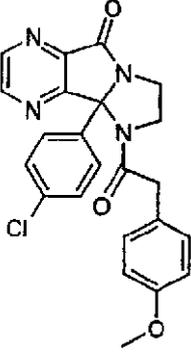
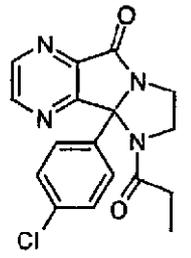
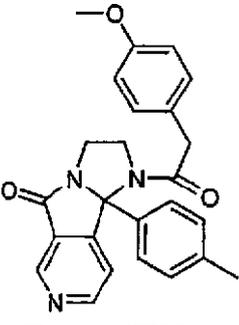
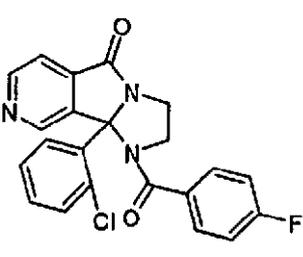
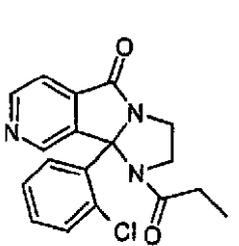
No.	構造
316	
317	
318	
319	

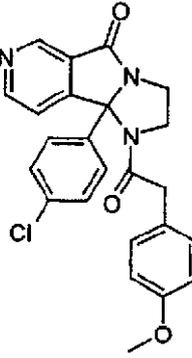
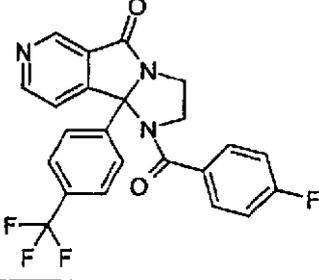
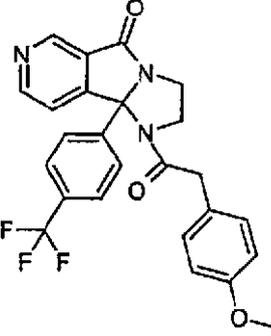
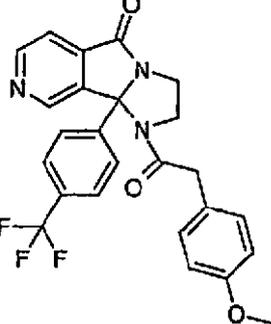
No.	構造
320	
321	
322	
323	
324	

No.	構造
325	
326	
327	
328	
329	

No.	構造
330	
331	
332	
333	
334	

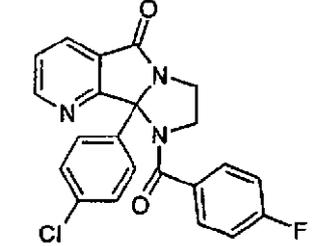
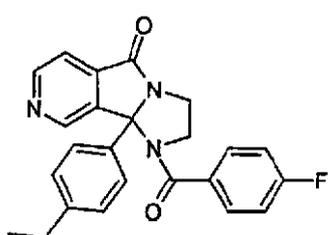
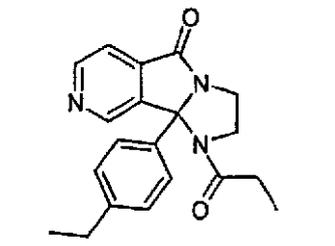
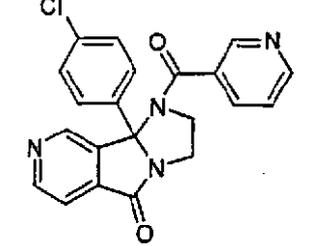
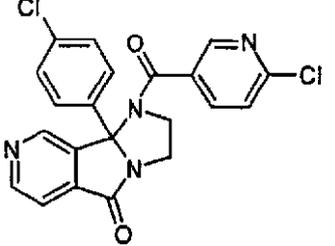


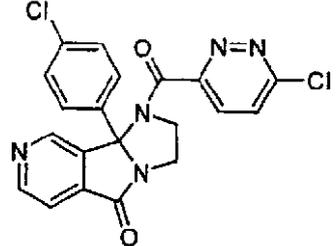
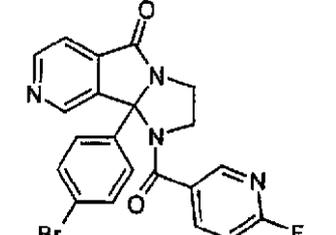
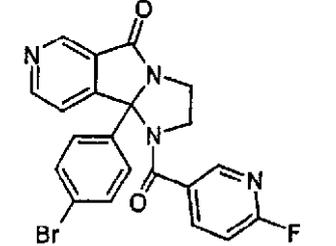
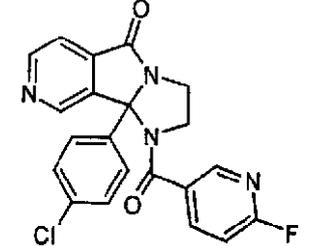
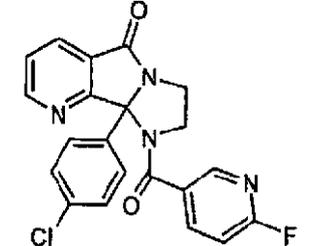
No.	構造
341	
342	
343	
344	
345	

No.	構造
346	
347	
348	
349	

No.	構造
350	
351	
352	
353	
354	

No.	構造
355	
356	
357	
358	
359	

No.	構造
360	
361	
362	
363	
364	

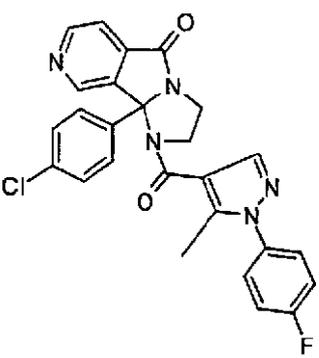
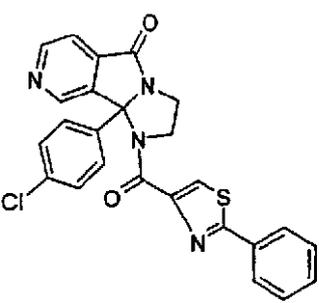
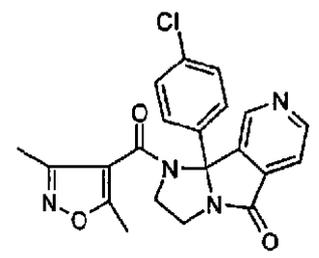
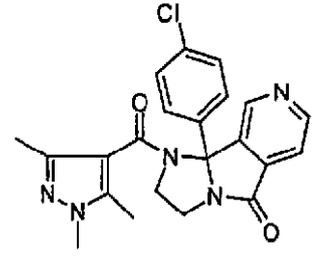
No.	構造
365	
366	
367	
368	
369	

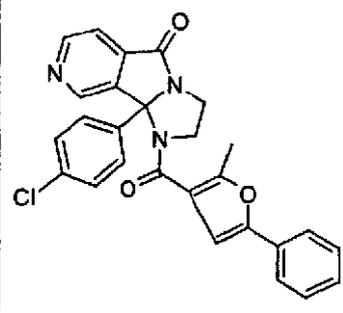
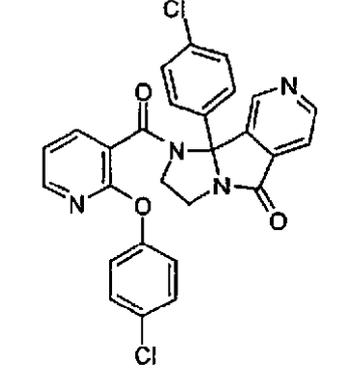
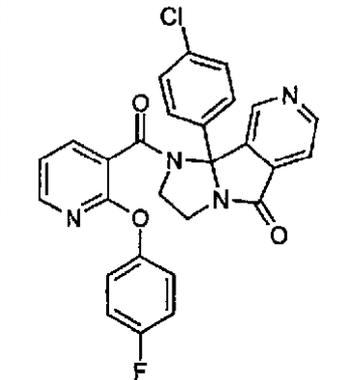
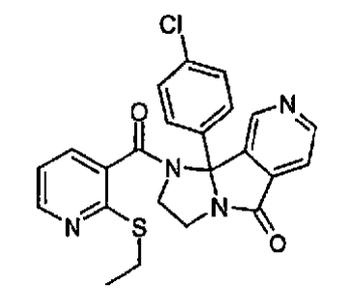
No.	構造
370	
371	
372	
373	
374	

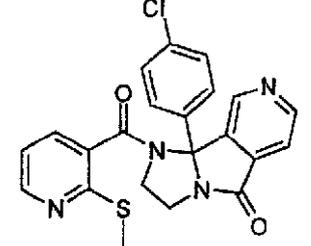
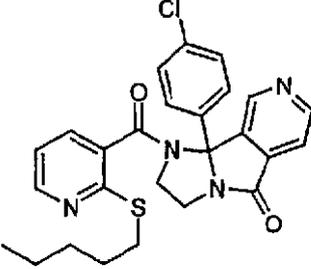
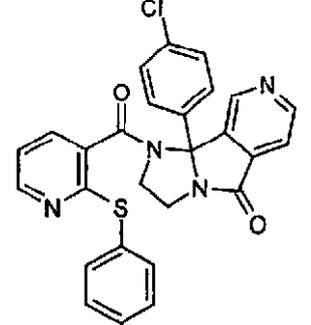
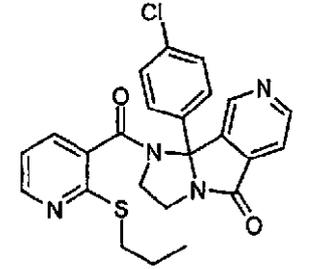
No.	構造
375	
376	
377	
378	
379	

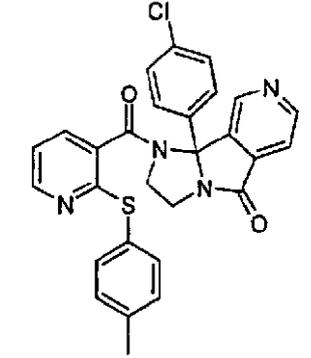
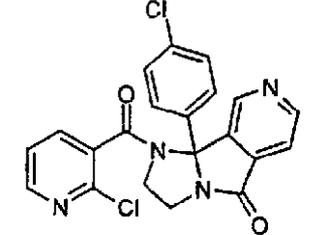
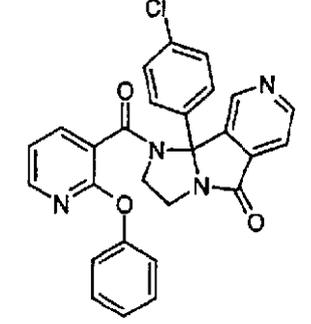
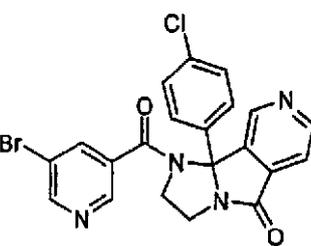
No.	構造
380	
381	
382	
383	
384	

No.	構造
385	
386	
387	
388	
389	

No.	構造
390	
391	
392	
393	

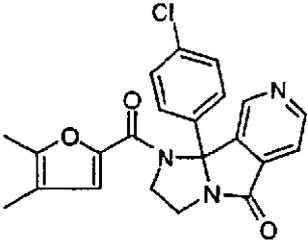
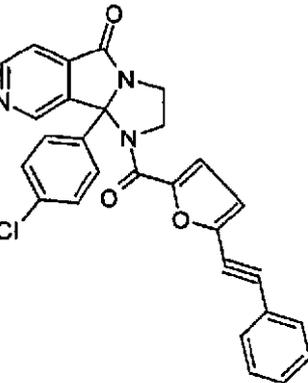
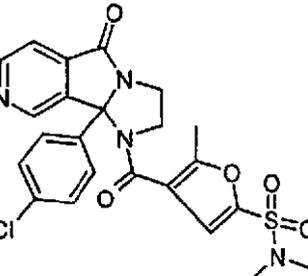
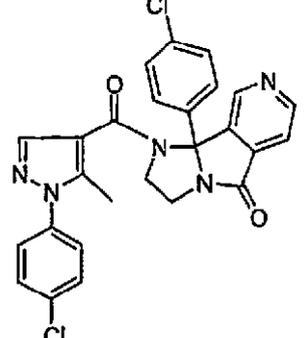
No.	構造
394	
395	
396	
397	

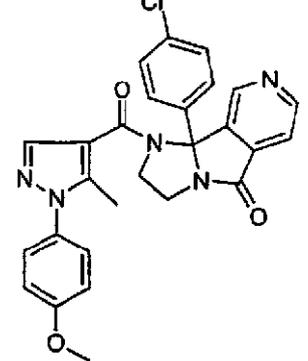
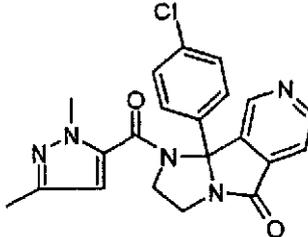
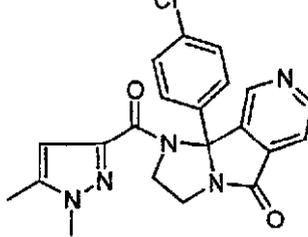
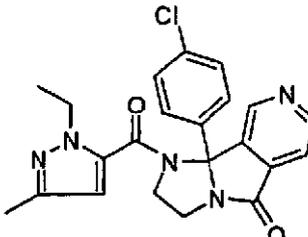
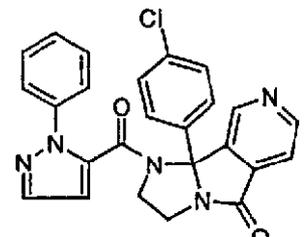
No.	構造
398	
399	
400	
401	

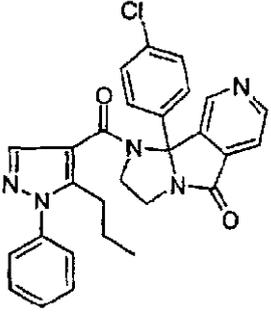
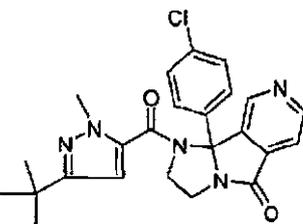
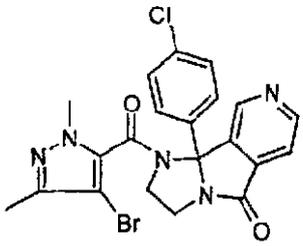
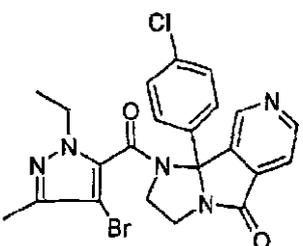
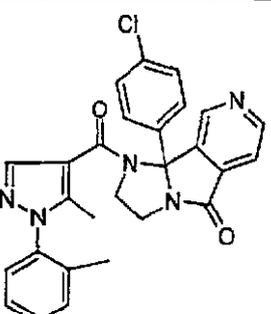
No.	構造
402	
403	
404	
405	

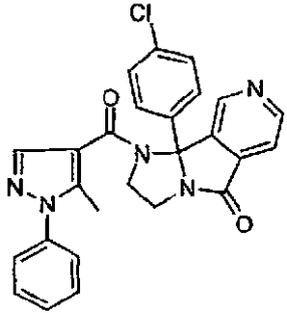
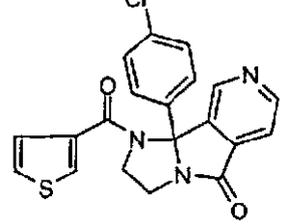
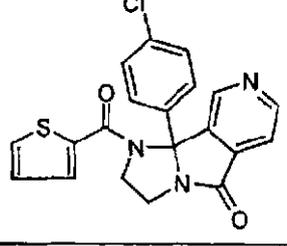
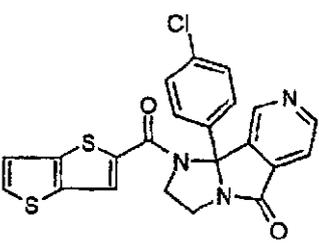
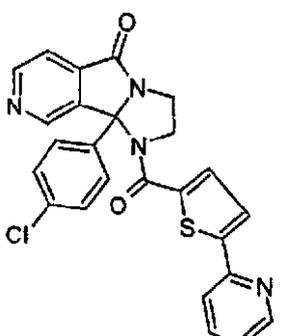
No.	構造
406	
407	
408	
409	

No.	構造
410	
411	
412	
413	
414	

No.	構造
415	
416	
417	
418	

No.	構造
419	
420	
421	
422	
423	

No.	構造
424	
425	
426	
427	
428	

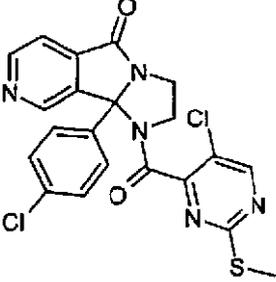
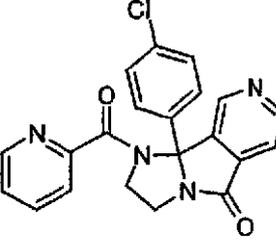
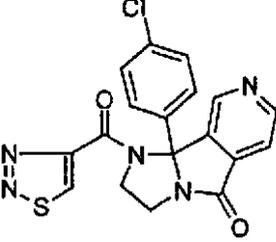
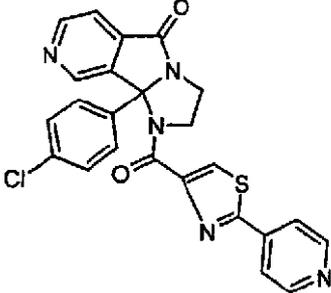
No.	構造
429	
430	
431	
432	
433	

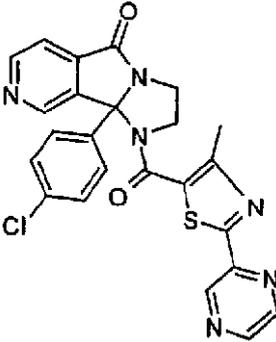
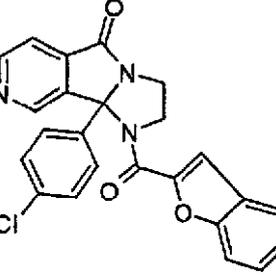
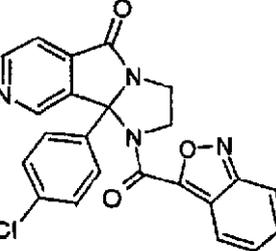
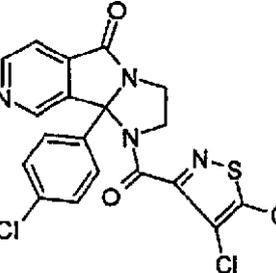
No.	構造
434	
435	
436	
437	
438	

No.	構造
439	
440	
441	
442	
443	

No.	構造
444	
445	
446	
447	
448	

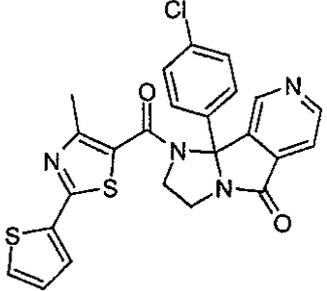
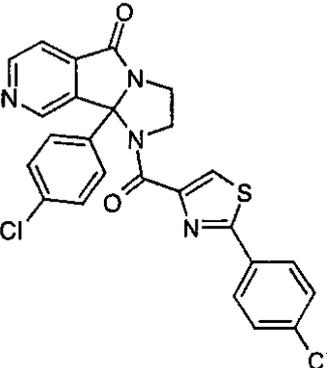
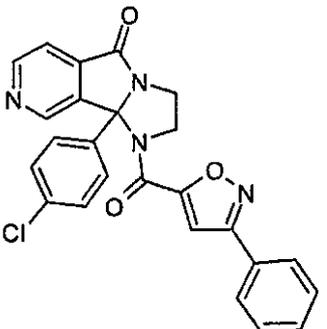
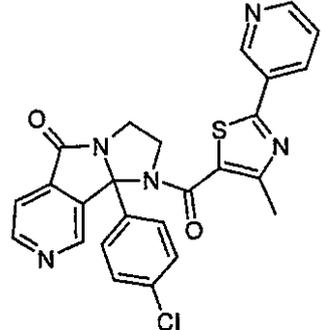
No.	構造
449	
450	
451	
452	
453	

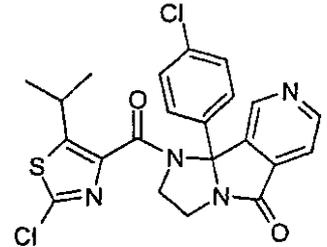
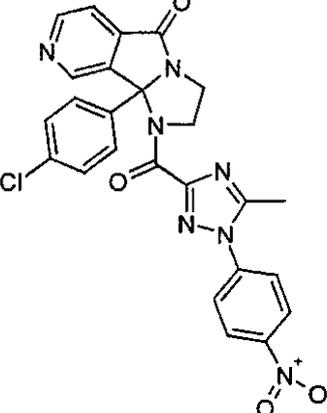
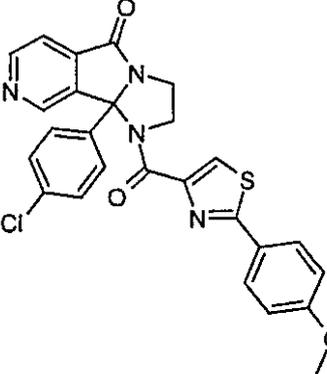
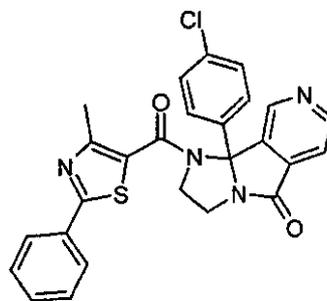
No.	構造
454	
455	
456	
457	

No.	構造
458	
459	
460	
461	

No.	構造
462	
463	
464	
465	

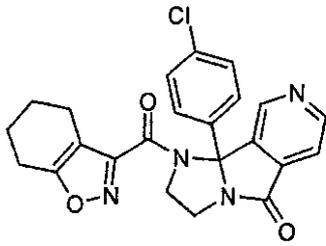
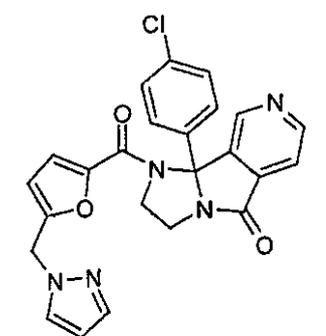
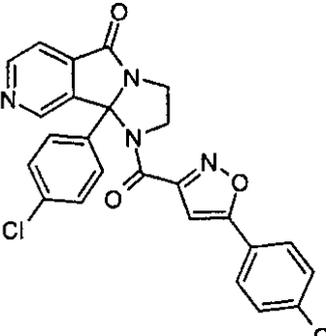
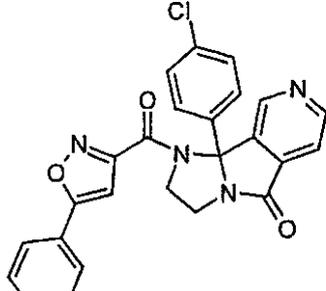
No.	構造
466	
467	
468	
469	

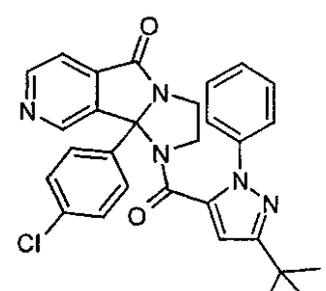
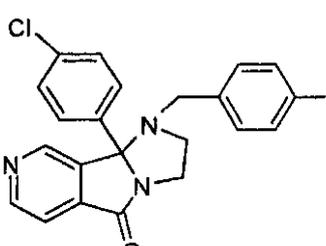
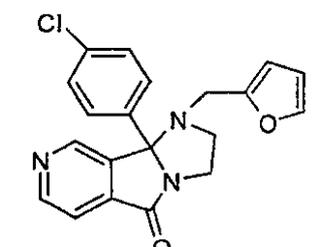
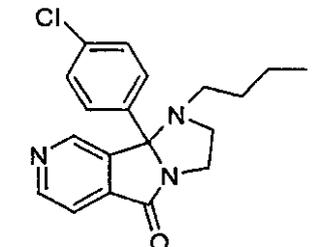
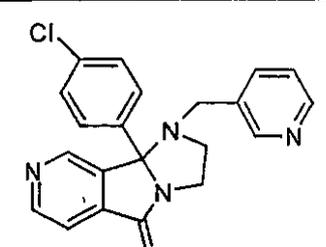
No.	構造
470	
471	
472	
473	

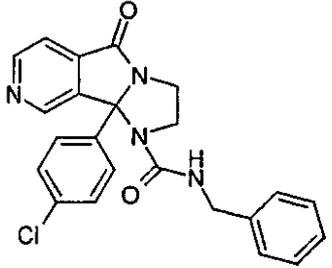
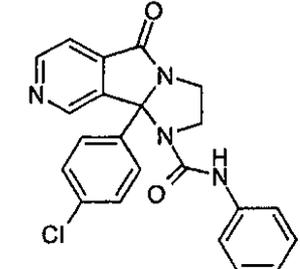
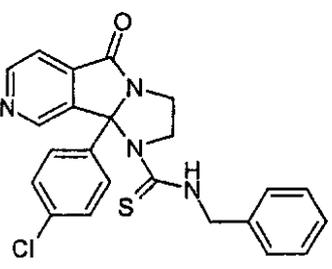
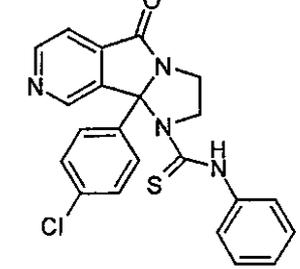
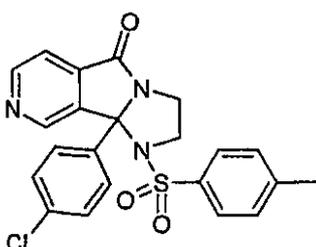
No.	構造
474	
475	
476	
477	

No.	構造
478	
479	
480	
481	
482	

No.	構造
483	
484	
485	
486	
487	

No.	構造
488	
489	
490	
491	

No.	構造
492	
493	
494	
495	
497	

No.	構造
498	
499	
500	
501	
502	

【請求項 6 6】

請求項 3 8 から 6 5 までのいずれか一項に記載の式 I の化合物、その塩又は薬学的に許容される誘導体を含む、ニューモウイルス亜科 (Pneumovirinae) のウイルスが関与する感染の処置のための医薬処方物。

【請求項 6 7】

次式の化合物又はその塩

【化 5】



[式中、

ピリジル環は場合によって置換されており；

B - C は、式 - CH₂ - (CH₂)_z - の場合によって置換されたリンカーであり、ここで、z は 1 ~ 4 であり；

R₁ は、C₁ - 1₂ アルキル、C₂ - 1₂ アルケニル、C₂ - 1₂ アルキニル、- (CH₂)_n C₃ - 7 シクロアルキル、- (CH₂)_n C₄ - 7 シクロアルケニル、- (CH₂)_n アリール、- (CH₂)_n アリール C₁ - 1₂ アルキル、- (CH₂)_n アリール C₂ - 1₂ アルケニル、- (CH₂)_n アリール C₂ - 1₂ アルキニル及び - (CH₂)_n ヘテロシクリルから選択され、ここで、n は 0 ~ 6 であり、前記アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール及びヘテロシクリル基は場合によって置換されており；

X は、O、S 及び NR₆ から選択され、ここで、R₆ は水素、低級アルキル、ヒドロキシ及び低級アルコキシから独立して選択され；

但し、- B - C - が - CH₂CH(CH(CH₃)₂)- である場合、R₁ は 3 - CH₃、4 - CH₃CH₂CH₂NHC(O)CH₂O - フェニル - ではない]。

【請求項 6 8】

前記ピリジル環は、ハロ、- NH₂、NO₂、- C₁ - 6 アルキル、アリール及びヘテロシクリルから独立して選択される 1 つ又は複数の置換基で場合によって置換されており、前記アリール及びヘテロシクリル基は、ハロ、C₁ - 6 アルキル又はハロ置換 C₁ - 6 アルキルで場合によって置換されており、ピリジル環の環窒素は場合によって N - オキシドである、請求項 6 7 に記載の化合物又はその塩。

【請求項 6 9】

ピリジル環は、ハロ、アルキル、C₆H₅ -、CH₃ - C₆H₄ -、CF₃ - C₆H₄ -、ピリジル及び NO₂ から選択される置換基で場合によって置換されており、ピリジル環の環窒素は場合によって N - オキシドであってよい、請求項 6 7 に記載の化合物及びその塩。

【請求項 7 0】

ピリジル環は置換されていない、請求項 6 7 に記載の化合物又はその塩。

【請求項 7 1】

リンカー - B - C - は請求項 2 1 から 2 3 までのいずれか一項で定義した通りである、請求項 6 7 に記載の化合物又はその塩。

【請求項 7 2】

X は酸素又は硫黄である、請求項 6 7 に記載の化合物又はその塩。

【請求項 7 3】

X は酸素である、請求項 6 7 に記載の化合物又はその塩。

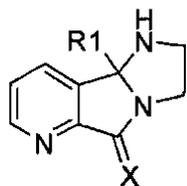
【請求項 7 4】

R₁ は請求項 2 5 から 2 9 までのいずれか一項で定義した通りである、請求項 6 7 に記載の化合物又はその塩。

【請求項 7 5】

次式の化合物又はその塩

【化 6】

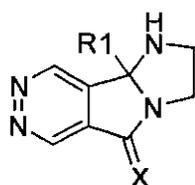


[式中、ピリジル環は場合によって置換されており、但し、 R_1 が 4 - クロロフェニルでない場合、 R_1 及び X は請求項 6 7 で定義した通りである]。

【請求項 7 6】

次式の化合物 又は その塩

【化 7】

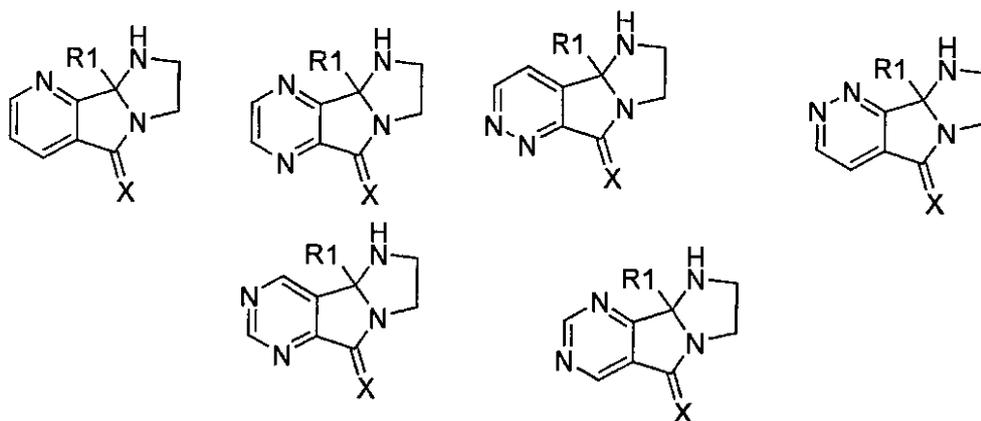


[式中、縮合ピリダジニル環は場合によって置換されており、但し、 R_1 はフェニルでも、4 - クロロフェニルでも、4 - メトキシフェニルでもない場合、 R_1 及び X は請求項 6 7 で定義した通りである]。

【請求項 7 7】

次式のいずれか 1 つの化合物 又は その塩

【化 8】

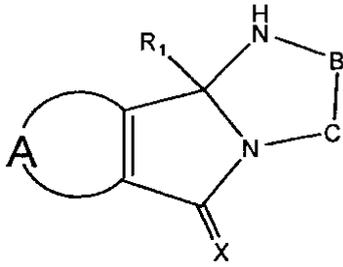


[式中、縮合ピリジル、ピラジニル、ピリダジニル又はピリミジニル環は、場合によって置換されており、 R_1 及び X は請求項 6 7 で定義した通りである]。

【請求項 7 8】

請求項 3 8 に記載の式 I の化合物を製造するための中間体としての式 I I I の化合物 又は その塩の使用

【化 9】



式 III

[式中、R₁、環 A、- B - C - 及び X は請求項 38 で定義した通りである]。

【請求項 79】

エナンチオマーに富むキラルリン酸水素を使用して請求項 78 に記載する式 III の化合物のジアステレオマー塩を形成させることによる、前記化合物のエナンチオマーを分離する方法。

【請求項 80】

エナンチオマーに富むキラルリン酸水素を使用して請求項 67 に記載の化合物のジアステレオマー塩を形成させることによる、前記化合物のエナンチオマーを分離する方法。

【請求項 81】

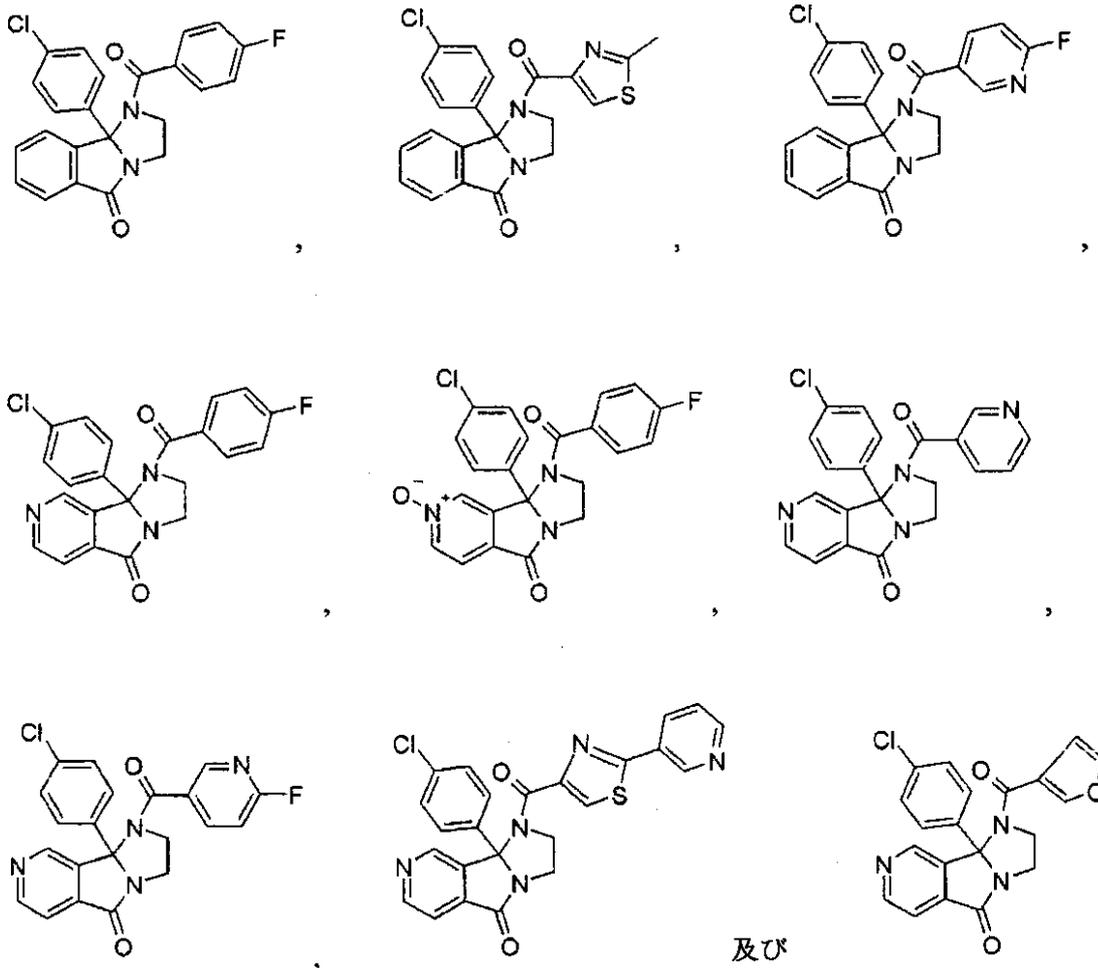
実質的に純粋な光学活性形態の、請求項 38 に記載の化合物。

【請求項 82】

実質的に純粋な光学活性形態の、請求項 67、75、76 又は 77 に記載の化合物。

【請求項 83】

【化 1 0】

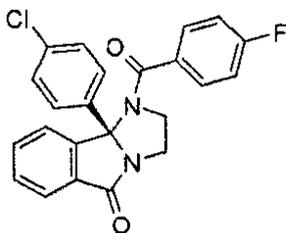


からなる群から選択される化合物の實質的に純粋な光学活性形態。

【請求項 8 4】

下記式の化合物。

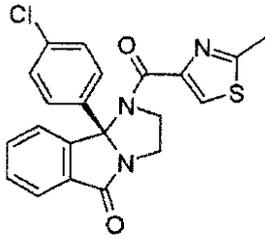
【化 1 1】



【請求項 8 5】

下記式の化合物。

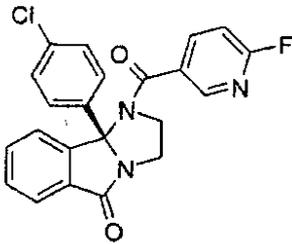
【化 1 2】



【請求項 8 6】

下記式の化合物。

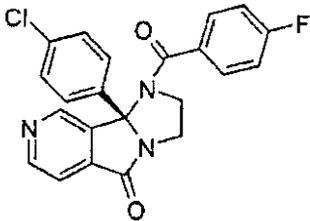
【化 1 3】



【請求項 8 7】

下記式の化合物。

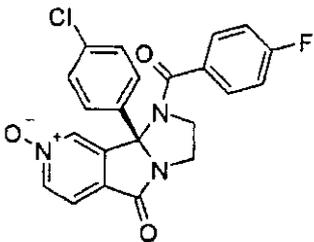
【化 1 4】



【請求項 8 8】

下記式の化合物。

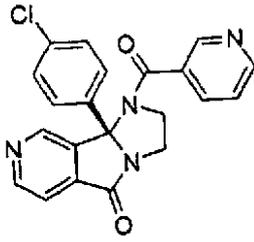
【化 1 5】



【請求項 8 9】

下記式の化合物。

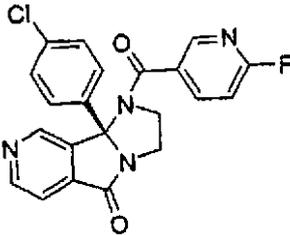
【化 1 6】



【請求項 9 0】

下記式の化合物。

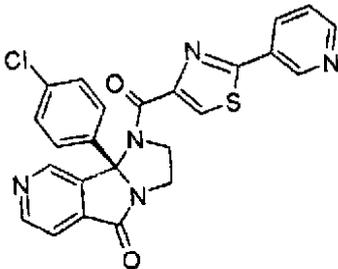
【化 1 7】



【請求項 9 1】

下記式の化合物。

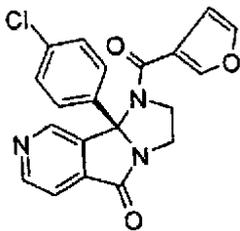
【化 1 8】



【請求項 9 2】

下記式の化合物。

【化 1 9】



【請求項 9 3】

R₅ が、C₂ - 6 アルケニル、C₂ - 6 アルキニル、C₃ - 7 シクロアルキル、C₄ - 7 シクロアルケニル、ベンジル又はヘテロシクリルである、請求項 3 8 に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項 9 4】

R₂ が C(O)R₃ であり、R₃ は、C₂ - 12 アルケニル、C₂ - 12 アルキニル、

- (CH₂)_mC₃₋₇シクロアルキル、- (CH₂)_mC₄₋₇シクロアルケニル、- (CH₂)_mアリール、- (CH₂)_mアリールC₁₋₁₂アルキル、- (CH₂)_mアリールC₂₋₁₂アルケニル、- (CH₂)_mアリールC₂₋₁₂アルキニル、- (CH₂)_mヘテロシクリル、- S - R₅及び- O - R₅から選択される、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項95】

R₂がCOR₃であり、R₃が、水素、C₁₋₁₂アルキル、C₂₋₁₂アルキニル、- (CH₂)_mC₃₋₇シクロアルキル、- (CH₂)_mC₄₋₇シクロアルケニル、- (CH₂)_mアリール、- (CH₂)_mアリールC₁₋₁₂アルキル、- (CH₂)_mアリールC₂₋₁₂アルケニル、- (CH₂)_mアリールC₂₋₁₂アルキニル及び- (CH₂)_mヘテロシクリルから選択される、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項96】

R₂が-CH₂R₃であり、R₃は、水素、C₁₋₁₂アルキル、C₂₋₁₂アルケニル、C₂₋₁₂アルキニル、- (CH₂)_mC₃₋₇シクロアルキル、- (CH₂)_mC₄₋₇シクロアルケニル、- (CH₂)_mアリールC₁₋₁₂アルキル、- (CH₂)_mアリールC₂₋₁₂アルケニル、- (CH₂)_mアリールC₂₋₁₂アルキニル及び- (CH₂)_mヘテロシクリルから選択される、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項97】

R₂がC(O)R₃であり、R₃は、C₂₋₁₂アルケニル、C₂₋₁₂アルキニル、- (CH₂)_mC₃₋₇シクロアルキル、- (CH₂)_mC₄₋₇シクロアルケニル、- (CH₂)_mアリール、- (CH₂)_mアリールC₁₋₁₂アルキル、- (CH₂)_mアリールC₂₋₁₂アルケニル、- (CH₂)_mアリールC₂₋₁₂アルキニル、- S - R₅及び- O - R₅から選択される、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【請求項98】

R₂が-CH₂R₃であり、R₃は、C₂₋₁₂アルケニル、C₂₋₁₂アルキニル、- (CH₂)_mC₃₋₇シクロアルキル、- (CH₂)_mC₄₋₇シクロアルケニル、- (CH₂)_mアリール、- (CH₂)_mアリールC₁₋₁₂アルキル、- (CH₂)_mアリールC₂₋₁₂アルケニル、- (CH₂)_mアリールC₂₋₁₂アルキニル、- (CH₂)_mヘテロシクリル、- S - R₅及び- O - R₅から選択される、請求項38に記載の化合物、又はその塩若しくは薬学的に許容される誘導体。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0059

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0059】

R₁は、場合によって置換されたアリール、アルキル又はヘテロシクリルでありうる。好ましくは、R₁は場合によって置換されたアリール又はヘテロシクリル基、さらに好ましくはフェニル、チエニル、ピロリル又はピリジル環である。R₁は、-C₁₋₆アルキルフェニル基でもありうる。R₁の環は、八口、ヒドロキシ、ニトロ、-NR'R''(ここで、R'及びR''は水素、低級アルキル及び-C(O)Rから独立して選択され、ここで、RはC₁₋₆アルキル、フェニル又はヘテロシクリルである)、C₁₋₁₂アルキル、フェニル及び-O-R_aで場合によって置換されていてもよく、ここで、R_aは-C₁₋₁₂アルキル、-C₃₋₇シクロアルキル、-C₁₋₁₂アルキルC₃₋₇シクロアルキル、フェニル又は-C₁₋₁₂アルキルフェニルであり、そのC₁₋₁₂アルキル、フェニル又はR_a基は、八口、-CN、-NR¹⁰R¹¹、-CO₂R¹²又は-CONR¹⁰R¹¹で場合によって置換されていてもよく、ここで、R¹⁰、R¹¹及びR¹²は水素又は低級アル

キルから独立して選択される。好ましくは、その環はフェニルであり、パラ位又は4 - 位で場合によって置換されている。