

【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22年12月9日(2010.12.9)

【公表番号】特表2010-505757(P2010-505757A)

【公表日】平成22年2月25日(2010.2.25)

【年通号数】公開・登録公報2010-008

【出願番号】特願2009-529767(P2009-529767)

【国際特許分類】

C 07 D 207/34	(2006.01)
C 07 D 401/12	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
C 07 D 417/14	(2006.01)
C 07 D 417/12	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 K 31/4025	(2006.01)
A 61 K 31/4709	(2006.01)
A 61 K 31/4439	(2006.01)
A 61 K 45/00	(2006.01)
A 61 P 31/12	(2006.01)
A 61 P 31/04	(2006.01)
A 61 P 31/10	(2006.01)
A 61 P 31/00	(2006.01)
A 61 P 33/00	(2006.01)
A 61 P 33/06	(2006.01)
C 07 K 5/00	(2006.01)
C 12 Q 1/68	(2006.01)
C 12 N 15/09	(2006.01)
G 01 N 33/58	(2006.01)

【F I】

C 07 D 207/34	C S P
C 07 D 401/12	
C 07 D 401/14	
C 07 D 417/14	
C 07 D 417/12	
A 61 K 31/5377	
A 61 K 31/4025	
A 61 K 31/4709	
A 61 K 31/4439	
A 61 K 45/00	
A 61 P 31/12	
A 61 P 31/04	
A 61 P 31/10	
A 61 P 31/00	
A 61 P 33/00	
A 61 P 33/06	
C 07 K 5/00	
C 12 Q 1/68	A
C 12 N 15/09	A
G 01 N 33/58	A

【手続補正書】

【提出日】平成22年9月27日(2010.9.27)

【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

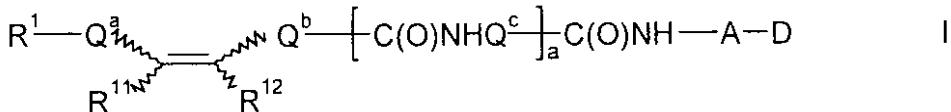
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

G^1 がCHを表す式Iaの構造フラグメント以外のものである Q^a または Q^b 基を少なくとも1つ含むという条件である、式I

【化1】



[前記式中、波線はシス-またはトランス-立体化学を示し、
 R^1 は、

H、

 $R^{1a}C(O)-NH-$ 、NO₂または $-N(R^{2a})R^{2b}$

を表し；

 R^{1a} は、

アリール(この後者の基は、OH、ハロ、シアノ、ニトロ、 $N(R^{2a})R^{2b}$ 、C₁～C₄アルキルおよびC₁～C₄アルコキシから選択される1個または複数の置換基で場合により置換されている)；

芳香族または部分芳香族C₁₃～C₁₄三環式炭素環(この後者の基は、OH、ハロ、シアノ、ニトロ、 $N(R^{2a})R^{2b}$ 、C₁～C₄アルキルおよびC₁～C₄アルコキシから選択される1個または複数の置換基で場合により置換されており、およびこの後者の基は、部分芳香族である場合、非芳香族部分で1個または2個のオキソ基で場合により置換されている)；または

C₁～C₁₂アルキル(この後者の基は、ハロおよびアリール(この後者の基は、OH、ハロ、シアノ、ニトロ、 $N(R^{2a})R^{2b}$ 、C₁～C₄アルキルおよびC₁～C₄アルコキシから選択される1個または複数の置換基で場合により置換されている)から選択される1個または複数の置換基で場合により置換および/または終結されている)

を表し；

 a は、1、2、3、または4を表し； A は、C₂～C₆アルキレンまたは $A^1-C(O)N(H)-A^2$ (A^2 は基Dに結合している)を表し； A^1 は、C₁～C₄アルキレンを表し； A^2 は、C₂～C₅アルキレンを表し； D は、Het¹、 $-N(R^{3a})R^{3b}$ 、 $-C(=NR^{3c})N(R^{3d})R^{3e}$ または $-N(R^{3f})C(=NR^{3g})N(H)R^{3h}$ を表し；

Het¹は、少なくとも1個のN原子、ならびに場合によりN、OおよびSから選択される1個または複数のヘテロ原子を含む、4員から12員の複素環基を表し、この複素環基は、=O、OH、ハロ、シアノ、ニトロ、 $N(R^{2a})R^{2b}$ 、C₁～C₄アルキルおよびC₁～C₄アルコキシから選択される1個または複数の置換基によって場合により置換されており；

 R^{3a} および R^{3b} は独立に、H、C₁～C₆アルキルまたはHet²を表し； R^{3c} から R^{3h} は独立に、HまたはC₁～C₆アルキルを表し；

Het²は独立に、N、OおよびSから選択される1個または複数のヘテロ原子を含む4員から12員の複素環基を表し、この複素環基は、=O、OH、ハロ、シアノ、ニトロ、 $N(R^{2a})R^{2b}$ 、C₁

~C₄アルキルおよびC₁~C₄アルコキシから選択される1個または複数の置換基によって場合により置換されており；

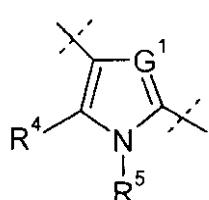
Q^aからQ^cはそれぞれ独立に、ここで使用する場合それぞれ存在する所で、

ナフチル(OH、ハロ、シアノ、ニトロ、N(R^{2a})R^{2b}、C₁~C₄アルキルおよびC₁~C₄アルコキシから選択される1個または複数の置換基によって場合により置換されている)、

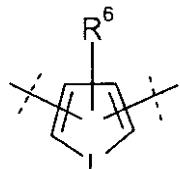
Het³、あるいは

式Ia、Ib、Ic、Id、IeまたはIf

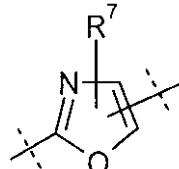
【化2】



Ia

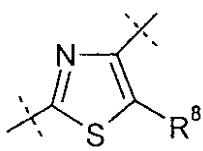


Ib

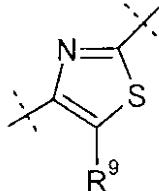


Ic

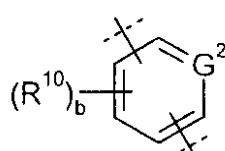
【化3】



Id



Ie



If

{前記式中、点線はフラグメントの結合の位置を示し；

R⁴は、HまたはC₁~C₆アルキルを表し；

R⁵は、C₁~C₁₂アルキルを表し；

R⁶、R⁷、R⁸およびR⁹は独立に、HまたはC₁~C₁₂アルキルを表し；

R¹⁰は、それぞれ存在する所で独立に、OH、ハロ、シアノ、ニトロ、N(R^{2a})R^{2b}、C₁~C₄アルキル、-S-C₁~-S-C₄アルキルおよびC₁~C₄アルコキシを表し；

bは、0、1、2、または3を表し；

G¹およびG²は独立に、CHまたはNを表し、あるいはG²はC-R¹⁰を表し；

Lは、OまたはSを表す}

の構造フラグメント

を表し；

Het³は、N、OおよびSから選択される1個または複数のヘテロ原子を含む9員または10員の二環複素環基を表し、この基は、=O、ハロ、シアノ、ニトロ、N(R^{2a})R^{2b}、Het^a、C₁~C₄アルキルおよびOR^aから選択される1個または複数の置換基によって場合により置換されており；

R^aは、H、C₁~C₄アルキル、アリール(この後者の基は、OH、ハロ、シアノ、ニトロ、N(R^{2a})R^{2b}、C₁~C₄アルキルおよびC₁~C₄アルコキシから選択される1個または複数の置換基によって場合により置換されている)あるいはHet^bを表し；

Het^aおよびHet^bは独立に、N、OおよびSから選択される1個または複数のヘテロ原子を含む4員から12員の複素環基を表し、この複素環基は、=O、OH、ハロ、シアノ、ニトロ、N(R^{2a})R^{2b}、C₁~C₄アルキルおよびC₁~C₄アルコキシから選択される1個または複数の置換基によって場合により置換されており；

R¹¹およびR¹²は独立に、ここで使用する場合それぞれ存在する所で、H、C₁~C₆アルキル、またはアリール(この後者の基は、OH、ハロ、シアノ、ニトロ、N(R^{2a})R^{2b}、C₁~C₄ア

ルキルおよびC₁～C₄アルコキシから選択される1個または複数の置換基で場合により置換されている)を表し;

R^{2a}およびR^{2b}は独立に、ここで使用する場合それぞれ存在する所で、HまたはC₁～C₄アルキルを表し、あるいはR^{2a}は-C(O)R¹³を表し;

R¹³はHまたはC₁～C₄アルキルを表し;ならびに

特別の指示のない限り、アルキル、アルキレン、アルケニレン、シクロアルキレン、フェニレン、およびナフチレン基、ならびにアルコキシ基のアルキル部分を1個または複数のハロ原子により置換してよく;

アルキル、アルコキシ、およびアルキレンは、明細書中にさらに規定されるものである]の化合物、あるいは薬剤として許容可能なそれらの塩または溶媒和物。

【請求項2】

R¹が、NO₂、-N(R^{2a})R^{2b}またはHを表し;あるいは

R^{1a}が、C₁～C₈アルキルを表す

請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

aが、1、2または3を表し;ならびに/あるいは

Aが、C₂～C₆アルキレンを表す

請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

Dが、Het¹またはN(R^{3a})R^{3b}を表し;

Het¹が、少なくとも1個のN原子、ならびに場合によりN、OおよびSから選択される1個または複数のヘテロ原子を含む5員から7員の複素環基を表し、この複素環基は、C₁～C₄アルキルおよびC₁～C₄アルコキシから選択される1個または複数の置換基によって場合により置換されており;ならびに/あるいは

R^{3a}およびR^{3b}が、C₁～C₄アルキルを表す

請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項5】

Q^aおよびQ^bが独立に、

ナフチル(ハロ、ニトロ、N(R^{2a})R^{2b}、C₁～C₃アルキルおよびC₁～C₃アルコキシから選択される1個または複数の置換基によって場合により置換されている)、

Het³、

あるいは式Ia、IdまたはIfの構造フラグメント

を表し;ならびに/あるいは

Q^cが、Ia、Ib、Ic、IdまたはIfの構造フラグメントを表す

請求項1から4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

R⁴がHを表し;

R⁵がC₁～C₆アルキルを表し;ならびに/あるいは

R⁸が、HまたはC₁～C₈アルキルを表す

請求項1から5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項7】

R¹⁰が、独立にそれぞれ存在する所で、OH、ハロ、ニトロ、N(R^{2a})R^{2b}、C₁～C₃アルキルおよびC₁～C₃アルコキシを表し;ならびに/あるいは

bが、0、1または2を表す

請求項1から6のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項8】

G¹が、CHを表し;ならびに/あるいは

G²が、CHまたはNを表す

請求項1から7のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項9】

Het³が、N原子、ならびに場合によりN、OおよびSから選択される1個または複数のヘテロ原子を含む、10員の二環複素環基を表し、この基は、ハロ、ニトロ、N(R^{2a})R^{2b}、Het^a、C₁～C₃アルキルおよびOR^aから選択される1個または複数の置換基によって場合により置換されており；

R^aが、C₁～C₂アルキルまたはHet^bを表し；ならびに/あるいは

Het^aおよびHet^bが独立に、N、OおよびSから選択される1個または複数のヘテロ原子を含む、10員または9員の複素環基を表し、この複素環基は、ハロ、ニトロ、C₁～C₂アルキルおよびC₁～C₂アルコキシから選択される1個または複数の置換基によって場合により置換されている

請求項1から8のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項10】

R¹¹およびR¹²が、両方ともHを表す

請求項1から9のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項11】

R^{2a}およびR^{2b}が独立に、ここで使用する場合それぞれ存在する所で、HまたはC₁～C₂アルキルを表す

請求項1から10のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項12】

Q^aおよびQ^bのうち1つが式I^fの構造フラグメントを表し、Q^aおよびQ^bのうちもう1つがナフチル(OH、ハロ、シアノ、ニトロ、N(R^{2a})R^{2b}、C₁～C₄アルキルおよびC₁～C₄アルコキシから選択される1個または複数の置換基によって場合により置換されている)、Het³、

あるいは式I^a、I^b、I^c、I^d、I^eまたはI^fの構造フラグメントを表す、

あるいはQ^aがHet³を表し、Q^bが

ナフチル(OH、ハロ、シアノ、ニトロ、N(R^{2a})R^{2b}、C₁～C₄アルキルおよびC₁～C₄アルコキシから選択される1個または複数の置換基によって場合により置換されている)、Het³、

あるいは式I^a、I^b、I^c、I^d、I^eまたはI^fの構造フラグメントを表す、

請求項1から11のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項13】

Q^aおよびQ^bが、相互にトランスに結合し、

R¹¹およびR¹²が両方ともHを表し；

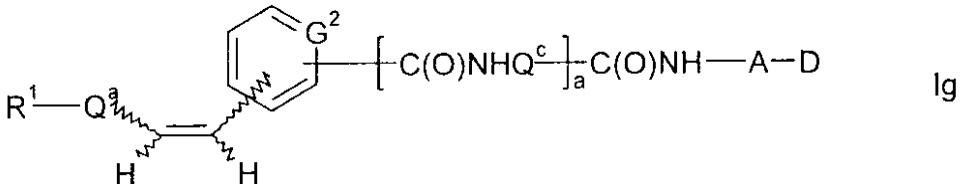
aは2を表し；ならびに/あるいは

Q^cがそれぞれ独立に、請求項1で定義される式I^aまたはI^dの構造フラグメントを表す請求項12に記載の化合物。

【請求項14】

式I^g

【化4】



[前記式中、波線は場合によりシス-またはトランス-立体化学を示し、R¹は、NO₂、-N(R^{2a})R^{2b}またはHを表し；

aは、1または2を表し；

Q^aは、ナフチル(OH、ハロ、シアノ、ニトロ、N(R^{2a})R^{2b}、C₁～C₄アルキルおよびC₁～C₄

アルコキシから選択される1個または複数の置換基によって場合により置換されている)、 Het^3 または式I fの構造フラグメントを表し;
 G^2 は、CHまたはNを表し;
 R^{2a} 、 R^{2b} 、 Het^3 、 Q^c 、AおよびDは請求項1で定義したとおりである]
の化合物である、請求項1に記載の化合物。

【請求項 1 5】

- (i) 4-({[4-({4-[(E)-2-(3-メトキシフェニル)エテニル]ベンゾイル}アミノ)-1-メチル-1H-ピロール-2-イル]カルボニル}アミノ)-1-メチル-N-[2-(4-モルホリニル)エチル]-1H-ピロール-2-カルボキシアミド;
- (ii) 1-メチル-4-({[1-メチル-4-({4-[(E)-2-(3-キノリニル)エテニル]ベンゾイル}アミノ)-1H-ピロール-2-イル]カルボニル}アミノ)-N-[2-(4-モルホリニル)エチル]-1H-ピロール-2-カルボキシアミド;
- (iii) 1-メチル-N-[1-メチル-5-({[2-(4-モルホリニル)エチル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]-4-({4-[(E)-2-(1-メチル-1H-ピロール-2-イル)エテニル]ベンゾイル}アミノ)-1H-ピロール-2-カルボキシアミド;
- (iv) N-[5-({[3-(ジメチルアミノ)プロピル]アミノ}カルボニル)-1-メチル-1H-ピロール-3-イル]-4-({4-[(E)-2-(3-メトキシフェニル)エテニル]ベンゾイル}アミノ)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキシアミド;
- (v) N-[5-({[3-(ジメチルアミノ)プロピル]アミノ}カルボニル)-1-メチル-1H-ピロール-3-イル]-1-メチル-4-({4-[(E)-2-(3-キノリニル)エテニル]ベンゾイル}アミノ)-1H-ピロール-2-カルボキシアミド;
- (vi) N-[5-({[3-(ジメチルアミノ)プロピル]アミノ}カルボニル)-1-メチル-1H-ピロール-3-イル]-4-({3-[(E)-2-(3-メトキシフェニル)エテニル]ベンゾイル}アミノ)-1-メチル-1H-ピロール-2-カルボキシアミド;
- (vii) N-[5-({[3-(ジメチルアミノ)プロピル]アミノ}カルボニル)-1-メチル-1H-ピロール-3-イル]-1-メチル-4-({4-[(E)-2-(4-ピリジニル)エテニル]ベンゾイル}アミノ)-1H-ピロール-2-カルボキシアミド;
- (viii) N-[5-({[5-({[3-(ジメチルアミノ)プロピル]アミノ}カルボニル)-1-メチル-1H-ピロール-3-イル]アミノ}カルボニル)-1-メチル-1H-ピロール-3-イル]-1-メチル-4-[(E)-2-(4-ニトロフェニル)エテニル]-1H-ピロール-2-カルボキシアミド;
- (ix) N-[3-(ジメチルアミノ)プロピル]-5-イソペンチル-2-({[1-メチル-4-({4-[(E)-2-(3-キノリニル)エテニル]ベンゾイル}アミノ)-1H-ピロール-2-イル]カルボニル}アミノ)-1,3-チアゾール-4-カルボキシアミド;
- (x) 1-メチル-N-[1-メチル-5-({[1-メチル-5-({[2-(4-モルホリニル)エチル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]-4-[(E)-2-(3-キノリニル)エテニル]-1H-ピロール-2-カルボキシアミド;
- (xi) 1-メチル-N-[1-メチル-5-({[2-(4-モルホリニル)エチル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]-4-[(1-メチル-4-[(E)-2-(2-キノリニル)エテニル]-1H-ピロール-2-イル}カルボニル]アミノ]-1H-ピロール-2-カルボキシアミド;
- (xii) N-[1-メチル-5-({[1-メチル-5-({[2-(4-モルホリニル)エチル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]-2-[(E)-2-(2-キノリニル)エテニル]-1,3-チアゾール-4-カルボキシアミド;
- (xiii) 1-メチル-N-[1-メチル-5-({[2-(4-モルホリニル)エチル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]-4-({4-[(E)-2-(2-ナフチル)エテニル]ベンゾイル}アミノ)-1H-ピロール-2-カルボキシアミド;
- (xiv) 4-[(4-[(E)-2-[2-(1H-1,2,3-ベンゾトリアゾール-1-イルオキシ)-3-キノリニル]エテニル]ベンゾイル)アミノ]-1-メチル-N-[1-メチル-5-({[2-(4-モルホリニル)エチル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]-1H-ピロール-2-カルボキシアミド;
- (xv) 1-メチル-N-[1-メチル-5-({[2-(4-モルホリニル)エチル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]-4-({4-[(E)-2-(2-キノリニル)エテニル]ベンゾイル}アミノ)-1H-ピロ-

ル-2-カルボキシアミド；

(xvi) 5-イソペンチル-2-({[1-メチル-4-({4-[(E)-2-(3-キノリニル)エテニル]ベンゾイル}アミノ)-1H-ピロール-2-イル]カルボニル}アミノ)-N-[2-(4-モルホリニル)エチル]-1,3-チアゾール-4-カルボキシアミド；

(xvii) 2-({[4-({4-[(E)-2-(2-クロロ-3-キノリニル)エテニル]ベンゾイル}アミノ)-1-メチル-1H-ピロール-2-イル]カルボニル}アミノ)-5-イソペンチル-N-[2-(4-モルホリニル)エチル]-1,3-チアゾール-4-カルボキシアミド；

(xviii) 2-[({4-[(4-[(E)-2-[2-(1H-1,2,3-ベンゾトリアゾール-1-イルオキシ)-3-キノリニル]エテニル]ベンゾイル}アミノ]-1-メチル-1H-ピロール-2-イル]カルボニル}アミノ]-5-イソペンチル-N-[2-(4-ルノルホリニル)エチル]-1,3-チアゾール-4-カルボキシアミド；

(xix) 5-イソペンチル-2-({[1-メチル-4-({4-[(E)-2-(2-キノリニル)エテニル]ベンゾイル}アミノ)-1H-ピロール-2-イル]カルボニル}アミノ)-N-[2-(4-モルホリニル)エチル]-1,3-チアゾール-4-カルボキシアミド；

(xx) 5-イソペンチル-2-({[1-メチル-4-({4-[(E)-2-(2-ナフチル)エテニル]ベンゾイル}アミノ)-1H-ピロール-2-イル]カルボニル}アミノ)-N-[2-(4-モルホリニル)エチル]-1,3-チアゾール-4-カルボキシアミド；

(xxi) 5-イソペンチル-2-[({1-メチル-4-[(1-メチル-4-[(E)-2-(4-ニトロフェニル)エテニル]-1H-ピロール-2-イル]カルボニル}アミノ]-1H-ピロール-2-イル]カルボニル}アミノ)-N-[2-(4-モルホリニル)エチル]-1,3-チアゾール-4-カルボキシアミド；

(xxii) 6-[{(E)-2-(4-メトキシフェニル)エテニル]-N-[1-メチル-5-({[1-メチル-5-({[2-(4-モルホリニル)エチル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]ニコチンアミド；

(xxiii) 2-[{(E)-2-(4-メトキシフェニル)エテニル]-N-[1-メチル-5-({[1-メチル-5-({[2-(4-モルホリニル)エチル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]ニコチンアミド；

(xxiv) N-[1-メチル-5-({[1-メチル-5-({[2-(4-モルホリニル)エチル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]-2-[(E)-2-[4-(メチルスルファニル)フェニル]エテニル]-6-キノリンカルボキシアミド；

(xxv) N-[1-メチル-5-({[1-メチル-5-({[2-(4-モルホリニル)エチル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]-6-[(E)-2-[4-(メチルスルファニル)フェニル]エテニル]ニコチンアミド，

またはそれらの薬剤として許容しうる誘導体

である、請求項1から14のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項16】

4-({[4-({4-[(E)-2-(3-メトキシフェニル)エテニル]ベンゾイル}アミノ)-1-メチル-1H-ピロール-2-イル]カルボニル}アミノ)-1-メチル-N-[2-(4-モルホリニル)エチル]-1H-ピロール-2-カルボキシアミドまたはその薬剤として許容しうる塩または溶媒和物である、請求項1から15のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項17】

1-メチル-4-({[1-メチル-4-({4-[(E)-2-(3-キノリニル)エテニル]ベンゾイル}アミノ)-1H-ピロール-2-イル]カルボニル}アミノ)-N-[2-(4-モルホリニル)エチル]-1H-ピロール-2-カルボキシアミドまたはその薬剤として許容しうる塩または溶媒和物である、請求項1から15のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項18】

6-[{(E)-2-(4-メトキシフェニル)エテニル]-N-[1-メチル-5-({[1-メチル-5-({[2-(4-モルホリニル)エチル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]アミノ}カルボニル)-1H-ピロール-3-イル]ニコチンアミドまたはその薬剤として許容しうる塩または溶媒和物である、請求項1から15のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項19】

請求項1から18のいずれか一項に記載の化合物を、薬剤として許容される補助剤、希釈剤または担体と混合された形で含む、薬剤製剤。

【請求項20】

請求項1から18のいずれか一項に記載の化合物を、薬剤として許容される補助剤、希釈剤または担体と混合された形で含む、ガンあるいはウイルス、細菌、真菌または他の微生物感染を治療する際に使用するための薬剤製剤。

【請求項21】

医薬品として使用するための、請求項1から18のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項22】

ガンあるいはウイルス、細菌、真菌または他の微生物感染を治療する際に使用するための、請求項1から18のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項23】

ガンあるいはウイルス、細菌、真菌または他の微生物感染を治療する際に使用するための薬剤を製造するための活性成分としての、請求項1から18のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項24】

ウイルス、細菌、真菌または他の微生物感染の治療において使用するための化合物であって、ウイルス、細菌、真菌または他の微生物病原体が、それぞれDNA複製を阻害することによって作用するのではない1種または複数の抗ウイルス、抗菌、抗真菌または他の抗微生物剤に対して耐性がある、請求項1から18のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項25】

ガンあるいはウイルス、細菌、真菌または他の微生物感染を治療する際に有効であることが知られている1種または複数の他の薬剤と組み合わせて、前記の疾患の治療において使用するための、請求項1から18のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項26】

ウイルス、細菌、真菌または他の微生物感染の治療において使用するための薬剤を製造するための活性成分としての、請求項1から18のいずれか一項に記載の化合物の使用であって、ウイルス、細菌、真菌または他の微生物病原体がそれぞれ、DNA複製を阻害することによって作用するのではない1種または複数の抗ウイルス、抗菌、抗真菌または他の抗微生物剤に対して耐性がある、使用。

【請求項27】

ガンあるいはウイルス、細菌、真菌または他の微生物感染を治療する際に有効であることが知られている1種または複数の他の薬剤と組み合わせて前記の疾患の治療において使用するための薬剤を製造するための活性成分としての、請求項1から18のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項28】

成分：

(A)請求項1から18のいずれか一項に記載の化合物を含む製剤；および
(B)その進展をDNA複製に依存している疾患を治療する際に有効であることが知られている1種または複数の他の化学薬剤を含む製剤
を含む組合せ製品。

【請求項29】

成分(A)および(B)のそれぞれが、薬剤として許容される補助剤、希釈剤または担体と混合された形で処方されている、請求項28に記載の組合せ製品。

【請求項30】

(A)および(B)が、別々の成分として提供されている、請求項28または29に記載の組合せ製品。

【請求項31】

(A)および(B)が、単一の製剤として提供されている、請求項28または29に記載の組合せ製品。

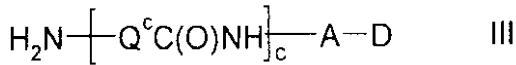
【請求項 3 2】

サンプル中のdsDNAを検出する方法であって、請求項1から18のいずれか一項に記載の化合物を前記サンプルと接触させる工程、前記サンプルと接触している前記化合物の蛍光を、単離した前記化合物の蛍光と比較する工程を含み、蛍光の変化がサンプル中にDNAが存在することを示す方法。

【請求項 3 3】

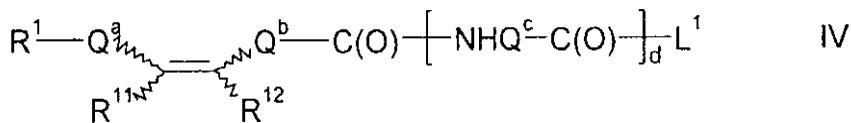
(a) 式III

【化 5】



[前記式中、 Q^c 、 D および A は請求項1で定義されたものであり、 c は以下で定義される]の化合物と、式IV

【化 6】

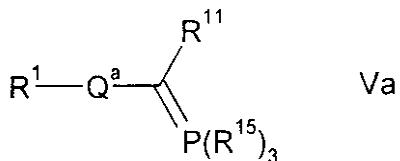


[前記式中、 L^1 は脱離基を表し、 c および d は両方とも0から4の整数を表し、これら c および d の合計は1から4であり、 R^1 、 R^{11} 、 R^{12} および Q^a から Q^c は請求項1で定義されたものである]

の化合物との反応、

(b) 式Va

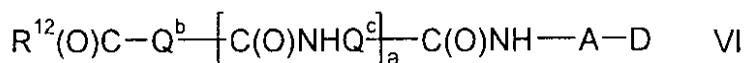
【化 7】



[前記式中、 R^{15} はアリール(この後者の基は、ハロ、シアノ、ニトロ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルおよび $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルコキシから選択される1個または複数の置換基で場合により置換されている)を表し、 R^1 、 R^{11} 、 Q^a およびアリールは請求項1で定義されたものである]

の化合物と、式VI

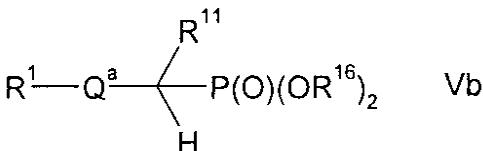
【化 8】



[前記式中、 A 、 a 、 D 、 R^{12} 、 Q^b および Q^c は請求項1で定義されたものである]の化合物の反応、

(c) 式Vb

【化 9】

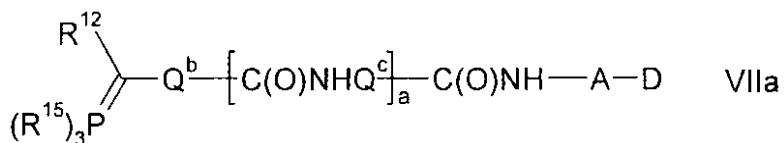


[前記式中、 R^{16} は $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルを表し、 R^1 、 R^{11} および Q^a は、請求項1で定義されたものである]

の化合物と、適切な塩基の反応に続く、上記で定義された式VIの化合物との反応、

(d) 式VIIa

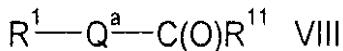
【化 1 0 】



[前記式中、 R^{12} 、 Q^b 、 Q^c 、 a 、 A および D は請求項1で定義されたものであり、 R^{15} は上記で定義されたものである]

の化合物と、式VIII

【化 1 1】

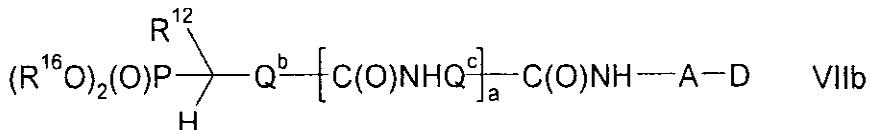


[前記式中、 R^1 、 R^{11} および Q^a は請求項1で定義されたものである]

の化合物との反応；あるいは

(e) 式VI 1b

【化 1 2】



[前記式中、 R^{12} 、 Q^b 、 Q^c 、 a 、 A および D は請求項1で定義されたものであり、 R^{16} は上記(c)で定義されたものである]

の化合物と、適切な塩基の反応に続く、上記で定義された式VIIIの化合物との反応を含む、請求項1に記載の式Iの化合物を調製する方法。