

【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

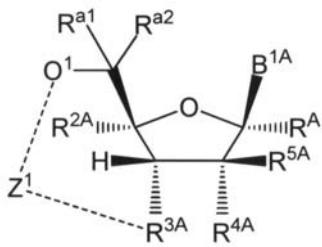
【補正の内容】

【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剤的に許容できる塩を含有する医薬組成物であって、

【化 1】



(I)

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；

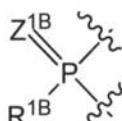
【化 2】

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、ハロウ、 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、ハロウ、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 、ハロウ、 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 、ハロウ、 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 、ハロウ、 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 $NR''^B R''^B$ 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

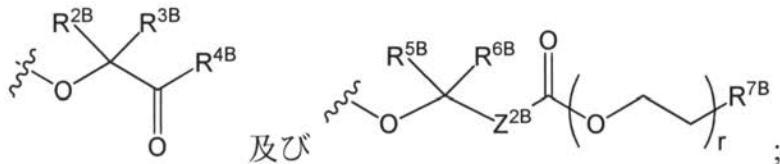
【化 4】



であり、 O^1 は O であり、 R^{2-A} は、ハロ、-CH₂F₂、-(CH₂)₁~₆F、-(CH₂)₁~₆

$\text{C}_1\text{--}\text{C}_6$ 、 $-(\text{CH}_2)_1\text{--}\text{C}_6\text{N}_3$ 、 $-(\text{CH}_2)_1\text{--}\text{C}_6\text{NH}_2$ 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 NR^BR^B 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 $\text{C}_1\text{--}\text{C}_6$ アルキル、所望により置換された $\text{C}_2\text{--}\text{C}_6$ アルケニルおよび所望により置換された $\text{C}_2\text{--}\text{C}_6$ 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 $\text{C}_1\text{--}\text{C}_6$ アルキル、

【化5】



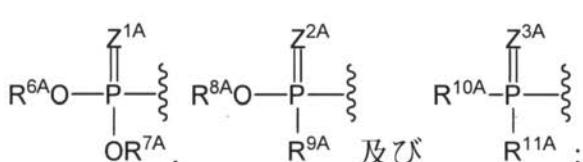
からなる群から選択され；

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 $\text{C}_1\text{--}\text{C}_3$ アルキル、非置換 $\text{C}_2\text{--}\text{C}_4$ アルケニル、非置換 $\text{C}_2\text{--}\text{C}_3$ 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

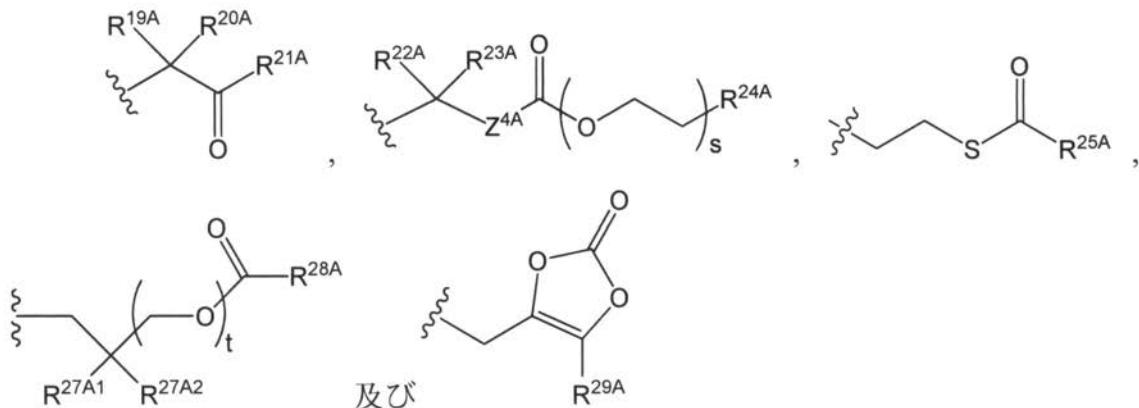
【化6】



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 $\text{C}_1\text{--}\text{C}_4$ アルキル、所望により置換された $\text{C}_2\text{--}\text{C}_4$ アルケニル、所望により置換された $\text{C}_2\text{--}\text{C}_4$ アルキニル、所望により置換された $\text{C}_3\text{--}\text{C}_6$ シクロアルキル、所望により置換された $\text{C}_3\text{--}\text{C}_6$ 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($\text{C}_1\text{--}\text{C}_6$ アルキル)、所望により置換された $^*-(\text{CR}^{15A}\text{R}^{16A})_p-\text{O}-\text{C}_1\text{--}\text{C}_4$ アルキル、所望により置換された $^*-(\text{CR}^{17A}\text{R}^{18A})_q-\text{O}-\text{C}_1\text{--}\text{C}_4$ アルケニル、

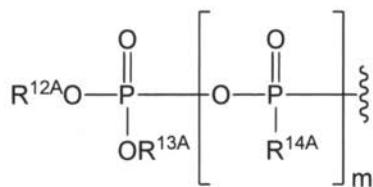
【化7】



からなる群から選択され；あるいは

R^{6A} は

【化 8】



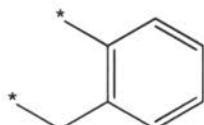
であり、 R^{7A} は不在または水素であり；あるいは
 R^{6A} および R^{7A} は一緒になって、所望により置換された

【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、 $\text{NR}^{30A}\text{R}^{31A}$ 、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；

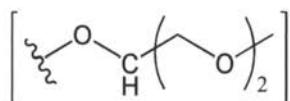
各 R^{15A} 、各 R^{16A} 、各 R^{17A} および各 R^{18A} は独立して、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキルまたはアルコキシであり；

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 $-\text{O}-\text{C}_{1-24}$ アルキル、所望により置換された $-\text{O}-$ アリール、所望により置換された $-\text{O}-$ ヘテロアリールおよび所望により置換された $-\text{O}-$ 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 $-\text{O}-\text{C}_{1-24}$ アルキル、所望により置換された $-\text{O}-$ アリール、所望により置換された $-\text{O}-$ ヘテロアリール、所望により置換された $-\text{O}-$ 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；

R²5A および R²9A は独立して、水素、所望により置換された C₁ - C₄ 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^2 7 A 1 および R^2 7 A 2 は独立して.

【化 1 2】

-C≡N

、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：

$R^{2-8}A$ は、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 $C_{2-2}4$ アルケニル、所望により置換された $C_{2-2}4$ 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；

$R^{3-0}A$ および $R^{3-1}A$ 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 $C_{2-2}4$ アルケニル、所望により置換された $C_{2-2}4$ 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''^B^1 および各 R''^B^2 は独立して、水素または所望により置換された C_{1-6} アルキルである。

R₂B、R₃B、R₅B および R₆B は独立して、水素または所望により置換された C₁-C₄アルキルであり；

R⁴BおよびR⁷Bは独立して、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アリール、所望により置換された-O-C₁₋₂₄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；

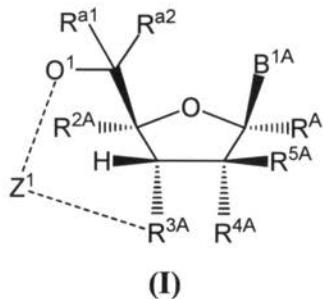
t は 1 または 2 であり；

Z¹A、Z²A、Z³A、Z⁴A、Z¹B および Z²B は独立して〇またはSである、前記医薬組成物。

【請求項2】

フランビ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剤的に許容できる塩を含有する医薬組成物であって、

【化13】

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；

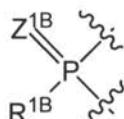
【化14】

が共に不在である場合、Z¹ は不在であり、O¹ は OR^{1A} であり、
R^{2A} は、ハロ、非置換 C₂₋₄ アルキル、非置換 C₂₋₄ アルケニル、-(CH₂)₁₋₆F または -CN であり、R^{5A} は、OH、所望により置換された C₁₋₆ アルキル、所望により置換された C₂₋₆ アルケニルおよび所望により置換された C₂₋₆ アルキニルからなる群から選択され、または、R^{2A} は、-CHF₂、-(CH₂)₁₋₆C1、-(CH₂)₁₋₆N₃ または -(CH₂)₁₋₆NH₂ であり、R^{5A} は、H、ハロ、OH、所望により置換された C₁₋₆ アルキル、所望により置換された C₂₋₆ アルケニルおよび所望により置換された C₂₋₆ 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" 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、N₃、-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15】

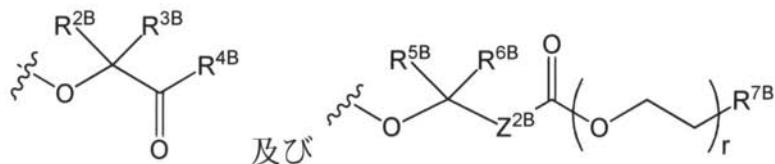
がそれぞれ単結合である場合、Z¹ は

【化16】



であり、O¹ は O であり、R^{2A} は、ハロ、-CHF₂、-(CH₂)₁₋₆F、-(CH₂)₁₋₆C1、-(CH₂)₁₋₆N₃、-(CH₂)₁₋₆NH₂ または -CN であり、R^{3A} は O であり；R^{4A} は、OH、ハロ、N₃、-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 C₁₋₆ アルキル、所望により置換された C₂₋₆ アルケニルおよび所望により置換された C₂₋₆ 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 C₁₋₆ アルキル、

【化17】



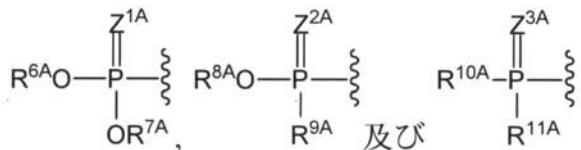
からなる群から選択され；

R^{a\ 1} および R^{a\ 2} 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^{1\ A} 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

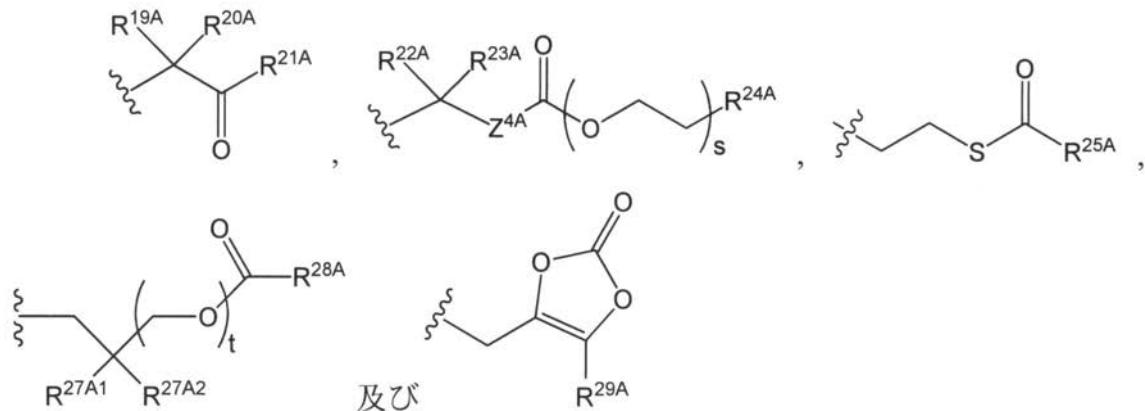
【化18】



からなる群から選択され；

R^{6\ A}、R^{7\ A} および R^{8\ A} 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 - 2} 4 アルケニル、所望により置換された C_{2 - 2} 4 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 * - (C_{1 - 5\ A} R_{1 - 6\ A})_p - O - C_{1 - 2} 4 アルキル、所望により置換された * - (C_{1 - 7\ A} R_{1 - 8\ A})_q - O - C_{1 - 2} 4 アルケニル、

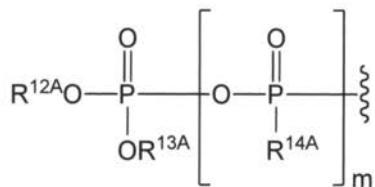
【化19】



からなる群から選択され；あるいは

R^{6\ A} は

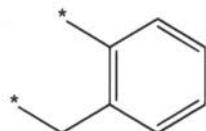
【化20】

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21】

および所望により置換された

【化22】

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、 $\text{NR}^{30A}\text{R}^3$ 、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；

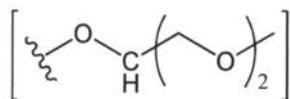
各 R^{15A} 、各 R^{16A} 、各 R^{17A} および各 R^{18A} は独立して、水素、所望により置換された C_{1-24} アルキルまたはアルコキシであり；

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 $-\text{O}-\text{C}_{1-24}$ アルキル、所望により置換された $-\text{O}-\text{アリール}$ 、所望により置換された $-\text{O}-\text{ヘテロアリール}$ および所望により置換された $-\text{O}-\text{单環式ヘテロシクリル}$ 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 $-\text{O}-\text{C}_{1-24}$ アルキル、所望により置換された $-\text{O}-\text{アリール}$ 、所望により置換された $-\text{O}-\text{ヘテロアリール}$ 、所望により置換された $-\text{O}-\text{单環式ヘテロシクリル}$ および

【化23】



からなる群から選択され；

R₂⁵A および R₂⁹A は独立して、水素、所望により置換された C₁ - ₂ ₄ 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；

R₂⁷A₁ および R₂⁷A₂ は独立して、

【化24】



、所望により置換された C₂ - ₈ オルガニルカルボニル、所望により置換された C₂ - ₈ アルコキシカルボニルおよび所望により置換された C₂ - 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；

R₂⁸A は、水素、所望により置換された C₁ - ₂ ₄ アルキル、所望により置換された C₂ - ₂ ₄ アルケニル、所望により置換された C₂ - ₂ ₄ アルキニル、所望により置換された C₃ - ₆ シクロアルキルおよび所望により置換された C₃ - ₆ シクロアルケニルからなる群から選択され；

R₃⁰A および R₃¹A は独立して、水素、所望により置換された C₁ - ₂ ₄ アルキル、所望により置換された C₂ - ₂ ₄ アルケニル、所望により置換された C₂ - ₂ ₄ 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 シクロアルケニルおよび所望により置換されたアリール (C₁ - ₄ アルキル) からなる群から選択され；

R^mA および各 RⁿB は独立して、所望により置換された C₁ - ₂ ₄ アルキルであり；
各 R^mB₁ および各 RⁿB₂ は独立して、水素または所望により置換された C₁ - ₆ アルキルであり；

R²B、R³B、R⁵B および R⁶B は独立して、水素または所望により置換された C₁ - ₂ ₄ アルキルであり；

R⁴B および R⁷B は独立して、水素、所望により置換された C₁ - 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-C₁ - 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；

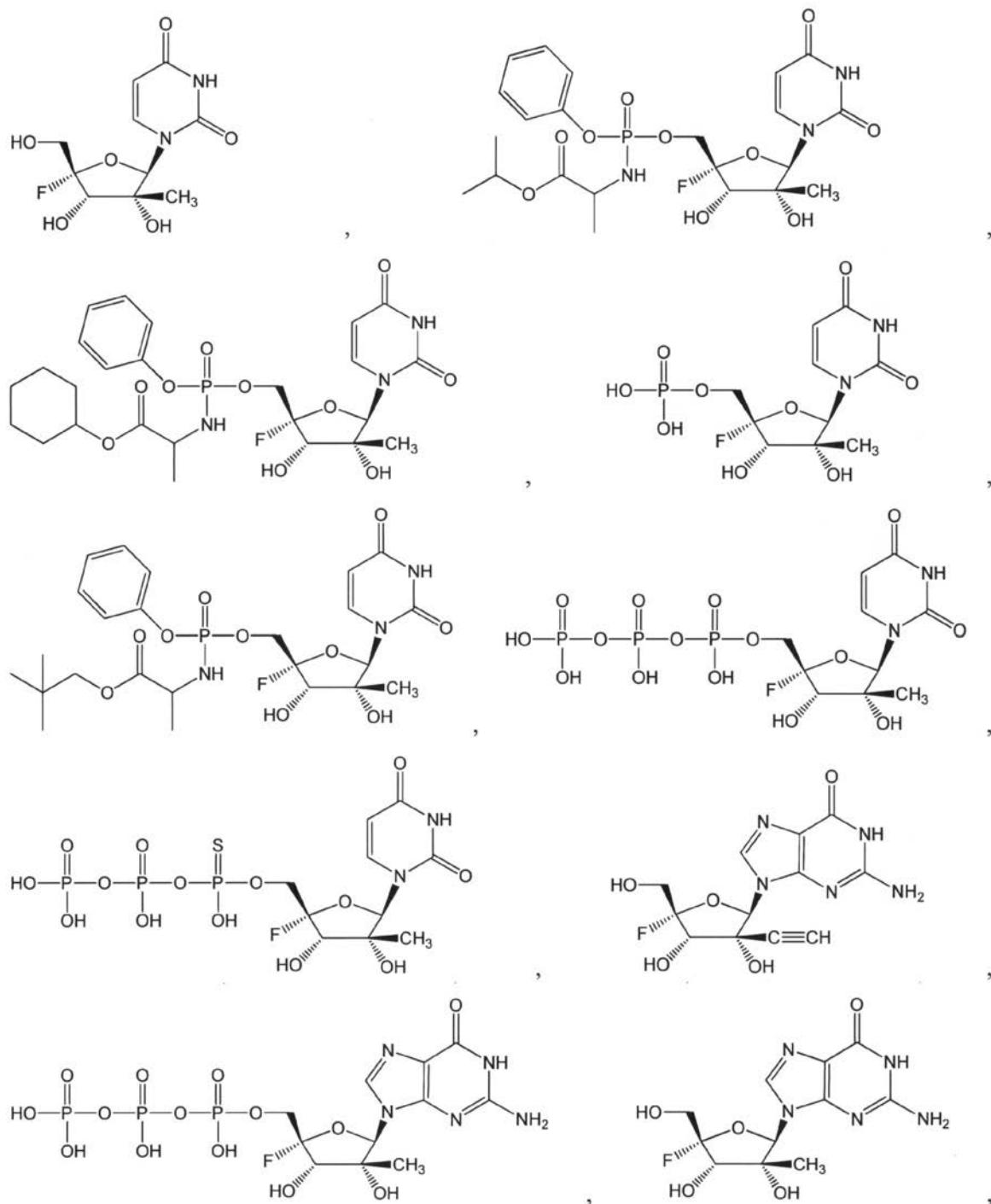
p および q は独立して 1、2 または 3 であり；

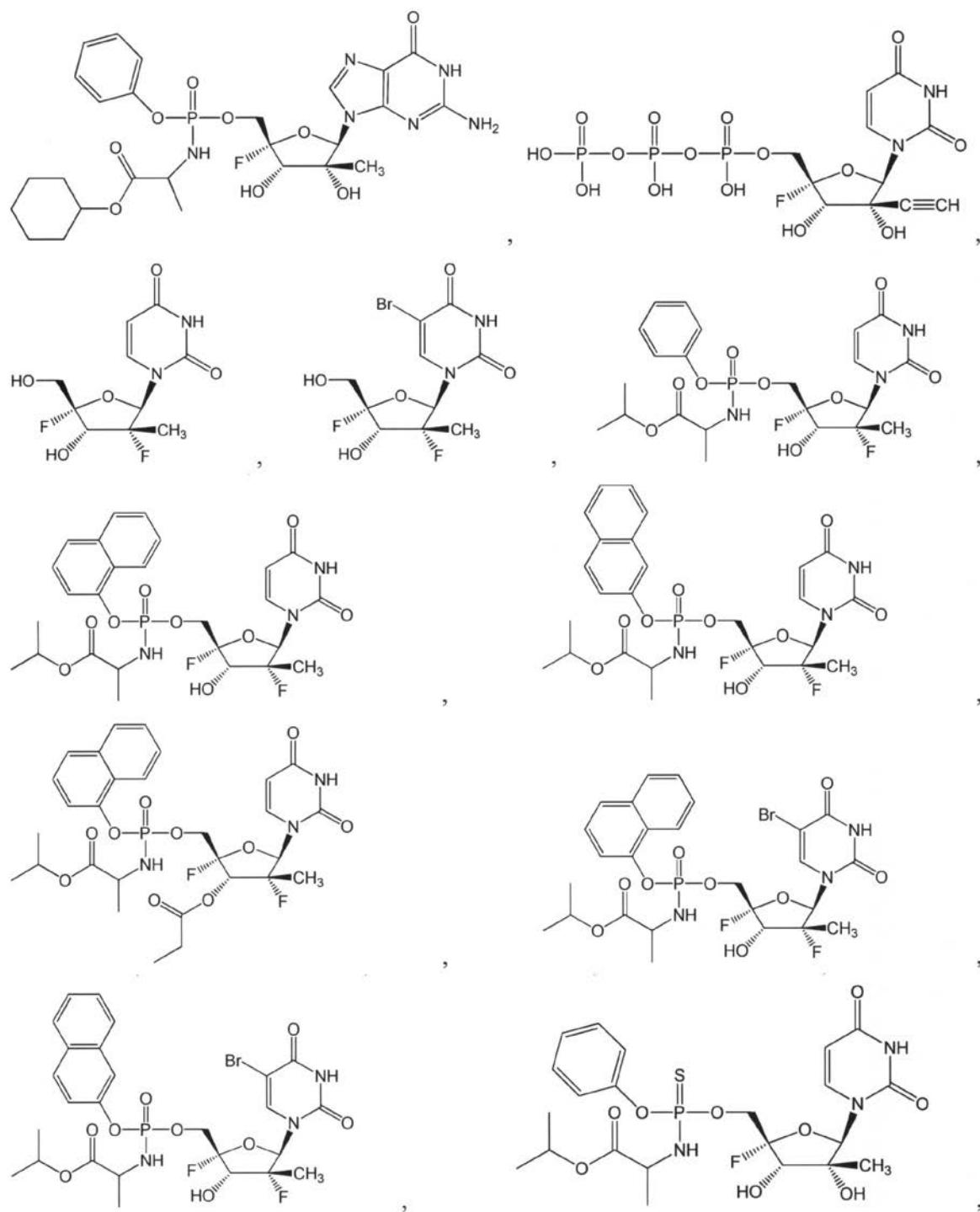
r および s は独立して 0、1、2 または 3 であり；

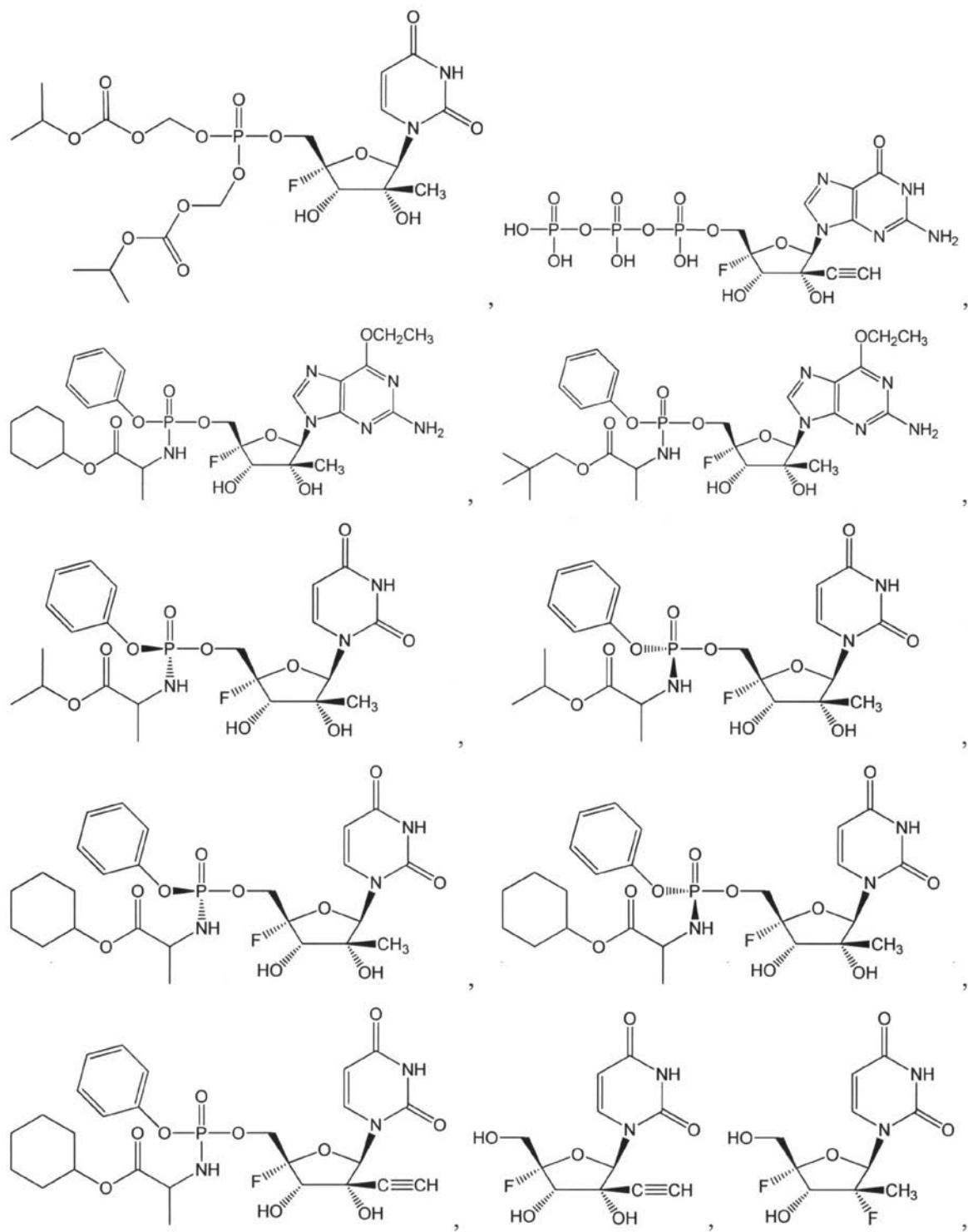
t は 1 または 2 であり；

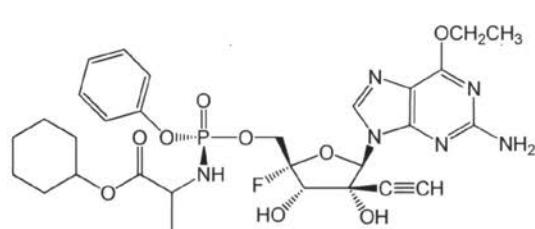
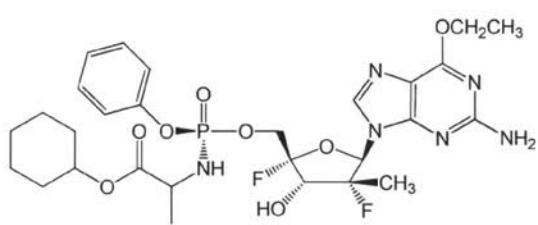
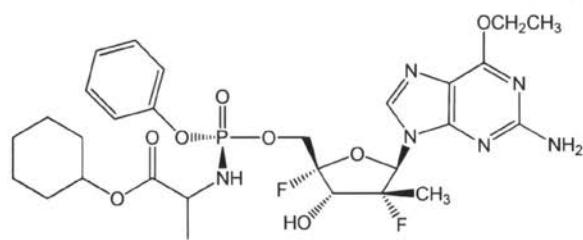
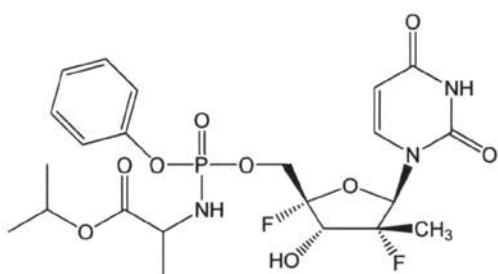
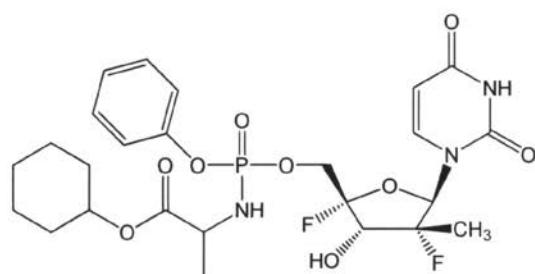
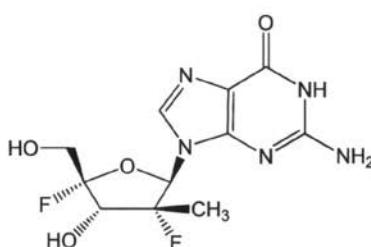
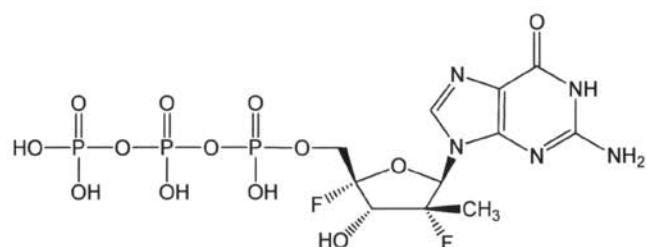
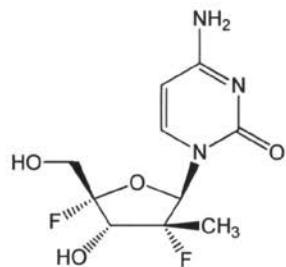
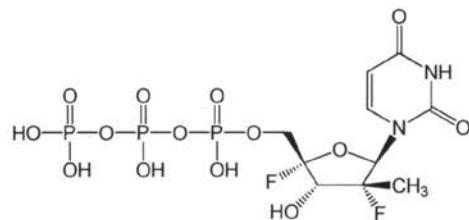
Z¹A、Z²A、Z³A、Z⁴A、Z¹B および Z²B は独立して O または S であり、
ただし、式 (I) の化合物またはその薬剤的に許容できる塩は、

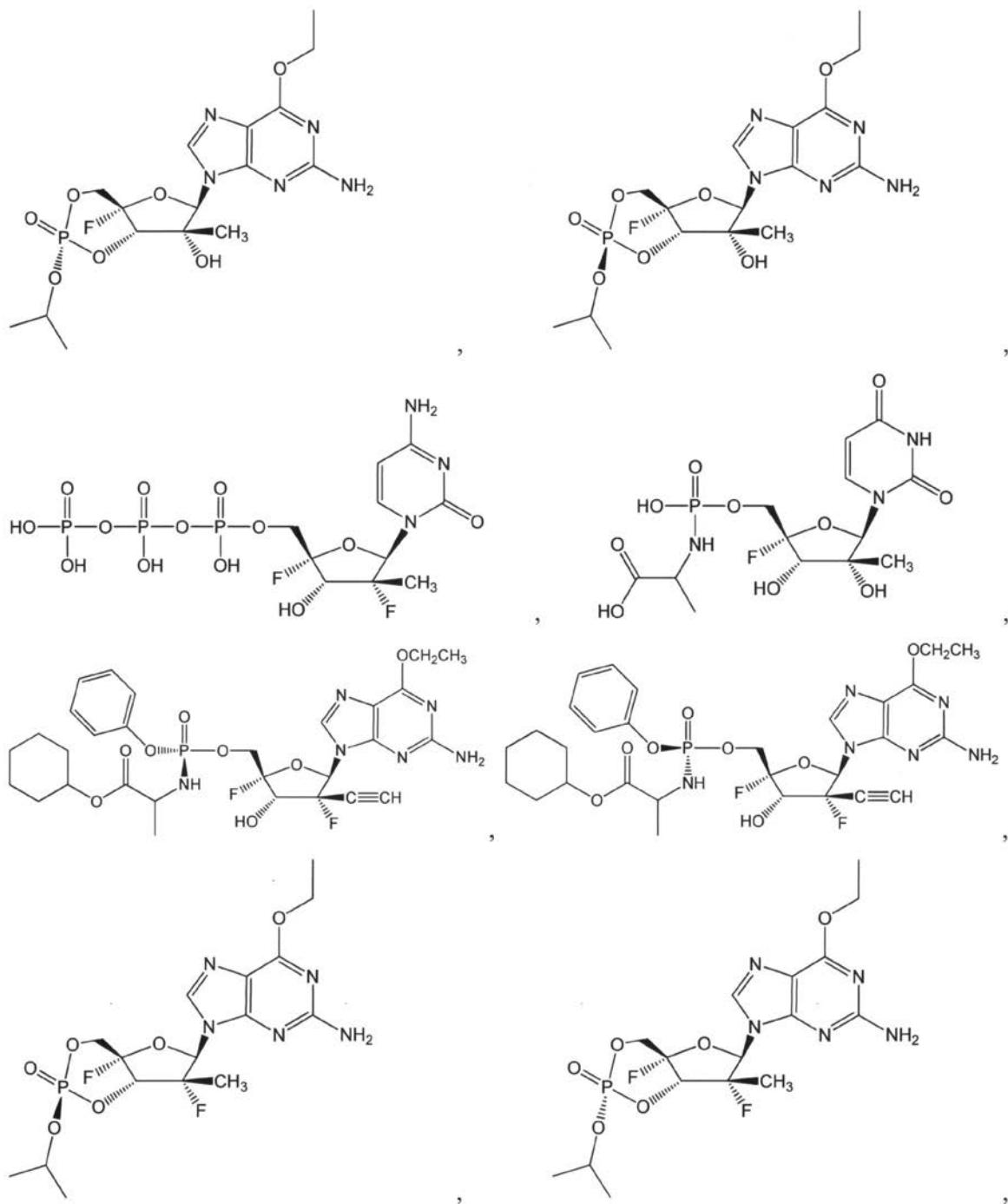
【化 2 5】

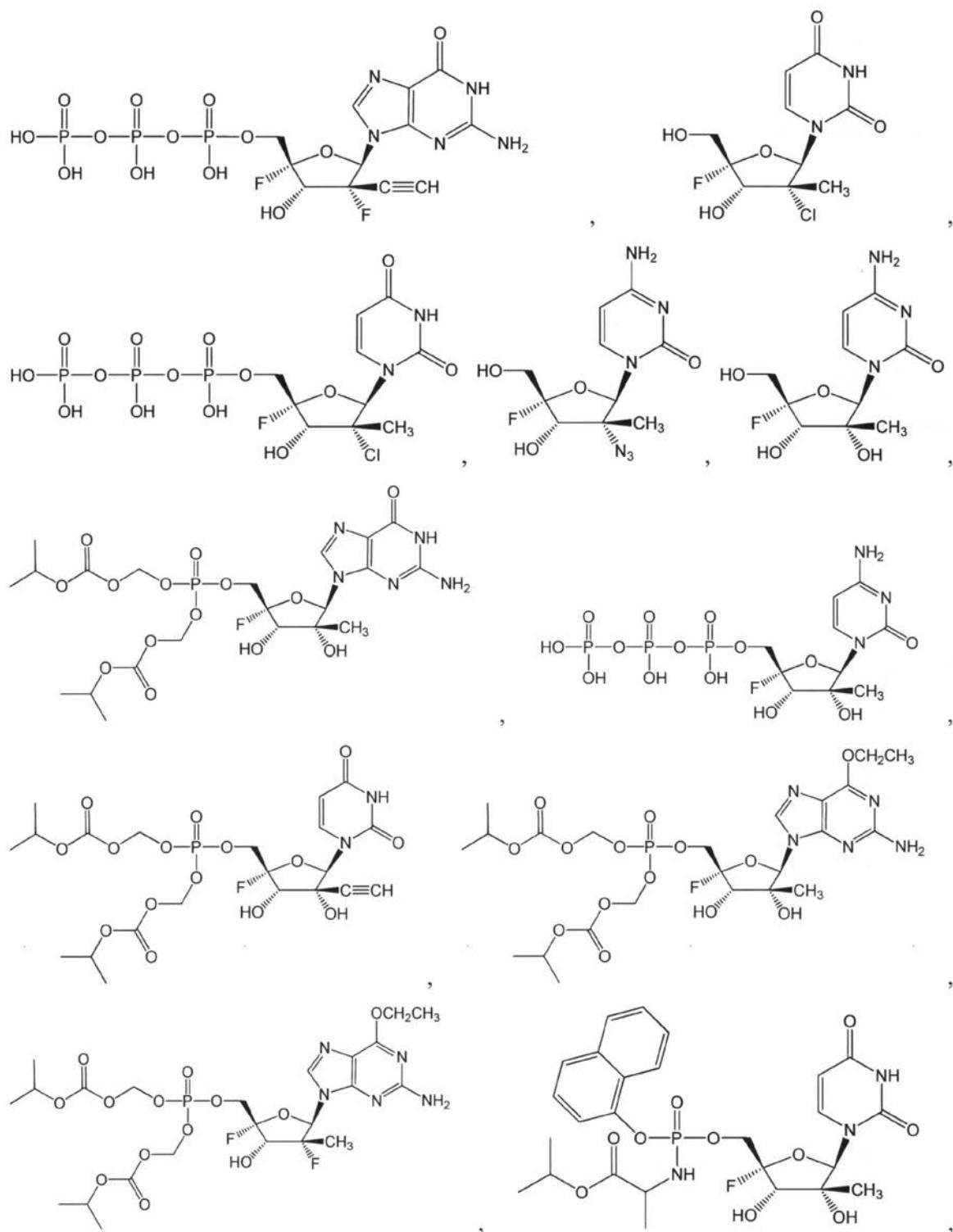


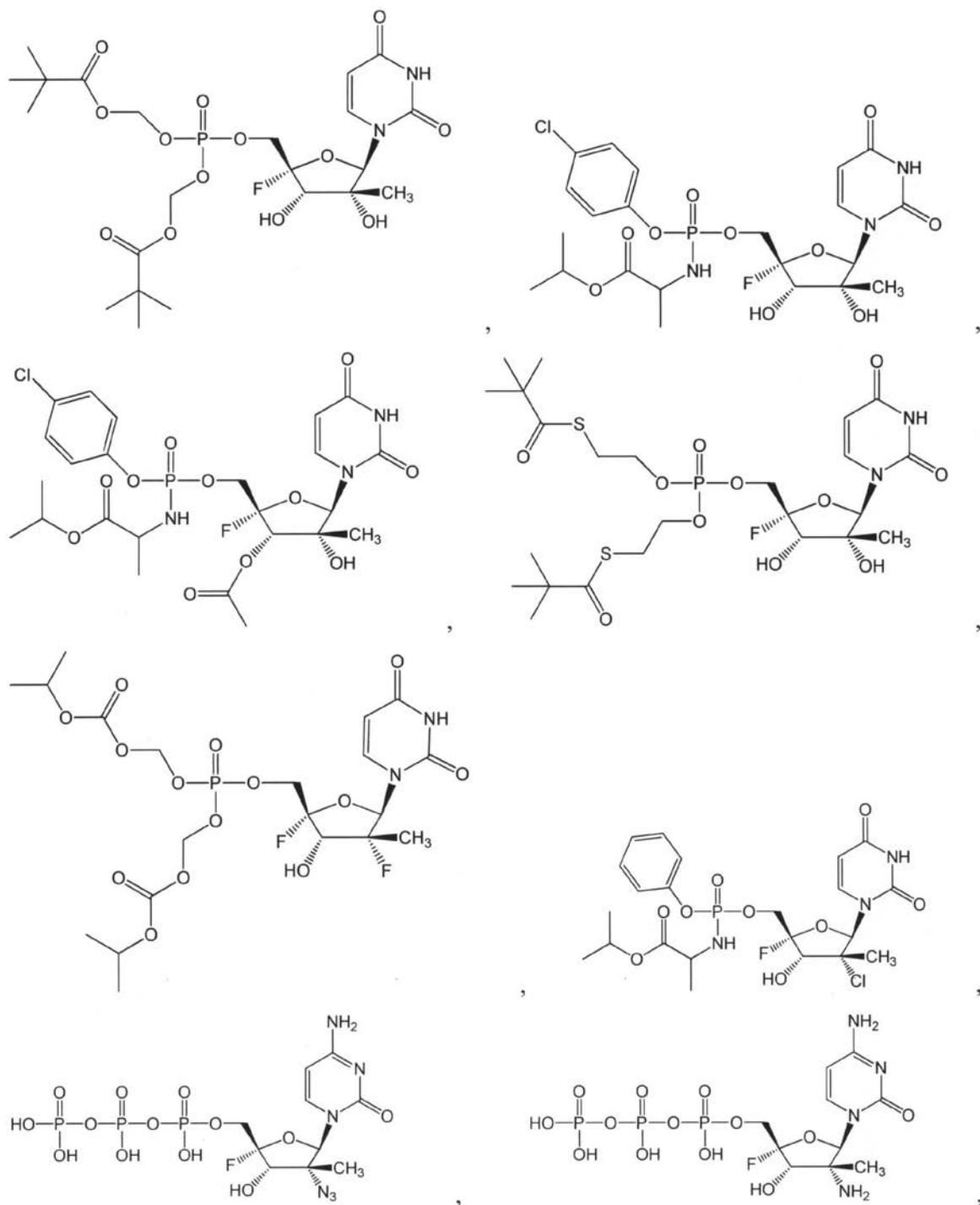


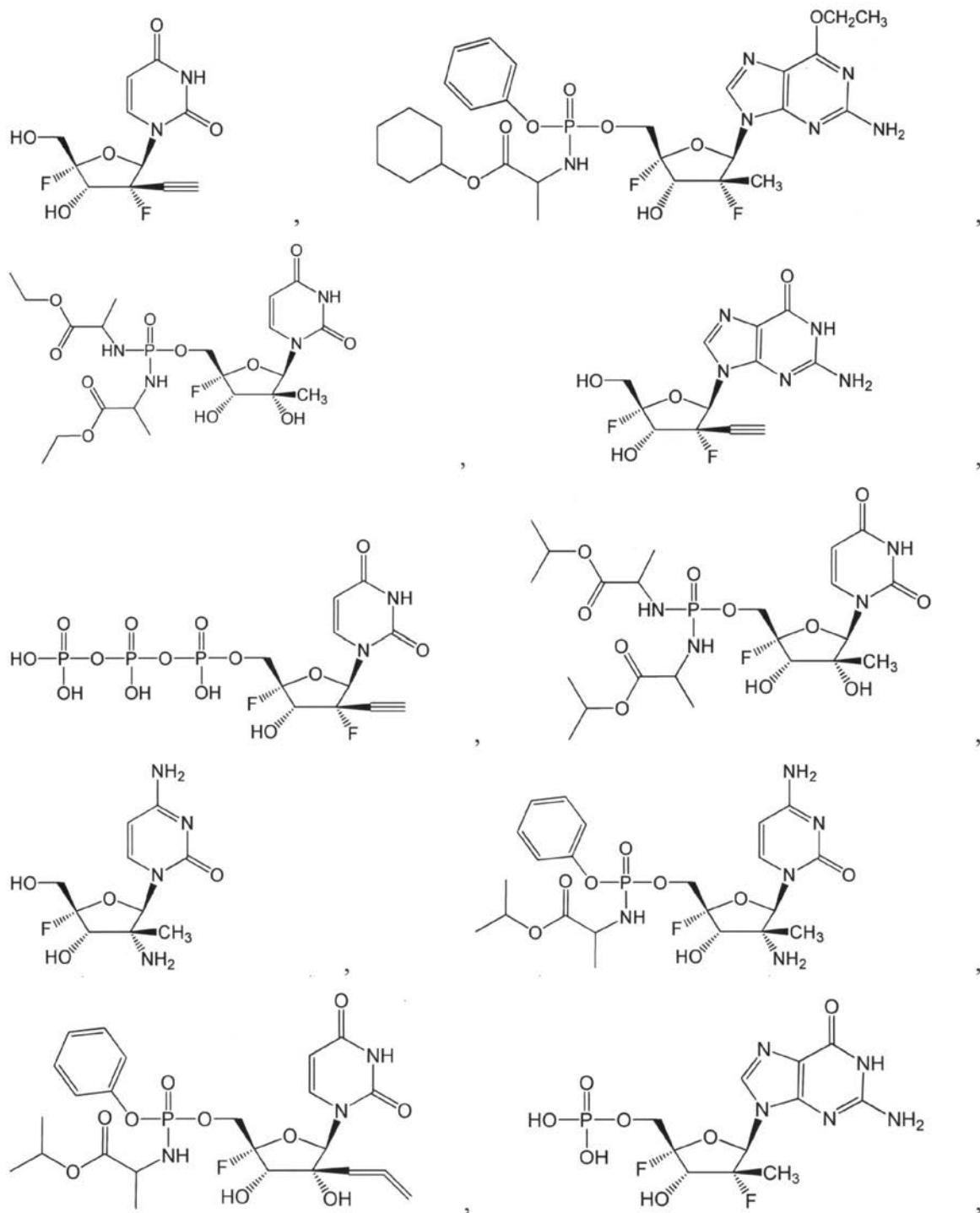


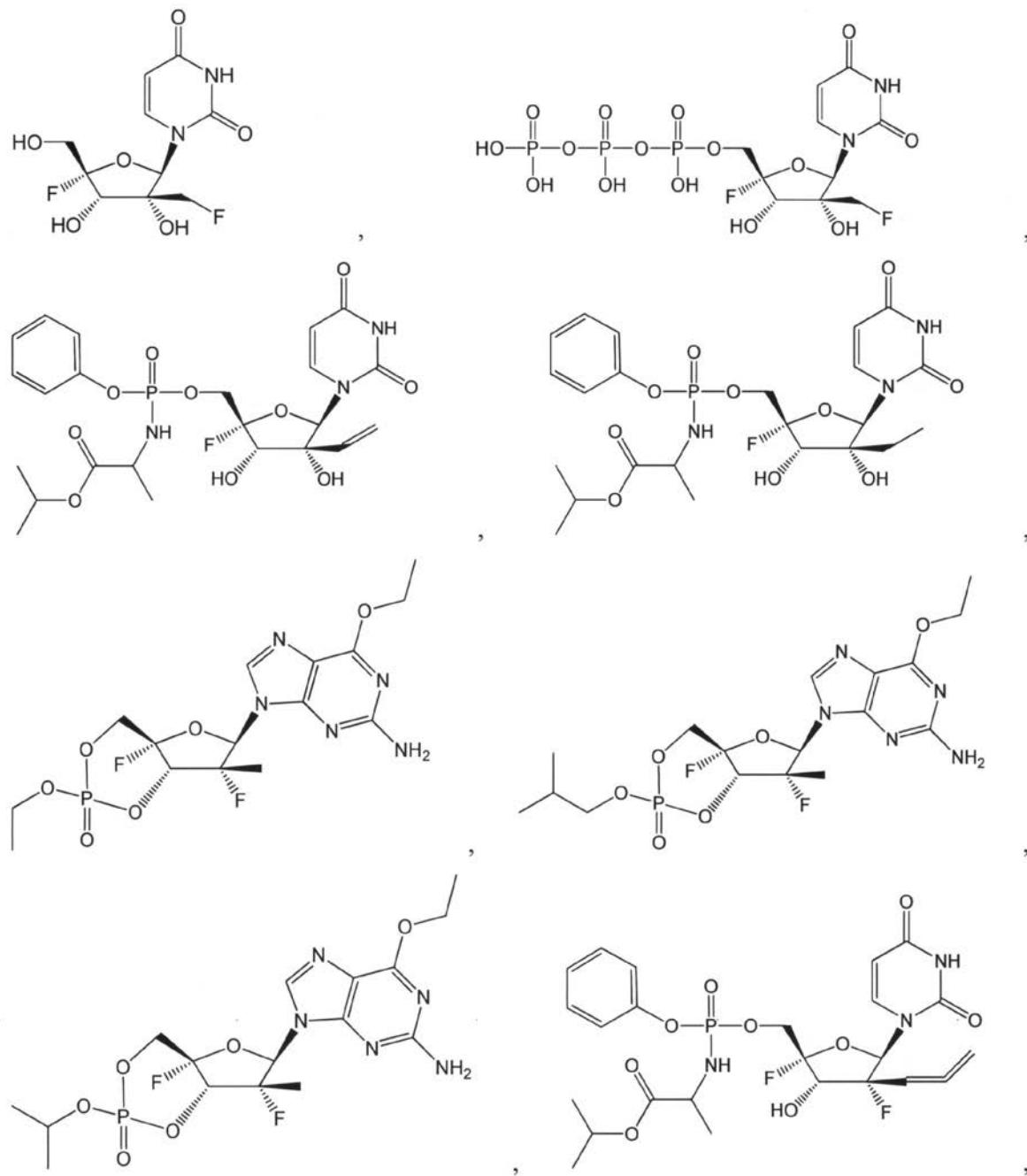


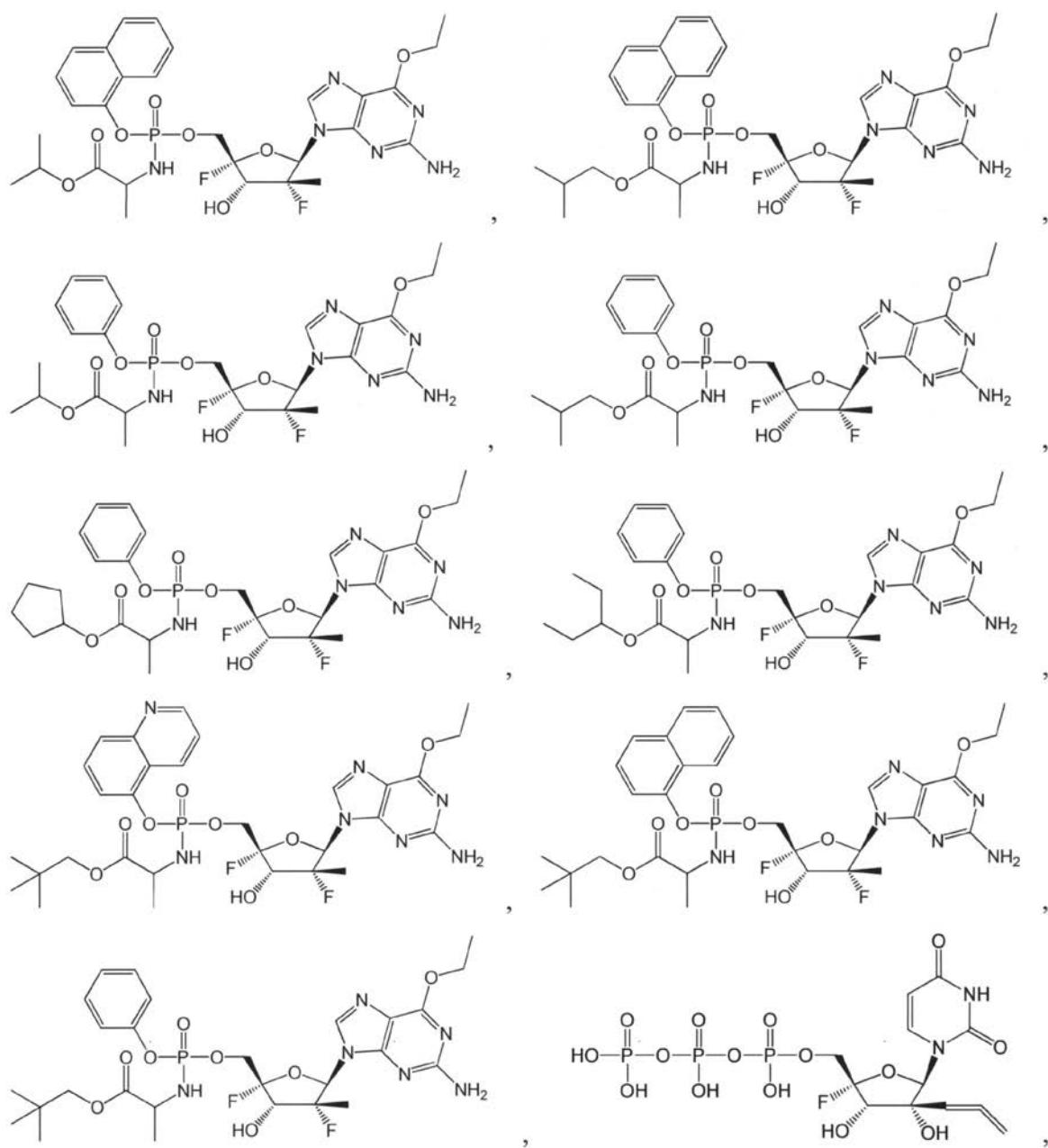


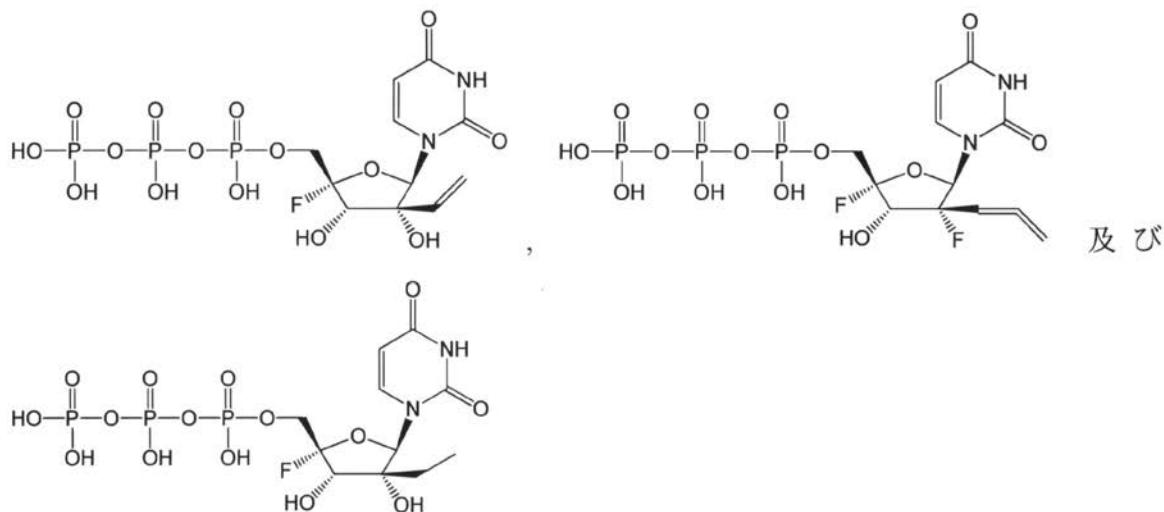












、または上記の薬剤的に許容できる塩からなる群から選択され得ない、前記医薬組成物。

【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-CHF₂、-(CH₂)_{1~6}Cl、-(CH₂)_{1~6}N₃、または-(CH₂)_{1~6}NH₂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-CHF₂、-(CH₂)_{1~6}Cl、-(CH₂)_{1~6}N₃、または-(CH₂)_{1~6}NH₂であり、R^{5A}がハロである、請求項1または2に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

R^{2A}が-(CH₂)_{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^B、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、N₃、またはNR^{B1}R^{B2}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】

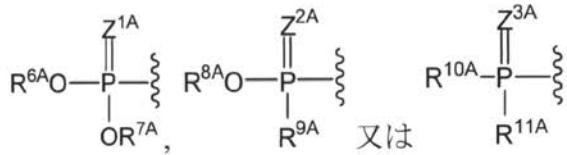
R^{1A}が所望により置換されたアシルまたは所望により置換されたO結合型アミノ酸で

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 1 3】

R^{1A} が

【化 2 6】

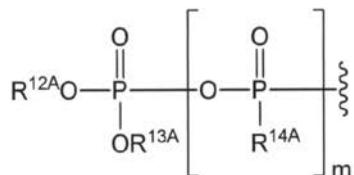


である、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

R^{6A} が

【化 2 7】



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 1 3 に記載の医薬組成物。

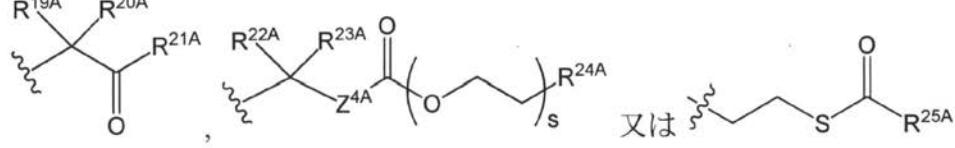
【請求項 1 5】

R^{6A} および R^{7A} が独立して、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 C_{2 - 2 4} アルケニル、所望により置換された C_{2 - 2 4} 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 *-(CR^{1 5A}R^{1 6A})_p-O-C_{1 - 2 4} アルキル、または所望により置換された *-(CR^{1 7A}R^{1 8A})_q-O-C_{1 - 2 4} アルケニルである、または

R^{6A} および R^{7A} は独立して、

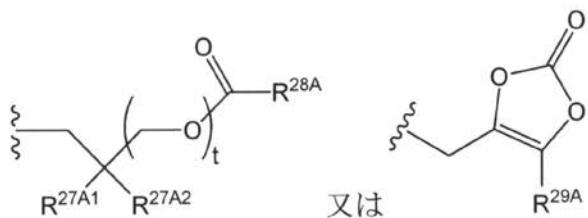
【化 2 8】



であり、または、

R^{6A} および R^{7A} は独立して、

【化29】



であり、または、

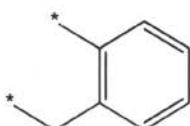
R^{6A}およびR^{7A}は一緒になって、所望により置換された

【化30】



および所望により置換された

【化31】



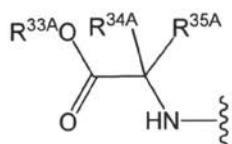
からなる群から選択される部分を形成し、R^{6A}およびR^{7A}に連結された酸素、リン並びに前記部分は6員～10員の環系を形成する、請求項13に記載の医薬組成物。

【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、

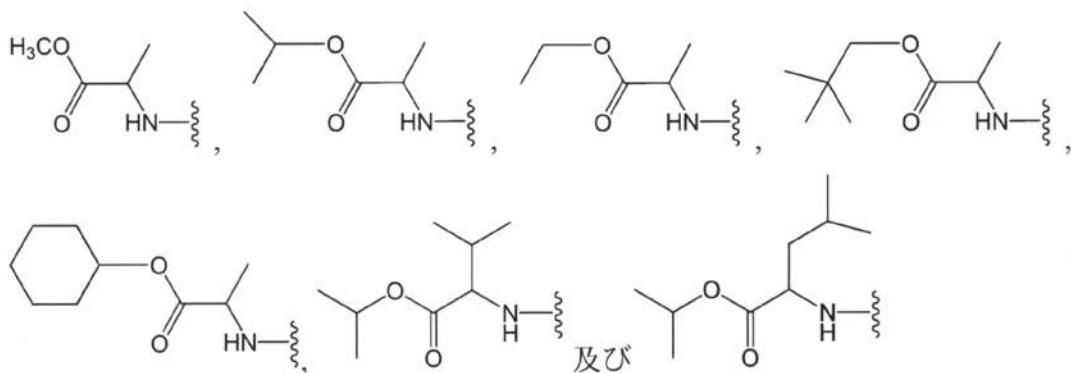
R^{8A}が所望により置換されたアリールまたは所望により置換されたヘテロアリールであり、R^{9A}が

【化32】



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C₆アリール、所望により置換されたC₁₀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33】



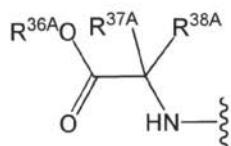
からなる群から選択される、請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項17】

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、

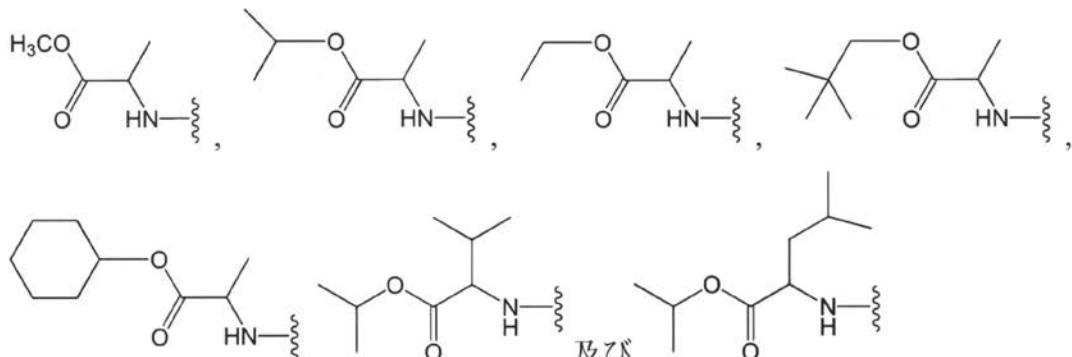
R^{10A}およびR^{11A}が独立して

【化34】



であり、式中、R^{36A}が水素、所望により置換されたC₁₋₆アルキル、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アリール、所望により置換されたアリール(C₁₋₆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C₁₋₆アルキル、所望により置換されたC₁₋₆ハロアルキル、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C₆アリール、所望により置換されたC₁₋₆アリールおよび所望により置換されたアリール(C₁₋₆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C₁₋₄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C₃₋₆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35】



からなる群から選択される、請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項18】

【化36】

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37】

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 、 $-OC(=O)R''^A$ 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。

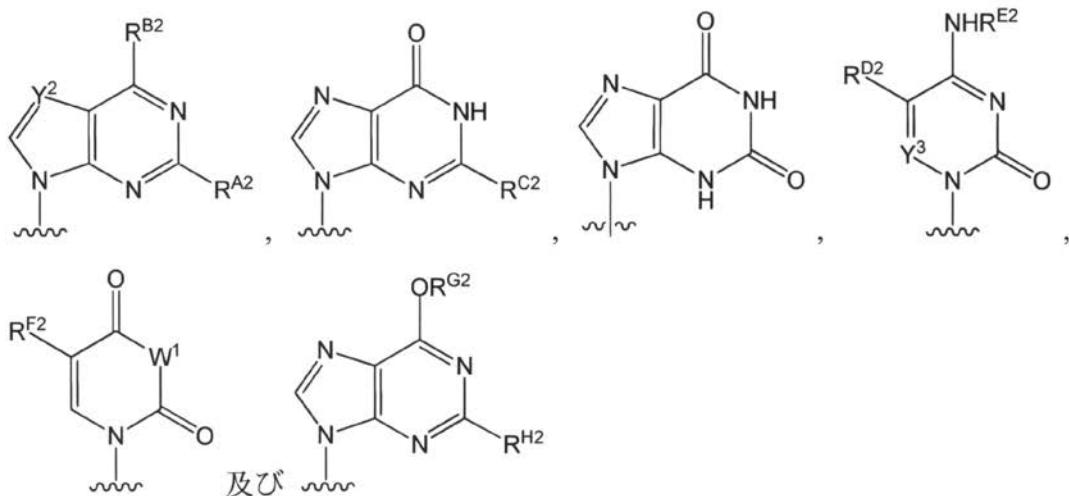
【請求項20】

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38】



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^F が水素、ハロゲン、所望により置換された $C_{1\sim6}$ アルキル、所望により置換された $C_{2\sim6}$ アルケニルおよび所望により置換された $C_{2\sim6}$ 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^I であり、式中、 R^I は水素、ハロゲン、所望により置換された $C_{1\sim6}$ アルキル、所望により置換された $C_{2\sim6}$ アルケニルおよび所望により置換された $C_{2\sim6}$ アルキニルからなる群から選択され；

W^1 が NH 、 $-NCH_2-O-C(=O)CH(NH_2)-CH(CH_3)_2$ または $-CH_2-O-P(=O)(OW^{1A})_2$ 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 $C_{1\sim6}$ アルキルからなる群から選択され；

R^G が所望により置換された $C_{1\sim6}$ アルキルであり；

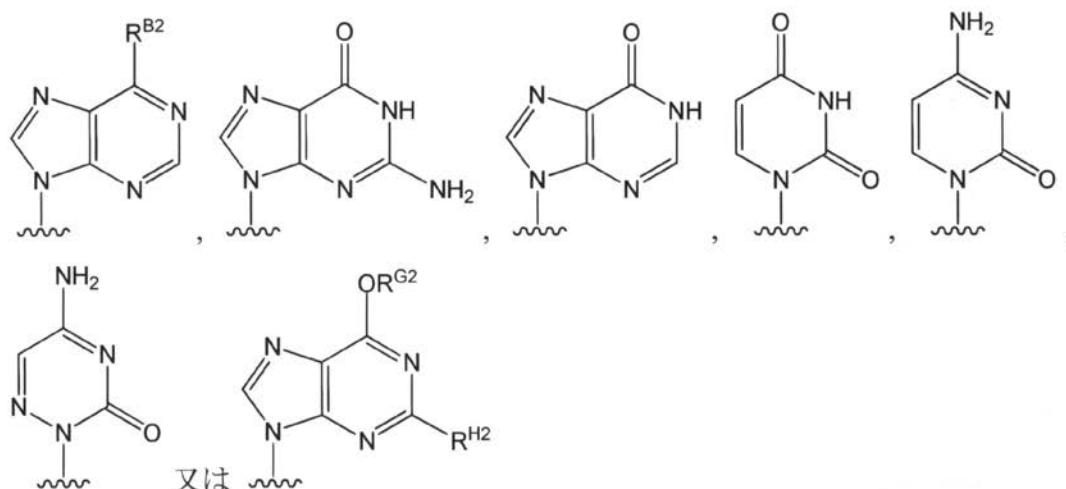
R^H が水素または NHR^T であり、式中、 R^T は独立して水素、 $-C(=O)R^U$ および $-C(=O)OR^V$ からなる群から選択され；

R^K 、 R^L 、 R^M 、 R^N 、 R^P 、 R^Q 、 R^R 、 R^S 、 R^U および R^V が独立して水素、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、 $C_{3\sim6}$ シクロアルキル、 $C_{3\sim6}$ シクロアルケニル、 $C_{6\sim10}$ アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール ($C_{1\sim6}$ アルキル)、ヘテロアリール ($C_{1\sim6}$ アルキル) およびヘテロシクリル ($C_{1\sim6}$ 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】

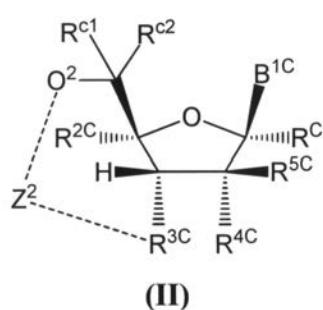


であり、 R^B が NH_2 であり、 R^G が非置換の $C_{1\sim6}$ アルキルであり、 R^H が NH_2 である、請求項 21 に記載の医薬組成物。

【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剤的に許容できる塩であって、

【化 40】



式中、

R^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41】

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

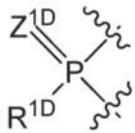
望により置換された O 結合型アミノ酸および $NR''D^1R''D^2$ からなる群から選択され、あるいは、 R^3C および R^4C は共にカルボニルを介して連結された酸素原子であるこ

とで 5 員環を形成し；

【化42】

がそれぞれ単結合である場合、 Z^2 は

【化43】



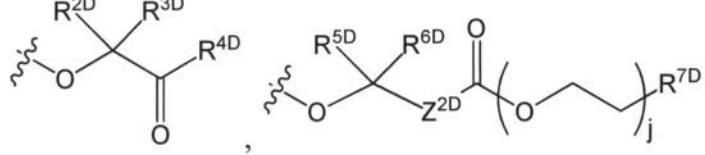
であり、 O^2 は O であり、 R^3C は O であり； R^2C は、ハロ、 $-CH_2F$ 、 $- (CH_2)_1-_6F$

、 $- (CH_2)_1-_6Cl$ 、 $- (CH_2)_1-_6N_3$ 、 $- (CH_2)_1-_6NH_2$ 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 $NR''D^1R''D^2$ 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44】



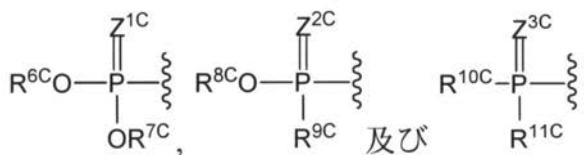
からなる群から選択され；

R^C_1 および R^C_2 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

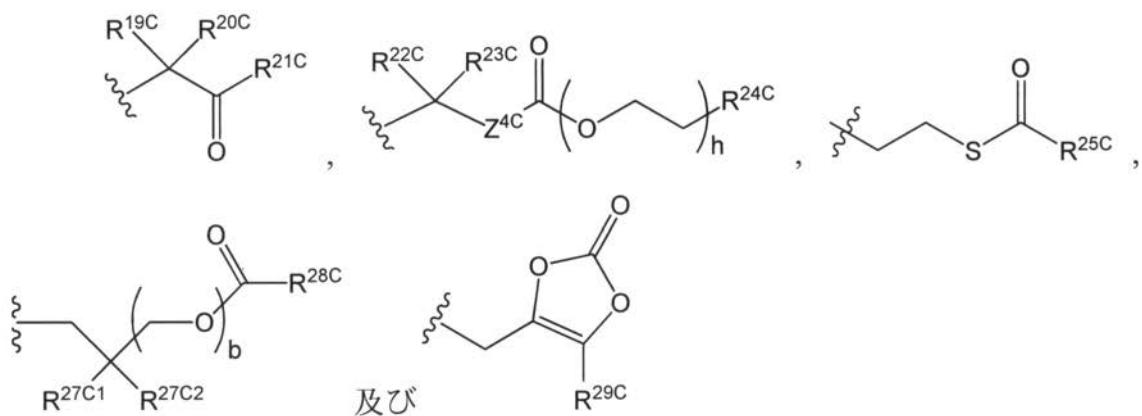
【化45】



からなる群から選択され；

$\underline{R^6C}$ 、 $\underline{R^7C}$ および $\underline{R^8C}$ 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 $^{*-}(CR^{15}C R^{16}C)_f-O-C_{1-24}$ アルキル、所望により置換された $^{*-}(CR^{17}C R^{18}C)_g-O-C_{1-24}$ アルケニル、

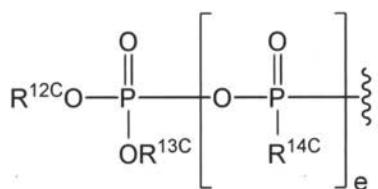
【化46】



からなる群から選択され；あるいは、

R^6C は

【化47】



であり、 R^7C は不在または水素であり；あるいは、

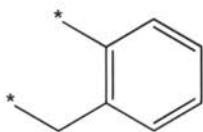
R^6C および R^7C は一緒になって、所望により置換された

【化48】



および所望により置換された

【化49】



からなる群から選択される部分を形成し、 $R^{6\text{ C}}$ および $R^{7\text{ C}}$ 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；

$R^{9\text{ C}}$ は、所望により置換された $C_{1\sim2\text{ 4}}$ アルキル、所望により置換された $C_{2\sim2\text{ 4}}$ アルケニル、所望により置換された $C_{2\sim2\text{ 4}}$ アルキニル、所望により置換された $C_{3\sim6}$ シクロアルキル、所望により置換された $C_{3\sim6}$ シクロアルケニル、 $NR^{3\sim0}CR^{3\sim1\text{ C}}$ 、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；

$R^{10\text{ C}}$ および $R^{11\text{ C}}$ 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；

$R^{12\text{ C}}$ および $R^{13\text{ C}}$ は独立して不在または水素であり；

$R^{14\text{ C}}$ は O^- 、 OH またはメチルであり；

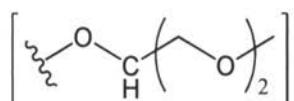
各 $R^{15\text{ C}}$ 、各 $R^{16\text{ C}}$ 、各 $R^{17\text{ C}}$ および各 $R^{18\text{ C}}$ は独立して、水素、所望により置換された $C_{1\sim2\text{ 4}}$ アルキルまたはアルコキシであり；

$R^{19\text{ C}}$ 、 $R^{20\text{ C}}$ 、 $R^{22\text{ C}}$ および $R^{23\text{ C}}$ は独立して、水素、所望により置換された $C_{1\sim2\text{ 4}}$ 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；

$R^{21\text{ C}}$ は、水素、所望により置換された $C_{1\sim2\text{ 4}}$ 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 $-O-C_{1\sim2\text{ 4}}$ 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 $-O-$ 单環式ヘテロシクリルからなる群から選択され；

$R^{24\text{ C}}$ は、水素、所望により置換された $C_{1\sim2\text{ 4}}$ 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 $-O-C_{1\sim2\text{ 4}}$ 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、所望により置換された $-O-$ 单環式ヘテロシクリルおよび

【化50】



からなる群から選択され；

$R^{25\text{ C}}$ および $R^{29\text{ C}}$ は独立して、水素、所望により置換された $C_{1\sim2\text{ 4}}$ 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；

$R^{27\text{ C}}^1$ および $R^{27\text{ C}}^2$ は独立して、

【化51】



、所望により置換された $C_{2\sim8}$ オルガニルカルボニル、所望により置換された $C_{2\sim8}$ アルコキシカルボニルおよび所望により置換された $C_{2\sim8}$ オルガニルアミノカルボニルからなる群から選択され；

$R^{28\text{ C}}$ は水素、所望により置換された $C_{1\sim2\text{ 4}}$ アルキル、所望により置換された $C_{2\sim2\text{ 4}}$ アルケニル、所望により置換された $C_{2\sim2\text{ 4}}$ アルキニル、所望により置換された $C_{3\sim6}$ シクロアルキルおよび所望により置換された $C_{3\sim6}$ シクロアルケニルからなる群から選択され；

$R^{30\text{ C}}$ および $R^{31\text{ C}}$ は独立して、水素、所望により置換された $C_{1\sim2\text{ 4}}$ アルキル、所望により置換された $C_{2\sim2\text{ 4}}$ アルケニル、所望により置換された $C_{2\sim2\text{ 4}}$ アルキ

ニル、所望により置換された C₃ - C₆ シクロアルキル、所望により置換された C₃ - C₆ 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 (C₁ - C₄ アルキル) からなる群から選択され；

R^{a1}C および各 R^{a2}D は独立して所望により置換された C₁ - C₂4 アルキルであり；各 R^{a3}D¹ および各 R^{a4}D² は独立して水素または所望により置換された C₁ - C₂4 アルキルであり；

R^{a5}D³、R^{a6}D⁴ および R^{a7}D⁵ は独立して、水素または所望により置換された C₁ - C₂4 アルキルであり、

R^{a8}D⁶ および R^{a9}D⁷ は独立して、水素、所望により置換された C₁ - C₂4 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-C₁ - C₂4 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；

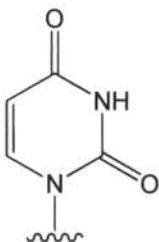
Z^{a10}C、Z^{a11}C、Z^{a12}C、Z^{a13}C、Z^{a14}D および Z^{a15}D¹ は独立して O または S であり；

ただし、R^{a2}C がハロであり；

【化 5 2】

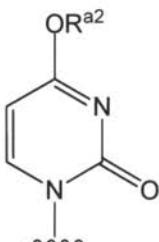
が共に不在であり；Z^{a2} が不在であり；O^{a2} が OR^{a1}C であり；B^{a1}C が所望により置換された

【化 5 3】



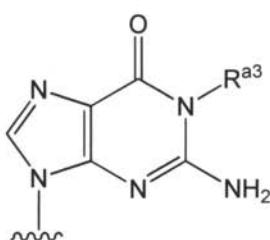
、所望により置換された

【化 5 4】



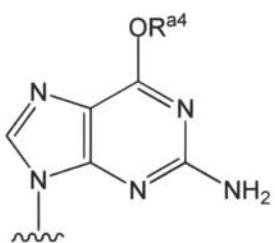
、所望により置換された

【化 5 5】



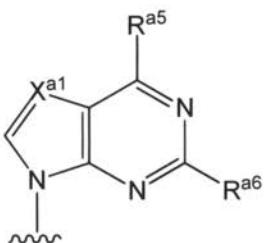
、所望により置換された

【化56】



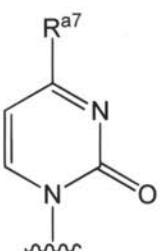
、所望により置換された

【化57】



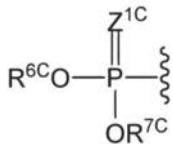
および所望により置換された

【化58】

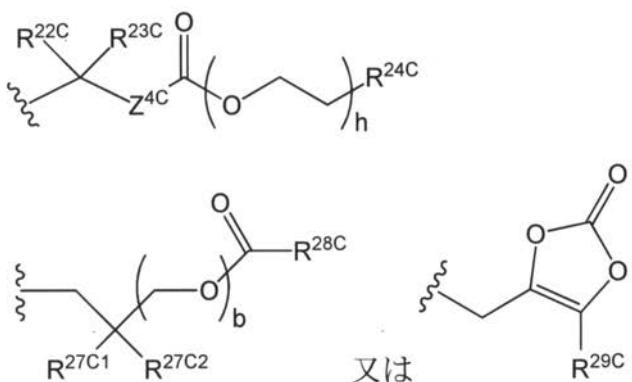


からなる群から選択され、式中、R^{a2}が所望により置換されたC₁₋₆アルキルまたは所望により置換されたC₃₋₆シクロアルキルであり、R^{a3}およびR^{a4}が独立して水素、非置換C₁₋₆アルキル、非置換C₃₋₆アルケニル、非置換C₃₋₆アルキニルおよび非置換C₃₋₆シクロアルキルからなる群から選択され、R^{a5}がNHR^{a8}であり、R^{a6}が水素、ハロゲンまたはNHR^{a9}であり；R^{a7}がNHR^{a10}であり；R^{a8}が水素、所望により置換されたC₁₋₆アルキル、所望により置換されたC₃₋₆アルケニル、所望により置換されたC₃₋₆シクロアルキル、-C(=O)R^{a11}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C₁₋₆アルキル、所望により置換されたC₃₋₆アルケニル、所望により置換されたC₃₋₆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C₁₋₆アルキル、所望により置換されたC₃₋₆アルケニル、所望により置換されたC₃₋₆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C₁₋₆アルキル、所望により置換されたC₂₋₆アルケニルおよび所望により置換されたC₂₋₆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C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₃₋₆シクロアルケニル、C₆₋₁₀アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール(C₁₋₆アルキル)、ヘテロアリール(C₁₋₆アルキル)およびヘテロシクリル(C₁₋₆アルキル)からなる群から選択される場合；R³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；R⁴

^c は O H、ハロ、N₃、-O C (=O) R^D、所望により置換されたO結合型アミノ酸およびN R^D R^Dからなる群から選択され；あるいは、R³^c はH、ハロ、OH、-O C (=O) R^D 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；R⁴^c 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、R¹^c は
【化59】

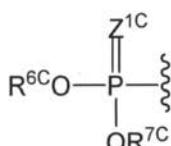


であり、式中、R⁶^c およびR⁷^c は独立して、hが1、2または3である
【化60】



であり；あるいは、R¹^c は

【化61】

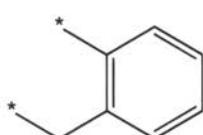


であり、式中、R⁶^c およびR⁷^c は一緒にになって、所望により置換された
【化62】



および所望により置換された

【化63】



からなる群から選択される部分を形成し、R⁶^c およびR⁷^c 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、R²^c が非置換C₁～₄アルキル、非置換C₂～₄アルケニル、非置換C₂～₄アルキニル、-(CH₂)₁～₆F、-(CH₂)₁～₆C1、-(CH₂)₁～₆N₃または-(CH₂)₁～₆NH₂であり；

【化64】

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り； R^{4C} がハロである場合； 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 $-(CH_2)_{1-6}Cl$ であり；

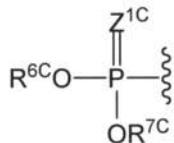
【化65】

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^{4C} がハロであり； R^{5C} がHまたはハロである場合； R^{3C} はHまたはハロであり；
ただし、 R^{2C} が $-(CH_2)_{1-6}Cl$ であり；

【化66】

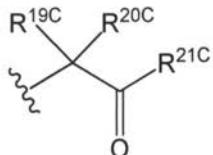
が共に不在であり； Z^2 が不在であり； O^2 が OR^{1C} であり； R^{3C} が OH 、 $-OC(=O)R''^C$ または所望により置換されたO結合型アミノ酸であり； R^{4C} がハロであり； R^{5C} がHまたはハロであり； R^{1C} が

【化67】



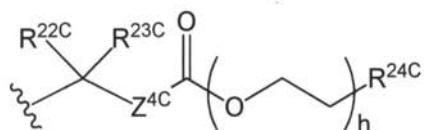
である場合、 R^{6C} および R^{7C} のうち少なくとも一方は、 R^{2-1C} が独立して所望により置換された $-O-$ ヘテロアリールおよび所望により置換された $-O-$ 単環式ヘテロシクリルからなる群から選択される

【化68】



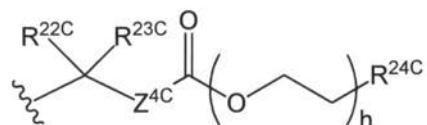
であり；あるいは、 R^{6C} および R^{7C} のうち少なくとも一方は、 s が1、2または3である

【化69】



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^{2-4C} 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70】



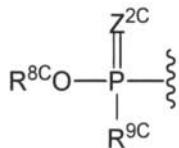
であり；

ただし、R²Cが-(CH₂)₁₋₆Clであり；

【化71】

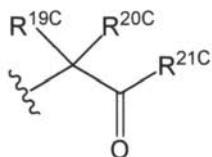
が共に不在であり；Z²が不在であり；O²がOR¹Cであり；R³CがOH、-OC(=O)R"、または所望により置換されたO結合型アミノ酸であり；R⁴Cがハロであり；R⁵CがHまたはハロであり；R¹Cが

【化72】

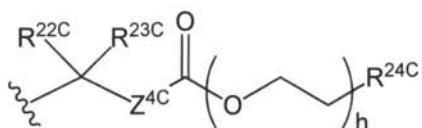


である場合；R⁸Cは、R²⁻¹Cが独立して所望により置換された-O-ヘテロアリールおよび所望により置換された-O-单環式ヘテロシクリルからなる群から選択される

【化73】

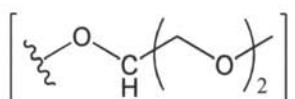
であり；あるいは、R⁸Cは、sが1、2または3である

【化74】



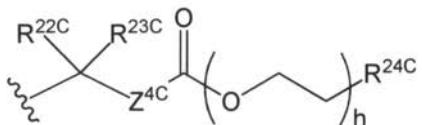
であり；あるいは、R⁸Cは、sが0であり、R²⁻⁴Cが所望により置換された-O-ヘテロアリール、所望により置換された-O-单環式ヘテロシクリルまたは

【化75】



である

【化76】



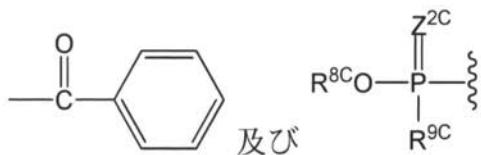
であり；

ただし、

【化77】

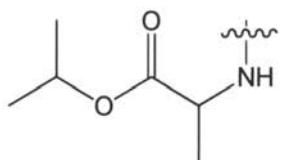
が共に不在であり； Z^2 が不在であり； O^2 が OR^{1C} であり； R^{2C} がフルオロであり； R^{3C} が OH または $-OC(=O)R''^C$ であり； R^{4C} がフルオロであり； R^{5C} がメチル、エチルまたはエテニルである場合； R^{1C} は H 、

【化78】



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79】



であり、 Z^{2C} は酸素である、

前記式(I I)の化合物またはその薬剤的に許容できる塩。

【請求項24】

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23に記載の化合物。

【請求項25】

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23に記載の化合物。

【請求項26】

R^{2D} が $-CH_2F$ または $-(CH_2)_1-6Cl$ 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23に記載の化合物。

【請求項27】

R^{2C} が $-(CH_2)_1-6F$ 、 $-(CH_2)_1-6N_3$ 、 $-(CH_2)_1-6NH_2$ 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23に記載の化合物。

【請求項28】

【化80】

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} がハロである、請求項23～27のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項29】

【化81】

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82】

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} がハロゲン、 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。

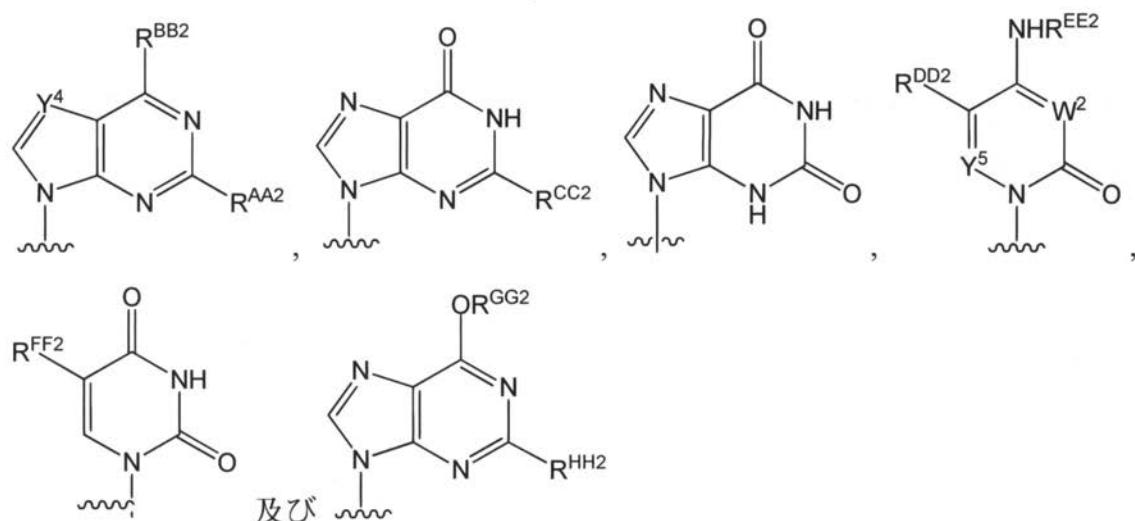
【請求項33】

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83】



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；

$R^{D\ D^2}$ が水素、重水素、ハロゲン、所望により置換された $C_{1\sim6}$ アルキル、所望により置換された $C_{2\sim6}$ アルケニルおよび所望により置換された $C_{2\sim6}$ アルキニルからなる群から選択され；

$R^{E\ E^2}$ が水素、ヒドロキシ、所望により置換された $C_{1\sim6}$ アルキル、所望により置換された $C_{3\sim8}$ シクロアルキル、 $-C(=O)R^{RR^2}$ および $-C(=O)OR^{SS^2}$ からなる群から選択され；

$R^{F\ F^2}$ が水素、ハロゲン、所望により置換された $C_{1\sim6}$ アルキル、所望により置換された $C_{2\sim6}$ アルケニルおよび所望により置換された $C_{2\sim6}$ 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^{II^2} であり、式中、 R^{II^2} は水素、ハロゲン、所望により置換された $C_{1\sim6}$ アルキル、所望により置換された $C_{2\sim6}$ アルケニルおよび所望により置換された $C_{2\sim6}$ アルキニルからなる群から選択され；

W^2 が NH 、 $-NCH_2-O-C(=O)CH(NH_2)-CH(CH_3)_2$ または $-(CH_2)_{1\sim2}-O-P(=O)(OW^{2C})_2$ 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 $C_{1\sim6}$ アルキルからなる群から選択され；

R^{GG^2} が所望により置換された $C_{1\sim6}$ アルキルであり；

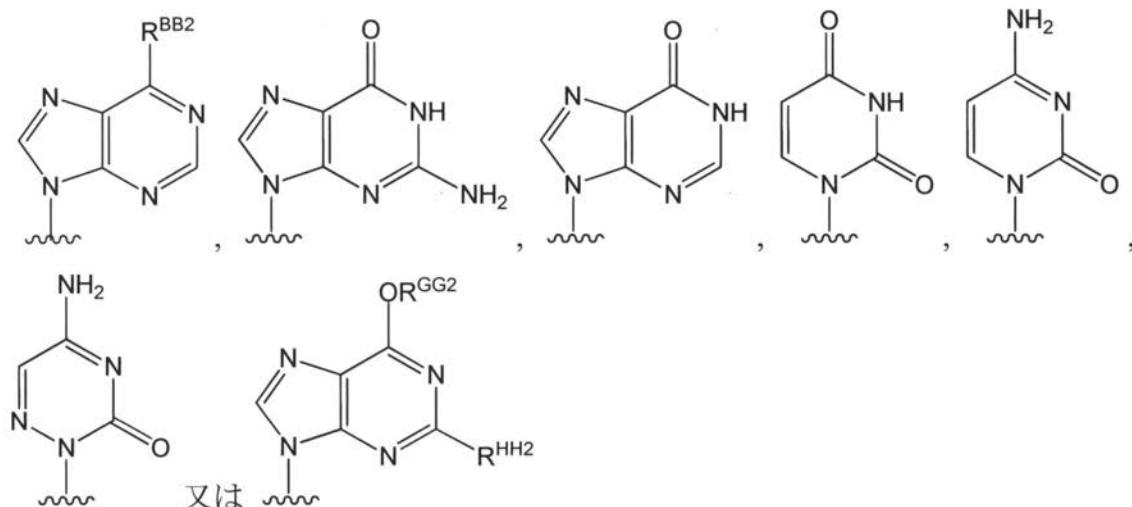
R^{HH^2} が水素または NHR^{TT^2} であり、式中、 R^{TT^2} は独立して水素、 $-C(=O)R^{UU^2}$ および $-C(=O)OR^{VV^2}$ からなる群から選択され；

R^{KK^2} 、 R^{LL^2} 、 R^{MM^2} 、 R^{NN^2} 、 R^{PP^2} 、 R^{QQ^2} 、 R^{RR^2} 、 R^{SS^2} 、 R^{UU^2} および R^{VV^2} が独立して水素、 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $C_{2\sim6}$ アルケニル、 $C_{2\sim6}$ アルキニル、 $C_{3\sim6}$ シクロアルキル、 $C_{3\sim6}$ シクロアルケニル、 $C_{6\sim10}$ アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アリール($C_{1\sim6}$ アルキル)、ヘテロアリール($C_{1\sim6}$ アルキル)およびヘテロシクリル($C_{1\sim6}$ 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

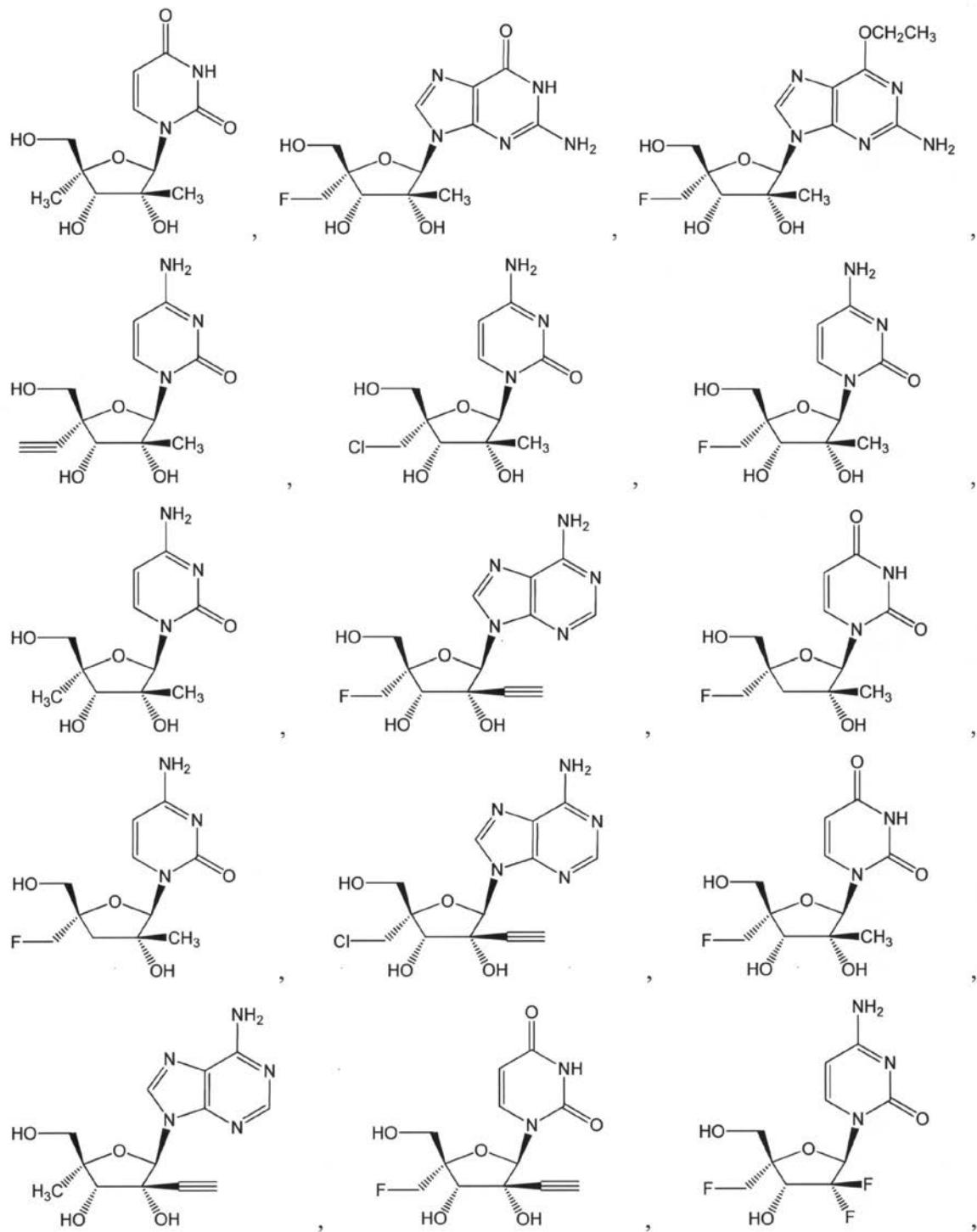
【化84】

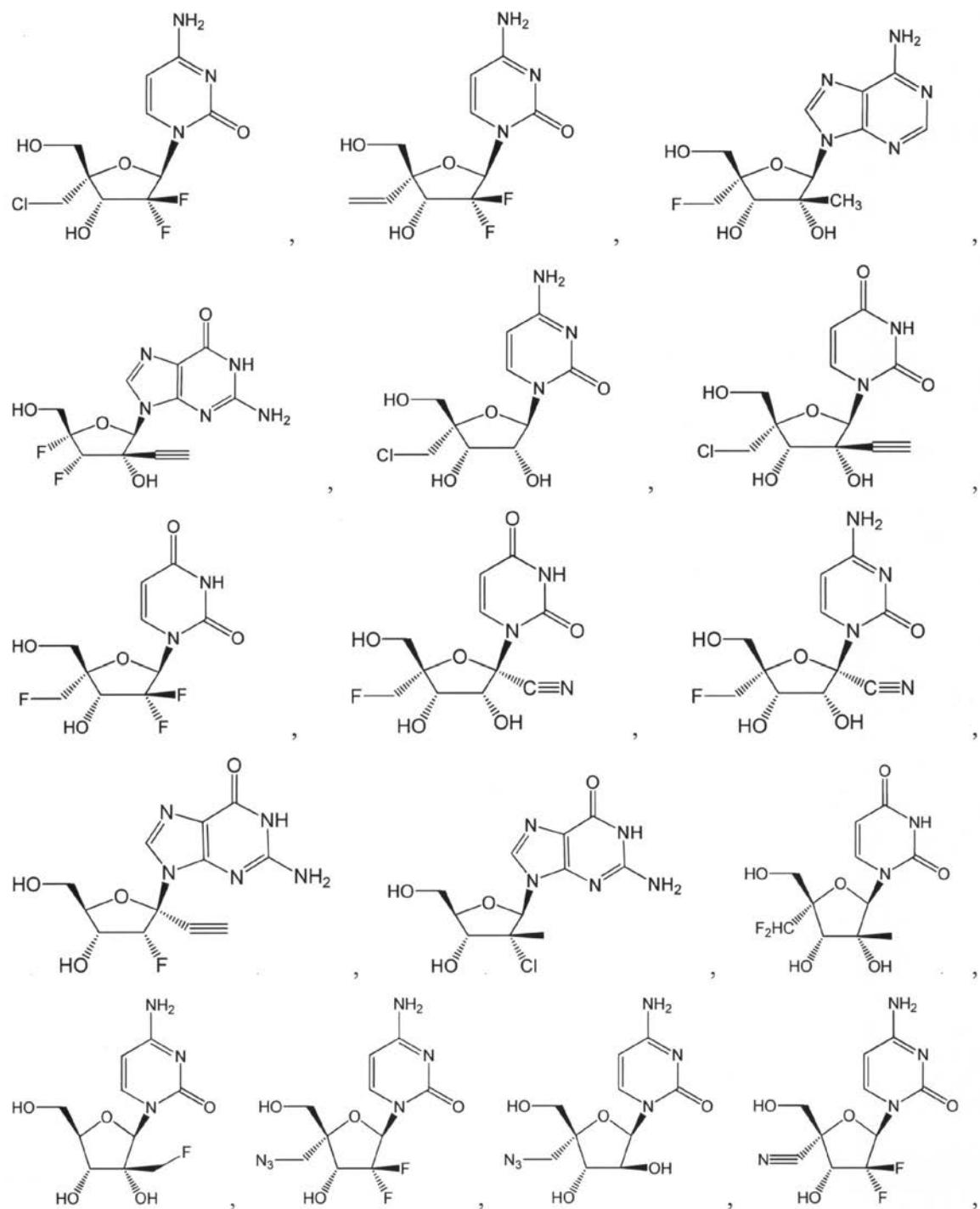


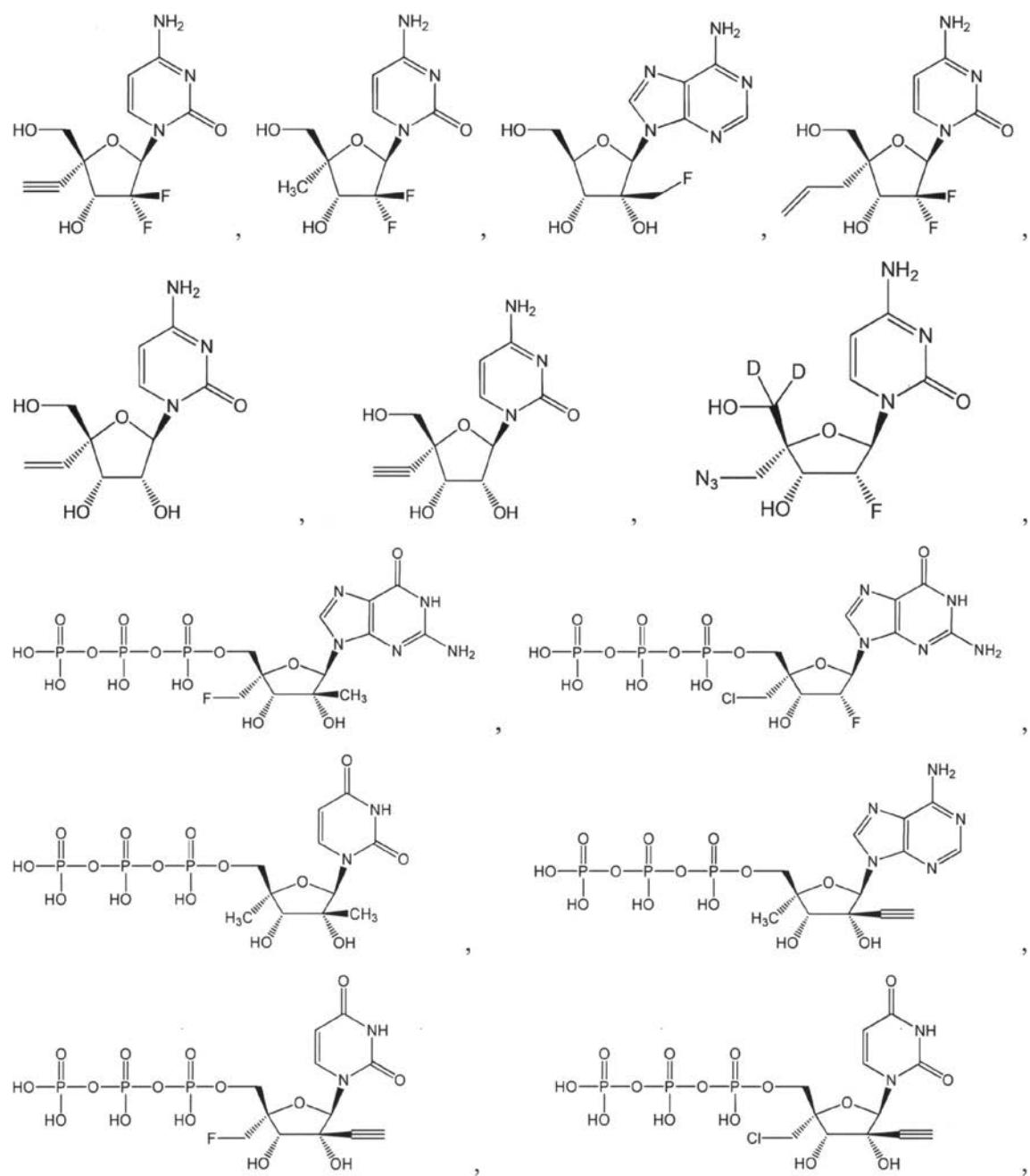
であり、 R^{BB^2} が NH_2 であり、 R^{GG^2} が非置換の $C_{1\sim6}$ アルキルであり、 R^{HH^2} が NH_2 である、請求項34に記載の化合物。

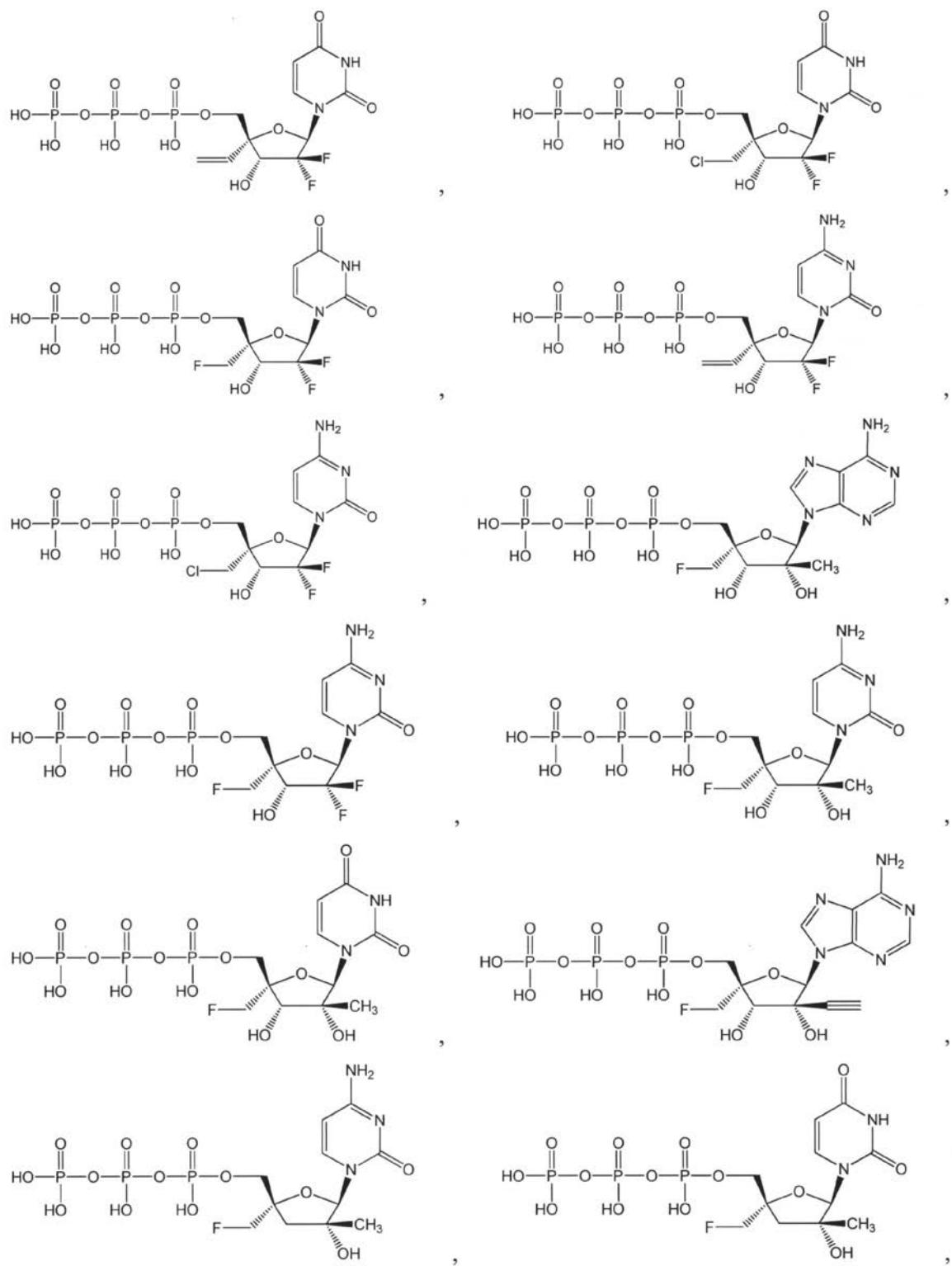
【請求項36】

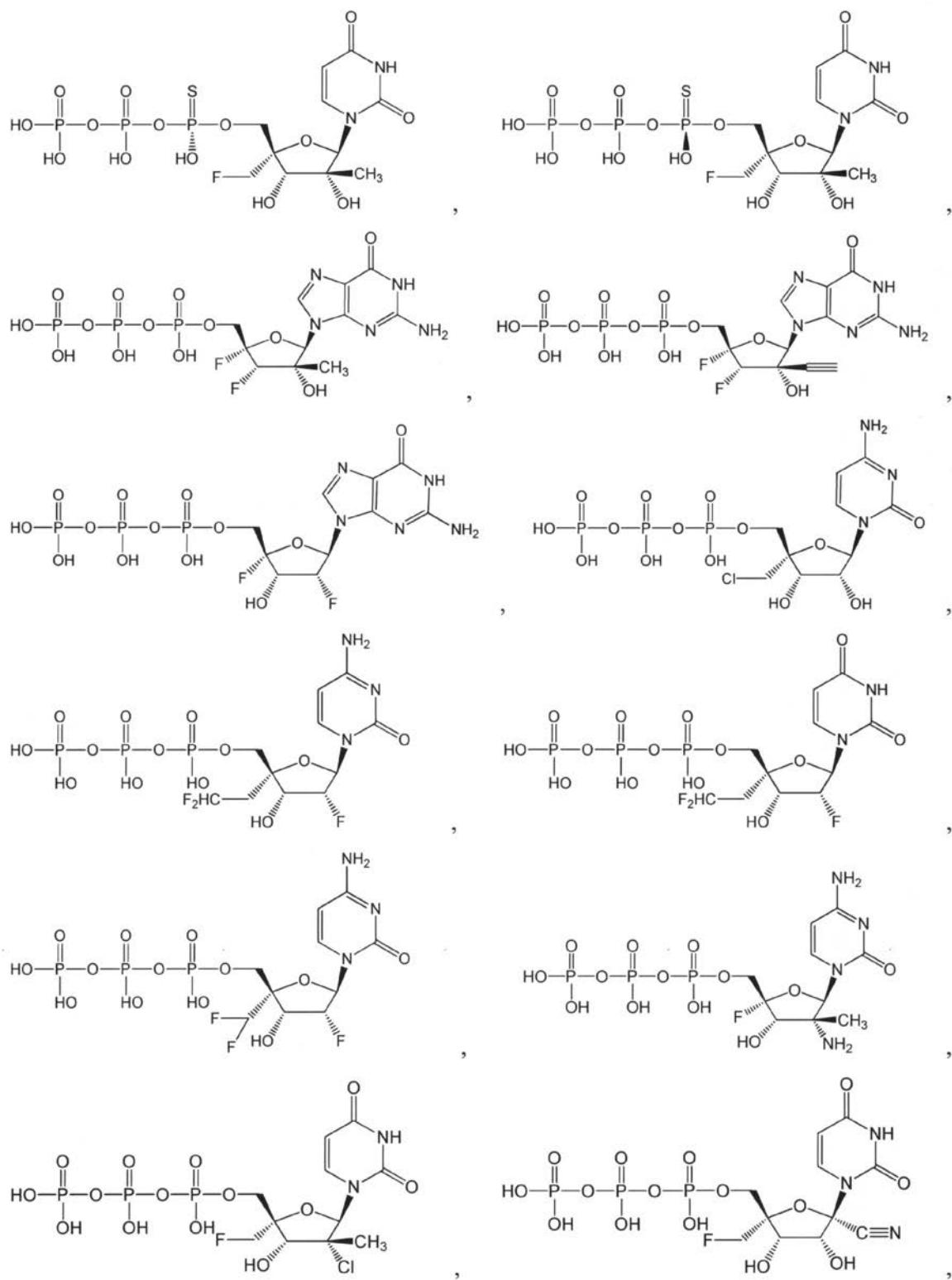
【化 8 5】

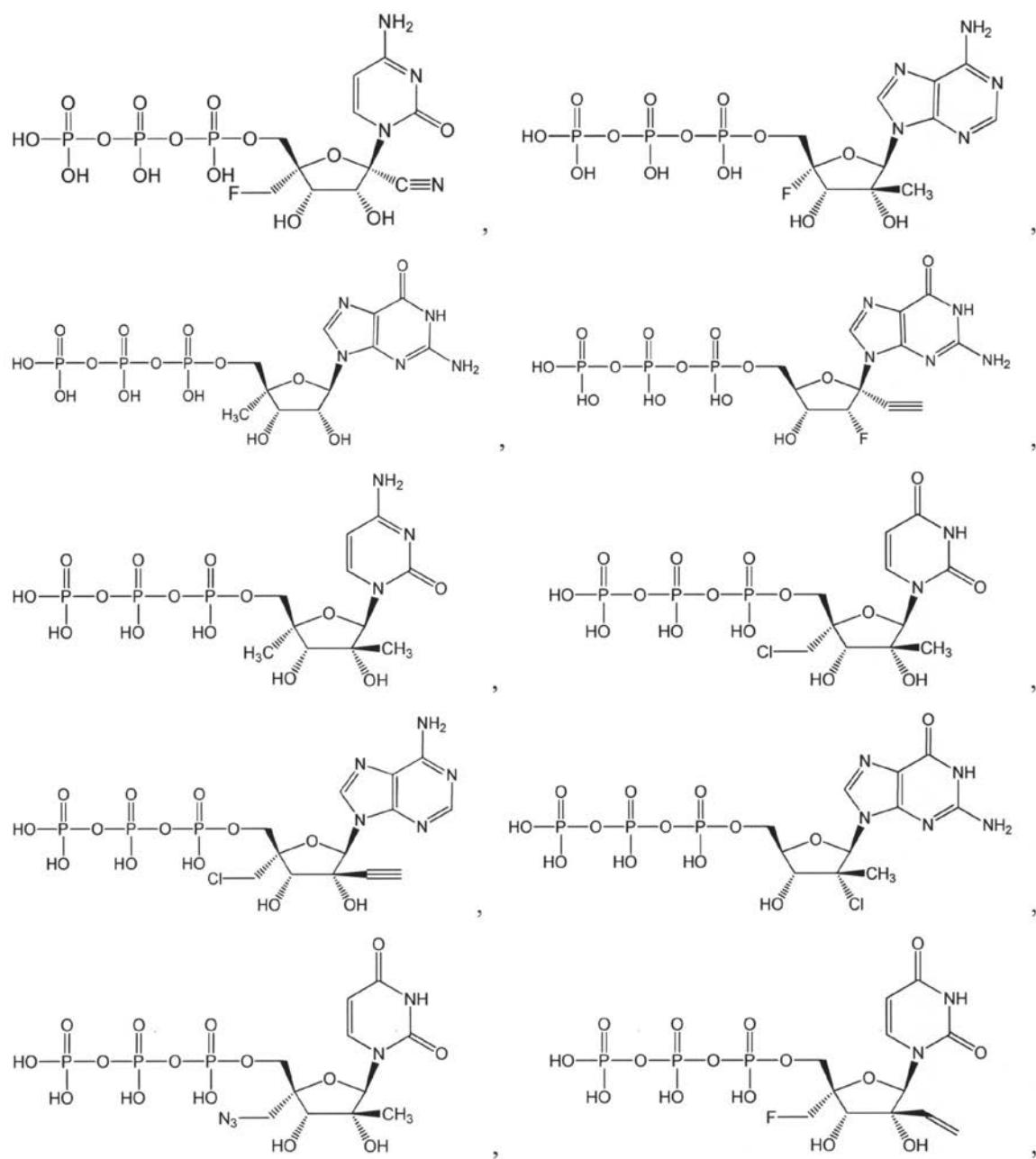


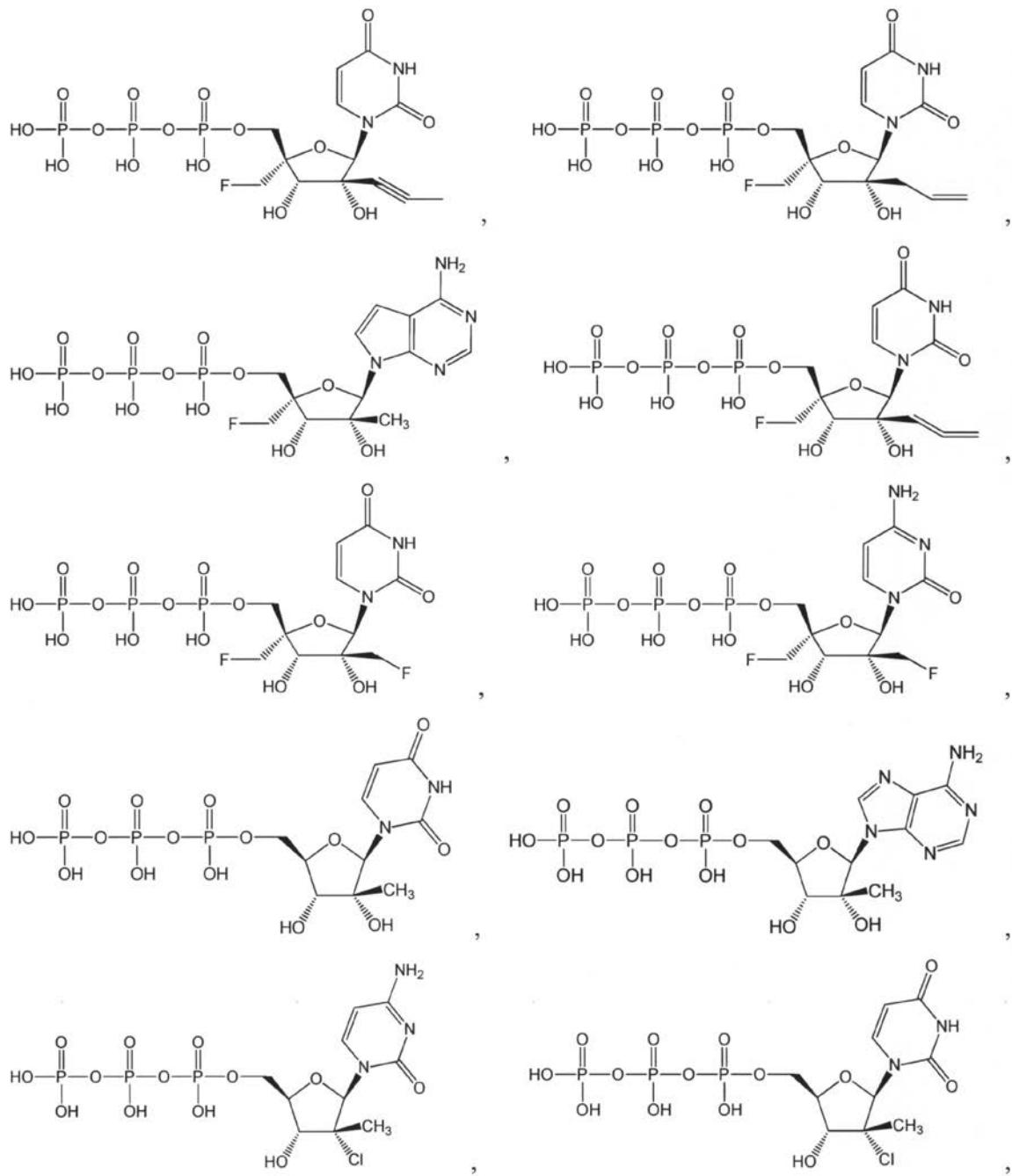


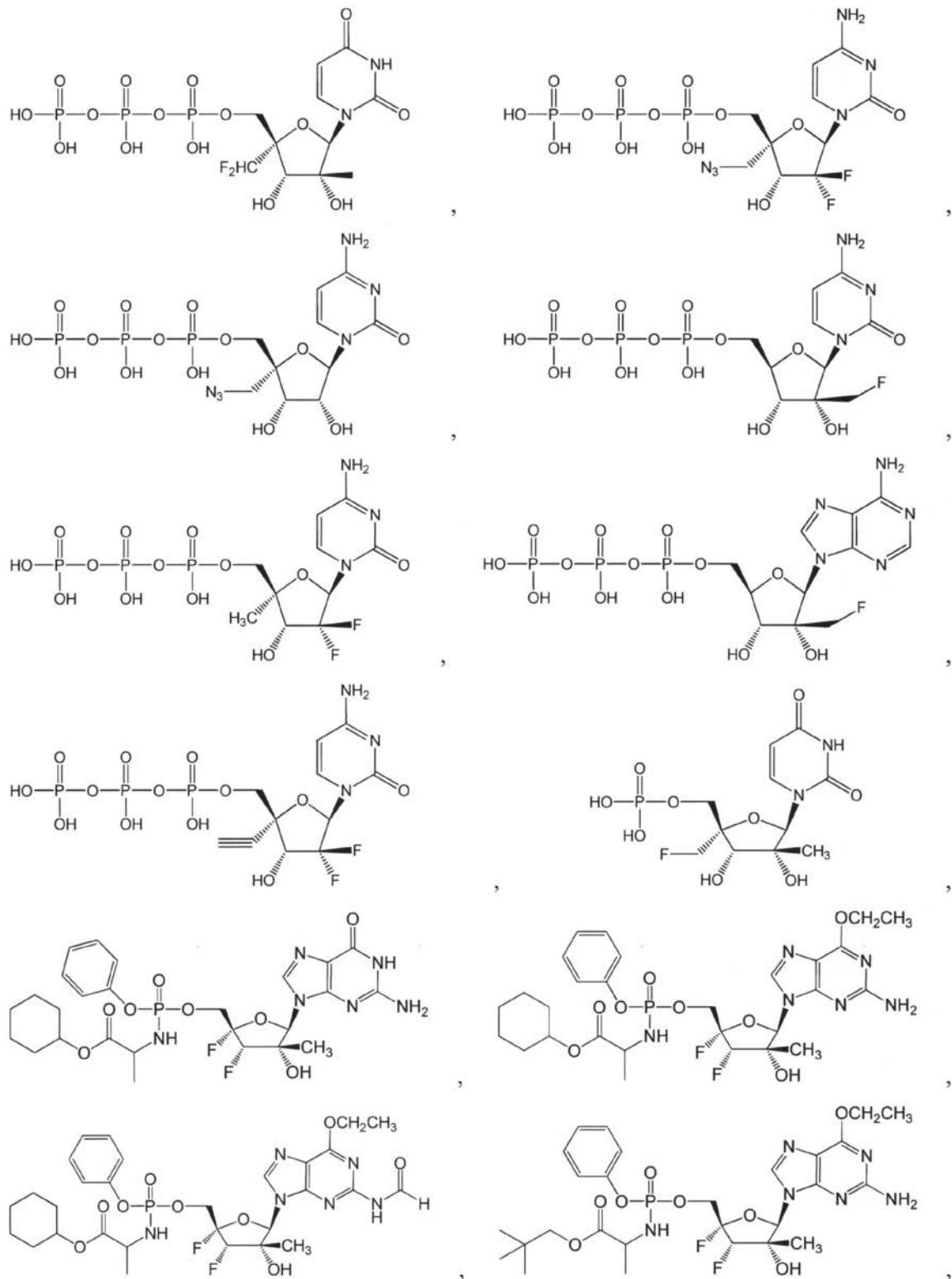


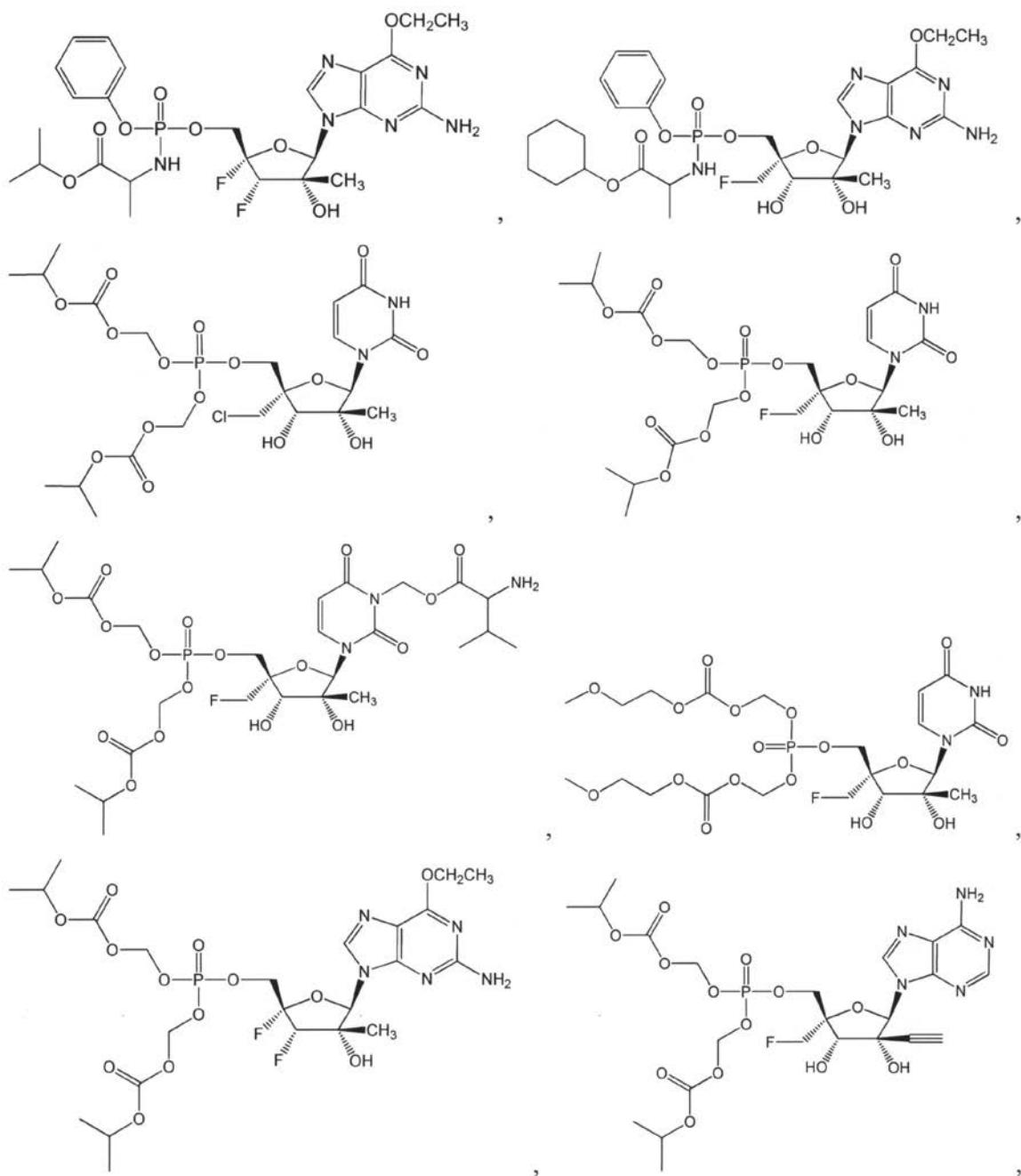


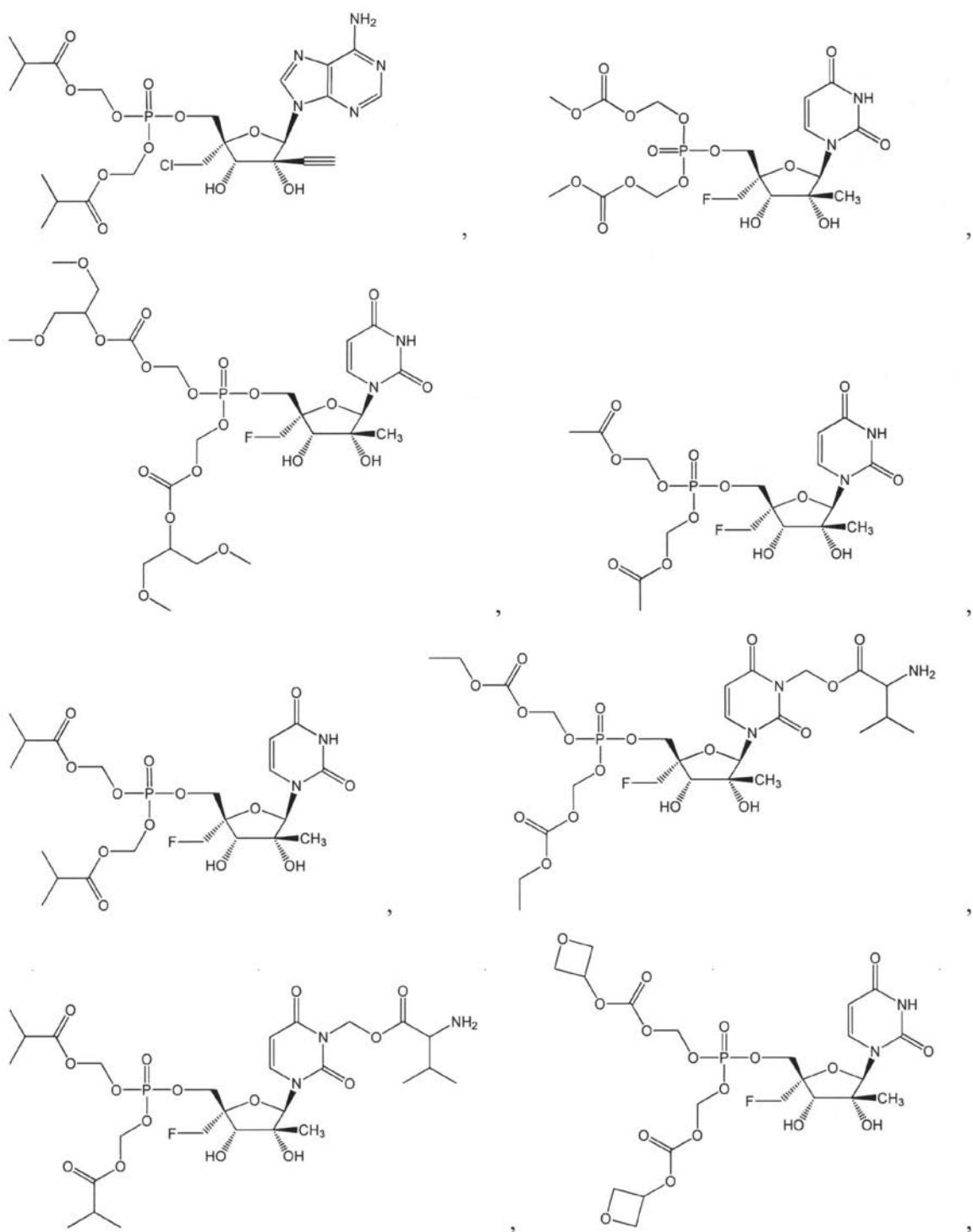


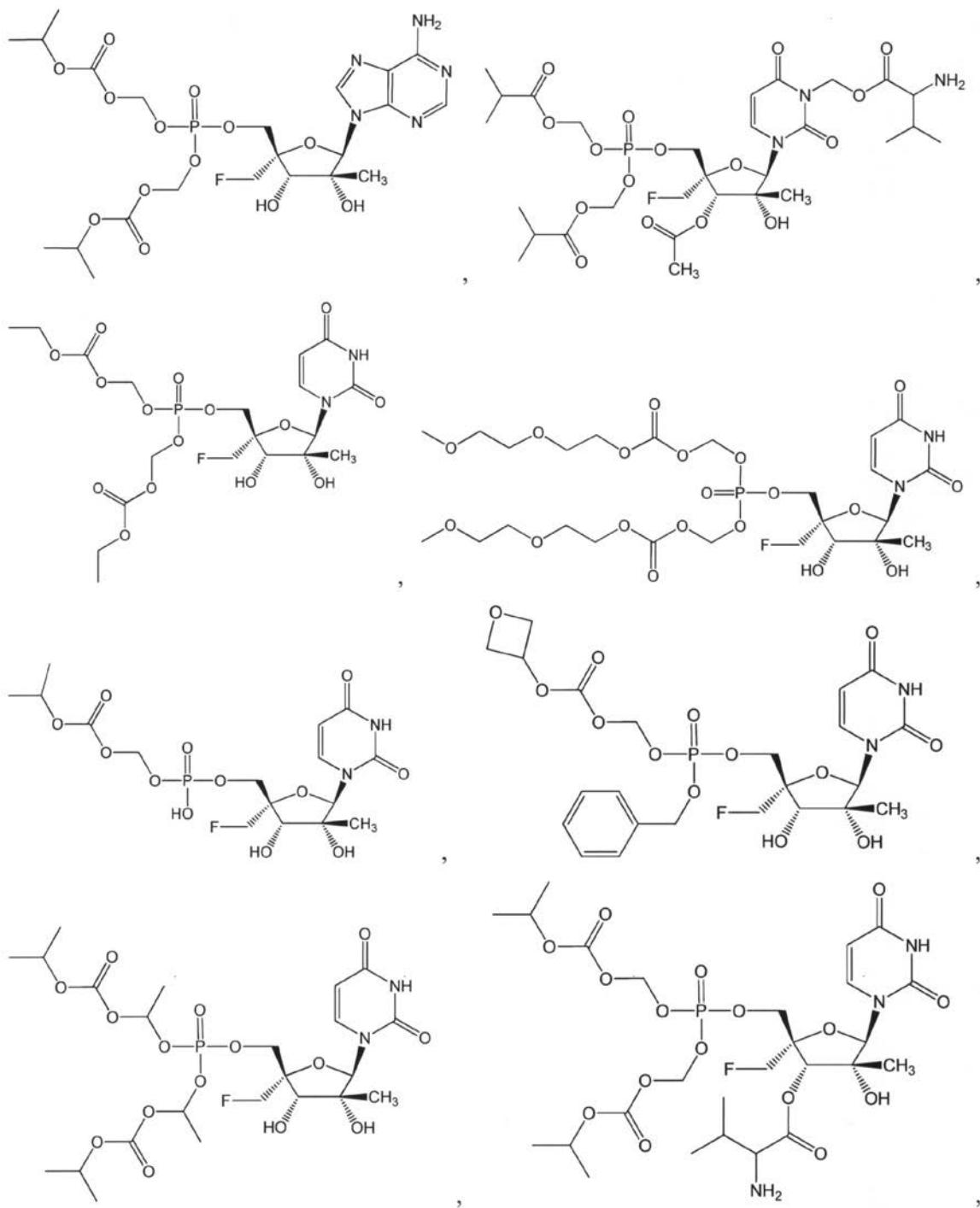


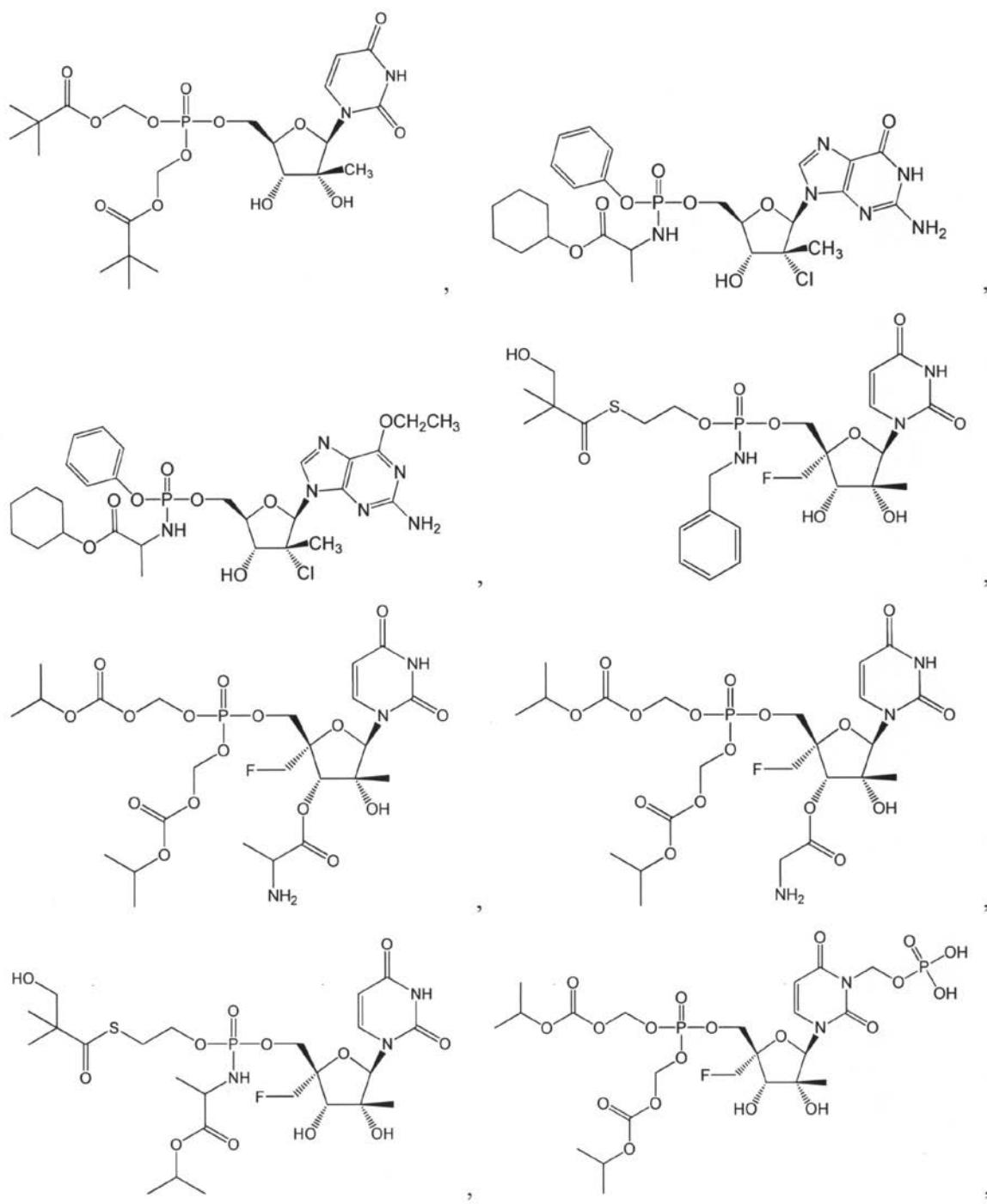


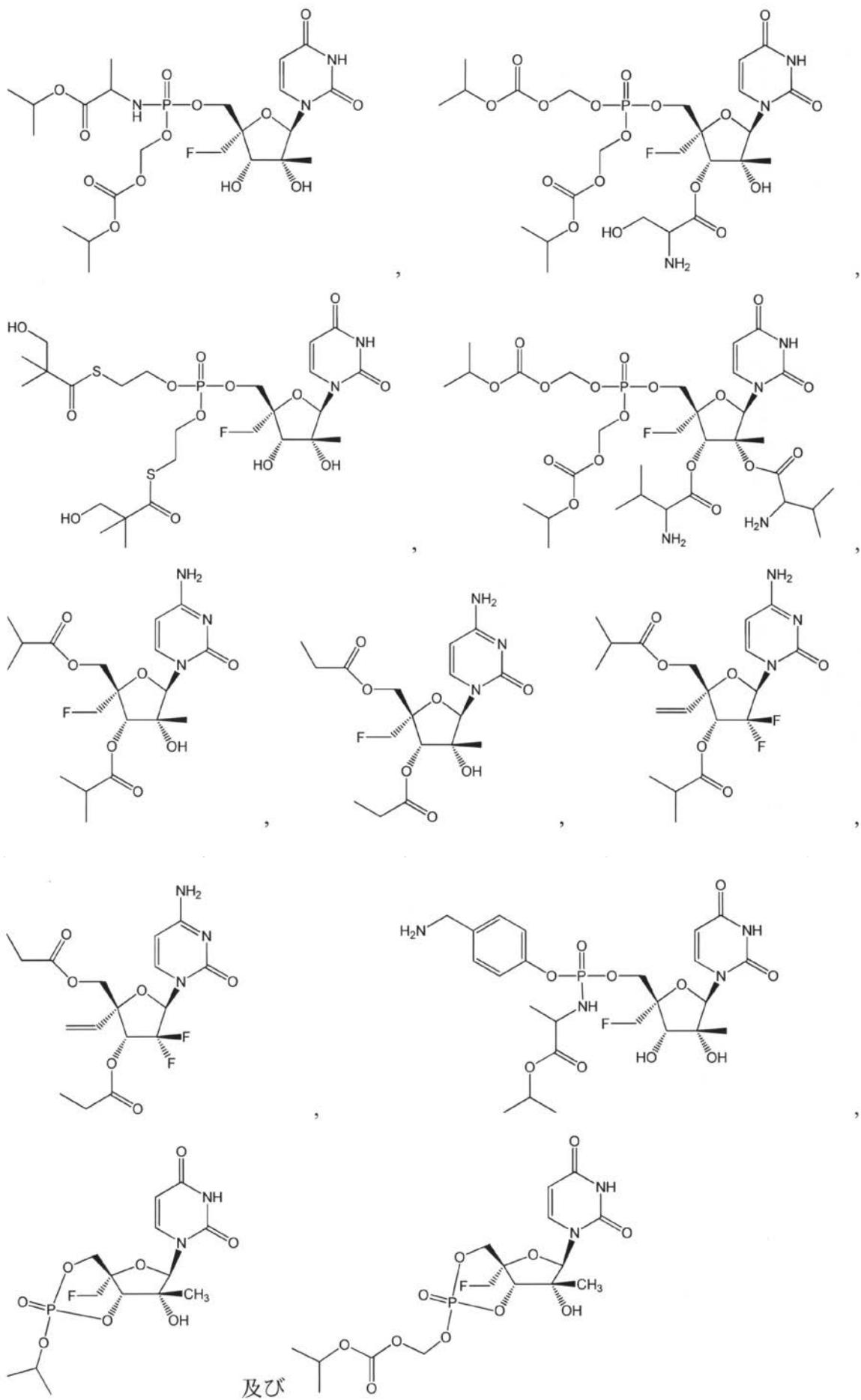












からなる群から選択される化合物またはその薬剤的に許容できる塩。

【請求項 3 7】

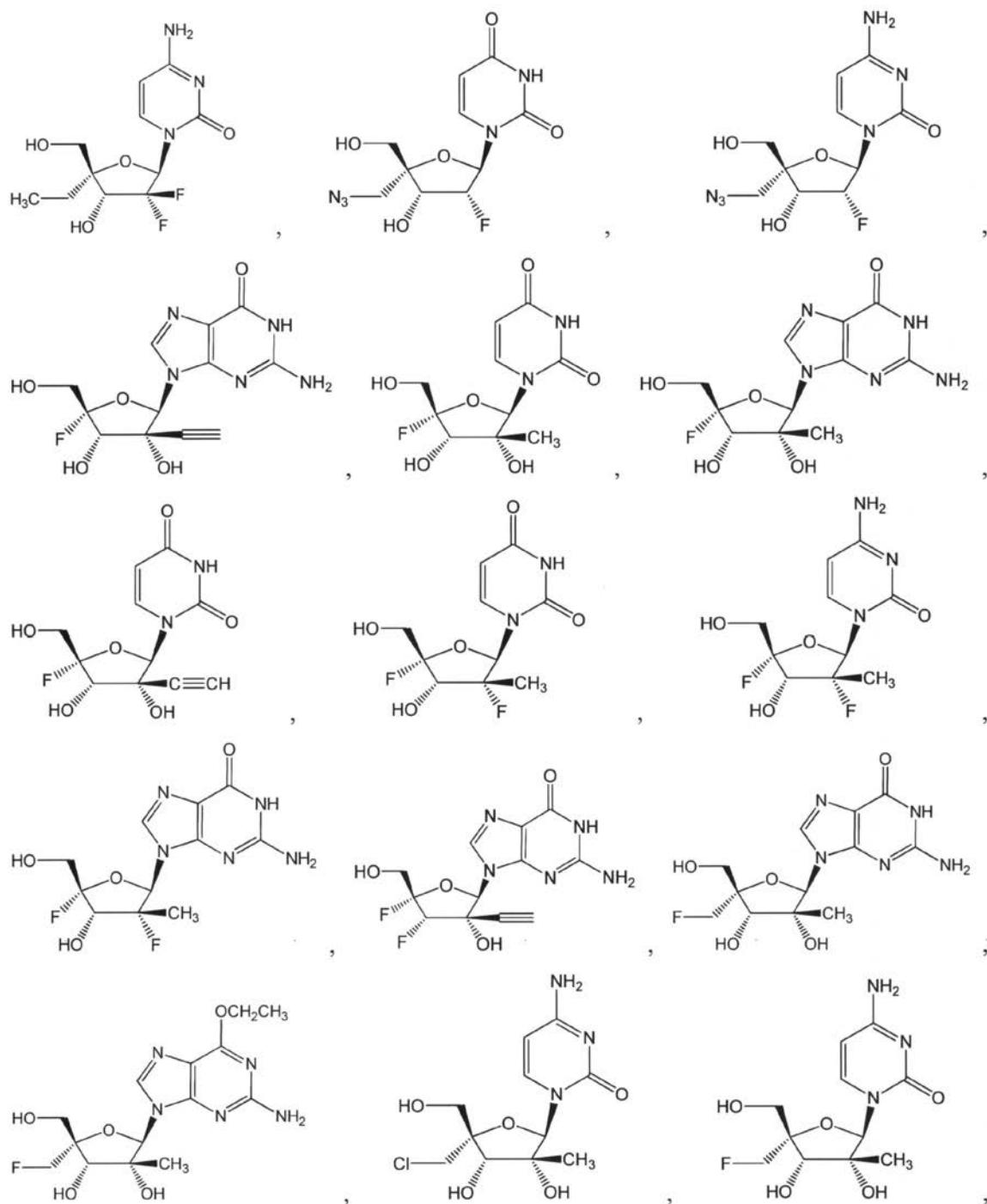
インターフェロン、リバビリン、HCVプロテアーゼ阻害剤、HCVポリメラーゼ阻害剤、NS5A阻害剤、抗ウイルス化合物、式(AA)の化合物、式(BB)の化合物および式(CC)の化合物、または前記化合物のいずれかの薬剤的に許容できる塩からなる群から選択される一つまたは複数の作用剤と組み合わせてHCV感染症を改善または治療するための医薬組成物。

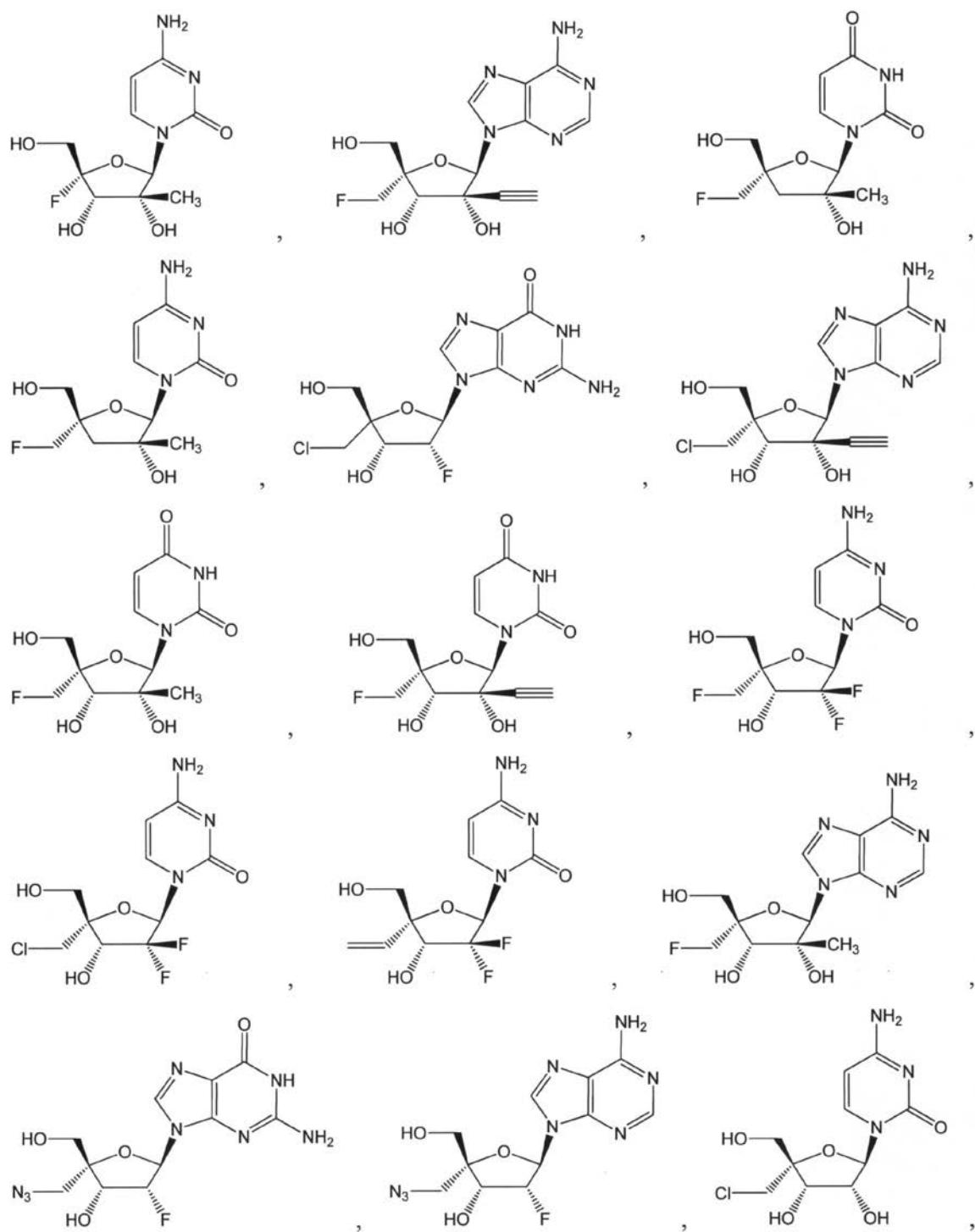
【請求項 3 8】

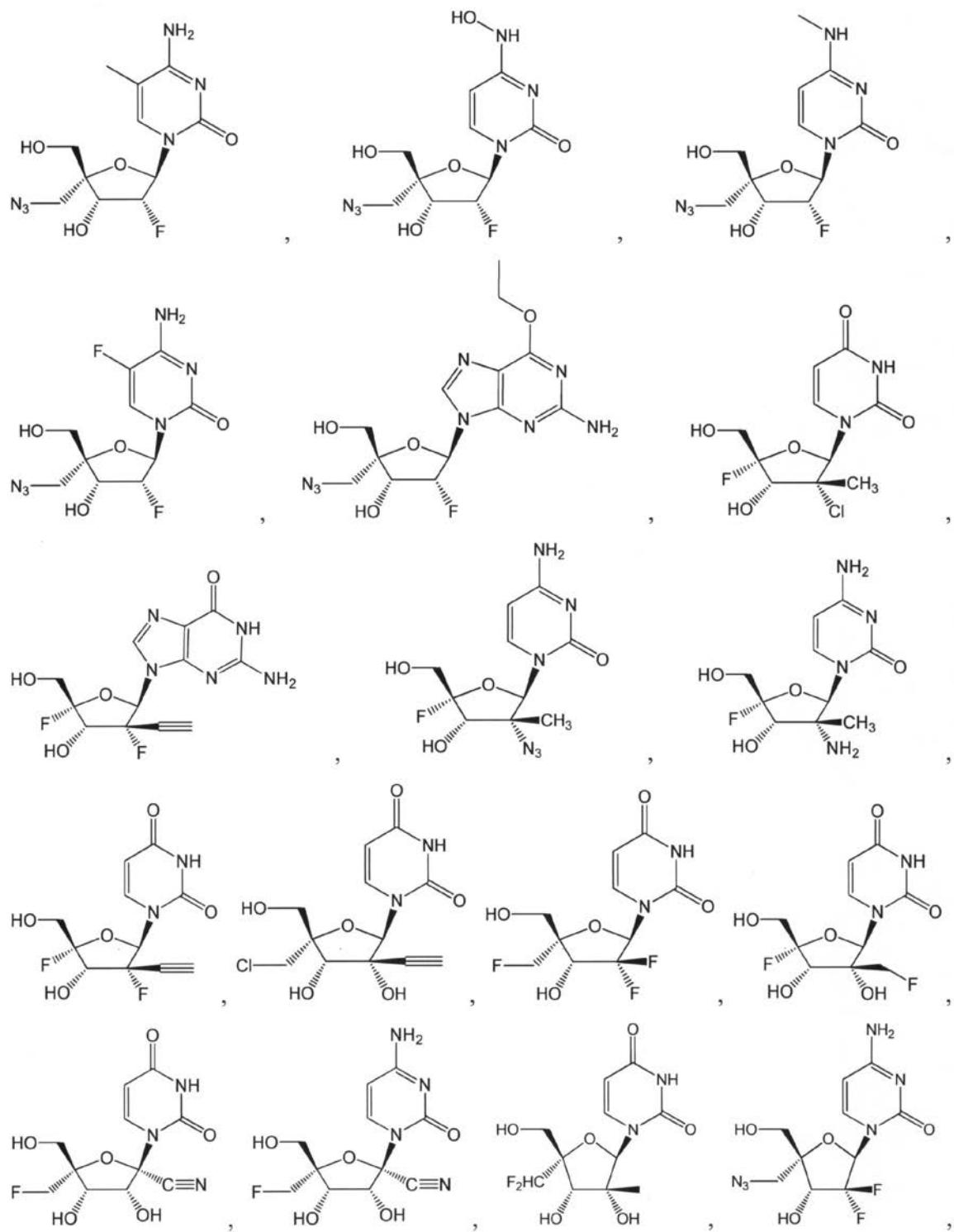
一つまたは複数の作用剤が、化合物1001～1016、2001～2012、3001～3014、4001～4012、5001～5011、6001～6078、7000～7027および8000～8016、または前記化合物のいずれかの薬剤的に許容できる塩からなる群から選択される、請求項37に記載の医薬組成物。

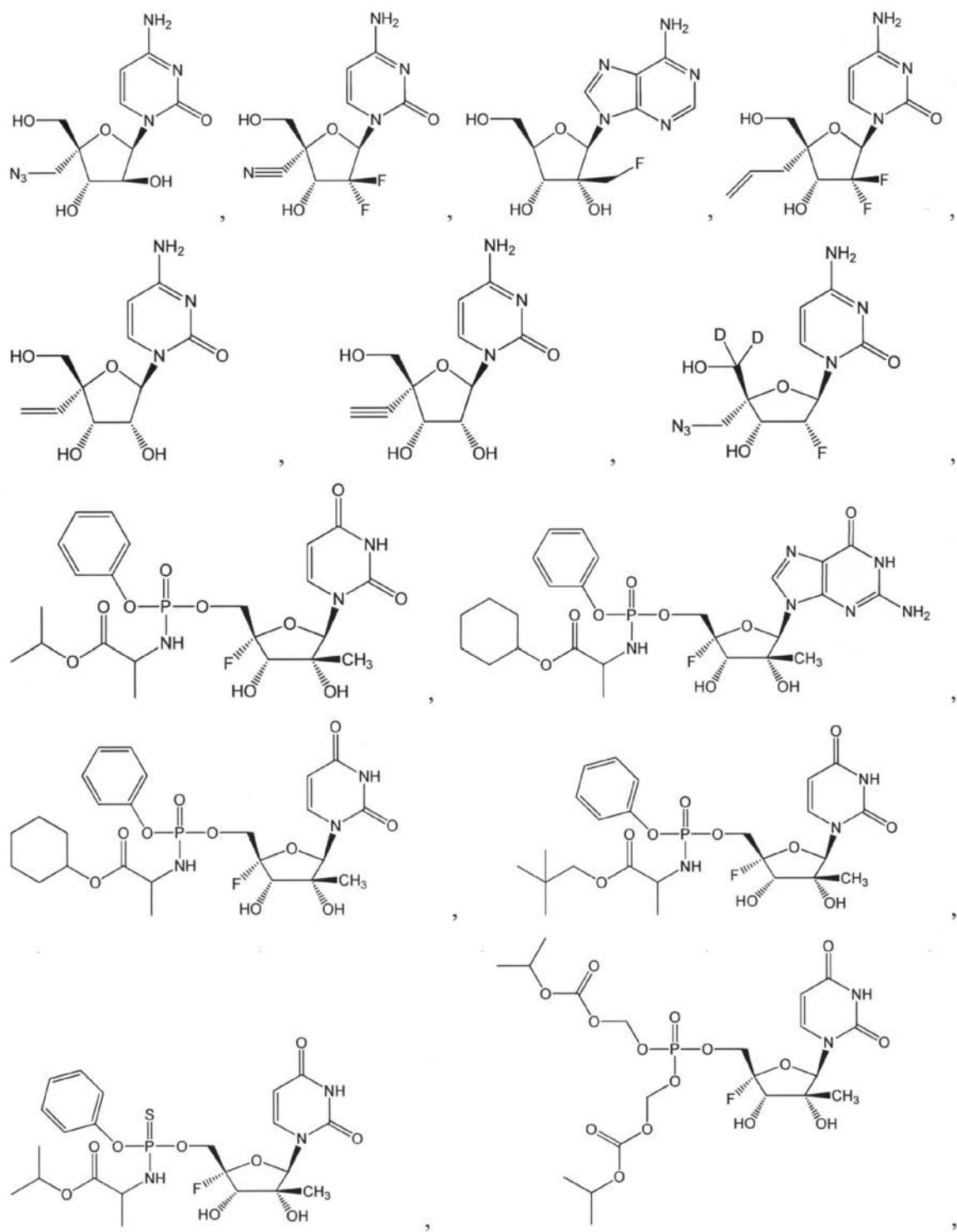
【請求項 3 9】

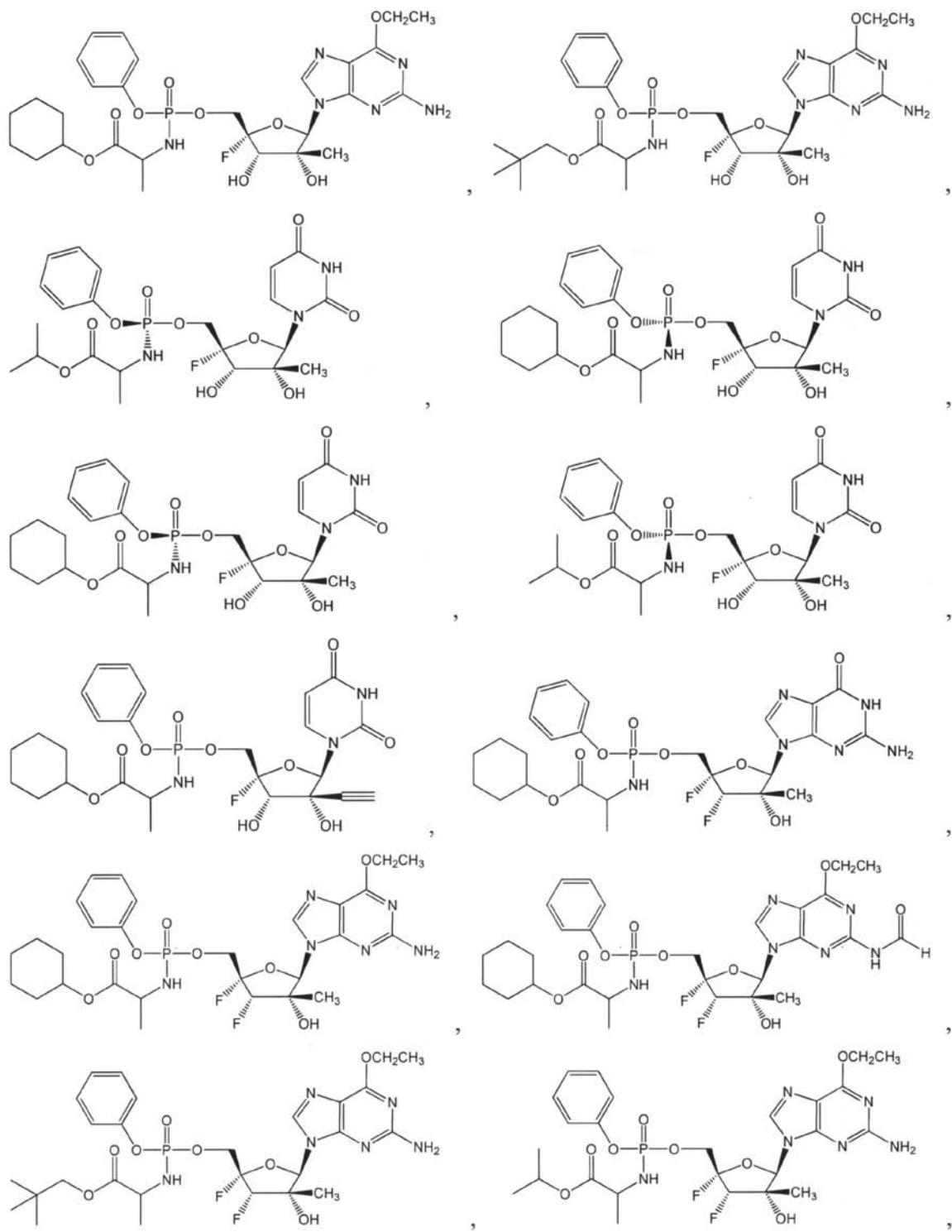
【化 8 6】

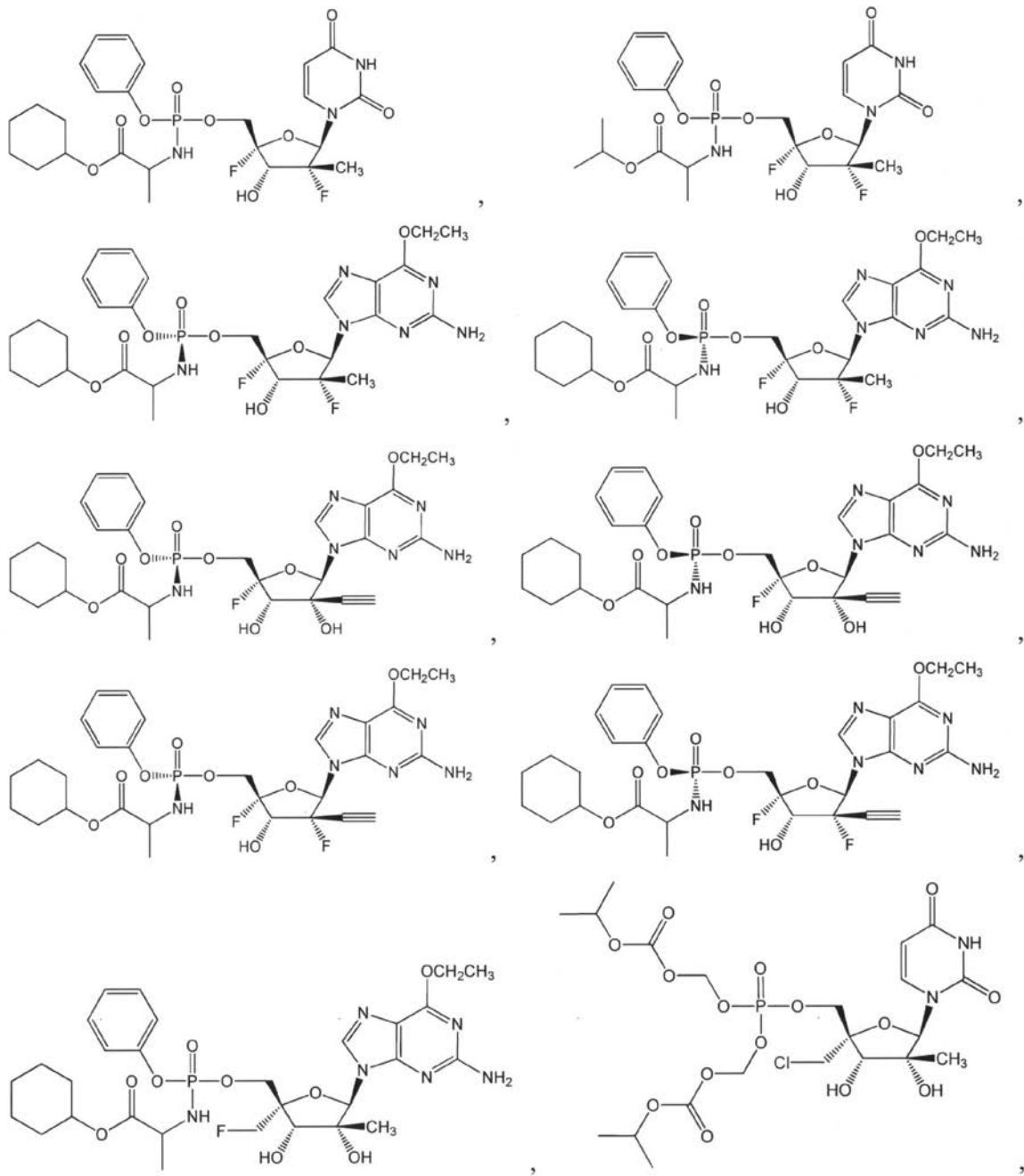


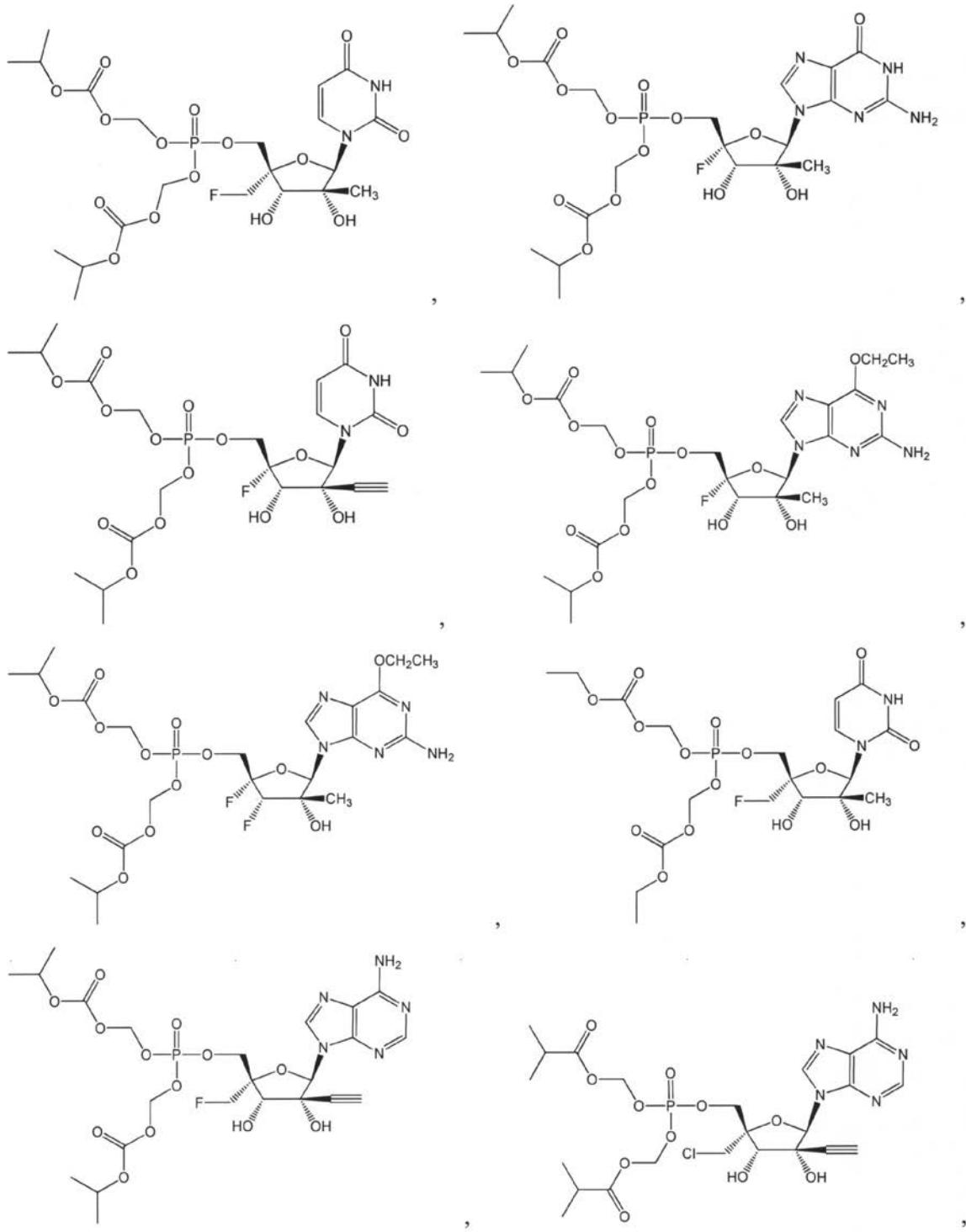


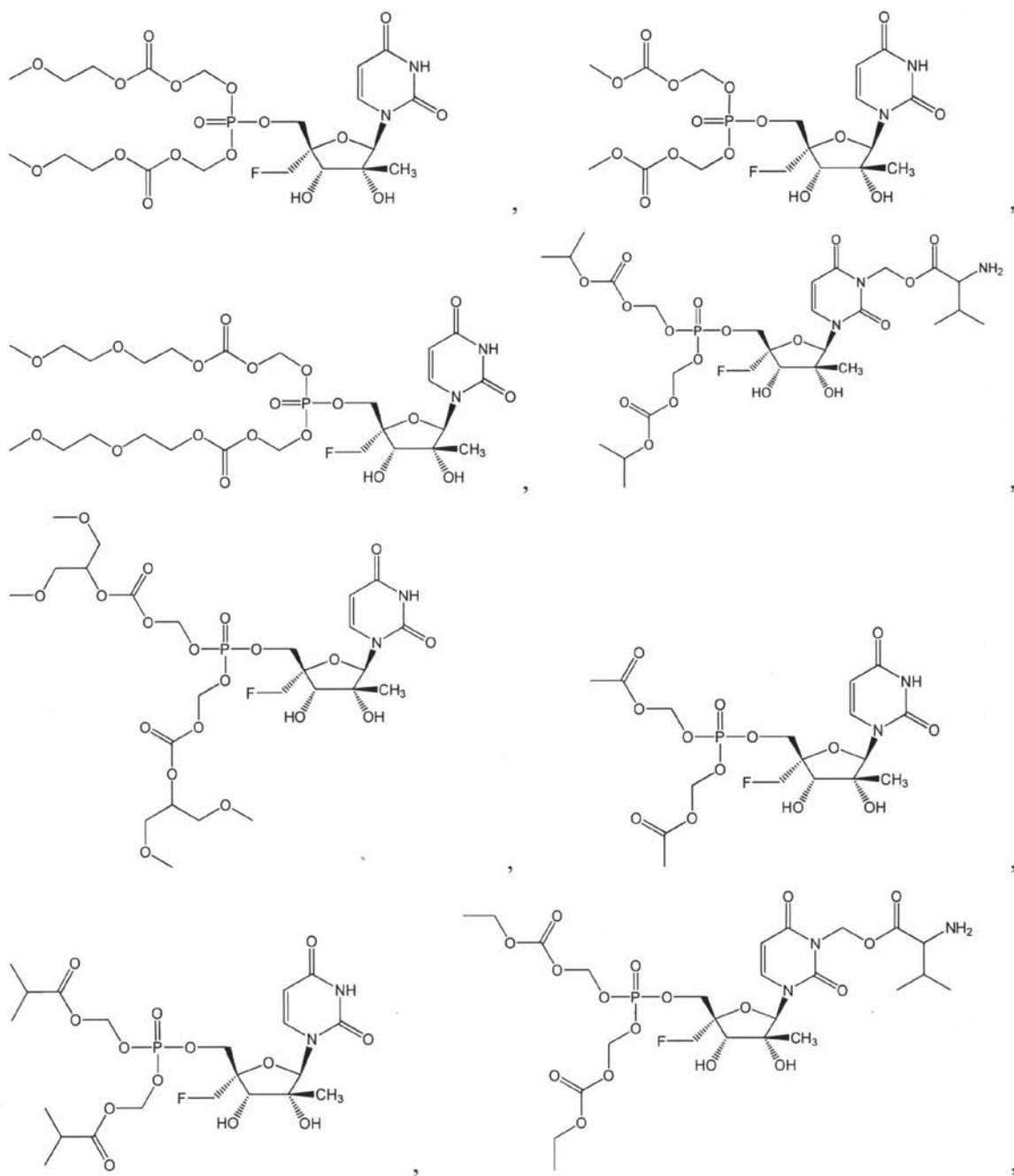


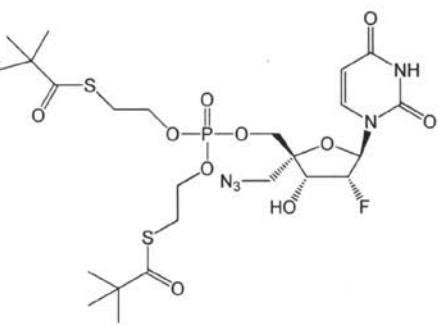
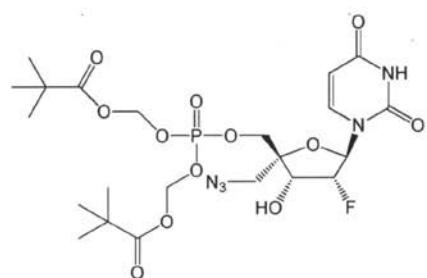
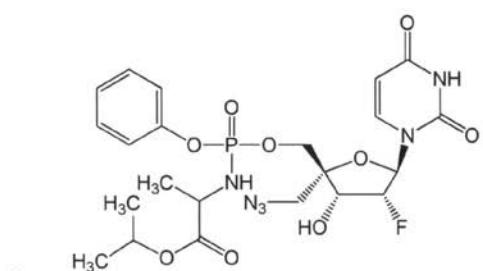
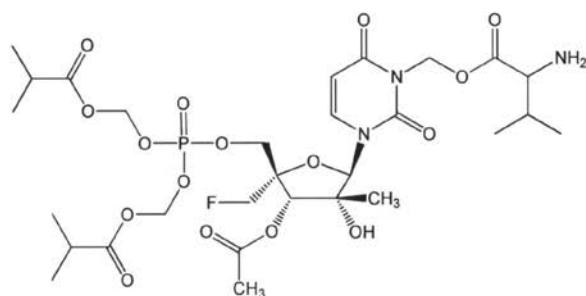
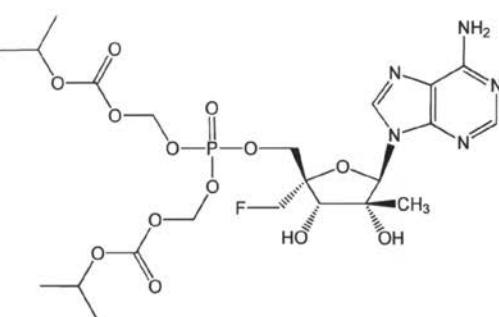
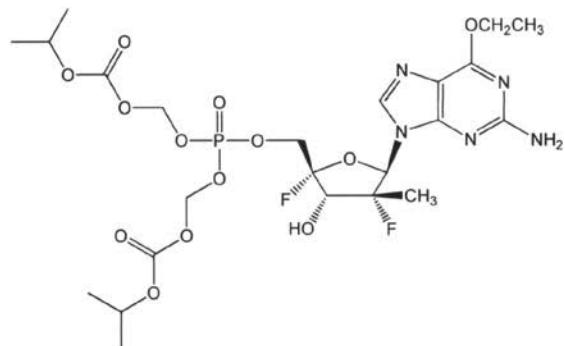
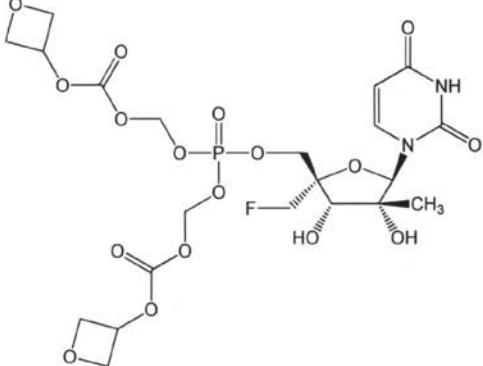
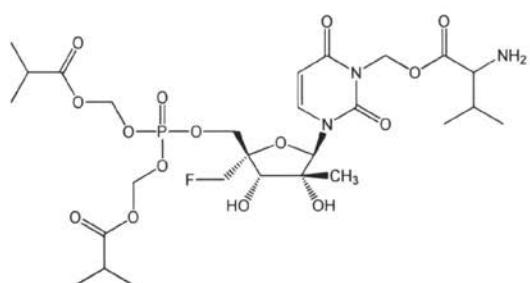


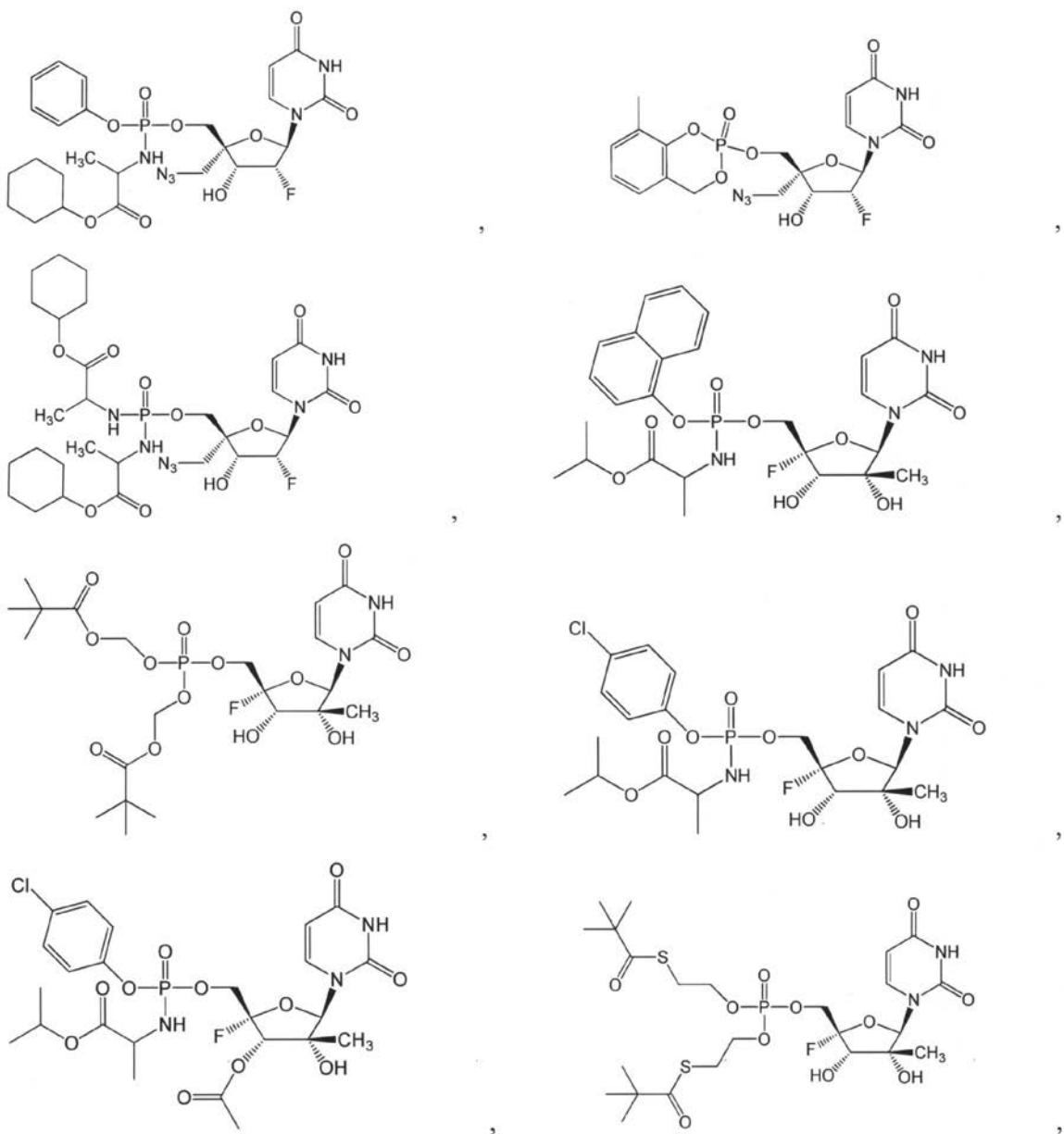


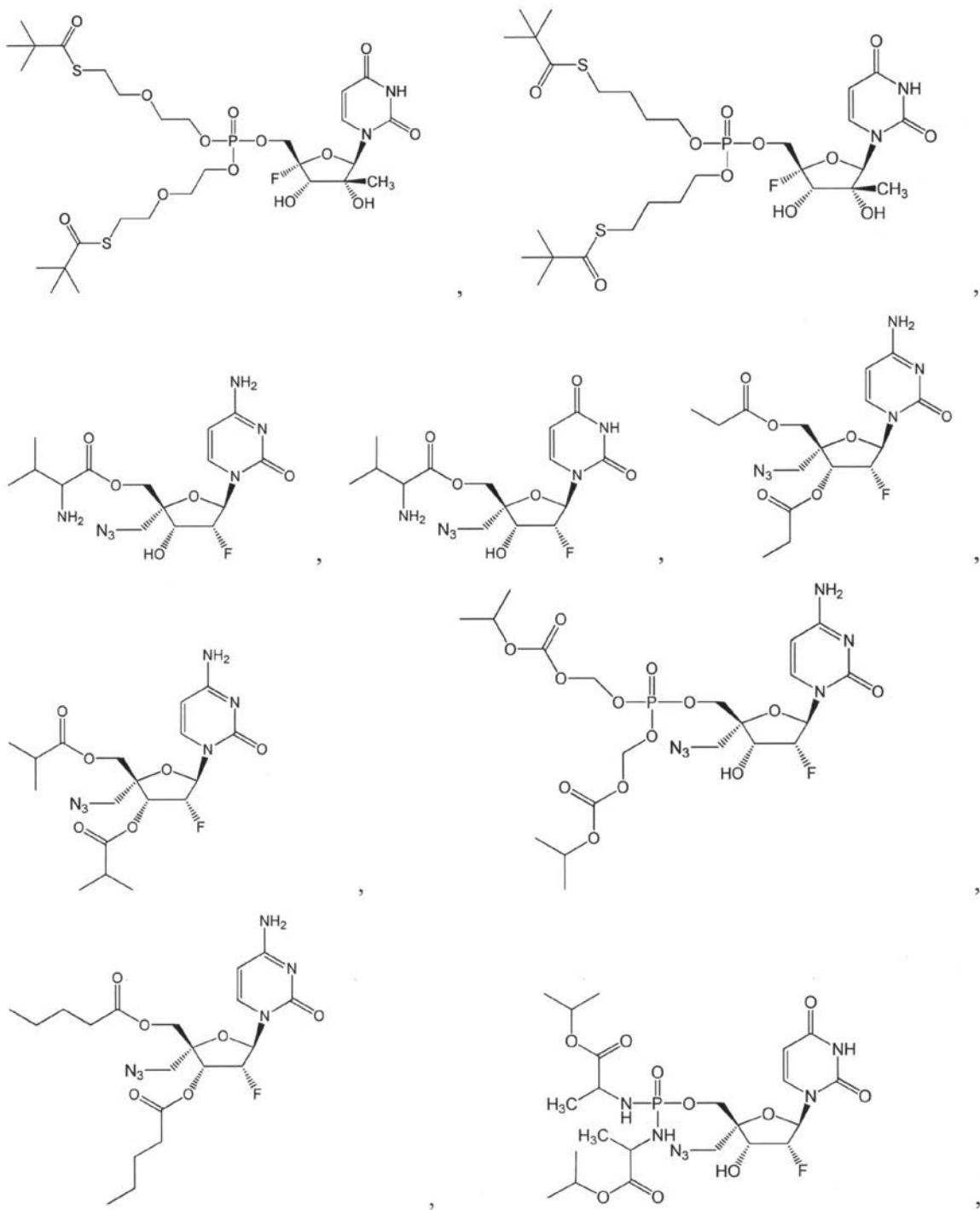


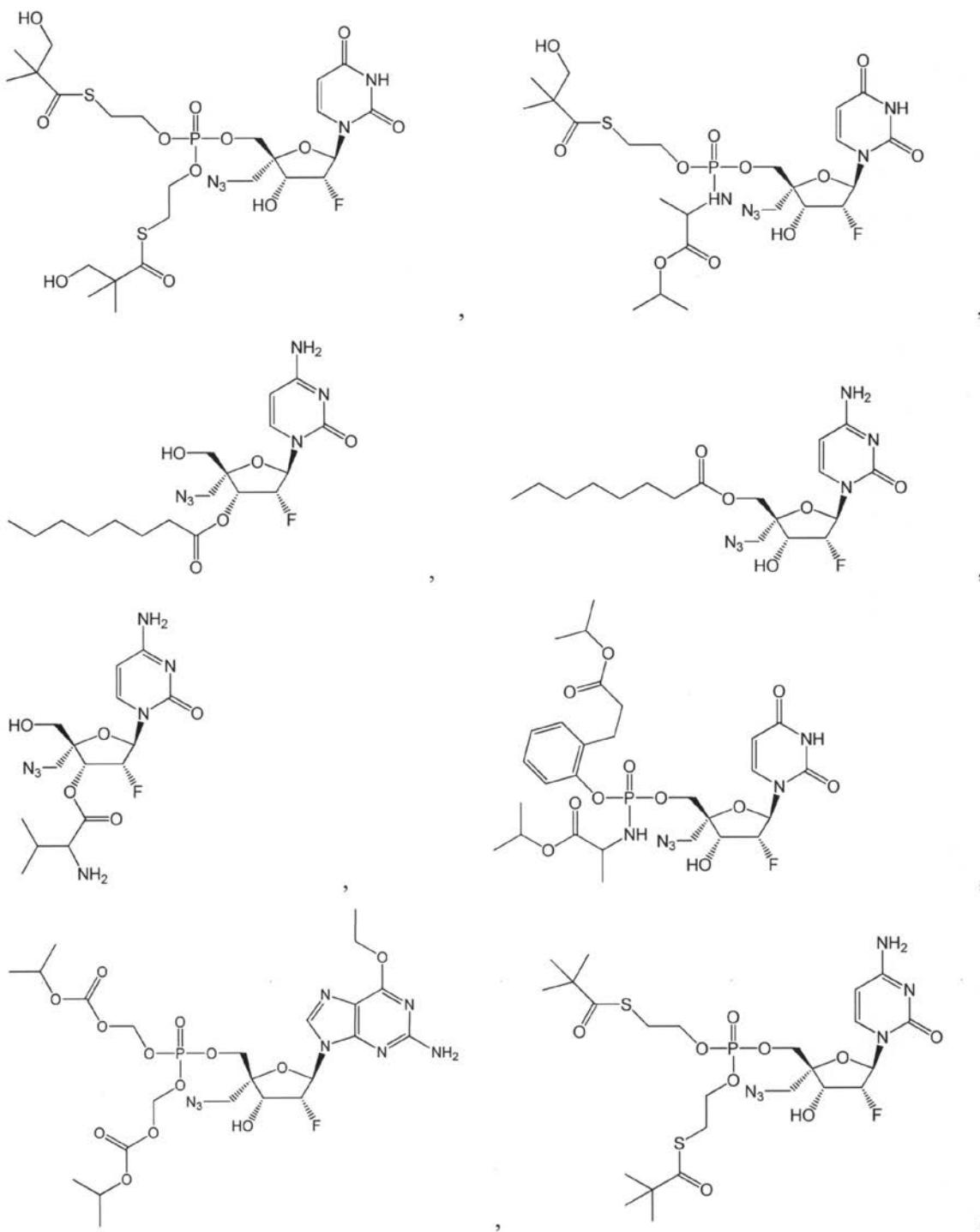


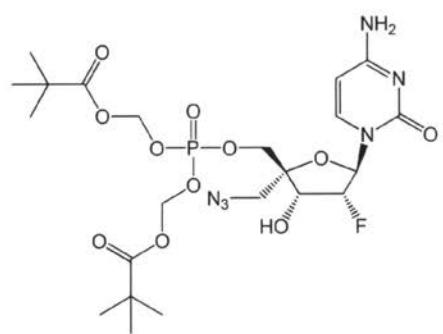




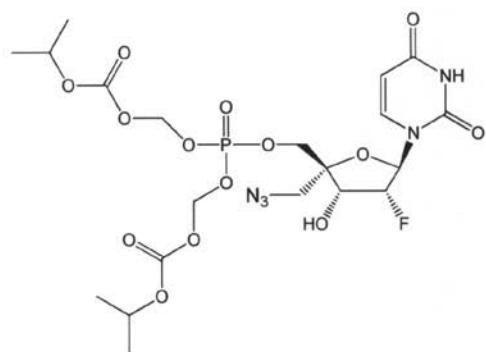




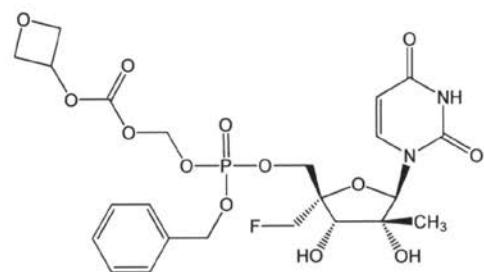




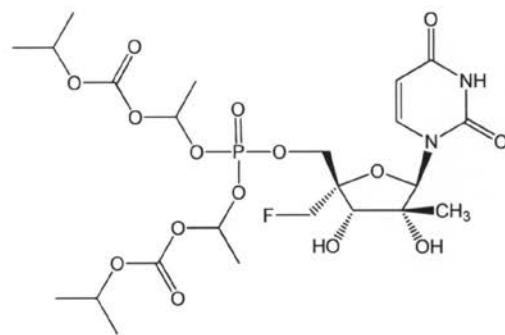
,



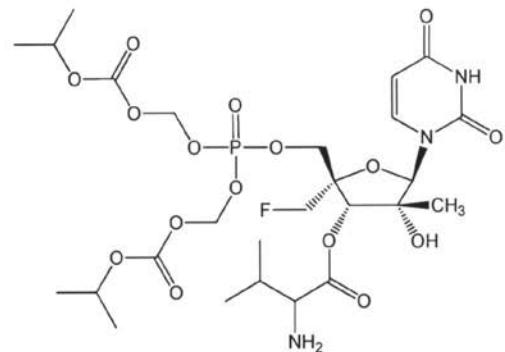
,



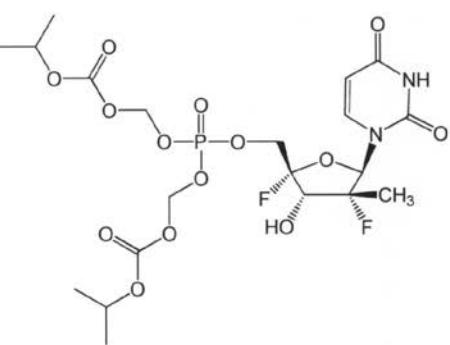
,



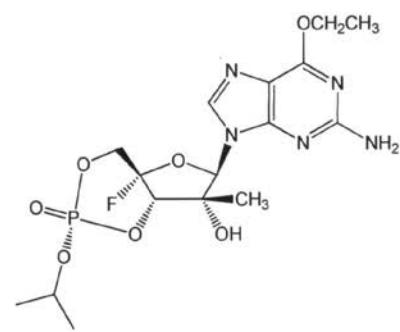
,



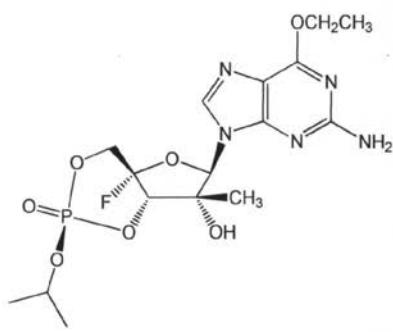
,



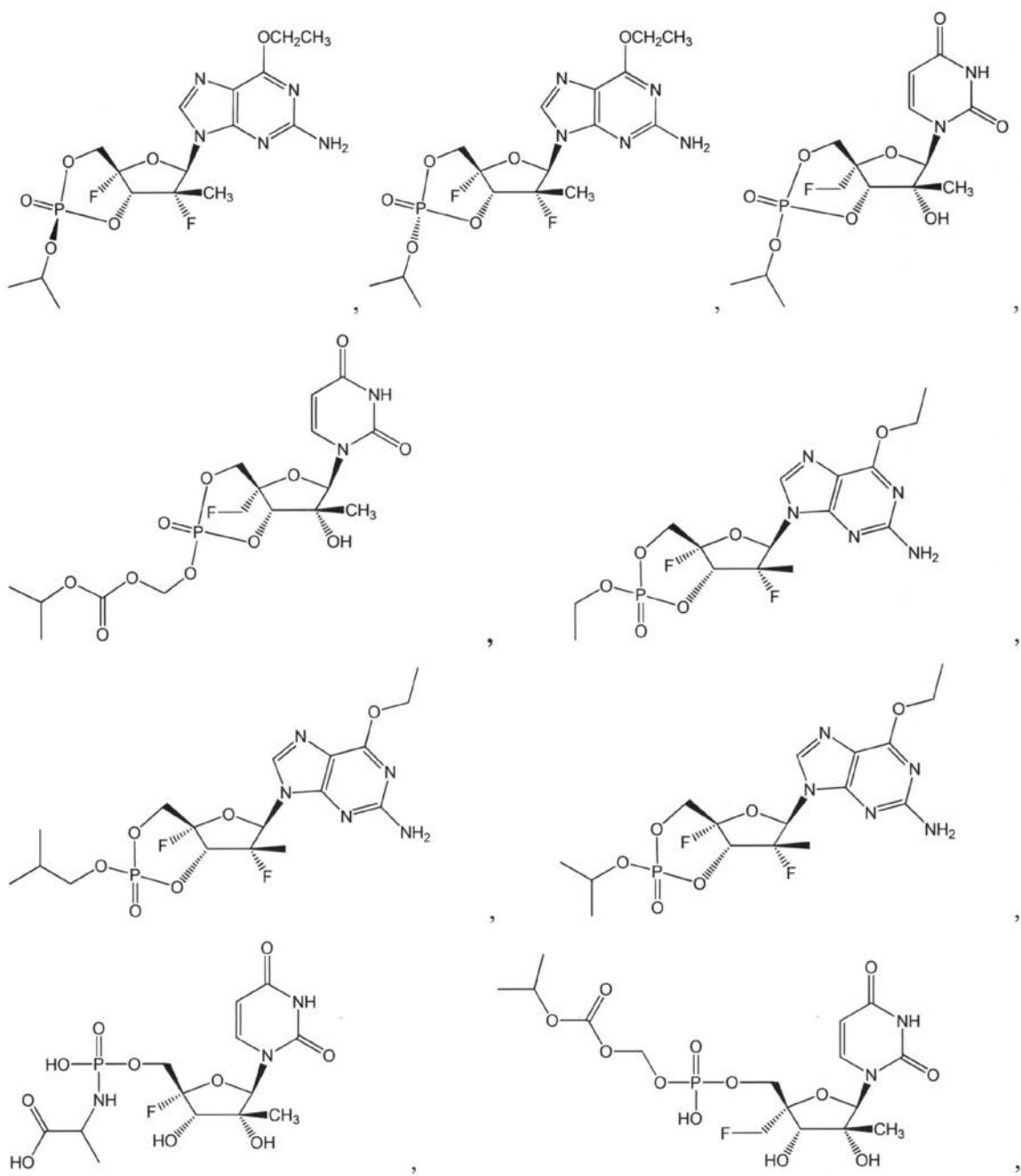
,

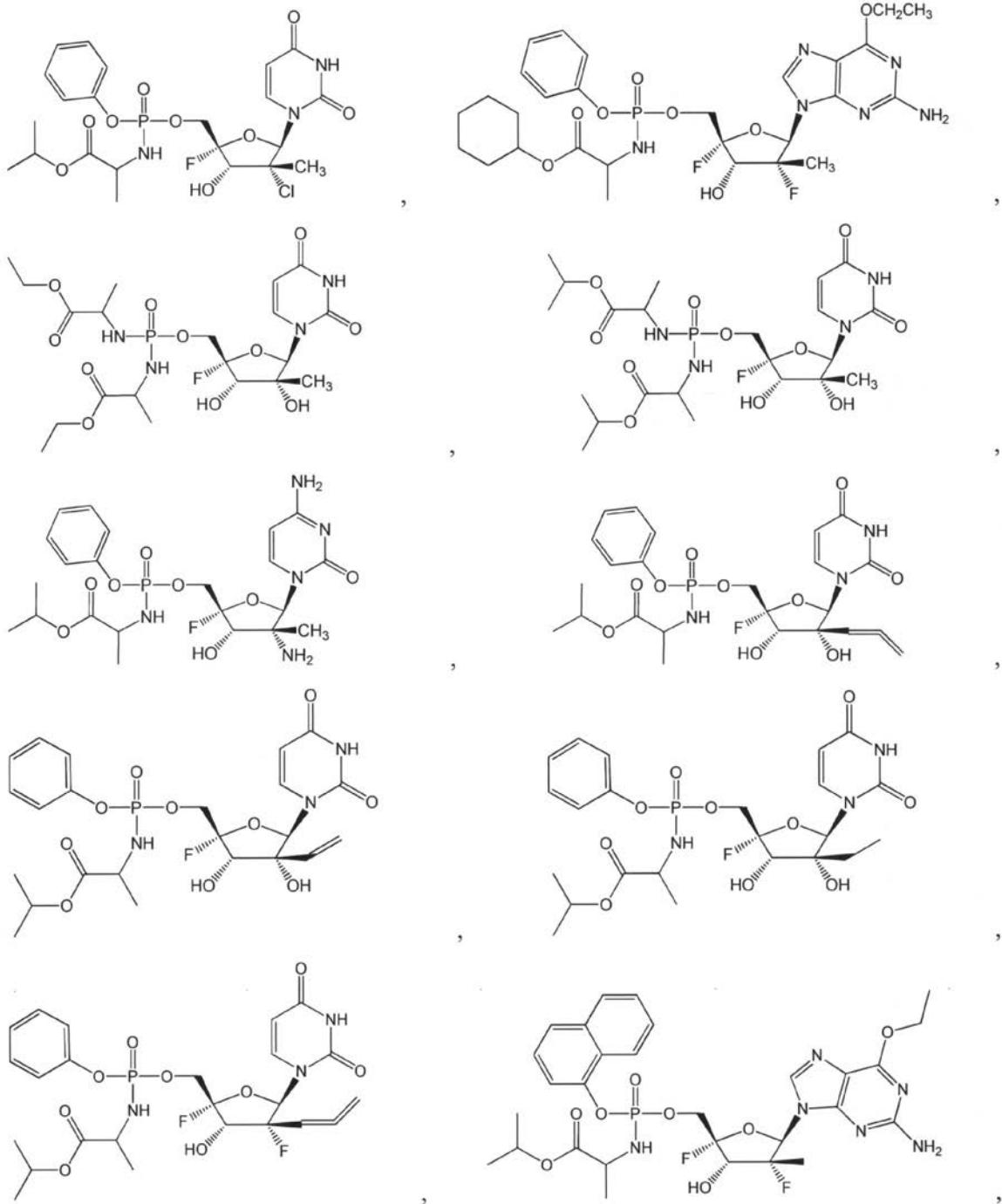


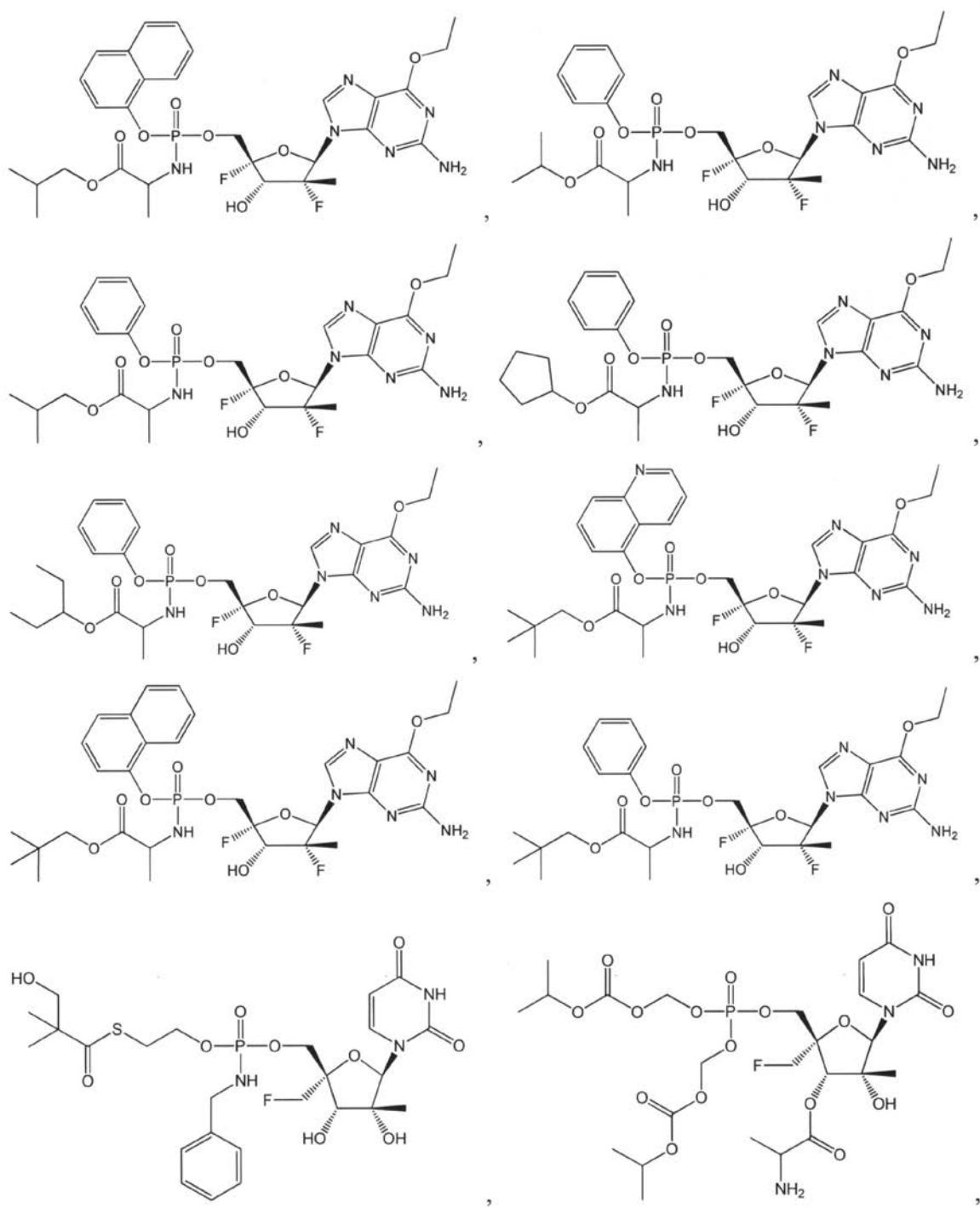
,

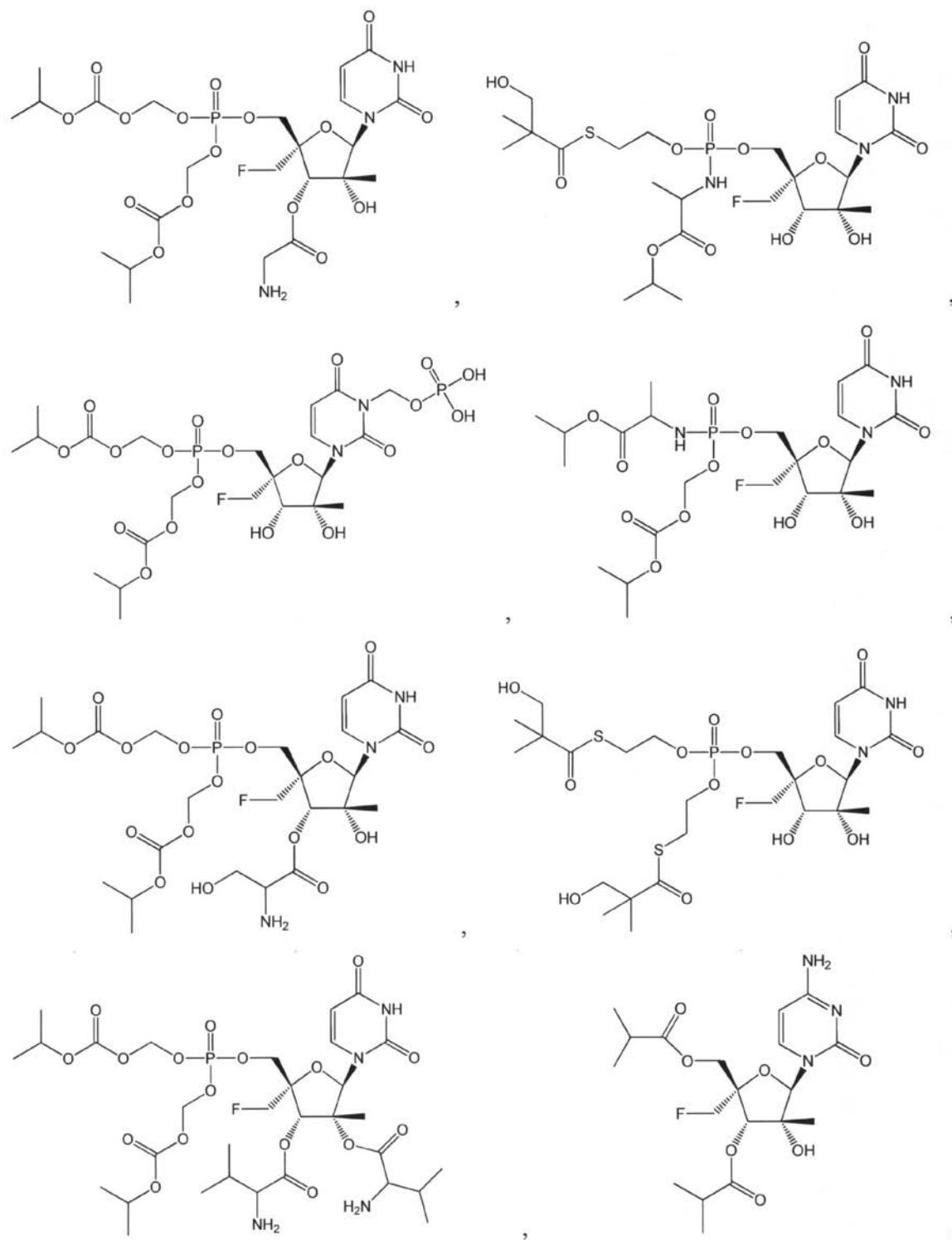


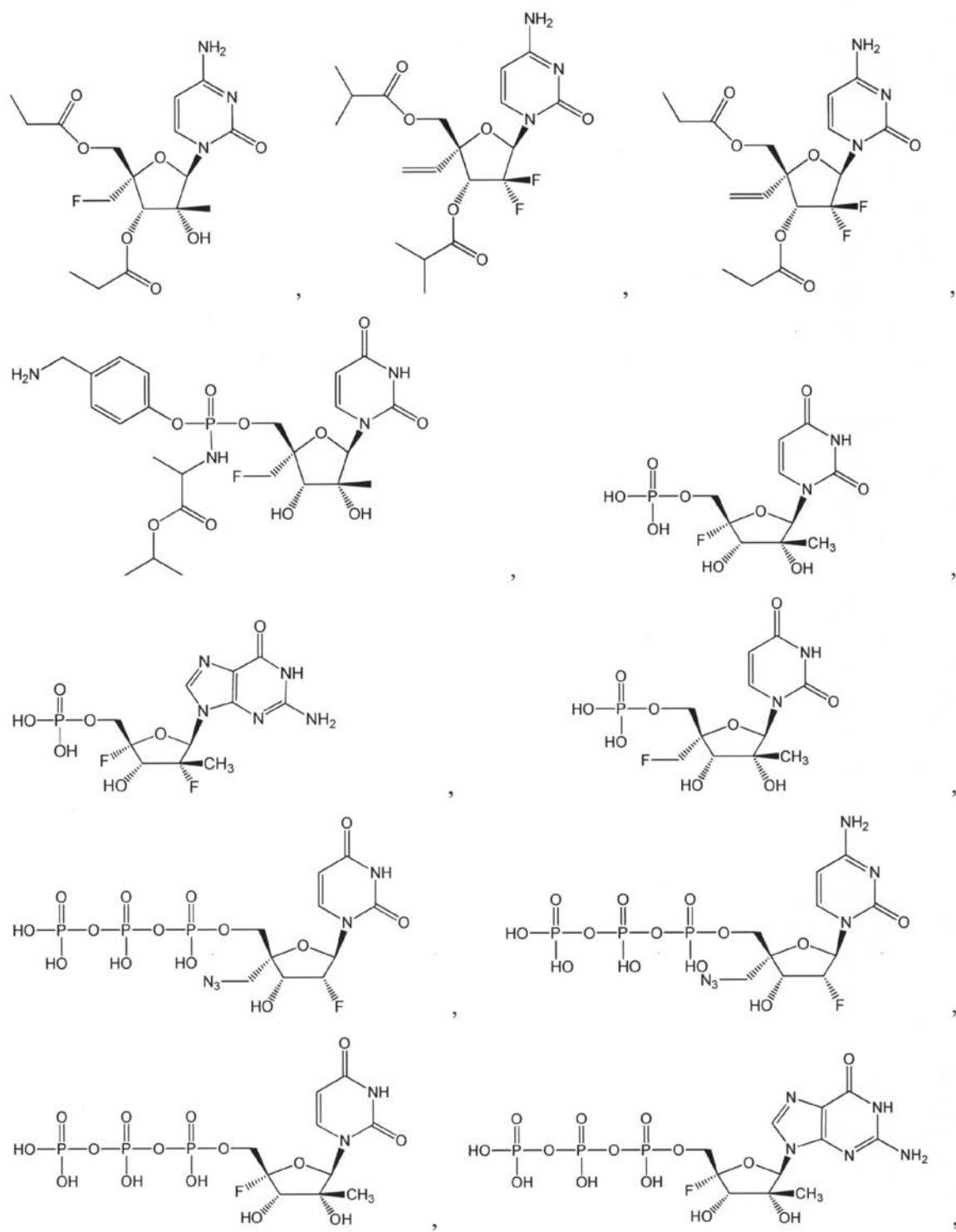
,

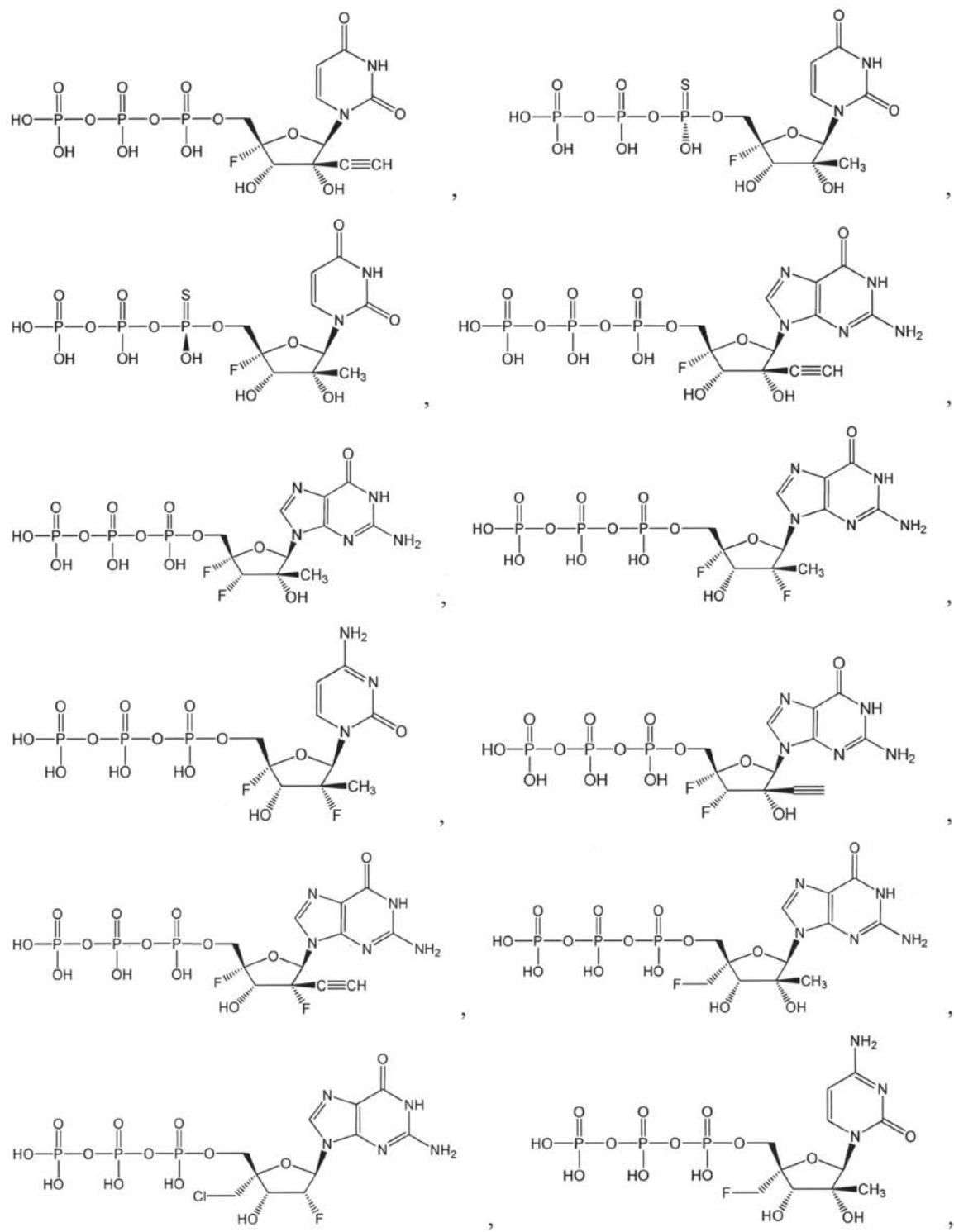


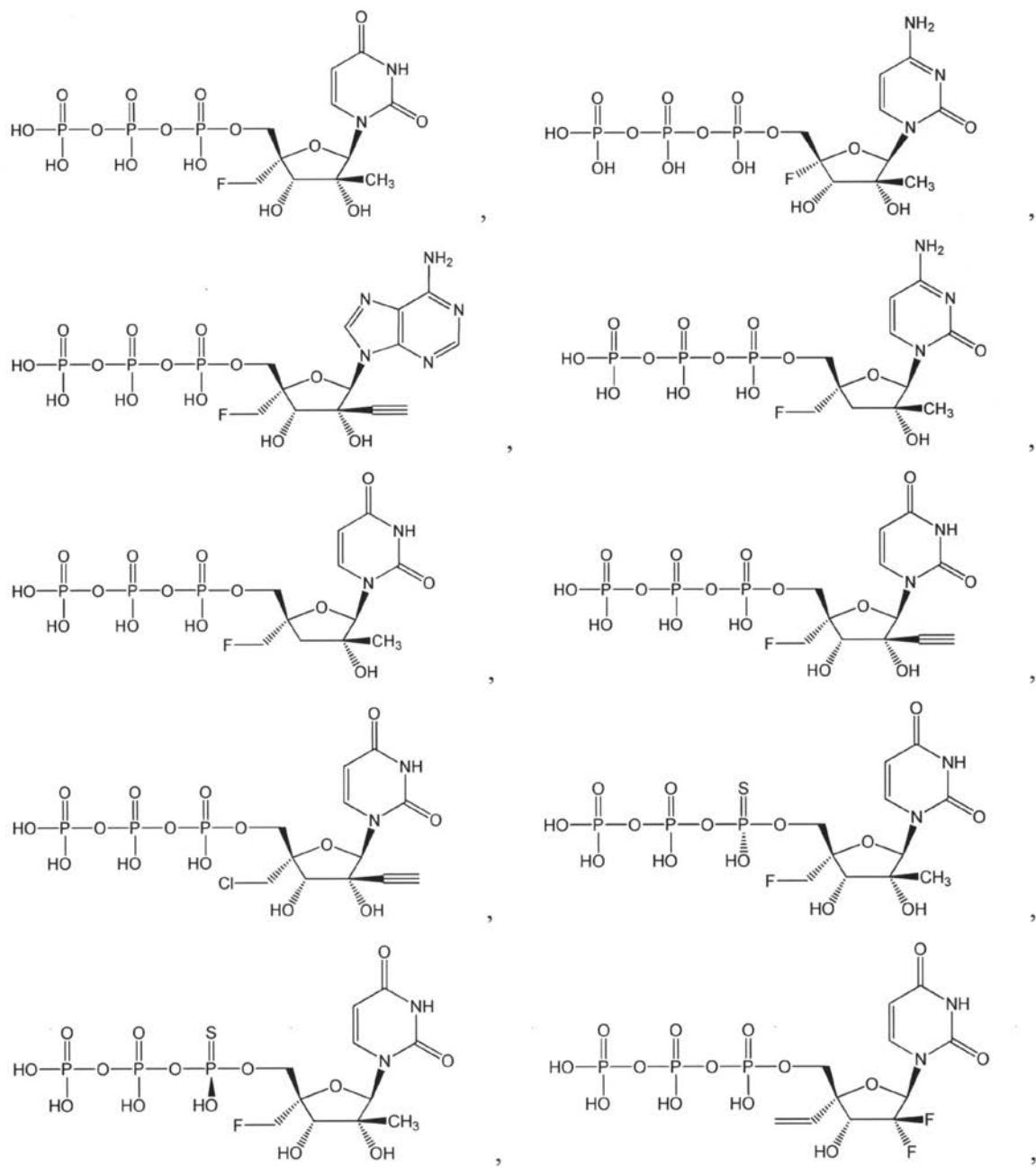


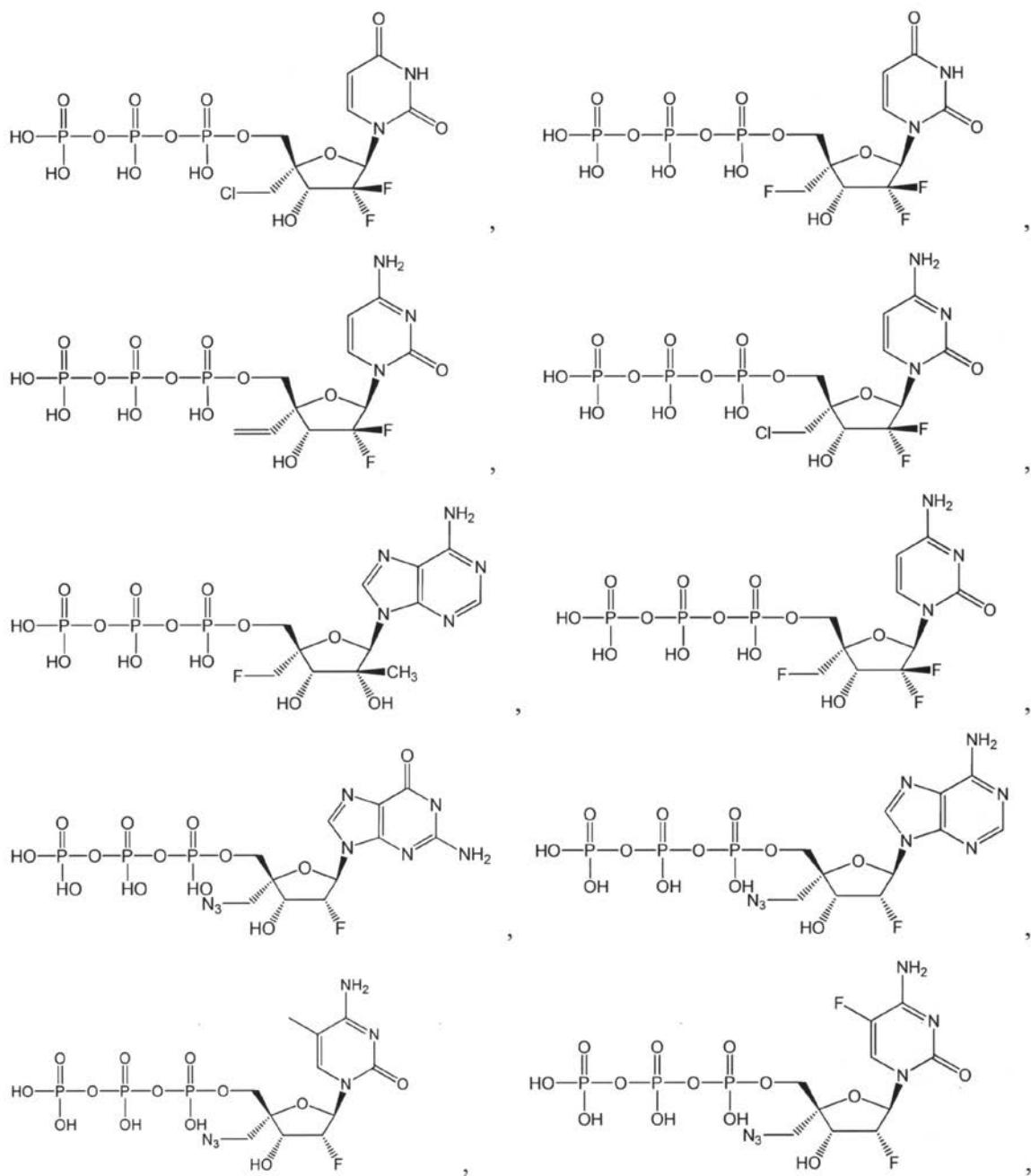


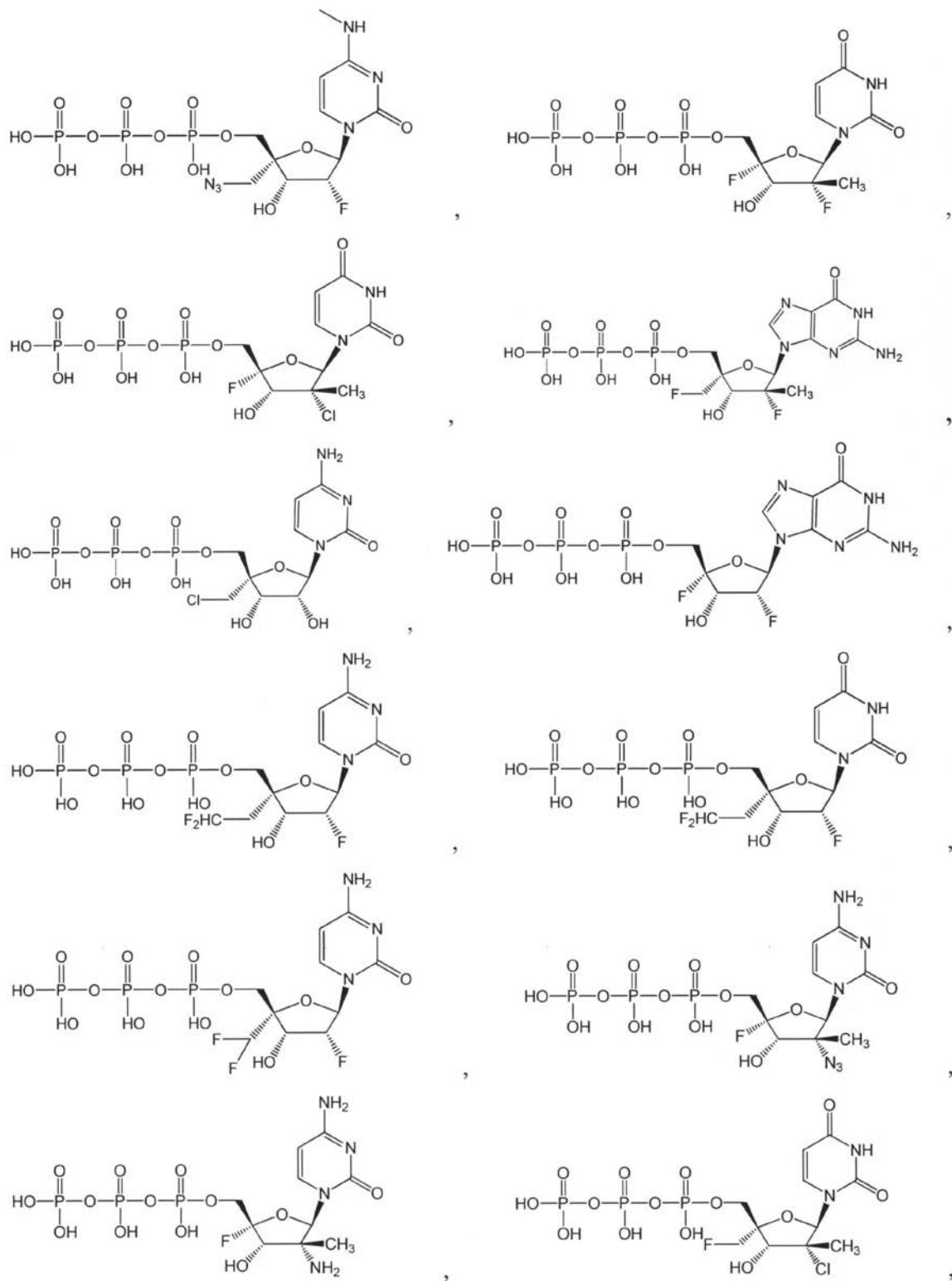


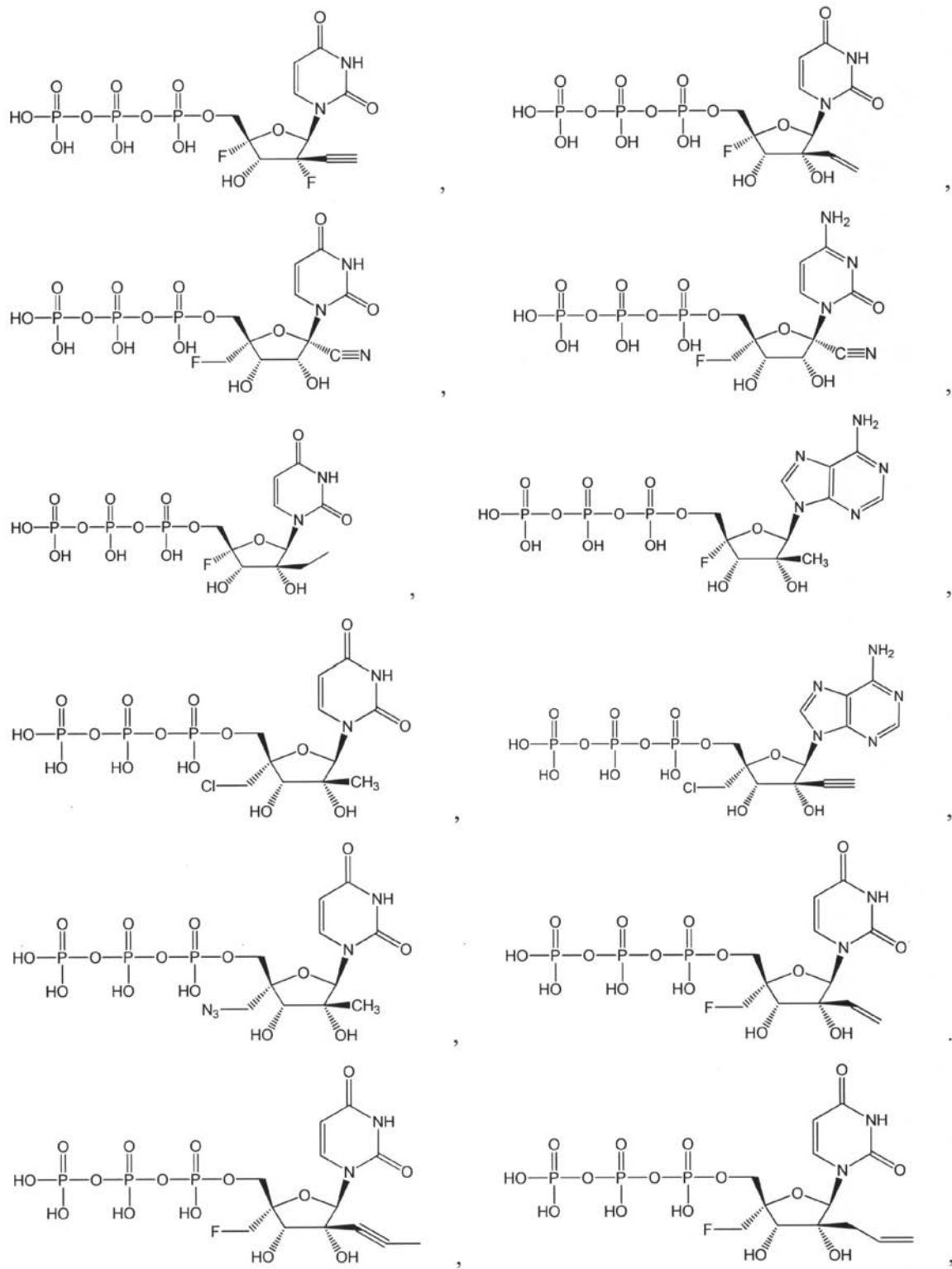


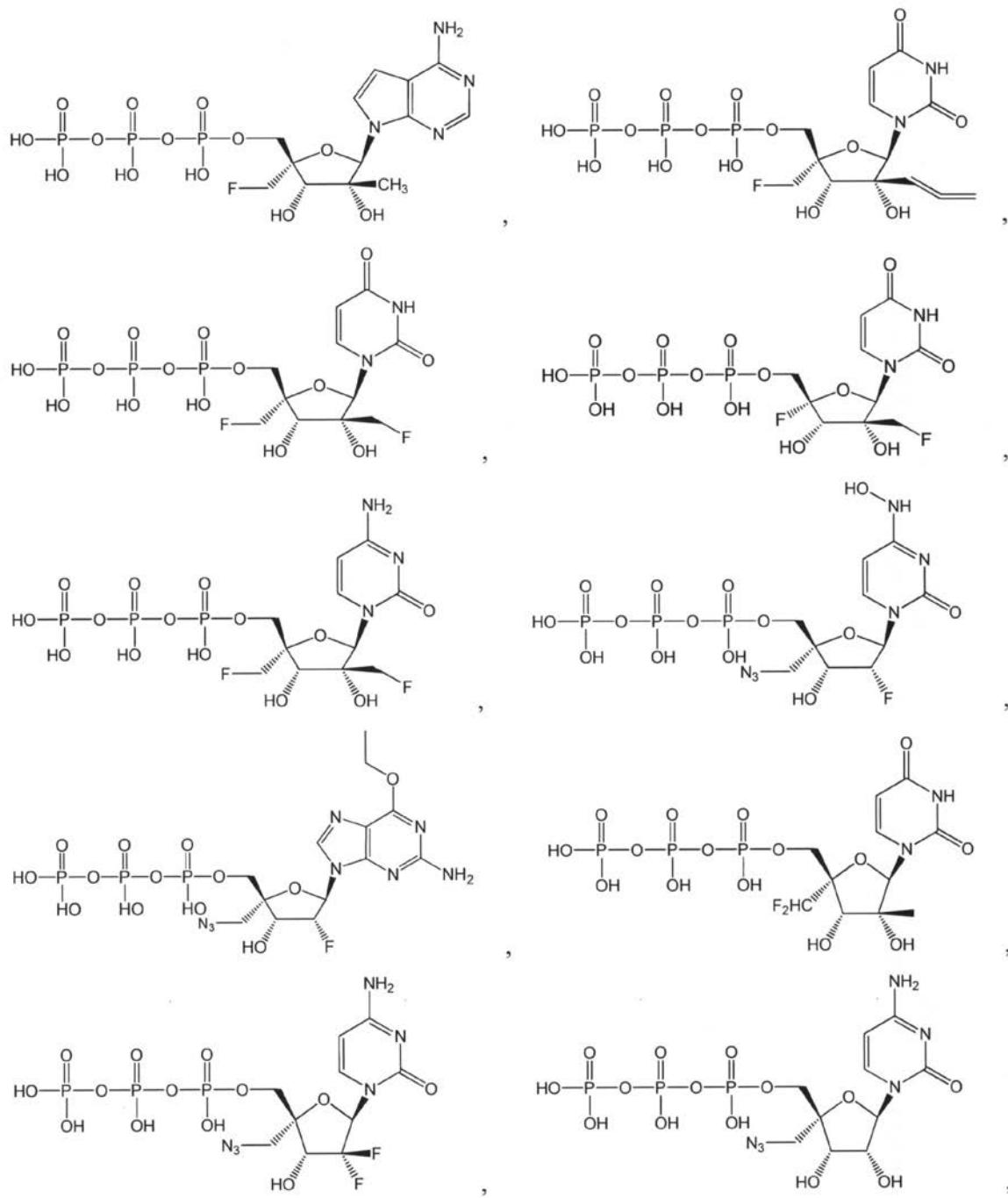


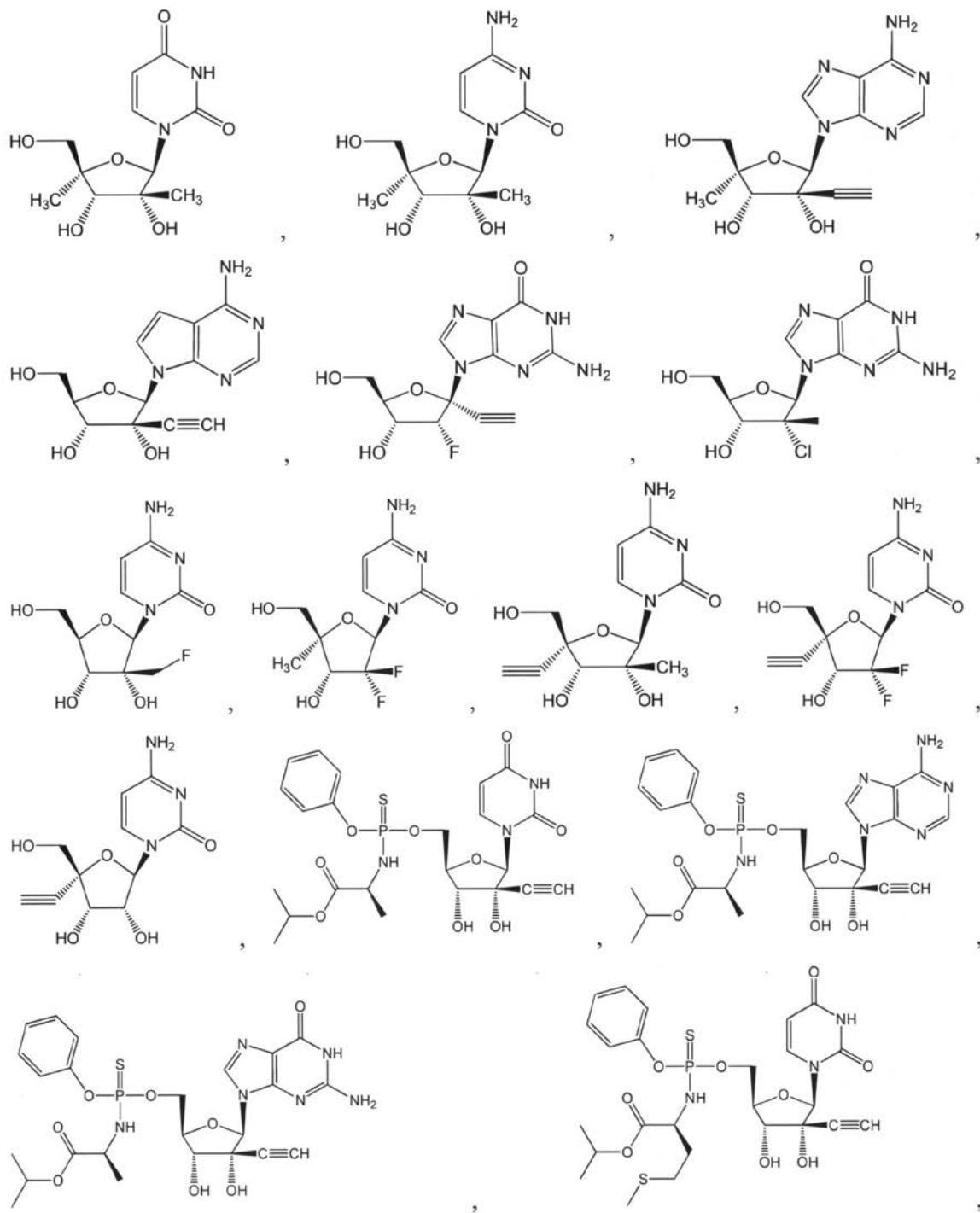


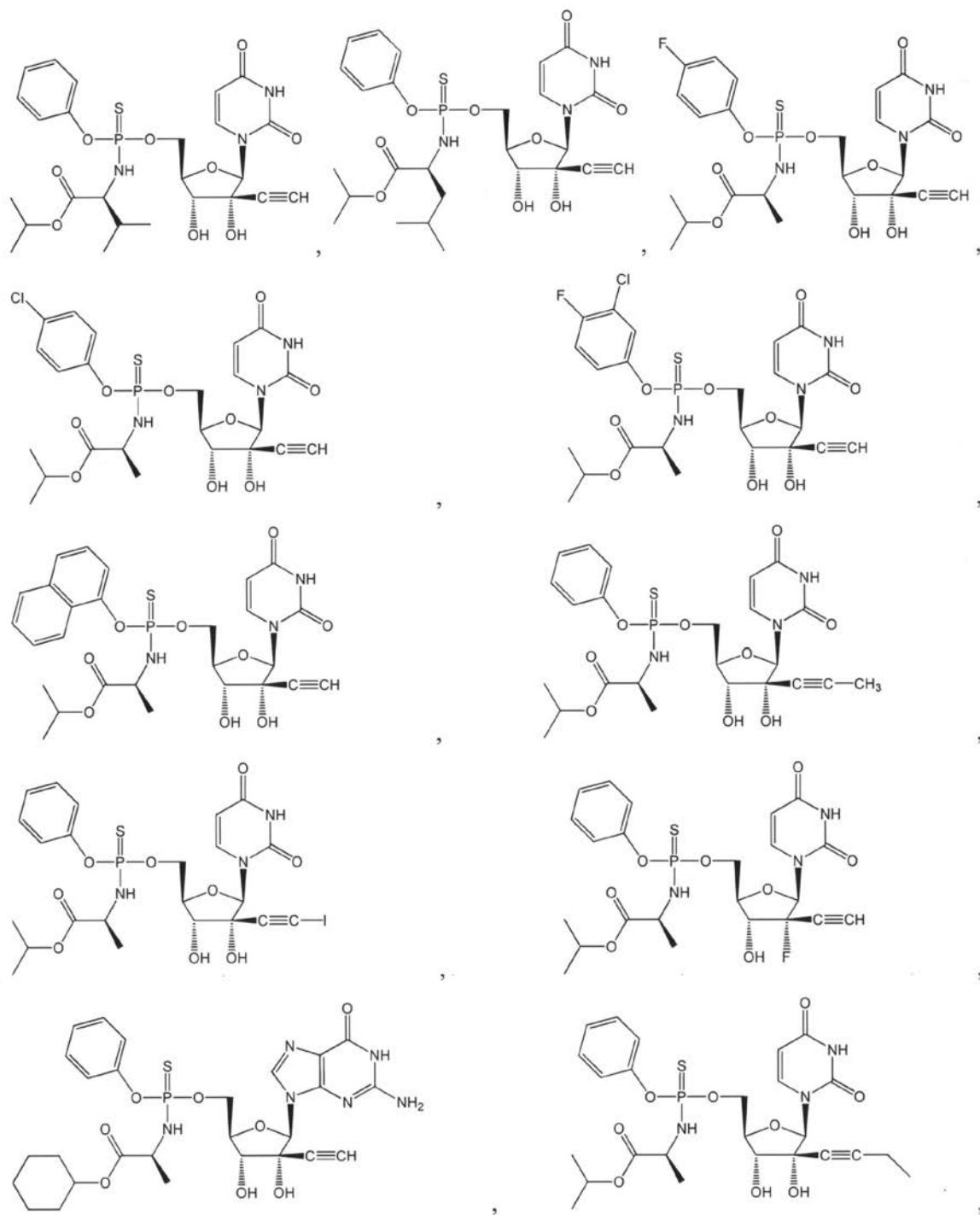


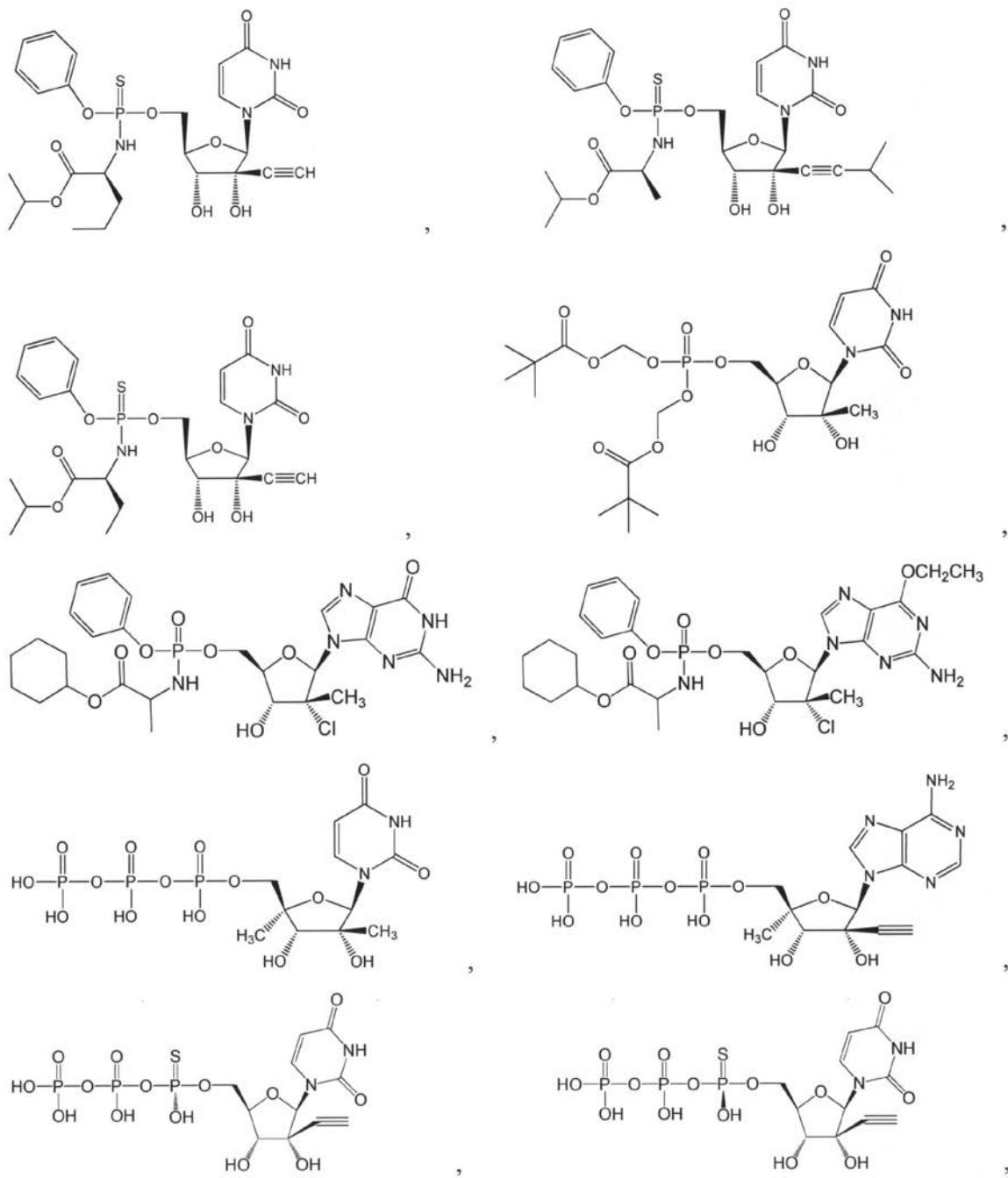


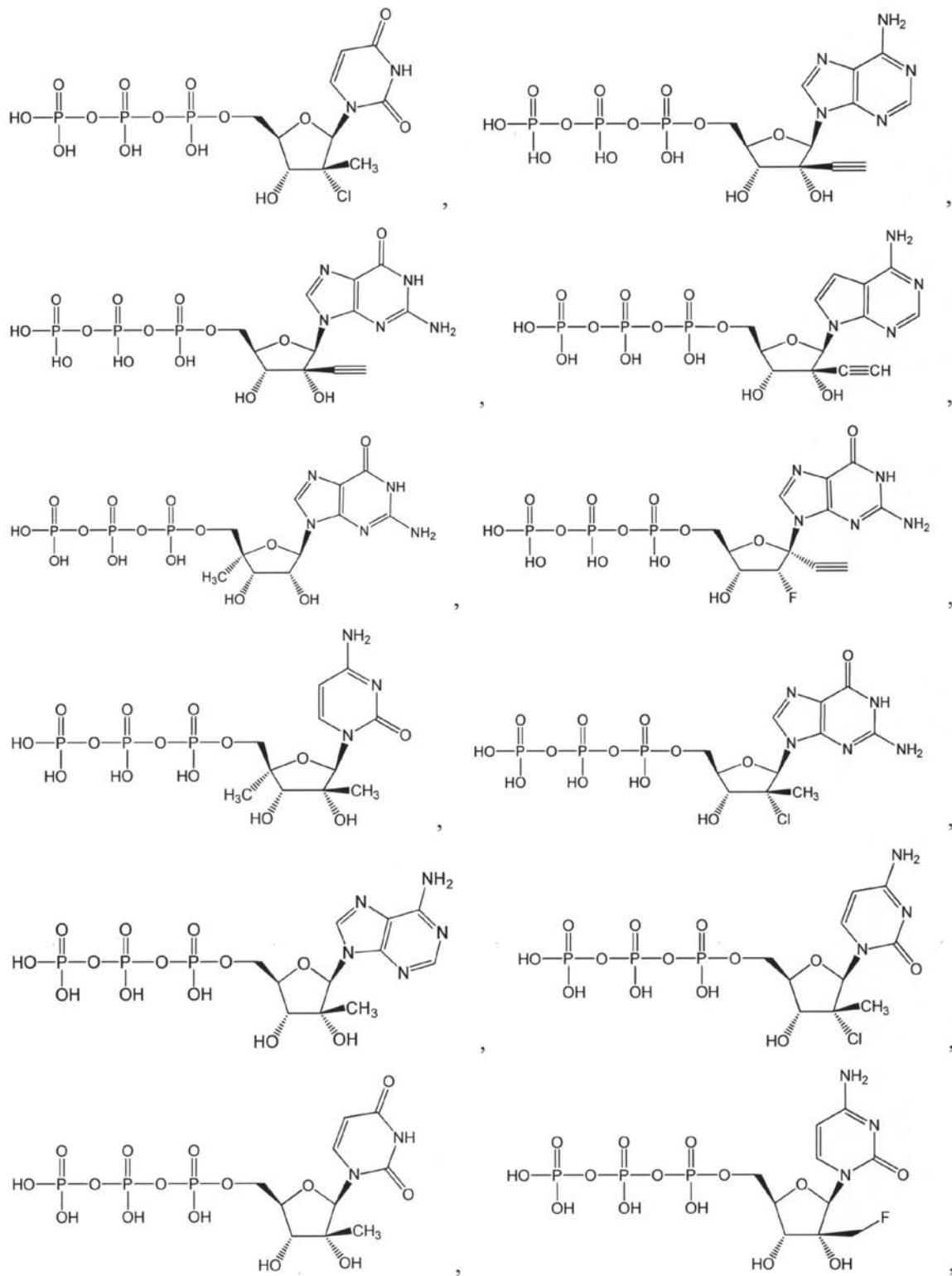


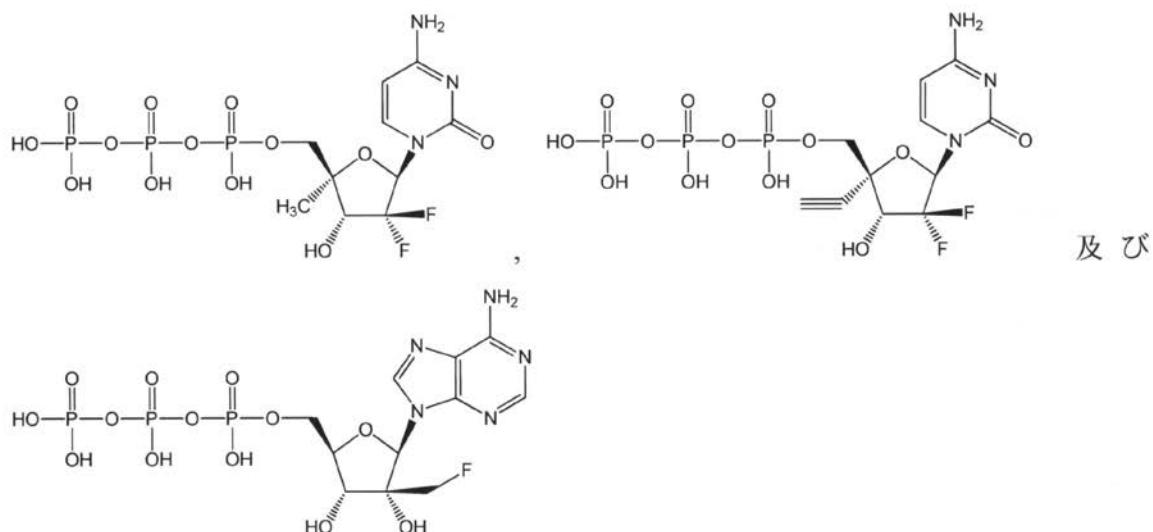








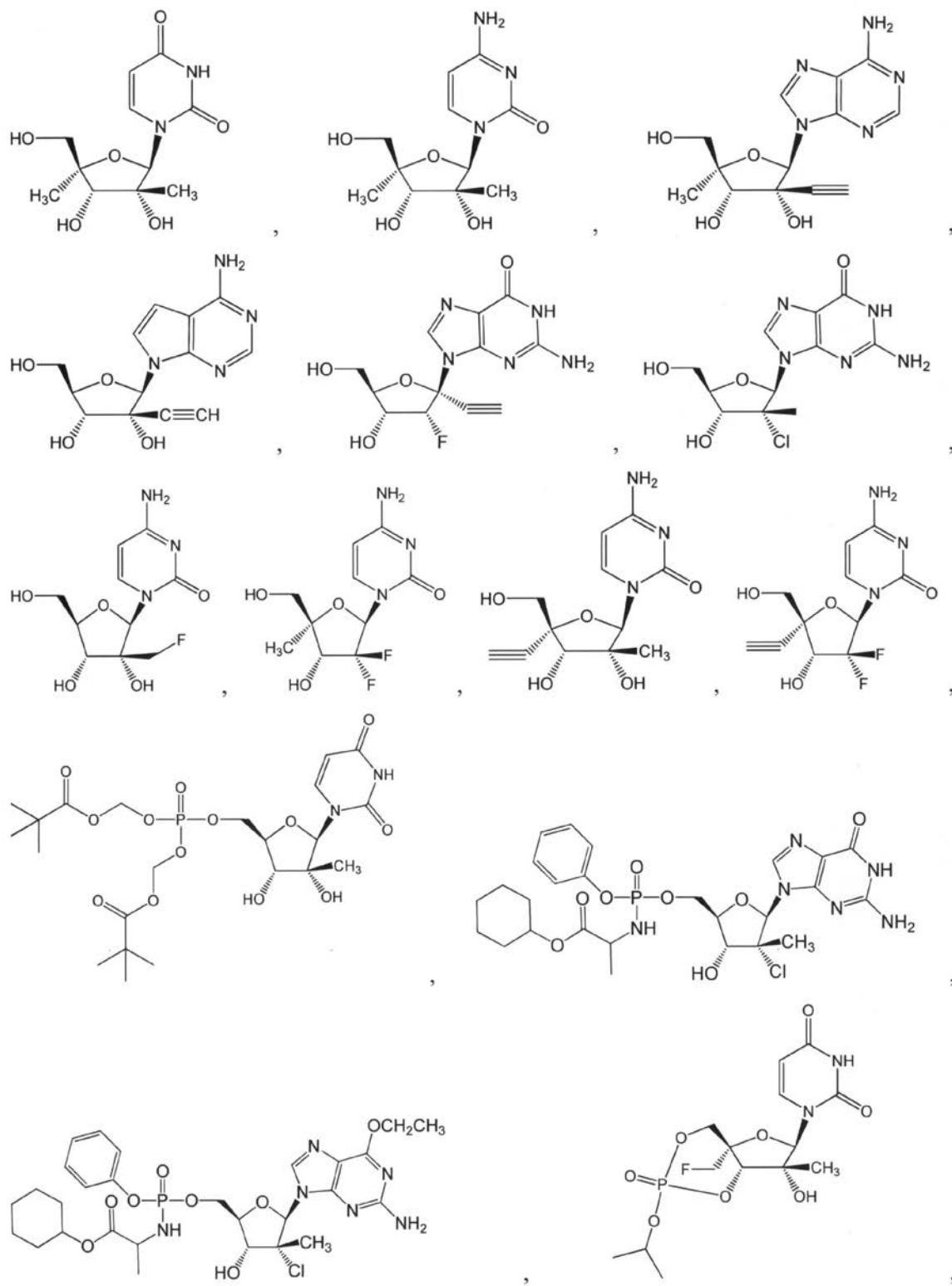


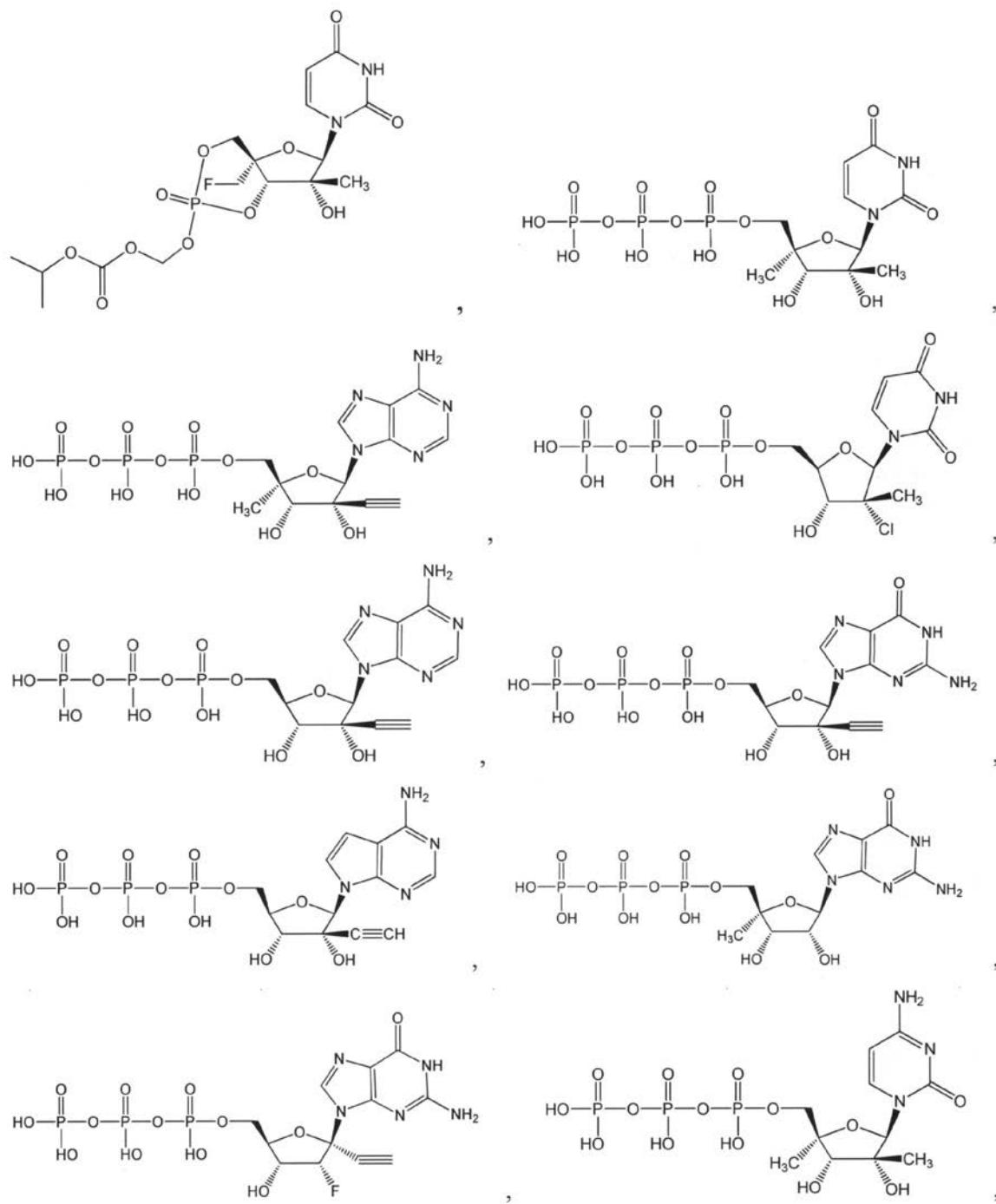


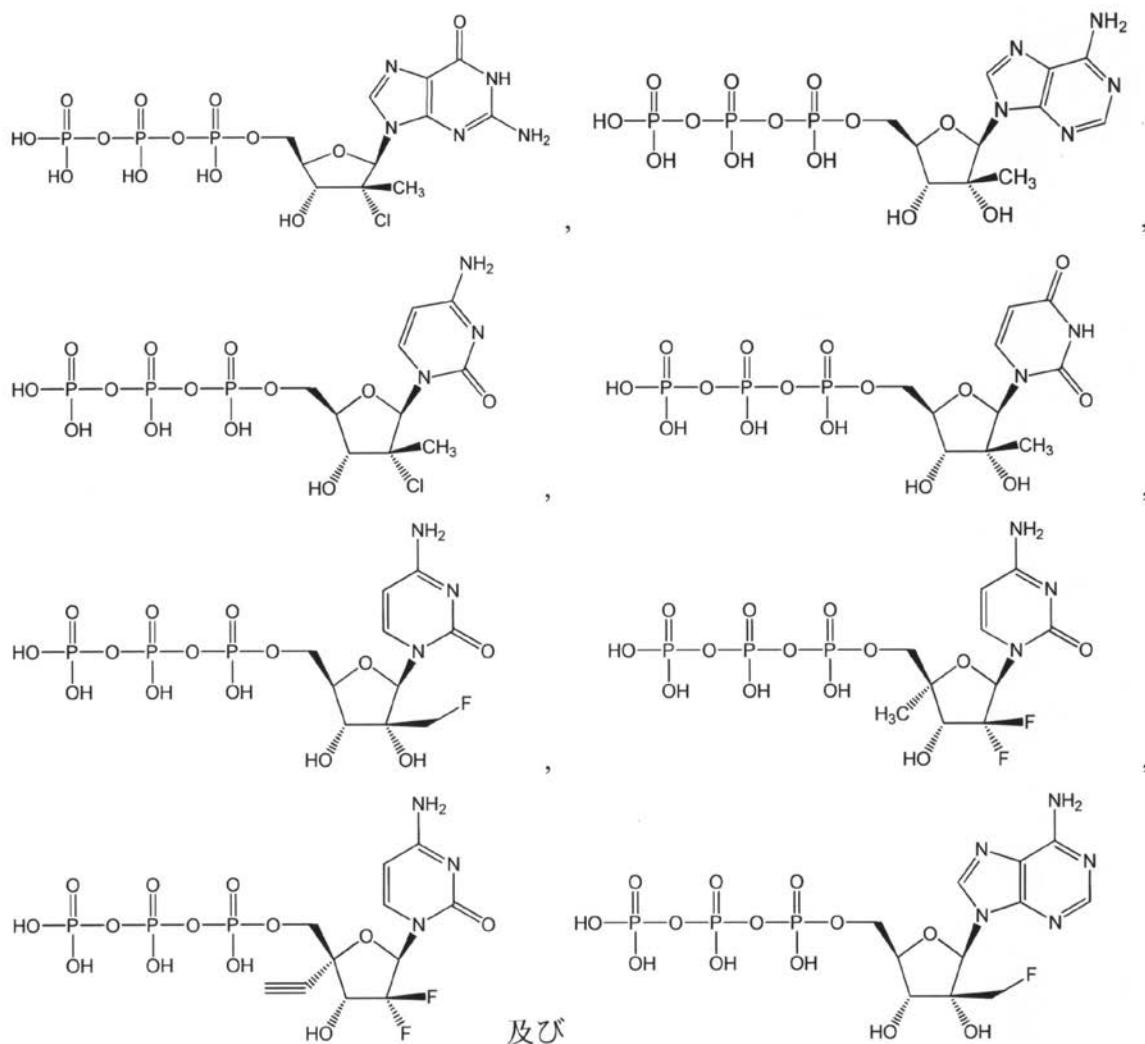
からなる群から選択される化合物またはその薬剤的に許容できる塩を含む、ピコルナウイルス科ウイルス感染症を改善または治療するための医薬組成物。

【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剤的に許容できる塩を含む、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医薬組成物。