

【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 0 7 H 19/06 (2006.01)

C 0 7 H 19/16 (2006.01)

C 0 7 H 19/10 (2006.01)

C 0 7 H 19/20 (2006.01)

C 0 7 H 19/11 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/16 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/7072 (2006.01)

A 6 1 K 31/708 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 H 19/06 C S P

C 0 7 H 19/16

C 0 7 H 19/10

C 0 7 H 19/20

C 0 7 H 19/11

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 31/16

A 6 1 P 31/14

A 6 1 K 31/7072

A 6 1 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

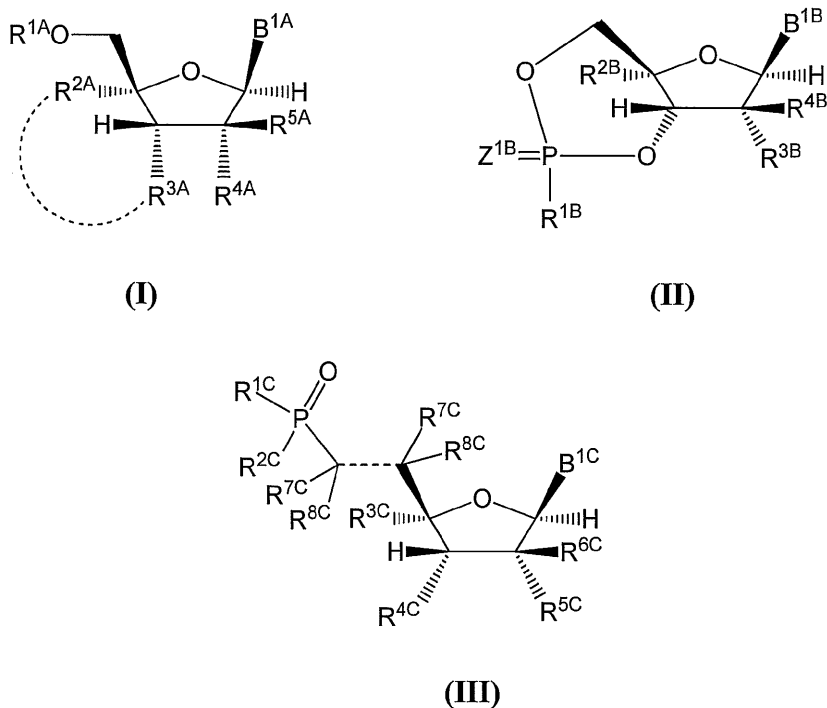
【補正の内容】

【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、ルブラウイルスおよびメタニユ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】

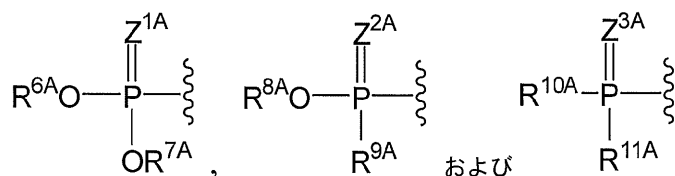


式中、

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】



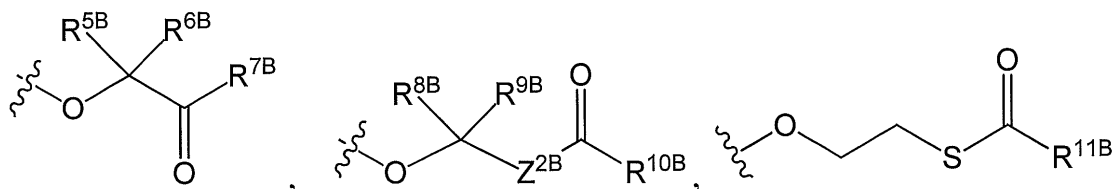
からなる群から選択される；

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 、 $-OC(=O)R^{11A}$ 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 、

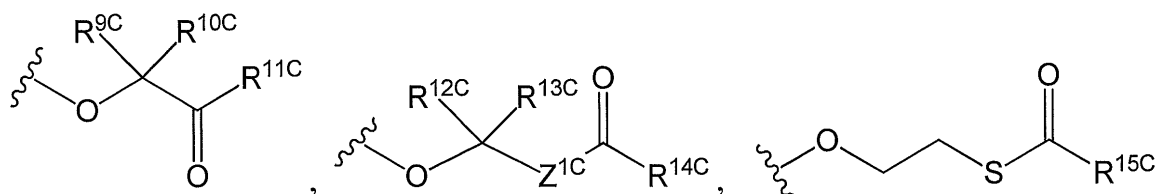
【化 3】



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 $C_1 \sim 6$ アルコキシ

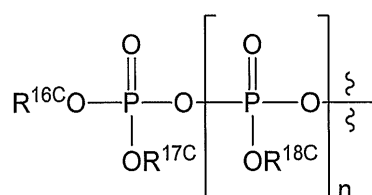
【化 4】



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 $C_1 \sim 6$ アルキル、置換されていてもよい $C_2 \sim 6$ アルケニル、置換されていてもよい $C_2 \sim 6$ 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、置換されていてもよい $-O-C_1 \sim 6$ アルキル、置換されていてもよい $-O-C_3 \sim 6$ アルケニル、置換されていてもよい $-O-C_3 \sim 6$ アルキニルおよびシアノからなる群から選択される；

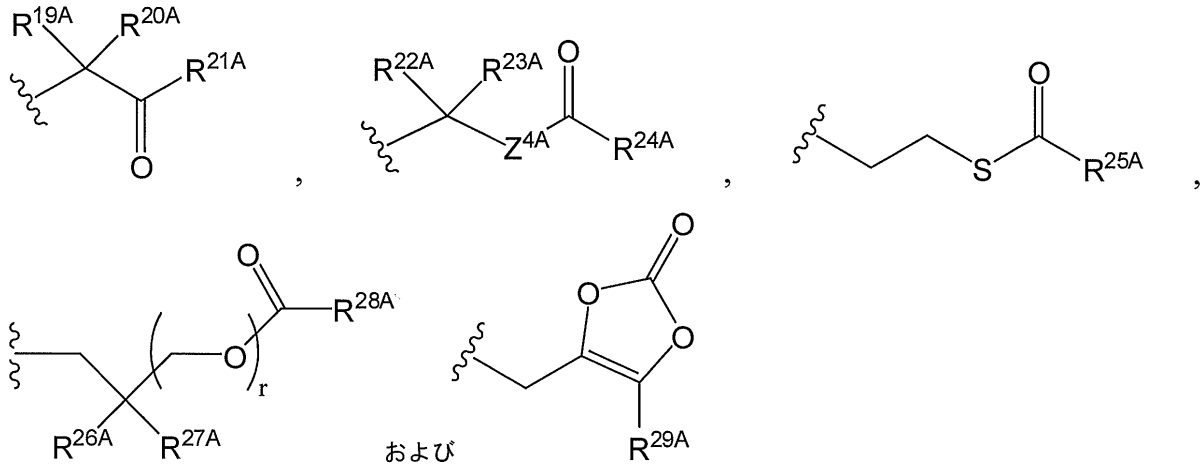
R^{4C} は、 OH 、 $-OC(=O)R^{11C}$ および置換されていてもよい O - 結合アミノ酸からなる群から選択される；

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；

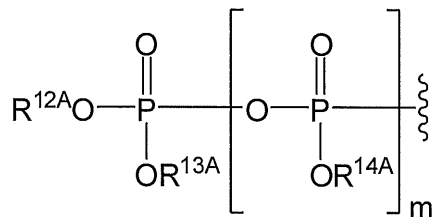
R^{6A} 、 R^{7A} および R^{8A} は独立して、非存在、水素、置換されていてもよい $C_1 \sim 24$ アルキル、置換されていてもよい $C_2 \sim 24$ アルケニル、置換されていてもよい $C_2 \sim 24$ アルキニル、置換されていてもよい $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、置換されていてもよい $C_3 \sim 6$ シクロアルケニル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアリール ($C_1 \sim 6$ アルキル)、置換されていてもよい $^*-(CR^{15A}R^{16A})_p-O-C_1 \sim 24$ アルキル、置換されていてもよい $^*-(CR^{17A}R^{18A})_q-O-C_1 \sim 24$ アルケニル、

【化 6】



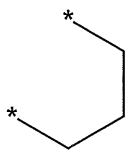
からなる群から選択される；あるいは
 R^{6A} は、

【化 7】



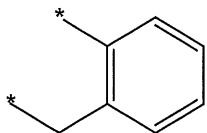
であり、 R^{7A} は、非存在または水素である；あるいは
 R^{6A} および R^{7A} は一緒になって、置換されていてもよい

【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、 R^{6A} および R^{7A} 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；

R^{9A} は独立して、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、 NR^{30A} 、 R^{31A} 、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^{10A} および R^{11A} 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；

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；

各 R^{15A} 、各 R^{16A} 、各 R^{17A} および各 R^{18A} は独立して、水素、置換されていてもよい C_{1-24} アルキルまたはアルコキシである；

R^{19A} 、 R^{20A} 、 R^{22A} 、 R^{23A} 、 R^{5B} 、 R^{6B} 、 R^{8B} 、 R^{9B} 、 R^{9C} 、 R^{10C} 、 R^{12C} および R^{13C} は独立して、水素、置換されていてもよい C_{1-24} 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^{21A} 、 R^{24A} 、 R^{7B} 、 R^{10B} 、 R^{11C} および R^{14C} は独立して、水素、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アリール、置換されていてもよい $-O-C_{1-24}$ 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^{25A} 、 R^{29A} 、 R^{11B} および R^{15C} は独立して、水素、置換されていてもよい C_{1-24} 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^{16C} 、 R^{17C} および R^{18C} は独立して、非存在または水素である；

R^{26A} および R^{27A} は独立して、 $-C=N$ 、または C_{2-8} オルガニルカルボニル、 C_{2-8} アルコキシカルボニルおよび C_{2-8} 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^{28A} は、水素、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^{30A} および R^{31A} は独立して、水素、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；

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

$- - - - -$ 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；

$- - - - -$ 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^{1A} および R^{1C} は独立して、置換されていてもよい C_{1-24} - 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；

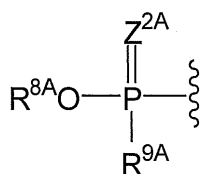
p および q は独立して、1、2 および 3 からなる群から選択される；

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 ($- - - - -$) が、非存在であり； R^{1A} が、

【化 10】



(式中、 R^{8A} は、非置換の C_{1-4} 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、 $-OCH_3$ とすることができない；

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、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}
 R^{4A} が、OH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／またはルブラウイルスである、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／または前記ルブ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、ルブラウイルスである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

前記ルブラウイルスが、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。

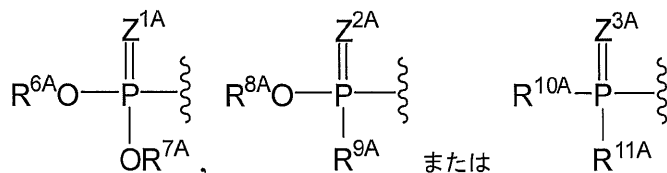
【請求項 11】

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】

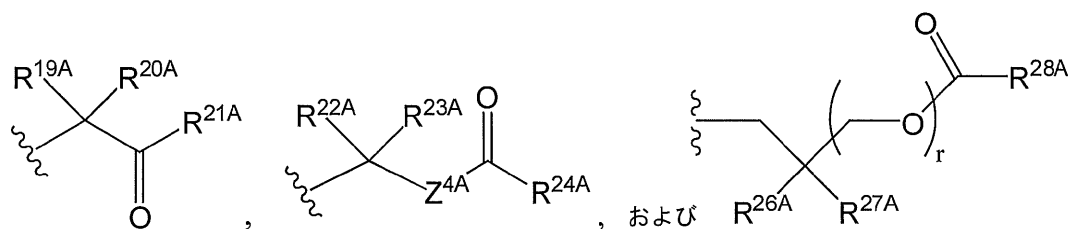
R^{6A} および R^{7A} がともに、水素または非存在である、請求項 12 に記載の化合物。

【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 $C_{1 \sim 24}$ 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、置換されていてもよい $C_{3 \sim 6}$ 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（ $C_{1 \sim 6}$ アルキル

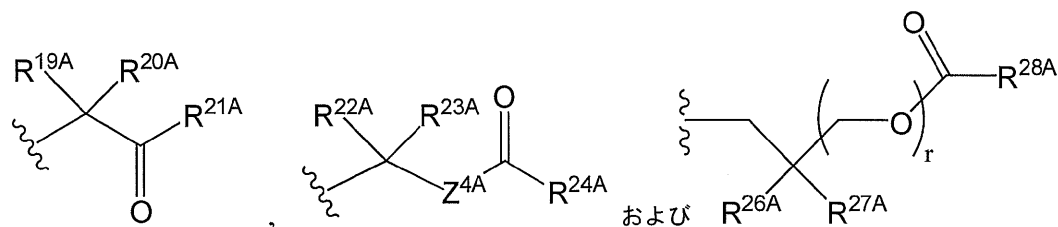
）からなる群から選択される； R^{6A} および R^{7A} の両方が独立して、置換されていてもよい C_{1-24} アルキル、置換されていてもよい C_{2-24} アルケニル、置換されていてもよい C_{2-24} アルキニル、置換されていてもよい C_{3-6} シクロアルキル、置換されていてもよい C_{3-6} シクロアルケニル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリールおよび置換されていてもよいアリール (C_{1-6} アルキル) からなる群から選択される； R^{6A} および R^{7A} の少なくとも一方が、

【化 1 2】



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_{1-24} 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、

【化 1 3】

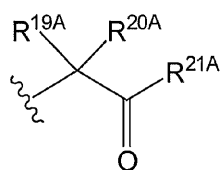


からなる群から選択される； R^{6A} および R^{7A} がともに、置換されていてもよい C_{1-24} アルキルである； R^{6A} および R^{7A} がともに、置換されていてもよい C_{2-24} アルケニルである； R^{6A} および R^{7A} がともに、 $* - (C R^{15A} R^{16A})_p - O - C_{1-24}$ アルキルである； R^{6A} および R^{7A} がともに、 $* - (C R^{17A} R^{18A})_q - O - C_{2-24}$ アルケニルである； R^{6A} および R^{7A} がともに、置換されて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_{1-6} アルキル) である、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

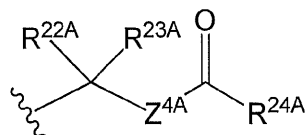
R^{6A} および R^{7A} がともに、

【化 1 4】



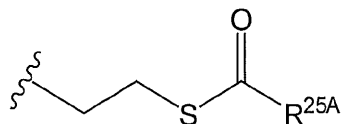
である； R^{6A} および R^{7A} がともに、

【化 1 5】



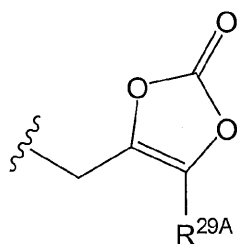
である； R^{6A} および R^{7A} がともに、

【化 1 6】



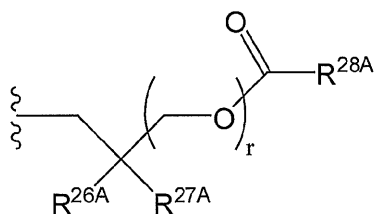
である； R^{6A} および R^{7A} がともに、

【化 1 7】



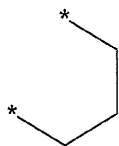
である； R^{6A} および R^{7A} がともに、

【化 1 8】



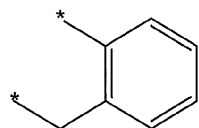
である；または、 R^{6A} および R^{7A} が一緒になって、置換されていてもよい

【化 1 9】



および置換されていてもよい

【化 2 0】

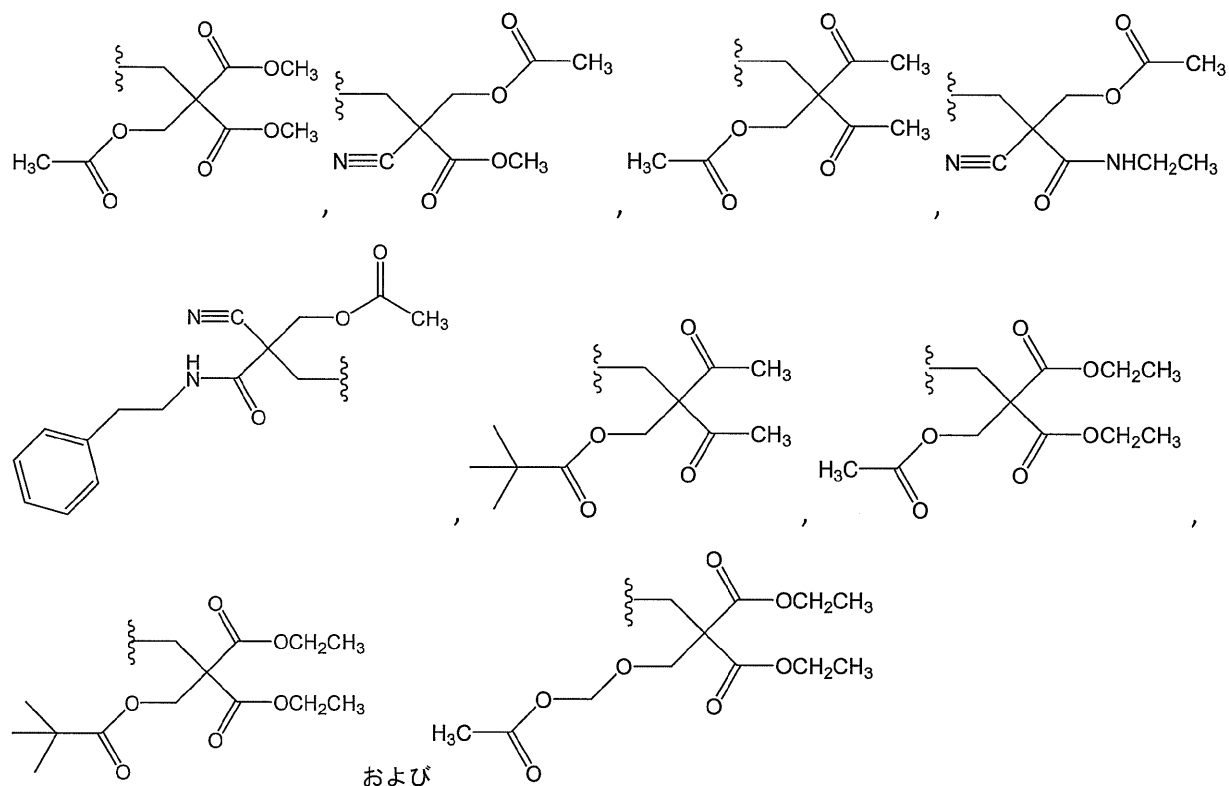


からなる群から選択される成分を形成することができ、ただし、この場合、 R^{6A} および R^{7A} につながっている酸素と、リンと、該成分とは、6員～10員環系を形成する、請求項12に記載の化合物。

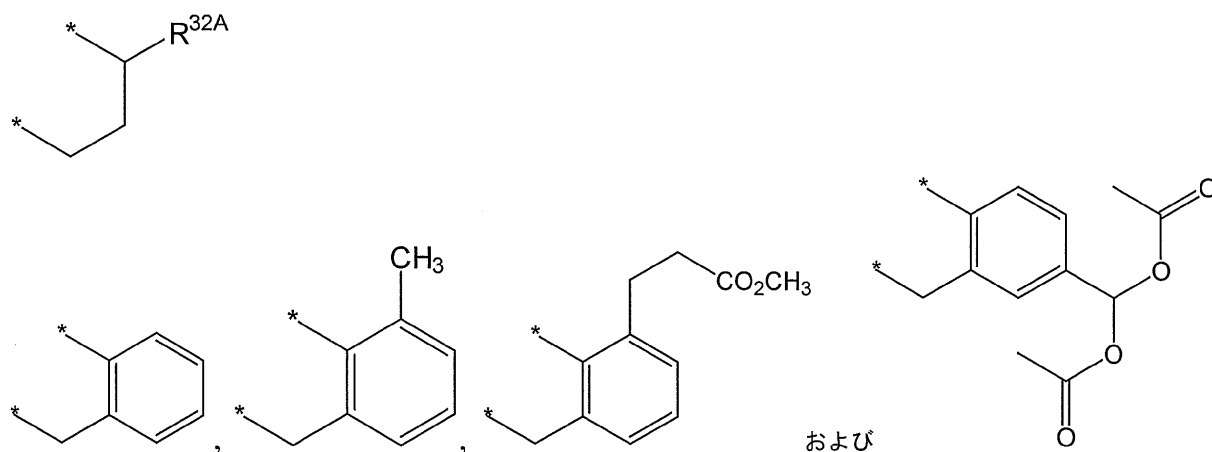
【請求項 1 6】

*CC(R26A)(R27A)C(=O)R28A

【化 2 2】



【化 2 3】



【請求項 17】

Z^{1A}が、0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。

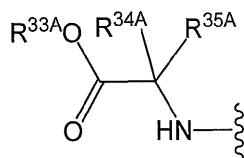
【請求項 19】

R^{8A} が、非存在、水素、置換されていてもよい $C_{1 \sim 24}$ 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； R^{9A} が独立して、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^{8A} が、水素であり、 R^{9A} が、 N R^{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 $C_{1 \sim 24}$ 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^{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ルエステル、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 $C_{1 \sim 6}$ -アルキル、置換されていてもよい $C_{3 \sim 6}$ 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 ($C_{1 \sim 6}$ 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 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{1 \sim 6}$ ハロアルキル、置換されていてもよい $C_{3 \sim 6}$ 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 ($C_{1 \sim 6}$ 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 $C_{1 \sim 4}$ -アルキルである；あるいは R^{34A} および R^{35A} は一緒になって、置換されていてもよい $C_{3 \sim 6}$ 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 $C_{1 \sim 6}$ -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 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{3 \sim 6}$ 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。

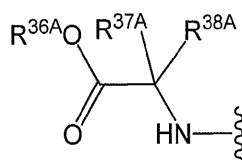
【請求項 23】

Z^{2A} が、S 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 24】

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ルエステル、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 25】



(式中、R^{36A} は、水素、置換されていてもよい C₁ ~ 6 - アルキル、置換されていてもよい C₃ ~ 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 (C₁ ~ 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 C₁ ~ 6 アルキル、置換されていてもよい C₁ ~ 6 ハロアルキル、置換されていてもよい C₃ ~ 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 C₁₀ アリールおよび置換されていてもよいアリール (C₁ ~ 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 C₁ ~ 4 - アルキルである；あるいは R^{37A} および R^{38A} は一緒になって、置換されていてもよい C₃ ~ 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 25】

R^{37A} が、置換されていてもよい C₁ ~ 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 C₁ ~ 6 アルキル、置換されていてもよい C₃ ~ 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 24 に記載の化合物。

【請求項 26】

Z^{3A} が、O である、請求項 12 または 24 ~ 25 のいずれか一項に記載の化合物。

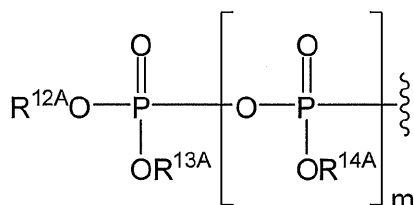
【請求項 27】

Z^{3A} が、S である、請求項 12 または 24 ~ 25 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 28】

R^{6A} が、

【化 26】



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 12 に記載の化合物。

【請求項 29】

mが、0であり、 R^{12A} および R^{13A} 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^{12A} 、 R^{13A} および R^{14A} 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^{1A} が、Hである、請求項11に記載の化合物。

【請求項31】

R^{1A} 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、 $-C(=O)R^{39A}$ であり、 R^{39A} が、置換されていてもよい C_{1-12} アルキル、置換されていてもよい C_{2-12} アルケニル、置換されていてもよい C_{2-12} 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_{6-10} 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。

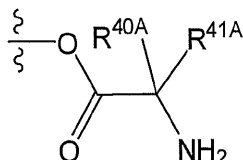
【請求項33】

R^{39A} が、置換または非置換 C_{1-12} アルキルである、請求項32に記載の化合物。

【請求項34】

R^{1A} 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^{1A} が、

【化27】



(式中、 R^{40A} 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^{41A} 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^{40A} および R^{41A} 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。

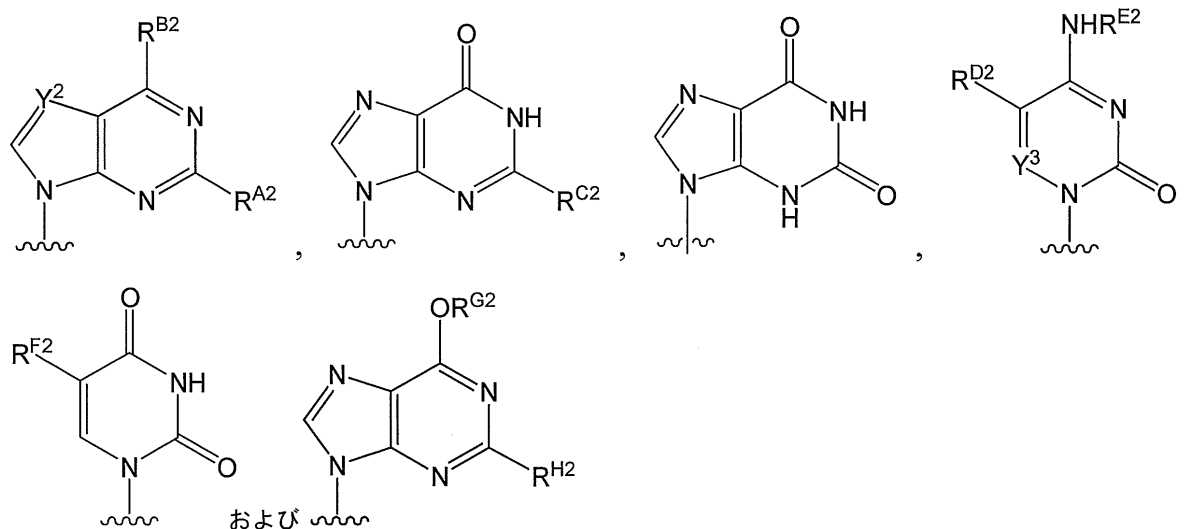
【請求項35】

R^{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^{41A} が、水素である、請求項34に記載の化合物。

【請求項36】

B^{1A} が、

【化 2 8】



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 $C_1 \sim 6$ アルキル、置換されていてもよい $C_2 \sim 6$ アルケニル、置換されていてもよい $C_3 \sim 8$ 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 $C_1 \sim 6$ アルキル、置換されていてもよい $C_2 \sim 6$ アルケニルおよび置換されていてもよい $C_2 \sim 6$ 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 $C_1 \sim 6$ アルキル、置換されていてもよい $C_3 \sim 8$ 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 $C_1 \sim 6$ アルキル、置換されていてもよい $C_2 \sim 6$ アルケニルおよび置換されていてもよい $C_2 \sim 6$ 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 $C_1 \sim 6$ -アルキル、置換されていてもよい $C_2 \sim 6$ -アルケニルおよび置換されていてもよい $C_2 \sim 6$ -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 $C_1 \sim 6$ アルキルである；

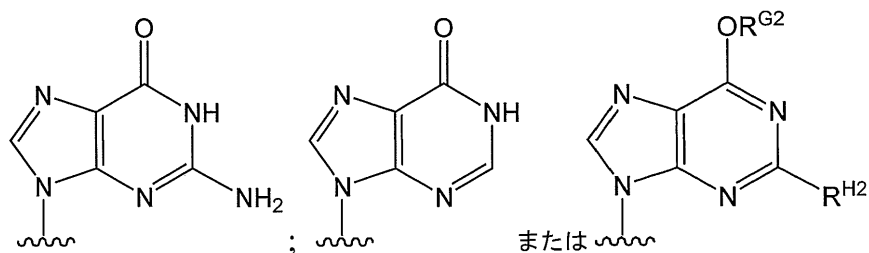
R^{H2} は、水素または NHR^{T2} であり、ただし、この場合、 R^{T2} は独立して、水素、 $-C(=O)R^{U2}$ および $-C(=O)OR^{V2}$ からなる群から選択される；

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、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim 6$ シクロアルケニル、 $C_6 \sim 10$ アリール、ヘテロアリール、ヘテロアリシクリル、アリール ($C_1 \sim 6$ アルキル)、ヘテロアリール ($C_1 \sim 6$ アルキル) およびヘテロアリシクリル ($C_1 \sim 6$ アルキル) からなる群から選択される、請求項 11 ~ 35 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 37】

B^{1A}が、

【化29】

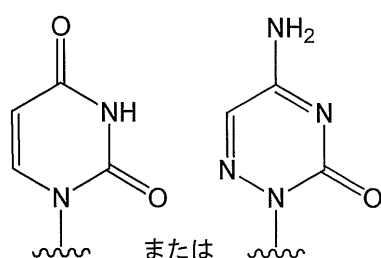


である、請求項36に記載の化合物。

【請求項38】

B^{1A}が、

【化30】

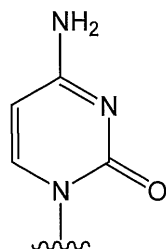


である、請求項36に記載の化合物。

【請求項39】

B^{1A}が、

【化31】



である、請求項36に記載の化合物。

【請求項40】

R^{2A}が、ハロゲン置換されたC₁~₆アルキルまたはスルフェニル置換されたC₁~₆アルキルである、および、R^{3A}が、OH、-OC(=O)R^{1A}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11~39のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項41】

R^{2A}が、非置換のC₁~₆アルキルである、請求項11~39のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項42】

R^{2A}が、スルフェニル置換されたC₁~₆アルキルである、請求項40に記載の化合物。

【請求項43】

R^{2A}が、ハロゲン置換されたC₁~₆アルキルである、請求項40に記載の化合物。

【請求項44】

R^{2A}が、置換されていてもよいC₂~₆アルケニル、置換されていてもよいC₃~₆シクロアルキル、置換されていてもよい-O-C₁~₆アルキル、置換されていてもよい-O-C₃~₆アルケニル、置換されていてもよい-O-C₃~₆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、 $-OC(=O)R'^{A}$ であり、 R'^{A} 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。

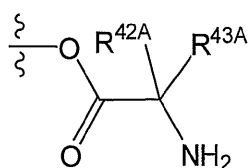
【請求項 47】

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 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^{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 (II) 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。

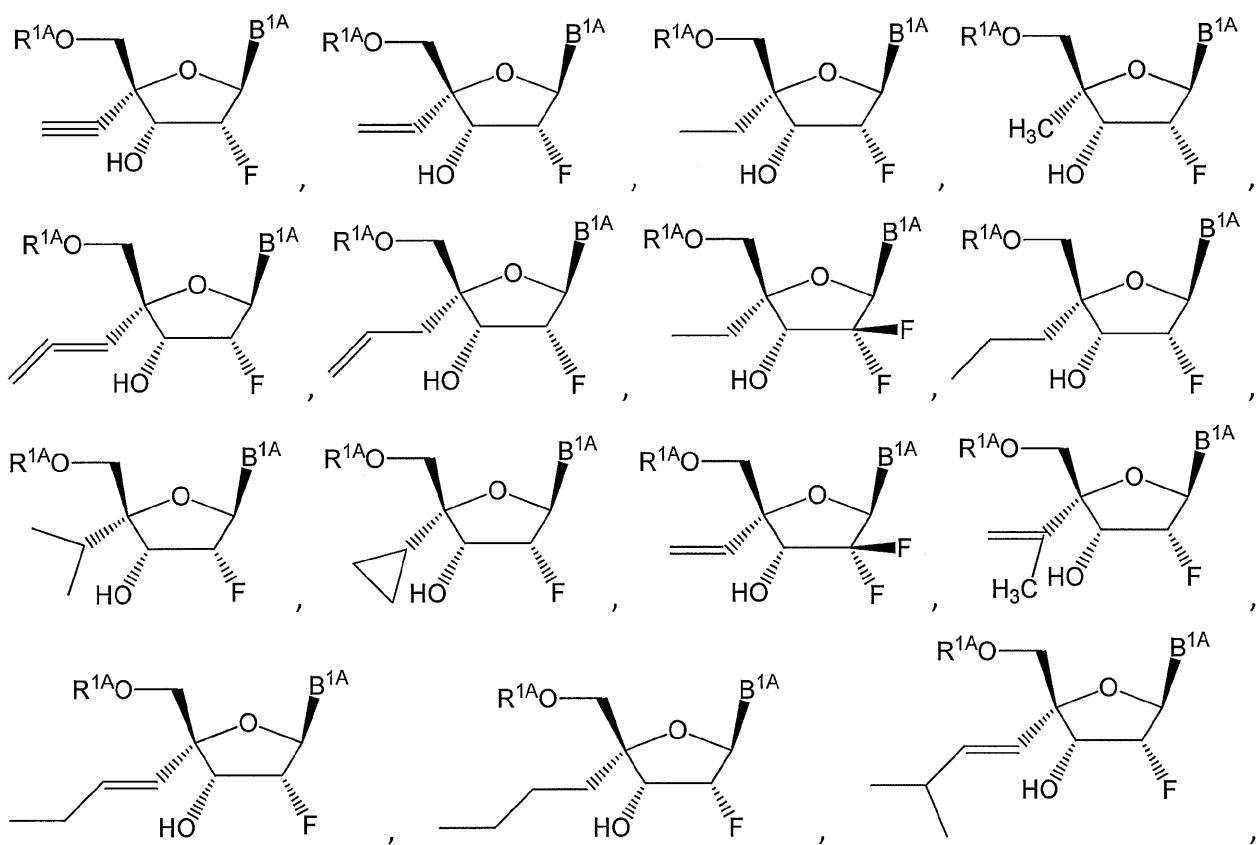
【請求項 54】

式 (III) 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】

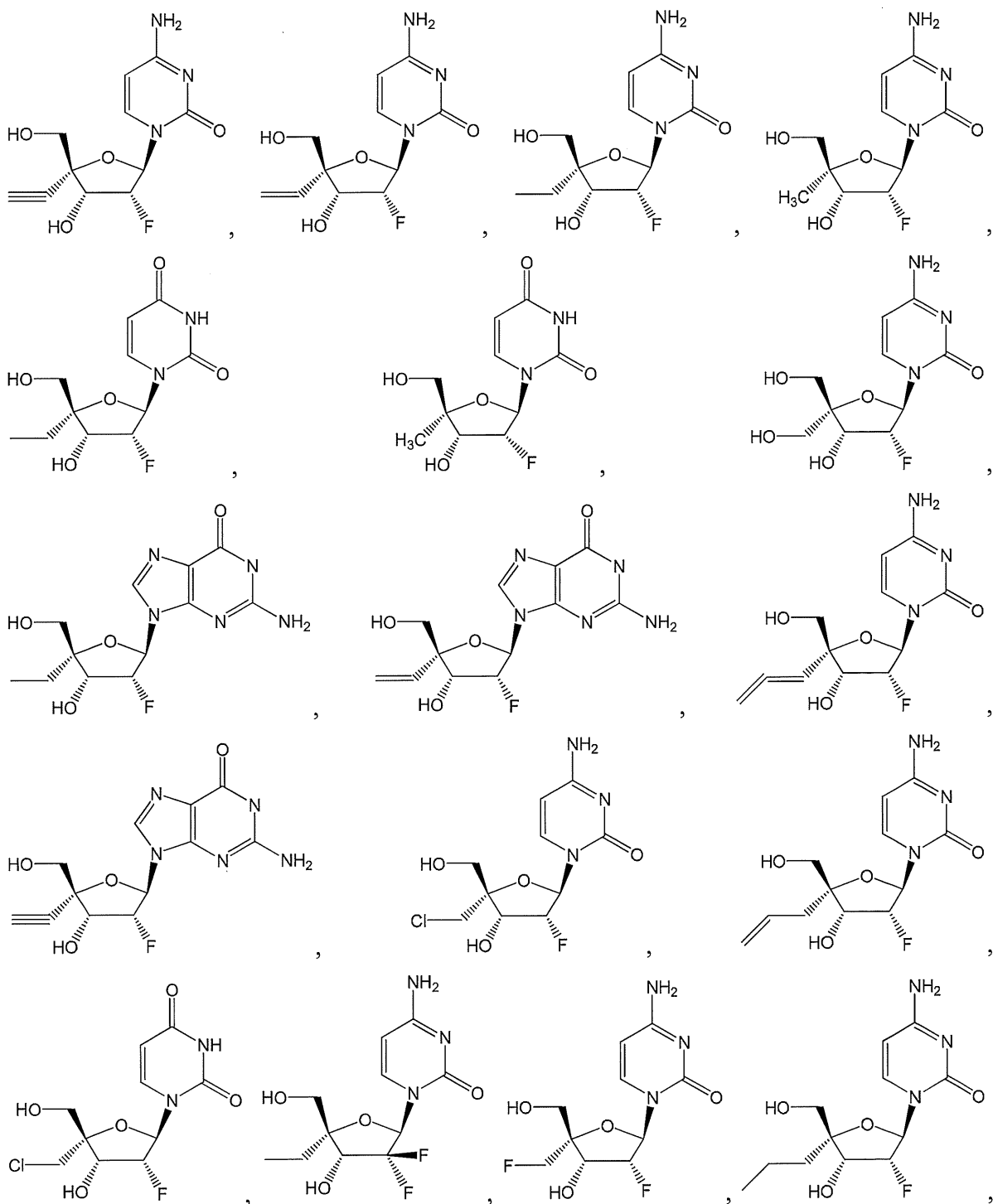


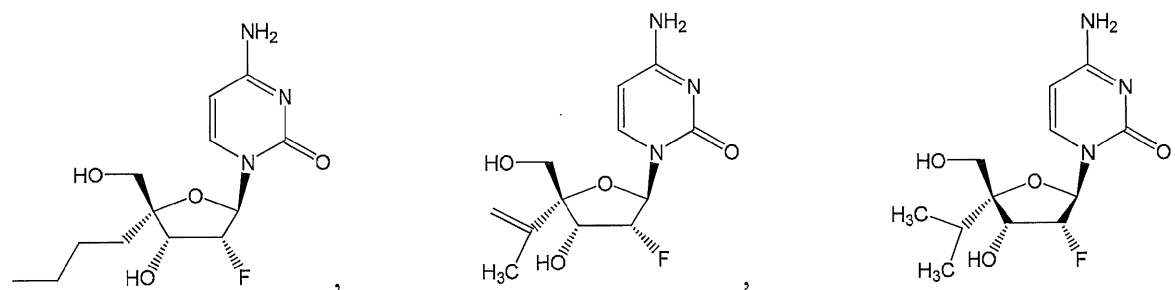
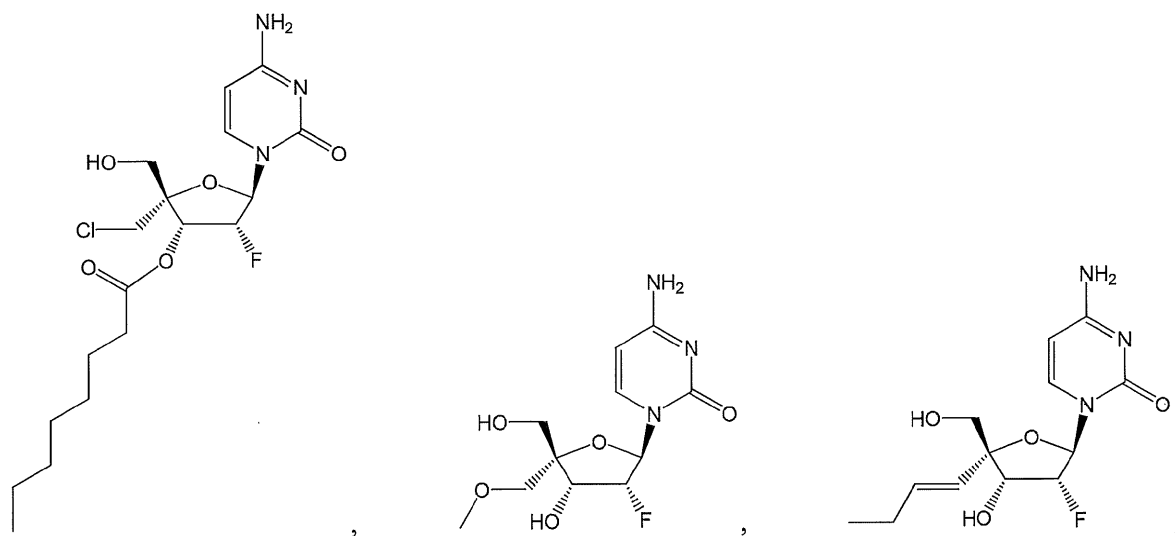
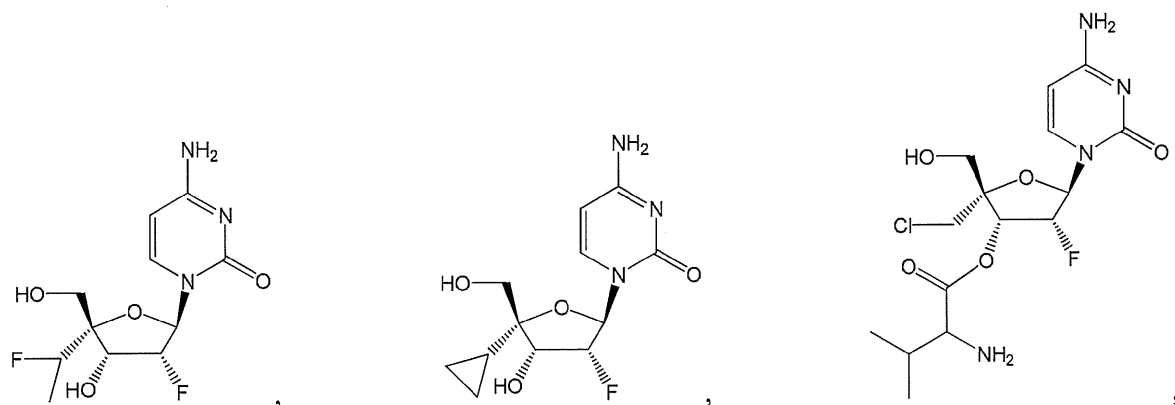
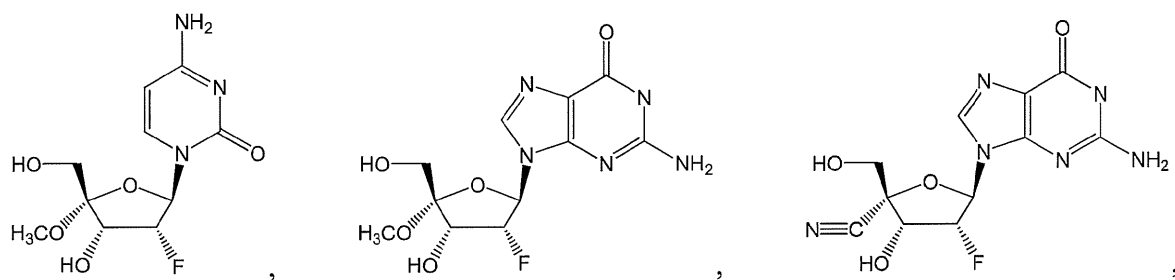


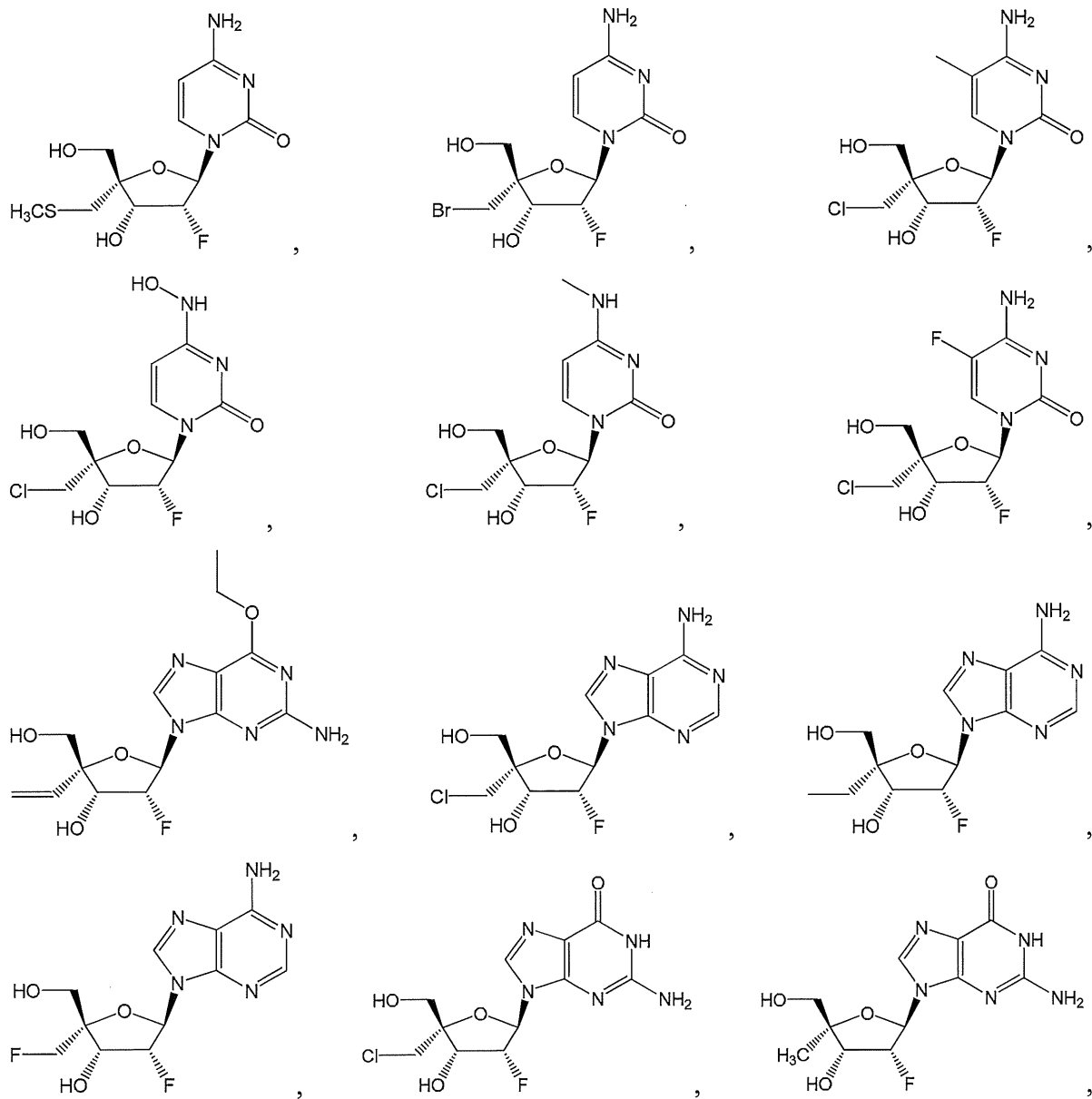
【請求項 56】

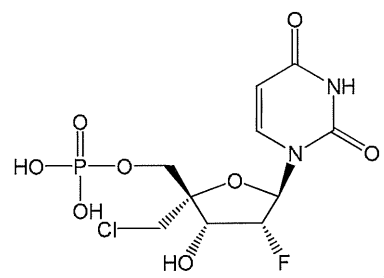
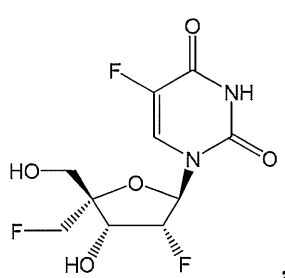
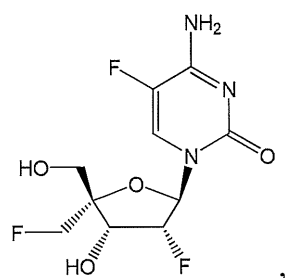
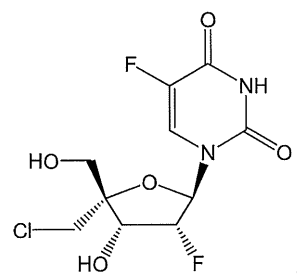
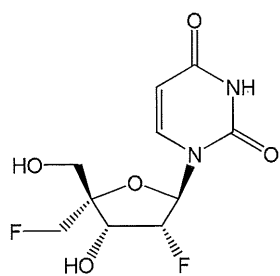
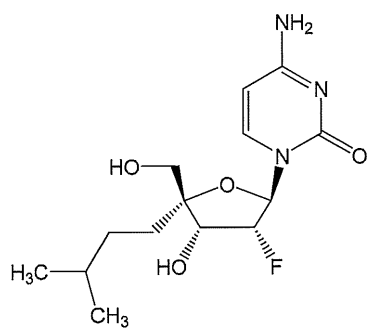
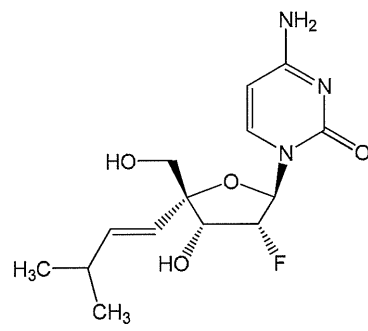
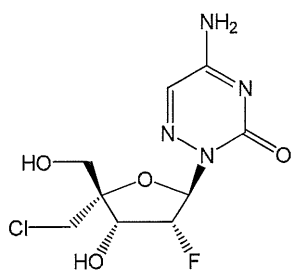
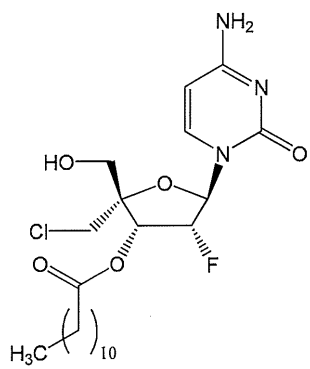
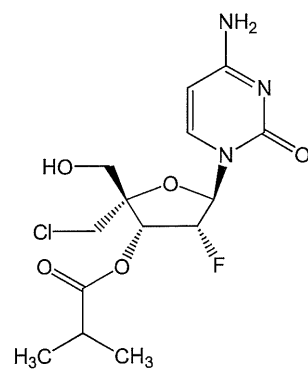
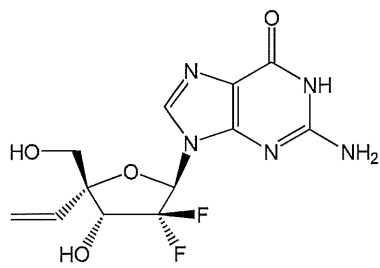
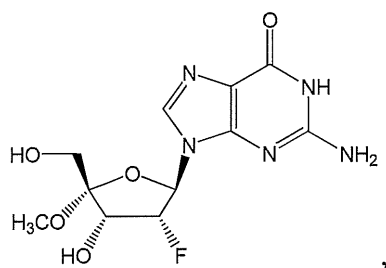
式 (I) の化合物が、

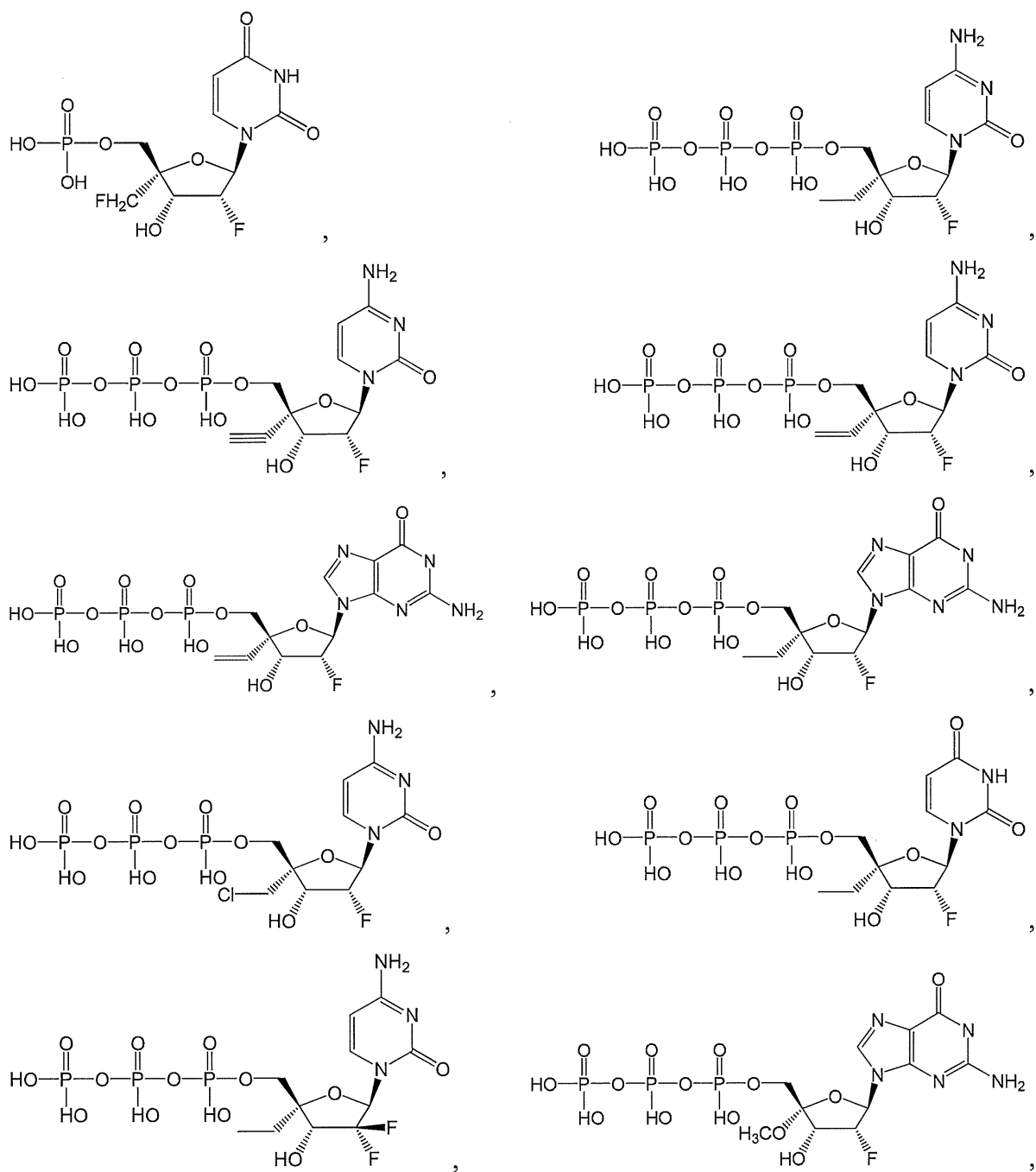
【化 3 4】

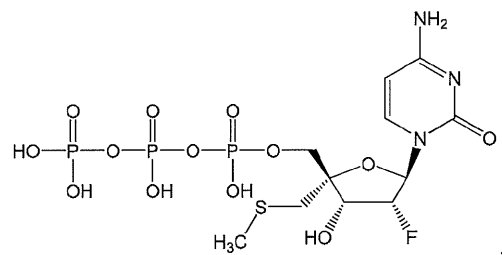
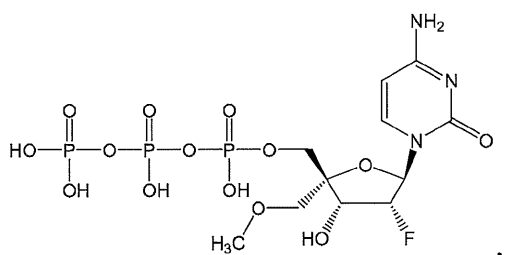
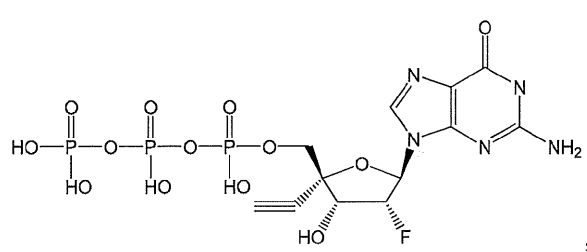
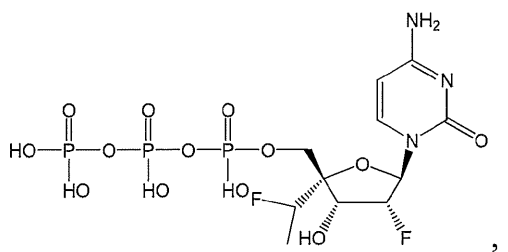
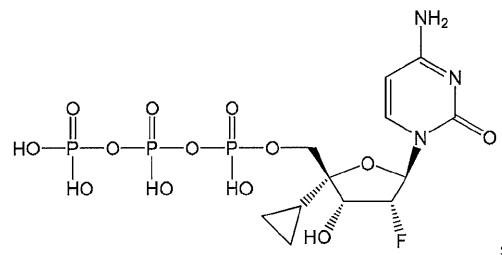
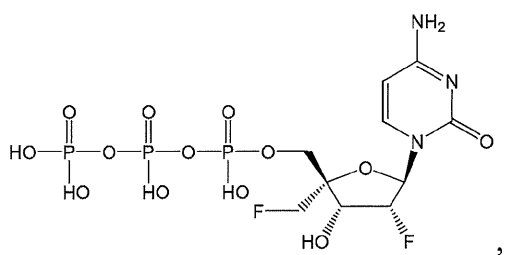
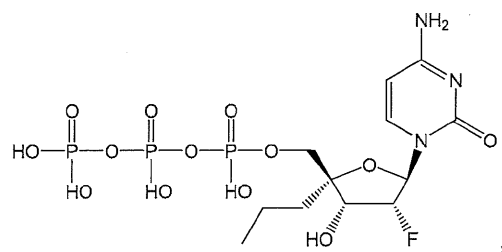
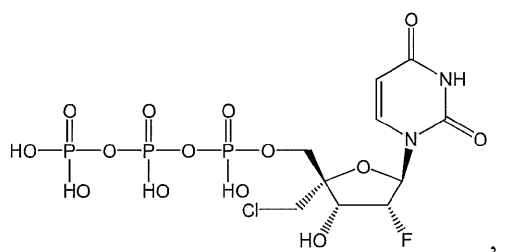
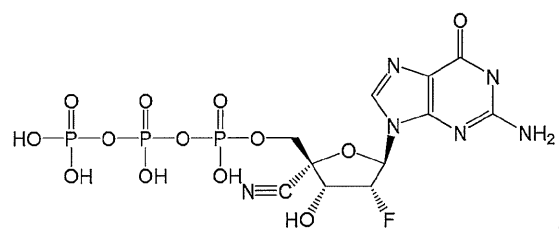
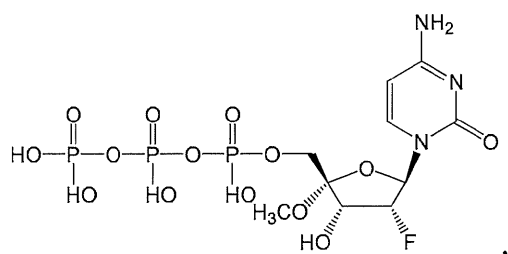


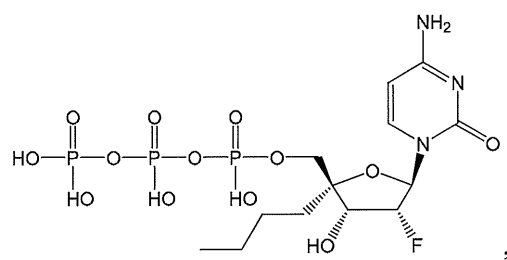
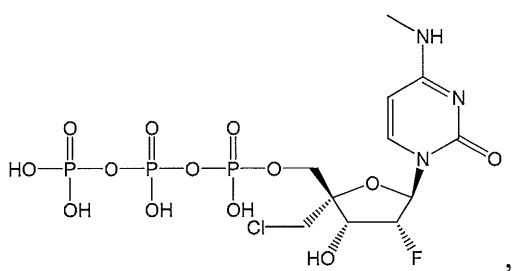
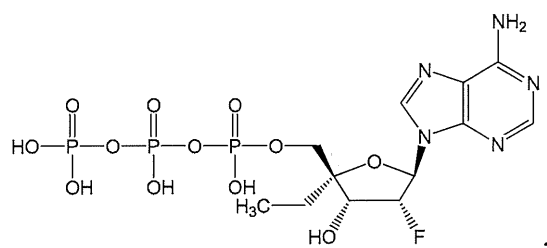
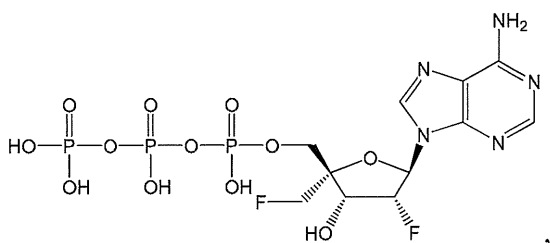
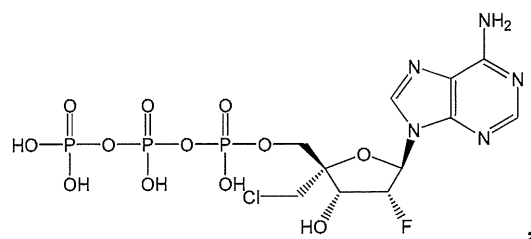
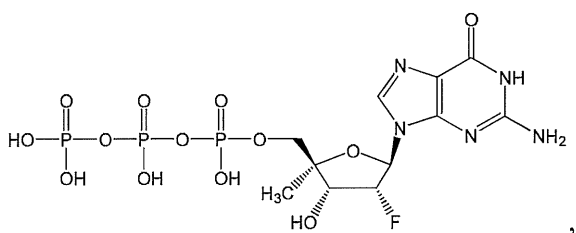
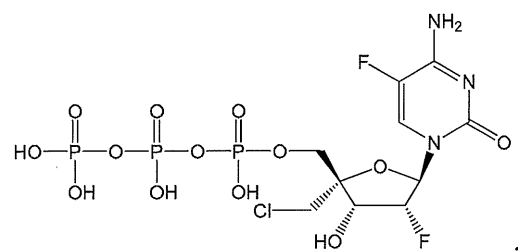
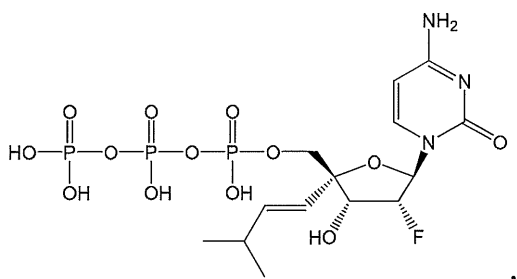
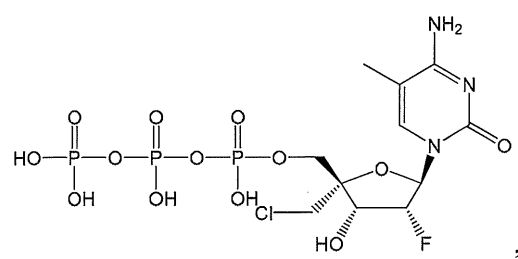
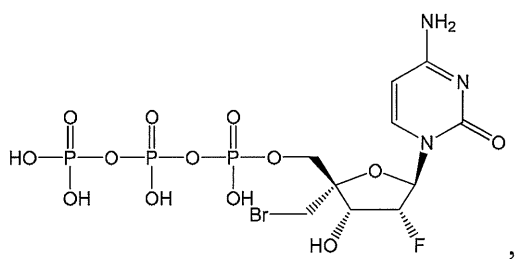


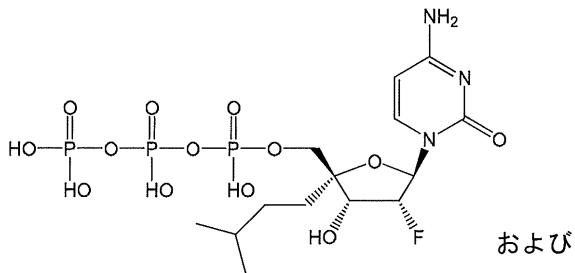
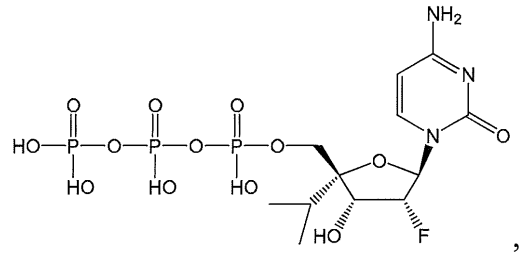
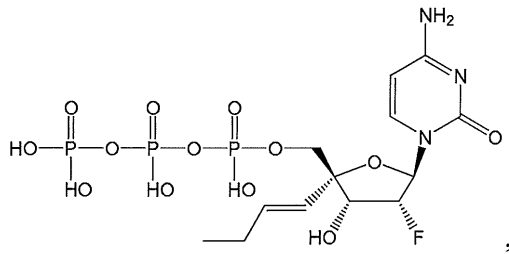




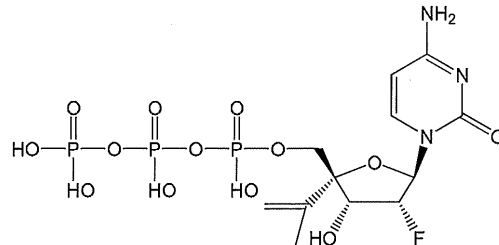








および

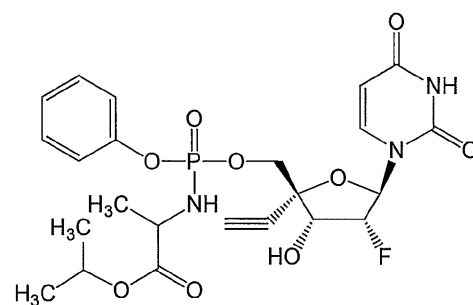
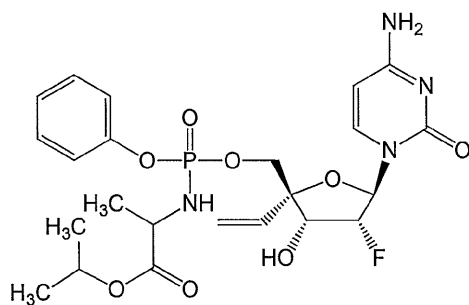
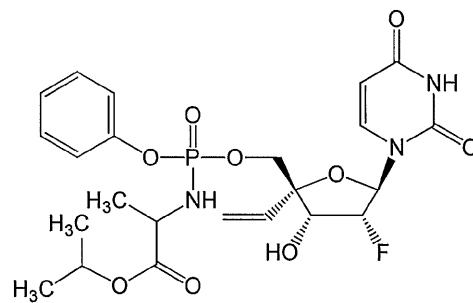
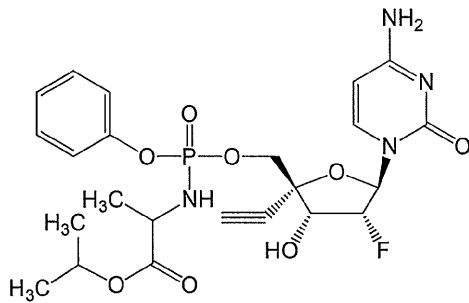


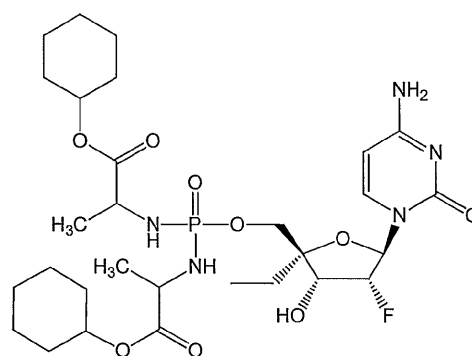
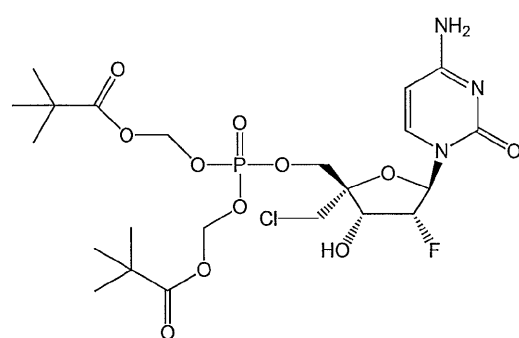
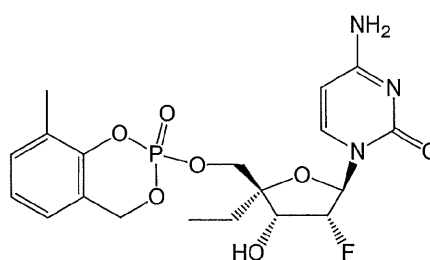
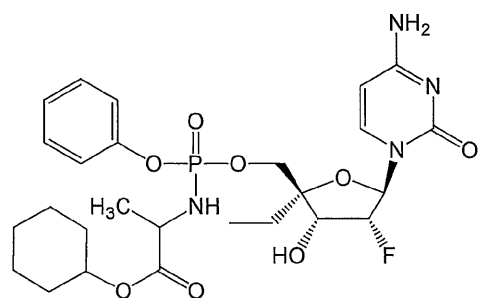
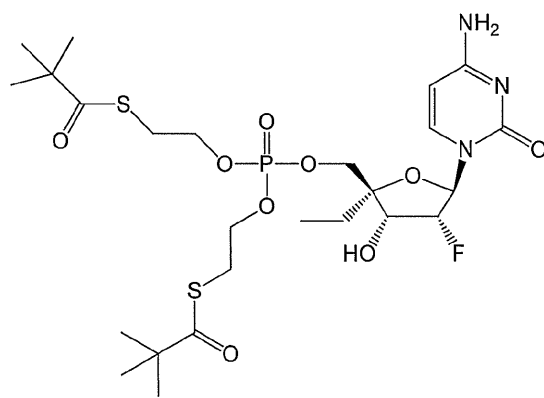
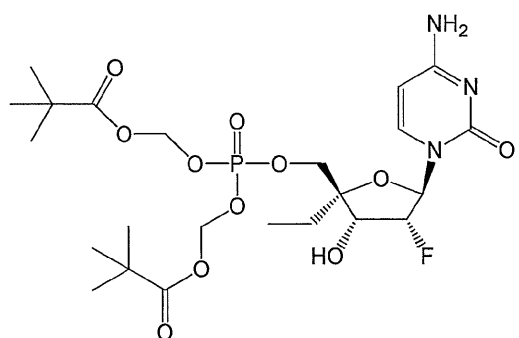
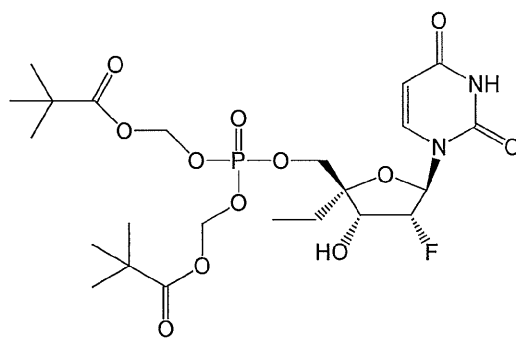
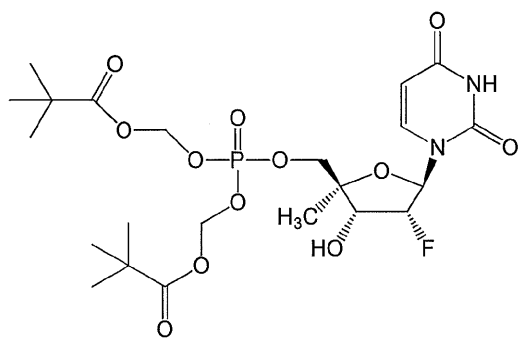
からなる群から選択される、または上記のものの医薬的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

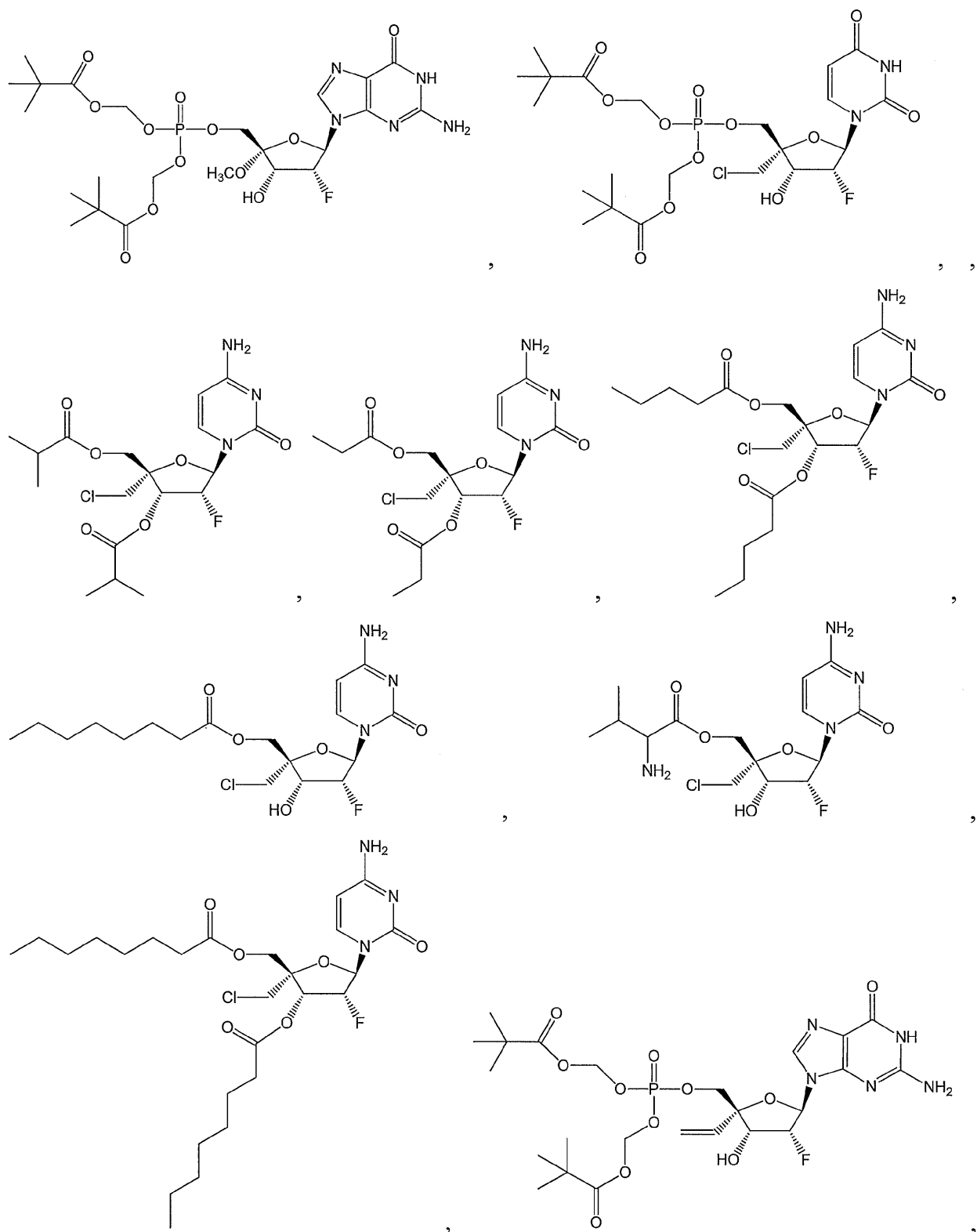
【請求項 5 7】

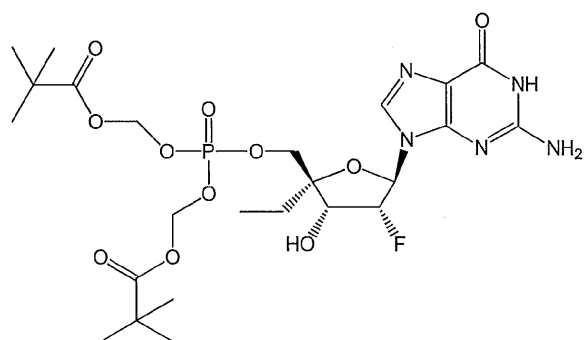
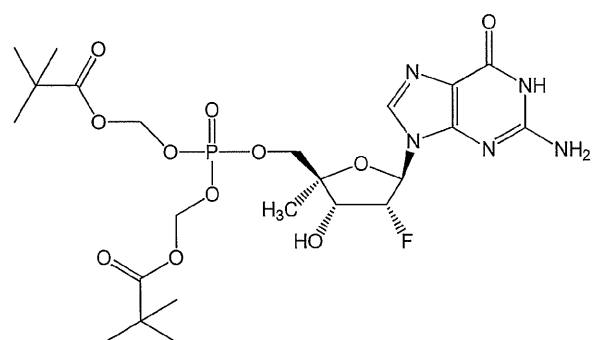
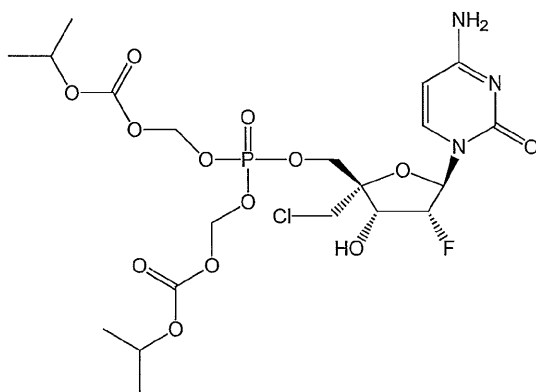
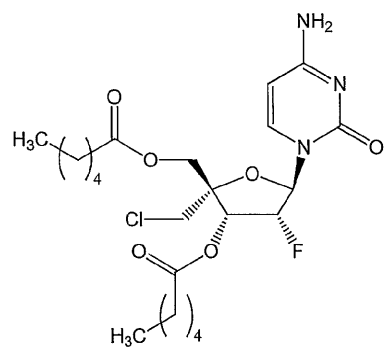
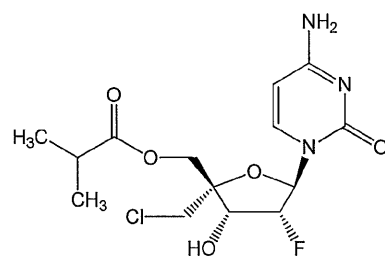
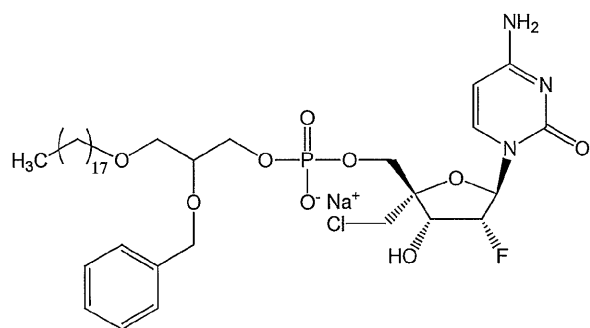
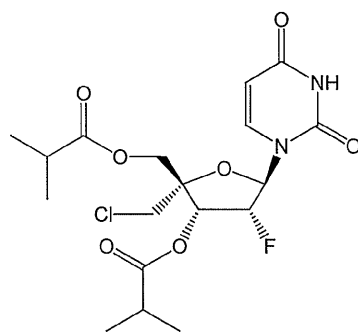
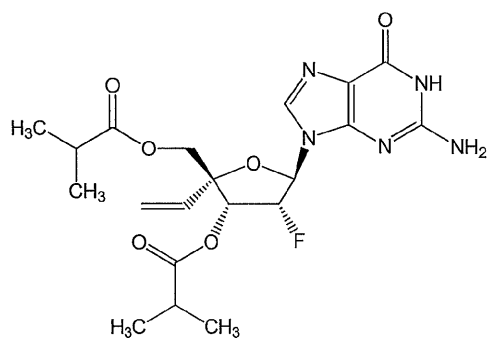
式 (I) の化合物が、

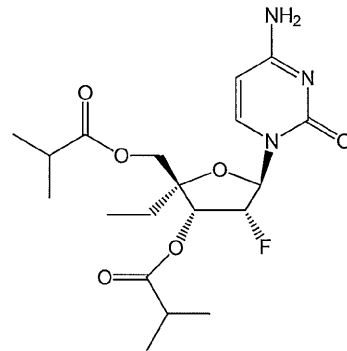
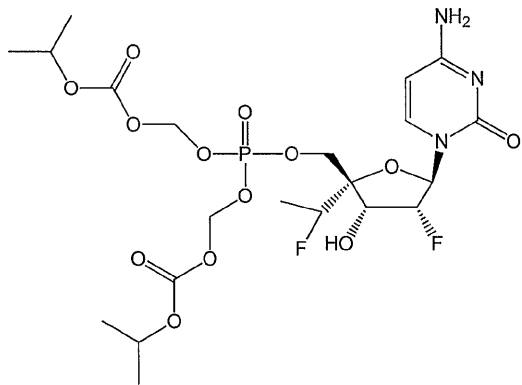
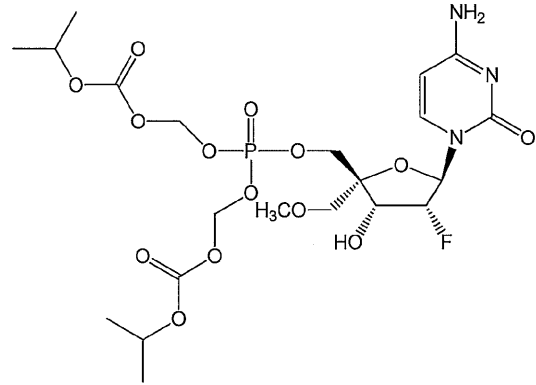
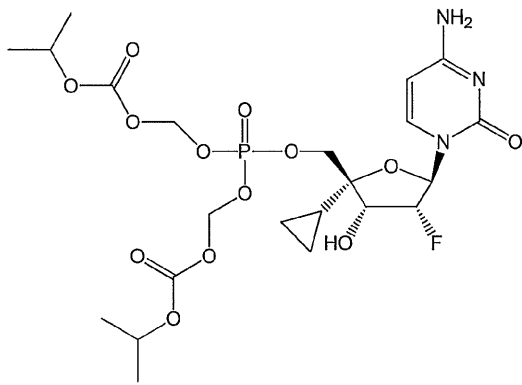
【化 3 5】



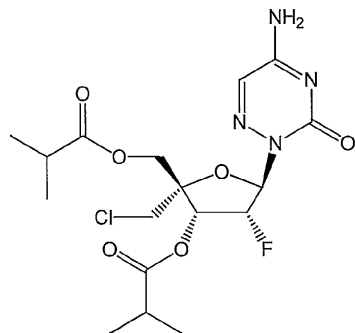








および

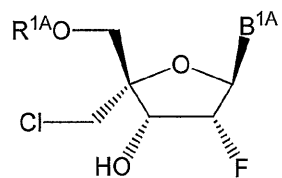


からなる群から選択される、または上記のものの医薬的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5 8】

式 (I) の化合物が、

【化 3 6】

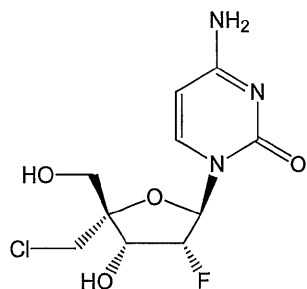


、またはその医薬的に許容される塩である、請求項 1 1 に記載の化合物。

【請求項 5 9】

式 (I) の化合物が、

【化 3 7】

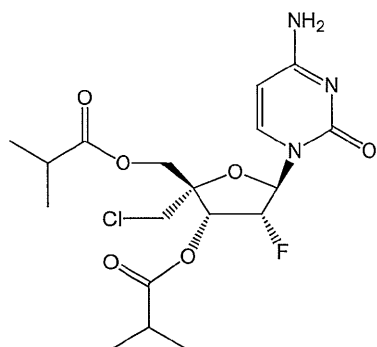


、またはその医薬的に許容される塩である、請求項 5 8 に記載の化合物。

【請求項 6 0】

式 (I) の化合物が、

【化 3 8】

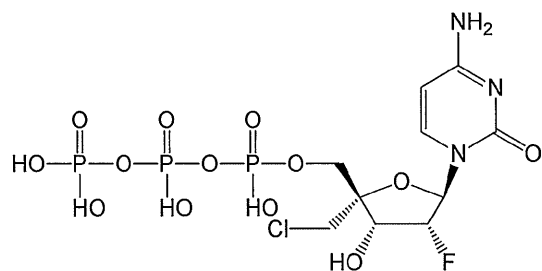


、またはその医薬的に許容される塩である、請求項 5 8 に記載の化合物。

【請求項 6 1】

式 (I) の化合物が、

【化 3 9】

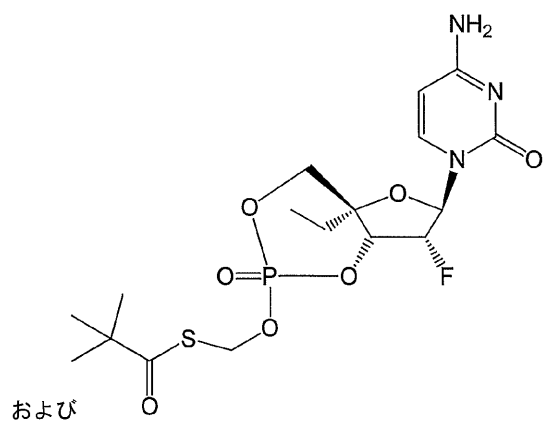
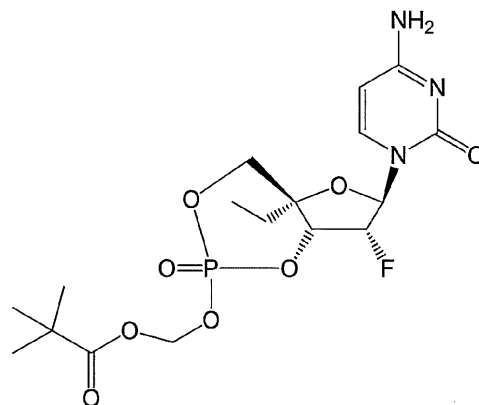
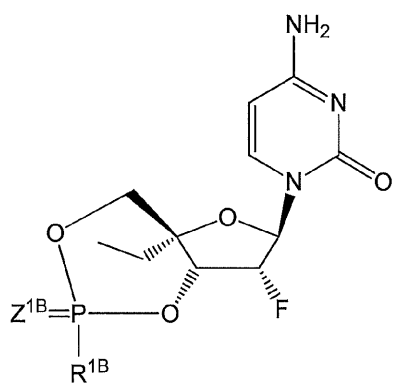


、またはその医薬的に許容される塩である、請求項 5 8 に記載の化合物。

【請求項 6 2】

式 (I I) の化合物が、

【化 4 0】

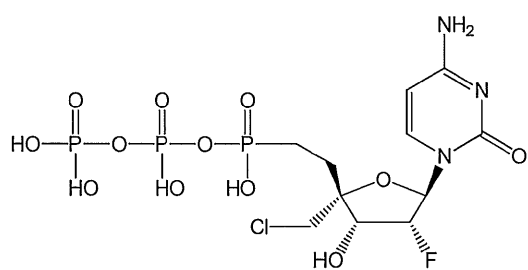


、またはその医薬的に許容される塩である、請求項 5 3 に記載の化合物。

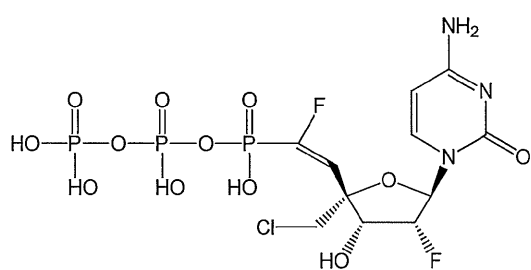
【請求項 6 3】

式 (I I I) の化合物が、

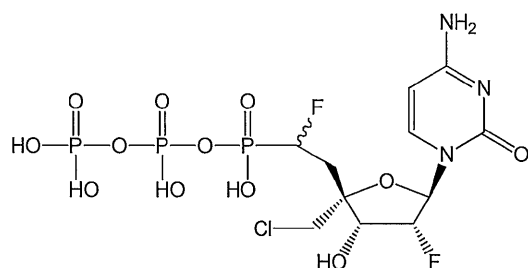
[illegible]



,



および



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。