

【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28年5月19日(2016.5.19)

【公表番号】特表2015-510946(P2015-510946A)

【公表日】平成27年4月13日(2015.4.13)

【年通号数】公開・登録公報2015-024

【出願番号】特願2015-501862(P2015-501862)

【国際特許分類】

C 07 H	19/06	(2006.01)
C 07 H	19/16	(2006.01)
C 07 H	19/10	(2006.01)
C 07 H	19/20	(2006.01)
C 07 H	19/11	(2006.01)
A 61 P	31/12	(2006.01)
A 61 P	31/16	(2006.01)
A 61 P	31/14	(2006.01)
A 61 K	31/7072	(2006.01)
A 61 K	31/708	(2006.01)

【F I】

C 07 H	19/06	C S P
C 07 H	19/16	
C 07 H	19/10	
C 07 H	19/20	
C 07 H	19/11	
A 61 P	31/12	
A 61 P	31/16	
A 61 P	31/14	
A 61 K	31/7072	
A 61 K	31/708	

【手続補正書】

【提出日】平成28年3月17日(2016.3.17)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

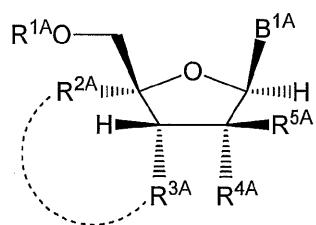
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

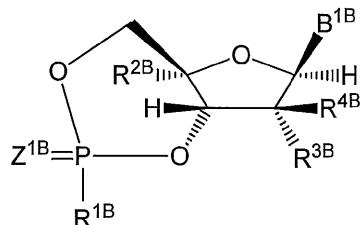
【請求項1】

ヘニパウイルス、モルビリウイルス、レスピロウイルス、ルプラウイルスおよびメタニューモウイルスから選択されるウイルスによってもたらされるウイルス感染症を改善または処置するための、式(I)、式(II)、および式(III)から選択される化合物、または上記のものの医薬的に許容される塩であって、該化合物は、下記の構造の1つを有する式(I)、式(II)、および式(III)から選択される化合物または上記のものの医薬的に許容される塩：

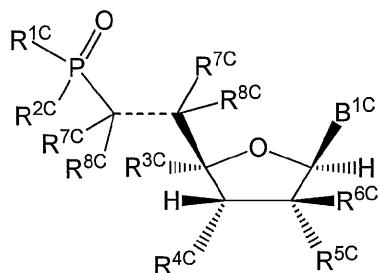
【化1】



(I)



(II)



(III)

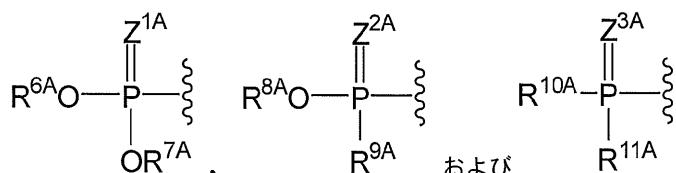
式中、

B^{1A}、B^{1B}およびB^{1C}は独立して、置換されていてもよい複素環式塩基、または保護されたアミノ基を有する置換されていてもよい複素環式塩基である；

R^{1A}は、水素、置換されていてもよいアシル、置換されていてもよいO-結合アミノ酸

、

【化2】



および

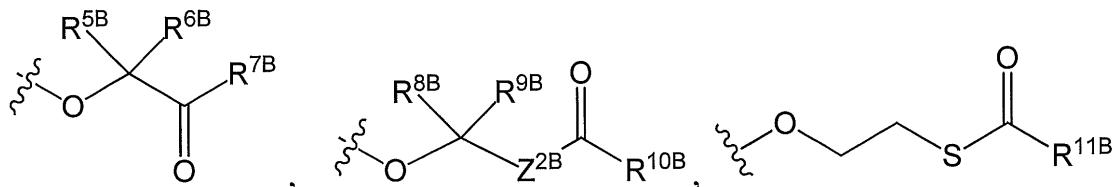
からなる群から選択される；

式(I)の破線(- - - - -)が、非存在である；R^{2A}は、非置換のC_{1~6}アルキル、ハロゲン置換されたC_{1~6}アルキル、ヒドロキシ置換されたC_{1~6}アルキル、アルコキシ置換されたC_{1~6}アルキルまたはスルフェニル置換されたC_{1~6}アルキル、置換されていてもよいC_{2~6}アルケニル、置換されていてもよいC_{2~6}アルキニル、置換されていてもよいC_{3~6}シクロアルキル、置換されていてもよい-O-C_{1~6}アルキル、置換されていてもよい-O-C_{3~6}アルケニル、置換されていてもよい-O-C_{3~6}アルキニルおよびシアノからなる群から選択される；

R^{3A}は、OH、-OC(=O)R'、および置換されていてもよいO-結合アミノ酸からなる群から選択される；

R^{1B}は、O⁻、OH、

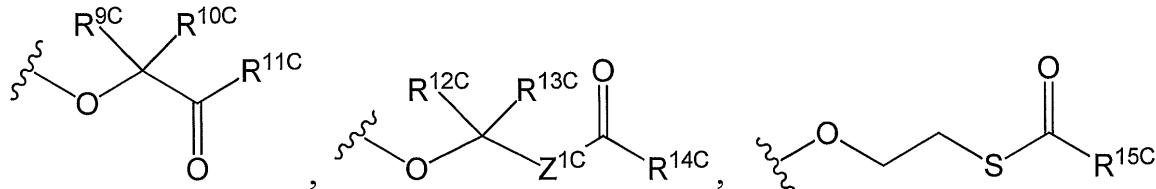
【化3】



置換されていてもよいN-結合アミノ酸および置換されていてもよいN-結合アミノ酸エステル誘導体からなる群から選択される；

R^{1C}およびR^{2C}は独立して、O⁻、OH、置換されていてもよいC_{1~6}アルコキシ

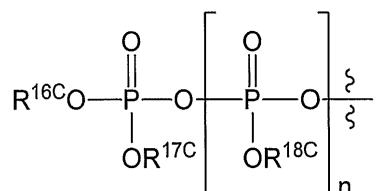
【化4】



置換されていてもよいN-結合アミノ酸および置換されていてもよいN-結合アミノ酸エステル誘導体からなる群から選択される；あるいは

R^{1C}は、

【化5】



であり、R^{2C}は、O⁻またはOHである；

R^{2B}およびR^{3C}は独立して、置換されていてもよいC_{1~6}アルキル、置換されていてもよいC_{2~6}アルケニル、置換されていてもよいC_{2~6}アルキニル、置換されていてもよいC_{3~6}シクロアルキル、置換されていてもよい-O-C_{1~6}アルキル、置換されていてもよい-O-C_{3~6}アルケニル、置換されていてもよい-O-C_{3~6}アルキニルおよびシアノからなる群から選択される；

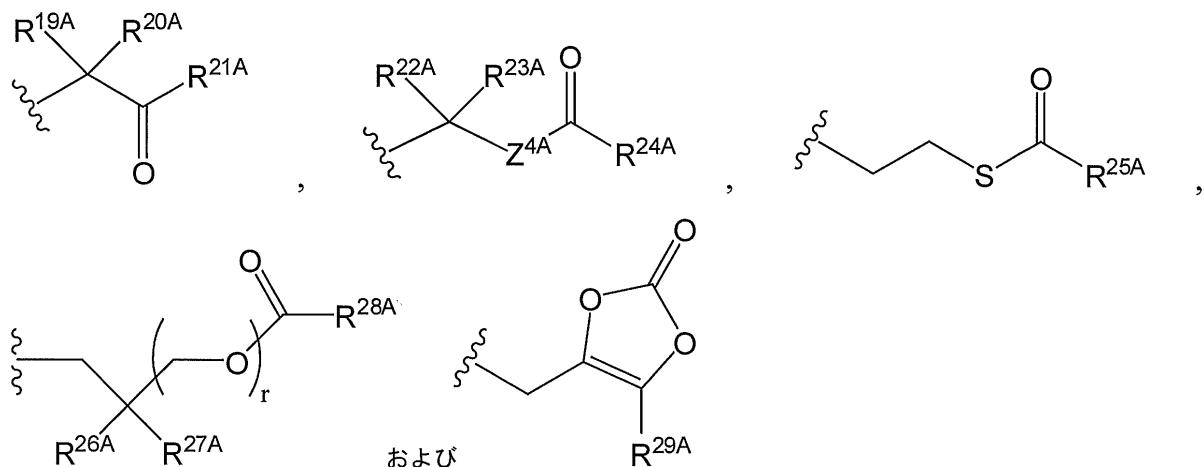
R^{4C}は、OH、-OC(=O)R' 'Cおよび置換されていてもよいO-結合アミノ酸からなる群から選択される；

R^{4A}、R^{3B}およびR^{5C}は独立して、ハロゲンである；

R^{5A}、R^{4B}およびR^{6C}は独立して、水素またはハロゲンである；

R^{6A}、R^{7A}およびR^{8A}は独立して、非存在、水素、置換されていてもよいC_{1~2}₄アルキル、置換されていてもよいC_{2~2}₄アルケニル、置換されていてもよいC_{2~2}₄アルキニル、置換されていてもよいC_{3~6}シクロアルキル、置換されていてもよいC_{3~6}シクロアルケニル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアリール(C_{1~6}アルキル)、置換されていてもよい*- (CR^{1~5A} R^{1~6A})_p-O-C_{1~2}₄アルキル、置換されていてもよい*- (CR^{1~7A} R^{1~8A})_q-O-C_{1~2}₄アルケニル、

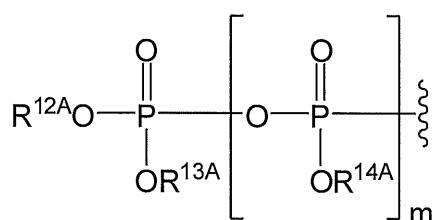
【化6】



からなる群から選択される；あるいは

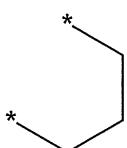
$\text{R}^{6\text{A}}$ は、

【化7】



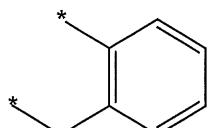
であり、 $\text{R}^{7\text{A}}$ は、非存在または水素である；あるいは
 $\text{R}^{6\text{A}}$ および $\text{R}^{7\text{A}}$ は一緒にになって、置換されていてもよい

【化8】



および置換されていてもよい

【化9】



からなる群から選択される成分を形成し、ただし、この場合、 $\text{R}^{6\text{A}}$ および $\text{R}^{7\text{A}}$ につながっている酸素と、リンと、該成分とは、6員～10員環系を形成する；

$\text{R}^{9\text{A}}$ は独立して、置換されていてもよい $\text{C}_{1~\sim~2~4}$ アルキル、置換されていてもよい $\text{C}_{2~\sim~2~4}$ アルケニル、置換されていてもよい $\text{C}_{2~\sim~2~4}$ アルキニル、置換されていてもよい $\text{C}_{3~\sim~6}$ シクロアルキル、置換されていてもよい $\text{C}_{3~\sim~6}$ シクロアルケニル、 $\text{NRR}^{3~0}$ $\text{A}\text{R}^{3~1\text{A}}$ 、置換されていてもよい N -結合アミノ酸および置換されていてもよい N -結合アミノ酸エステル誘導体からなる群から選択される；

$\text{R}^{10\text{A}}$ および $\text{R}^{11\text{A}}$ は独立して、置換されていてもよい N -結合アミノ酸または置換されていてもよい N -結合アミノ酸エステル誘導体である；

$\text{R}^{12\text{A}}$ 、 $\text{R}^{13\text{A}}$ および $\text{R}^{14\text{A}}$ は独立して、非存在または水素である；

各 $\text{R}^{15\text{A}}$ 、各 $\text{R}^{16\text{A}}$ 、各 $\text{R}^{17\text{A}}$ および各 $\text{R}^{18\text{A}}$ は独立して、水素、置換されていてもよい $\text{C}_{1~\sim~2~4}$ アルキルまたはアルコキシである；

$R^{1\sim 9A}$ 、 $R^{2\sim 0A}$ 、 $R^{2\sim 2A}$ 、 $R^{2\sim 3A}$ 、 R^{5B} 、 R^{6B} 、 R^{8B} 、 R^{9B} 、 R^{9C} 、 $R^{1\sim 0C}$ 、 $R^{1\sim 2C}$ および $R^{1\sim 3C}$ は独立して、水素、置換されていてもよい $C_{1\sim 24}$ アルキルおよび置換されていてもよいアリールからなる群から選択される；

$R^{2\sim 1A}$ 、 $R^{2\sim 4A}$ 、 R^{7B} 、 $R^{1\sim 0B}$ 、 $R^{1\sim 1C}$ および $R^{1\sim 4C}$ は独立して、水素、置換されていてもよい $C_{1\sim 24}$ アルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよい $-O-C_{1\sim 24}$ アルキルおよび置換されていてもよい $-O-$ アリールからなる群から選択される；

$R^{2\sim 5A}$ 、 $R^{2\sim 9A}$ 、 $R^{1\sim 1B}$ および $R^{1\sim 5C}$ は独立して、水素、置換されていてもよい $C_{1\sim 24}$ アルキルおよび置換されていてもよいアリールからなる群から選択される；

$R^{1\sim 6C}$ 、 $R^{1\sim 7C}$ および $R^{1\sim 8C}$ は独立して、非存在または水素である；

$R^{2\sim 6A}$ および $R^{2\sim 7A}$ は独立して、 $-C-N$ 、または $C_{2\sim 8}$ オルガニルカルボニル、 $C_{2\sim 8}$ アルコキシカルボニルおよび $C_{2\sim 8}$ オルガニルアミノカルボニルからなる群から選択される置換されていてもよい置換基である；

$R^{2\sim 8A}$ は、水素、置換されていてもよい $C_{1\sim 24}$ -アルキル、置換されていてもよい $C_{2\sim 24}$ アルケニル、置換されていてもよい $C_{2\sim 24}$ アルキニル、置換されていてもよい $C_{3\sim 6}$ シクロアルキルおよび置換されていてもよい $C_{3\sim 6}$ シクロアルケニルからなる群から選択される；

$R^{3\sim 0A}$ および $R^{3\sim 1A}$ は独立して、水素、置換されていてもよい $C_{1\sim 24}$ -アルキル、置換されていてもよい $C_{2\sim 24}$ アルケニル、置換されていてもよい $C_{2\sim 24}$ アルキニル、置換されていてもよい $C_{3\sim 6}$ シクロアルキルおよび置換されていてもよい $C_{3\sim 6}$ シクロアルケニルからなる群から選択される；

式(I)について、 $\cdots\cdots\cdots$ は、単結合または二重結合である；

$\cdots\cdots\cdots$ が、単結合であるとき、各 R^7C および各 R^8C は独立して、水素またはハロゲンである；

$\cdots\cdots\cdots$ が、二重結合であるとき、各 R^7C は、非存在であり、各 R^8C は独立して、水素またはハロゲンである；

$R^{1\sim 4A}$ および $R^{1\sim 4C}$ は独立して、置換されていてもよい $C_{1\sim 24}$ -アルキルである；

m および n は独立して、0または1である；

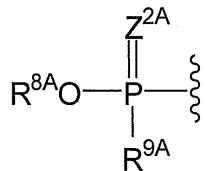
p および q は独立して、1、2および3からなる群から選択される；

r は、1または2である；

Z^{1A} 、 Z^{2A} 、 Z^{3A} 、 Z^{4A} 、 Z^{1B} 、 Z^{2B} および Z^{1C} は独立して、OまたはSである；

ただし、式(I)の破線($\cdots\cdots\cdots$)が、非存在であり； R^{1A} が、

【化10】



(式中、 R^{8A} は、非置換の $C_{1\sim 4}$ アルキル、またはハロゲンもしくはメチルでパラ置換されていてもよいフェニルであり、 R^{9A} は、グリシン、アラニン、バリン、ロイシン、フェニルアラニン、トリプトファン、メチオニンおよびプロリンからなる群から選択されるアミノ酸のメチルエステル、エチルエステル、イソプロピルエステル、n-ブチルエステル、ベンジルエステルまたはフェニルエステルである)であり； R^{3A} が、OHであり； R^{4A} が、フルオロであり； R^{5A} が、フルオロまたは水素であり； B^{1A} が、非置換のウラシルであるとき； R^{2A} は、 $-OCH_3$ とすることができます；

ただし、式(I)の破線($\cdots\cdots\cdots$)が、非存在であり； R^{1A} が、Hであり； R^{3A} が、OHであり； R^{4A} が、フルオロであり； R^{5A} が、フルオロであり； B^{1A} が、

非置換のシトシンであるとき； R^{2A} は、アレニルとすることができない；および、ただし、式(I)の破線(-----)が、非存在であり； R^{1A} が、Hであり； R^{3A} が、OHであり； R^{4A} が、フルオロであり； R^{5A} が、フルオロであり； B^{1A} が、非置換のシトシンであるとき； R^{2A} は、エチニルとすることができない。

【請求項2】

前記ウイルスが、ヘニパウイルス、モルビリウイルスおよび／またはルプラウイルスである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

前記ヘニパウイルスが、ニパーウイルスである；前記モルビリウイルスが麻疹ウイルスである；および／または前記ルプラウイルスが流行性耳下腺炎ウイルスである、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

前記ウイルスが、レスピロウイルスである、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

前記レスピロウイルスが、ヒトパラインフルエンザウイルス1である、請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

前記レスピロウイルスが、ヒトパラインフルエンザウイルス3である、請求項4に記載の化合物。

【請求項7】

前記ウイルスが、ルプラウイルスである、請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

前記ルプラウイルスが、ヒトパラインフルエンザウイルス2、および／またはヒトパラインフルエンザウイルス4である、請求項7に記載の化合物。

【請求項9】

前記ウイルスが、メタニューモウイルスである、請求項1に記載の化合物。

【請求項10】

前記メタニューモウイルスが、ヒトメタニューモウイルスである、請求項9に記載の化合物。

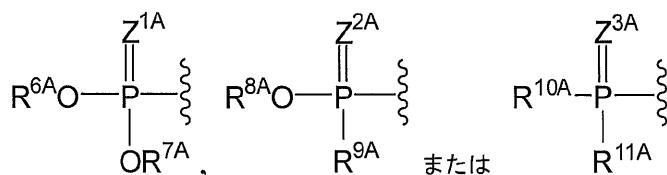
【請求項11】

前記化合物が、式(I)の化合物である、請求項1～10のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項12】

R^{1A} が、

【化11】



である、請求項11に記載の化合物。

【請求項13】

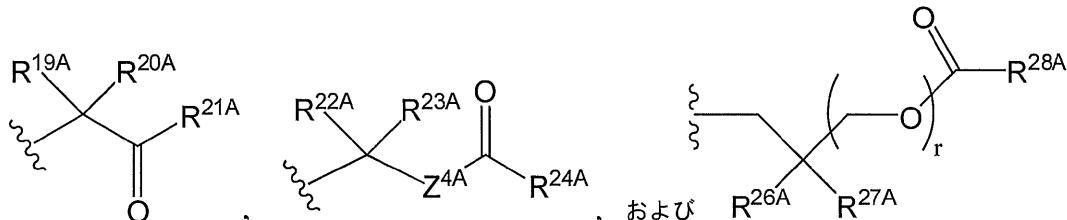
R^{6A} および R^{7A} がともに、水素または非存在である、請求項12に記載の化合物。

【請求項14】

R^{6A} および R^{7A} の一方が、水素であり、 R^{6A} および R^{7A} の他方が、置換されていてもよいC_{1～24}アルキル、置換されていてもよいC_{2～24}アルケニル、置換されていてもよいC_{2～24}アルキニル、置換されていてもよいC_{3～6}シクロアルキル、置換されていてもよいC_{3～6}シクロアルケニル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリールおよび置換されていてもよいアリール(C_{1～6}アルキル

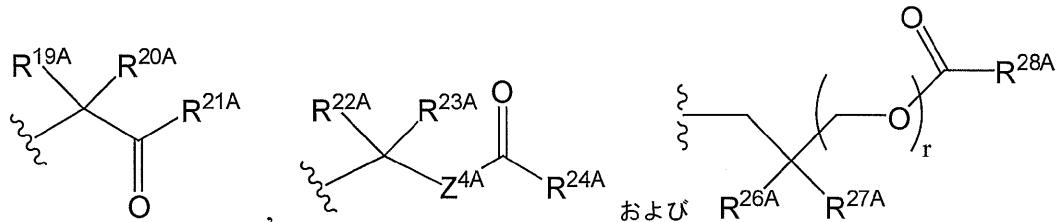
) からなる群から選択される； R^{6A} および R^{7A} の両方が独立して、置換されていてもよい $C_{1\sim24}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{2\sim24}$ アルケニル、置換されていてもよい $C_{2\sim24}$ アルキニル、置換されていてもよい $C_{3\sim6}$ シクロアルキル、置換されていてもよい $C_{3\sim6}$ シクロアルケニル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリールおよび置換されていてもよいアリール ($C_{1\sim6}$ アルキル) からなる群から選択される； R^{6A} および R^{7A} の少なくとも一方が、

【化12】



からなる群から選択される；および R^{6A} および R^{7A} の他方が、非存在、水素、置換されていてもよい $C_{1\sim24}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{2\sim24}$ アルケニル、置換されていてもよい $C_{2\sim24}$ アルキニル、置換されていてもよい $C_{3\sim6}$ シクロアルキル、置換されていてもよい $C_{3\sim6}$ シクロアルケニル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリールおよび置換されていてもよいアリール ($C_{1\sim6}$ アルキル) からなる群から選択される； R^{6A} および R^{7A} の両方が独立して、

【化13】

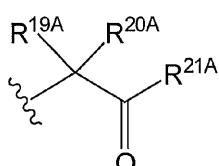


からなる群から選択される； R^{6A} および R^{7A} がとともに、置換されていてもよい $C_{1\sim24}$ アルキルである； R^{6A} および R^{7A} がとともに、置換されていてもよい $C_{2\sim24}$ アルケニルである； R^{6A} および R^{7A} がとともに、*-(CR^{15A}R^{16A})_p-O-C_{1\sim24} アルキルである； R^{6A} および R^{7A} がとともに、*-(CR^{17A}R^{18A})_q-O-C_{2\sim24} アルケニルである； R^{6A} および R^{7A} がとともに、置換されていてもよいアリールである；または R^{6A} および R^{7A} がともに、置換されていてもよいアリール ($C_{1\sim6}$ アルキル) である、請求項12に記載の化合物。

【請求項15】

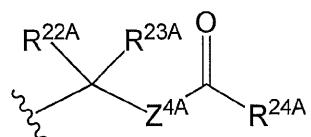
R^{6A} および R^{7A} がともに、

【化14】



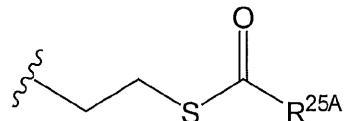
である； R^{6A} および R^{7A} がともに、

【化15】



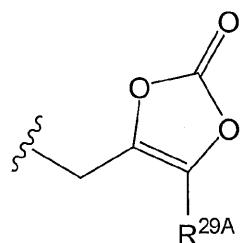
である；R<sup>6A</sup>およびR<sup>7A</sup>がともに、

【化16】



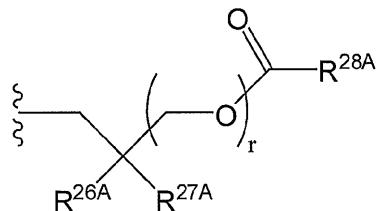
である；R<sup>6A</sup>およびR<sup>7A</sup>がともに、

【化17】



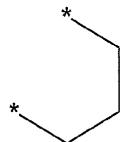
である；R<sup>6A</sup>およびR<sup>7A</sup>がともに、

【化18】



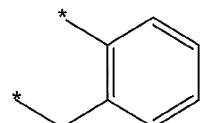
である；または、R<sup>6A</sup>およびR<sup>7A</sup>が一緒になって、置換されていてもよい

【化19】



および置換されていてもよい

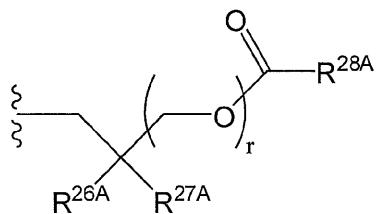
【化20】



からなる群から選択される成分を形成することができ、ただし、この場合、R<sup>6A</sup>およびR<sup>7A</sup>につながっている酸素と、リンと、該成分とは、6員～10員環系を形成する、請求項12に記載の化合物。

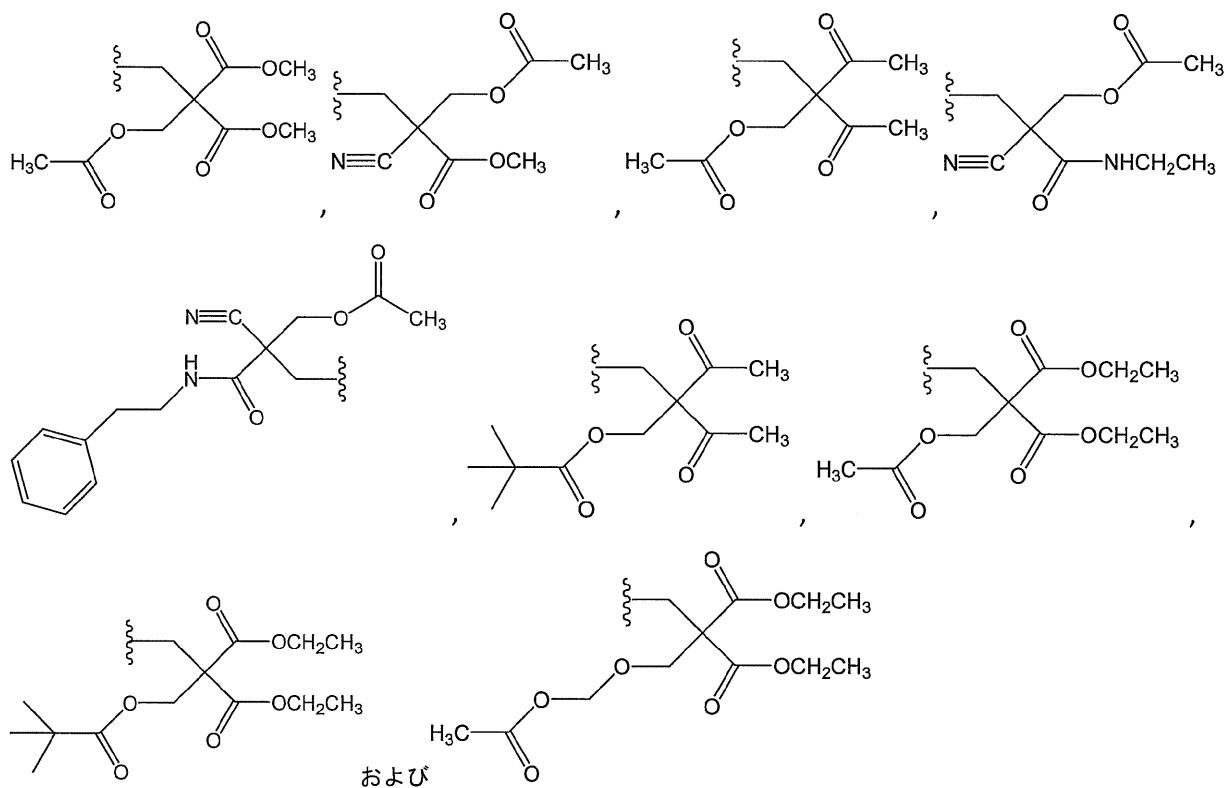
【請求項16】

【化 2 1】

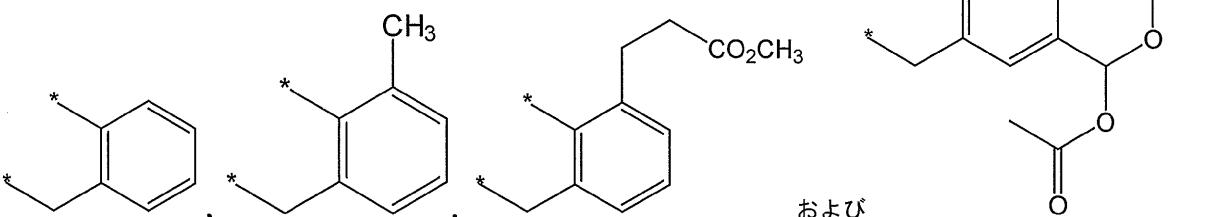
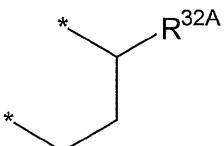


が、

【化 2 2】

からなる群から選択されるか、または、 $\text{R}^{6\text{A}}$ および $\text{R}^{7\text{A}}$ が一緒になって、

【化 2 3】

からなる群から選択される成分を形成することができ、ただし、この場合、 $\text{R}^{32\text{A}}$ は、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリールまたは置換されていてもよいヘテロシクリルである、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 17】

 $\text{Z}^{1\text{A}}$ が、O である、請求項 12 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 18】

Z^{1A} が、S である、請求項 12 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物。

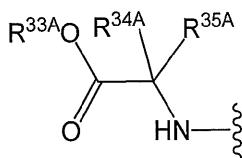
【請求項 19】

R^{8A} が、非存在、水素、置換されていてもよい $C_{1~2~4}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{2~2~4}$ アルケニル、置換されていてもよい $C_{2~2~4}$ アルキニル、置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルキルおよび置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルケニルからなる群から選択され； R^{9A} が独立して、置換されていてもよい $C_{1~2~4}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{2~2~4}$ アルケニル、置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルキルおよび置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルケニルからなる群から選択される； R^{8A} が、水素であり、 R^{9A} が、 $NR^{30A}R^{31A}$ であり、ただし、この場合、 R^{30} および R^{31} は独立して、水素、置換されていてもよい $C_{1~2~4}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{2~2~4}$ アルケニル、置換されていてもよい $C_{2~2~4}$ アルキニル、置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルキルおよび置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルケニルからなる群から選択される； R^{8A} が、非存在または水素であり； R^{9A} が、置換されていてもよい N - 結合アミノ酸、または置換されていてもよい N - 結合アミノ酸エステル誘導体である； または、 R^{8A} が、置換されていてもよいアリールであり； R^{9A} が、置換されていてもよい N - 結合アミノ酸または置換されていてもよい N - 結合アミノ酸エステル誘導体である、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 20】

R^{9A} が、アラニン、アスパラギン、アスパラギン酸、システイン、グルタミン酸、グルタミン、グリシン、プロリン、セリン、チロシン、アルギニン、ヒスチジン、イソロイシン、ロイシン、リシン、メチオニン、フェニルアラニン、トレオニン、トリプトファン、バリンおよびそれらのエステル誘導体からなる群から選択される； R^{9A} が、アラニンイソプロピルエステル、アラニンシクロヘキシリエステル、アラニンネオペンチルエステル、バリンイソプロピルエステルおよびロイシンイソプロピルエステルからなる群から選択される； または、 R^{9A} が、構造

【化 24】



(式中、 R^{33A} は、水素、置換されていてもよい $C_{1~6}$ - アルキル、置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアリール ($C_{1~6}$ アルキル) および置換されていてもよいハロアルキルからなる群から選択される； R^{34A} は、水素、置換されていてもよい $C_{1~6}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{1~6}$ ハロアルキル、置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルキル、置換されていてもよい C_6 アリール、置換されていてもよい $C_{1~6}$ アリールおよび置換されていてもよいアリール ($C_{1~6}$ アルキル) からなる群から選択される； R^{35A} は、水素または置換されていてもよい $C_{1~4}$ - アルキルである； あるいは R^{34A} および R^{35A} は一緒にになって、置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルキルを形成する) を有する、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 21】

R^{34A} が、置換されていてもよい $C_{1~6}$ - アルキルである； R^{35A} が、水素である； および / または R^{33A} が、置換されていてもよい $C_{1~6}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルキルまたは置換されていてもよいベンジルである、請求項 20 に記載の化合物。

【請求項 22】

Z^{2A} が、O である、請求項 12 または 19 ~ 21 のいずれか一項に記載の化合物。

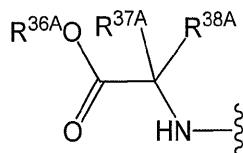
【請求項 2 3】

Z^{2A} が、S である、請求項 1 2 または 1 9 ~ 2 1 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 4】

R^{10A} および R^{11A} がともに、置換されていてもよいN-結合アミノ酸または置換されていてもよいN-結合アミノ酸エステル誘導体である； R^{10A} および R^{11A} が独立して、アラニン、アスパラギン、アスパラギン酸、システイン、グルタミン酸、グルタミン、グリシン、プロリン、セリン、チロシン、アルギニン、ヒスチジン、イソロイシン、ロイシン、リシン、メチオニン、フェニルアラニン、トレオニン、トリプトファン、バリンおよびそれらのエステル誘導体からなる群から選択される； R^{10A} および R^{11A} が独立して、アラニンイソプロピルエステル、アラニンシクロヘキシリエステル、アラニンネオペンチルエステル、バリンイソプロピルエステルおよびロイシンイソプロピルエステルからなる群から選択される； または、 R^{10A} および R^{11A} が独立して、構造

【化 2 5】



(式中、 R^{36A} は、水素、置換されていてもよい $C_{1~6}$ -アルキル、置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアリール ($C_{1~6}$ アルキル) および置換されていてもよいハロアルキルからなる群から選択される； R^{37A} は、水素、置換されていてもよい $C_{1~6}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{1~6}$ ハロアルキル、置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルキル、置換されていてもよい C_6 アリール、置換されていてもよい C_{10} アリールおよび置換されていてもよいアリール ($C_{1~6}$ アルキル) からなる群から選択される； R^{38A} は、水素または置換されていてもよい $C_{1~4}$ -アルキルである； あるいは R^{37A} および R^{38A} は一緒にになって、置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルキルを形成する) を有する、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

R^{37A} が、置換されていてもよい $C_{1~6}$ -アルキルである； R^{38A} が、水素であるおよび / または R^{36A} が、置換されていてもよい $C_{1~6}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルキルまたは置換されていてもよいベンジルである、請求項 2 4 に記載の化合物。

【請求項 2 6】

Z^{3A} が、O である、請求項 1 2 または 2 4 ~ 2 5 のいずれか一項に記載の化合物。

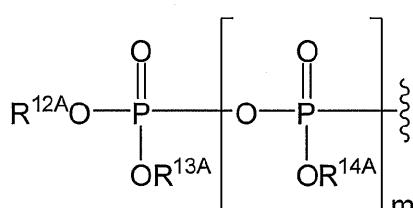
【請求項 2 7】

Z^{3A} が、S である、請求項 1 2 または 2 4 ~ 2 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 8】

R^{6A} が、

【化 2 6】



であり、 R^{7A} が非存在または水素である；

ただし、 R^{12A} 、 R^{13A} および R^{14A} は独立して、非存在または水素である、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 2 9】

m が、0であり、 $R^{1~2~A}$ および $R^{1~3~A}$ が独立して、非存在または水素である；または m が、1であり、 $R^{1~2~A}$ 、 $R^{1~3~A}$ および $R^{1~4~A}$ が独立して、非存在または水素である、請求項28に記載の化合物。

【請求項30】

$R^{1~A}$ が、Hである、請求項11に記載の化合物。

【請求項31】

$R^{1~A}$ が、置換されていてもよいアシルである、請求項11に記載の化合物。

【請求項32】

前記置換されていてもよいアシルが、-C(=O)R^{3~9~A}であり、R^{3~9~A}が、置換されていてもよいC_{1~1~2}アルキル、置換されていてもよいC_{2~1~2}アルケニル、置換されていてもよいC_{2~1~2}アルキニル、置換されていてもよいC_{3~8}シクロアルキル、置換されていてもよいC_{5~8}シクロアルケニル、置換されていてもよいC_{6~1~0}アリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール(C_{1~6}アルキル)、置換されていてもよいヘテロアリール(C_{1~6}アルキル)および置換されていてもよいヘテロシクリル(C_{1~6}アルキル)からなる群から選択される、請求項31に記載の化合物。

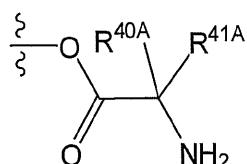
【請求項33】

R^{3~9~A}が、置換または非置換C_{1~1~2}アルキルである、請求項32に記載の化合物。

【請求項34】

$R^{1~A}$ が、置換されていてもよいO-結合アミノ酸である；または、 $R^{1~A}$ が、

【化27】



(式中、 $R^{4~0~A}$ は、水素、置換されていてもよいC_{1~6}アルキル、置換されていてもよいC_{1~6}ハロアルキル、置換されていてもよいC_{3~6}シクロアルキル、置換されていてもよいC₆アリール、置換されていてもよいC_{1~0}アリールおよび置換されていてもよいアリール(C_{1~6}アルキル)からなる群から選択される； $R^{4~1~A}$ は、水素または置換されていてもよいC_{1~4}-アルキルであり；あるいはR^{4~0~A}およびR^{4~1~A}は一緒になって、置換されていてもよいC_{3~6}シクロアルキルを形成する)である、請求項11に記載の化合物。

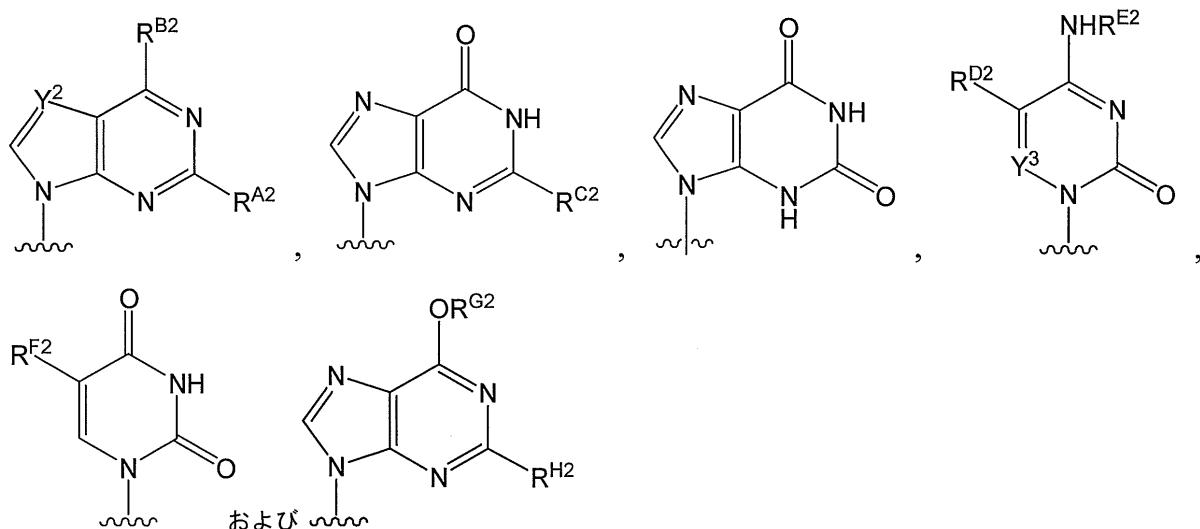
【請求項35】

$R^{4~0~A}$ が、置換されていてもよいC_{1~6}-アルキルである；および/または、 $R^{4~1~A}$ が、水素である、請求項34に記載の化合物。

【請求項36】

B^{1~A}が、

【化28】



からなる群から選択され、

式中、

R^{A2} は、水素、ハロゲンおよび NHR^{J2} からなる群から選択され、ただし、この場合、 R^{J2} は、水素、 $-C(=O)R^K2$ および $-C(=O)OR^L2$ からなる群から選択される；

R^{B2} は、ハロゲンまたは NHR^W2 であり、ただし、この場合、 R^W2 は、水素、置換されていてもよい $C_{1~6}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{2~6}$ アルケニル、置換されていてもよい $C_{3~8}$ シクロアルキル、 $-C(=O)R^M2$ および $-C(=O)OR^N2$ からなる群から選択される；

R^{C2} は、水素または NHR^O2 であり、ただし、この場合、 R^O2 は、水素、 $-C(=O)R^P2$ および $-C(=O)OR^Q2$ からなる群から選択される；

R^{D2} は、水素、ハロゲン、置換されていてもよい $C_{1~6}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{2~6}$ アルケニルおよび置換されていてもよい $C_{2~6}$ アルキニルからなる群から選択される；

R^{E2} は、水素、ヒドロキシ、置換されていてもよい $C_{1~6}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{3~8}$ シクロアルキル、 $-C(=O)R^R2$ および $-C(=O)OR^S2$ からなる群から選択される；

R^{F2} は、水素、ハロゲン、置換されていてもよい $C_{1~6}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{2~6}$ アルケニルおよび置換されていてもよい $C_{2~6}$ アルキニルからなる群から選択される；

Y^2 および Y^3 は独立して、 N または CR^I2 であり、ただし、この場合、 R^I2 は、水素、ハロゲン、置換されていてもよい $C_{1~6}$ - アルキル、置換されていてもよい $C_{2~6}$ - アルケニルおよび置換されていてもよい $C_{2~6}$ - アルキニルからなる群から選択される；

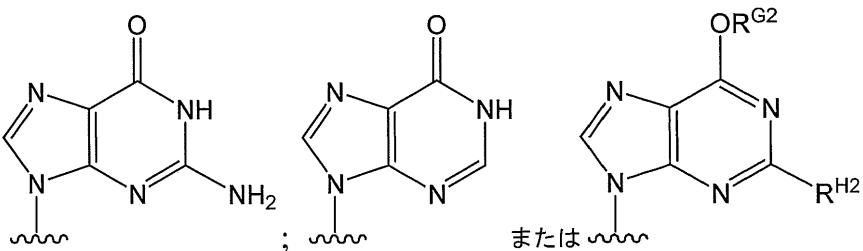
R^{G2} は、置換されていてもよい $C_{1~6}$ アルキルである；

R^{H2} は、水素または NHR^T2 であり、ただし、この場合、 R^T2 は独立して、水素、 $-C(=O)R^U2$ および $-C(=O)OR^V2$ からなる群から選択される；

R^K2 、 R^L2 、 R^M2 、 R^N2 、 R^P2 、 R^Q2 、 R^R2 、 R^S2 、 R^U2 および R^V2 は独立して、 $C_{1~6}$ アルキル、 $C_{2~6}$ アルケニル、 $C_{2~6}$ アルキニル、 $C_{3~6}$ シクロアルキル、 $C_{3~6}$ シクロアルケニル、 $C_{6~10}$ アリール、ヘテロアリール、ヘテロアリシクリル、アリール ($C_{1~6}$ アルキル)、ヘテロアリール ($C_{1~6}$ アルキル) およびヘテロアリシクリル ($C_{1~6}$ アルキル) からなる群から選択される、請求項 1 1 ~ 35 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項37】

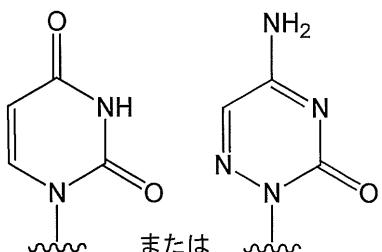
B^{1 A} が、
【化 2 9】



である、請求項 3 6 に記載の化合物。

【請求項 3 8】

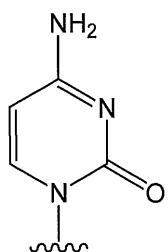
B^{1 A} が、
【化 3 0】



である、請求項 3 6 に記載の化合物。

【請求項 3 9】

B^{1 A} が、
【化 3 1】



である、請求項 3 6 に記載の化合物。

【請求項 4 0】

R^{2 A} が、ハロゲン置換された C_{1 ~ 6} アルキルまたはスルフェニル置換された C_{1 ~ 6} アルキルである、および、R^{3 A} が、O H、- O C (= O) R' ' A および置換されていてもよい O - 結合アミノ酸からなる群から選択される、請求項 1 1 ~ 3 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 4 1】

R^{2 A} が、非置換の C_{1 ~ 6} アルキルである、請求項 1 1 ~ 3 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 4 2】

R^{2 A} が、スルフェニル置換された C_{1 ~ 6} アルキルである、請求項 4 0 に記載の化合物。

【請求項 4 3】

R^{2 A} が、ハロゲン置換された C_{1 ~ 6} アルキルである、請求項 4 0 に記載の化合物。

【請求項 4 4】

R^{2 A} が、置換されていてもよい C_{2 ~ 6} アルケニル、置換されていてもよい C_{3 ~ 6} シクロアルキル、置換されていてもよい - O - C_{1 ~ 6} アルキル、置換されていてもよい - O - C_{3 ~ 6} アルケニル、置換されていてもよい - O - C_{3 ~ 6} アルキニル、またはシ

アノである、請求項 11～39 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 45】

R^{3A} が、OH である、請求項 11～44 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 46】

R^{3A} が、-OC(=O)R' であり、R' が、置換されていてもよいC_{1～8} アルキルである、請求項 11～44 のいずれか一項に記載の化合物。

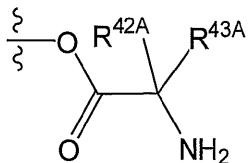
【請求項 47】

R^{3A} が、O-結合アミノ酸である、請求項 11～44 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 48】

前記 O-結合アミノ酸が、アラニン、アスパラギン、アスパラギン酸、システイン、グルタミン酸、グルタミン、グリシン、プロリン、セリン、チロシン、アルギニン、ヒスチジン、イソロイシン、ロイシン、リシン、メチオニン、フェニルアラニン、トレオニン、トリプトファンおよびバリンからなる群から選択される；または、R^{3A} が、

【化 32】



(式中、R^{42A} は、水素、置換されていてもよいC_{1～6} アルキル、置換されていてもよいC_{1～6} ハロアルキル、置換されていてもよいC_{3～6} シクロアルキル、置換されていてもよいC₆ アリール、置換されていてもよいC_{1～10} アリールおよび置換されていてもよいアリール(C_{1～6} アルキル)からなる群から選択される；R^{43A} は、水素または置換されていてもよいC_{1～4}-アルキルである；あるいはR^{42A} およびR^{43A} は一緒になって、置換されていてもよいC_{3～6} シクロアルキルを形成する)である、請求項 47 に記載の化合物。

【請求項 49】

R^{40A} が、置換されていてもよいC_{1～6} アルキルである；および／または、R^{43A} が水素である、請求項 48 に記載の化合物。

【請求項 50】

R^{5A} が、水素である、請求項 11～49 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 51】

R^{5A} が、ハロゲンである、請求項 11～49 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 52】

R^{4A} が、フルオロである、請求項 11～51 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 53】

式(I I)の化合物である、請求項 1～10 のいずれか一項に記載の化合物。

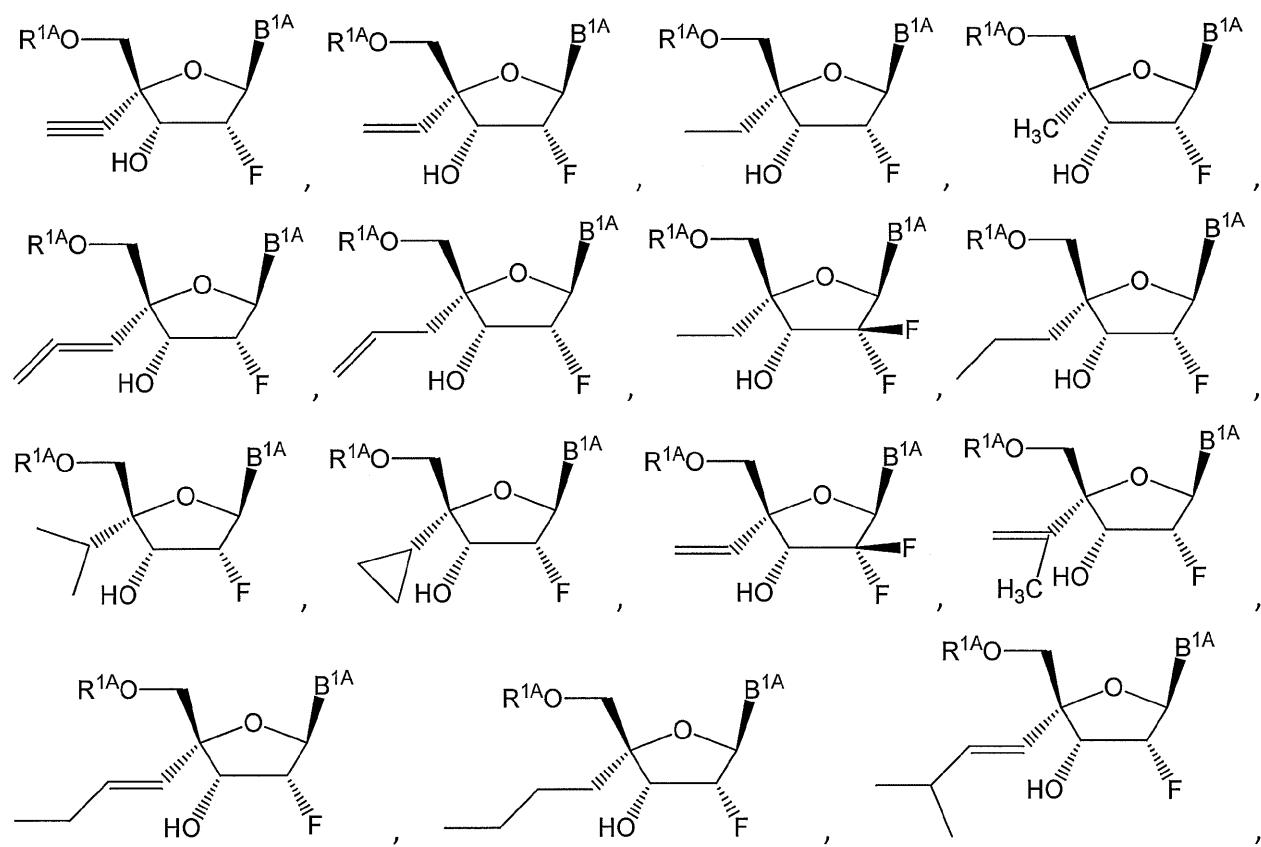
【請求項 54】

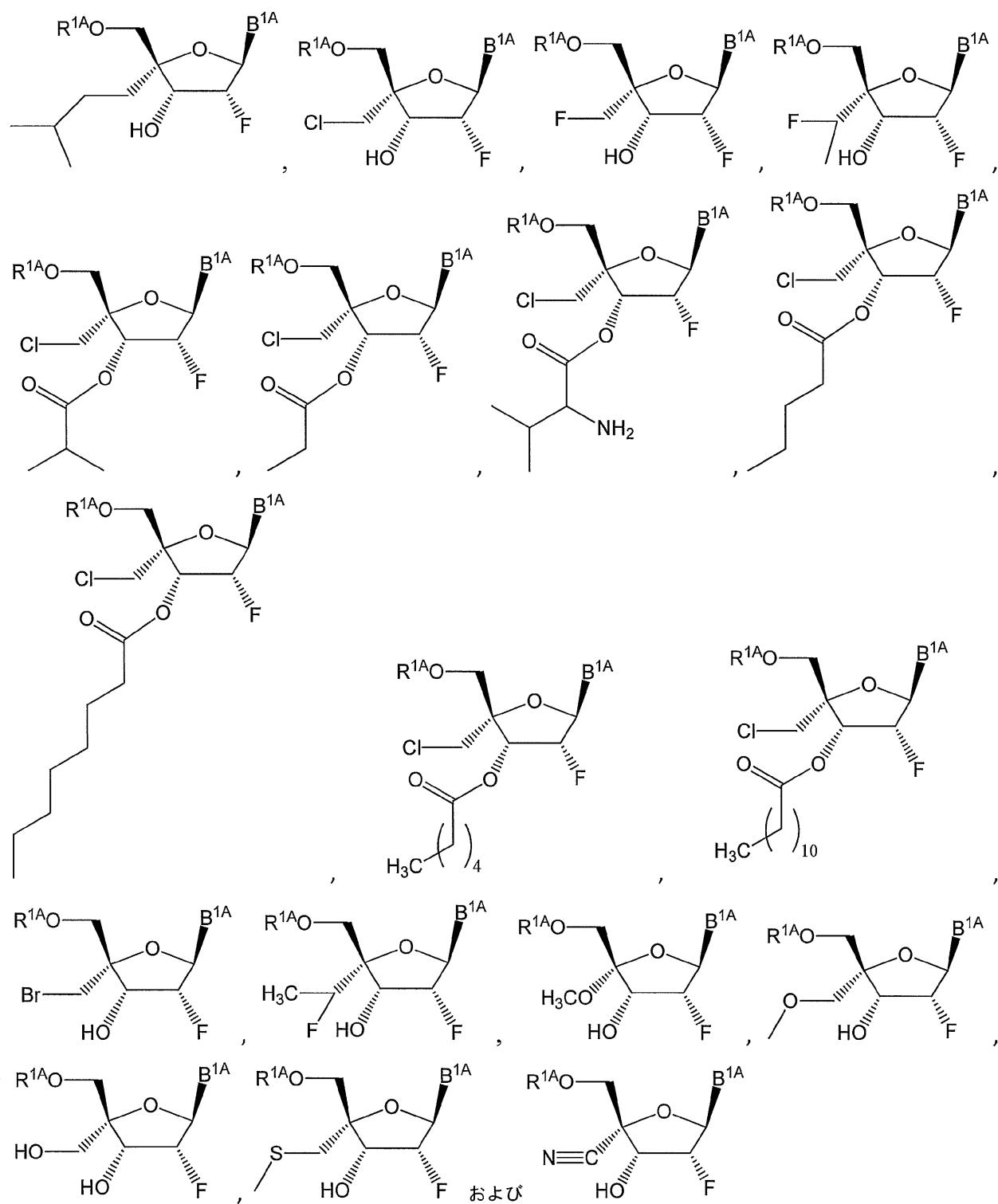
式(I I I)の化合物である、請求項 1～10 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 55】

式(I)の化合物が、

【化 3 3】



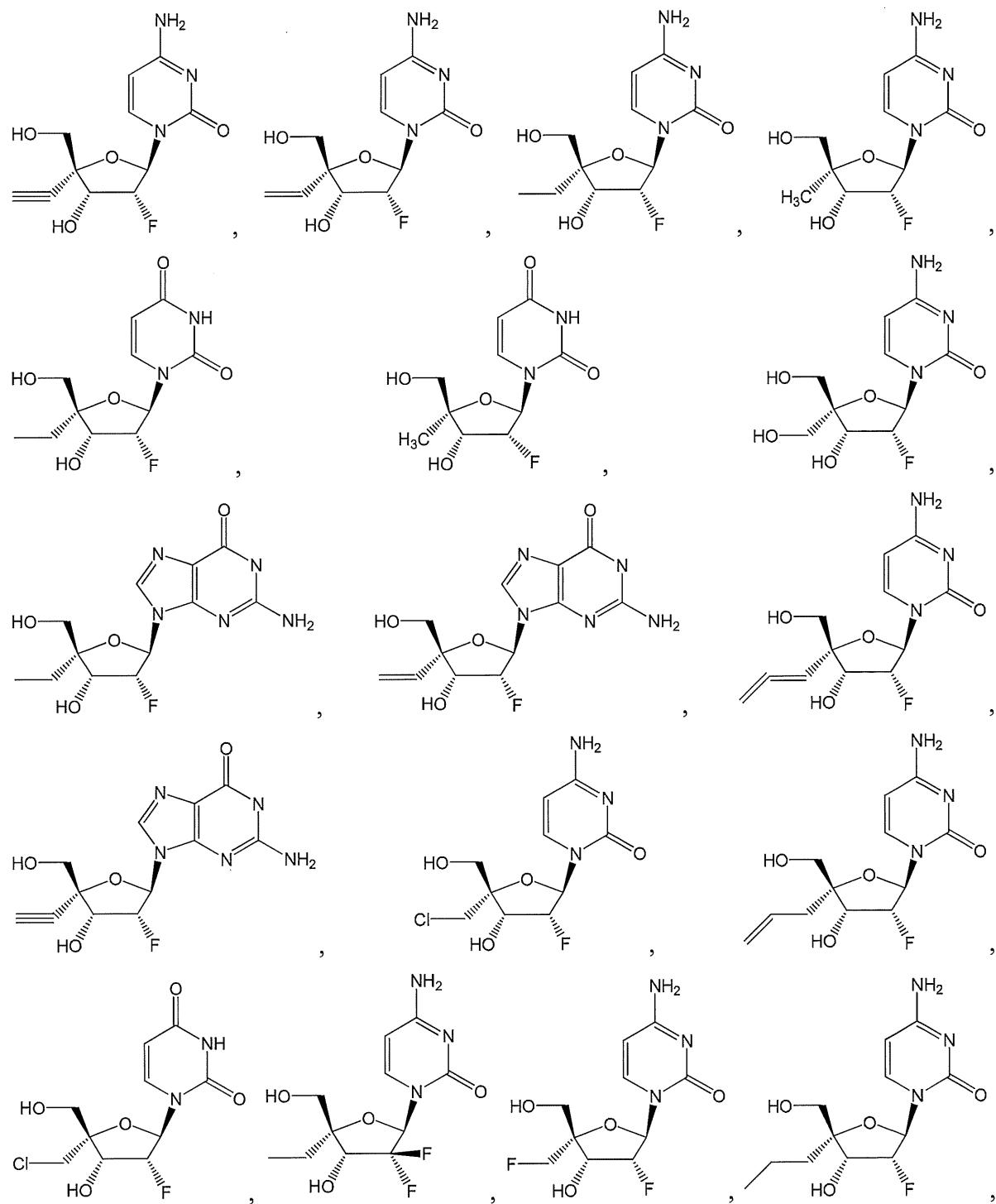


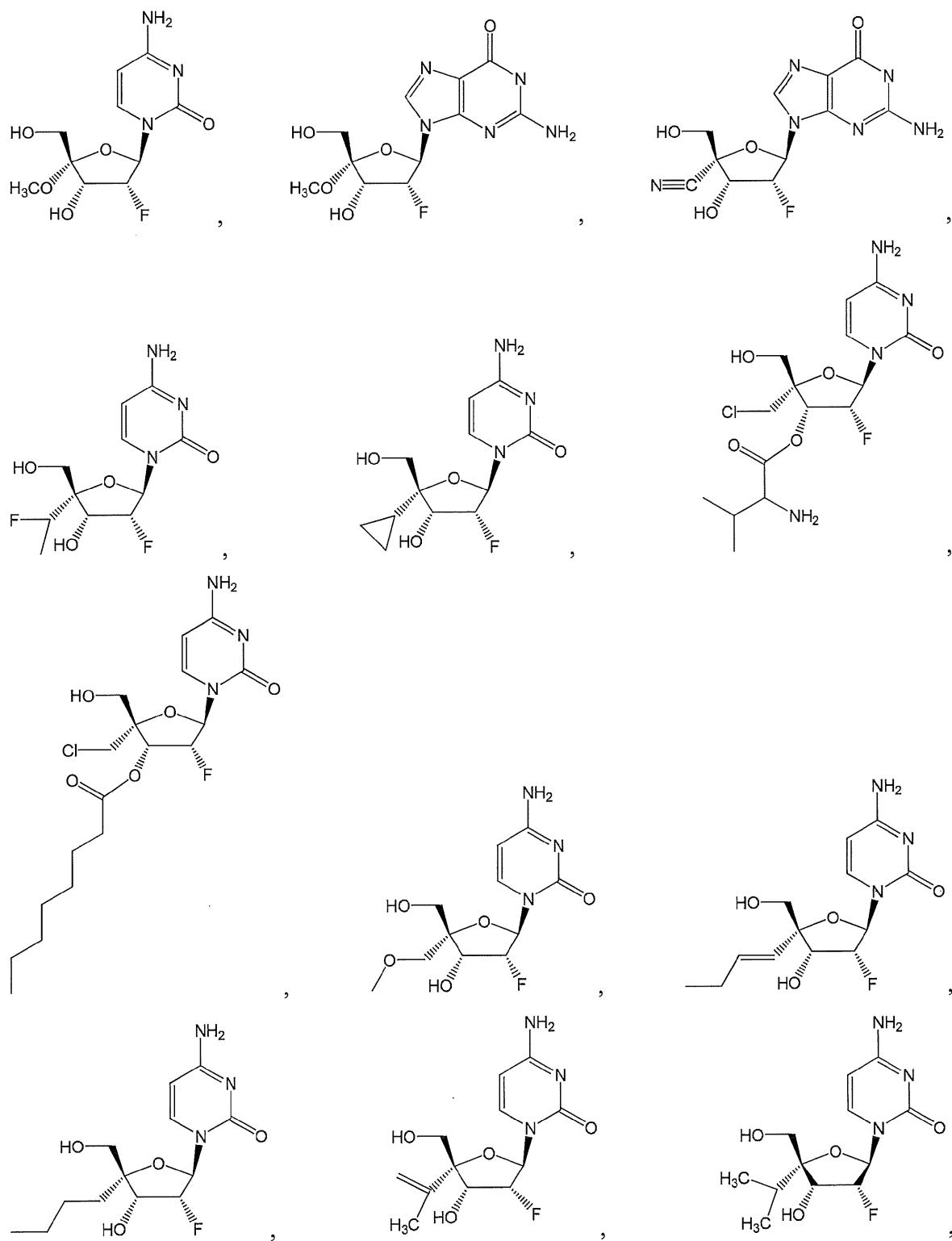
からなる群から選択される、または上記のものの医薬的に許容される塩である、請求項 1
1に記載の化合物。

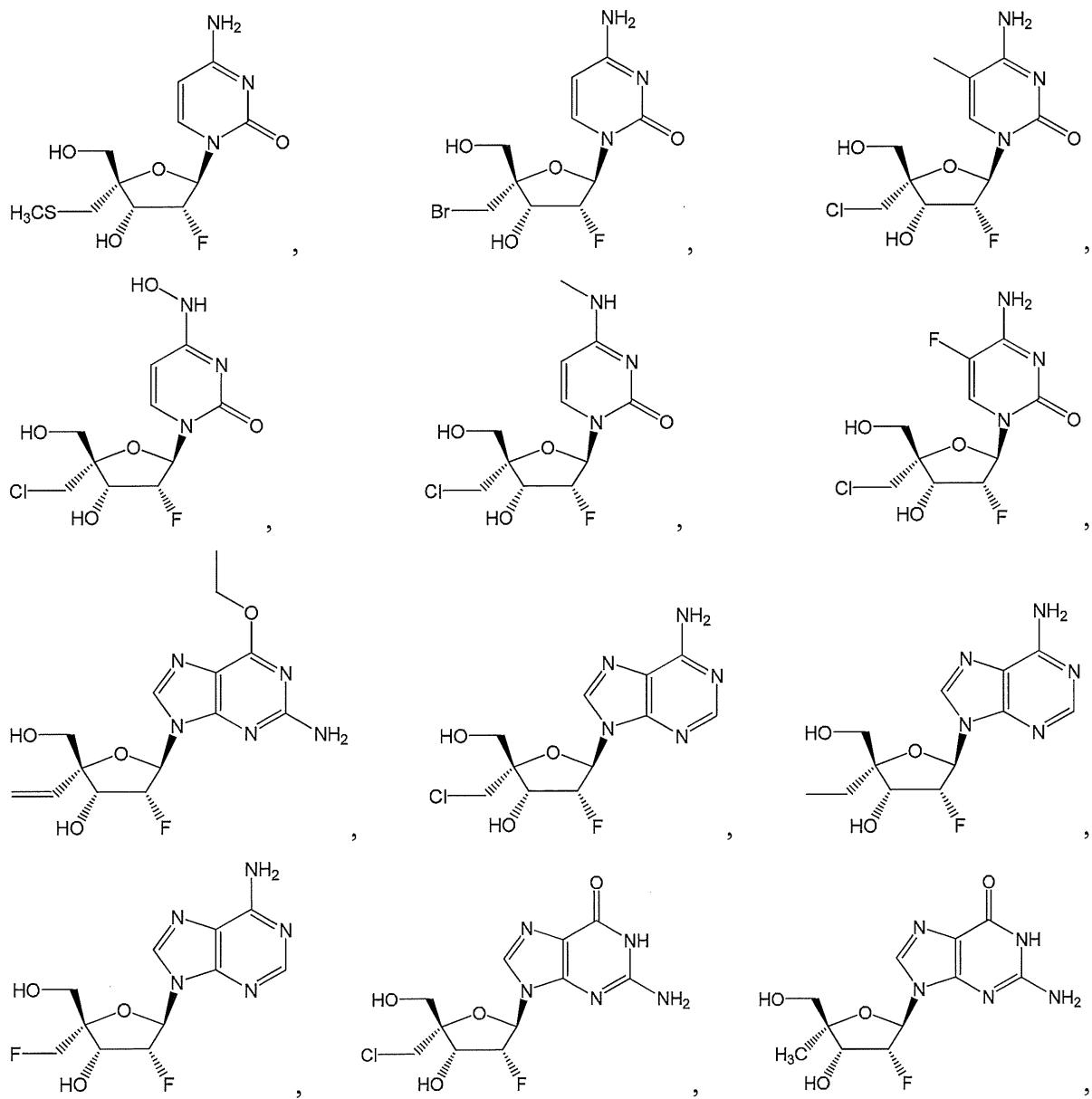
【請求項 5 6】

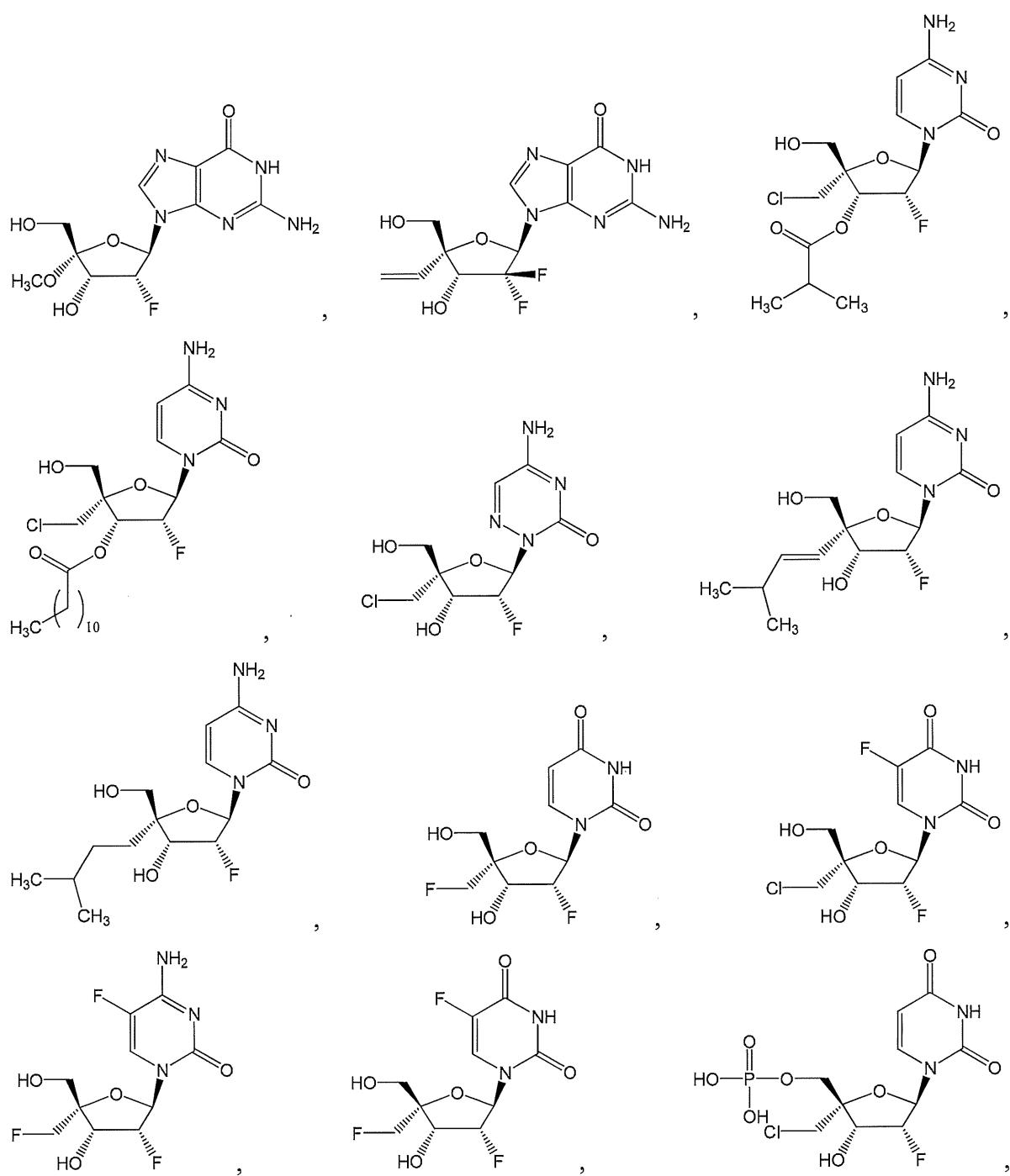
式(I)の化合物が、

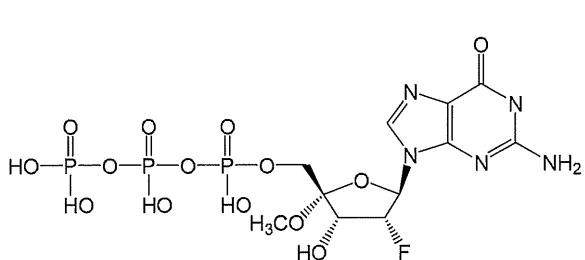
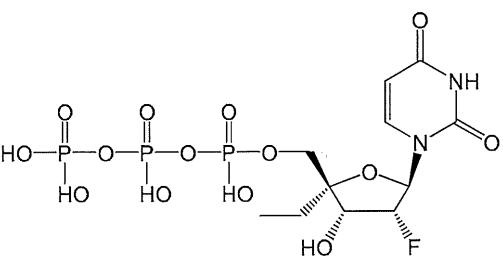
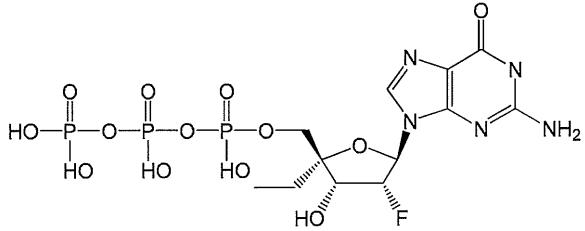
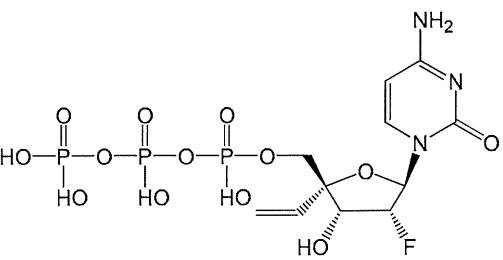
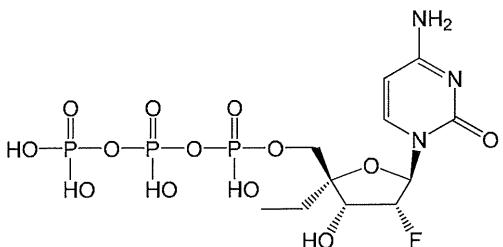
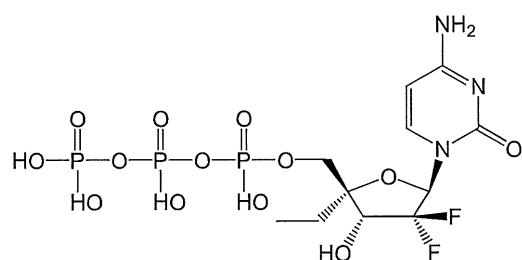
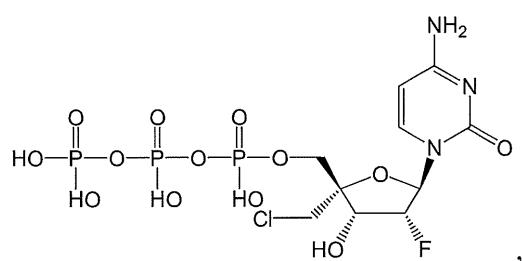
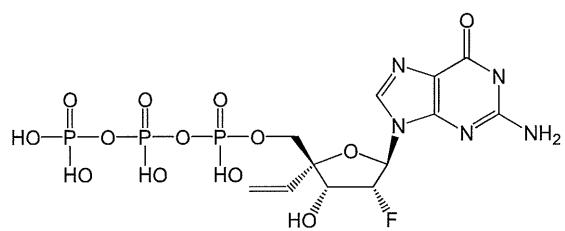
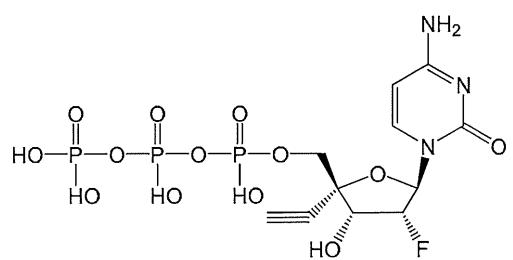
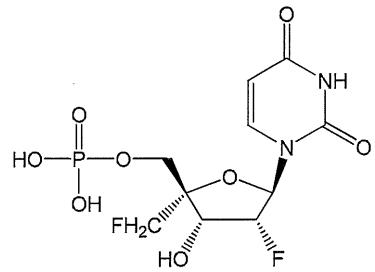
【化 3 4】

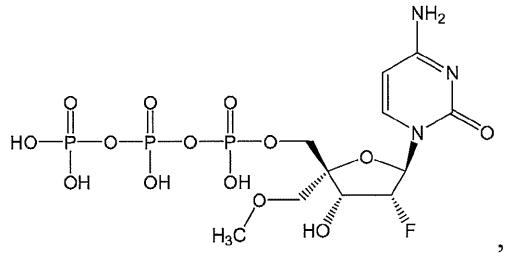
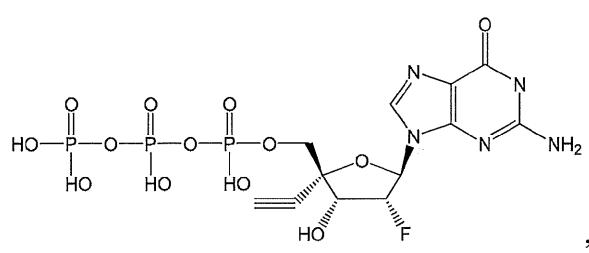
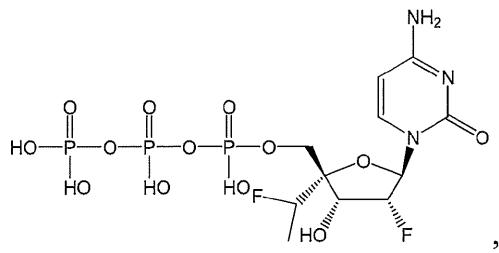
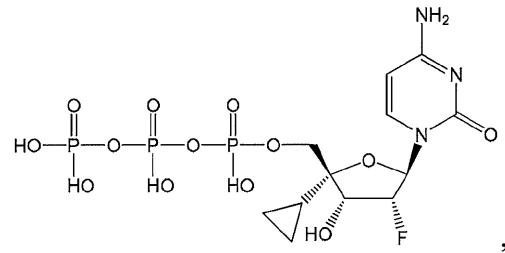
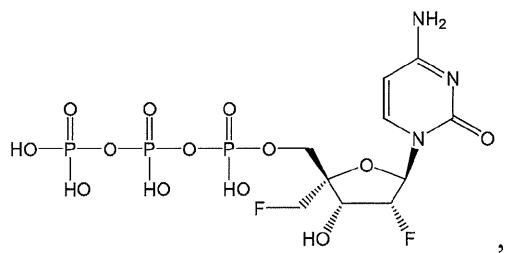
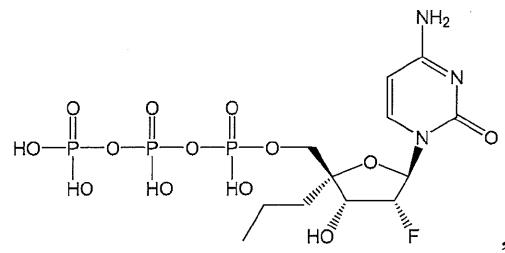
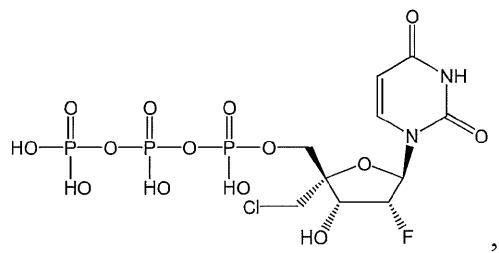
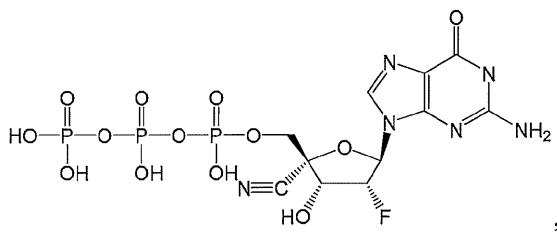
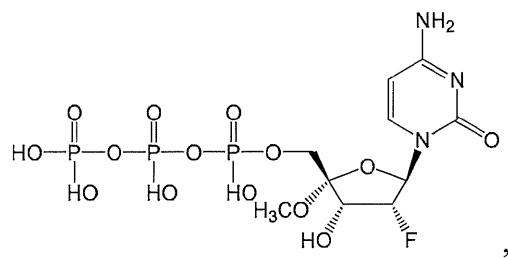


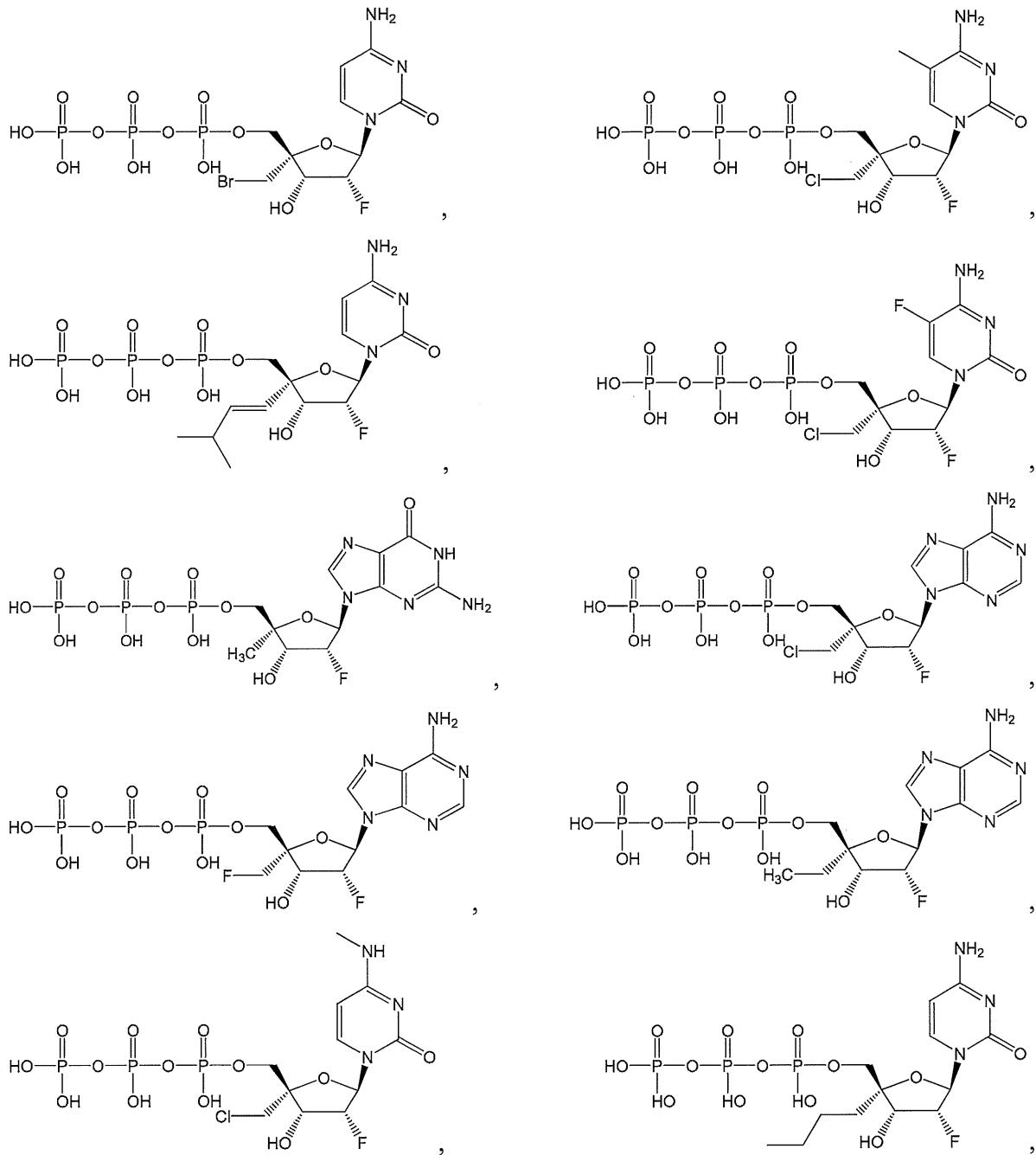


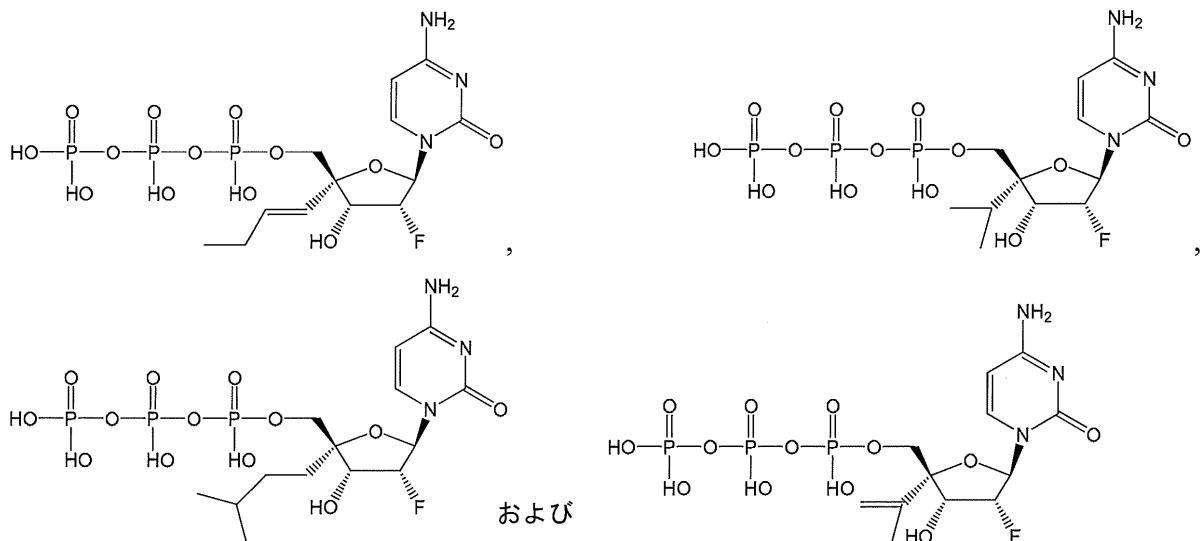








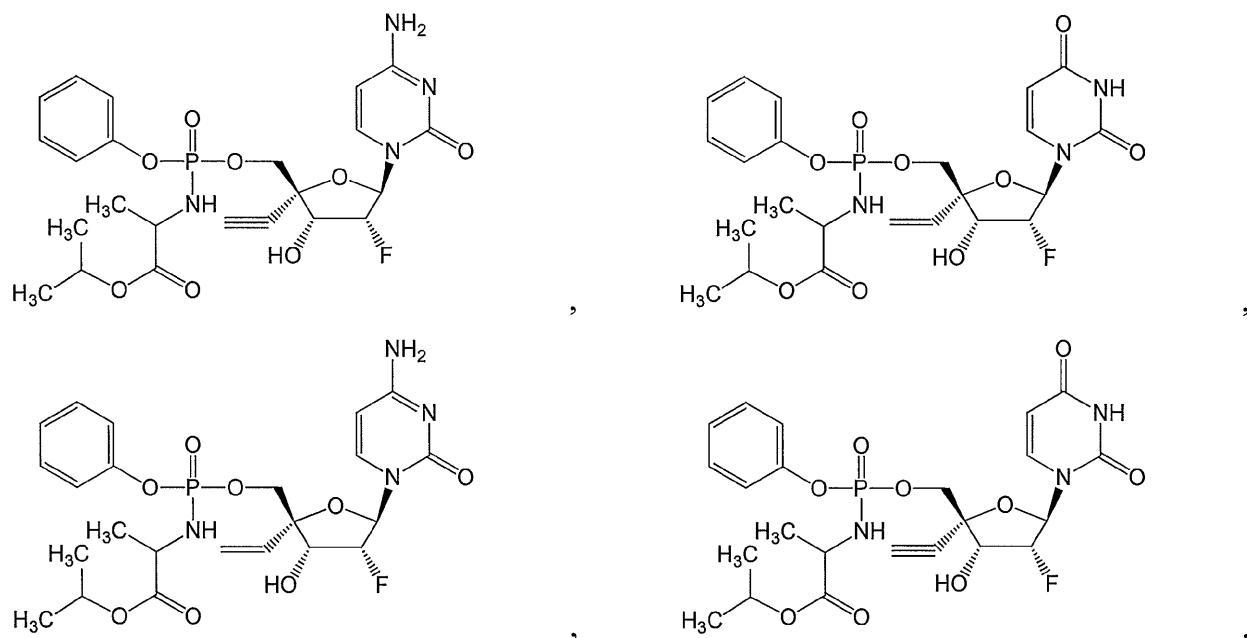


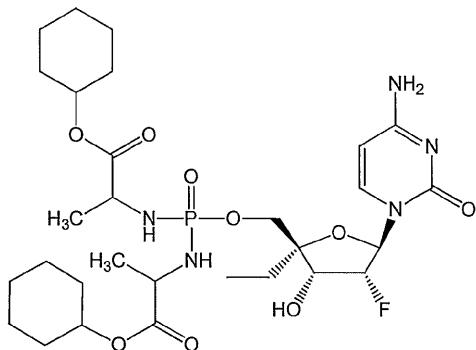
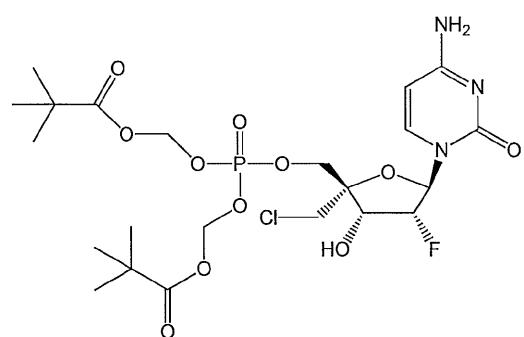
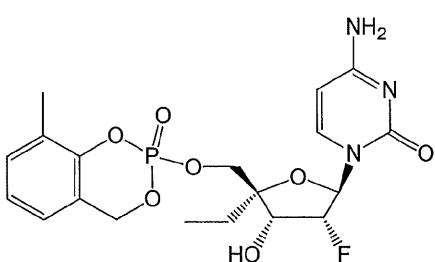
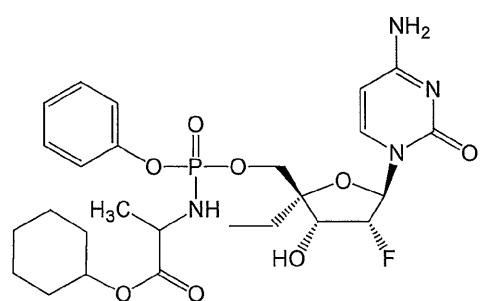
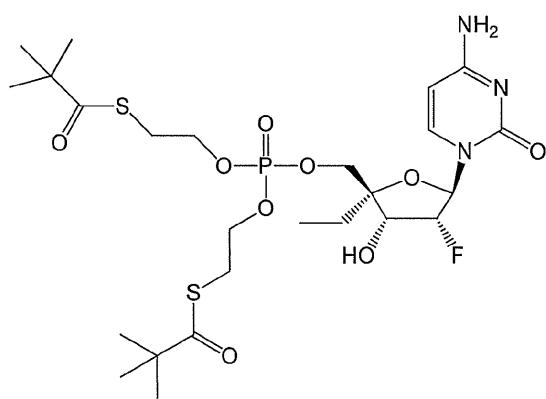
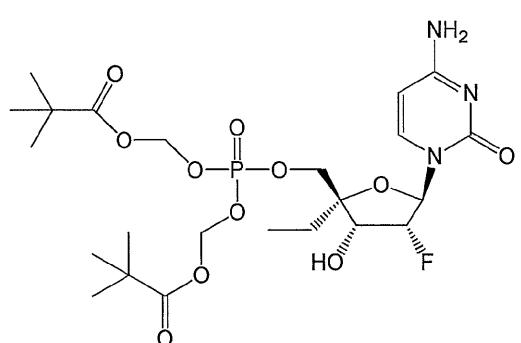
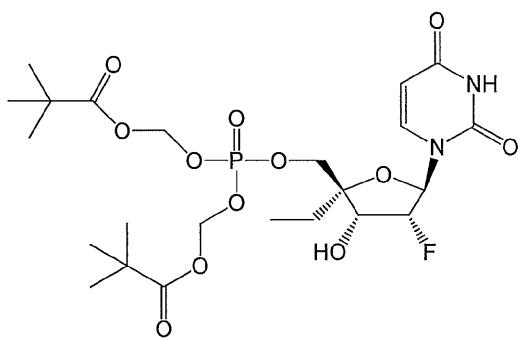
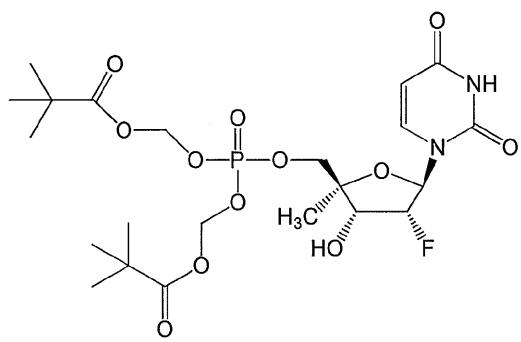


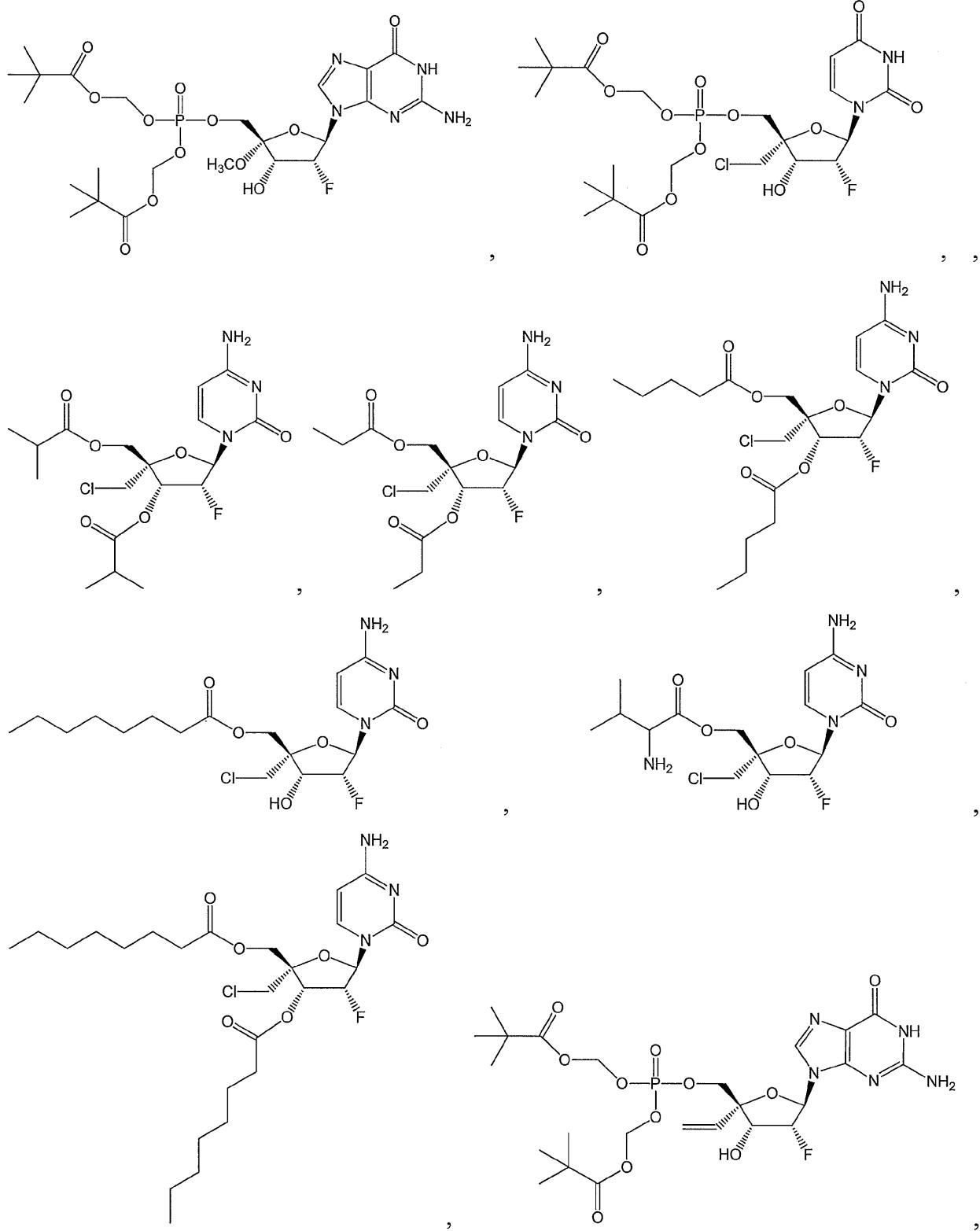
からなる群から選択される、または上記のものの医薬的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

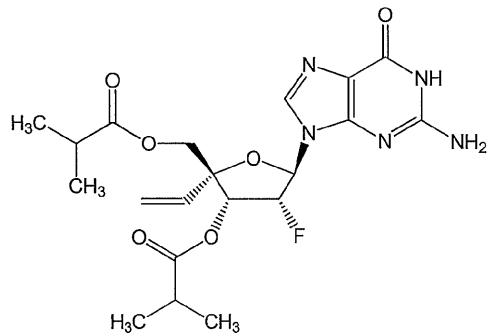
【請求項 5 7】

式 (I) の化合物が、
【化 3 5】

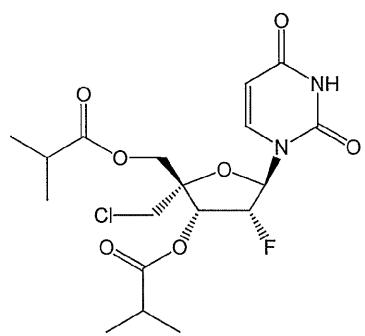




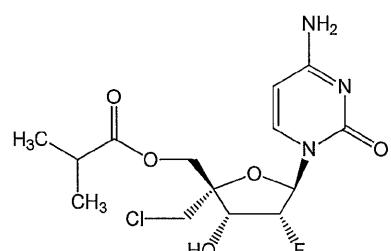
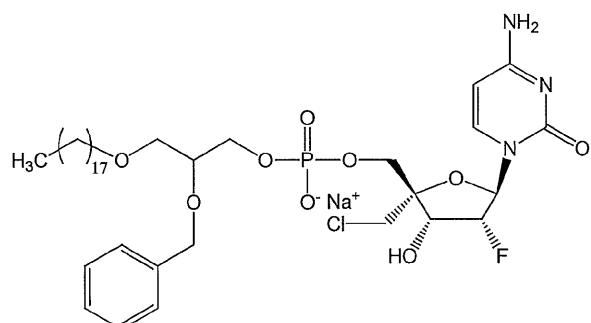




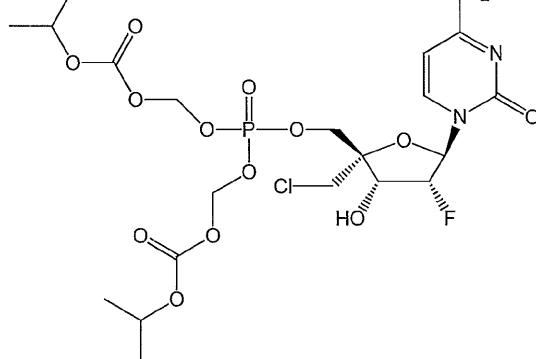
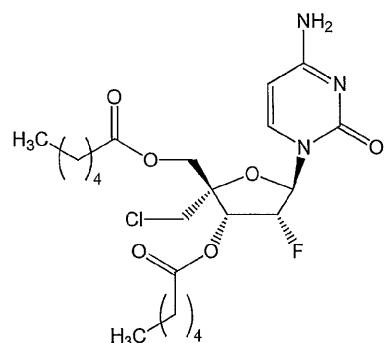
,



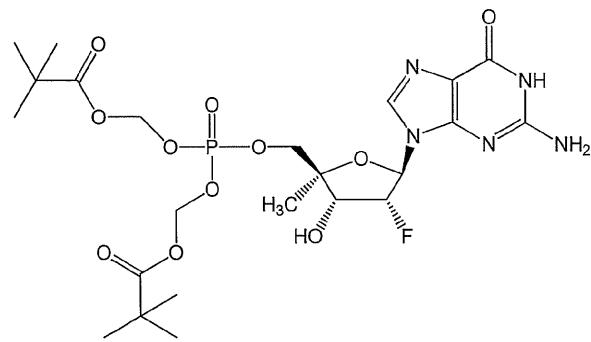
,



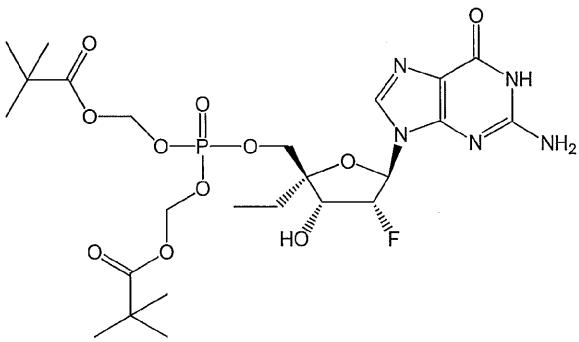
,



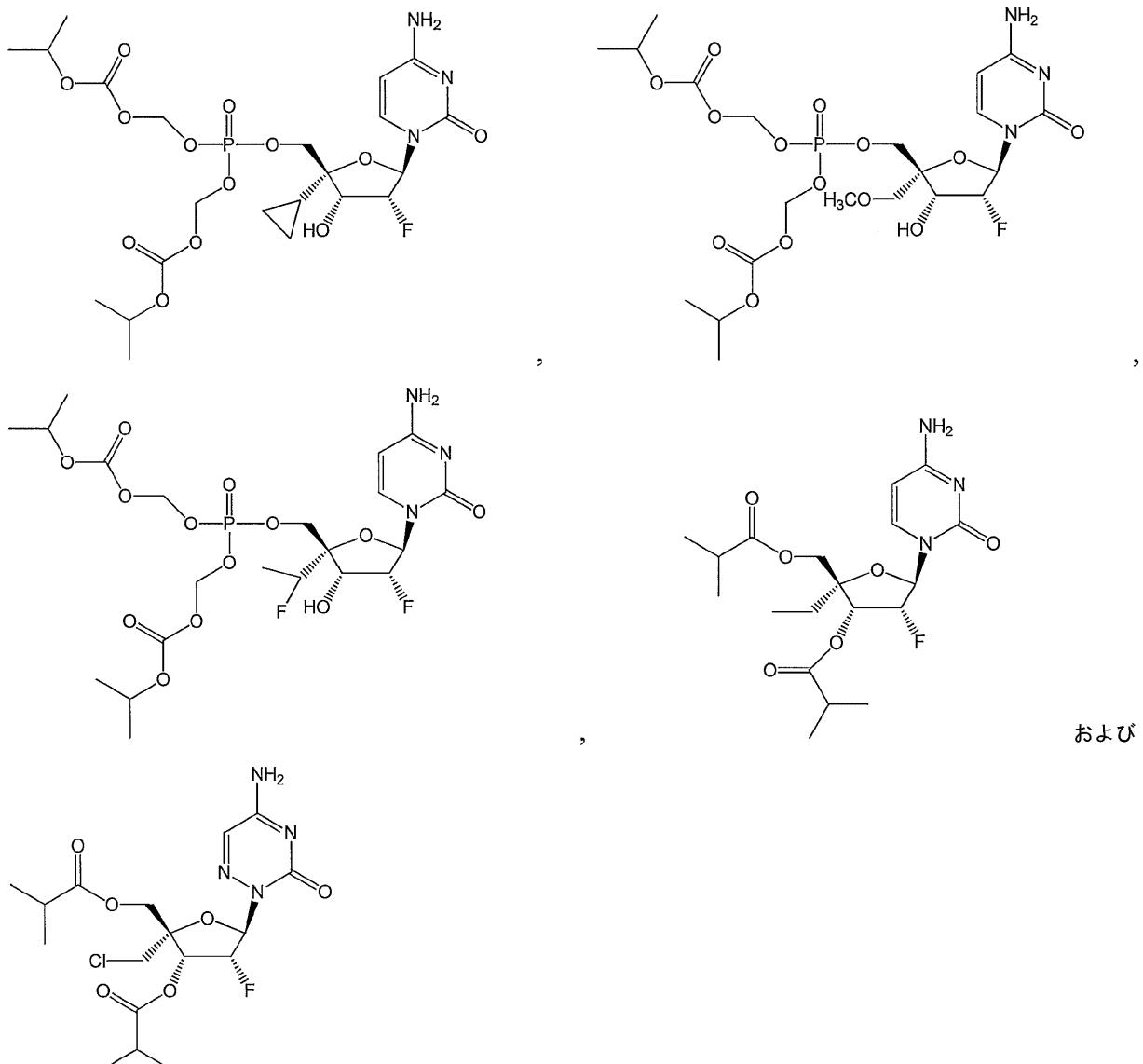
4



,



,

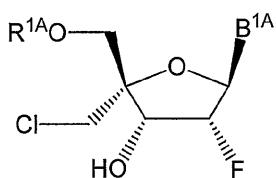


からなる群から選択される、または上記のものの医薬的に許容される塩である、請求項 1
1に記載の化合物。

【請求項 5 8】

式(I)の化合物が、

【化 3 6】

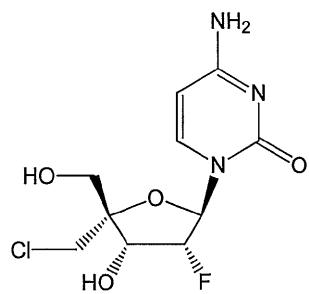


、またはその医薬的に許容される塩である、請求項 1 1に記載の化合物。

【請求項 5 9】

式(I)の化合物が、

【化37】

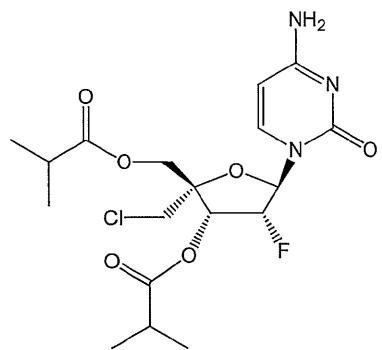


、またはその医薬的に許容される塩である、請求項58に記載の化合物。

【請求項60】

式(I)の化合物が、

【化38】

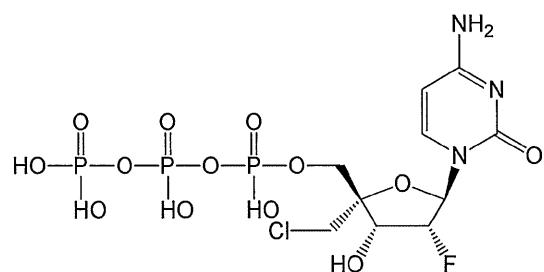


、またはその医薬的に許容される塩である、請求項58に記載の化合物。

【請求項61】

式(I)の化合物が、

【化39】

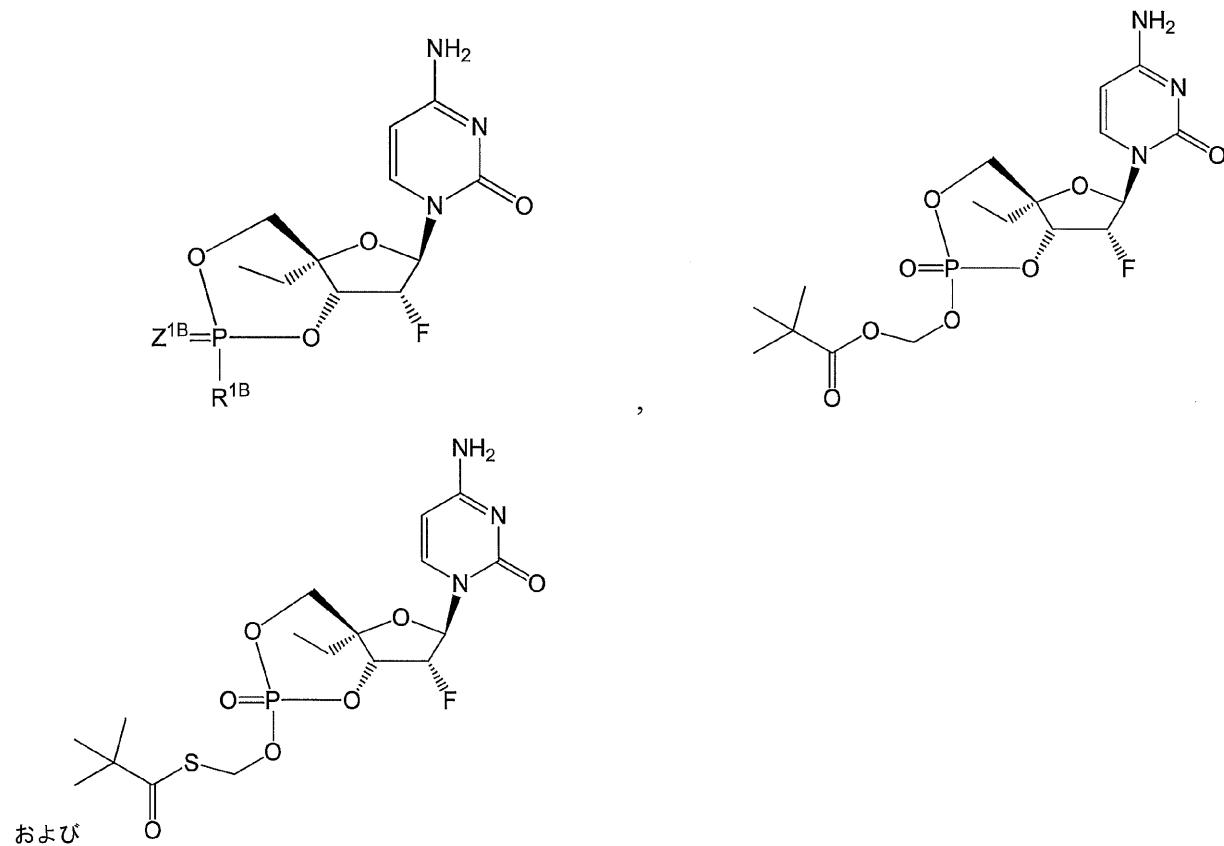


、またはその医薬的に許容される塩である、請求項58に記載の化合物。

【請求項62】

式(II)の化合物が、

【化 4 0】

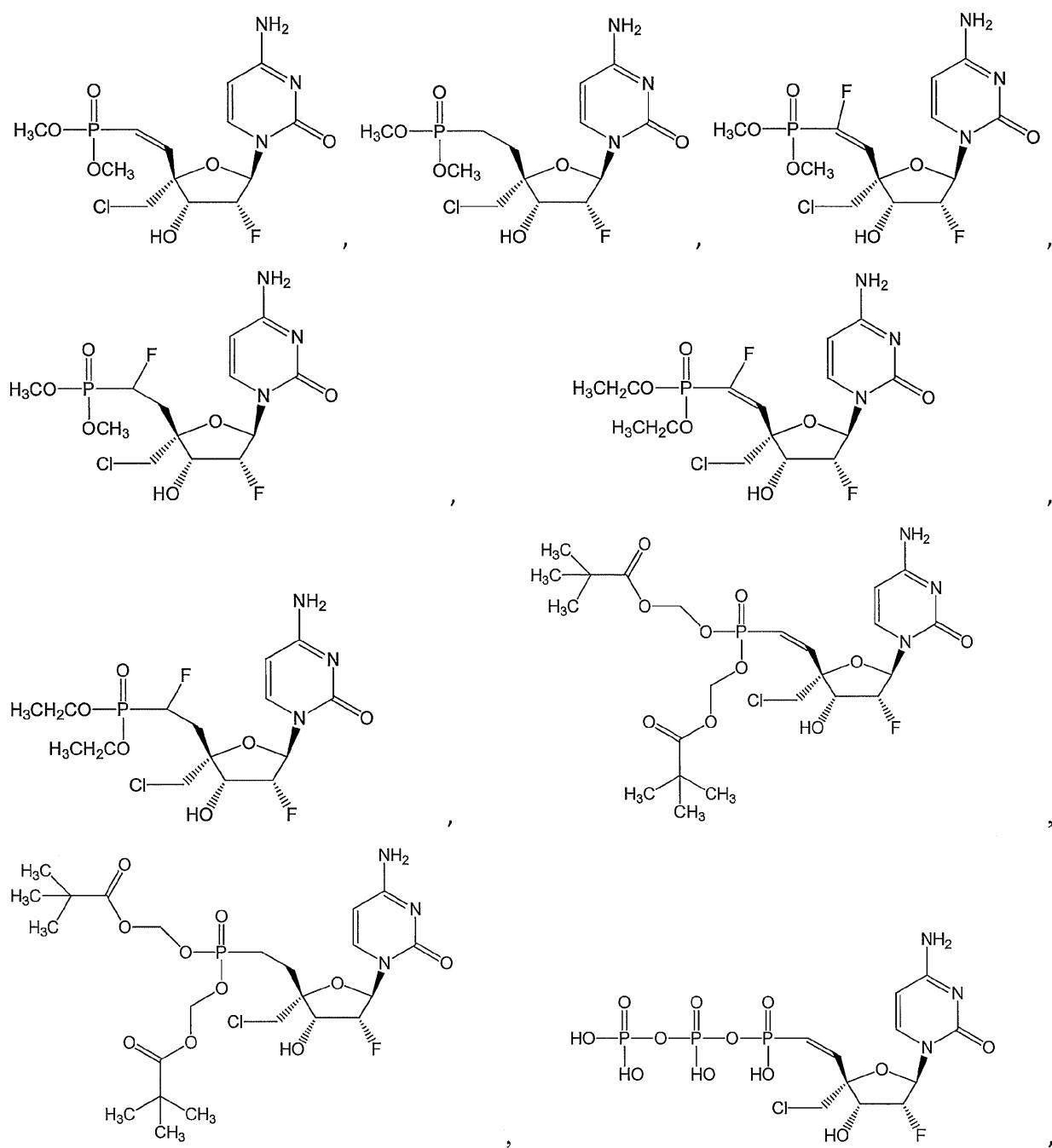


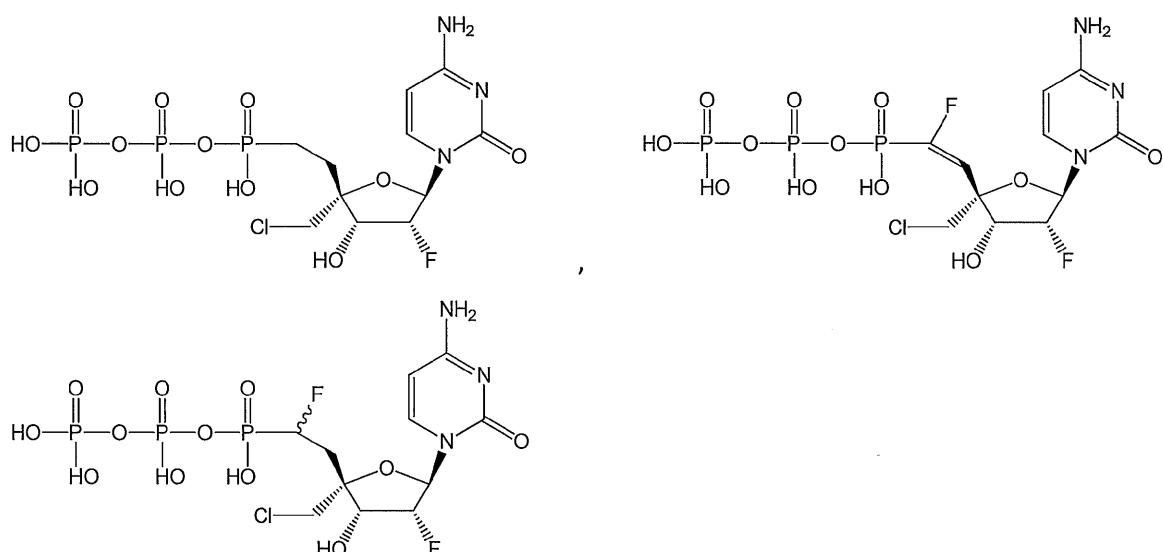
、またはその医薬的に許容される塩である、請求項 5 3 に記載の化合物。

【請求項 6 3】

式（I I I）の化合物が、

【化41】





からなる群から選択される、または上記のものの医薬的に許容される塩である、請求項 5
4 に記載の化合物。