

【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29年12月14日 (2017.12.14)

【公表番号】特表2016-536288(P2016-536288A)

【公表日】平成28年11月24日 (2016.11.24)

【年通号数】公開・登録公報2016-065

【出願番号】特願2016-521765(P2016-521765)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/7068 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/708 (2006.01)

A 6 1 K 31/7076 (2006.01)

A 6 1 K 31/706 (2006.01)

A 6 1 K 31/7072 (2006.01)

C 0 7 H 19/067 (2006.01)

C 0 7 H 19/167 (2006.01)

C 0 7 H 19/073 (2006.01)

C 0 7 H 19/173 (2006.01)

C 0 7 H 19/20 (2006.01)

C 0 7 H 19/10 (2006.01)

C 0 7 H 19/06 (2006.01)

C 0 7 H 19/16 (2006.01)

C 0 7 H 19/11 (2006.01)

A 6 1 K 38/21 (2006.01)

A 6 1 K 31/7056 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/7068

A 6 1 P 31/14

A 6 1 K 31/708

A 6 1 K 31/7076

A 6 1 K 31/706

A 6 1 K 31/7072

C 0 7 H 19/067 C S P

C 0 7 H 19/167

C 0 7 H 19/073

C 0 7 H 19/173

C 0 7 H 19/20

C 0 7 H 19/10

C 0 7 H 19/06

C 0 7 H 19/16

C 0 7 H 19/11

A 6 1 K 37/66 G

A 6 1 K 31/7056

A 6 1 K 45/00

【手続補正書】

【提出日】平成29年10月30日 (2017.10.30)

【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

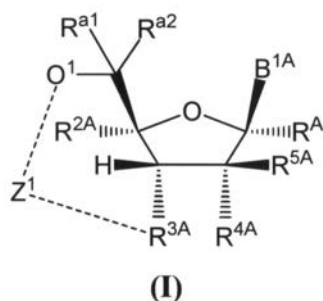
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

ピコルナウイルス科ウイルス感染症を改善または治療するための、以下の構造を有する式 (I) の化合物またはその薬剂的に許容できる塩を含有する医薬組成物であって、
【化 1】



式中、

B^{1A} は、所望により置換されたヘテロ環式塩基または保護アミノ基を有する所望により置換されたヘテロ環式塩基であり；

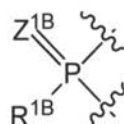
【化 2】

が共に不在である場合、 Z^1 は不在であり、 O^1 は OR^{1A} であり、 R^{2A} は、非置換 C_{2-4} アルキルまたは $-(CH_2)_{1-6}F$ であり、 R^{5A} は、ハロ、 OH 、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルおよび所望により置換された C_{2-6} アルキニルからなる群から選択され、または、 R^{2A} は、ハロ、非置換 C_{2-4} アルケニル、 $-CHF_2$ 、 $-(CH_2)_{1-6}Cl$ 、 $-(CH_2)_{1-6}N_3$ 、 $-(CH_2)_{1-6}NH_2$ または $-CN$ であり、 R^{5A} は、 H 、ハロ、 OH 、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルおよび所望により置換された C_{2-6} アルキニルからなる群から選択され、 R^{3A} は H 、ハロ、 OH 、 $-OC(=O)R^{''A}$ および所望により置換された O 結合型アミノ酸からなる群から選択され、 R^{4A} は OH 、ハロ、 N_3 、 $-OC(=O)R^{''B}$ 、所望により置換された O 結合型アミノ酸および $NR^{''B1}R^{''B2}$ からなる群から選択され、あるいは、 R^{3A} および R^{4A} は共にカルボニルを介して連結された酸素原子であることで 5 員環を形成し；

【化 3】

がそれぞれ単結合である場合、 Z^1 は

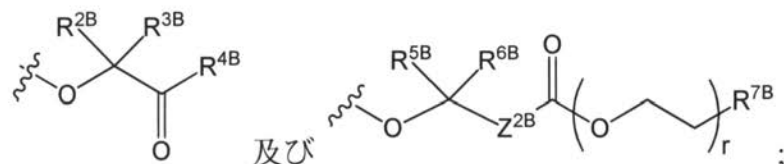
【化 4】



であり、 O^1 は O であり、 R^{2A} は、ハロ、 $-CHF_2$ 、 $-(CH_2)_{1-6}F$ 、 $-(CH$

C_{1-6} 、 $-(\text{CH}_2)_{1-6}\text{N}_3$ 、 $-(\text{CH}_2)_{1-6}\text{NH}_2$ または $-\text{CN}$ であり、 R^{3A} は O であり； R^{4A} は、 OH 、ハロ、 N_3 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^{''B}$ 、所望により置換された O 結合型アミノ酸および $\text{NR}^{''B1}\text{R}^{''B2}$ からなる群から選択され； R^{5A} は、 H 、ハロ、 OH 、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルおよび所望により置換された C_{2-6} アルキニルからなる群から選択され、 R^{1B} は O^- 、 OH 、 $-\text{O}-$ 所望により置換された C_{1-6} アルキル、

【化 5】



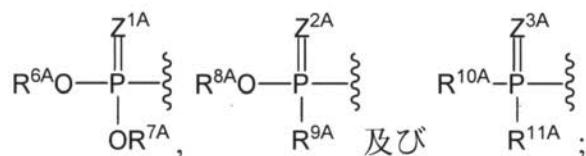
からなる群から選択され；

R^{a1} および R^{a2} は独立して水素または重水素であり；

R^A は水素、重水素、非置換 C_{1-3} アルキル、非置換 C_{2-4} アルケニル、非置換 C_{2-3} アルキニルまたはシアノであり；

R^{1A} は水素、所望により置換されたアシル、所望により置換された O 結合型アミノ酸、

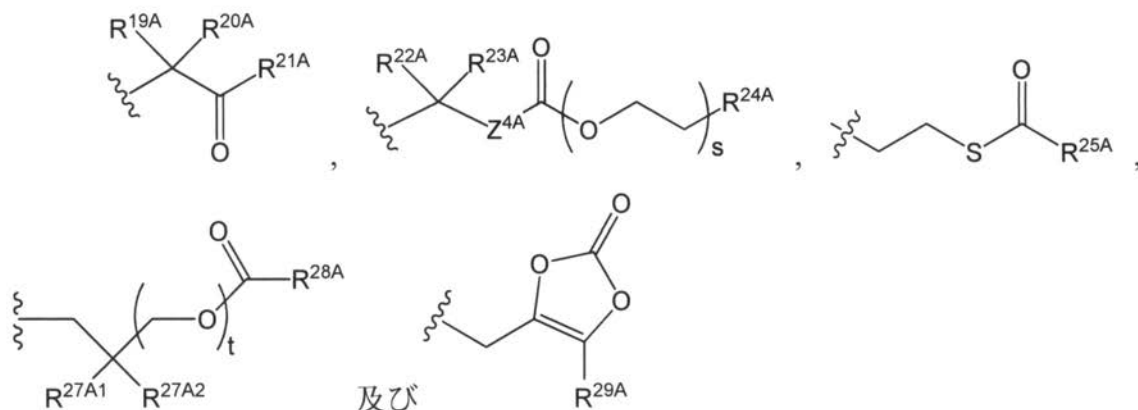
【化 6】



からなる群から選択され；

R^{6A} 、 R^{7A} および R^{8A} は独立して、不在、水素、所望により置換された C_{1-2} アルキル、所望により置換された C_{2-24} アルケニル、所望により置換された C_{2-24} アルキニル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルキル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルケニル、所望により置換されたアリール、所望により置換されたヘテロアリール、所望により置換されたアリール (C_{1-6} アルキル)、所望により置換された $^*-(\text{CR}^{15A}\text{R}^{16A})_p-\text{O}-\text{C}_{1-24}$ アルキル、所望により置換された $^*-(\text{CR}^{17A}\text{R}^{18A})_q-\text{O}-\text{C}_{1-24}$ アルケニル、

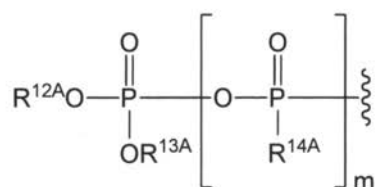
【化 7】



からなる群から選択され；あるいは

R^{6A} は

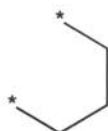
【化 8】



であり、 R^{7A} は不在または水素であり；あるいは

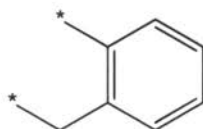
R^{6A} および R^{7A} は一緒になって、所望により置換された

【化 9】



および所望により置換された

【化 10】



からなる群から選択される部分を形成し、 R^{6A} および R^{7A} に連結された酸素、リン並びに前記部分は 6 員～10 員の環系を形成し；

R^{9A} は、所望により置換された C_{1-24} アルキル、所望により置換された C_{2-24} アルケニル、所望により置換された C_{2-24} アルキニル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルキル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルケニル、 $NR^{30A}R^{31A}$ 、所望により置換された N 結合型アミノ酸および所望により置換された N 結合型アミノ酸エステル誘導体からなる群から選択され；

R^{10A} および R^{11A} は独立して、所望により置換された N 結合型アミノ酸または所望により置換された N 結合型アミノ酸エステル誘導体であり；

R^{12A} および R^{13A} は独立して不在または水素であり；

R^{14A} は O^- 、 OH またはメチルであり；

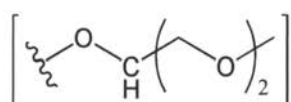
各 R^{15A} 、各 R^{16A} 、各 R^{17A} および各 R^{18A} は独立して、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキルまたはアルコキシであり；

R^{19A} 、 R^{20A} 、 R^{22A} および R^{23A} は独立して、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキルおよび所望により置換されたアリールからなる群から選択され；

R^{21A} は、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキル、所望により置換されたアリール、所望により置換された $-O-C_{1-24}$ アルキル、所望により置換された $-O$ -アリール、所望により置換された $-O$ -ヘテロアリールおよび所望により置換された $-O$ -単環式ヘテロシクリルからなる群から選択され；

R^{24A} は、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキル、所望により置換されたアリール、所望により置換された $-O-C_{1-24}$ アルキル、所望により置換された $-O$ -アリール、所望により置換された $-O$ -ヘテロアリール、所望により置換された $-O$ -単環式ヘテロシクリルおよび

【化 1 1】



からなる群から選択され；

R^{25A} および R^{29A} は独立して、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキル および所望により置換されたアリールからなる群から選択され；

R^{27A1} および R^{27A2} は独立して、

【化 1 2】



、所望により置換された C_{2-8} オルガニルカルボニル、所望により置換された C_{2-8} アルコシカルボニルおよび所望により置換された 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；

R^{28A} は、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキル、所望により置換された C_{2-24} アルケニル、所望により置換された C_{2-24} アルキニル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルキルおよび所望により置換された C_{3-6} シクロアルケニル からなる群から選択され；

R^{30A} および R^{31A} は独立して、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキル、所望により置換された C_{2-24} アルケニル、所望により置換された C_{2-24} アルキニル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルキル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルケニルおよび所望により置換されたアリール (C_{1-4} アルキル) からなる群から選択され；

R^{3A} および各 R^{3B} は独立して、所望により置換された C_{1-24} アルキルであり；

各 R^{3B1} および各 R^{3B2} は独立して、水素または所望により置換された C_{1-6} アルキルであり；

R^{2B} 、 R^{3B} 、 R^{5B} および R^{6B} は独立して、水素または所望により置換された C_{1-24} アルキルであり；

R^{4B} および R^{7B} は独立して、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキル、所望により置換されたアリール、所望により置換された $-O-C_{1-24}$ アルキル、所望により置換された $-O-$ アリール、所望により置換された $-O-$ ヘテロアリールおよび所望により置換された $-O-$ 単環式ヘテロシクリルからなる群から選択され；

m は 0 または 1 であり；

p および q は独立して 1、2 または 3 であり；

r および s は独立して 0、1、2 または 3 であり；

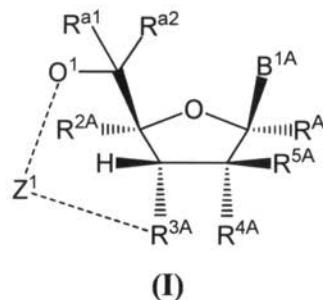
t は 1 または 2 であり；

Z^{1A} 、 Z^{2A} 、 Z^{3A} 、 Z^{4A} 、 Z^{1B} および Z^{2B} は独立して O または S である、前記医薬組成物。

【請求項 2】

フラビウイルス科ウイルス感染症を改善または治療するための、以下の構造を有する式 (I) の化合物またはその薬剂的に許容できる塩を含有する医薬組成物であって、

【化 1 3】



式中、

B^{1A} は、所望により置換されたヘテロ環式塩基または保護アミノ基を有する所望により置換されたヘテロ環式塩基であり；

【化 1 4】

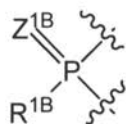
が共に不在である場合、 Z^1 は不在であり、 O^1 は OR^{1A} であり、

R^{2A} は、ハロ、非置換 C_{2-4} アルキル、非置換 C_{2-4} アルケニル、 $-(CH_2)_{1-6}F$ または $-CN$ であり、 R^{5A} は、 OH 、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルおよび所望により置換された C_{2-6} アルキニルからなる群から選択され、または、 R^{2A} は、 $-CHF_2$ 、 $-(CH_2)_{1-6}Cl$ 、 $-(CH_2)_{1-6}N_3$ または $-(CH_2)_{1-6}NH_2$ であり、 R^{5A} は、 H 、ハロ、 OH 、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルおよび所望により置換された C_{2-6} アルキニルからなる群から選択され、 R^{3A} は H 、ハロ、 OH 、 $-OC(=O)R''^A$ および所望により置換された O 結合型アミノ酸からなる群から選択され、 R^{4A} は OH 、ハロ、 N_3 、 $-OC(=O)R''^B$ 、所望により置換された O 結合型アミノ酸および $NR''^{B1}R''^{B2}$ からなる群から選択され、あるいは、 R^{3A} および R^{4A} は共にカルボニルを介して連結された酸素原子であることで 5 員環を形成し；

【化 1 5】

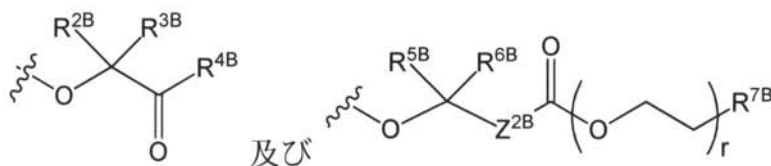
がそれぞれ単結合である場合、 Z^1 は

【化 1 6】



であり、 O^1 は O であり、 R^{2A} は、ハロ、 $-CHF_2$ 、 $-(CH_2)_{1-6}F$ 、 $-(CH_2)_{1-6}Cl$ 、 $-(CH_2)_{1-6}N_3$ 、 $-(CH_2)_{1-6}NH_2$ または $-CN$ であり、 R^{3A} は O であり； R^{4A} は、 OH 、ハロ、 N_3 、 $-OC(=O)R''^B$ 、所望により置換された O 結合型アミノ酸および $NR''^{B1}R''^{B2}$ からなる群から選択され； R^{5A} は、 H 、ハロ、 OH 、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルおよび所望により置換された C_{2-6} アルキニルからなる群から選択され、 R^{1B} は O^- 、 OH 、 $-O$ -所望により置換された C_{1-6} アルキル、

【化 17】



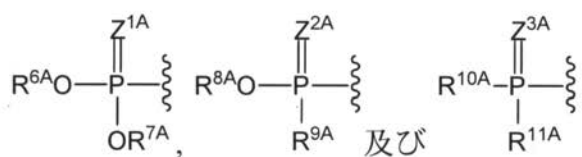
からなる群から選択され；

R^{a1} および R^{a2} は独立して水素または重水素であり；

R^A は水素、重水素、非置換 C_{1-3} アルキル、非置換 C_{2-4} アルケニル、非置換 C_{2-3} アルキニルまたはシアノであり；

R^{1A} は水素、所望により置換されたアシル、所望により置換された O 結合型アミノ酸

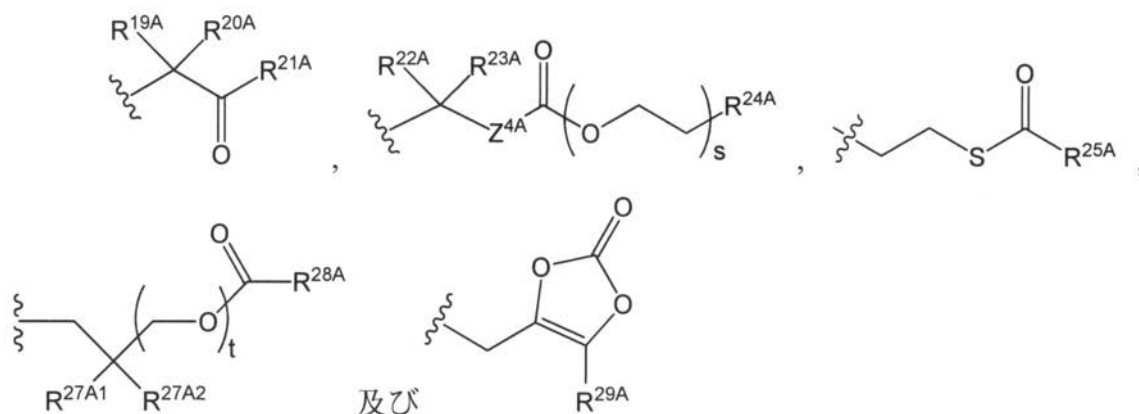
【化 18】



からなる群から選択され；

R^{6A} 、 R^{7A} および R^{8A} は独立して、不在、水素、所望により置換された C_{1-2} アルキル、所望により置換された C_{2-24} アルケニル、所望により置換された C_{2-24} アルキニル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルキル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルケニル、所望により置換されたアリール、所望により置換されたヘテロアリール、所望により置換されたアリール (C_{1-6} アルキル)、所望により置換された $^*-(CR^{15A}R^{16A})_p-O-C_{1-24}$ アルキル、所望により置換された $^*-(CR^{17A}R^{18A})_q-O-C_{1-24}$ アルケニル、

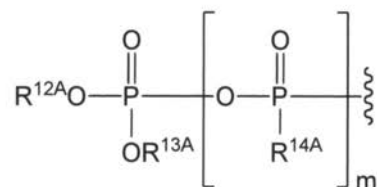
【化 19】



からなる群から選択され；あるいは

R^{6A} は

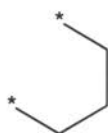
【化 2 0】



であり、 R^{7A} は不在または水素であり；あるいは

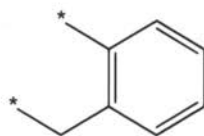
R^{6A} および R^{7A} は一緒になって、所望により置換された

【化 2 1】



および所望により置換された

【化 2 2】



からなる群から選択される部分を形成し、 R^{6A} および R^{7A} に連結された酸素、リン並びに前記部分は 6 員～10 員の環系を形成し；

R^{9A} は、所望により置換された C_{1-24} アルキル、所望により置換された C_{2-24} アルケニル、所望により置換された C_{2-24} アルキニル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルキル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルケニル、 $NR^{30A}R^{31A}$ 、所望により置換された N 結合型アミノ酸および所望により置換された N 結合型アミノ酸エステル誘導体からなる群から選択され；

R^{10A} および R^{11A} は独立して、所望により置換された N 結合型アミノ酸または所望により置換された N 結合型アミノ酸エステル誘導体であり；

R^{12A} および R^{13A} は独立して不在または水素であり；

R^{14A} は O^- 、 OH またはメチルであり；

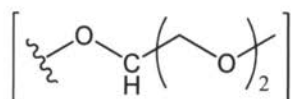
各 R^{15A} 、各 R^{16A} 、各 R^{17A} および各 R^{18A} は独立して、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキルまたはアルコキシであり；

R^{19A} 、 R^{20A} 、 R^{22A} および R^{23A} は独立して、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキルおよび所望により置換されたアリールからなる群から選択され；

R^{21A} は、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキル、所望により置換されたアリール、所望により置換された $-O-C_{1-24}$ アルキル、所望により置換された $-O$ -アリール、所望により置換された $-O$ -ヘテロアリールおよび所望により置換された $-O$ -単環式ヘテロシクリルからなる群から選択され；

R^{24A} は、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキル、所望により置換されたアリール、所望により置換された $-O-C_{1-24}$ アルキル、所望により置換された $-O$ -アリール、所望により置換された $-O$ -ヘテロアリール、所望により置換された $-O$ -単環式ヘテロシクリルおよび

【化 2 3】



からなる群から選択され；

R^{25A} および R^{29A} は独立して、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキル
および所望により置換されたアリールからなる群から選択され；

R^{27A1} および R^{27A2} は独立して、

【化 2 4】



、所望により置換された C_{2-8} オルガニルカルボニル、所望により置換された C_{2-8}
 C_{2-8} アルコキシカルボニルおよび所望により置換された 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；

R^{28A} は、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキル、所望により置換された
 C_{2-24} アルケニル、所望により置換された C_{2-24} アルキニル、所望により置換され
た C_{3-6} シクロアルキルおよび所望により置換された C_{3-6} シクロアルケニルから
なる群から選択され；

R^{30A} および R^{31A} は独立して、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキル
、所望により置換された C_{2-24} アルケニル、所望により置換された C_{2-24} アルキ
ニル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルキル、所望により置換された C_{3-6} シ
クロアルケニルおよび所望により置換されたアリール (C_{1-4} アルキル) からなる群か
ら選択され；

$R^{''A}$ および各 $R^{''B}$ は独立して、所望により置換された C_{1-24} アルキルであり；

各 $R^{''B1}$ および各 $R^{''B2}$ は独立して、水素または所望により置換された C_{1-6} ア
ルキルであり；

R^{2B} 、 R^{3B} 、 R^{5B} および R^{6B} は独立して、水素または所望により置換された C
 $_{1-24}$ アルキルであり；

R^{4B} および R^{7B} は独立して、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキル、所
望により置換されたアリール、所望により置換された $-O-C_{1-24}$ アルキル、所望によ
り置換された $-O$ -アリール、所望により置換された $-O$ -ヘテロアリールおよび所望によ
り置換された $-O$ -単環式ヘテロシクリルからなる群から選択され；

m は 0 または 1 であり；

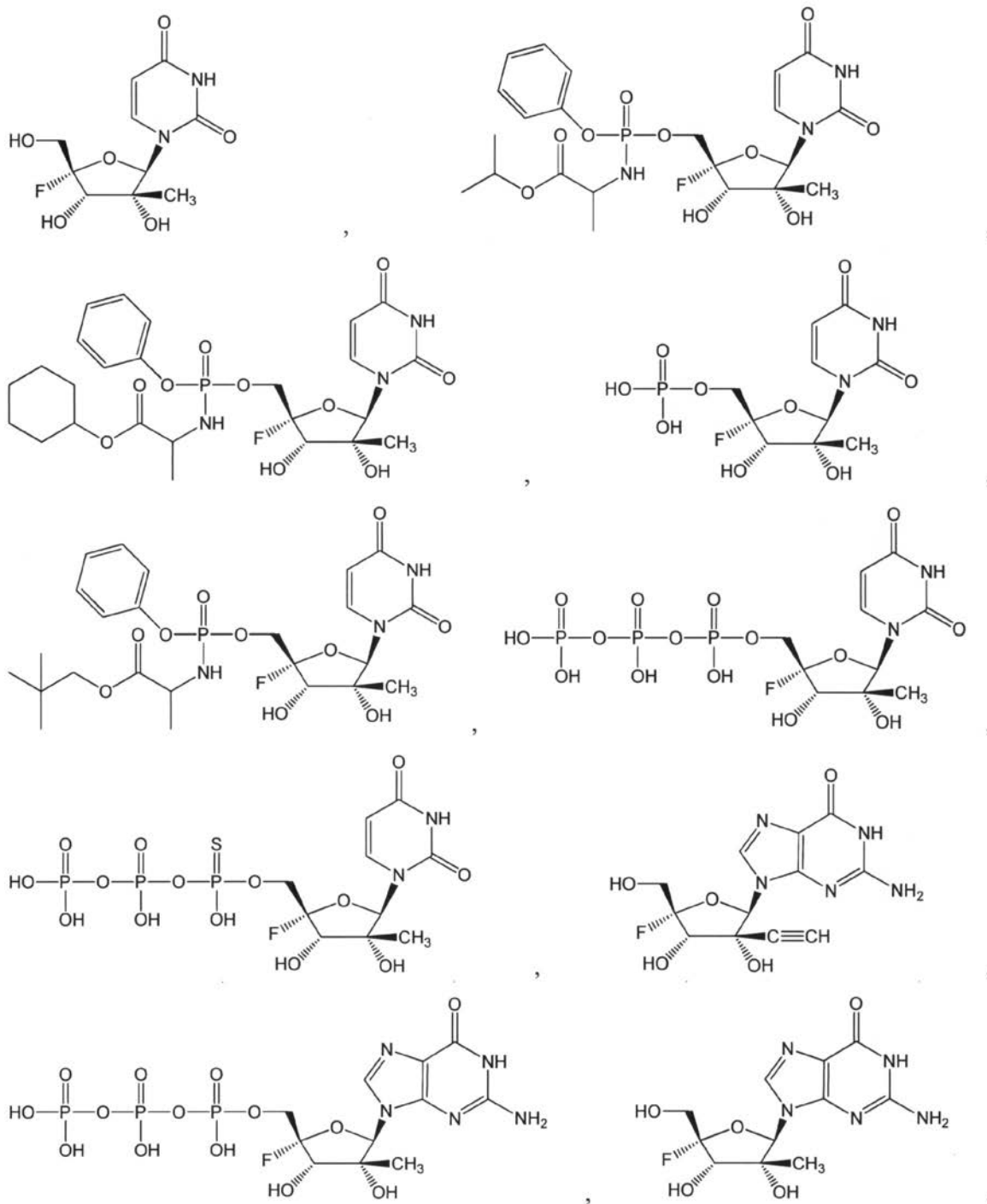
p および q は独立して 1、2 または 3 であり；

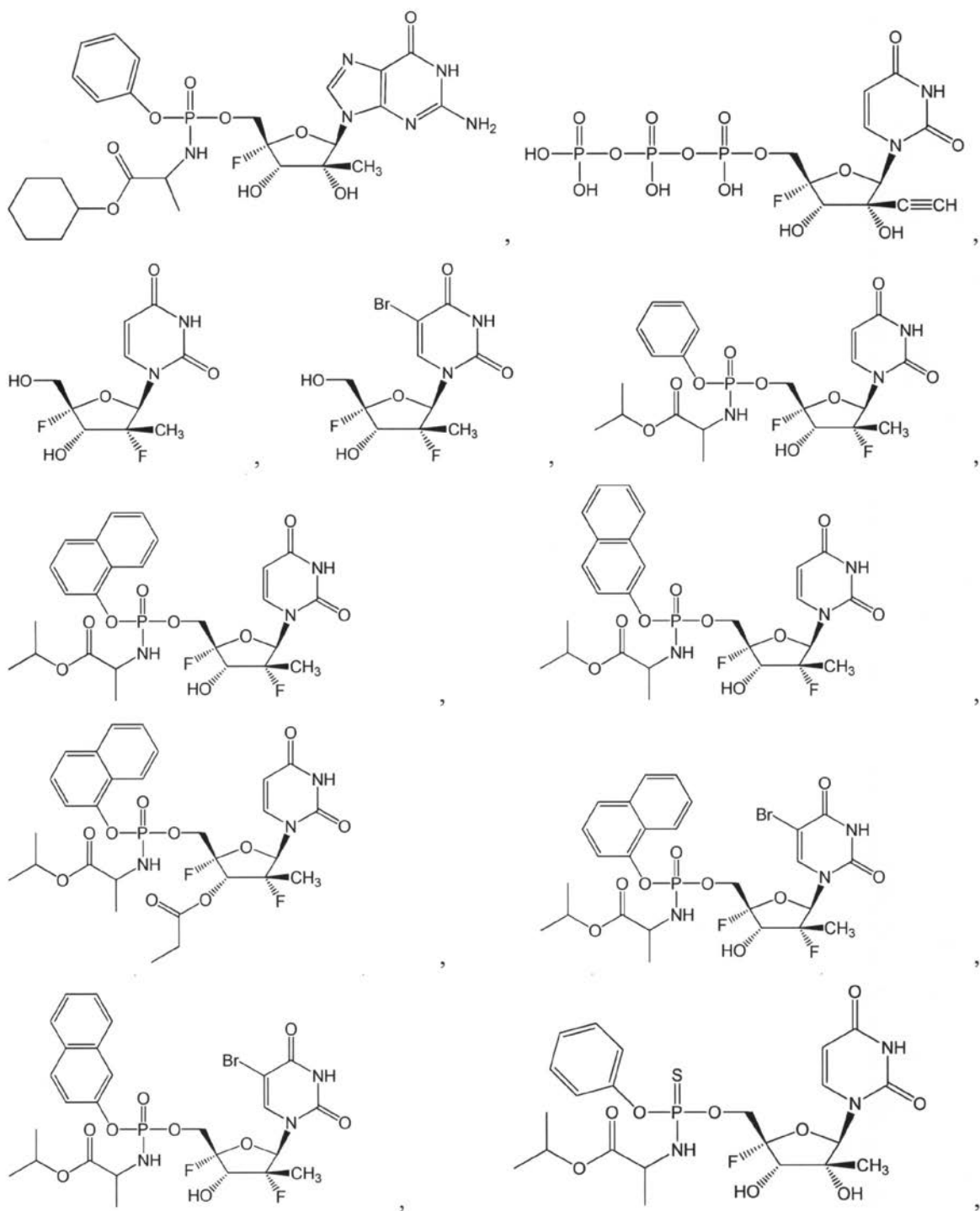
r および s は独立して 0、1、2 または 3 であり；

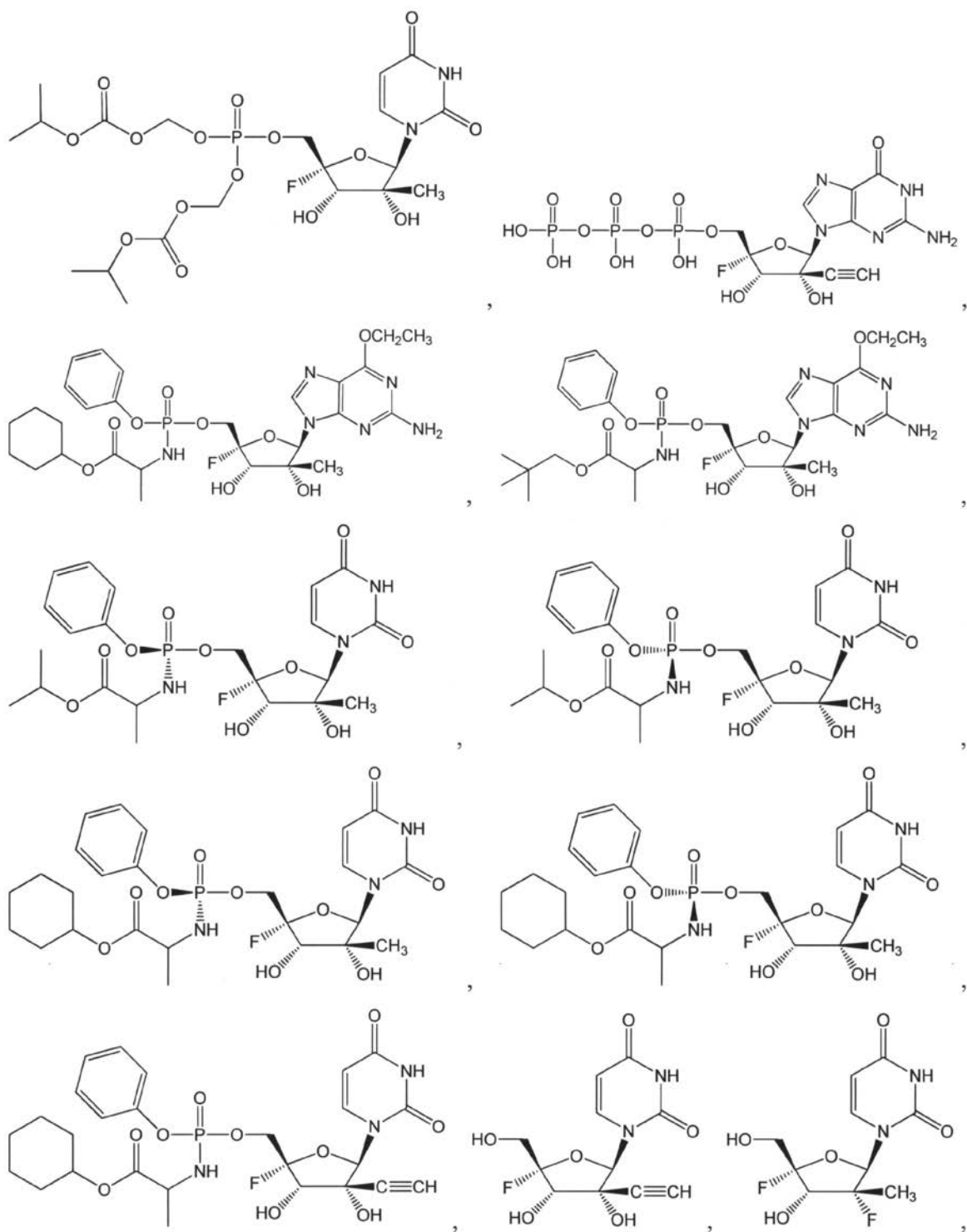
t は 1 または 2 であり；

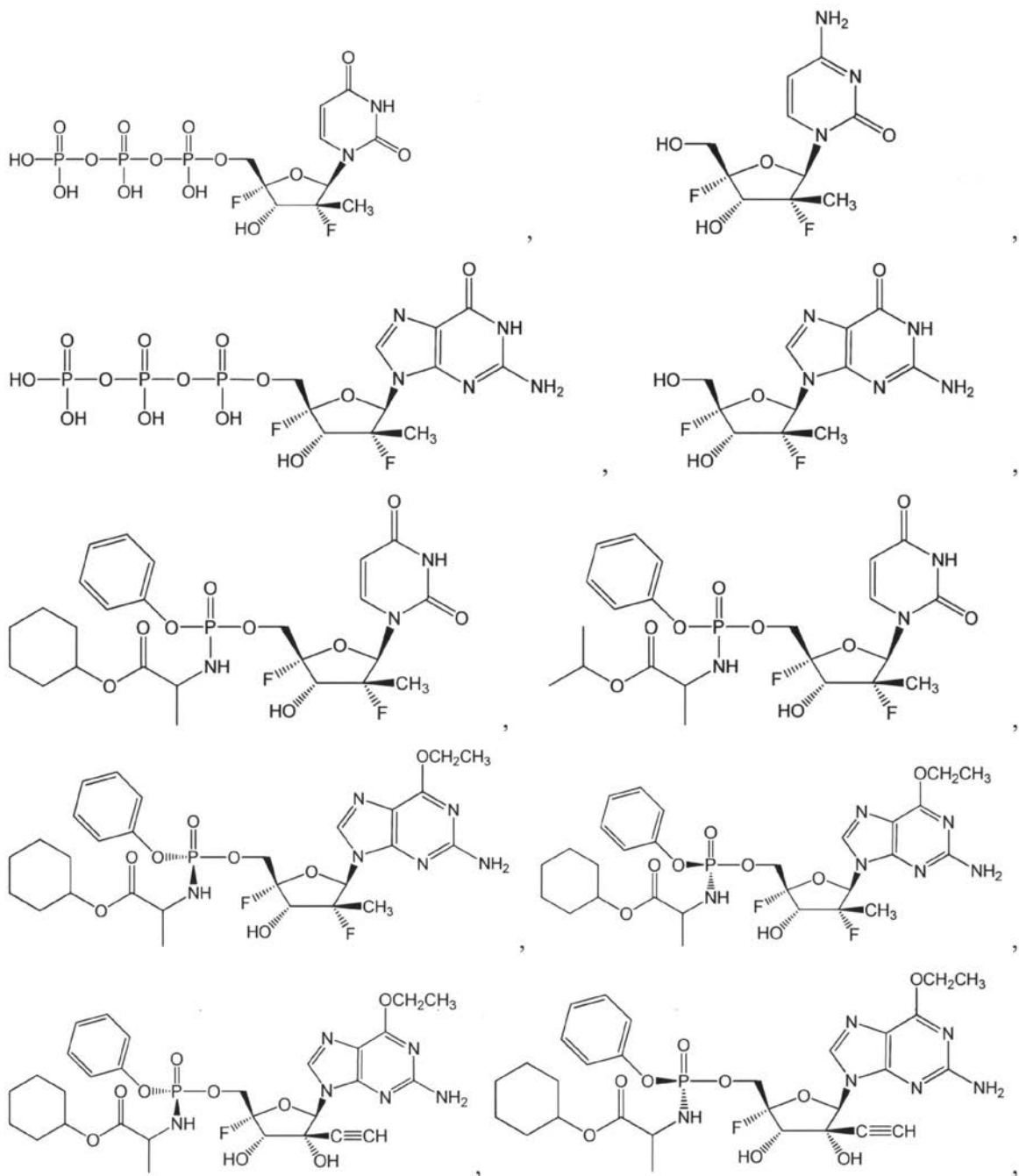
Z^{1A} 、 Z^{2A} 、 Z^{3A} 、 Z^{4A} 、 Z^{1B} および Z^{2B} は独立して O または S であり、
ただし、式 (I) の化合物またはその薬剂的に許容できる塩は、

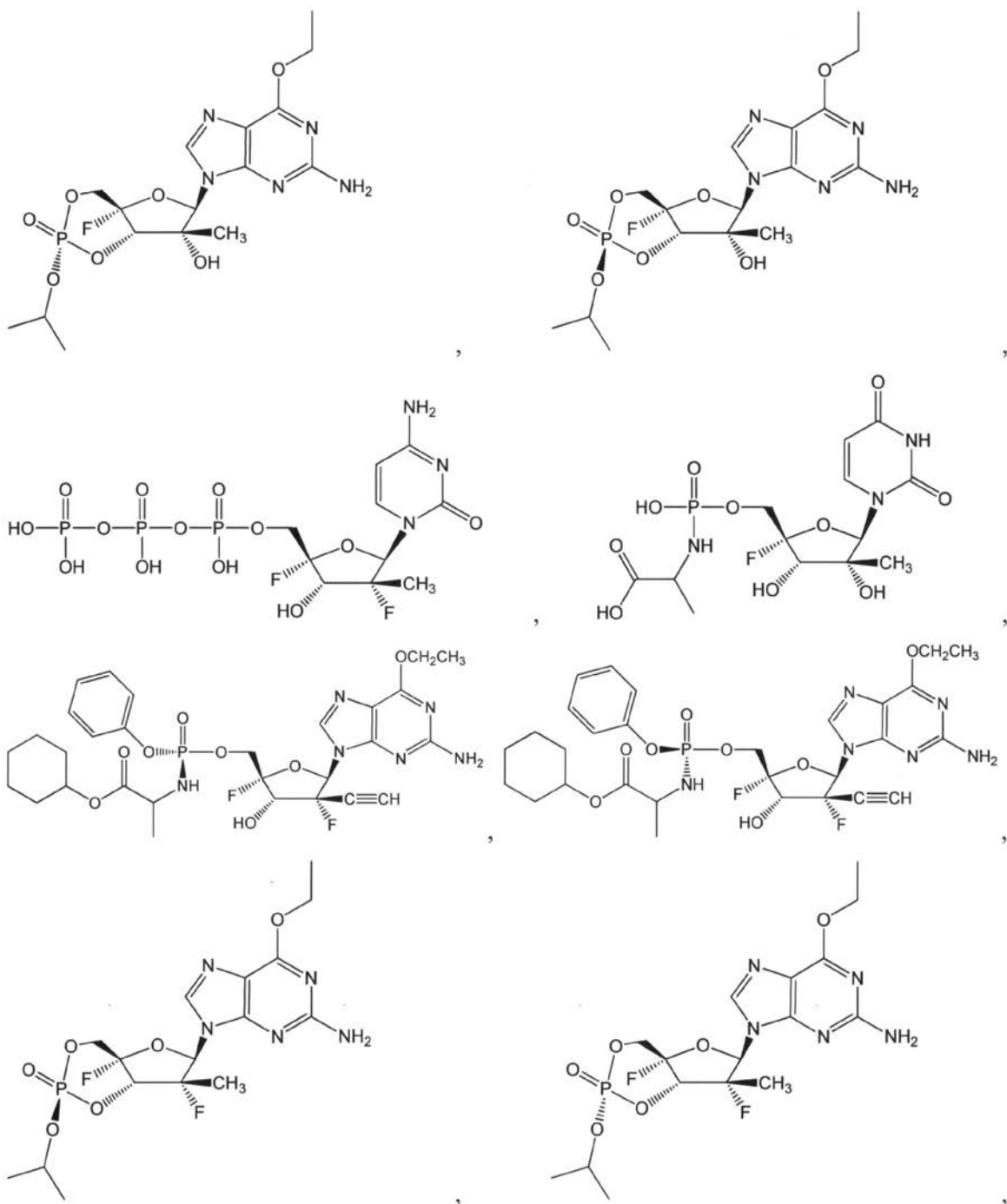
【化 2 5】

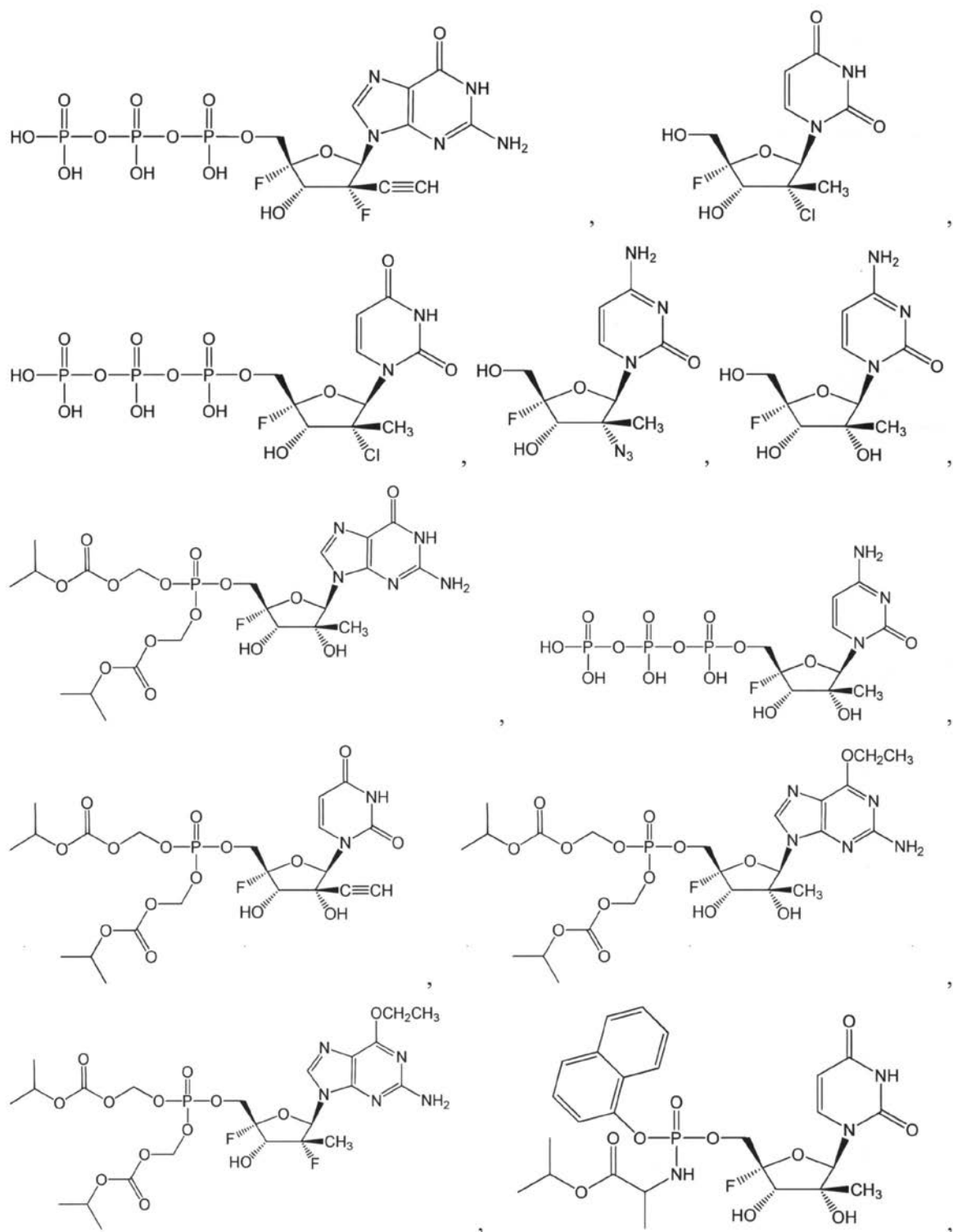


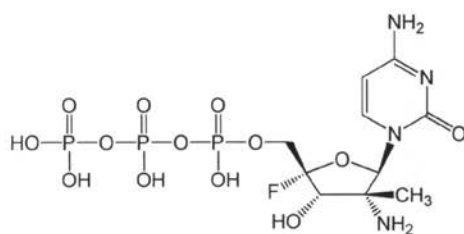
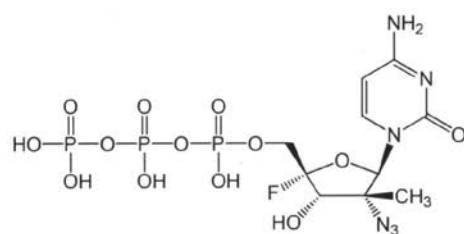
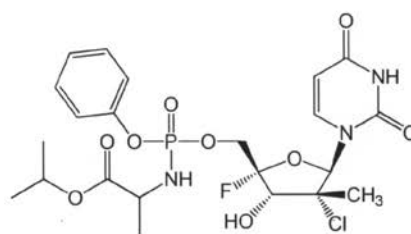
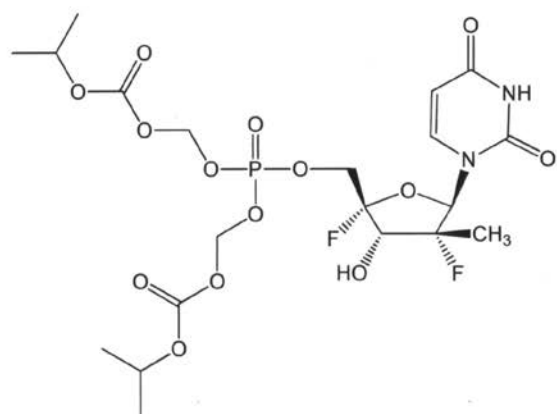
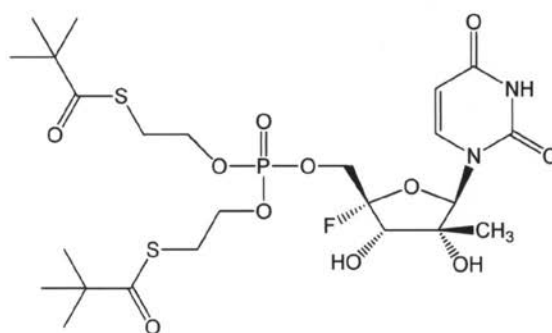
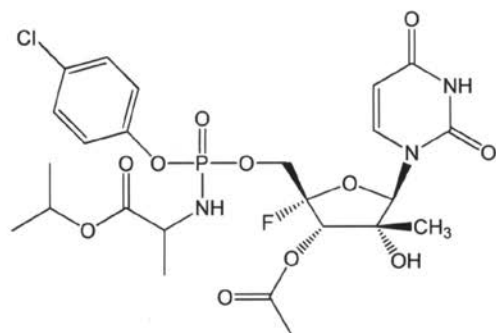
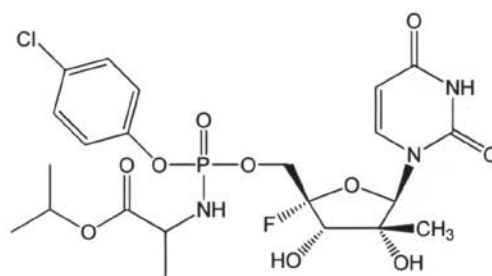
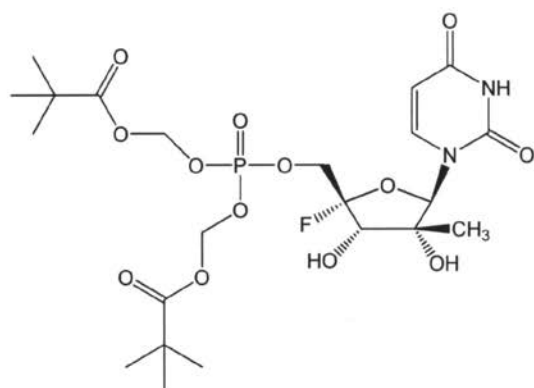


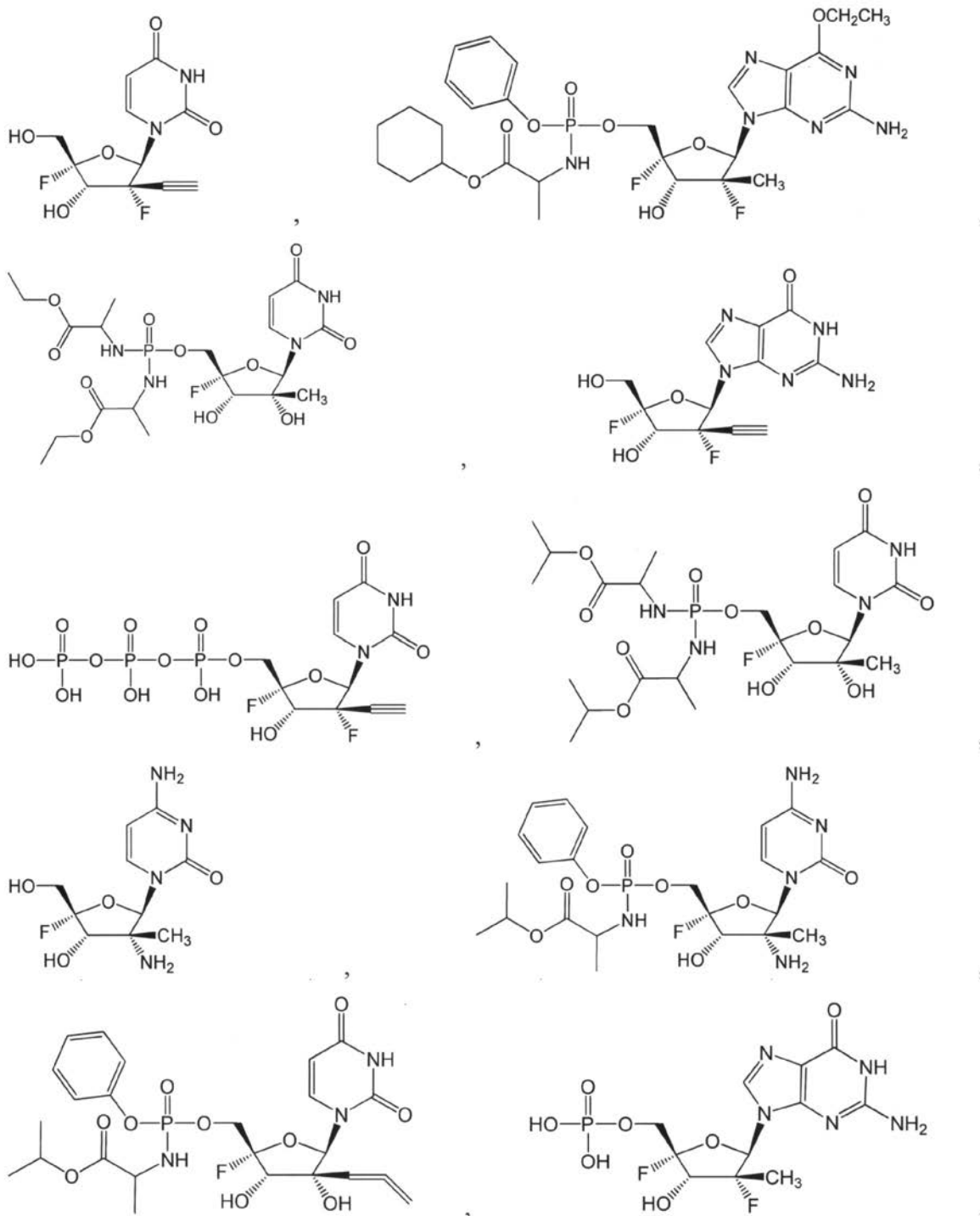


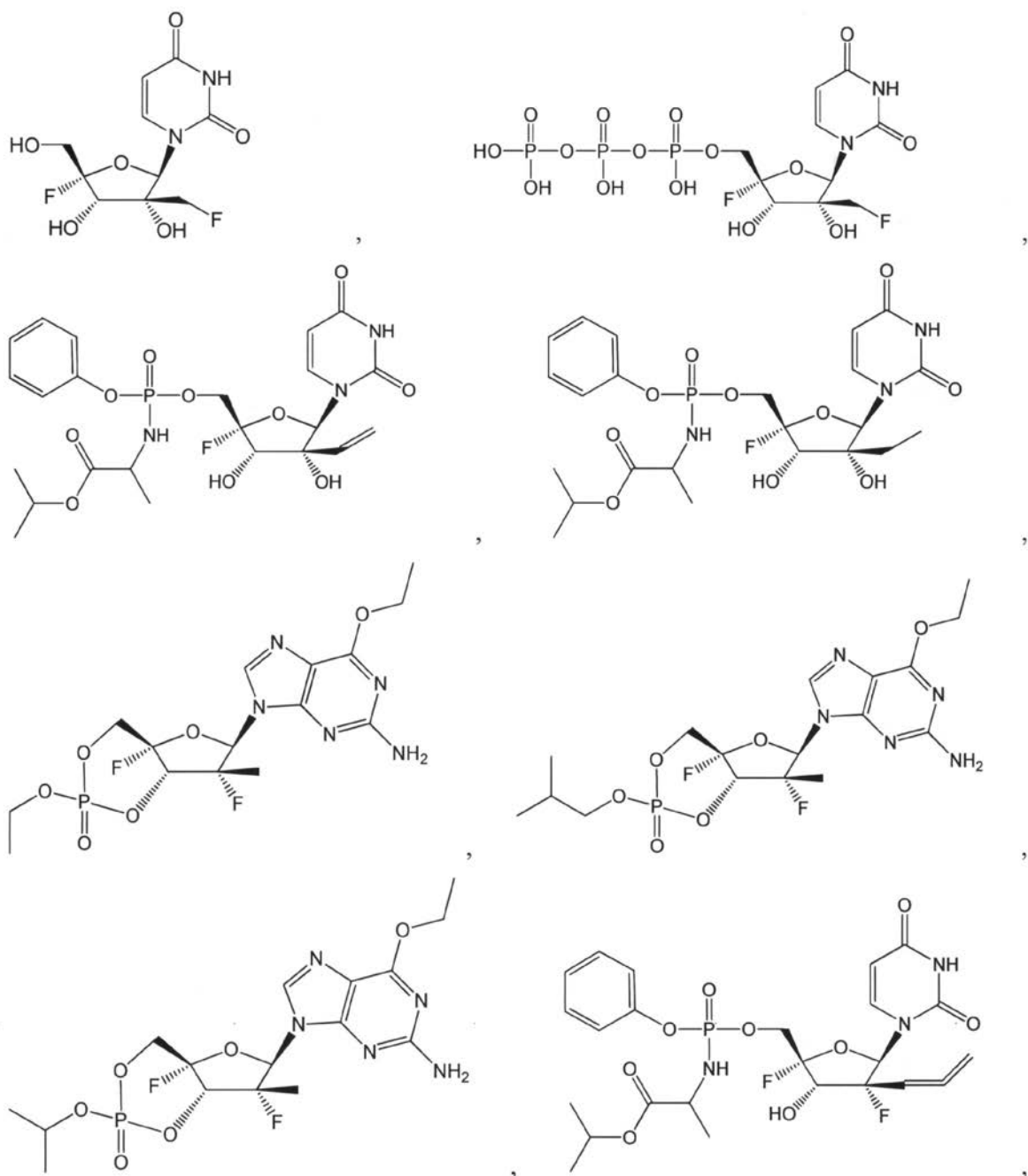


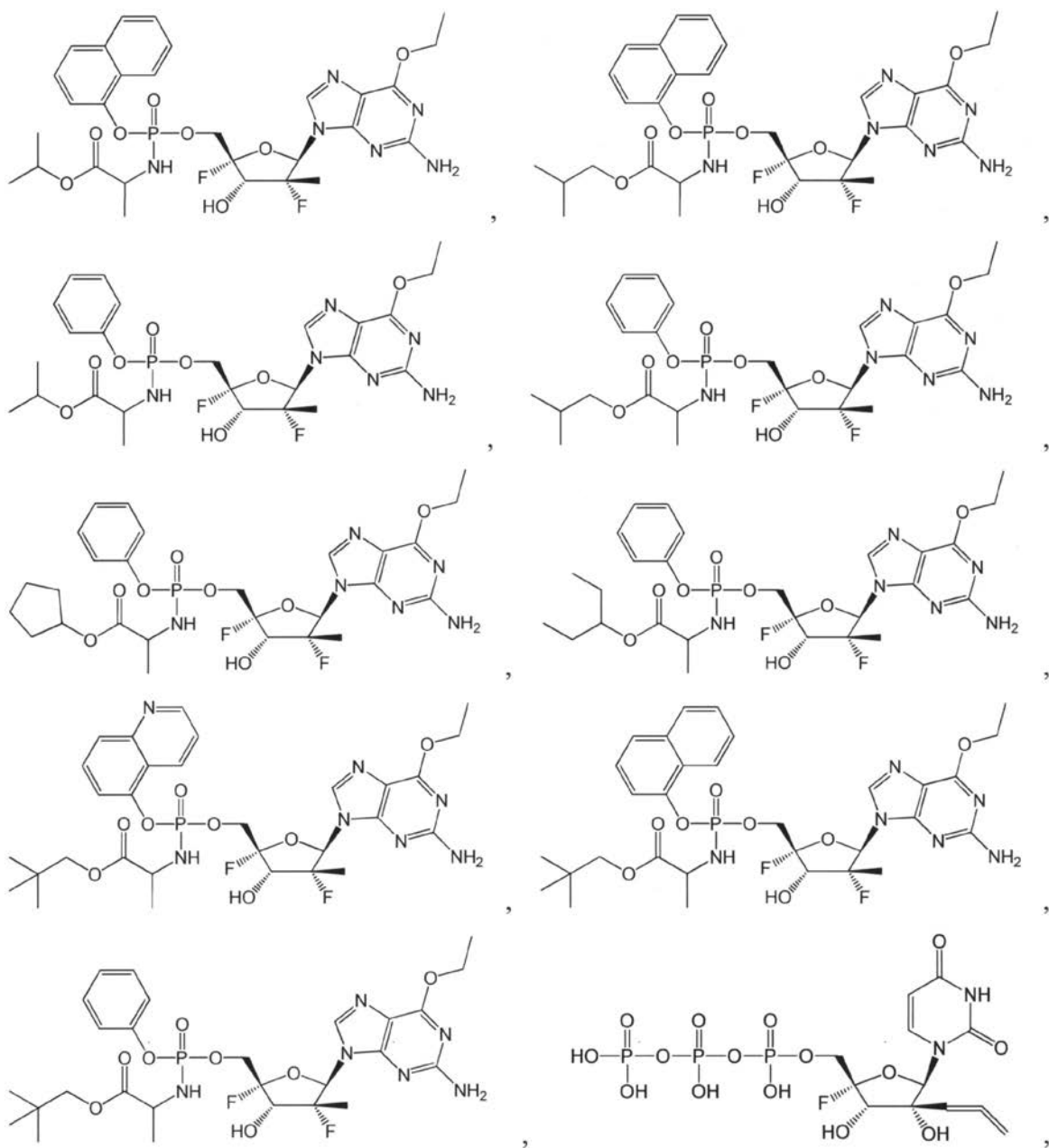


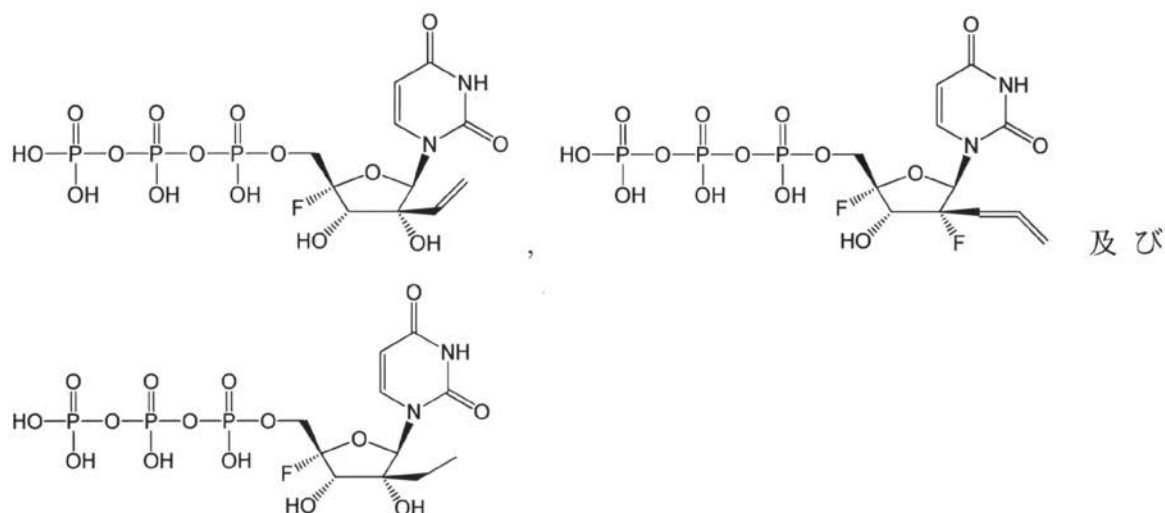












、または上記の薬剂的に許容できる塩からなる群から選択され得ない、前記医薬組成物。

【請求項 3】

R^{2A} がハロゲンであり、 R^{5A} は、OH、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニル、または所望により置換された C_{2-6} アルキニルである、請求項 1 または 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

R^{2A} が非置換 C_{1-4} アルキルまたは非置換 C_{2-4} アルケニルであり、 R^{5A} は、OH、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニル、または所望により置換された C_{2-6} アルキニルである、請求項 1 または 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

R^{2A} が $-CHF_2$ 、 $-(CH_2)_{1-6}Cl$ 、 $-(CH_2)_{1-6}N_3$ 、または $-(CH_2)_{1-6}NH_2$ であり、 R^{5A} が H である、請求項 1 または 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

R^{2A} が $-CHF_2$ 、 $-(CH_2)_{1-6}Cl$ 、 $-(CH_2)_{1-6}N_3$ 、または $-(CH_2)_{1-6}NH_2$ であり、 R^{5A} がハロゲンである、請求項 1 または 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

R^{2A} が $-(CH_2)_{1-6}F$ であり、 R^{5A} は、OH、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニル、または所望により置換された C_{2-6} アルキニルである、請求項 1 または 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

R^{2A} が $-CN$ であり、 R^{5A} は、OH、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニル、または所望により置換された C_{2-6} アルキニルである、請求項 1 または 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

R^{4A} が OH、 $-OC(=O)R^{3B}$ 、または所望により置換された O 結合型アミノ酸である、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

R^{4A} がハロゲン、 N_3 、または $NR^{3B1}R^{3B2}$ である、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

R^{1A} が水素である、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

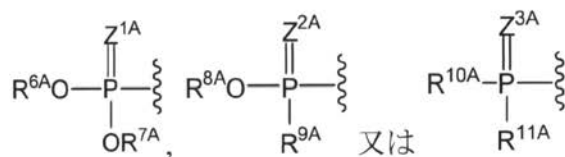
R^{1A} が所望により置換されたアシルまたは所望により置換された O 結合型アミノ酸で

ある、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

R^{1A} が

【化 26】

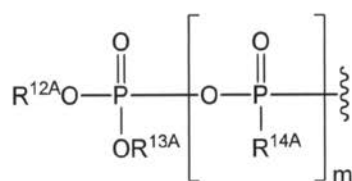


である、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

R^{6A} が

【化 27】



であり、 R^{7A} が不在または水素であり、 m が 0 または 1 である、請求項 13 に記載の医薬組成物。

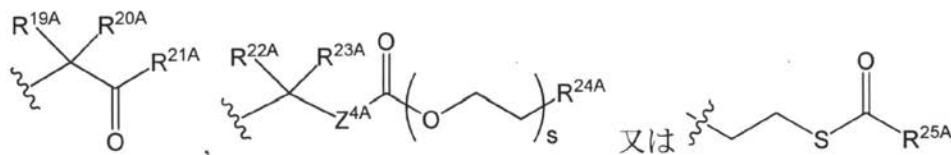
【請求項 15】

R^{6A} および R^{7A} が独立して、所望により置換された C_{1-24} アルキル、所望により置換された C_{2-24} アルケニル、所望により置換された C_{2-24} アルキニル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルキル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルケニル、所望により置換されたアリール、所望により置換されたヘテロアリール、所望により置換されたアリール (C_{1-6} アルキル) である、または、

R^{6A} および R^{7A} は独立して、所望により置換された $^*-(C R^{15A} R^{16A})_p-O-C_{1-24}$ アルキル、または所望により置換された $^*-(C R^{17A} R^{18A})_q-O-C_{1-24}$ アルケニルである、または

R^{6A} および R^{7A} は独立して、

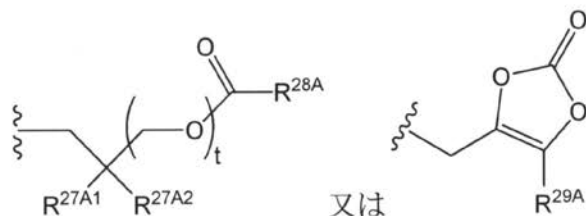
【化 28】



であり、または、

R^{6A} および R^{7A} は独立して、

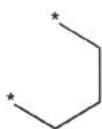
【化 2 9】



であり、または、

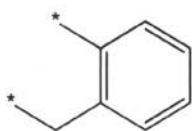
R^{6A} および R^{7A} は一緒になって、所望により置換された

【化 3 0】



および所望により置換された

【化 3 1】



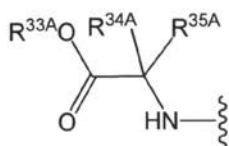
からなる群から選択される部分を形成し、 R^{6A} および R^{7A} に連結された酸素、リン並びに前記部分は 6 員 ~ 10 員の環系を形成する、請求項 13 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

R^{8A} が所望により置換されたアリールまたは所望により置換されたヘテロアリールであり、 R^{9A} が所望により置換された N 結合型アミノ酸または所望により置換された N 結合型アミノ酸エステル誘導体である、または、

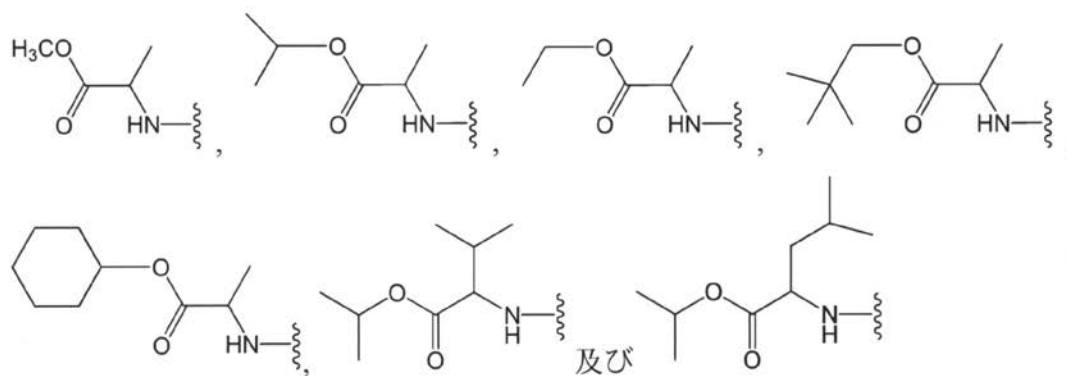
R^{8A} が所望により置換されたアリールまたは所望により置換されたヘテロアリールであり、 R^{9A} が

【化 3 2】



であり、式中、 R^{33A} が水素、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルキル、所望により置換されたアリール、所望により置換されたアリール (C_{1-6} アルキル) および所望により置換されたハロアルキルからなる群から選択され； R^{34A} が水素、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{1-6} ハロアルキル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルキル、所望により置換された C_6 アリール、所望により置換された C_{10} アリールおよび所望により置換されたアリール (C_{1-6} アルキル) からなる群から選択され； R^{35A} が水素または所望により置換された C_{1-4} アルキルであり；あるいは、 R^{34A} および R^{35A} が一緒になって所望により置換された C_{3-6} シクロアルキルを形成しており、好ましくは、 R^{9A} が

【化 3 3】



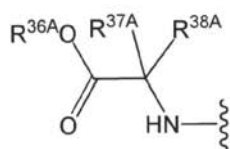
からなる群から選択される、請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

R^{10A} および R^{11A} が独立して所望により置換された N 結合型アミノ酸または所望により置換された N 結合型アミノ酸エステル誘導体である、または、

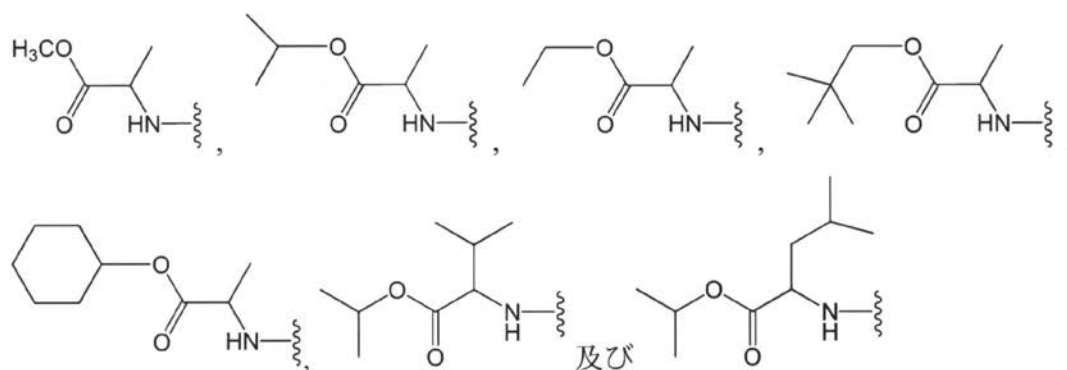
R^{10A} および R^{11A} が独立して

【化 3 4】



であり、式中、 R^{36A} が水素、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルキル、所望により置換されたアリール、所望により置換されたアリール (C_{1-6} アルキル) および所望により置換されたハロアルキルからなる群から選択され； R^{37A} が水素、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{1-6} ハロアルキル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルキル、所望により置換された C_6 アリール、所望により置換された C_{10} アリールおよび所望により置換されたアリール (C_{1-6} アルキル) からなる群から選択され； R^{38A} が水素または所望により置換された C_{1-4} アルキルであり；あるいは、 R^{37A} および R^{38A} が一緒になって所望により置換された C_{3-6} シクロアルキルを形成しており、好ましくは、 R^{10A} および R^{11A} が独立して

【化 3 5】



からなる群から選択される、請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

【化 3 6】

が共に不在であり、 Z^1 が不在であり、 O^1 が OR^{1A} であり、 R^{3A} が H またはハロゲンである、請求項 1 ~ 17 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

【化 3 7】

が共に不在であり、 Z^1 が不在であり、 O^1 が OR^{1A} であり、 R^{3A} が OH、 $-OC(=O)R^{2A}$ または所望により置換された O 結合型アミノ酸である、請求項 1 ~ 17 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

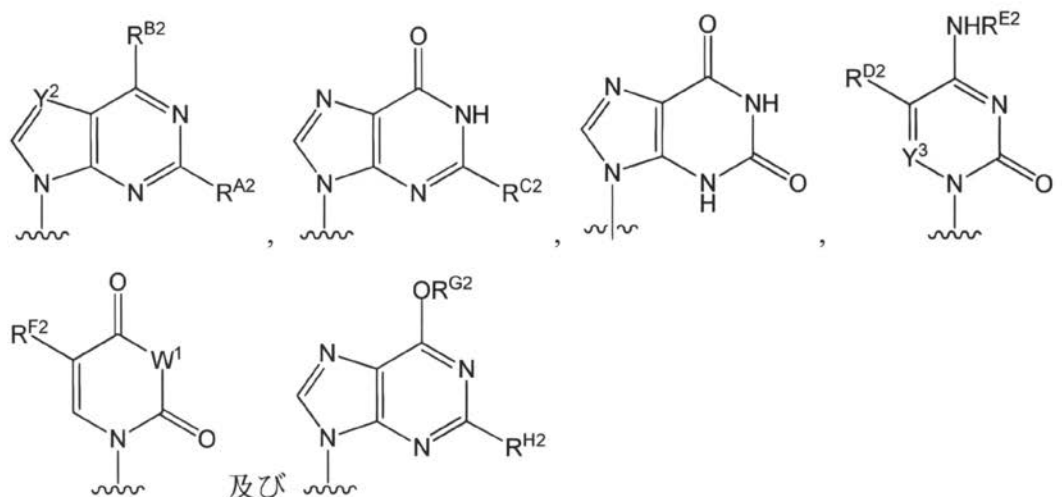
【請求項 20】

R^A が水素であり、 R^{a1} および R^{a2} が共に水素である、請求項 1 ~ 19 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

B^{1A} が

【化 3 8】



からなる群から選択され；

式中、

R^{A2} が水素、ハロゲンおよび NHR^{J2} からなる群から選択され、式中、 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；

R^{B2} がハロゲンまたは NHR^{W2} であり、式中、 R^{W2} は水素、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニル、所望により置換された 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；

R^{C2} が水素または NHR^{O2} であり、式中、 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；

R^{D2} が水素、重水素、ハロゲン、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルおよび所望により置換された C_{2-6} アルキニルからなる群から選択され；

R^{E2} が水素、ヒドロキシ、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された 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；

R^{F2} が水素、ハロゲン、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルおよび所望により置換された C_{2-6} アルキニルからなる群から選択され；

Y^2 および Y^3 が独立して N または CR^{I2} であり、式中、 R^{I2} は水素、ハロゲン、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルおよび所望により置換された C_{2-6} アルキニルからなる群から選択され；

W^1 が NH 、 $-NCH_2-OC(=O)CH(NH_2)-CH(CH_3)_2$ または $-(CH_2)_{1-2}-O-P(=O)(OW^{1A})_2$ であり、式中、 W^{1A} は不在、水素および所望により置換された C_{1-6} アルキルからなる群から選択され；

R^{G2} が所望により置換された C_{1-6} アルキルであり；

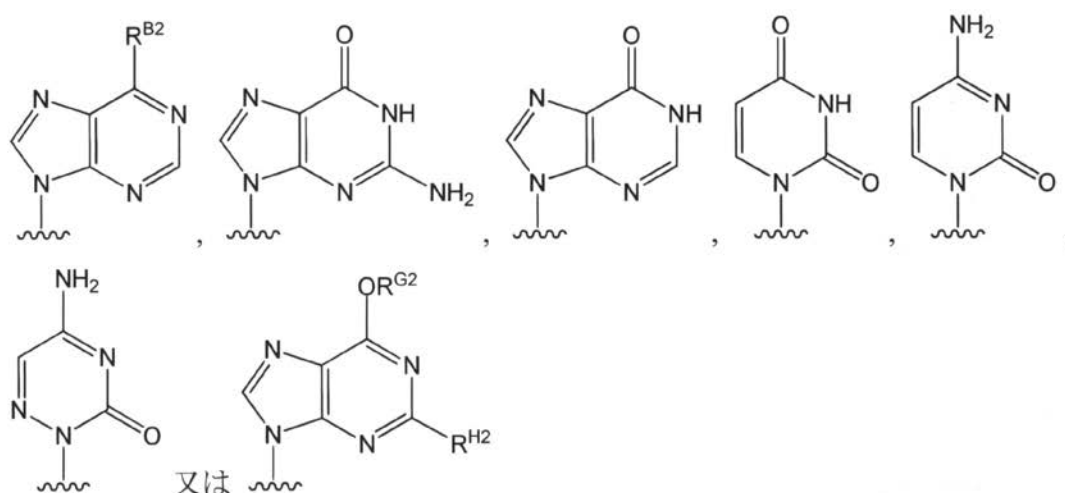
R^{H2} が水素または NHR^{T2} であり、式中、 R^{T2} は独立して水素、 $-C(=O)R^{U2}$ および $-C(=O)OR^{V2}$ からなる群から選択され；

R^{K2} 、 R^{L2} 、 R^{M2} 、 R^{N2} 、 R^{P2} 、 R^{Q2} 、 R^{R2} 、 R^{S2} 、 R^{U2} および R^{V2} が独立して水素、 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 ~ 20 のいずれか一項に記載の 医薬組成物。

【請求項 22】

B^{1A} が

【化 39】

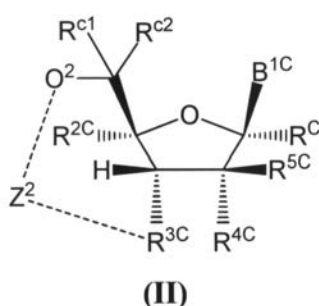


であり、 R^{B2} が NH_2 であり、 R^{G2} が非置換の C_{1-6} アルキルであり、 R^{H2} が NH_2 である、請求項 21 に記載の 医薬組成物。

【請求項 23】

以下の構造を有する式 (II) の化合物またはその薬剂的に許容できる塩であって、

【化 40】



式中、

B^{1C} は所望により置換されたヘテロ環式塩基または保護アミノ基を有する所望により置換されたヘテロ環式塩基であり；

【化 4 1】

が共に不在である場合、 Z^2 は不在であり、 O^2 は OR^{1C} であり、

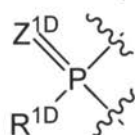
R^{2C} は、ハロ、非置換 C_{2-4} アルキル、非置換 C_{2-4} アルケニル、 $-(CH_2)_1-6F$ 、 $-(CH_2)_1-6N_3$ 、 $-(CH_2)_1-6NH_2$ または $-CN$ であり； R^{5C} は、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルおよび所望により置換された C_{2-6} アルキニルからなる群から選択され、または、 R^{2C} は $-CHF_2$ または $-(CH_2)_1-6Cl$ であり； R^{5C} は H 、ハロ、 OH 、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルおよび所望により置換された C_{2-6} アルキニルからなる群から選択され、

R^{3C} は H 、ハロ、 OH 、 $-OC(=O)R^{''C}$ および所望により置換された O 結合型アミノ酸からなる群から選択され、 R^{4C} は OH 、ハロ、 N_3 、 $-OC(=O)R^{''D}$ 、所望により置換された O 結合型アミノ酸および $NR^{''D1}R^{''D2}$ からなる群から選択され、あるいは、 R^{3C} および R^{4C} は共にカルボニルを介して連結された酸素原子であることで 5 員環を形成し；

【化 4 2】

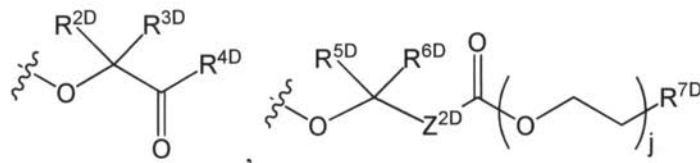
がそれぞれ単結合である場合、 Z^2 は

【化 4 3】



であり、 O^2 は O であり、 R^{3C} は O であり； R^{2C} は、ハロ、 $-CH_2F$ 、 $-(CH_2)_1-6F$ 、 $-(CH_2)_1-6Cl$ 、 $-(CH_2)_1-6N_3$ 、 $-(CH_2)_1-6NH_2$ または $-CN$ であり； R^{4C} は OH 、ハロ、 N_3 、 $-OC(=O)R^{''D}$ 、所望により置換された O 結合型アミノ酸および $NR^{''D1}R^{''D2}$ からなる群から選択され； R^{5C} は、 H 、ハロ、 OH 、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルおよび所望により置換された C_{2-6} アルキニルからなる群から選択され； R^{1D} は O^- 、 OH 、 $-O-$ 所望により置換された C_{1-6} アルキル、

【化 4 4】



からなる群から選択され；

R^{C1} および R^{C2} は独立して水素または重水素であり；

R^C は水素、重水素、非置換 C_{1-3} アルキル、非置換 C_{2-4} アルケニル、非置換 C_{2-3} アルキニルまたはシアノであり；

R^{1C} は水素、所望により置換されたアシル、所望により置換された O 結合型アミノ酸

-



からなる群から選択され；

R^{6C}、R^{7C} および R^{8C} は独立して、不在、水素、所望により置換された C₁₋₂₄ アルキル、所望により置換された C₂₋₂₄ アルケニル、所望により置換された C₂₋₂₄ アルキニル、所望により置換された C₃₋₆ シクロアルキル、所望により置換された C₃₋₆ シクロアルケニル、所望により置換されたアリール、所望により置換されたヘテロアリール、所望により置換されたアリール (C₁₋₆ アルキル)、所望により置換された * - (C R^{15C} R^{16C})_f - O - C₁₋₂₄ アルキル、所望により置換された * - (C R^{17C} R^{18C})_g - O - C₁₋₂₄ アルケニル、

【化 4 6】



からなる群から選択され；あるいは、

R⁶Cは

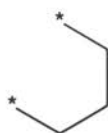
【化 4 7】



であり、 R^7C は不在または水素であり；あるいは、

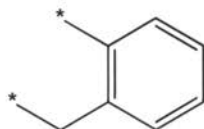
R^6C および R^7C は一緒になって、所望により置換された

【化 4 8】



および所望により置換された

【化 4 9】



からなる群から選択される部分を形成し、 R^{6C} および R^{7C} に連結された酸素、リンおよび前記部分は 6 員 ~ 10 員の環系を形成し；

R^{9C} は、所望により置換された C_{1-24} アルキル、所望により置換された C_{2-24} アルケニル、所望により置換された C_{2-24} アルキニル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルキル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルケニル、 $NR^{30C}R^{31C}$ 、所望により置換された N 結合型アミノ酸および所望により置換された N 結合型アミノ酸エステル誘導体からなる群から選択され；

R^{10C} および R^{11C} は独立して、所望により置換された N 結合型アミノ酸または所望により置換された N 結合型アミノ酸エステル誘導体であり；

R^{12C} および R^{13C} は独立して不在または水素であり；

R^{14C} は O^- 、 OH またはメチルであり；

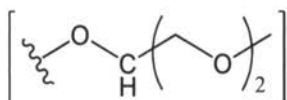
各 R^{15C} 、各 R^{16C} 、各 R^{17C} および各 R^{18C} は独立して、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキルまたはアルコキシであり；

R^{19C} 、 R^{20C} 、 R^{22C} および R^{23C} は独立して、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキルおよび所望により置換されたアリールからなる群から選択され；

R^{21C} は、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキル、所望により置換されたアリール、所望により置換された $-O-C_{1-24}$ アルキル、所望により置換された $-O$ -アリール、所望により置換された $-O$ -ヘテロアリールおよび所望により置換された $-O$ -単環式ヘテロシクリルからなる群から選択され；

R^{24C} は、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキル、所望により置換されたアリール、所望により置換された $-O-C_{1-24}$ アルキル、所望により置換された $-O$ -アリール、所望により置換された $-O$ -ヘテロアリール、所望により置換された $-O$ -単環式ヘテロシクリルおよび

【化 5 0】



からなる群から選択され；

R^{25C} および R^{29C} は独立して、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキルおよび所望により置換されたアリールからなる群から選択され；

R^{27C1} および R^{27C2} は独立して、

【化 5 1】



、所望により置換された C_{2-8} オルガニルカルボニル、所望により置換された C_{2-8} アルコキシカルボニルおよび所望により置換された 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；

R^{28C} は水素、所望により置換された C_{1-24} アルキル、所望により置換された C_{2-24} アルケニル、所望により置換された C_{2-24} アルキニル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルキルおよび所望により置換された C_{3-6} シクロアルケニルからなる群から選択され；

R^{30C} および R^{31C} は独立して、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキル、所望により置換された C_{2-24} アルケニル、所望により置換された C_{2-24} アルキ

ニル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルキル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルケニルおよび所望により置換されたアリール (C_{1-4} アルキル) からなる群から選択され；

R^{1C} および各 R^{2D} は独立して所望により置換された $C_{1-2,4}$ アルキルであり；

各 R^{2D1} および各 R^{2D2} は独立して水素または所望により置換された $C_{1-2,4}$ アルキルであり；

R^{2D} 、 R^{3D} 、 R^{5D} および R^{6D} は独立して、水素または所望により置換された $C_{1-2,4}$ アルキルであり、

R^{4D} および R^{7D} は独立して、水素、所望により置換された $C_{1-2,4}$ アルキル、所望により置換されたアリール、所望により置換された $-O-C_{1-2,4}$ アルキル、所望により置換された $-O-$ アリール、所望により置換された $-O-$ ヘテロアリール、および所望により置換された $-O-$ 単環式ヘテロシクリルからなる群より選択され、

e は 0 または 1 であり；

f および g は独立して 1、2 または 3 であり；

h および j は独立して 0、1、2 または 3 であり；

b は 1 または 2 であり；

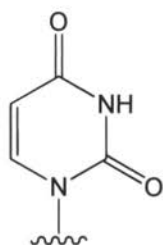
Z^{1C} 、 Z^{2C} 、 Z^{3C} 、 Z^{4C} 、 Z^{1D} および Z^{2D} は独立して O または S であり；

ただし、 R^{2C} がハロゲンであり；

【化 5 2】

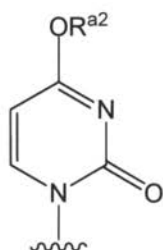
が共に不在であり； Z^2 が不在であり； O^2 が OR^{1C} であり； B^{1C} が所望により置換された

【化 5 3】



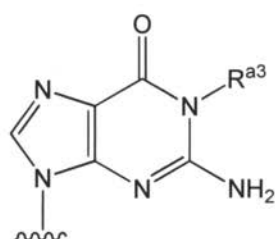
、所望により置換された

【化 5 4】



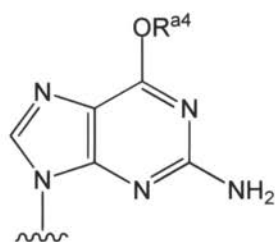
、所望により置換された

【化 5 5】



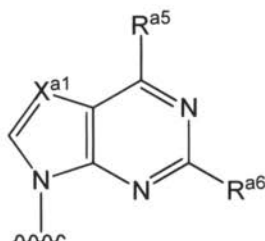
、所望により置換された

【化 5 6】



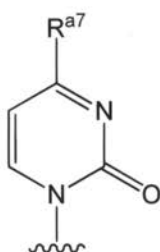
、所望により置換された

【化 5 7】



および所望により置換された

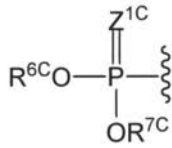
【化 5 8】



からなる群から選択され、式中、 R^{a2} が所望により置換された C_{1-6} アルキルまたは所望により置換された C_{3-6} シクロアルキルであり、 R^{a3} および R^{a4} が独立して水素、非置換 C_{1-6} アルキル、非置換 C_{3-6} アルケニル、非置換 C_{3-6} アルキニルおよび非置換 C_{3-6} シクロアルキルからなる群から選択され、 R^{a5} が NHR^{a8} であり、 R^{a6} が水素、ハロゲンまたは NHR^{a9} であり； R^{a7} が NHR^{a10} であり； R^{a8} が水素、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{3-6} アルケニル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルキル、 $-C(=O)R^{a11}$ および $-C(=O)OR^{a12}$ からなる群から選択され； R^{a9} が水素、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{3-6} アルケニル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルキル、 $-C(=O)R^{a13}$ および $-C(=O)OR^{a14}$ からなる群から選択され； R^{a10} が水素、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{3-6} アルケニル、所望により置換された C_{3-6} シクロアルキル、 $-C(=O)R^{a15}$ および $-C(=O)OR^{a16}$ からなる群から選択され； X^{a1} が N または $-CR^{a17}$ であり； R^{a17} が水素、ハロゲン、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルおよび所望により置換された C_{2-6} アルキニルからなる群から選択され； R^{a11} 、 R^{a12} 、 R^{a13} 、 R^{a14} 、 R^{a15} および R^{a16} が独立して 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) およびヘテロシクリル (C_{1-6} アルキル) からなる群から選択される場合； R^3 は H、ハロおよび所望により置換された O 結合型アミノ酸からなる群から選択され； R^4

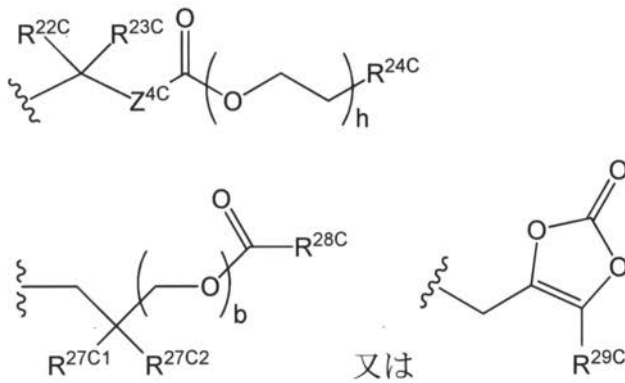
C は OH 、ハロ、 N_3 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}''^D$ 、所望により置換された O 結合型アミノ酸および NR''^D からなる群から選択され；あるいは、 R^{3C} は H 、ハロ、 OH 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}''^C$ および所望により置換された O 結合型アミノ酸からなる群から選択され； R^{4C} は所望により置換された O 結合型アミノ酸であり；あるいは、 R^{1C} は

【化 5 9】



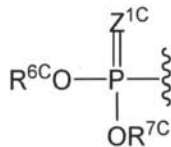
であり、式中、 R^{6C} および R^{7C} は独立して、 h が 1、2 または 3 である

【化 6 0】



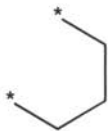
であり；あるいは、 R^{1C} は

【化 6 1】



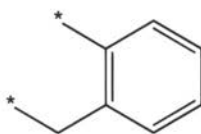
であり、式中、 R^{6C} および R^{7C} は一緒になって、所望により置換された

【化 6 2】



および所望により置換された

【化 6 3】



からなる群から選択される部分を形成し、 R^{6C} および R^{7C} に連結された酸素、リンおよび前記部分は 6 員～10 員の環系を形成し；

ただし、 R^{2C} が非置換 C_{1-4} アルキル、非置換 C_{2-4} アルケニル、非置換 C_{2-4} アルキニル、 $-(\text{CH}_2)_{1-6}$ F、 $-(\text{CH}_2)_{1-6}$ Cl、 $-(\text{CH}_2)_{1-6}$ N₃ または $-(\text{CH}_2)_{1-6}$ NH₂ であり；

【化 6 4】

が共に不在であり； Z^{2C} が不在であり； O^{2C} が OR^{1C} であり； R^{3C} が OH 、 $-OC(=O)R^{5C}$ または所望により置換された O 結合型アミノ酸であり； R^{4C} がハ口である場合； R^{5C} は所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルおよび所望により置換された C_{2-6} アルキニルからなる群から選択され；

ただし、 R^{2C} が $-(CH_2)_{1-6}-C(=O)-$ であり；

【化 6 5】

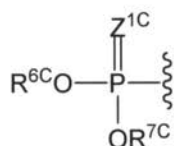
が共に不在であり； Z^{2C} が不在であり； O^{2C} が OR^{1C} であり； R^{4C} がハ口であり； R^{5C} が H またはハ口である場合； R^{3C} は H またはハ口であり；

ただし、 R^{2C} が $-(CH_2)_{1-6}-C(=O)-$ であり；

【化 6 6】

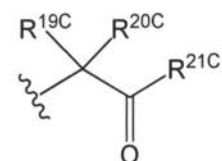
が共に不在であり； Z^{2C} が不在であり； O^{2C} が OR^{1C} であり； R^{3C} が OH 、 $-OC(=O)R^{5C}$ または所望により置換された O 結合型アミノ酸であり； R^{4C} がハ口であり； R^{5C} が H またはハ口であり； R^{1C} が

【化 6 7】



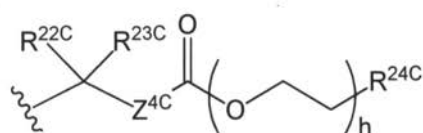
である場合、 R^{6C} および R^{7C} のうち少なくとも一方は、 R^{21C} が独立して所望により置換された $-O-$ ヘテロアリールおよび所望により置換された $-O-$ 単環式ヘテロシクリルからなる群から選択される

【化 6 8】



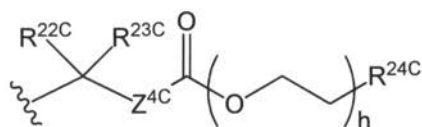
であり；あるいは、 R^{6C} および R^{7C} のうち少なくとも一方は、 s が 1、2 または 3 である

【化 6 9】



であり；あるいは、 R^{6C} および R^{7C} のうち少なくとも一方は、 s が 0 であり、 R^{24C} が所望により置換された $-O-$ ヘテロアリールまたは所望により置換された $-O-$ 単環式ヘテロシクリルである

【化 7 0】



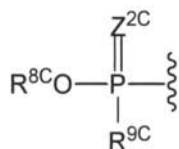
であり；

ただし、 R^{2C} が $-(CH_2)_{1-6}-C(=O)-$ であり；

【化 7 1】

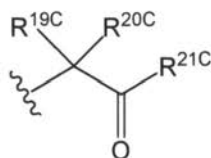
が共に不在であり； Z^2 が不在であり； O^2 が OR^{1C} であり； R^{3C} が OH 、 $-OC(=O)R^{5C}$ または所望により置換された O 結合型アミノ酸であり； R^{4C} がハロゲンであり； R^{5C} が H またはハロゲンであり； R^{1C} が

【化 7 2】



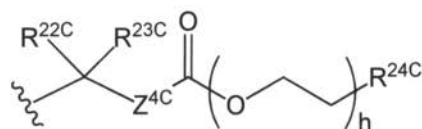
である場合； R^{8C} は、 R^{21C} が独立して所望により置換された $-O-$ ヘテロアリールおよび所望により置換された $-O-$ 単環式ヘテロシクリルからなる群から選択される

【化 7 3】



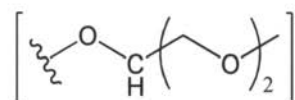
であり；あるいは、 R^{8C} は、 s が 1、2 または 3 である

【化 7 4】



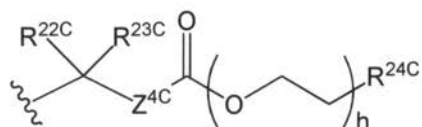
であり；あるいは、 R^{8C} は、 s が 0 であり、 R^{24C} が所望により置換された $-O-$ ヘテロアリール、所望により置換された $-O-$ 単環式ヘテロシクリルまたは

【化 7 5】



である

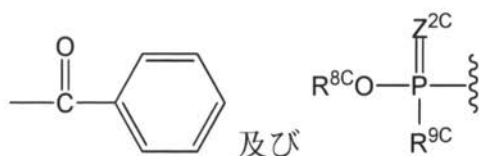
【化 7 6】



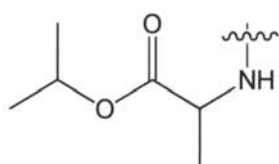
であり、
 ただし、
 【化 7 7】

が共に不在であり； Z^{2C} が不在であり； O^{2C} が OR^{1C} であり； R^{2C} がフルオロであり； R^{3C} が OH または $-OC(=O)R^{11C}$ であり； R^{4C} がフルオロであり； R^{5C} がメチル、エチルまたはエテニルである場合； R^{1C} は H 、

【化 7 8】



からなる群から選択され得ず、式中、 R^{8C} は非置換アリールであり； R^{9C} は
 【化 7 9】



であり、 Z^{2C} は酸素である、
 前記式 (II) の化合物またはその薬剂的に許容できる塩。

【請求項 2 4】

R^{2C} がハロであり、 R^{5C} が所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルまたは所望により置換された C_{2-6} アルキニルである、請求項 2 3 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

R^{2C} が非置換 C_{1-4} アルキルまたは非置換 C_{2-4} アルケニルであり、 R^{5C} が所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルまたは所望により置換された C_{2-6} アルキニルである、請求項 2 3 に記載の化合物。

【請求項 2 6】

R^{2D} が $-CHF_2$ または $-(CH_2)_{1-6}Cl$ であり、 R^{5C} が所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルまたは所望により置換された C_{2-6} アルキニルである、請求項 2 3 に記載の化合物。

【請求項 2 7】

R^{2C} が $-(CH_2)_{1-6}F$ 、 $-(CH_2)_{1-6}N_3$ 、 $-(CH_2)_{1-6}NH_2$ または $-CN$ であり、 R^{5C} が H 、ハロ、 OH 、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルまたは所望により置換された C_{2-6} アルキニルである、請求項 2 3 に記載の化合物。

【請求項 2 8】

【化 8 0】

が共に不在であり、 Z^{2C} が不在であり、 O^{2C} が OR^{1C} であり、 R^{3C} がハロである、請求項 2 3 ~ 2 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 9】

【化 8 1】

が共に不在であり、 Z^2 が不在であり、 O^2 が OR^{1C} であり、 R^{3C} が H である、請求項 23 ~ 27 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 30】

【化 8 2】

が共に不在であり、 Z^2 が不在であり、 O^2 が OR^{1C} であり、 R^{3C} が OH、 $-OC(=O)R''^C$ または所望により置換された O 結合型アミノ酸である、請求項 23 ~ 27 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 31】

R^{4C} がハロ、 N_3 、または $NR''^{D1}R''^{D2}$ である、請求項 23 ~ 30 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 32】

R^{4C} が OH、 $-OC(=O)R''^D$ または所望により置換された O 結合型アミノ酸である、請求項 23 ~ 30 のいずれか一項に記載の化合物。

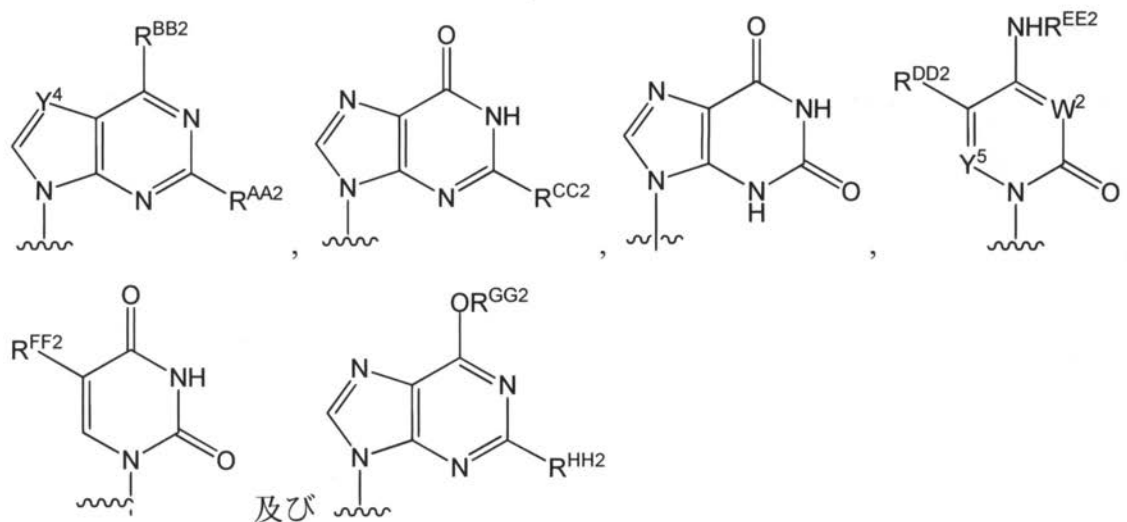
【請求項 33】

R^C が水素であり、 R^{C1} および R^{C2} が共に水素である、請求項 23 ~ 32 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 34】

B^{1C} が、

【化 8 3】



からなる群から選択され；

式中、

R^{AA2} が水素、ハロゲンおよび NHR^{JJ2} からなる群から選択され、式中、 R^{JJ2} は水素、 $-C(=O)R^{KK2}$ および $-C(=O)OR^{LL2}$ からなる群から選択され；

R^{BB2} がハロゲンまたは NHR^{WW2} であり、式中、 R^{WW2} は水素、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニル、所望により置換された C_{3-8} シクロアルキル、 $-C(=O)R^{MM2}$ および $-C(=O)OR^{NN2}$ からなる群から選択され；

R^{CC2} が水素または NHR^{OO2} であり、式中、 R^{OO2} は水素、 $-C(=O)R^{PP2}$ および $-C(=O)OR^{QQ2}$ からなる群から選択され；

R^{DD2} が水素、重水素、ハロゲン、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルおよび所望により置換された C_{2-6} アルキニルからなる群から選択され；

R^{EE2} が水素、ヒドロキシ、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{3-8} シクロアルキル、 $-C(=O)R^{RR2}$ および $-C(=O)OR^{SS2}$ からなる群から選択され；

R^{FF2} が水素、ハロゲン、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} アルケニルおよび所望により置換された C_{2-6} アルキニルからなる群から選択され；

Y^4 および Y^5 が独立して N または CR^{II2} であり、式中、 R^{II2} は水素、ハロゲン、所望により置換された C_{1-6} アルキル、所望により置換された C_{2-6} - アルケニルおよび所望により置換された C_{2-6} - アルキニルからなる群から選択され；

W^2 が NH 、 $-NCH_2-OC(=O)CH(NH_2)-CH(CH_3)_2$ または $-(CH_2)_1-2-O-P(=O)(OW^{2C})_2$ であり、式中、 W^{2C} は不在、水素および所望により置換された C_{1-6} アルキルからなる群から選択され；

R^{GG2} が所望により置換された C_{1-6} アルキルであり；

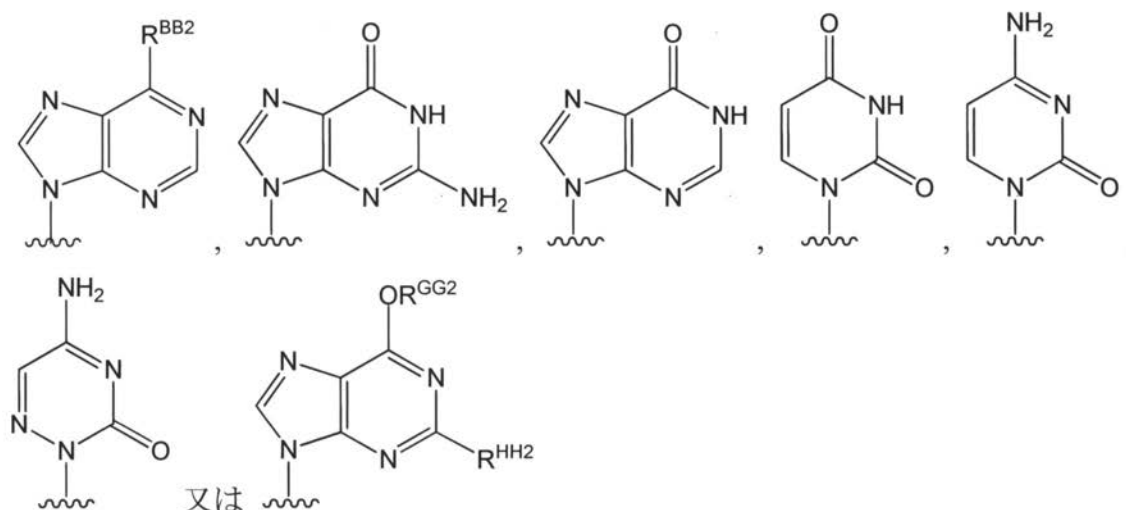
R^{HH2} が水素または NHR^{TT2} であり、式中、 R^{TT2} は独立して水素、 $-C(=O)R^{UU2}$ および $-C(=O)OR^{VV2}$ からなる群から選択され；

R^{KK2} 、 R^{LL2} 、 R^{MM2} 、 R^{NN2} 、 R^{PP2} 、 R^{QQ2} 、 R^{RR2} 、 R^{SS2} 、 R^{UU2} および R^{VV2} が独立して水素、 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 23 ~ 33 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 35】

B^{1C} が

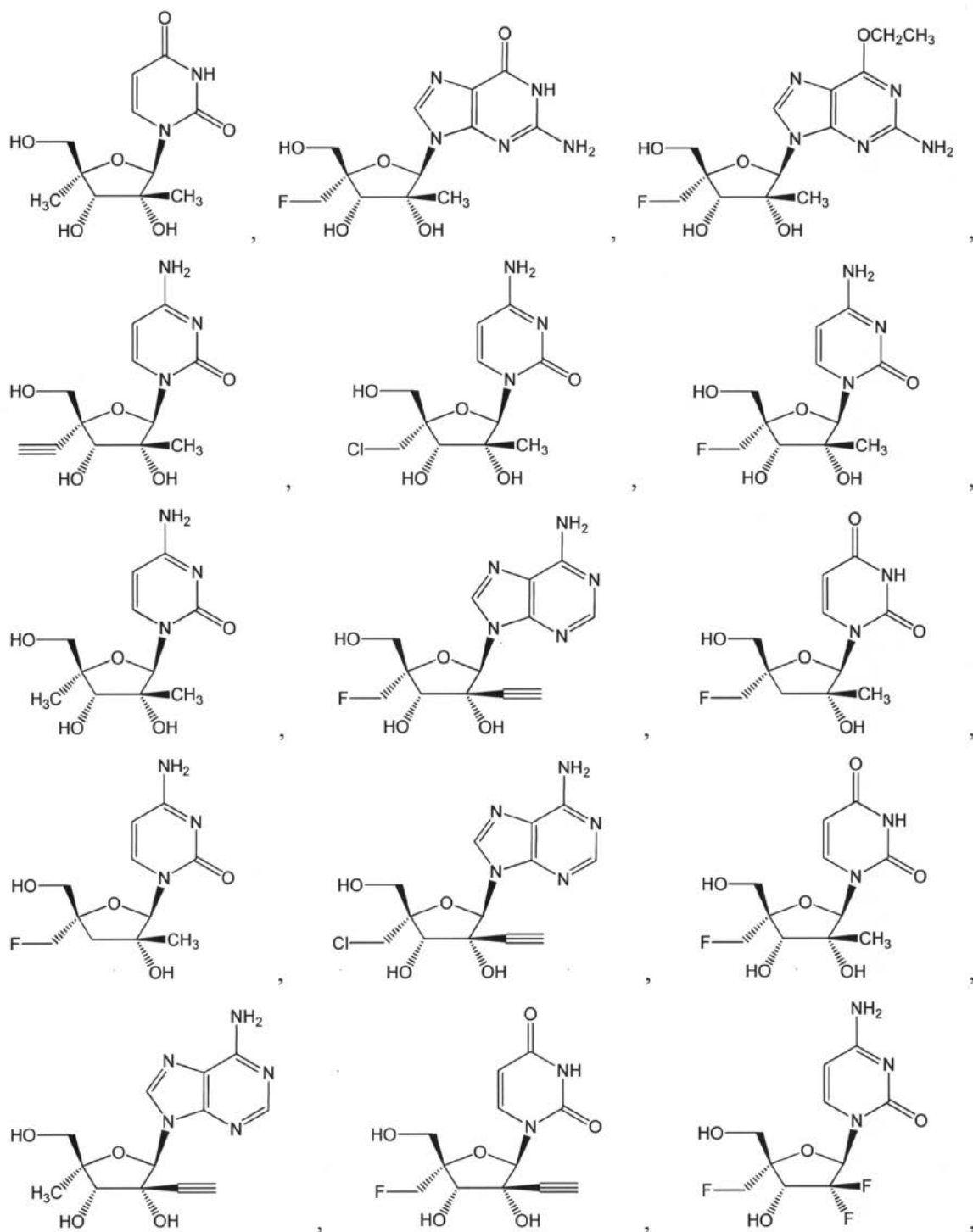
【化 84】

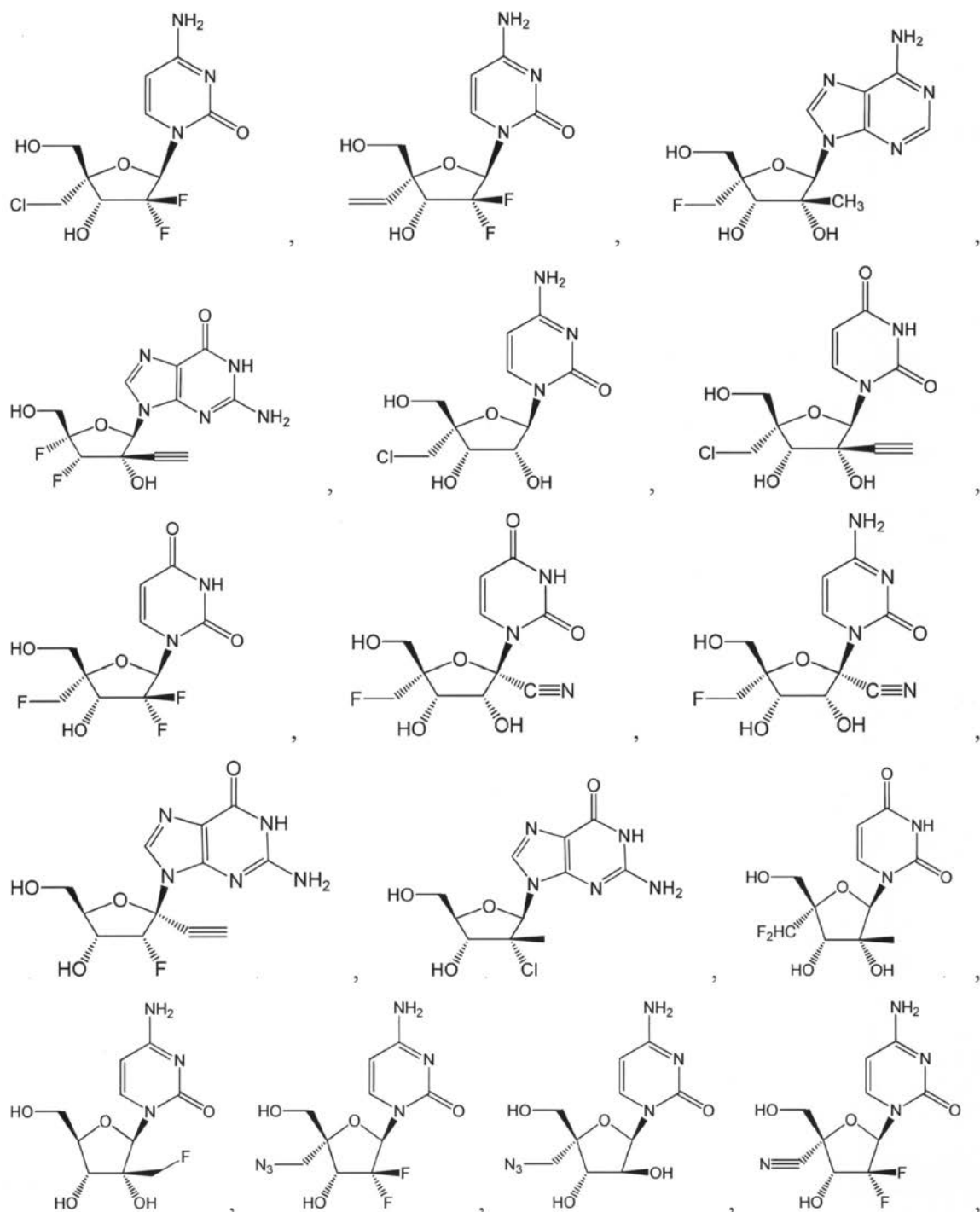


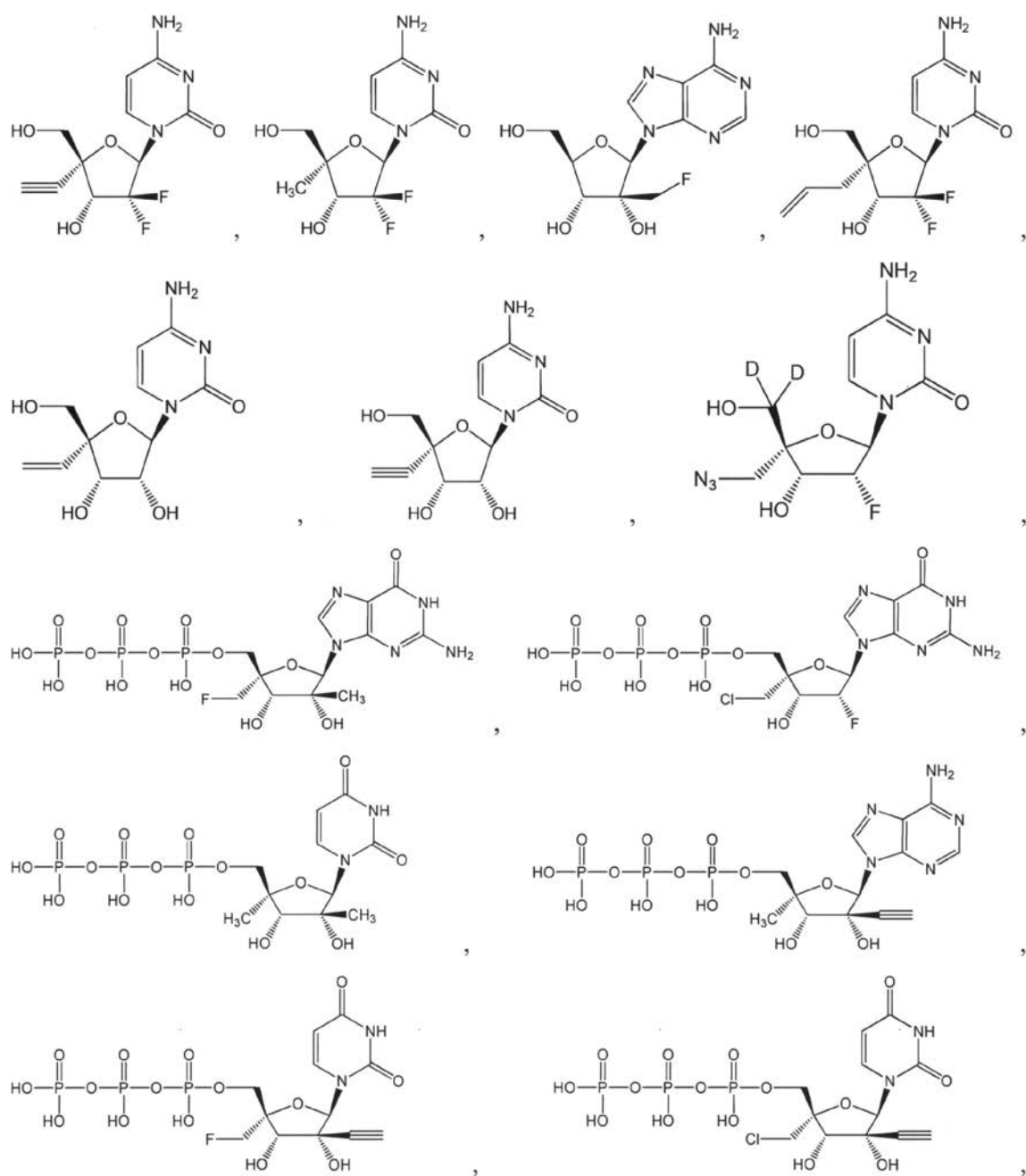
であり、 R^{BB2} が NH_2 であり、 R^{GG2} が非置換の C_{1-6} アルキルであり、 R^{HH2} が NH_2 である、請求項 34 に記載の化合物。

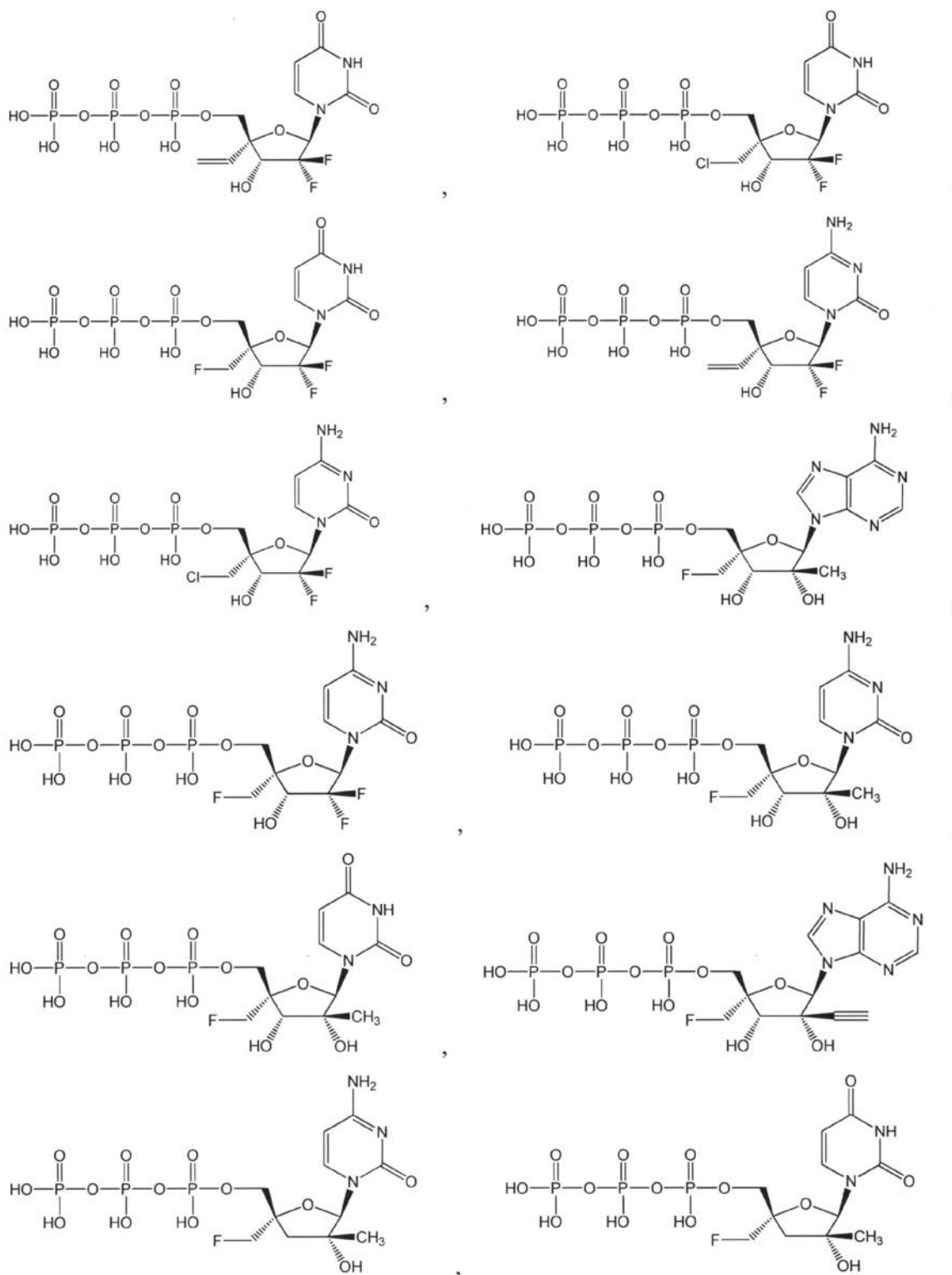
【請求項 36】

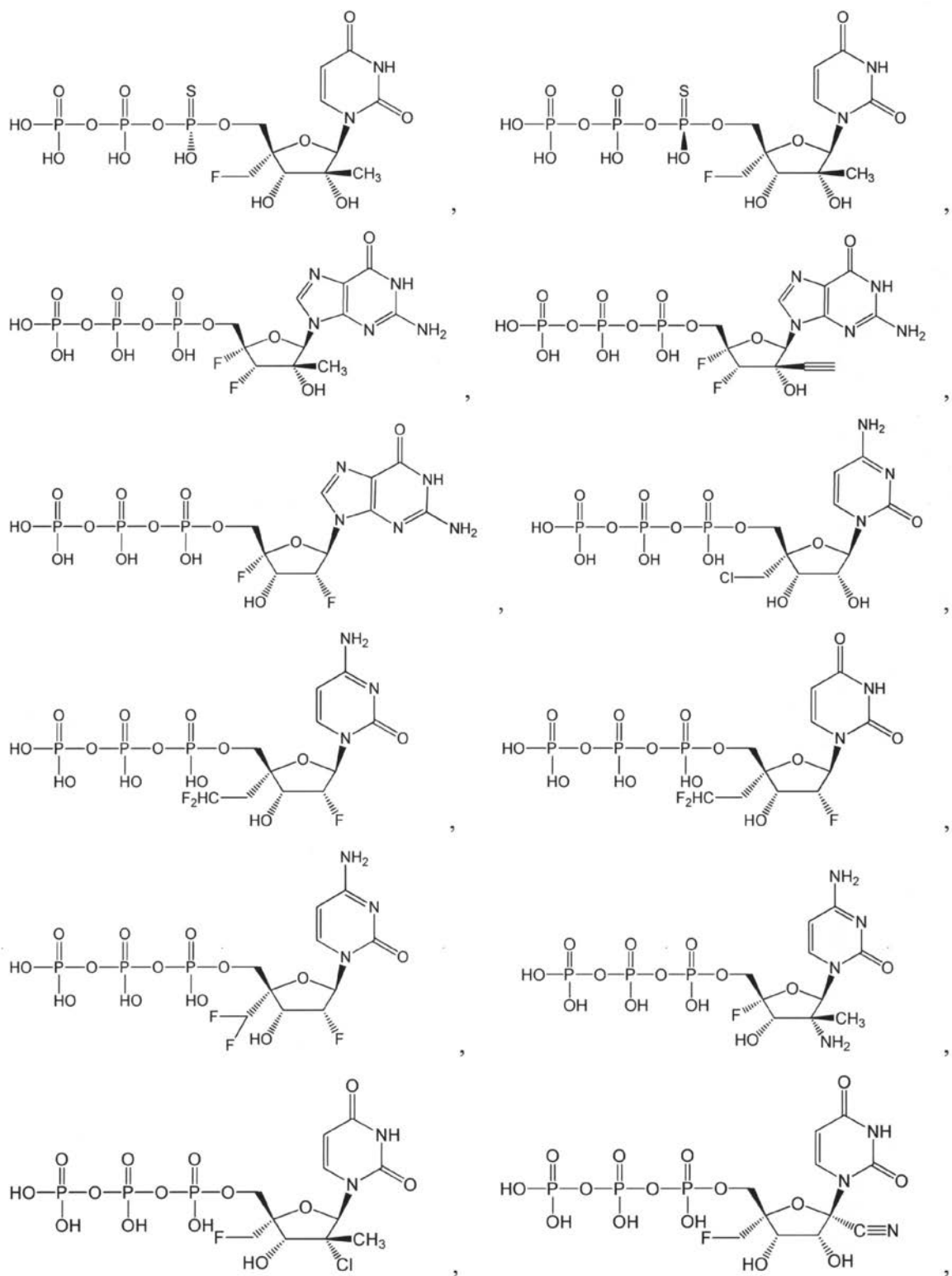
【化 8 5】

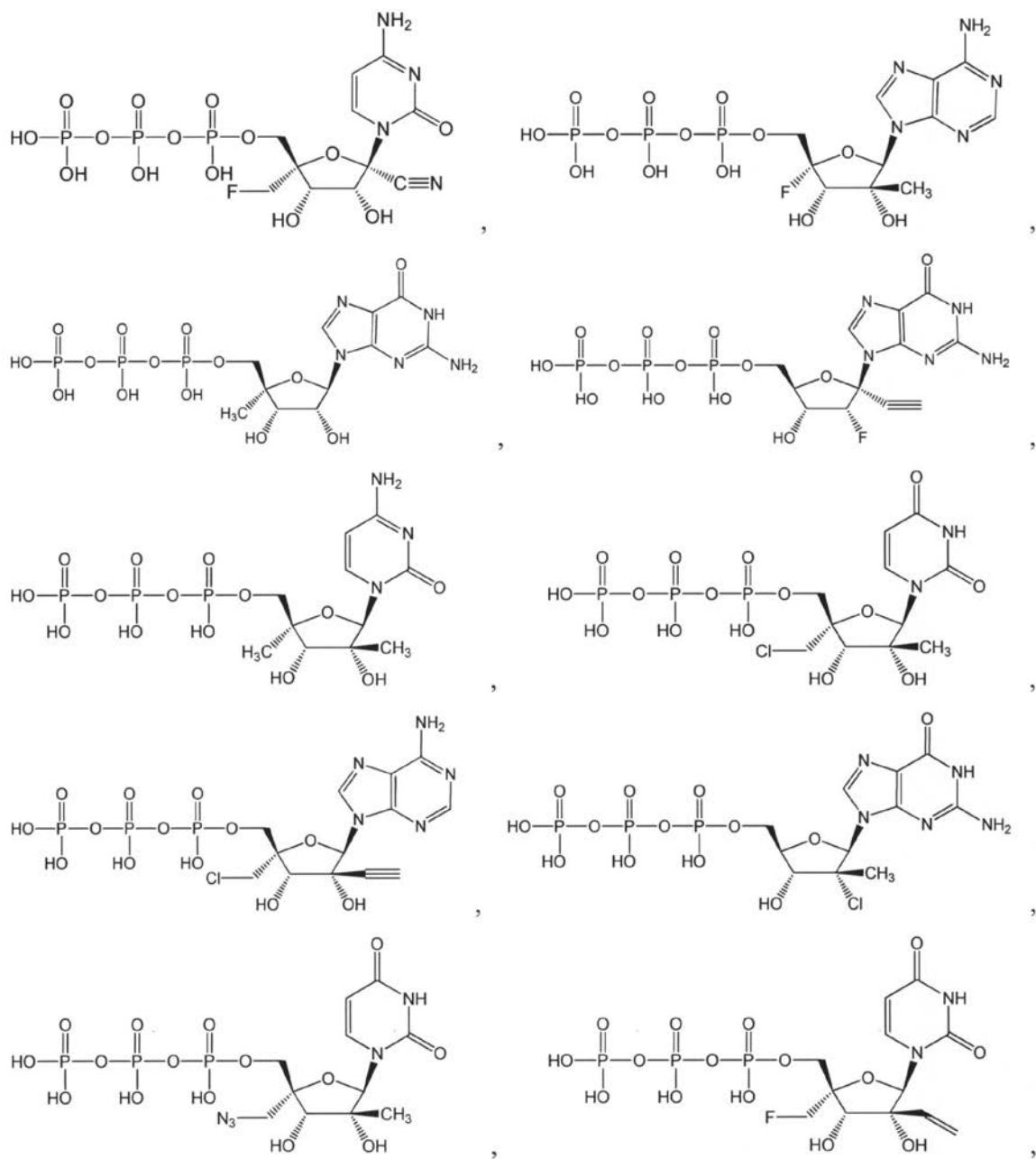


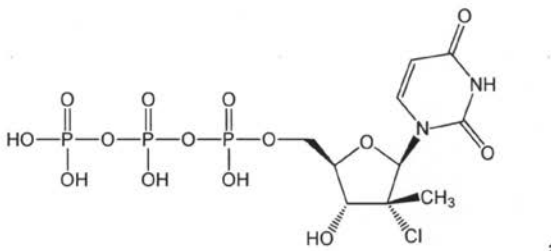
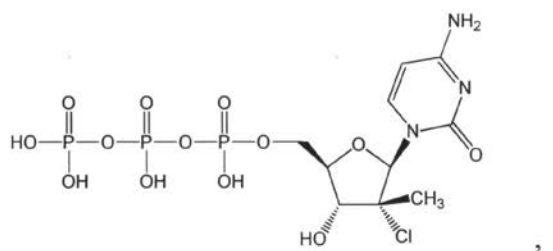
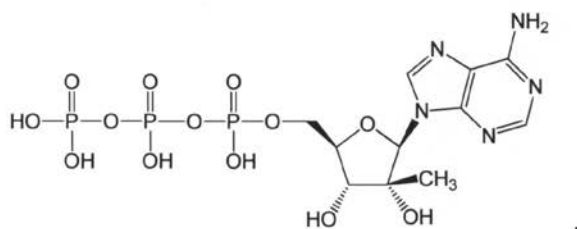
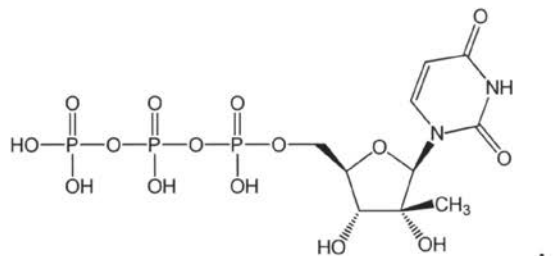
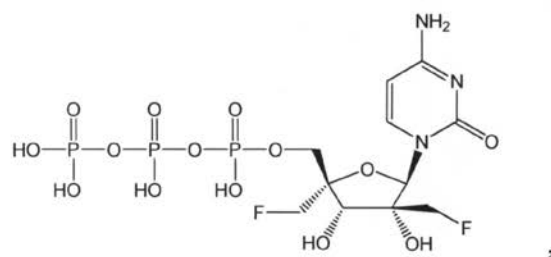
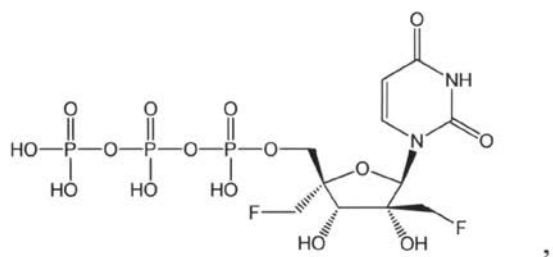
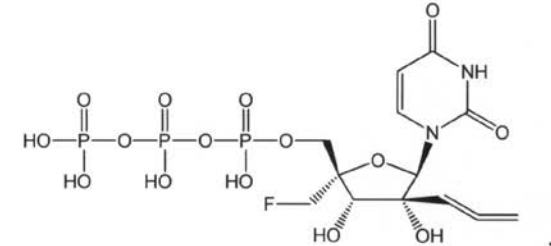
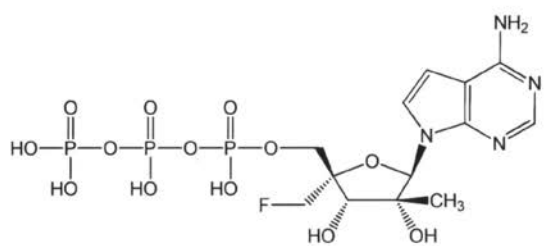
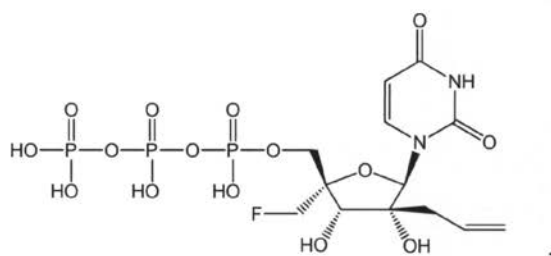
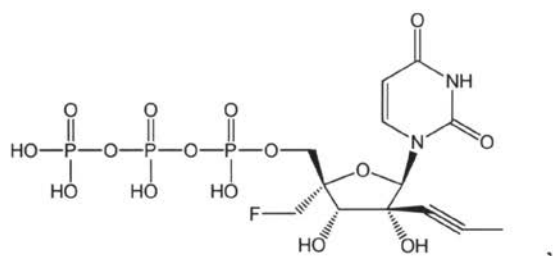


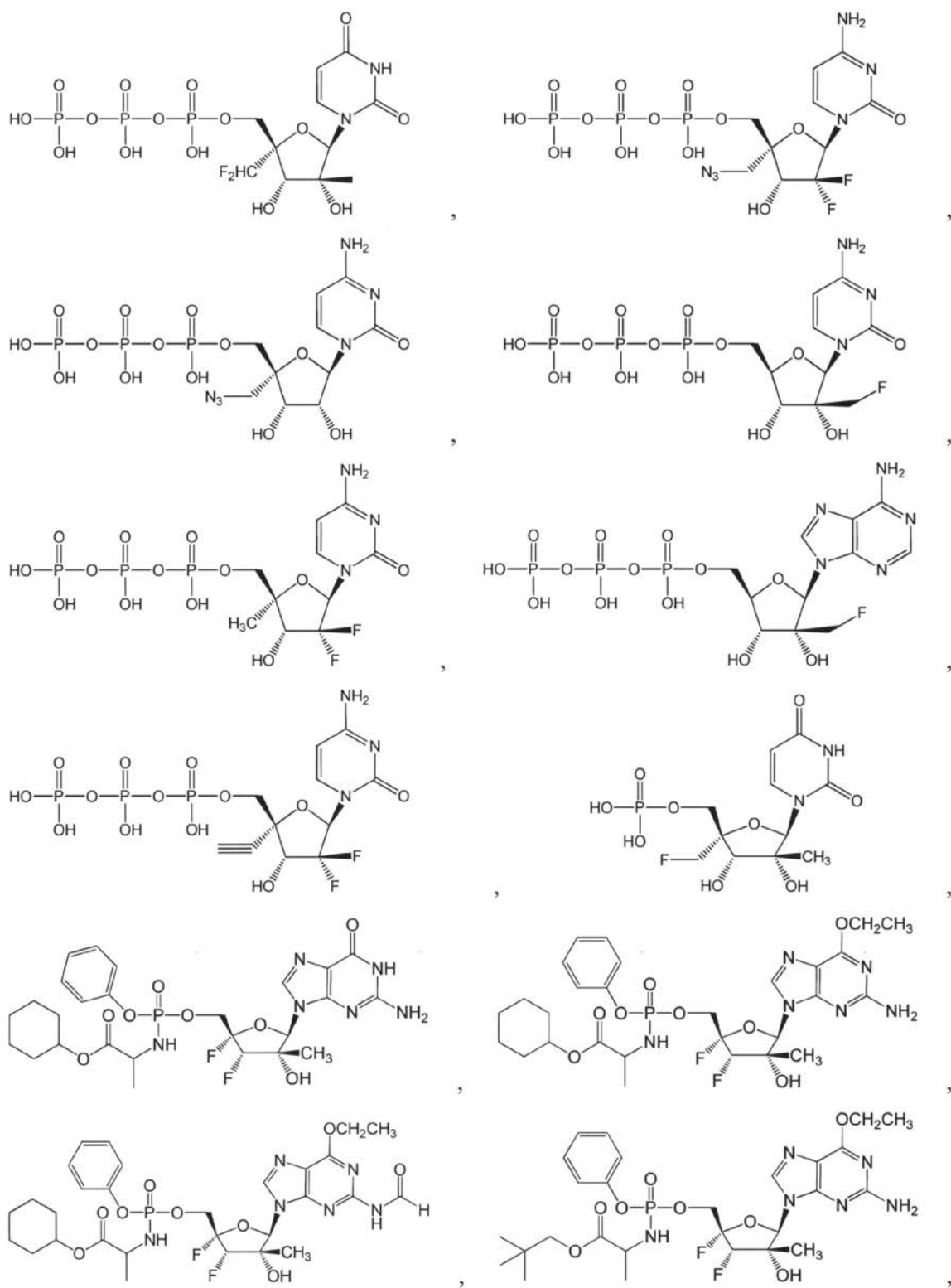


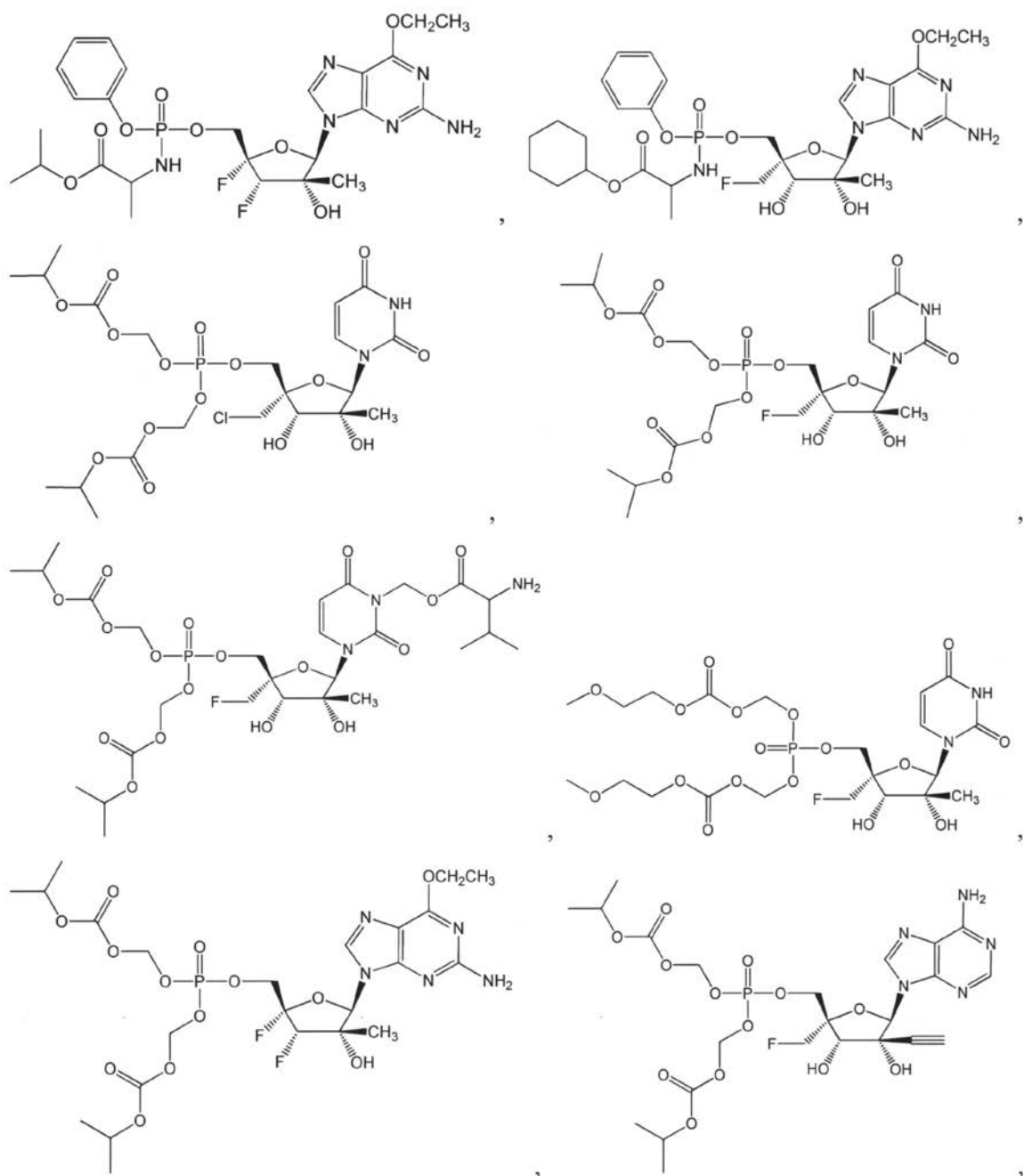


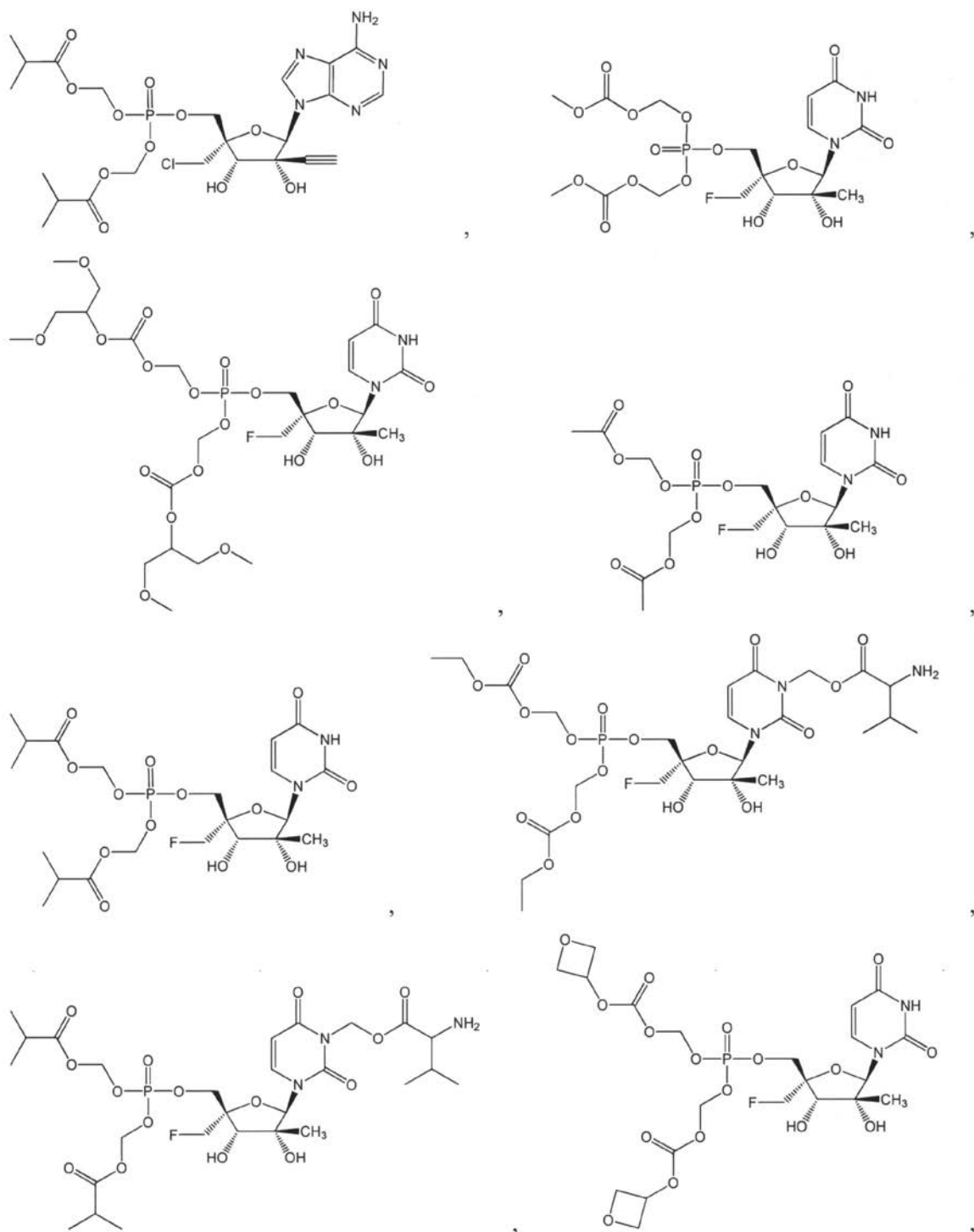


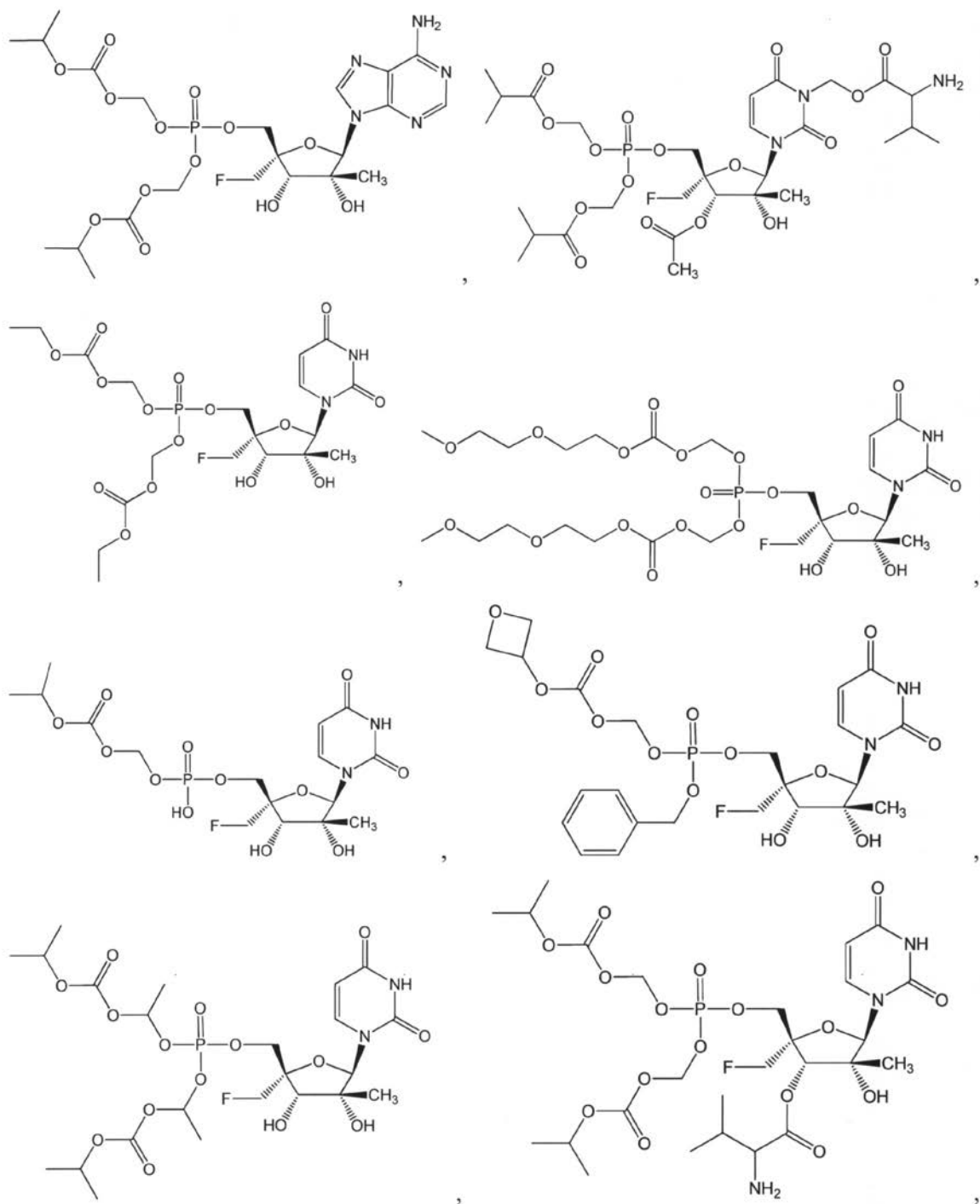


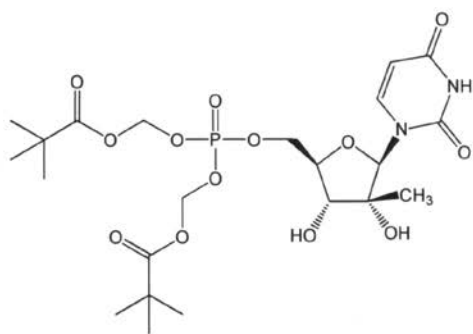




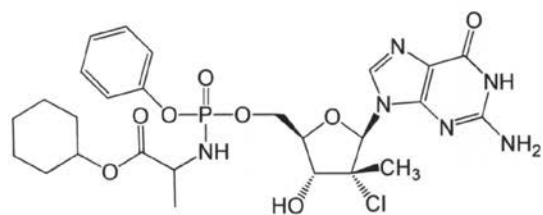




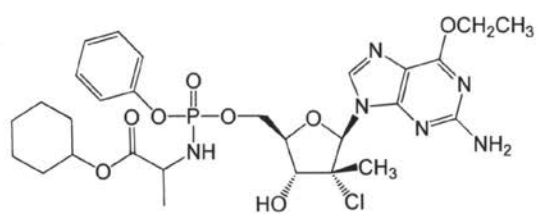




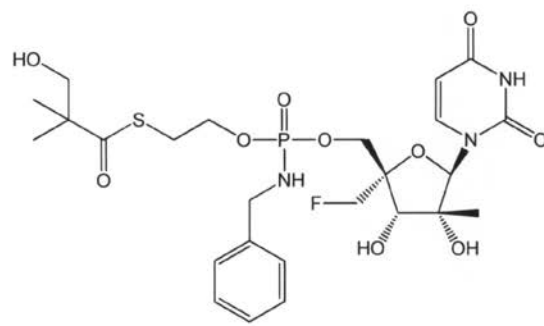
,



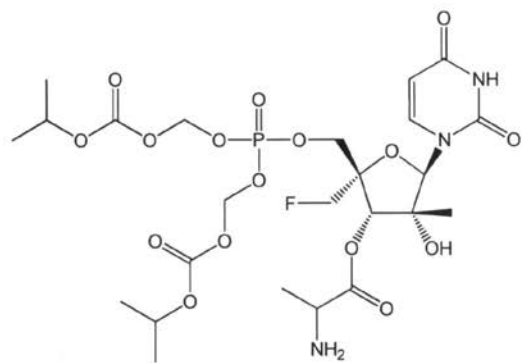
,



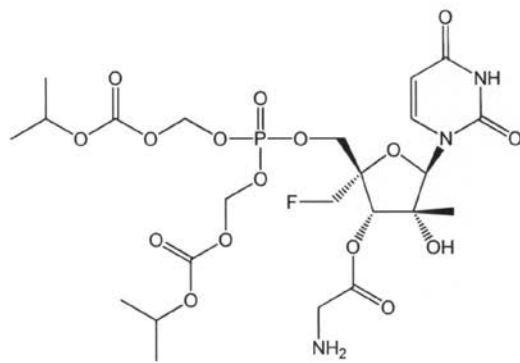
,



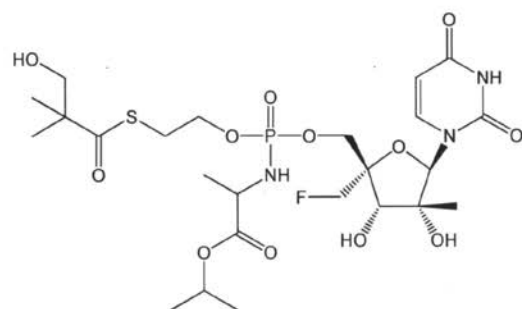
,



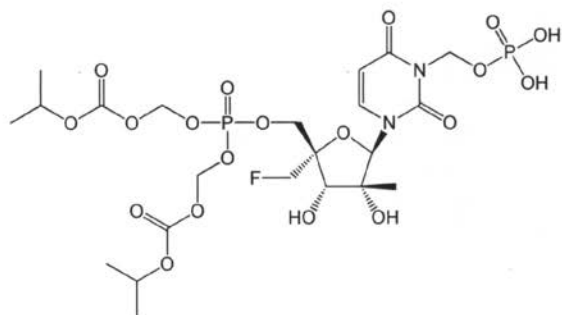
,



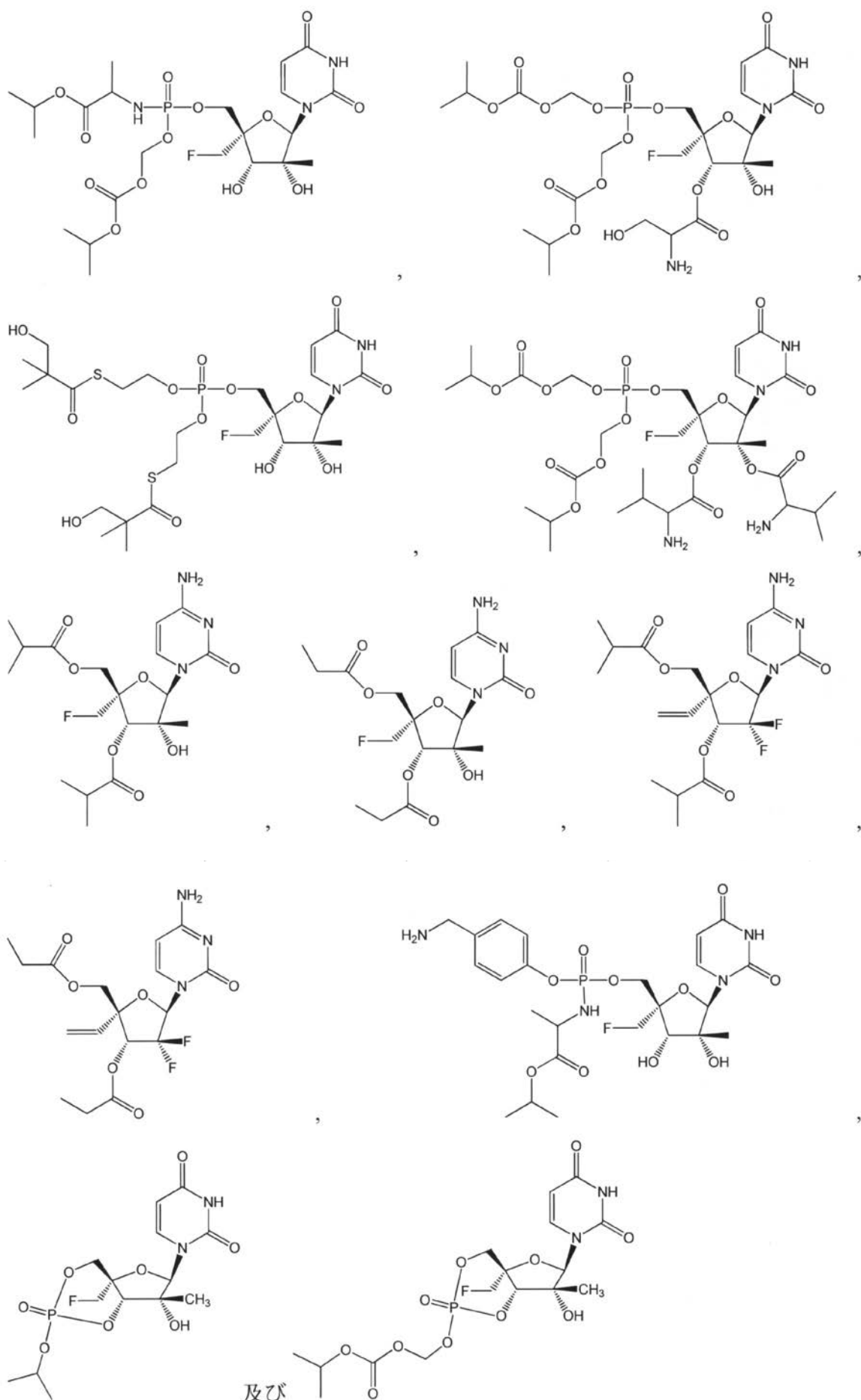
,



,



,



からなる群から選択される化合物またはその薬剂的に許容できる塩。

【請求項 37】

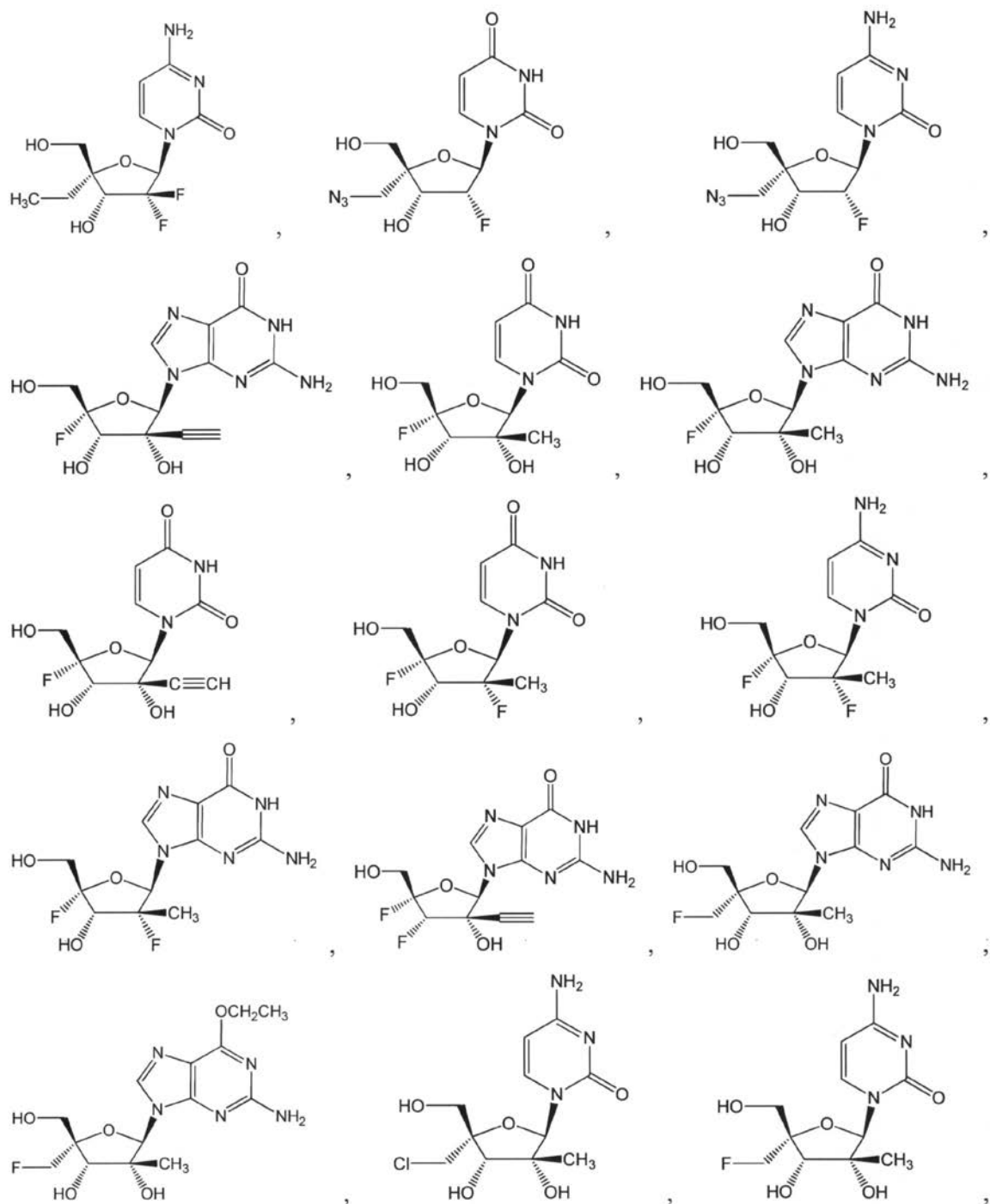
インターフェロン、リバビリン、HCVプロテアーゼ阻害剤、HCVポリメラーゼ阻害剤、NS5A阻害剤、抗ウイルス化合物、式(AA)の化合物、式(BB)の化合物および式(CC)の化合物、または前記化合物のいずれかの薬剂的に許容できる塩からなる群から選択される一つまたは複数の作用剤と組み合わせでHCV感染症を改善または治療するための医薬組成物。

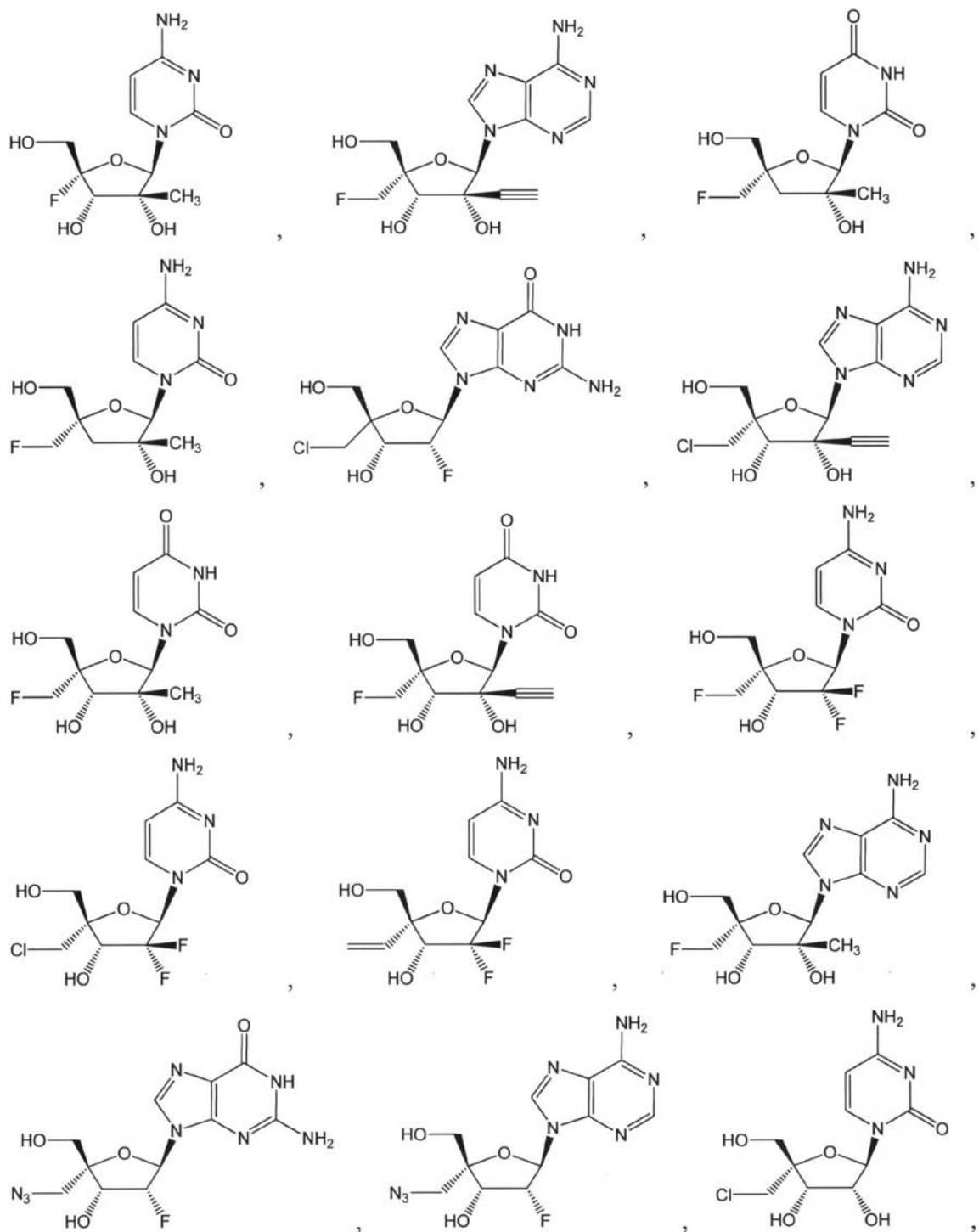
【請求項 38】

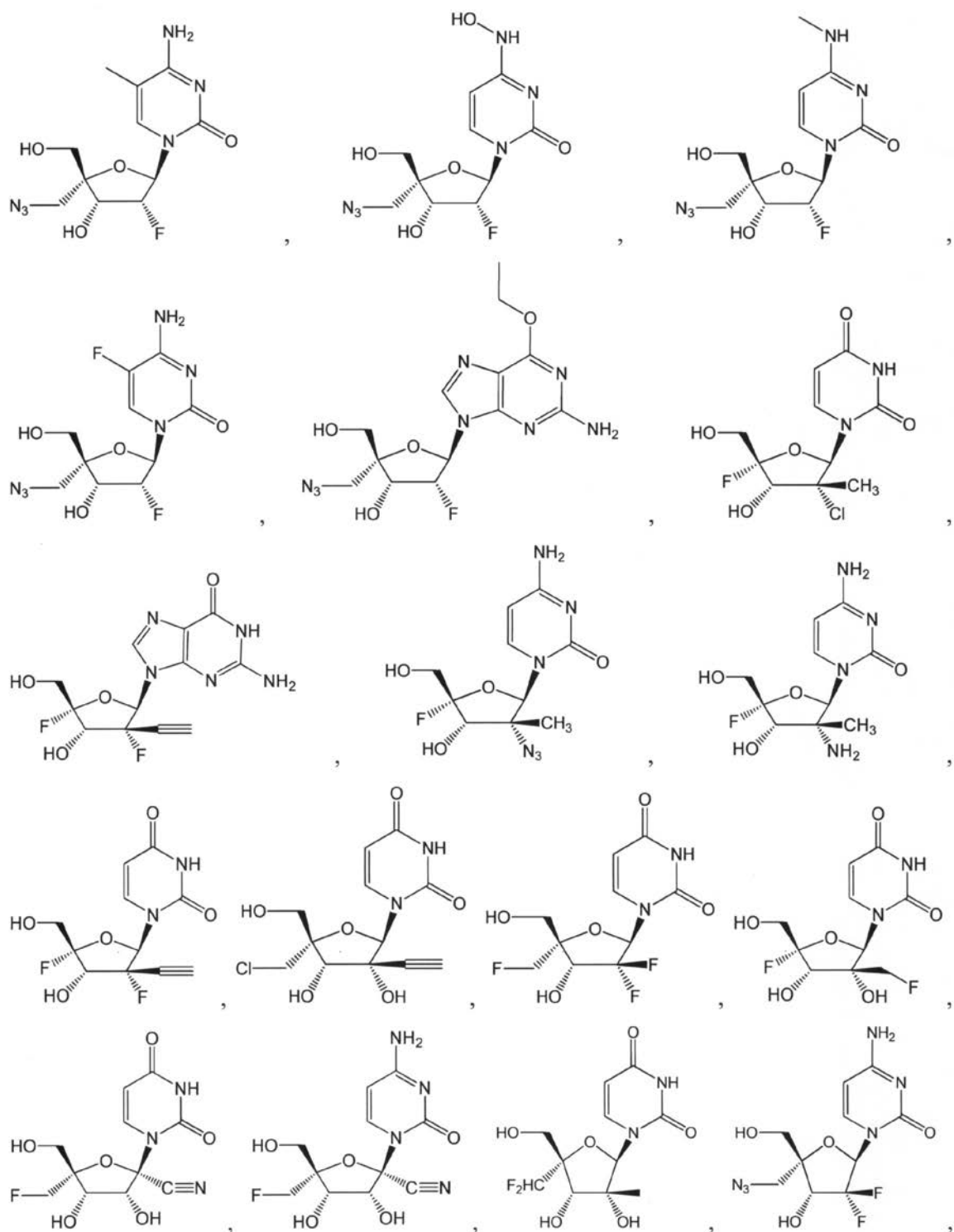
一つまたは複数の作用剤が、化合物1001～1016、2001～2012、3001～3014、4001～4012、5001～5011、6001～6078、7000～7027および8000～8016、または前記化合物のいずれかの薬剂的に許容できる塩からなる群から選択される、請求項37に記載の医薬組成物。

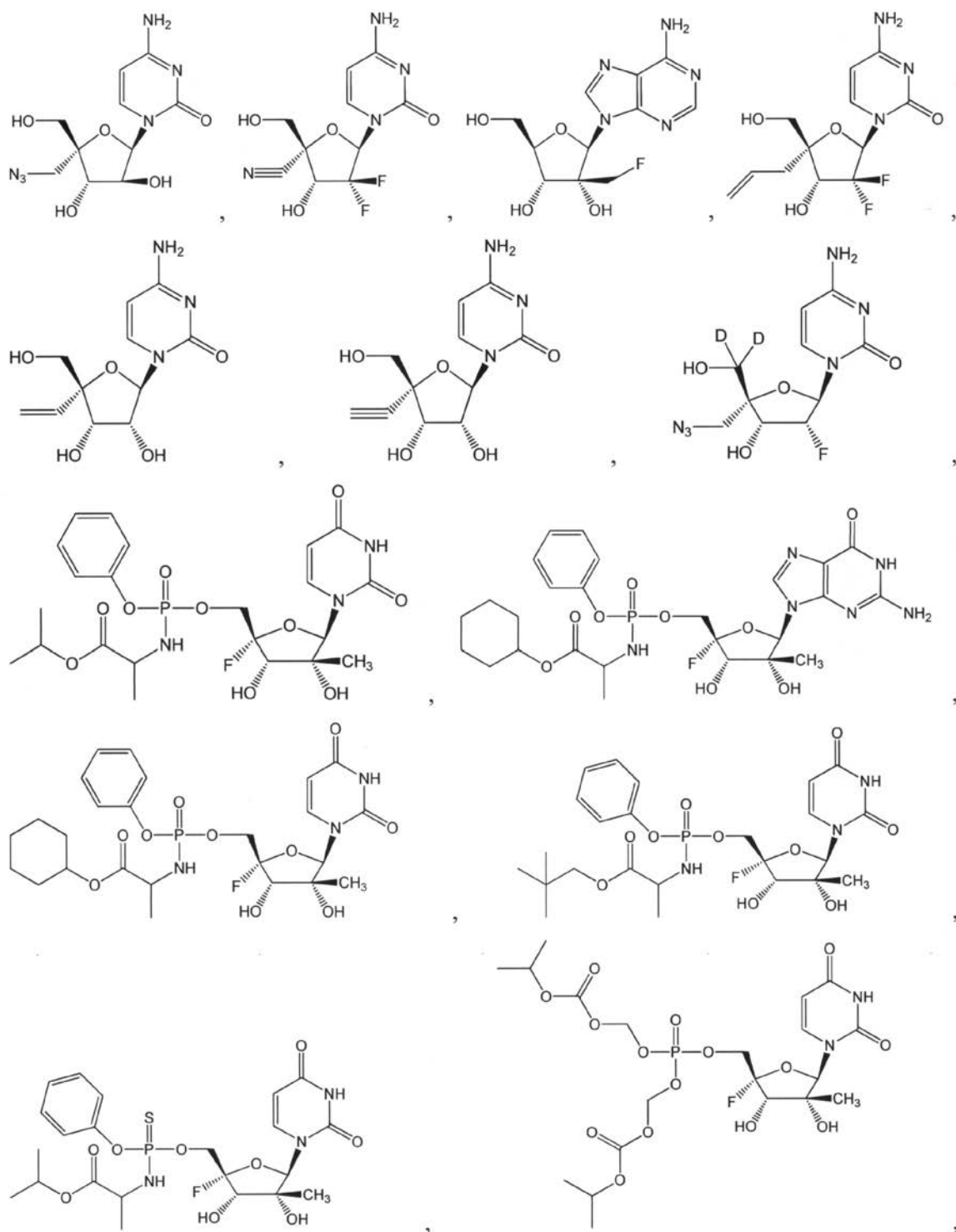
【請求項 39】

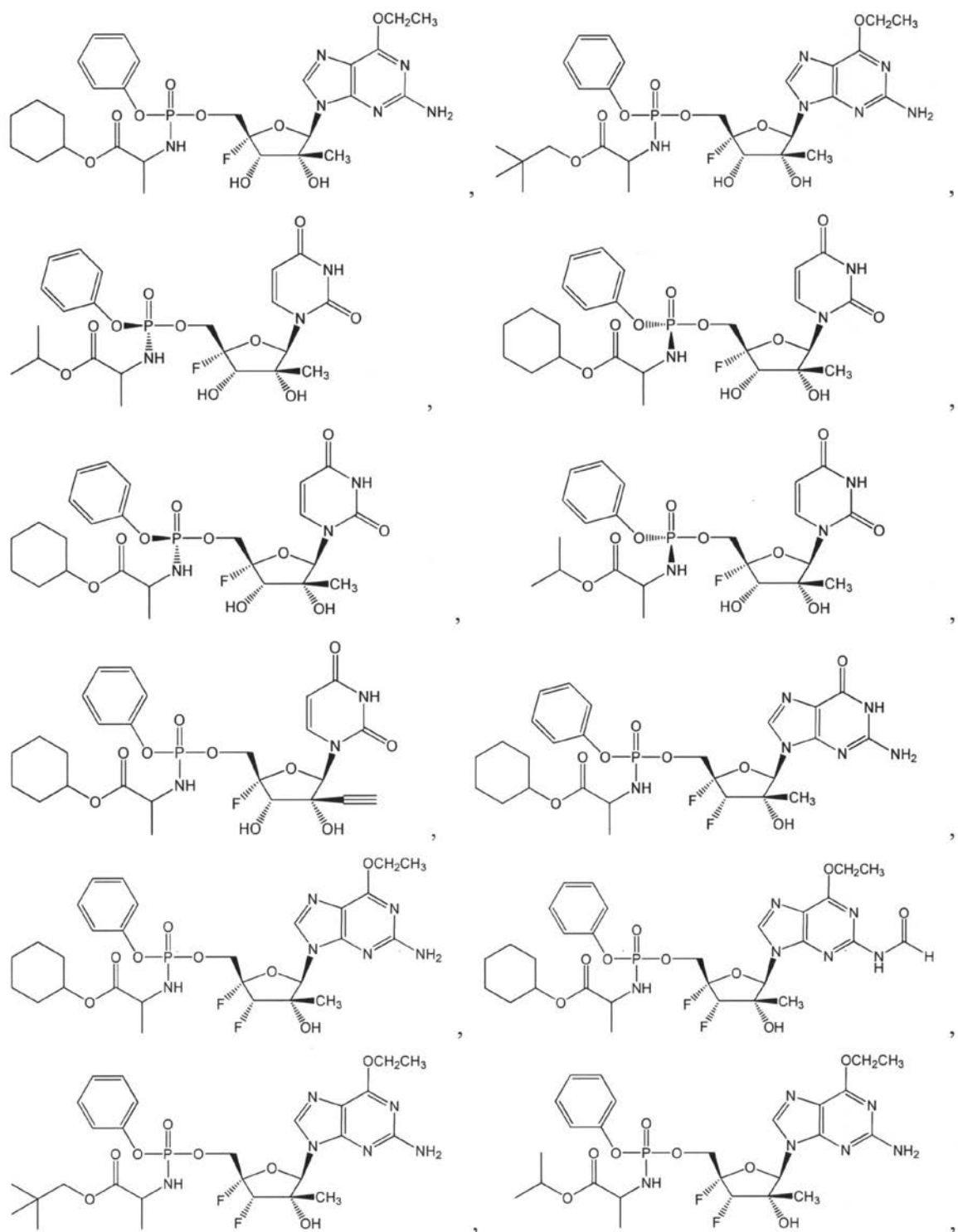
【化 8 6】

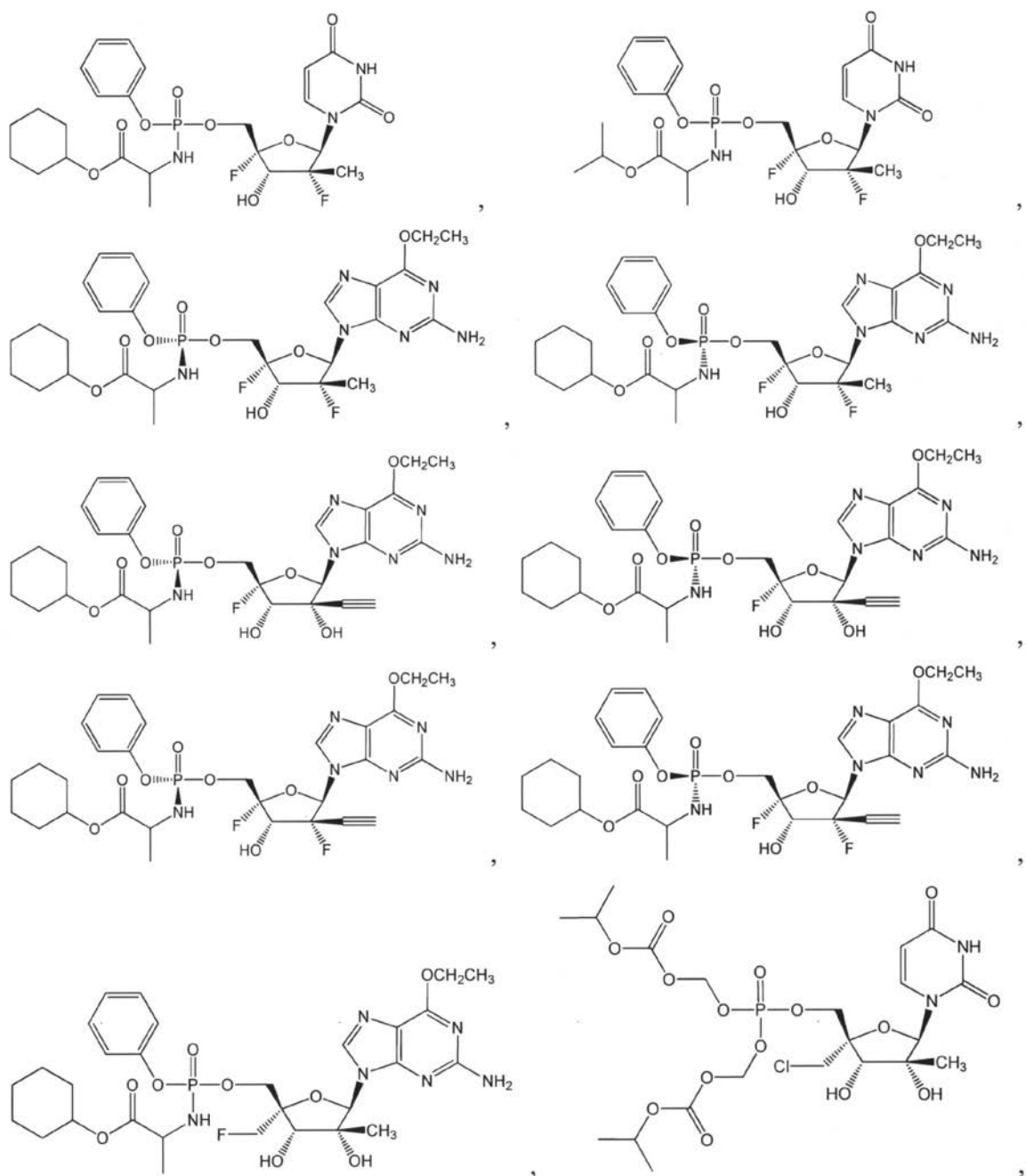


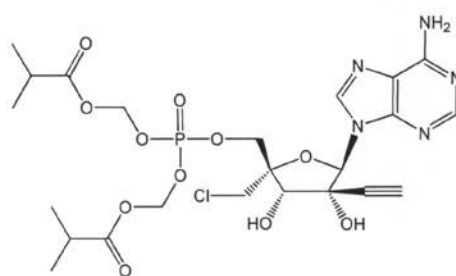
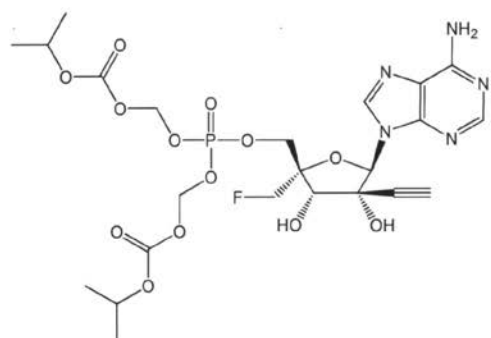
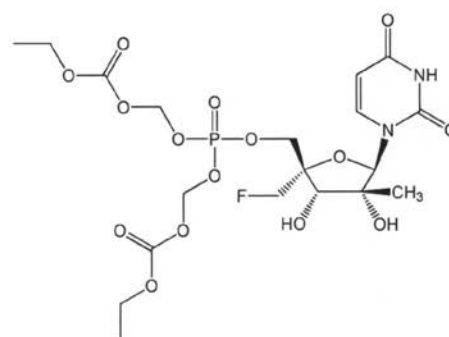
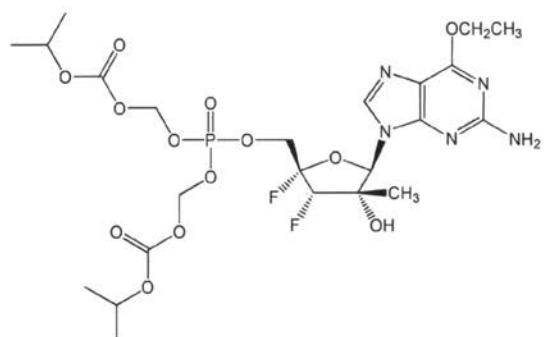
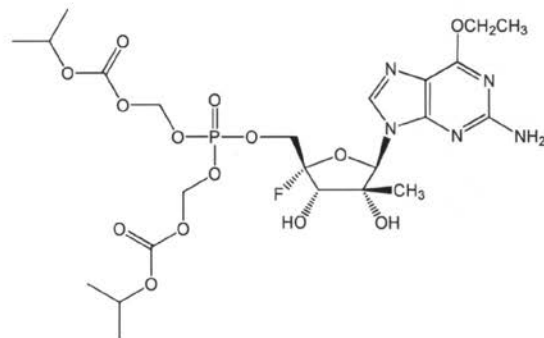
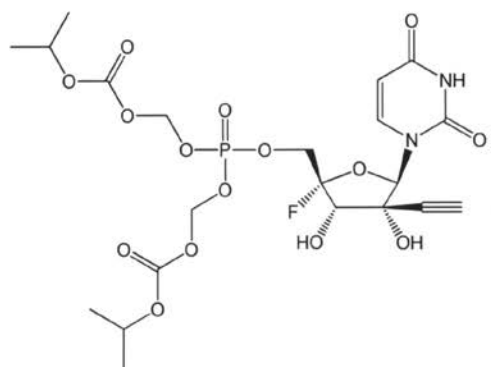
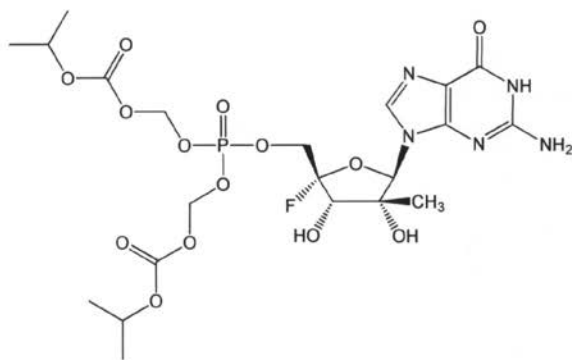
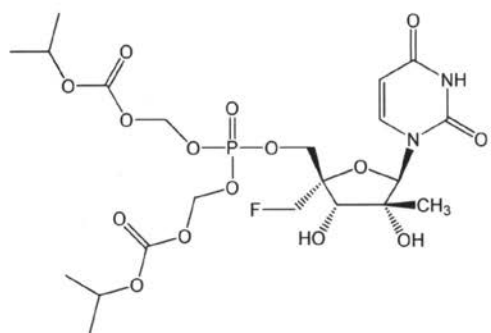


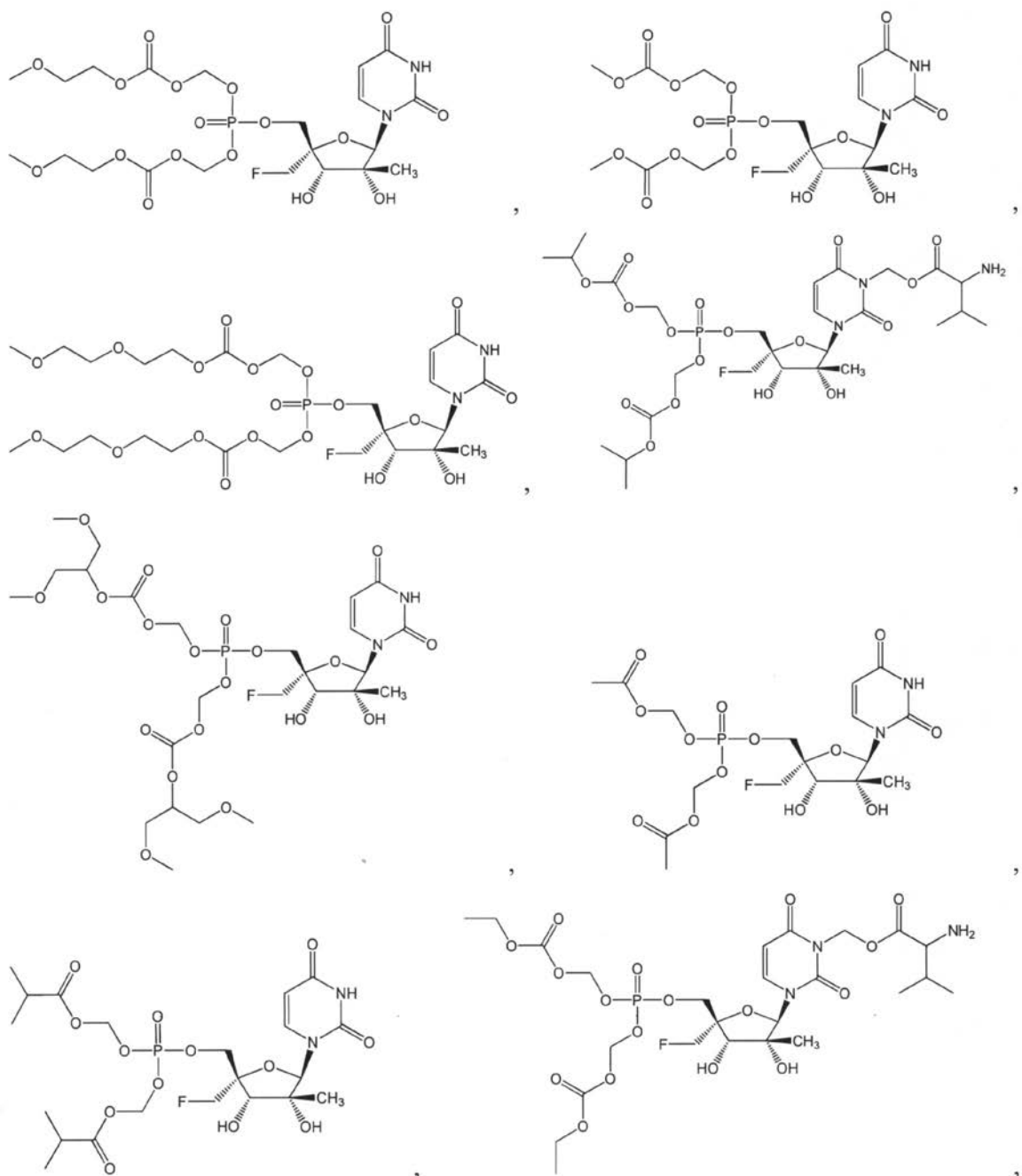


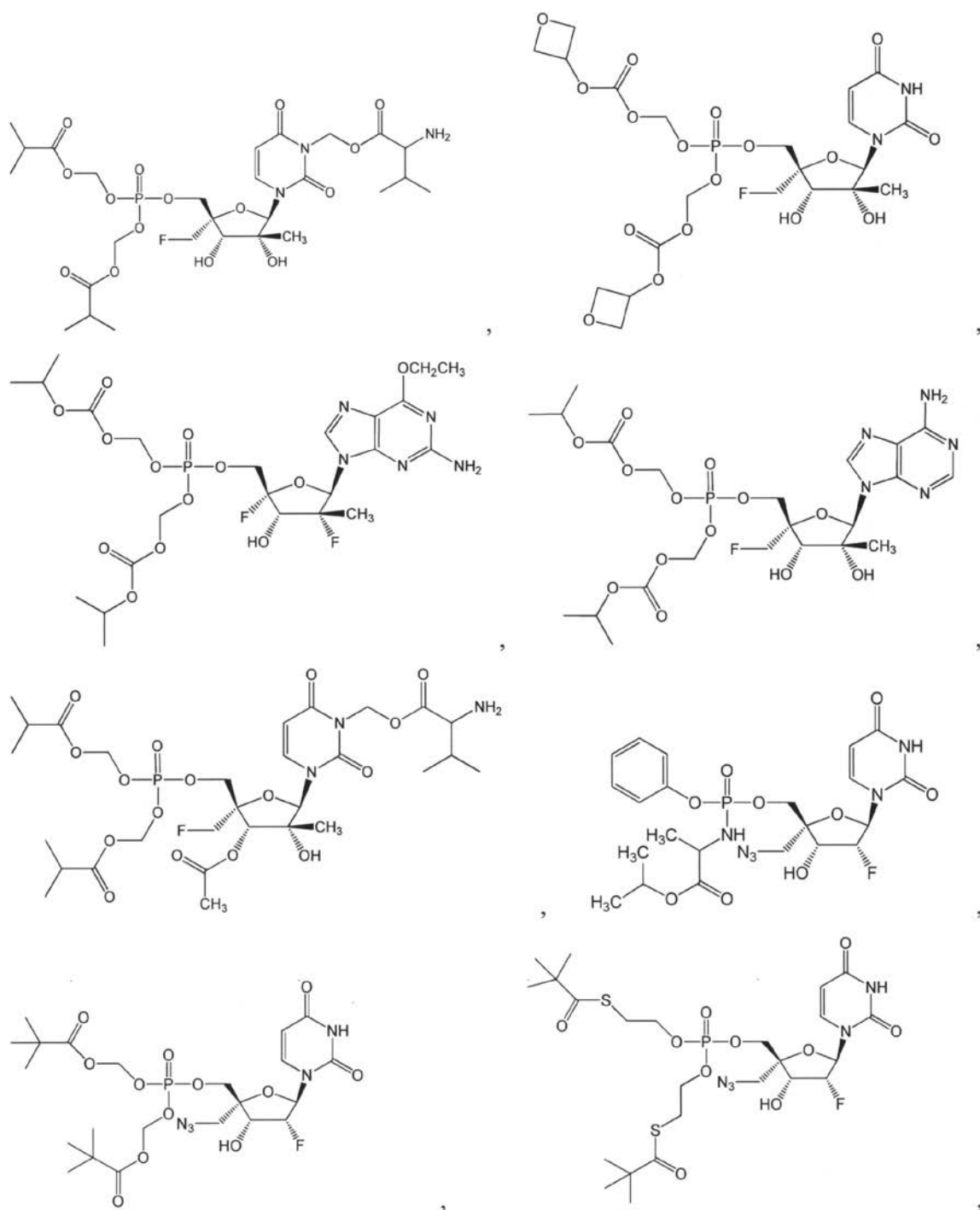


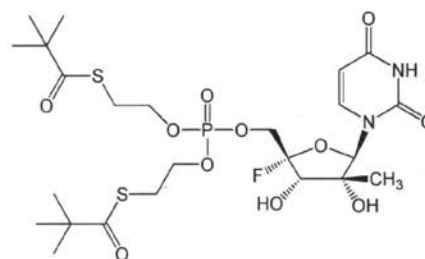
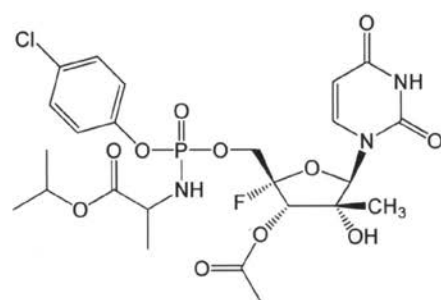
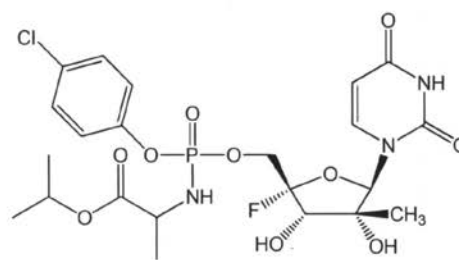
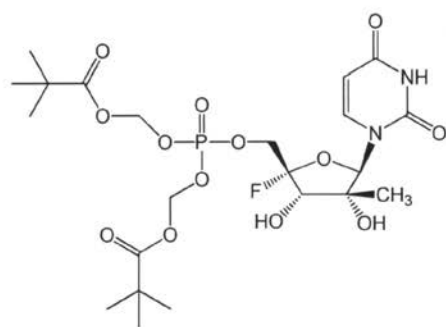
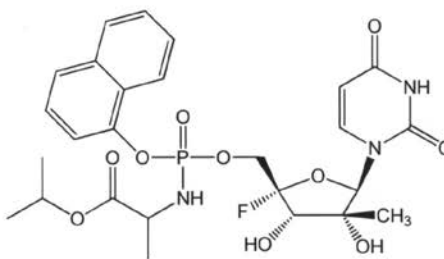
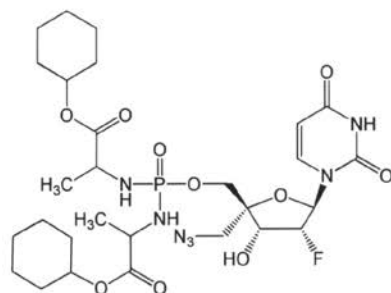
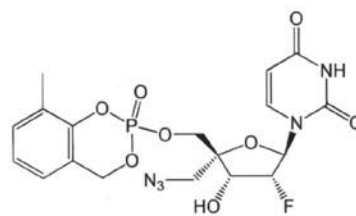
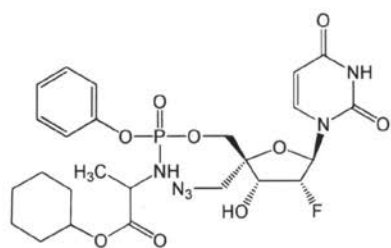


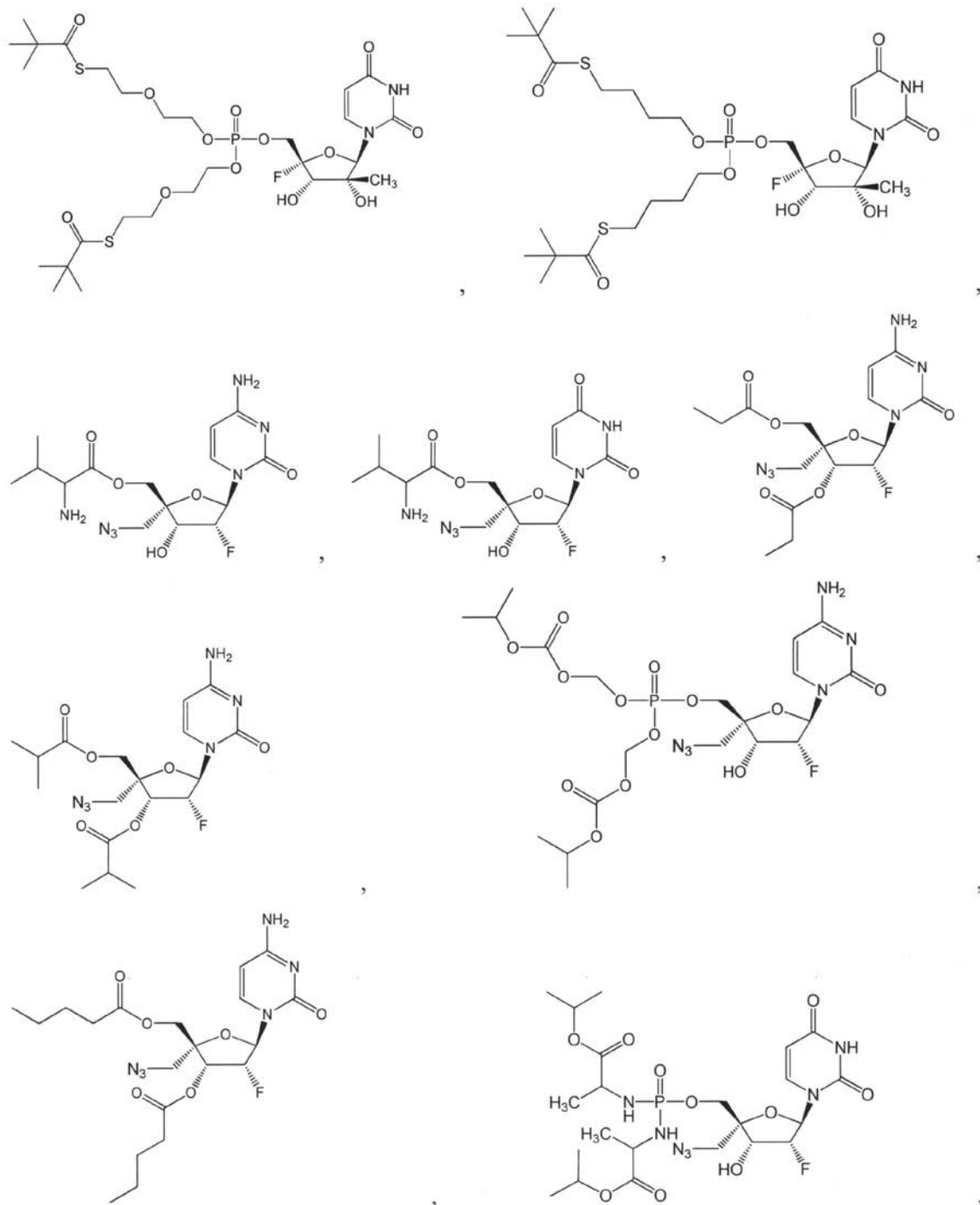


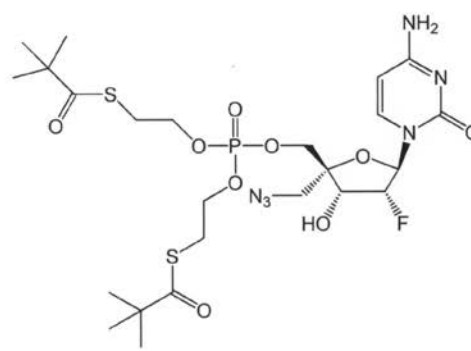
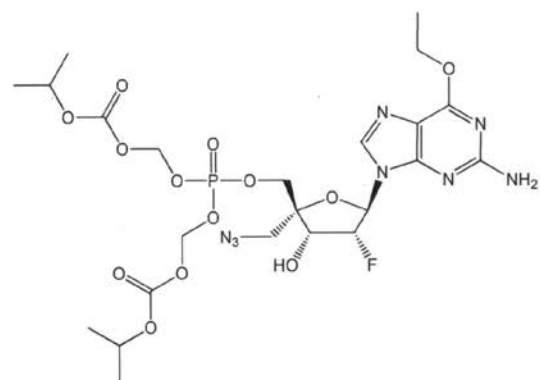
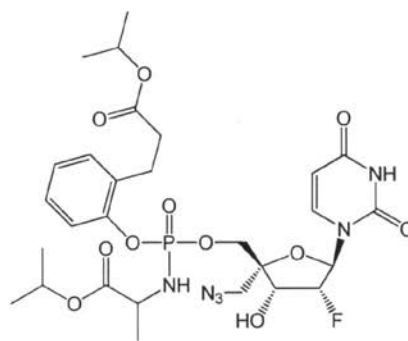
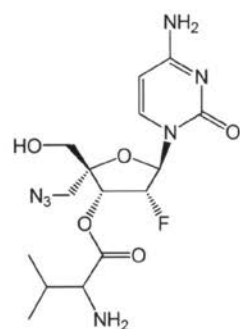
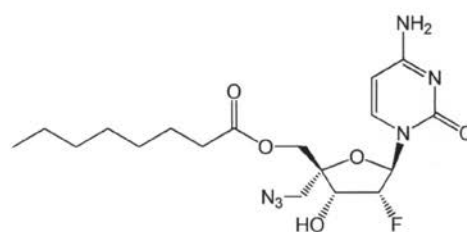
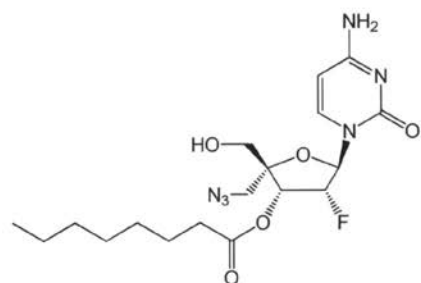
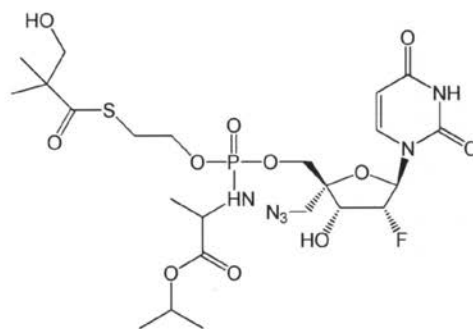
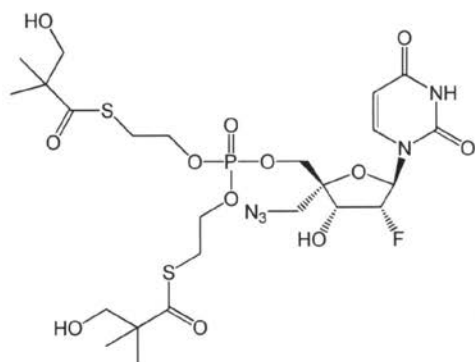


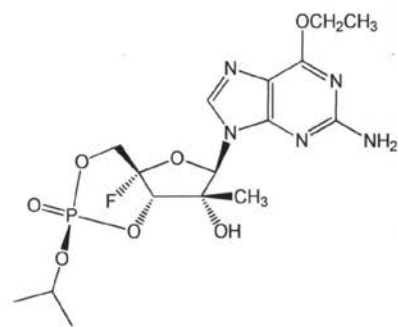
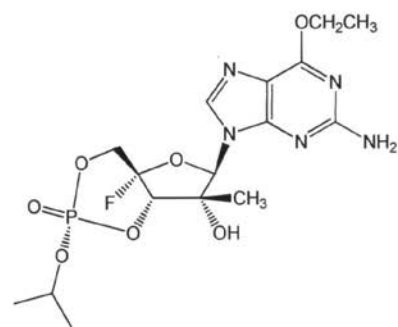
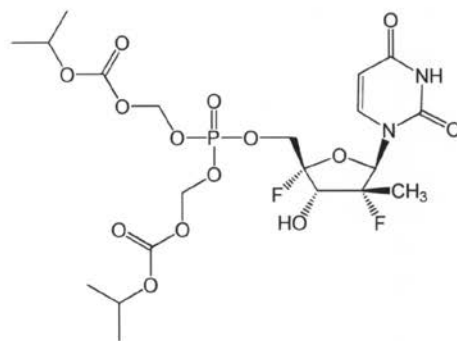
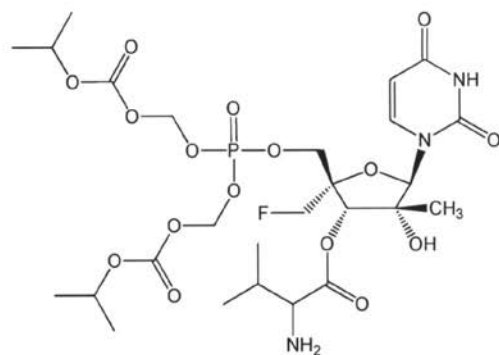
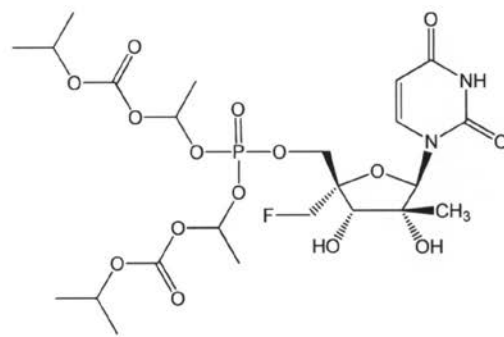
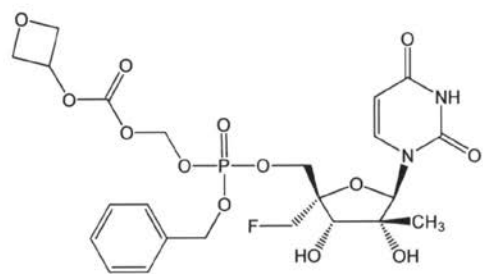
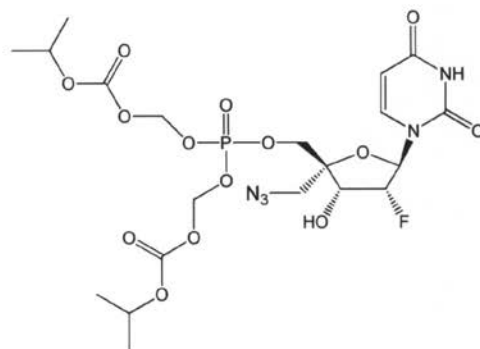
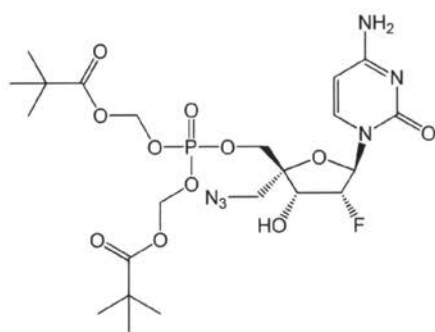


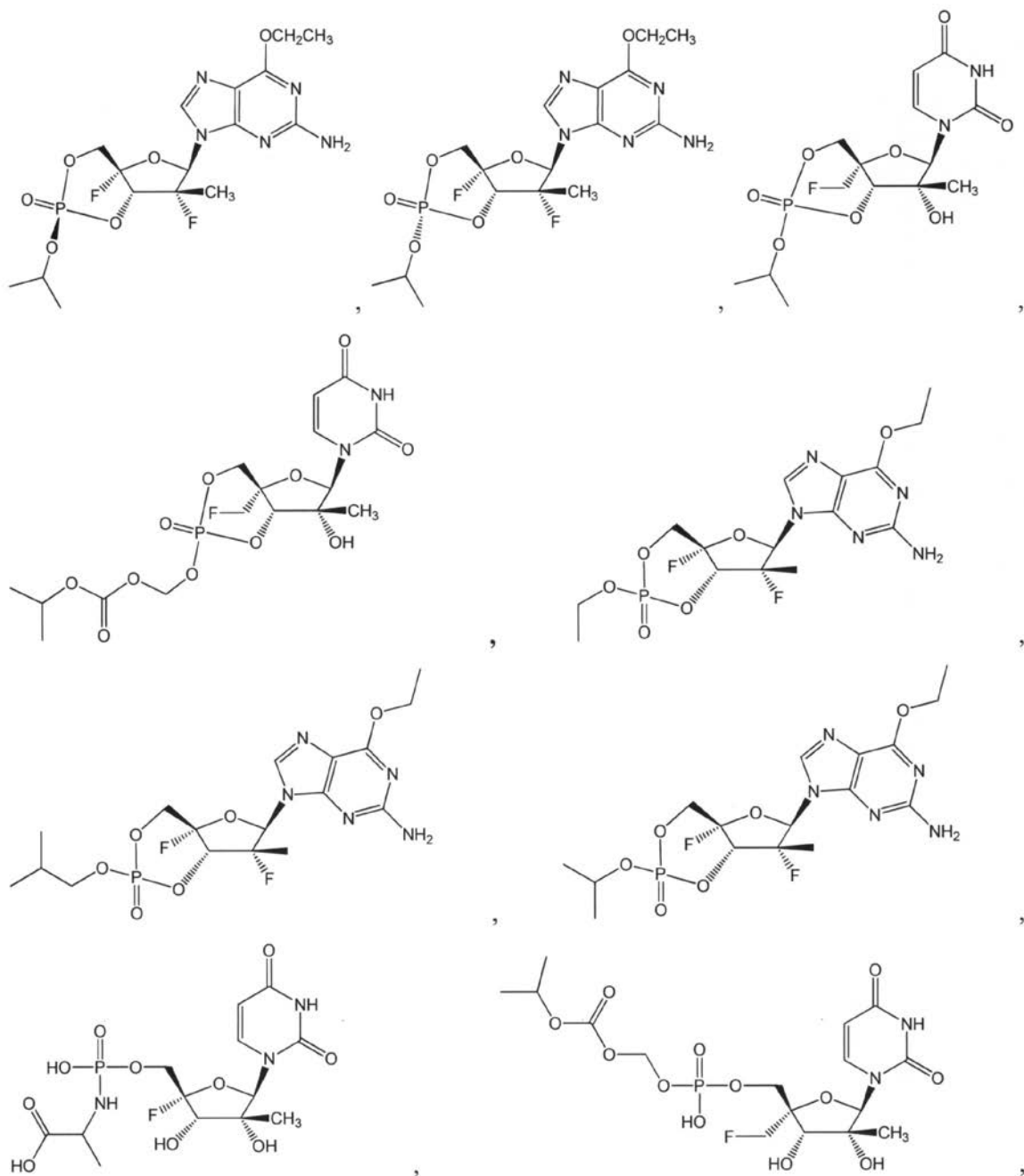


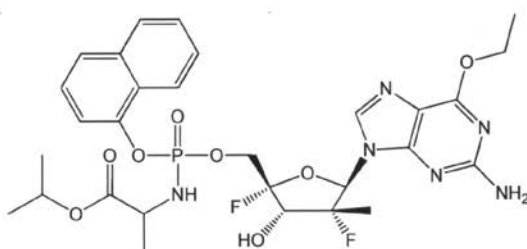
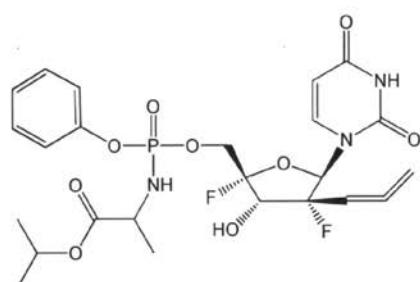
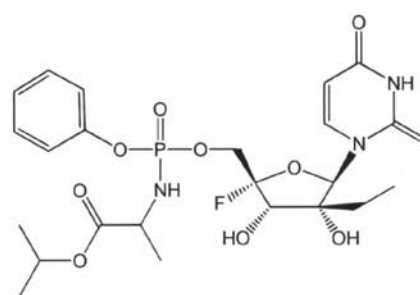
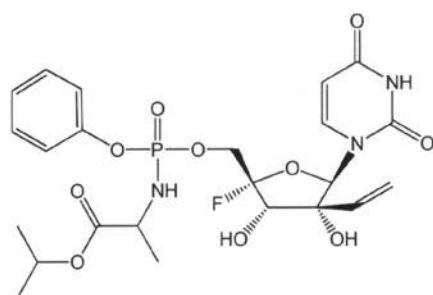
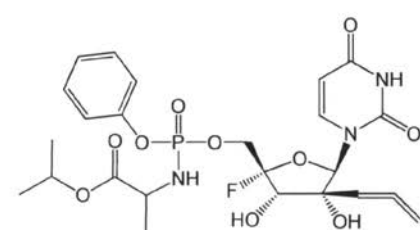
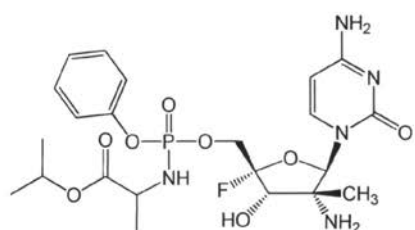
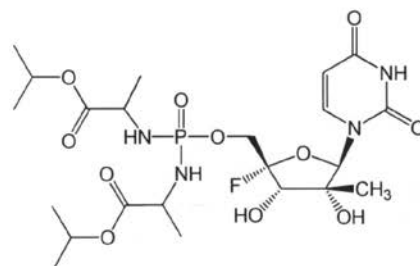
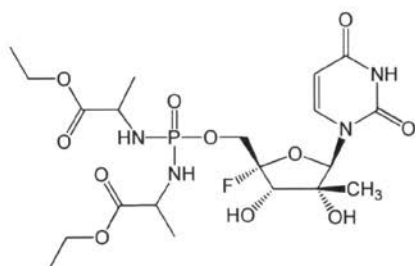
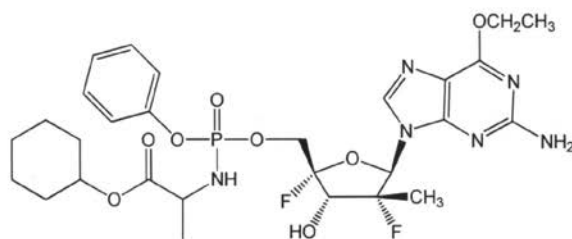
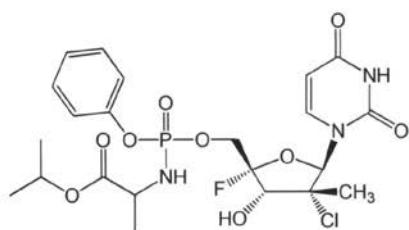


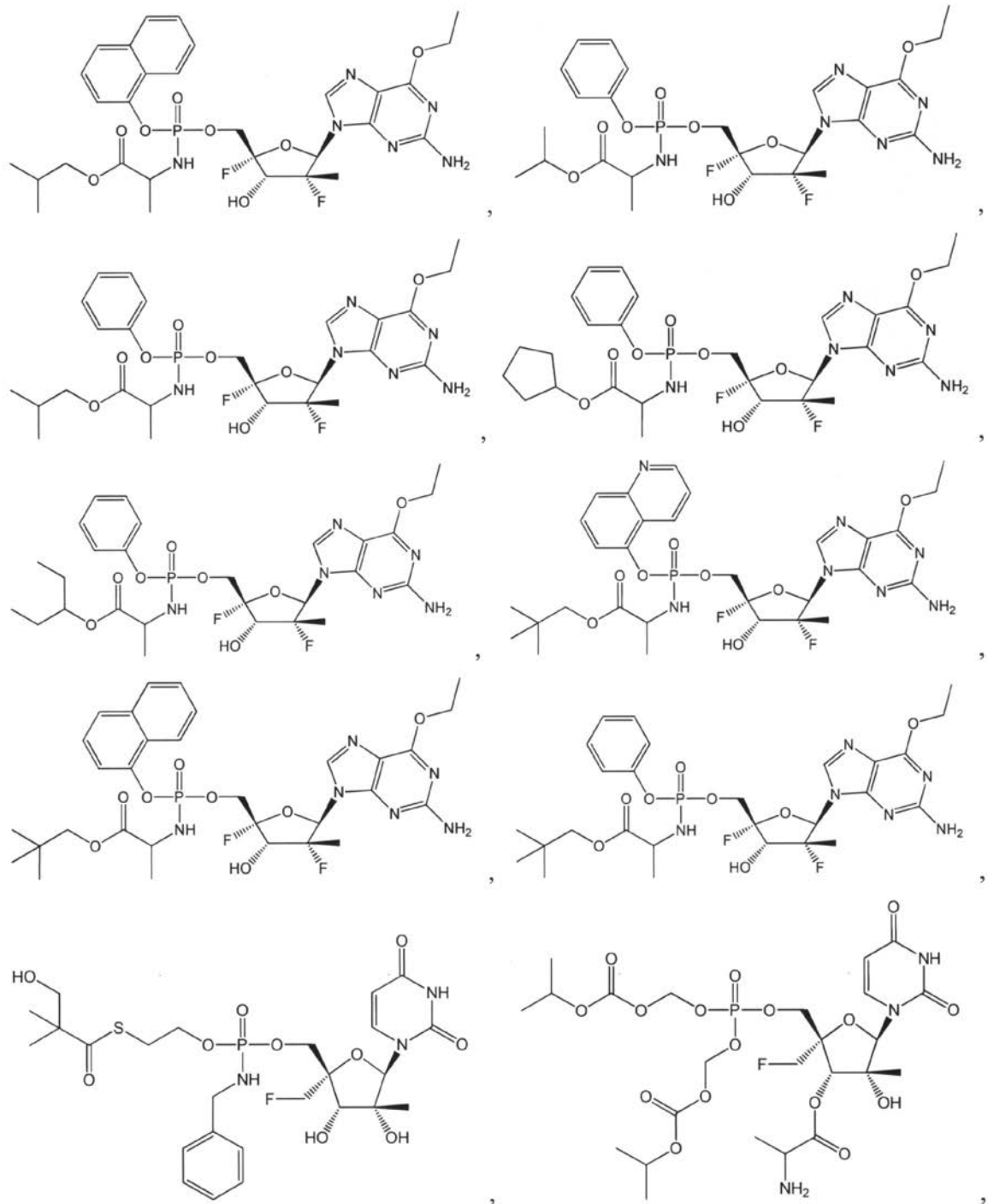


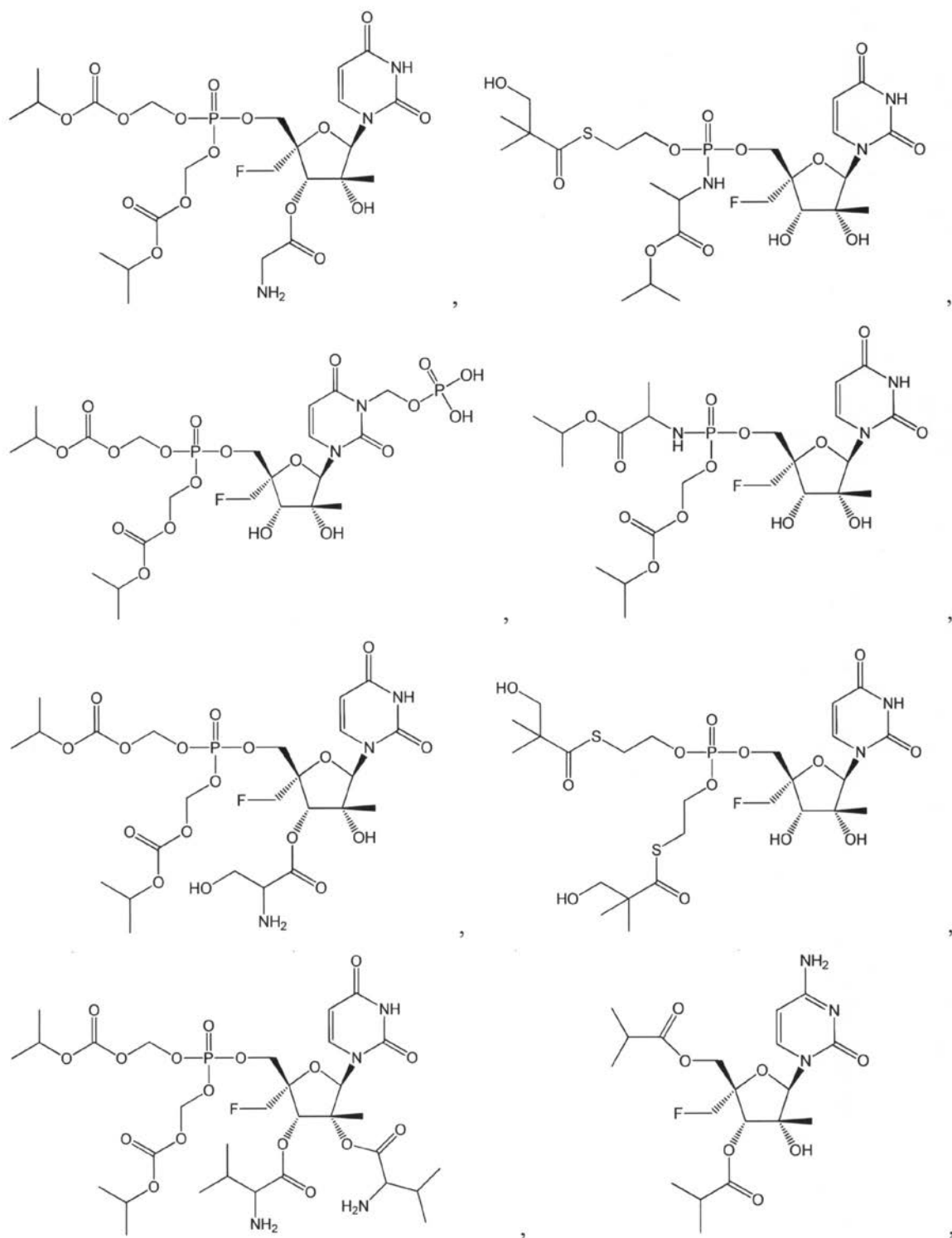


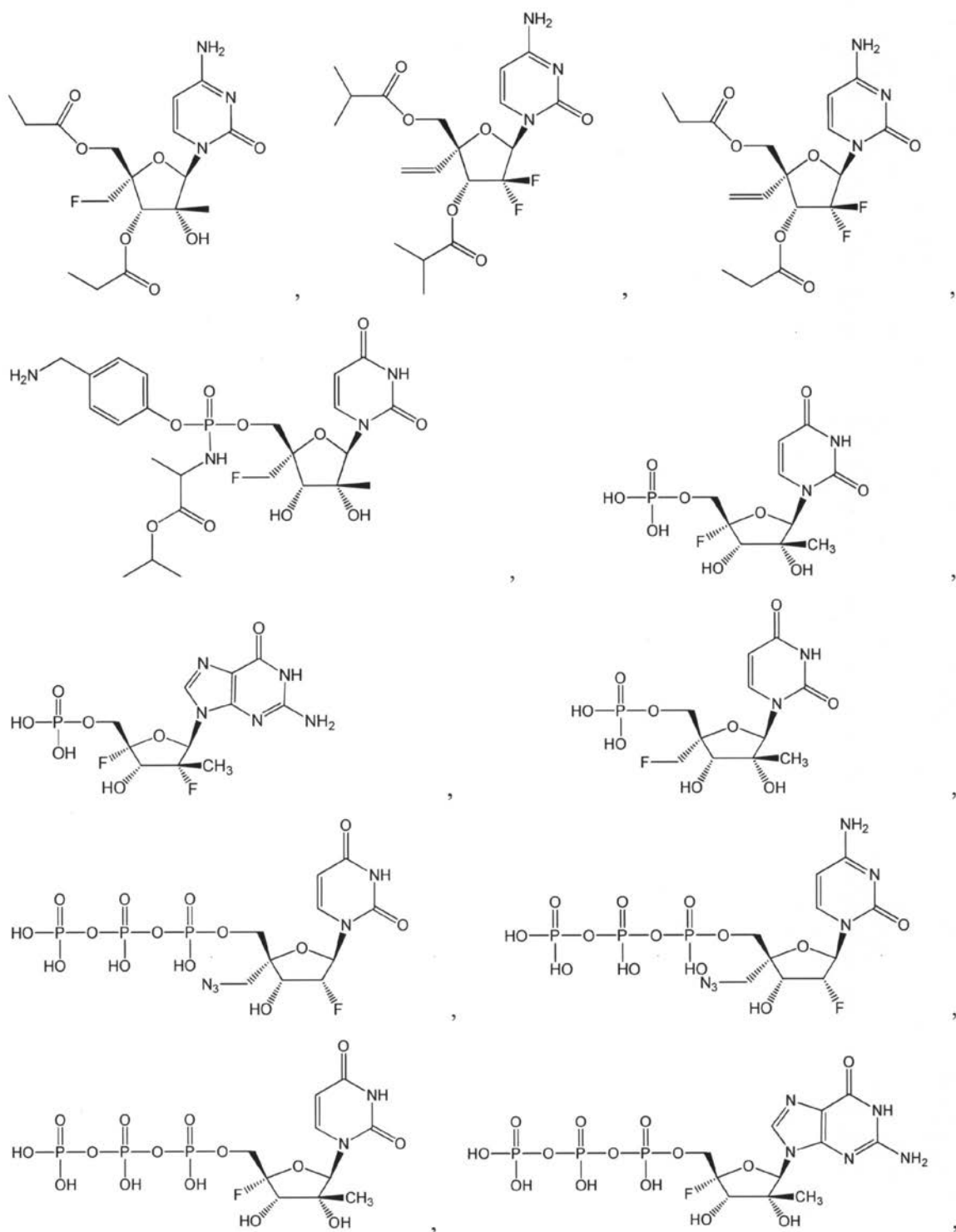


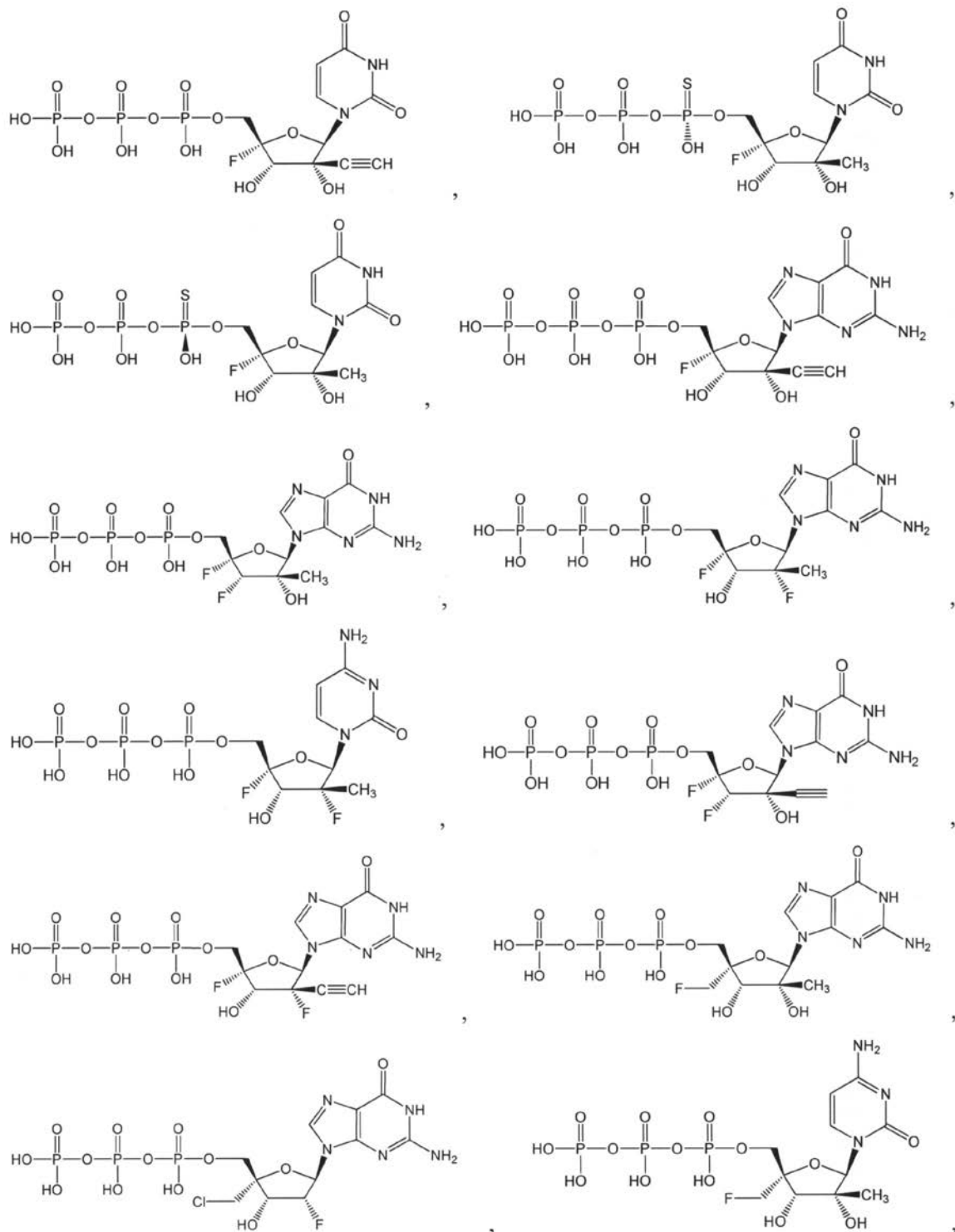


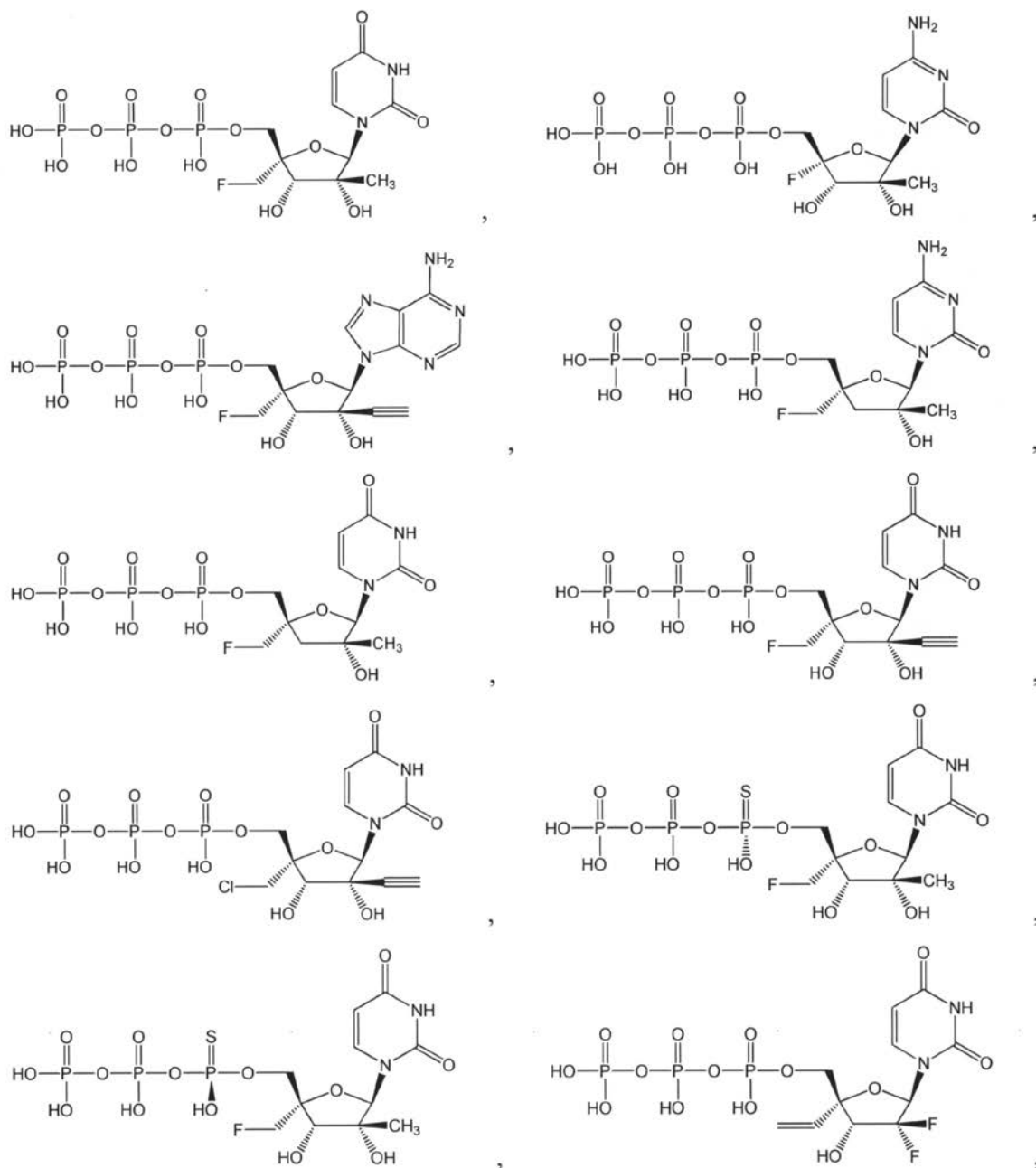


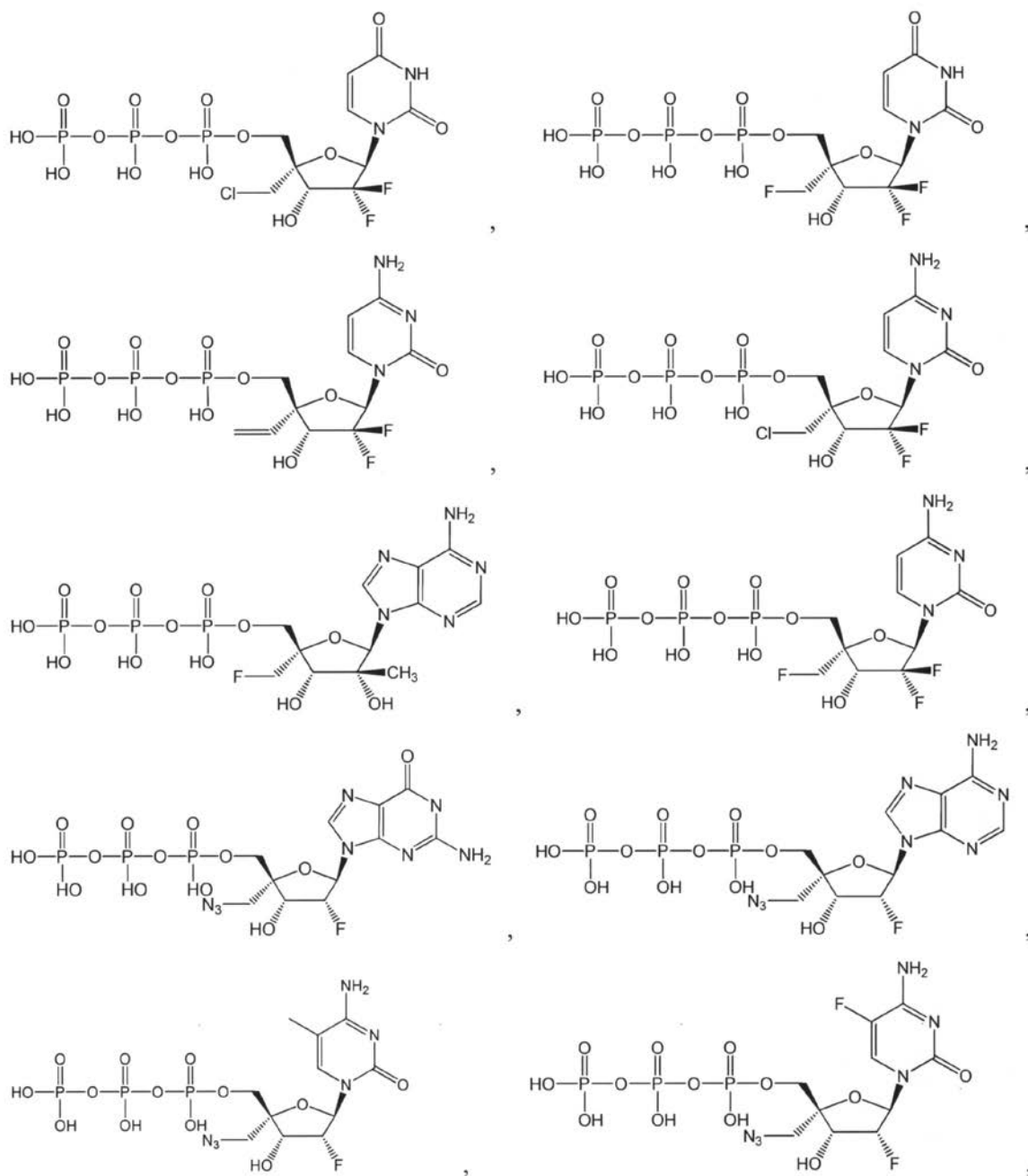


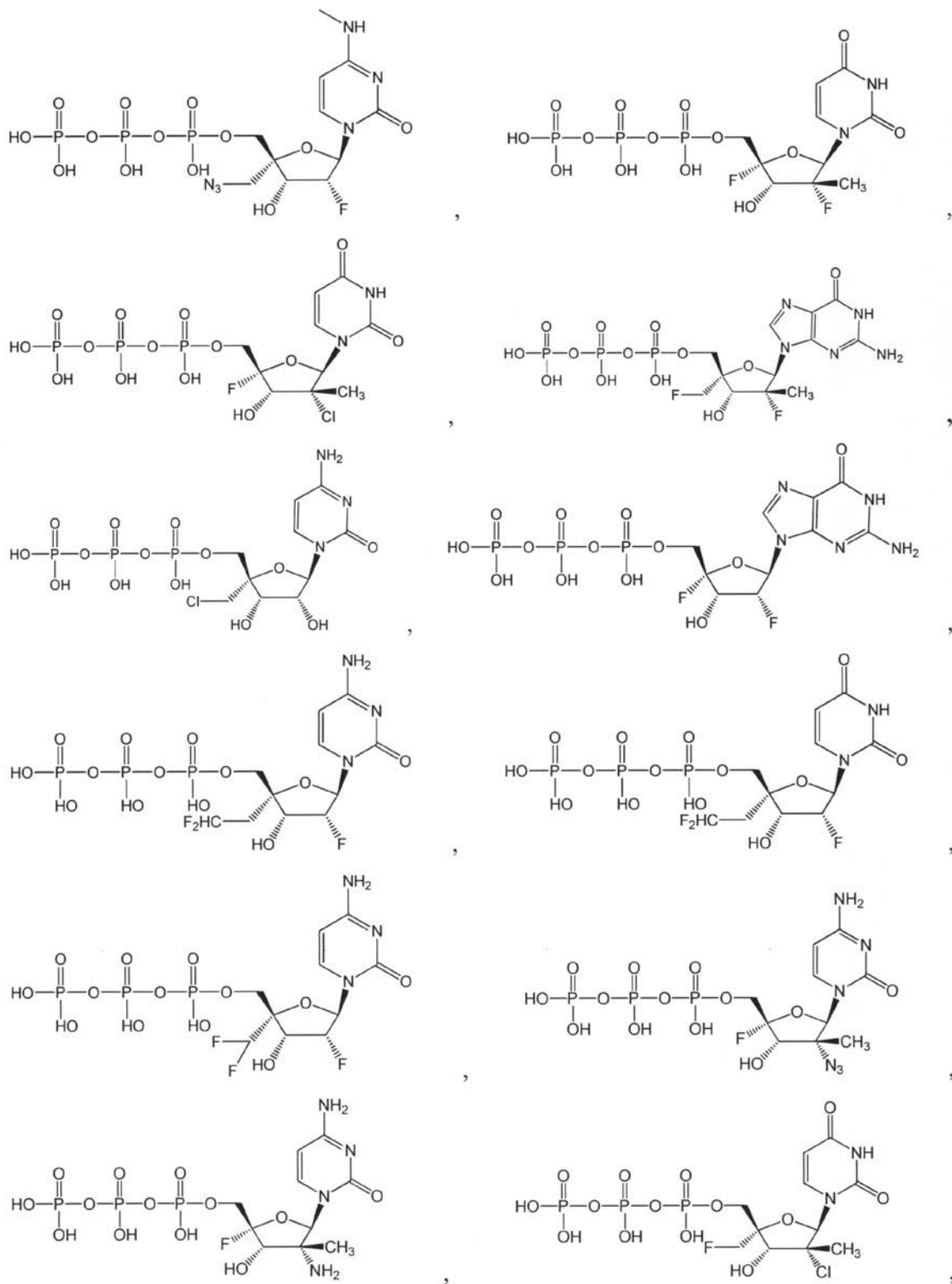


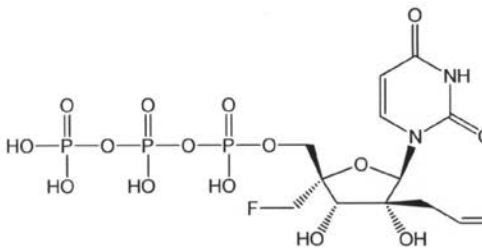
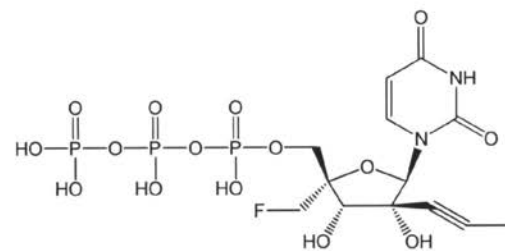
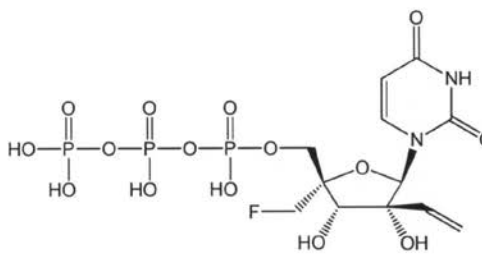
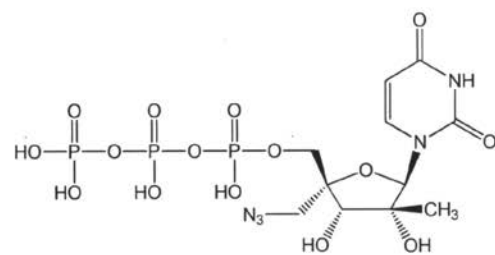
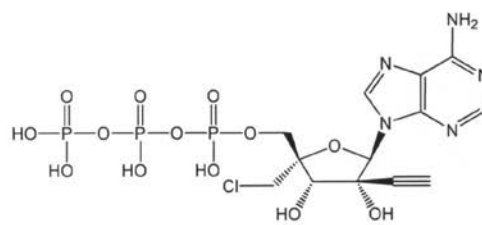
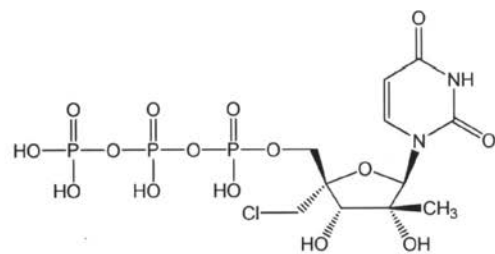
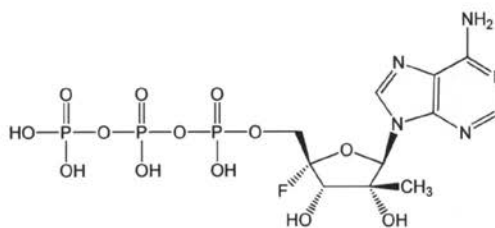
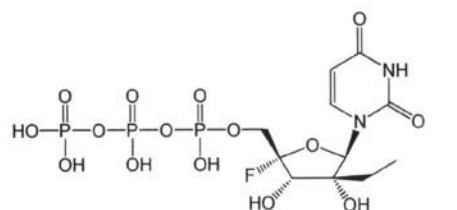
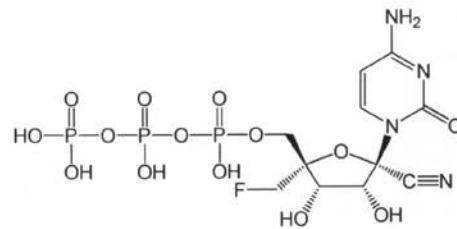
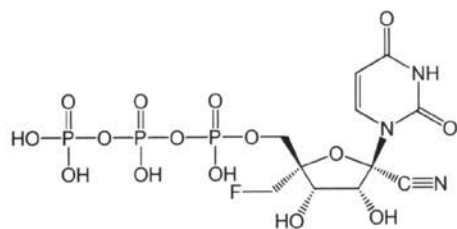
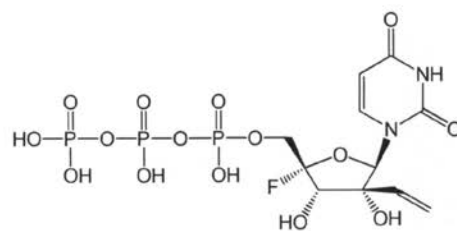
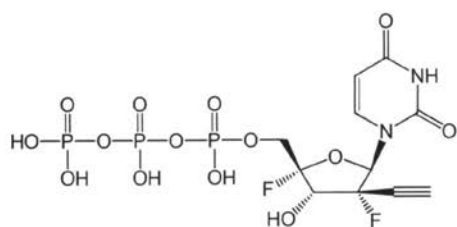


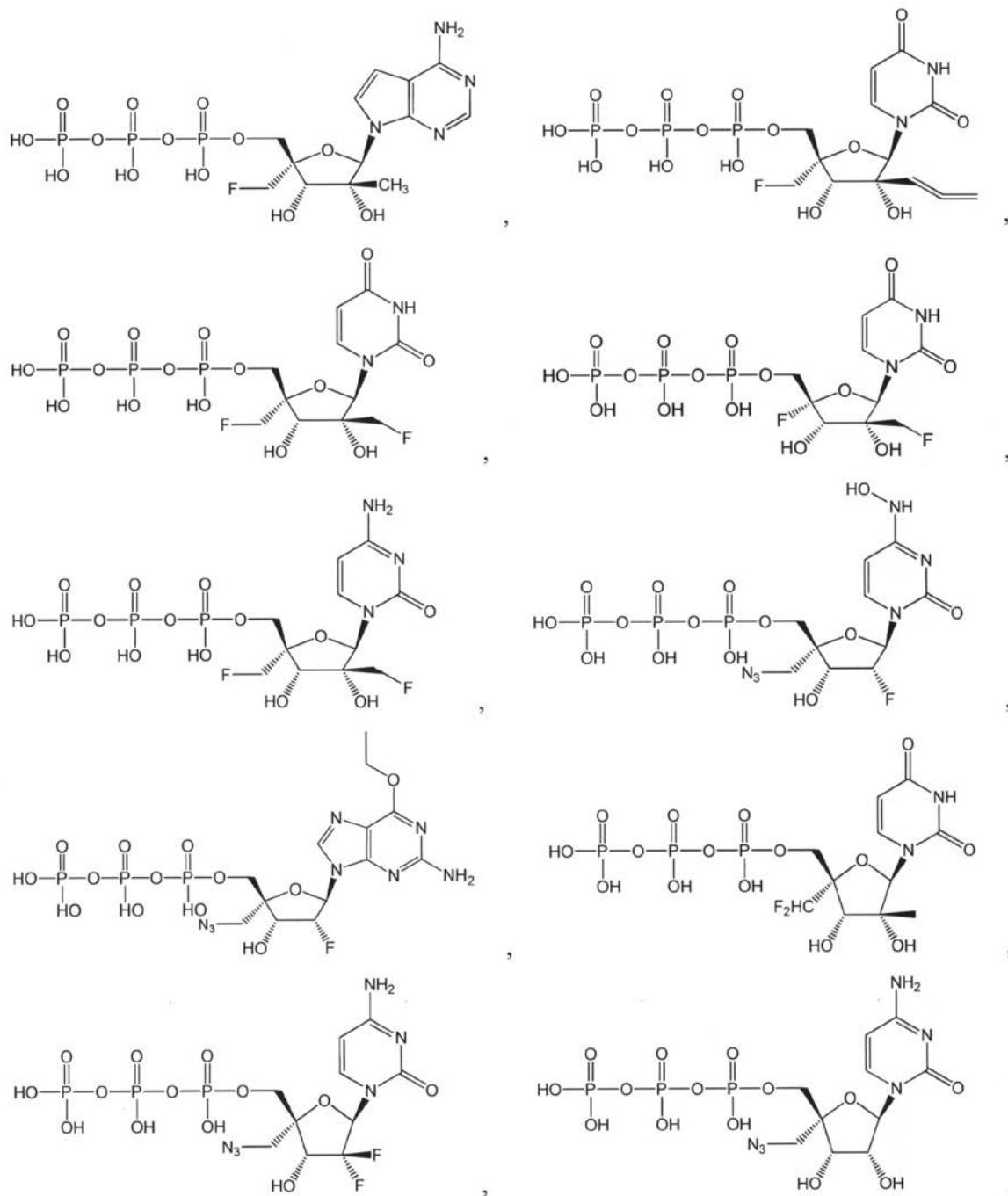


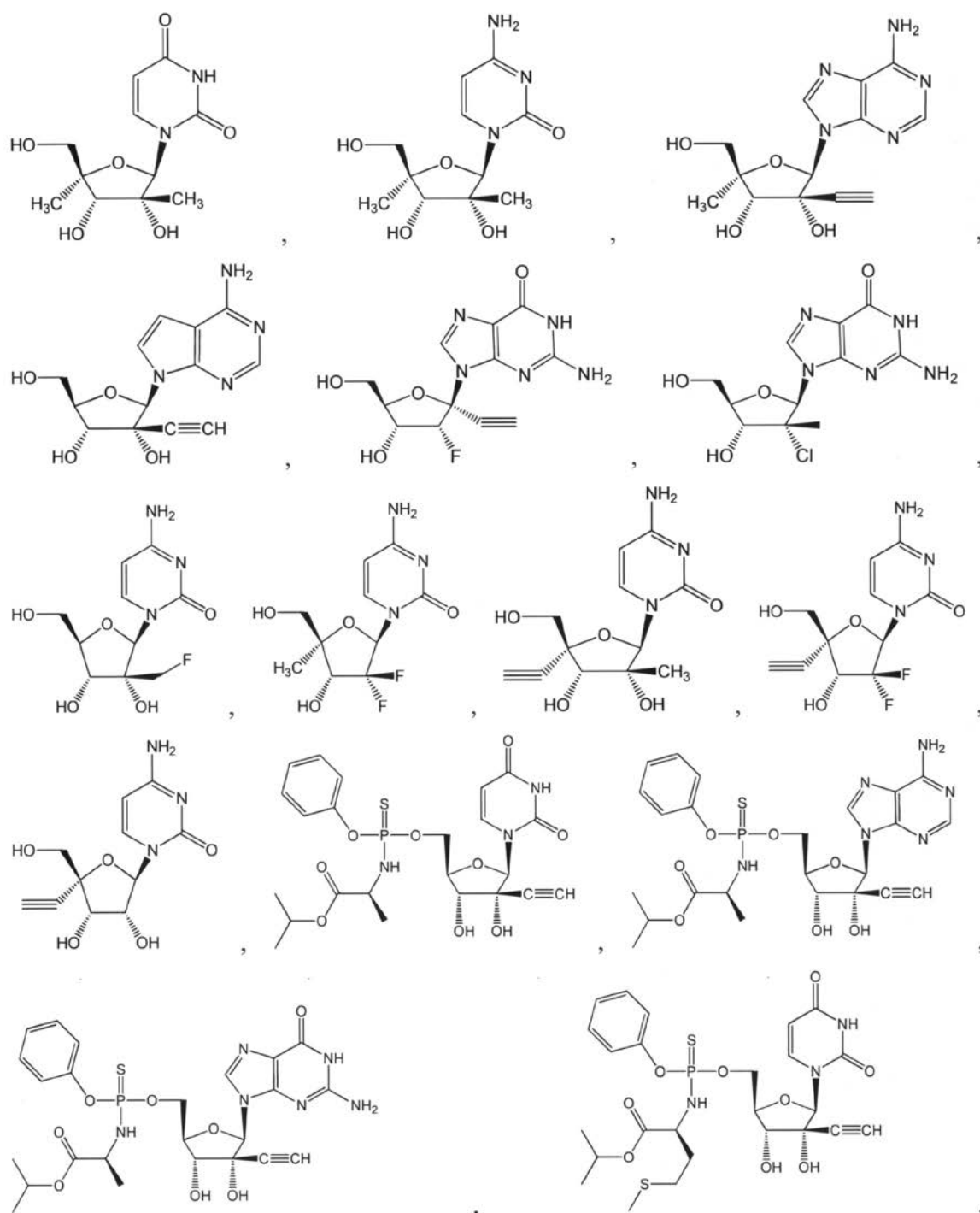


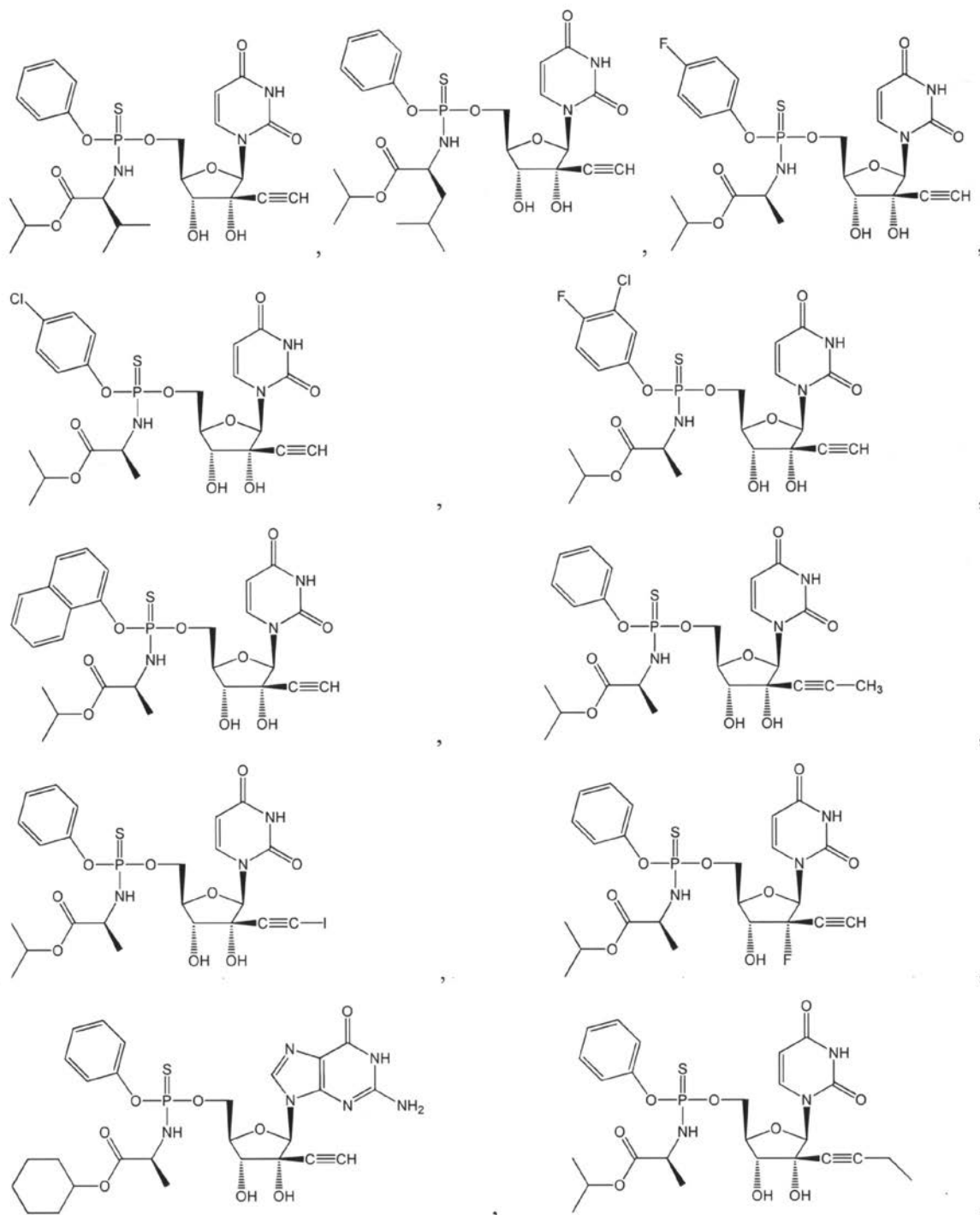


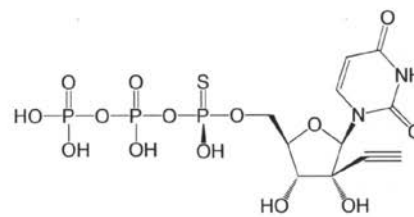
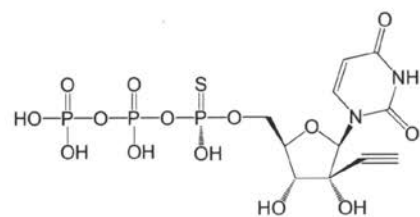
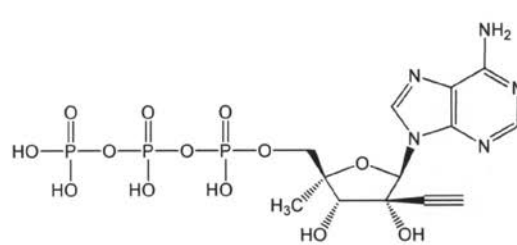
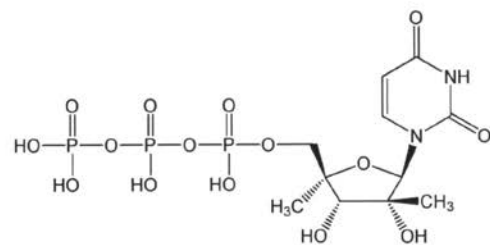
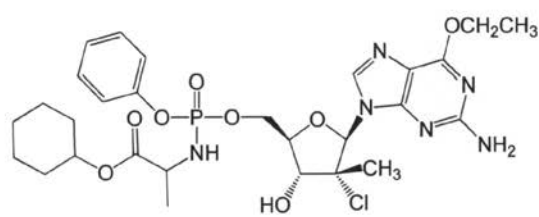
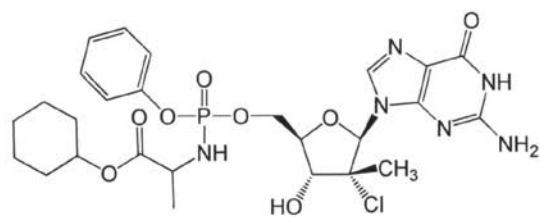
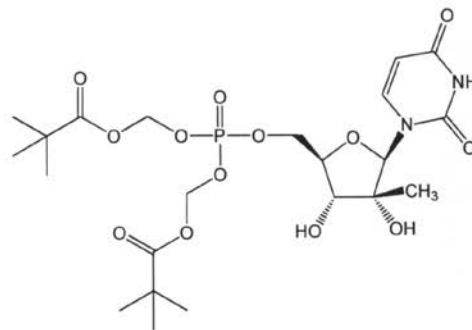
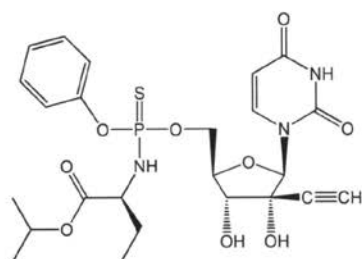
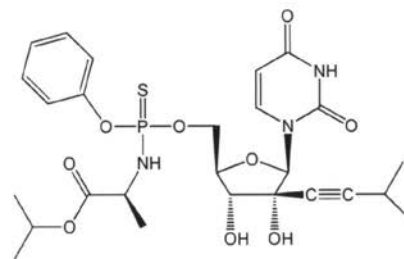
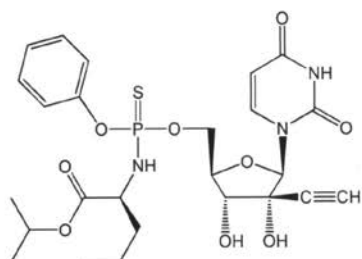


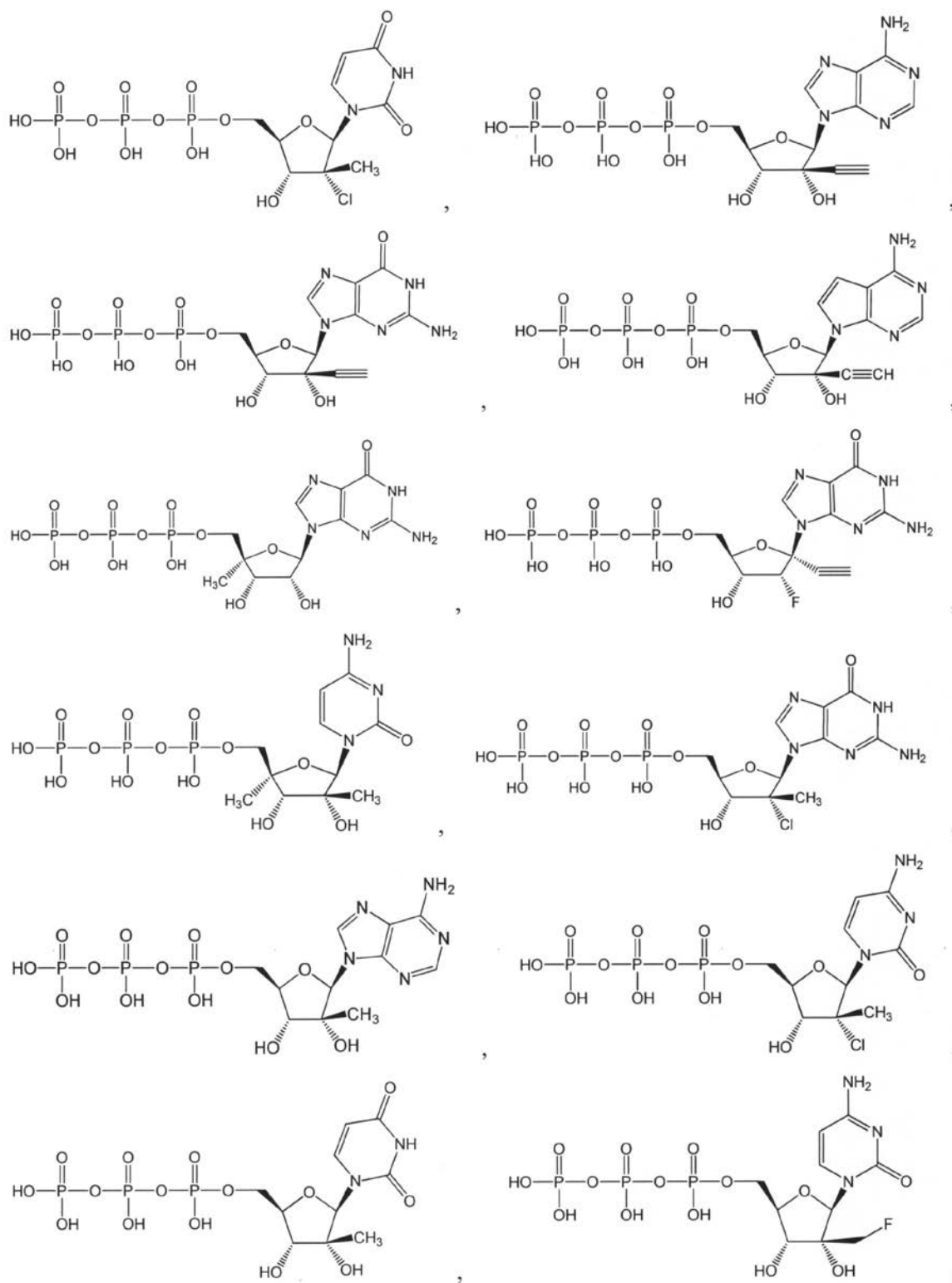


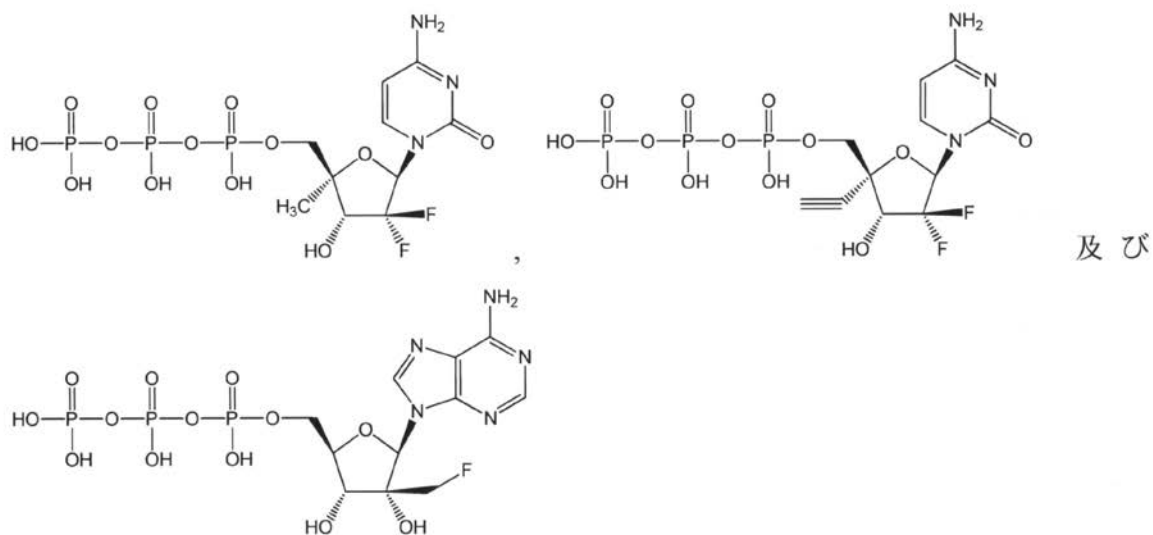








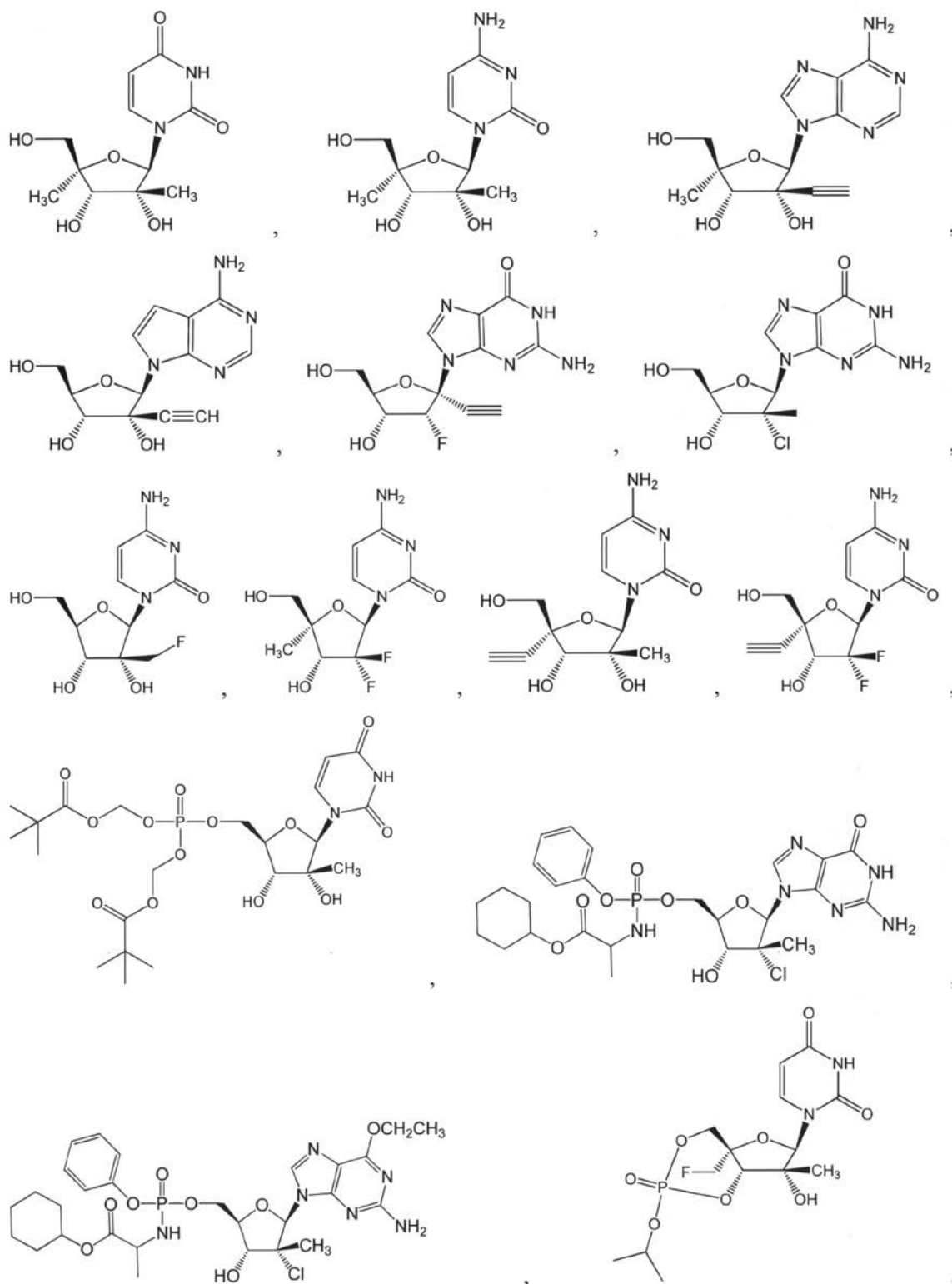


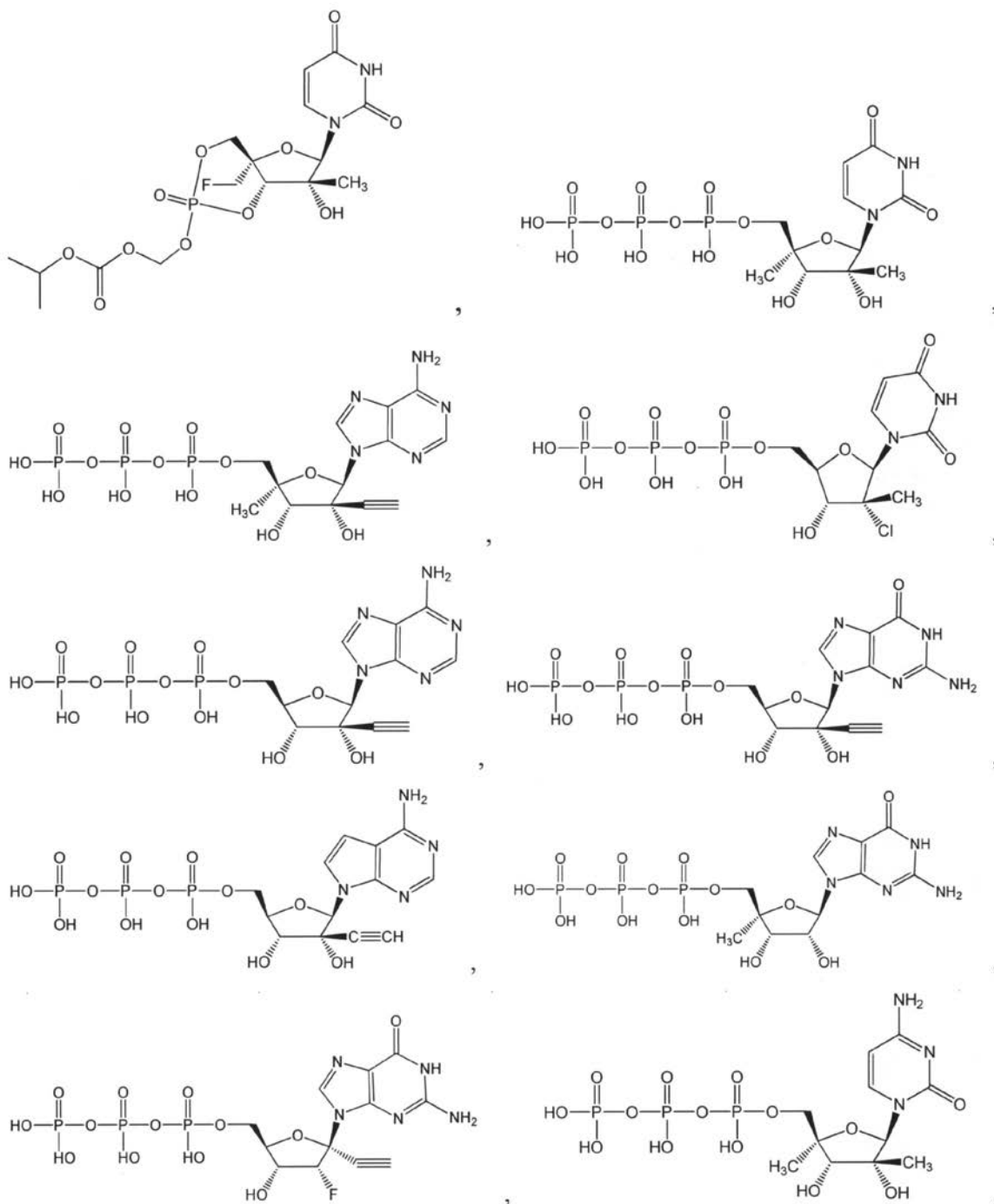


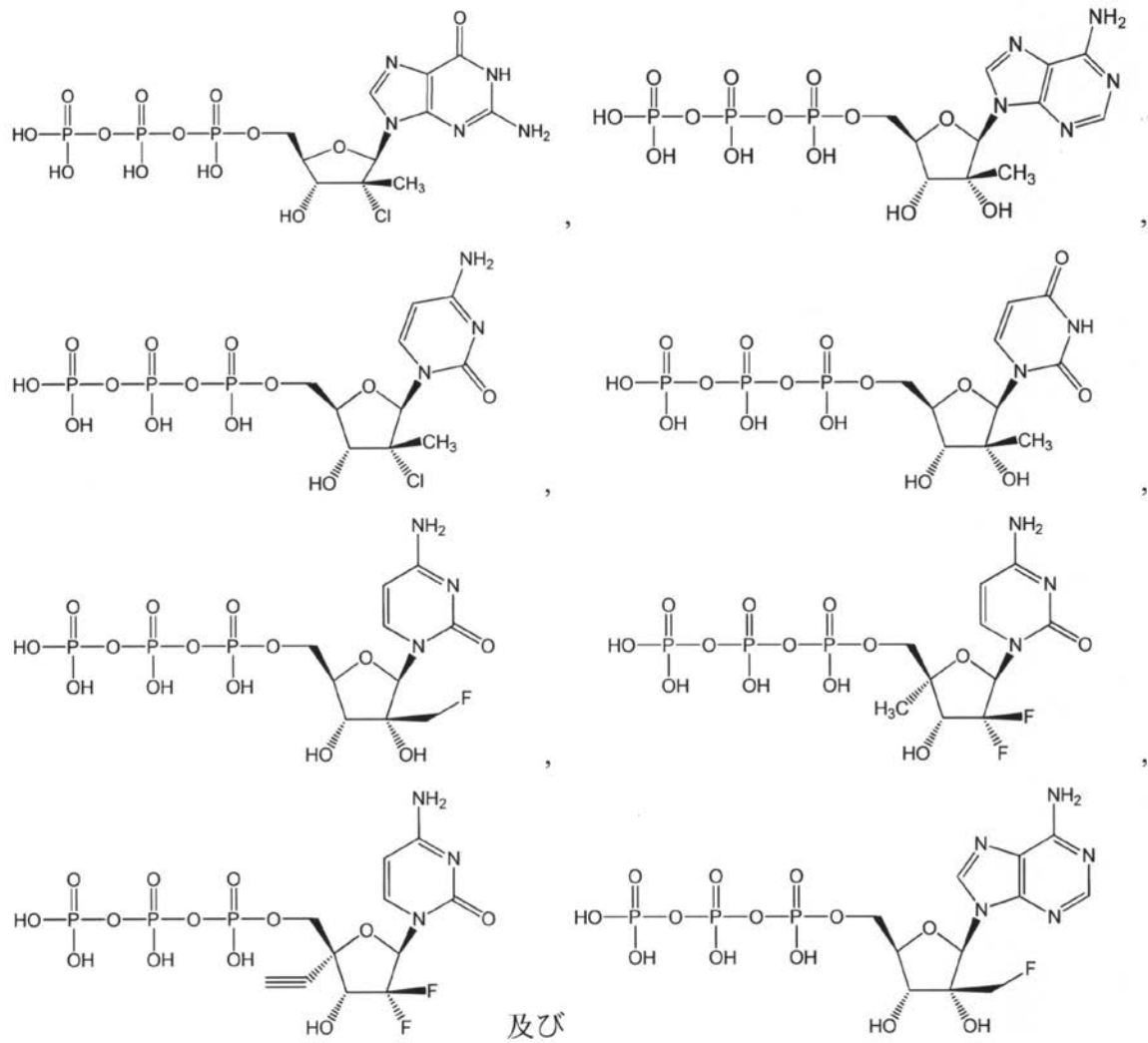
からなる群から選択される化合物またはその薬剂的に許容できる塩を含む、ピコルナウイルス科ウイルス感染症を改善または治療するための医薬組成物。

【請求項 40】

【化 8 7】







からなる群から選択される化合物またはその薬剂的に許容できる塩を含む、フラビウイ
ス科ウイルス感染症を改善または治療するための医薬組成物。