

【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18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2004-531536(P2004-531536A)
【公表日】平成16年10月14日(2004.10.14)
【年通号数】公開・登録公報2004-040
【出願番号】特願2002-583396(P2002-583396)
【国際特許分類】

C 0 7 D 271/06 (2006.01)
A 6 1 K 31/4245 (2006.01)
A 6 1 K 31/427 (2006.01)
A 6 1 K 31/433 (2006.01)
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
A 6 1 K 31/454 (2006.01)
A 6 1 K 31/4709 (2006.01)
A 6 1 K 31/4725 (2006.01)
A 6 1 K 31/497 (2006.01)
A 6 1 K 31/506 (2006.01)
A 6 1 P 31/12 (2006.01)
A 6 1 P 31/20 (2006.01)
C 0 7 D 271/10 (2006.01)
C 0 7 D 413/04 (2006.01)
C 0 7 D 413/14 (2006.01)
C 0 7 D 417/04 (2006.01)
C 0 7 D 498/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 271/06
A 6 1 K 31/4245
A 6 1 K 31/427
A 6 1 K 31/433
A 6 1 K 31/4439
A 6 1 K 31/454
A 6 1 K 31/4709
A 6 1 K 31/4725
A 6 1 K 31/497
A 6 1 K 31/506
A 6 1 P 31/12
A 6 1 P 31/20
C 0 7 D 271/10
C 0 7 D 413/04
C 0 7 D 413/14
C 0 7 D 417/04
C 0 7 D 498/04 1 0 1

【手続補正書】
【提出日】平成17年4月6日(2005.4.6)
【手続補正1】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

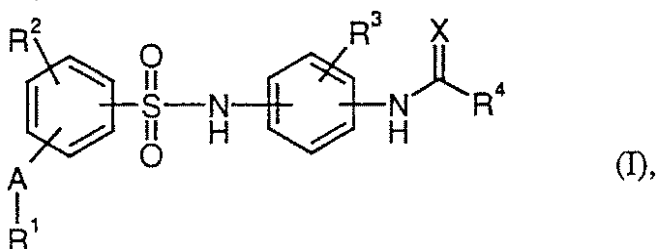
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(1)の化合物、ならびにその互変異性体、立体異性体、立体異性体混合物およびそれらの薬理的に許容される塩：

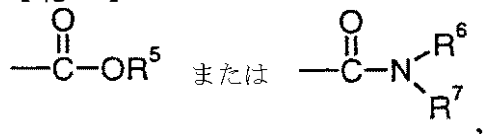
【化1】



[式中、

R^2 および R^3 は、同一または異なって、水素、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ -アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ -アルコキシ、または下記式の基：

【化2】



を表し；

R^5 、 R^6 および R^7 は、同一または異なって、それぞれ、水素を表すか、またはヒドロキシル、ハロゲン、シアノ、トリフルオロメチルおよびトリフルオロメトキシから成る群から選択される1個または2個の置換基によって置換されていてもよい $(C_1 \sim C_6)$ -アルキルを表し；

Aは、C原子を介して隣接するフェニル環に結合し、N、OおよびSから成る群から選択される1~3個のヘテロ原子を有する5または6員のヘテロアリールを表し；

R^1 は、 $(C_6 \sim C_{10})$ -アリール、N、OおよびSから成る群から選択される1~3個のヘテロ原子をそれぞれ有する5~10員のヘテロアリールまたは5~10員のヘテロシクリルを表し；

R^1 は、下記から成る群から選択される3個までの置換基によって置換されていてもよく：ヒドロキシル；アミノ；モノ- $(C_1 \sim C_6)$ -アルキルアミノ；ジ- $(C_1 \sim C_6)$ -アルキルアミノ；ハロゲン；ニトロ；シアノ；オキソ；アミノまたはヒドロキシルによって置換されていてもよい $(C_1 \sim C_6)$ -アルキル； $(C_1 \sim C_6)$ -アルコキシ；フェニル；N、OおよびSから成る群から選択される2個までのヘテロ原子を有する5または6員のヘテロシクリル；N、OおよびSから成る群から選択される1個またはそれ以上のヘテロ原子を有する5または6員のヘテロアリール； $-C(O)-O-R^8$ ； $-C(O)-NR^9R^{10}$ ； $-NH-C(O)-R^{11}$ ； $-NH-C(O)-C(O)-R^{12}$ ；および $-NH-SO_2-R^{13}$ ；

R^8 、 R^9 および R^{10} は、同一または異なって、それぞれ、水素または $(C_1 \sim C_6)$ アルキルを表すか、または

R^9 および R^{10} は、それらが結合している窒素原子と一緒に5または6員の複素環を形成し、該複素環は、窒素または酸素ヘテロ原子をさらに有していてもよく、該複素環は、下記から成る群から選択される同一または異なる置換基によって一または二置換されていてもよく：ヒドロキシルまたはアミノによって任意に置換されている $(C_1 \sim C_4)$ -アルキル、アミノ、ヒドロキシル、 $(C_1 \sim C_4)$ -アルコキシ、オキソ、カルボキシルおよび $(C_1 \sim C_4)$ -アルコシカルボニル；

R^{11} および R^{12} は、同一または異なって、それぞれ、トリフルオロメチル、 $(C_1 \sim C_6)$ -アルコキシ、ヒドロキシルを表すか、または、アミノ、 $(C_1 \sim C_6)$ -アルコシカルボ

ニルアミノ、モノ - (C₁ ~ C₆) - アシルアミノ、ヒドロキシル、アミジノ、グアニジノ、(C₁ ~ C₆) - アルコシカルボニル、カルボキシルおよびフェニルから成る群から選択される同一または異なる置換基によって任意に一または二置換されている(C₁ ~ C₆) アルキルを表し；

R³は、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシル、(C₁ ~ C₄) - アルコキシまたは(C₁ ~ C₄) - アルキルによってそれぞれ置換されていてもよい(C₁ ~ C₆) - アルキルまたは(C₆ ~ C₁₀) - アリールを表し；

R⁴は、(C₁ ~ C₆) - アルキルを表し、それは、下記から成る群から選択される同一または異なる置換基によって3回まで置換されていてもよく：アミノ、ヒドロキシル、ハロゲン、ならびにハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノおよびヒドロキシルから成る群から選択される同一または異なる置換基によって任意に一または二置換されている(C₁ ~ C₆) - アルコキシ、(C₁ ~ C₅) - アルカノイルオキシおよびフェニル；または

R⁴は、(C₃ ~ C₇) - シクロアルキルを表し、それは、下記から成る群から選択される同一または異なる置換基によって3回まで置換されていてもよく：アミノ、ヒドロキシル、ハロゲン、ならびにアミノ、ヒドロキシル、ハロゲンおよび(C₁ ~ C₆) - アルコキシから成る群から選択される同一または異なる置換基によって3回まで任意に置換されている(C₁ ~ C₆) - アルコキシおよび(C₁ ~ C₆) - アルキル；または

R⁴は、(C₆ ~ C₁₀) - アリールを表し、それは、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノおよびヒドロキシルから成る群から選択される同一または異なる置換基によって任意に一または二置換され；

Xは、酸素または硫黄を表し；

窒素含有複素環は、Nオキシドとして存在してもよい]。

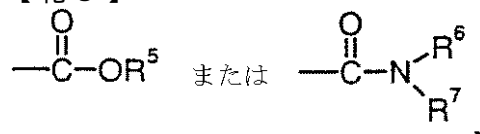
【請求項2】

下記のように定義される請求項1に記載の一般式(1)の化合物、ならびにその互変異性体、立体異性体、立体異性体混合物およびそれらの薬理的に許容される塩；

式中、

R²およびR³は、同一または異なって、水素、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、(C₁ ~ C₆) - アルキル、(C₁ ~ C₆) - アルコキシ、または下記式の基；

【化3】



を表し；

R⁵、R⁶およびR⁷は、同一または異なって、それぞれ、水素を表すか、またはヒドロキシル、ハロゲン、シアノ、トリフルオロメチルおよびトリフルオロメトキシから成る群から選択される1個または2個の置換基によって置換されていてもよい(C₁ ~ C₆) - アルキルを表し；

Aは、C原子を介して隣接するフェニル環に結合し、N、OおよびSから成る群から選択される1~3個のヘテロ原子を有する5または6員のヘテロアリールを表し；

R¹は、(C₆ ~ C₁₀) - アリール、N、OおよびSから成る群から選択される1~3個のヘテロ原子をそれぞれ有する5~10員のヘテロアリールまたは5~10員のヘテロシクリルを表し；

R¹は、下記から成る群から選択される3個までの置換基によって置換されていてもよく：ヒドロキシル；アミノ；モノ - (C₁ ~ C₆) - アルキルアミノ；ジ - (C₁ ~ C₆) - アルキルアミノ；ハロゲン；ニトロ；シアノ；オキソ；アミノまたはヒドロキシルによって置換されていてもよい(C₁ ~ C₆) - アルキル；(C₁ ~ C₆) - アルコキシ；フェニル；N、OおよびSから成る群から選択される1個またはそれ以上のヘテロ原子を有する5または6員のヘテロアリール；-C(O)-O-R⁸；-C(O)-NR⁹R¹⁰；および-NH-C(O)-R¹¹；

R⁸、R⁹およびR¹⁰は、同一または異なって、それぞれ、水素または(C₁ ~ C₆) アルキ

ルを表し；

R^1 は、アミノ、ヒドロキシル、グアニジノ、カルボキシルおよびフェニルから成る群から選択される同一または異なる置換基によって任意に一または二置換されている ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し；

R^4 は、($C_1 \sim C_6$) - アルキルを表し、それは、下記から成る群から選択される同一または異なる置換基によって3回まで置換されていてもよく：アミノ、ヒドロキシル、ハロゲン、ならびにハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノおよびヒドロキシルから成る群から選択される同一または異なる置換基によって任意に一または二置換されている ($C_1 \sim C_6$) - アルコキシおよびフェニル；または

R^4 は、($C_3 \sim C_7$) - シクロアルキルを表し、それは、下記から成る群から選択される同一または異なる置換基によって3回まで置換されていてもよく：アミノ、ヒドロキシル、ハロゲン、ならびにアミノ、ヒドロキシル、ハロゲンおよび ($C_1 \sim C_6$) - アルコキシから成る群から選択される同一または異なる置換基によって3回まで任意に置換されている ($C_1 \sim C_6$) - アルコキシおよび ($C_1 \sim C_6$) - アルキル；または

R^4 は、($C_6 \sim C_{10}$) - アリールを表し、それは、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノおよびヒドロキシルから成る群から選択される同一または異なる置換基によって任意に一または二置換され；

Xは、酸素または硫黄を表し；

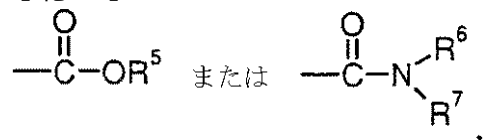
窒素含有複素環は、Nオキシドとして存在してもよい。

【請求項3】

下記のように定義される請求項1に記載の一般式(1)の化合物、ならびにその互変異性体、立体異性体、立体異性体混合物およびそれらの薬理的に許容される塩；
式中、

R^2 および R^3 は、同一または異なって、水素、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、($C_1 \sim C_6$) - アルキル、($C_1 \sim C_6$) - アルコキシ、または下記式の基：

【化4】



を表し；

R^5 、 R^6 および R^7 は、同一または異なって、それぞれ、水素を表すか、またはヒドロキシル、ハロゲン、シアノ、トリフルオロメチルおよびトリフルオロメトキシから成る群から選択される1個または2個の置換基によって置換されていてもよい ($C_1 \sim C_6$) - アルキルを表し；

Aは、C原子を介して隣接するフェニル環に結合し、N、OおよびSから成る群から選択される1~3個のヘテロ原子を有する5または6員のヘテロアリールを表し；

R^1 は、($C_6 \sim C_{10}$) - アリール、N、OおよびSから成る群から選択される1~3個のヘテロ原子をそれぞれ有する5~10員のヘテロアリールまたは5~10員のヘテロシクリルを表し；

R^1 は、下記から成る群から選択される3個までの置換基によって置換されていてもよく：ヒドロキシル；アミノ；モノ - ($C_1 \sim C_6$) - アルキルアミノ；ジ - ($C_1 \sim C_6$) - アルキルアミノ；ハロゲン；ニトロ；シアノ；オキソ；アミノまたはヒドロキシルによって置換されていてもよい ($C_1 \sim C_6$) - アルキル；($C_1 \sim C_6$) - アルコキシ；フェニル；N、OおよびSから成る群から選択される1個またはそれ以上のヘテロ原子を有する5または6員のヘテロアリール；-C(O)-O-R⁸；-C(O)-NR⁹R¹⁰；-NH-C(O)-R¹¹；

R^8 、 R^9 および R^{10} は、同一または異なって、それぞれ、水素または ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し；

R^{11} は、アミノ、ヒドロキシル、グアニジノ、カルボキシルおよびフェニルから成る群から選択される同一または異なる置換基によって任意に一または二置換されている (C_1

~C₆) アルキルを表し；

R⁴は、(C₁~C₆) - アルキルを表し、それは、下記から成る群から選択される同一または異なる置換基によって3回まで置換されていてよく；アミノ、ヒドロキシル、ハロゲン、ならびにハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノおよびヒドロキシルから成る群から選択される同一または異なる置換基によって任意に一または二置換されている(C₁~C₆) - アルコキシおよびフェニル；または

R⁴は、(C₃~C₇) - シクロアルキルを表し、それは、下記から成る群から選択される同一または異なる置換基によって3回まで置換されていてよく；アミノ、ヒドロキシル、ハロゲン、ならびにアミノ、ヒドロキシル、ハロゲンおよび(C₁~C₆) - アルコキシから成る群から選択される同一または異なる置換基によって3回まで任意に置換されている(C₁~C₆) - アルコキシおよび(C₁~C₆) - アルキル；または

R⁴は、(C₆~C₁₀) - アリールを表し、それは、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノおよびヒドロキシルから成る群から選択される同一または異なる置換基によって任意に一または二置換され；

Xは、酸素を表し；

窒素含有複素環は、Nオキシドとして存在してもよい。

【請求項4】

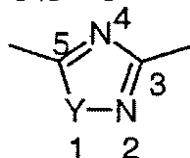
下記のように定義される請求項1に記載の一般式(1)の化合物、ならびにその互変異性体、立体異性体、立体異性体混合物およびそれらの薬理学的に許容される塩；

式中、

R²およびR³は、同一または異なって、水素またはハロゲンを表し；

Aは、基(A-I)；

【化5】



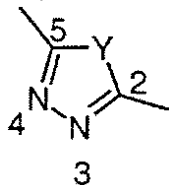
(A-I)

を表し、該基は、3または5位の炭素原子の1つを介して隣接するフェニル環に結合し；

Yは、酸素または硫黄を表し；または

Aは、基(A-II)；

【化6】



(A-II)

を表し、該基は、2または5位の炭素原子の1つを介して隣接するフェニル環に結合し；

Yは、酸素または硫黄を表し；

R¹は、N、OおよびSから成る群から選択される3個までのヘテロ原子をそれぞれ有する5~10員のヘテロアリールまたは5~10員のヘテロシクリルを表すか、またはフェニルを表し；

R¹は、下記から成る群から選択される1~3個の置換基によって置換されていてよく；ヒドロキシルまたはアミノによって任意に置換されている(C₁~C₄) - アルキル、ヒドロキシル、オキソ、ハロゲン、アミノ、モノ - (C₁~C₄) - アルキルアミノ、ジ - (C₁~C₄) - アルキルアミノおよび - NH - C(O) - R¹¹；

R¹¹は、アミノ、ヒドロキシル、グアニジノおよびカルボキシルから成る群から選択

される同一または異なる置換基によって任意に一または二置換されている ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し；

R^4 は、($C_1 \sim C_4$) - アルキルを表し、それは、アミノ、ヒドロキシル、弗素、塩素および ($C_1 \sim C_4$) - アルコキシから成る群から選択される同一または異なる置換基によって3回まで置換されていてもよく；または

R^4 は、($C_3 \sim C_5$) - シクロアルキルを表し、それは、下記から成る群から選択される同一または異なる置換基によって3回まで置換されていてもよく：アミノ、ヒドロキシル、弗素、塩素、ならびにアミノ、ヒドロキシル、弗素、塩素および ($C_1 \sim C_4$) - アルコキシから成る群から選択される同一または異なる置換基によって3回まで任意に置換されている ($C_1 \sim C_4$) - アルコキシおよび ($C_1 \sim C_4$) - アルキル；

Xは、酸素または硫黄を表し；

窒素含有複素環は、Nオキシドとして存在してもよい。

【請求項5】

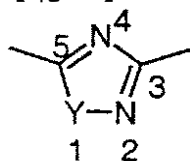
下記のように定義される請求項1に記載の一般式(1)の化合物、ならびにその互変異性体、立体異性体、立体異性体混合物およびそれらの薬理的に許容される塩；

式中、

R^2 および R^3 は、同一または異なって、水素またはハロゲンを表し；

Aは、基(A-I)；

【化7】



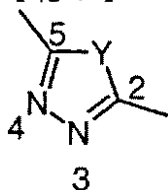
(A-I)

を表し、該基は、3または5位の炭素原子の1つを介して隣接するフェニル環に結合し；

Yは、酸素または硫黄を表し；または

Aは、基(A-II)；

【化8】



(A-II)

を表し、該基は、2または5位の炭素原子の1つを介して隣接するフェニル環に結合し；

Yは、酸素または硫黄を表し；

R^1 は、N、OおよびSから成る群から選択される3個までのヘテロ原子をそれぞれ有する5~10員のヘテロアリールまたは5~10員のヘテロシクリルを表し；

R^1 は、下記から成る群から選択される1~3個の置換基によって置換されていてもよく：ヒドロキシルまたはアミノによって任意に置換されている ($C_1 \sim C_4$) - アルキル、ヒドロキシル、オキソ、ハロゲン、アミノ、モノ - ($C_1 \sim C_4$) - アルキルアミノ、ジ - ($C_1 \sim C_4$) - アルキルアミノおよび - NH - C(O) - R^{11} ；

R^{11} は、アミノ、ヒドロキシル、グアニジノおよびカルボキシルから成る群から選択される同一または異なる置換基によって任意に一または二置換されている ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し；

R^4 は、($C_1 \sim C_4$) - アルキルを表し、それは、アミノ、ヒドロキシル、弗素、塩素および ($C_1 \sim C_4$) - アルコキシから成る群から選択される同一または異なる置換基によって3回まで置換されていてもよく；または

R^4 は、($C_3 \sim C_5$) - シクロアルキルを表し、それは、下記から成る群から選択される同一または異なる置換基によって3回まで置換されていてもよく：アミノ、ヒドロキシル、弗素、塩素、ならびにアミノ、ヒドロキシル、弗素、塩素および($C_1 \sim C_4$) - アルコキシから成る群から選択される同一または異なる置換基によって3回まで任意に置換されている($C_1 \sim C_4$) - アルコキシおよび($C_1 \sim C_4$) - アルキル；

Xは、酸素を表す。

【請求項6】

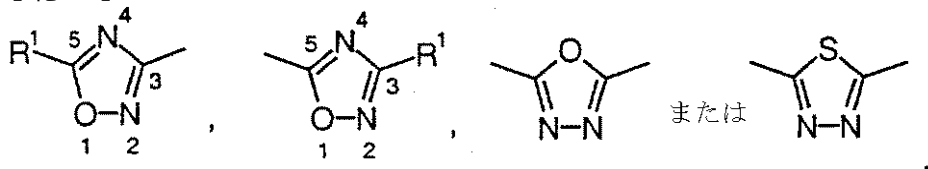
下記のように定義される請求項1に記載の一般式(1)の化合物、ならびにその互変異性体、立体異性体、立体異性体混合物およびそれらの薬理的に許容される塩：

式中、

R^2 および R^3 は、水素を表し；

Aは、下記の基の1つを表し；

【化9】



R^1 は、フェニル、ピリジル、ピラジニル、チアゾリル、チアジアゾリル、キノリニル、イソキノリニル、オキサゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピロリルおよびインドリルから成る群から選択される基を表し；

R^1 は、メチル、アミノメチル、ヒドロキシル、臭素、塩素、弗素、アミノ、ジメチルアミノおよび - NH - C(O) - R^{11} から成る群から選択される1個または2個の置換基によって置換されていてもよく；

R^{11} は、アミノ、ヒドロキシル、グアニジノおよびカルボキシルから成る群から選択される同一または異なる置換基によって任意に一または二置換されている($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し；

R^4 は、ヒドロキシル、弗素および塩素から成る群から選択される同一または異なる置換基によって3回まで任意に置換されている tert - ブチルを表し；または

R^4 は、ヒドロキシル、弗素または塩素によって任意に置換されているメチルによって置換されているシクロプロピルまたはシクロブチルを表し；

Xは、酸素を表し；

窒素含有複素環は、Nオキシドとして存在してもよい。

【請求項7】

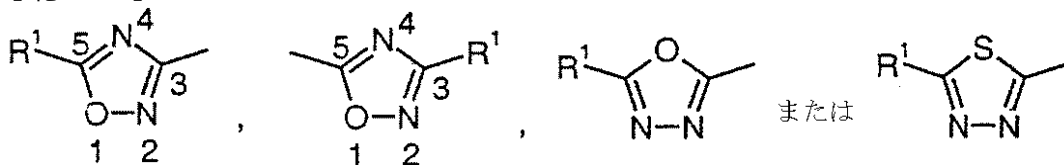
下記のように定義される請求項1に記載の一般式(1)の化合物：

式中、

R^2 および R^3 は、水素を表し；

Aは、下記の基の1つを表し；

【化10】



R^1 は、フェニル、ピリジル、ピラジニル、チアゾリル、チアジアゾリル、キノリニル、イソキノリニル、オキサゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピロリルおよびインドリルから成る群から選択される基を表し；

R^1 は、メチル、アミノメチル、ヒドロキシル、臭素、塩素、弗素、アミノ、ジメチルアミノおよび - NH - C(O) - R^{11} から成る群から選択される1個または2個の置換基によって置換されていてもよく；

R^{11} は、アミノ、ヒドロキシル、グアニジノおよびカルボキシルから成る群から選択される同一または異なる置換基によって任意に一または二置換されている ($C_1 \sim C_6$) アルキルを表し；

R^4 は、ヒドロキシル、弗素および塩素から成る群から選択される同一または異なる置換基によって3回まで任意に置換されている tert - ブチルを表し；または

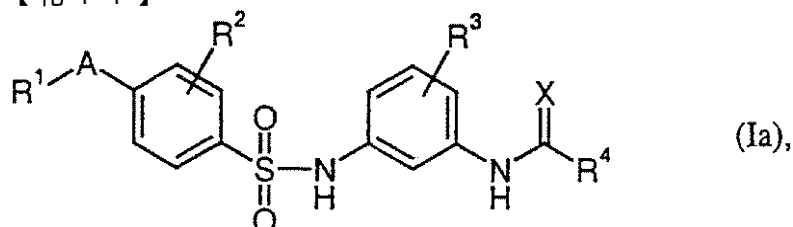
R^4 は、ヒドロキシル、弗素または塩素によって任意に置換されているメチルによって置換されているシクロプロピルまたはシクロブチルを表し；

Xは、酸素を表す。

【請求項 8】

下記のように定義される請求項1に記載の一般式 (Ia) の化合物：

【化 1 1】



式中、

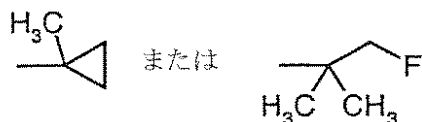
R^1 、 R^4 、AおよびXは、前記のように定義され；

R^2 および R^3 は、同一または異なって、水素、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、($C_1 \sim C_6$) - アルキルまたは ($C_1 \sim C_6$) - アルコキシを表す。

【請求項 9】

R^4 が、下記の基の1つを表す請求項1に記載の一般式 (I) の化合物：

【化 1 2】



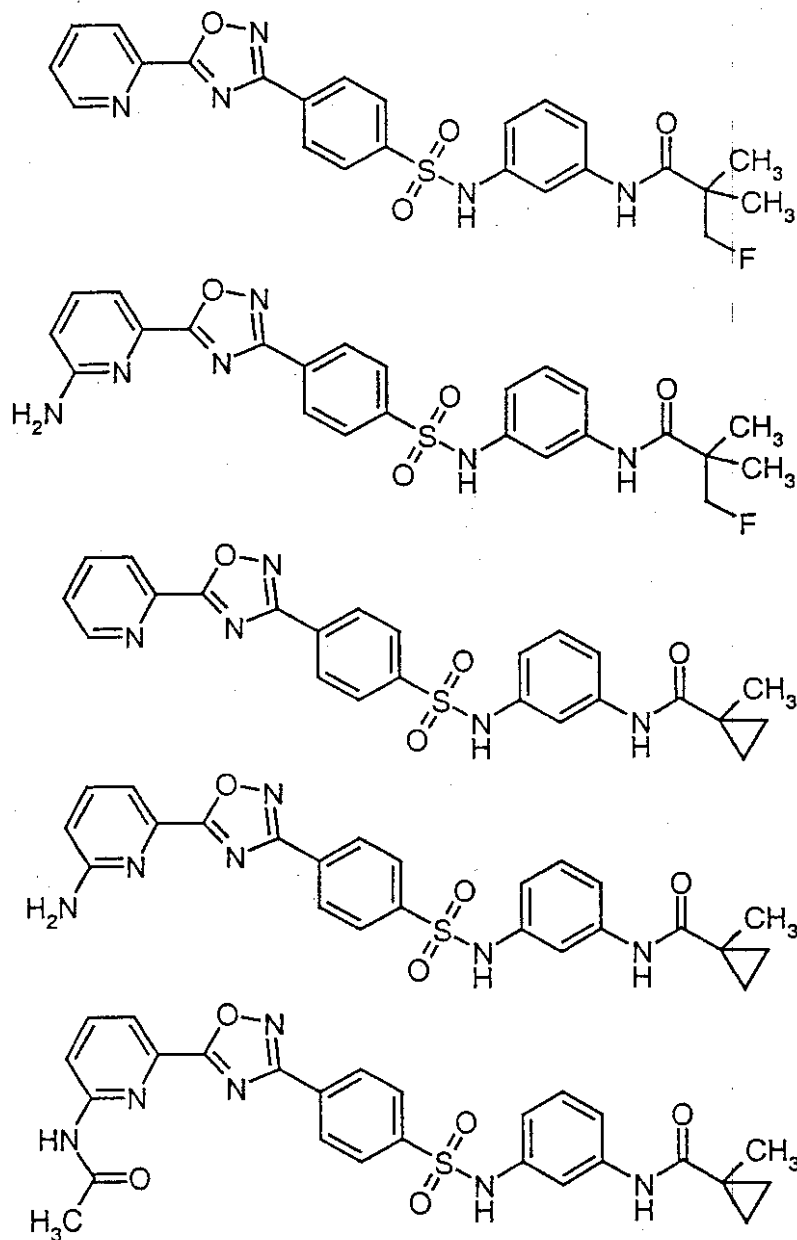
【請求項 10】

Aが、3位で結合している1, 2, 4 - オキサジアゾールを表す請求項1に記載の一般式 (I) の化合物。

【請求項 11】

下記の化合物群から選択される請求項1に記載の化合物：

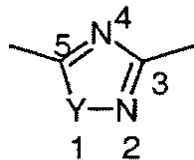
【化13】



【請求項12】

Aは、基(A-1)：

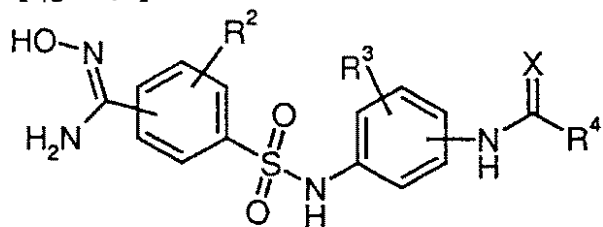
【化14】



(A-1)

を表し、該基は3または5位の炭素原子の1つを介して隣接するフェニル環に結合し；
 Yは、酸素を表す；
 請求項1に記載の一般式(1)の化合物の製造方法であって、
 一般式[D-1]のアミドキシム：

【化15】



[D-1]

[式中、X、R²、R³およびR⁴は前記のように定義される]
を、カルボン酸[E-1]：

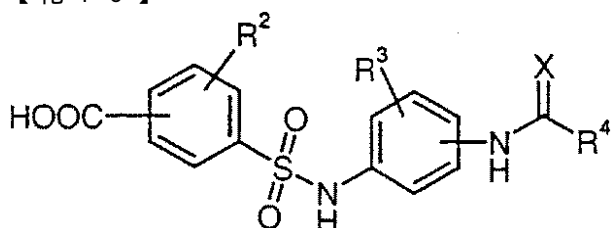


[式中、R¹は前記のように定義される]

と反応させるか、または

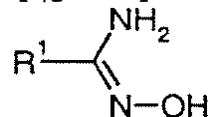
一般式[F-3]のスルホンアミド：

【化16】



[式中、X、R²、R³およびR⁴は前記のように定義される]
を、一般式[G-1]のアミドキシム：

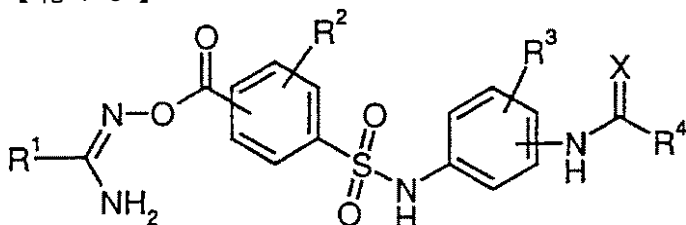
【化17】



[G-1]

[式中、R¹は前記のように定義される]
と縮合させて、一般式[G-2]の化合物：

【化18】



[G-2]

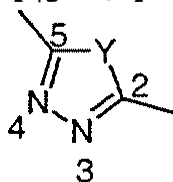
[式中、R¹、R²、R³、R⁴およびXは前記のように定義される]
を得、次に、化合物[G-2]を、水の除去によって環化して、一般式(1)の化合物を得る

ことを含んで成る方法。

【請求項13】

Aは、基(A-II)：

【化19】



(A-II)

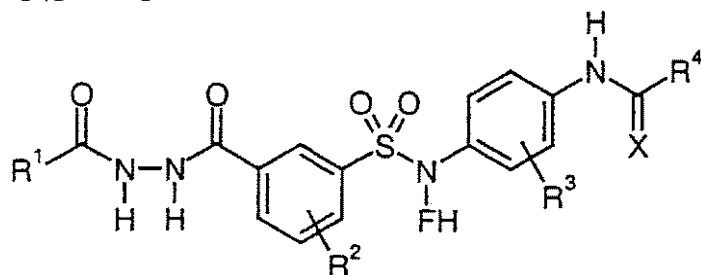
を表し、該基は2または5位の炭素原子の1つを介して隣接するフェニル環に結合し；

Yは、酸素を表す；

請求項1に記載の一般式(1)の化合物の製造方法であって、

一般式[H-2]のヒドラジド；

【化20】



[H-2]

[式中、

X、R¹、R²、R³およびR⁴は前記のように定義され；

FHは、水素、アミノ保護基またはポリマー支持体を表す]

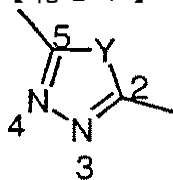
を、水の除去によって環化して、一般式(1)の化合物を得ることを含んで成る方法。

【請求項14】

Xは、酸素を表し；

Aは、基(A-II)；

【化21】



(A-II)

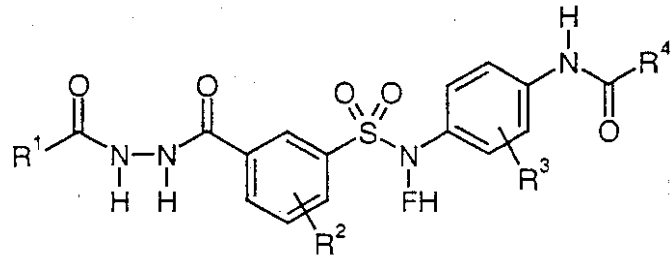
を表し、該基は2または5位の炭素原子の1つを介して隣接するフェニル環に結合し；

Yは、硫黄を表す；

請求項1に記載の一般式(1)の化合物の製造方法であって、

一般式[H-3]のヒドラジド；

【化22】



[H-3]

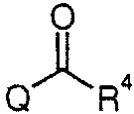
[式中、

R¹、R²、R³は前記のように定義され；

FHは、水素、アミノ保護基またはポリマー支持体を表し；

R⁴は、(C₁~C₆)-アルコキシ、(C₁~C₆)-アルケノキシまたはアラルコキシを表す]を、チオ供与体、好ましくはLawesson試薬の存在下に環化して、Yが硫黄である一般式(1)の化合物を得、次に、基-C(O)-R⁴を除去し、最後に、下記の一般式の化合物：

【化23】

[式中、R⁴およびQは前記のように定義される]

と反応させる

ことを含んで成る方法。

【請求項15】

疾患の予防または治療のための、請求項1~11のいずれかに記載の一般式(1)の化合物の使用。

【請求項16】

薬剤の製造のための、請求項1~11のいずれかに記載の一般式(1)の化合物の使用。

【請求項17】

該薬剤がウイルス性疾患を制御する薬剤である請求項16に記載の一般式(1)の化合物の使用。

【請求項18】

該薬剤がサイトメガロウイルス感染を制御する薬剤である請求項16または17に記載の一般式(1)の化合物の使用。

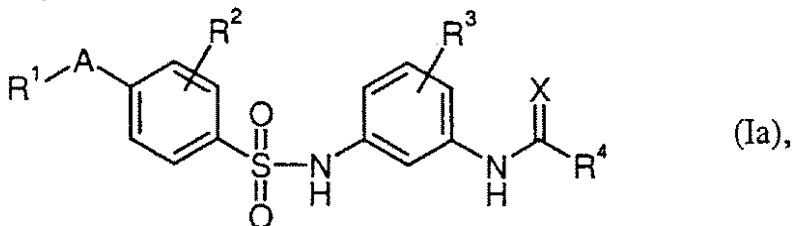
【請求項19】

請求項1に記載の一般式(1)の化合物を含んで成る薬剤。

【請求項20】

請求項1に記載の一般式(1a)の化合物：

【化24】



(1a),

[式中、R¹、R²、R³、R⁴、AおよびXは前記のように定義される]。