



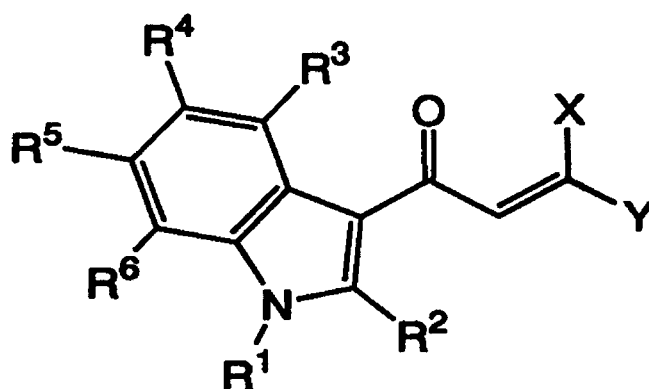
PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類6 C07D 209/12, 209/20, 209/22, 401/04, 403/06, 409/06, 409/14, 417/06, A61K 31/40, 31/41, 31/415, 31/44, 31/535	A1	(11) 国際公開番号 WO99/50245 (43) 国際公開日 1999年10月7日(07.10.99)
(21) 国際出願番号 PCT/JP99/01547 (22) 国際出願日 1999年3月26日(26.03.99) (30) 優先権データ 特願平10/78203 1998年3月26日(26.03.98) JP (71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 塩野義製薬株式会社(SHIONOGI & CO., LTD.)(JP/JP) 〒541-0045 大阪府大阪市中央区道修町3丁目1番8号 Osaka, (JP) (72) 発明者; および (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ) 藤下利夫(FUJISHITA, Toshio)(JP/JP) 〒572-0803 大阪府寝屋川市梅が丘1-11-6-302 Osaka, (JP) 吉永智一(YOSHINAGA, Tomokazu)(JP/JP) 〒569-0078 大阪府高槻市大手町3-19-301 Osaka, (JP) (74) 代理人 弁理士 山内秀晃(YAMAUCHI, Hideaki) 〒553-0002 大阪府大阪市福島区鷺洲5丁目12番4号 塩野義製薬株式会社 特許部 Osaka, (JP)	(81) 指定国 AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM) 添付公開書類 国際調査報告書	

(54)Title: INDOLE DERIVATIVES WITH ANTIVIRAL ACTIVITY

(54)発明の名称 抗ウイルス作用を有するインドール誘導体



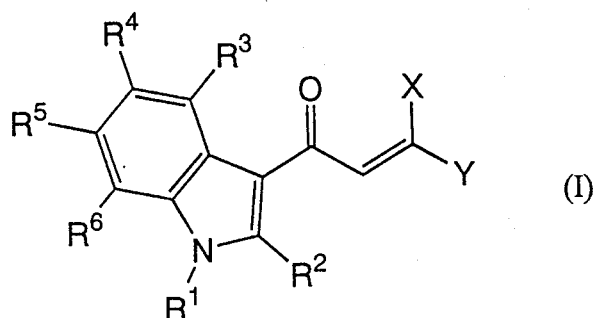
(I)

(57) Abstract

Compounds represented by formula (I), wherein R¹ represents hydrogen, lower alkyl, optionally substituted arylsulfonyl, etc.; R² represents hydrogen, lower alkyl, optionally substituted aralkyl, etc.; R³, R⁴, R⁵, and R⁶ each independently represents hydrogen, halogeno, lower trihaloalkyl, etc.; X represents hydroxy or optionally substituted amino; and Y represents COOR (R is hydrogen or an ester residue), optionally substituted aryl, or optionally substituted heteroaryl. They have an integrase inhibitory activity and are useful as an anti-HIV agent.

(57)要約

式：



(式中、

R¹は水素、低級アルキル、置換基を有していてもよいアリールスルホニル等；

R²は水素、低級アルキル、置換基を有していてもよいアラルキル等；

R³、R⁴、R⁵及びR⁶はそれぞれ独立して、水素、ハロゲン、トリハロゲン化低級アルキル等；

Xはヒドロキシ又は置換基を有していてもよいアミノ；

YはCOOR（Rは水素またはエステル残基）、置換基を有していてもよいアリール、又は置換基を有していてもよいヘテロアリールである。）

で示される化合物は、インテグラーゼ阻害作用を有し、抗HIV薬として有用である。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

AE	アラブ首長国連邦	DM	ドミニカ	KZ	カザフスタン	RU	ロシア
AL	アルバニア	EE	エストニア	LC	セントルシア	SD	スーダン
AM	アルメニア	ES	スペイン	LI	リヒテンシュタイン	SE	スウェーデン
AT	オーストリア	FI	フィンランド	LK	スリ・ランカ	SG	シンガポール
AU	オーストラリア	FR	フランス	LR	リベリア	SI	スロヴェニア
AZ	アゼルバイジャン	GA	ガボン	LS	レソト	SK	スロヴァキア
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	GB	英国	LT	リトアニア	SL	シエラ・レオネ
BB	バルバドス	GD	グレナダ	LU	ルクセンブルグ	SN	セネガル
BE	ベルギー	GE	グルジア	LV	ラトヴィア	SZ	スワジランド
BF	ブルキナ・ファソ	GH	ガーナ	MA	モロッコ	TD	チャード
BG	ブルガリア	GM	ガンビア	MC	モナコ	TG	トーゴ
BJ	ベナン	GN	ギニア	MD	モルドヴァ	TJ	タジキスタン
BR	ブラジル	GW	ギニア・ビサウ	MG	マダガスカル	TZ	タンザニア
BY	ベラルーシ	GR	ギリシャ	MK	マケドニア旧ユーゴスラヴィア共和国	TM	トルクメニスタン
CA	カナダ	HR	クロアチア	ML	マリ	TR	トルコ
CF	中央アフリカ	HU	ハンガリー	MN	モンゴル	TT	トリニダード・トバゴ
CG	コンゴ	ID	インドネシア	MR	モーリタニア	UA	ウクライナ
CH	スイス	IE	アイルランド	MW	マラウイ	UG	ウガンダ
CI	コートジボアール	IL	イスラエル	MX	メキシコ	US	米国
CM	カメルーン	IN	インド	NE	ニジェール	UZ	ウズベキスタン
CN	中国	IS	アイスランド	NL	オランダ	VN	ヴェトナム
CR	コスタ・リカ	IT	イタリア	NO	ノールウェー	YU	ユーゴスラビア
CU	キューバ	JP	日本	NZ	ニュージーランド	ZA	南アフリカ共和国
CY	キプロス	KE	ケニア	PL	ポーランド	ZW	ジンバブエ
CZ	チェッコ	KG	キルギスタン	PT	ポルトガル		
DE	ドイツ	KP	北朝鮮	RO	ルーマニア		
DK	デンマーク	KR	韓国				