

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成28年12月15日(2016.12.15)

【公表番号】特表2015-535261(P2015-535261A)

【公表日】平成27年12月10日(2015.12.10)

【年通号数】公開・登録公報2015-077

【出願番号】特願2015-539919(P2015-539919)

【国際特許分類】

C 07 H	19/06	(2006.01)
A 61 P	31/18	(2006.01)
A 61 P	31/20	(2006.01)
A 61 P	31/14	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
A 61 P	31/22	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 K	31/7068	(2006.01)
C 07 H	19/10	(2006.01)
A 61 K	45/00	(2006.01)

【F I】

C 07 H	19/06	
A 61 P	31/18	
A 61 P	31/20	
A 61 P	31/14	
A 61 P	43/00	1 2 1
A 61 P	31/22	
A 61 P	35/00	
A 61 K	31/7068	
C 07 H	19/10	
A 61 K	45/00	

【手続補正書】

【提出日】平成28年10月24日(2016.10.24)

【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

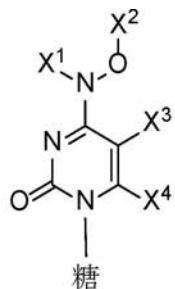
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



## ( I )

の化合物、または薬学上許容可能なその塩若しくはプロドラッグであって、式中、

$X^1$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $COR^1$ 、または $COOR^1$ であり、

$X^2$ は、水素、 $CH_2 - O(CO) - X^5$ 、 $CH_2 - O(CO)O - X^5$ 、 $COR^1$ 、または $COOR^1$ であり、

$R^1$ はそれぞれ、独立して、 $C_1 \sim C_20$ アルキル、脂肪族アルコールから誘導された炭素鎖、或いは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アルコキシ、ジ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)-アミノ、フルオロ、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、または置換ヘテロアリールによって置換された $C_1 \sim C_20$ アルキルであり、

前記置換基は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、或いは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ジ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)-アミノ、フルオロ、または $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキルによって置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

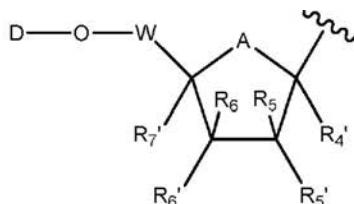
$X^5$ は、独立して、 $C_1 \sim C_20$ アルキル、脂肪族アルコールから誘導された炭素鎖、或いは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、または置換ヘテロアリールによって置換された $C_1 \sim C_20$ アルキルであり、前記置換基は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、或いは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ジ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)-アミノ、フルオロ、または $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキルによって置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

$X^3$ 及び $X^4$ はそれぞれ、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、アリール、アルキルアリール、ハロゲン、 $NH_2$ 、 $OH$ 、 $SH$ 、 $CN$ 、または $NO_2$ であり、場合により、 $R^2$ は $COR^1$ または $COOR^1$ である、前記化合物、または薬学上許容可能なその塩若しくはプロドラッグ。

## 【請求項 2】

糖は、一般式 ( I I )

## 【化 2】



## ( I I )

のリボースまたは改質リボースであり、

式中、

Dは、H、 $C(O)R^1$ 、 $C(O)OR^1$ 、ニリン酸エステル、または三リン酸エステルであり、

$R^1$ は、前述で定義される通りであり、

Wは、 $CL_2$ または $CL_2CL_2$ であり、Lは、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、及び $C_2 \sim C_6$ アルキニルからなる群から選択され、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、及び $C_2 \sim C_6$ アルキニルはそれぞれ、1つ以上のヘテロ原子を任意で含むことができ、

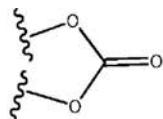
Aは、O、S、 $CH_2$ 、 $CHF$ 、 $CF_2$ 、 $C = CH_2$ 、 $C = CHF$ 、または $C = CF_2$ であり、

$R^{4'}$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^{6'}$ 、 $R^{7'}$ 、及び $R^{8'}$ は、独立して、H、F、Cl、Br、I、 $OH$ 、 $SH$ 、 $NH_2$ 、 $NHOH$ 、 $NHNH_2$ 、 $N_3$ 、 $C(O)OH$ 、 $CN$ 、 $CH_2OH$ 、 $C(O)$

NH<sub>2</sub>、C(S)NH<sub>2</sub>、C(O)OR、R、OR、SR、SSR、NHR、及びNR<sub>2</sub>からなる群から選択され、

R<sup>5'</sup>及びR<sup>6'</sup>は、一体となって環

【化3】



を形成することができ、

AがOまたはCH<sub>2</sub>であり、DがHまたはアシルであり、WがCH<sub>2</sub>であり、R<sup>4'</sup>及びR<sup>7'</sup>がHであるとき、R<sup>5'</sup>、R<sup>6'</sup>、R<sup>6'</sup>は、H、ハロゲン、OH、SH、OCH<sub>3</sub>、SCH<sub>3</sub>、NH<sub>2</sub>、NHC<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>、CH=CH<sub>2</sub>、CN、CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>OH、またはCOOHであることができず、

AがOまたはSであるとき、R<sup>7'</sup>は、OH、SH、NH<sub>2</sub>、NHOH、NHNH<sub>2</sub>、OR、SR、SSR、NHR、またはNR<sub>2</sub>であることができず、

Rは、独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、(C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル)アリール、アルキルアリール、またはアリールアルキルであり、前記基は、請求項1において前述で定義される通りの1つ以上の置換基によって置換可能である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R<sup>6'</sup>は、独立して、NHOH、NHNH<sub>2</sub>、N<sub>3</sub>、C(O)NH<sub>2</sub>、C(S)NH<sub>2</sub>、C(O)OR、R、OR、SR、SSR、NHR、及びNR<sub>2</sub>からなる群から選択され、Rは、独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>～<sub>6</sub>シクロアルキル、(C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル)アリール、アルキルアリール、またはアリールアルキルであり、前記基は、請求項1において前述で定義される通りの1つ以上の置換基によって置換可能である、請求項2に記載の化合物。

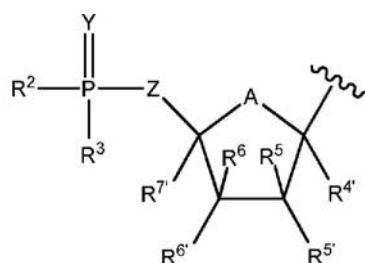
【請求項4】

R<sup>7'</sup>は、独立して、H、F、Cl、Br、I、N<sub>3</sub>、C(O)OH、CN、CH<sub>2</sub>OH、C(O)NH<sub>2</sub>、C(S)NH<sub>2</sub>、C(O)OR、及びRからなる群から選択され、Rは、独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>～<sub>6</sub>シクロアルキル、(C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル)アリール、アルキルアリール、またはアリールアルキルであり、前記基は、請求項1において前述で定義される通りの1つ以上の置換基によって置換可能である、請求項2に記載の化合物。

【請求項5】

糖は、一般式(I III)または(I V)

【化4】



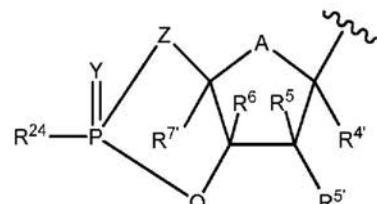
(I III)

のリボースまたは改質リボースであり、

式中、

Yは、OまたはSであり、

Zは、CL<sub>2</sub>、CL<sub>2</sub>CL<sub>2</sub>、CL<sub>2</sub>OCL<sub>2</sub>、CL<sub>2</sub>SCCL<sub>2</sub>、CL<sub>2</sub>O、OCL<sub>2</sub>、及びCL<sub>2</sub>NHCL<sub>2</sub>からなる群から選択され、Lは、独立して、H、F、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～<sub>6</sub>アルケニル、及びC<sub>2</sub>～<sub>6</sub>アルキニルからなる群から選択され、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～



(I V)

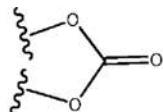
$C_6$ アルケニル、及び $C_2 \sim C_6$ アルキニルはそれぞれ、1つ以上のヘテロ原子を任意で含むことができる。

Aは、O、S、 $CH_2$ 、 $CHF$ 、 $CF_2$ 、 $C=CH_2$ 、 $C=CHF$ 、または $C=CF_2$ であり、

$R^{4'}$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^{6'}$ 、 $R^{6'}$ 、及び $R^{7'}$ は、独立して、H、F、Cl、Br、I、OH、SH、 $NH_2$ 、 $NHOH$ 、 $NHNH_2$ 、 $N_3$ 、 $C(O)OH$ 、CN、 $CH_2OH$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(S)NH_2$ 、 $C(O)OR$ 、R、OR、SR、SSR、NHR、及び $NR_2$ からなる群から選択され、

$R^{5'}$ 及び $R^{6'}$ が、一体となって環

【化5】



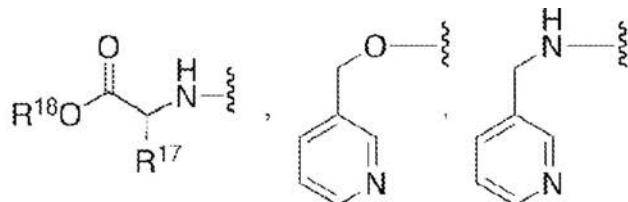
を形成することができ、

式中、AがOまたはSであるとき、 $R^{7'}$ は、OH、SH、 $NH_2$ 、 $NHOH$ 、 $NHNH_2$ 、OR、SR、SSR、NHR、または $NR_2$ であることができず、且つ、

Rは、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、及び $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、アリール、アルキルアリール、またはアリールアルキルであり、前記基は、請求項1において前述で定義される通りの1つ以上の置換基によって置換可能であり、

$R^{24}$ は、 $OR^{15}$ 、

【化6】



、及び脂肪族アルコールからなる群から選択され、

$R^{15}$ は、H、Li、Na、K、フェニル、及びピリジニルからなる群から選択され、フェニル及びピリジニルは、 $(CH_2)_0 \sim C_6CO_2R^{16}$ 及び $(CH_2)_0 \sim C_6CON(R^{16})_2$ からなる群から独立して選択される1～3の置換基によって任意で置換され、

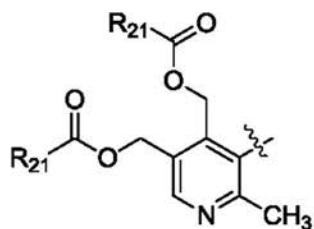
$R^{17}$ は、天然L-アミノ酸において生じる基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、アリール、アルキルアリール、またはアリールアルキルから選択され、前記基は、請求項1において前述で定義される通りの1つ以上の置換基によって置換可能であり、

$R^{18}$ は、H、 $C_1 \sim C_20$ アルキル、脂肪族アルコールから誘導された炭素鎖、或いは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ジ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)-アミノ、フルオロ、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、または置換ヘテロアリールによって置換された $C_1 \sim C_20$ アルキルであり、前記置換基は、 $C_1 \sim C_5$ アルキル、或いは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ジ( $C_1 \sim C_6$ アルキル)-アミノ、フルオロ、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、またはシクロアルキルによって置換された $C_1 \sim C_5$ アルキルであり、

$R^2$ 及び $R^3$ は、以下からなる群から独立して選択される、請求項1に記載の化合物：

(a)  $OR^8$ であって、 $R^8$ は、H、Li、Na、K、 $C_1 \sim C_20$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、または、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $(CH_2)_0 \sim C_6CO_2R^{9a}$ 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、- $N(R^{9a})_2$ 、 $C_1 \sim C_6$ アシルアミノ、- $NHSO_2C_1 \sim C_6$ アルキル、- $SO_2N(R^{9a})_2$ 、- $SO_2C_1 \sim C_6$ アルキル、 $COR^{9b}$ 、ニトロ、シアノからなる群から独立して選択される1～3の置換基によって任意で置換されるアリール、またはヘテロアリール、及び

## 【化7】



であり、

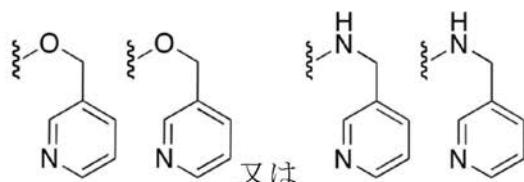
式中、R<sup>21</sup>は、以下に定義される通りであり、

R<sup>9a</sup>は、独立して、H、C<sub>1</sub>～<sub>20</sub>アルキル、脂肪族アルコールから誘導された炭素鎖、或いは、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル)-アミノ、フルオロ、C<sub>3</sub>～<sub>10</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～<sub>10</sub>シクロアルキルアルキル、シクロヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、または置換ヘテロアリールによって置換されたC<sub>1</sub>～<sub>20</sub>アルキルであり、前記置換基は、C<sub>1</sub>～<sub>5</sub>アルキル、或いは、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル)-アミノ、フルオロ、C<sub>3</sub>～<sub>10</sub>シクロアルキル、またはC<sub>3</sub>～<sub>10</sub>シクロアルキルアルキルによって置換されたC<sub>1</sub>～<sub>5</sub>アルキルであり、

R<sup>9b</sup>は、-OR<sup>9a</sup>または-N(R<sup>9a</sup>)<sub>2</sub>である、OR<sup>8</sup>

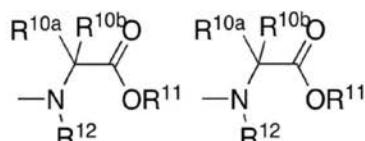
(b)

## 【化8】



(c)

## 【化9】



であって、R<sup>10a</sup>及びR<sup>10b</sup>は、

(i) H、C<sub>1</sub>～<sub>10</sub>アルキル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>9a</sup><sub>2</sub>、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>ヒドロキシアルキル、-CH<sub>2</sub>SH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>S(O)<sub>p</sub>Me、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NH<sub>2</sub>(=NH)NH<sub>2</sub>、(1H-インドール-3-イル)メチル、(1H-イミダゾール-4-イル)メチル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>COR<sup>9b</sup>、アリール、及びアリール-C<sub>1</sub>～<sub>3</sub>アルキルからなる群から独立して選択され、前記アリール基は、ヒドロキシル、C<sub>1</sub>～<sub>10</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルコキシ、ハロゲン、ニトロ、及びシアノからなる群から選択される基によって任意で置換される、

(ii) R<sup>10a</sup>はHであり、且つ、R<sup>10b</sup>とR<sup>12</sup>は一緒に(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>～<sub>4</sub>であり隣接するN原子及びC原子を含む環を形成する、

(iii) R<sup>10a</sup>とR<sup>10b</sup>は一緒に(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>であり環を形成する、

(iv) R<sup>10a</sup>及びR<sup>10b</sup>はともにC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルである、或いは、

(v) R<sup>10a</sup>はHであり、且つ、R<sup>10b</sup>は、H、CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>Ph、CH<sub>2</sub>-インドール-3-イル、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H、CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>-イミダゾール-4-イル、CH<sub>2</sub>OH、CH(OH)CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>(4'-OH)-Ph、CH<sub>2</sub>SH、またはC<sub>3</sub>～<sub>10</sub>シクロアルキルであり、

pは0～2であり、

rは1～6であり、

nは4または5であり、

$m$  は 0 ~ 3 であり、

$R^{11}$  は、 H、  $C_{1 \sim 10}$  アルキル、 或いは、  $C_{1 \sim 6}$  アルキル、  $C_{1 \sim 6}$  アルコキシ、 ジ (  $C_{1 \sim 6}$  アルキル) - アミノ、 フルオロ、  $C_{3 \sim 10}$  シクロアルキル、  $C_{3 \sim 10}$  シクロアルキルアルキル、 シクロヘテロアルキル、 アリール、 ヘテロアリール、 置換アリール、 または置換ヘテロアリールによって置換された  $C_{1 \sim 10}$  アルキルであり、 前記置換基は、  $C_{1 \sim 5}$  アルキル、 或いは、  $C_{1 \sim 6}$  アルキル、  $C_{1 \sim 6}$  アルコキシ、 ジ (  $C_{1 \sim 6}$  アルキル) - アミノ、 フルオロ、  $C_{3 \sim 10}$  シクロアルキル、 または  $C_{3 \sim 10}$  シクロアルキルアルキルによって置換された  $C_{1 \sim 5}$  アルキルであり、

$R^{12}$  は、 H または  $C_{1 \sim 3}$  アルキルであり、 或いは、  $R^{10a}$  または  $R^{10b}$  及び  $R^{12}$  は、 一緒に ( $CH_2$ ) $2 \sim 4$  であり隣接する N 原子及び C 原子を含む環を形成する、

(d) O 連結脂質 (リン脂質を含む)、 N または O 連結ペプチド、 O 連結コレステロール、 または O 連結フィトステロール、

(e)  $R^2$  と  $R^3$  が一体になって環、

【化 10】



形成することができる、式中、  $W^2$  は、  $C_{1 \sim 6}$  アルキル、  $CF_3$ 、  $C_{2 \sim 6}$  アルケニル、  $C_{1 \sim 6}$  アルコキシ、  $OR^{9c}$ 、  $COR^{9a}$ 、  $COR^{9a}$ 、 ハロゲン、  $C_{1 \sim 6}$  ハロアルキル、 -  $N(R^{9a})_2$ 、  $C_{1 \sim 6}$  アシルアミノ、  $COR^{9a}$ 、  $SR^{9a}$ 、 -  $NHSO_2C_{1 \sim 6}$  アルキル、 -  $SO_2N(R^{9a})_2$ 、 -  $SO_2C_{1 \sim 6}$  アルキル、  $COR^{9b}$ 、 及びシアノからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 の置換基によって任意で置換されるフェニルまたは単環式ヘテロアリールからなる群から選択され、

a) 2 つのヘテロ原子があり、一方が O である場合、他方は O または S であることができない、且つ、

b) 2 つのヘテロ原子があり、一方が S である場合、他方は O または S であることができないという条件で、前記単環式ヘテロアリール及び置換された単環式ヘテロアリールは、 N、 O、 及び S からなる群から独立して選択される 1 ~ 2 のヘテロ原子を有し、

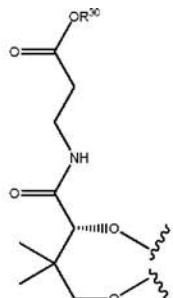
$R^{9a}$  は、 独立して、 H または  $C_{1 \sim 6}$  アルキルであり、

$R^{9b}$  は、 -  $OR^{9a}$  または  $N(R^{9a})_2$  であり、

$R^{9c}$  は、 H または  $C_{1 \sim 6}$  アシルである、

(f)  $R^2$  と  $R^3$  が一体になって環、

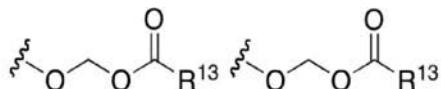
【化 11】



形成することができ、式中、  $R^{30}$  は、 H、  $C_{1 \sim 20}$  アルキル、  $C_{1 \sim 20}$  アルケニル、 脂肪族アルコールから誘導された炭素鎖、 或いは、  $C_{1 \sim 6}$  アルキル、  $C_{1 \sim 6}$  アルコキシ、 ジ (  $C_{1 \sim 6}$  アルキル) - アミノ、 フルオロ、  $C_{3 \sim 10}$  シクロアルキル、  $C_{3 \sim 10}$  シクロアルキルアルキル、 シクロヘテロアルキル、 アリール、 ヘテロアリール、 置換アリール、 または置換ヘテロアリールによって置換された  $C_{1 \sim 20}$  アルキルであり、 前記置換基は、  $C_{1 \sim 5}$  アルキル、 或いは、  $C_{1 \sim 6}$  アルキル、  $C_{1 \sim 6}$  アルコキシ、 ジ (  $C_{1 \sim 6}$  アルキル) - アミノ、 フルオロ、  $C_{3 \sim 10}$  シクロアルキル、 または  $C_{3 \sim 10}$  シクロアルキルアルキルによって置換された  $C_{1 \sim 5}$  アルキルである、

(g)

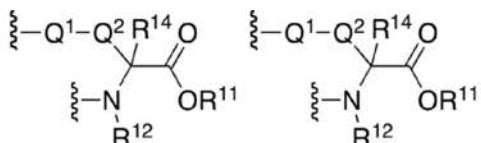
## 【化12】



であって、R<sup>13</sup>は、H、C<sub>1～10</sub>アルキル、またはC<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>1～6</sub>アルコキシ、ジ(C<sub>1～6</sub>アルキル)-アミノ、フルオロ、C<sub>3～10</sub>シクロアルキル、C<sub>3～10</sub>シクロアルキルアルキル、シクロヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、または置換ヘテロアリール部位によって置換されたC<sub>1～10</sub>アルキルからなる群から選択され、前記置換基は、C<sub>1～5</sub>アルキル、或いは、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>1～6</sub>アルコキシ、ジ(C<sub>1～6</sub>アルキル)-アミノ、フルオロ、C<sub>3～10</sub>シクロアルキル、またはC<sub>3～10</sub>シクロアルキルアルキルによって置換されたC<sub>1～5</sub>アルキルである。

(h) R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一体になって環、

## 【化13】



形成することができ、式中、R<sup>14</sup>は、

(i) H、C<sub>1～10</sub>アルキル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sub>2</sub><sup>9a</sup>、C<sub>1～6</sub>ヒドロキシアルキル、-CH<sub>2</sub>SH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>S(O)<sub>p</sub>Me、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>NH<sub>2</sub>(=NH)NH<sub>2</sub>、(1H-インドール-3-イル)メチル、(1H-イミダゾール-4-イル)メチル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>COR<sup>9b</sup>、アリール、アリール-C<sub>1～3</sub>アルキル、ヘテロアリール、及びヘテロアリール-C<sub>1～3</sub>アルキルからなる群から独立して選択され、前記アリール基及びヘテロアリール基は、ヒドロキシル、C<sub>1～10</sub>アルキル、C<sub>1～6</sub>アルコキシ、ハロゲン、ニトロ、及びシアノからなる群から選択される基によって任意で置換され、

(ii) R<sup>14</sup>は、H、CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>Ph、CH<sub>2</sub>-インドール-3-イル、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SC<sub>6</sub>H<sub>5</sub>、CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H、CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>-イミダゾール-4-イル、CH<sub>2</sub>OH、CH(OH)CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph)、CH<sub>2</sub>SH、またはC<sub>3～10</sub>シクロアルキルであり、

pは0～2であり、

rは1～6であり、

mは、0～3であり、

Q<sup>1</sup>は、NR<sup>9a</sup>、O、またはSであり、

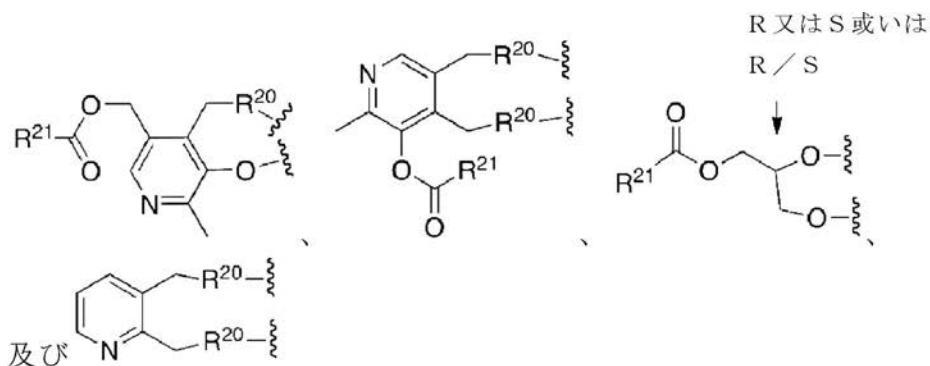
Q<sup>2</sup>は、C<sub>1～10</sub>アルキル、C<sub>1～6</sub>ヒドロキシアルキル、アリール及びアリール-C<sub>1～3</sub>アルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリール-C<sub>1～3</sub>アルキルであり、前記アリール基及びヘテロアリール基は、ヒドロキシル、C<sub>1～10</sub>アルキル、C<sub>1～6</sub>アルコキシ、フルオロ、及びクロロからなる群から選択される基によって任意で置換され、

R<sup>11</sup>は、H、C<sub>1～10</sub>アルキル、またはC<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>1～6</sub>アルコキシ、ジ(C<sub>1～6</sub>アルキル)-アミノ、フルオロ、C<sub>3～10</sub>シクロアルキル、C<sub>3～10</sub>シクロアルキルアルキル、シクロヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、または置換ヘテロアリール部位によって置換されたC<sub>1～10</sub>アルキルであり、前記置換基は、C<sub>1～5</sub>アルキル、或いは、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>1～6</sub>アルコキシ、ジ(C<sub>1～6</sub>アルキル)-アミノ、フルオロ、C<sub>3～10</sub>シクロアルキル、またはC<sub>3～10</sub>シクロアルキルアルキルによって置換されたC<sub>1～5</sub>アルキルであり、

R<sup>12</sup>は、HまたはC<sub>1～3</sub>アルキルであり、或いは、R<sup>14b</sup>及びR<sup>12</sup>は、一緒に(CH<sub>2</sub>)<sub>2～4</sub>であり隣接するN原子及びC原子を含む環を形成する、

(i) R<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>が一体になって、

## 【化14】



からなる群から選択される環を形成することができ、

式中、R<sup>20</sup>は、OまたはNHであり、

R<sup>21</sup>は、H、C<sub>1</sub>~<sub>20</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~<sub>20</sub>アルケニル、脂肪酸から誘導された炭素鎖、並びに、C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル)-アミノ、フルオロ、C<sub>3</sub>~<sub>10</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>~<sub>10</sub>シクロアルキルアルキル、シクロヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、または置換ヘテロアリールによって置換されたC<sub>1</sub>~<sub>20</sub>アルキルからなる群から選択され、前記置換基は、C<sub>1</sub>~<sub>5</sub>アルキル、或いは、C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル)-アミノ、フルオロ、C<sub>3</sub>~<sub>10</sub>シクロアルキル、またはC<sub>3</sub>~<sub>10</sub>シクロアルキルアルキルによって置換されたC<sub>1</sub>~<sub>5</sub>アルキルである、

(j) R<sup>3</sup>が、OH、O<sup>-</sup>K<sup>+</sup>、O<sup>-</sup>L<sup>i+</sup>、またはO<sup>-</sup>Na<sup>+</sup>である場合、R<sup>2</sup>がリン酸エステルまたはニリン酸エステルである。

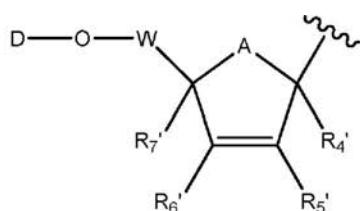
## 【請求項6】

R<sup>7</sup>は、H、F、Cl、Br、I、N<sub>3</sub>、C(O)OH、CN、CH<sub>2</sub>OH、C(O)NH<sub>2</sub>、C(S)NH<sub>2</sub>、C(O)OR、及びRからなる群から独立して選択される、請求項5に記載の化合物。

## 【請求項7】

糖は、一般式(V)

## 【化15】



(V)

のリボースまたは改質リボースであり、

式中、

Dは、H、C(O)R<sup>1</sup>、C(O)OR<sup>1</sup>、ニリン酸エステル、または三リン酸エステルであり、

R<sup>1</sup>は、独立して、C<sub>1</sub>~<sub>20</sub>アルキル、脂肪族アルコールから誘導された炭素鎖、或いは、C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル)-アミノ、フルオロ、C<sub>3</sub>~<sub>10</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>~<sub>10</sub>シクロアルキルアルキル、シクロヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、または置換ヘテロアリールによって置換されたC<sub>1</sub>~<sub>20</sub>アルキルであり、前記置換基は、C<sub>1</sub>~<sub>5</sub>アルキル、或いは、C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル)-アミノ、フルオロ、C<sub>3</sub>~<sub>10</sub>シクロアルキル、またはC<sub>3</sub>~<sub>10</sub>シクロアルキルアルキルによって置換されたC<sub>1</sub>~<sub>5</sub>アルキルであり、

Wは、CL<sub>2</sub>またはCL<sub>2</sub>CL<sub>2</sub>であり、Lは、独立して、H、C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~<sub>6</sub>

アルケニル、及び $C_2 \sim C_6$ アルキニルからなる群から選択され、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、及び $C_2 \sim C_6$ アルキニルはそれぞれ、1つ以上のヘテロ原子を任意で含むことができ、

A、 $R^2$ 、 $R^3$ 、Y、Z、 $R^{4'}$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^{6'}$ 、及び $R^{7'}$ は、請求項1～3に関連して前述で定義される通りであり、

AがOまたはSであるとき、 $R^{7'}$ は、OH、SH、 $NH_2$ 、 $NHOH$ 、 $NHNH_2$ 、OR、SR、SSR、NHR、及び $NR_2$ であることができず、

Rは、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、及び $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、アリール、アルキルアリール、またはアリールアルキルであり、前記基は、請求項1～3に関連して前述で定義される通りの1つ以上の置換基によって置換可能であり、

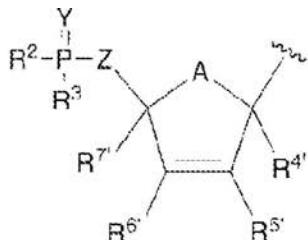
AがOまたは $CH_2$ であり、DがHまたはアシルであり、Wが $CH_2$ であり、 $R^{4'}$ 及び $R^{7'}$ がHであるとき、 $R^{5'}$ 及び $R^{6'}$ は、H、ハロゲン、OH、SH、 $OCH_3$ 、 $SC_3$ 、 $NH_2$ 、 $NHC_3$ 、 $CH_3$ 、 $CH=CH_2$ 、CN、 $CH_2NH_2$ 、 $CH_2OH$ 、または $COOH$ であることができず、場合により、

$R^{5'}$ 及び $R^{6'}$ は、独立して、 $NHOH$ 、 $NHNH_2$ 、 $N_3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(S)N$ 、 $H_2$ 、 $C(O)OR$ 、R、OR、SR、SSR、NHR、及び $NR_2$ からなる群から選択され、あるいは場合により、

AがOまたは $CH_2$ であり、DがHまたはアシルであり、Wが $CH_2$ であり、 $R^{4'}$ 及び $R^{7'}$ がHであるとき、 $R^{5'}$ 及び $R^{6'}$ は、H、ハロゲン、OH、SH、 $OCH_3$ 、 $SC_3$ 、 $NH_2$ 、 $NHC_3$ 、 $CH_3$ 、 $CH=CH_2$ 、CN、 $CH_2NH_2$ 、 $CH_2OH$ 、または $COOH$ であることができず、あるいは

糖は、一般式(VI)

【化16】



(VI)

の改質リボースであり、

式中、

A、 $R^2$ 、 $R^3$ 、Y、Z、 $R^{4'}$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^{6'}$ 、及び $R^{7'}$ は、請求項1～3に関連して前述で定義される通りであり、

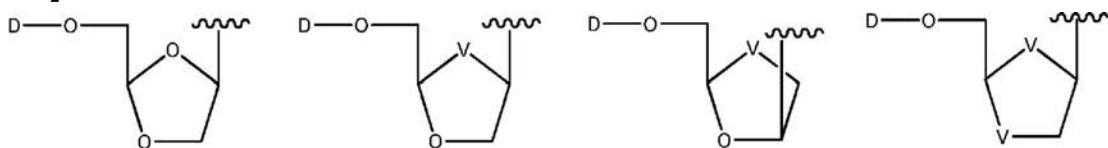
AがOまたはSであるとき、 $R^{7'}$ は、OH、SH、 $NH_2$ 、 $NHOH$ 、 $NHNH_2$ 、OR、SR、SSR、NHR、または $NR_2$ であることができず、

Rは、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、アリール、アルキルアリール、またはアリールアルキルであり、前記基は、請求項1～3に関連して前述で定義される通りの1つ以上の置換基によって置換可能であり、場合により、

$R^{7'}$ は、独立して、H、F、Cl、Br、I、 $N_3$ 、 $C(O)OH$ 、CN、 $CH_2OH$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(S)NH_2$ 、 $C(O)OR$ 、及びRからなる群から選択され、Rは、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、アリール、アルキルアリール、またはアリールアルキルであり、前記基は、式I、II、III、IV、及びIV'に関連して前述で定義される通りの1つ以上の置換基によって置換可能であり、あるいは

糖は、一般式(VII)、(VII')、(IX)、及び(X)

## 【化17】



(VII)

(VII)

(IX)

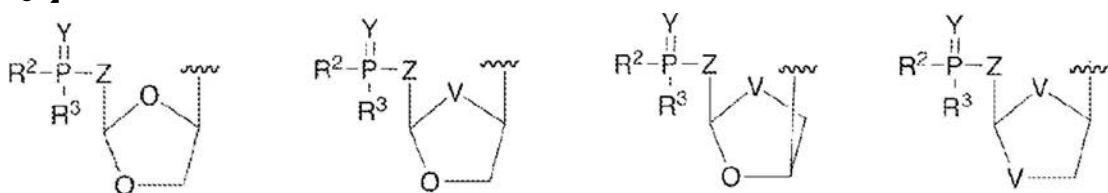
(X)

のジオキソラン、オキサチオラン、またはジチオランであり、

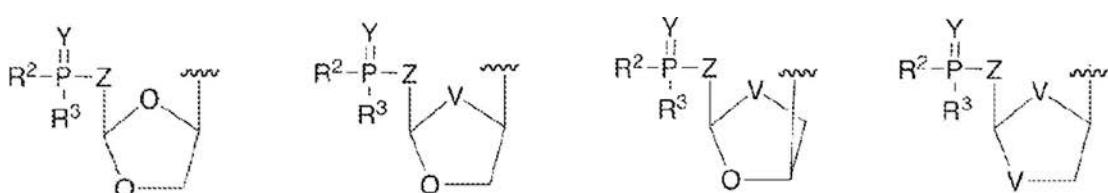
Dは、H、C(O)R<sup>1</sup>、C(O)OR<sup>1</sup>、ニリン酸エステル、または三リン酸エステルであり、Vは、個々に、SまたはSeであり、R<sup>1</sup>は、独立して、C<sub>1</sub>~<sub>20</sub>アルキル、脂肪族アルコールから誘導された炭素鎖、或いはC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)-アミノ、フルオロ、C<sub>3</sub>~<sub>10</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>~<sub>10</sub>シクロアルキルアルキル、シクロヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、または置換ヘテロアリールによって置換されたC<sub>1</sub>~<sub>20</sub>アルキルであり、前記置換基は、C<sub>1</sub>~<sub>5</sub>アルキル、或いは、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)-アミノ、フルオロ、C<sub>3</sub>~<sub>10</sub>シクロアルキル、またはC<sub>3</sub>~<sub>10</sub>シクロアルキルアルキルによって置換されたC<sub>1</sub>~<sub>5</sub>アルキルでありDは、Hまたはアシルであることができず、あるいは

糖は、一般式(XI)、(XII)、(XIII)、及び(XIV)

## 【化18】



## 【化19】



(XI)

(XII)

(XIII)

(XIV)

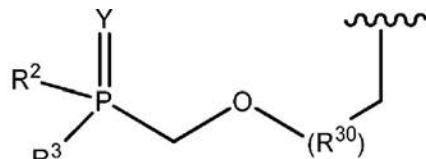
のジオキソラン、オキサチオラン、またはジチオランであり、

式中、

Vは、個々に、SまたはSeであり、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、Y、及びZは、請求項1~3に関して前述で定義される通りであり、あるいは

糖は、一般式(XV)

## 【化20】



(XV)

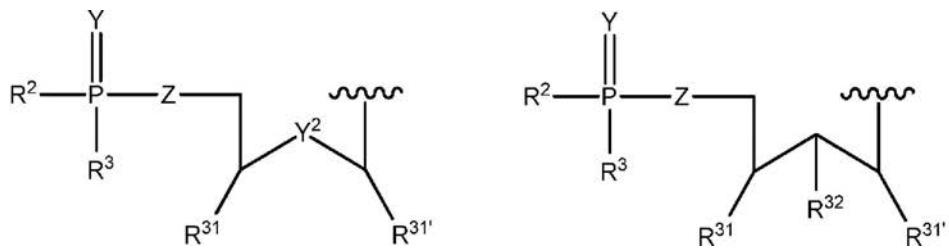
のホスホニルメトキシアルキルであり、

式中、

$R^2$ 、 $R^3$ 、及び $Y$ は、請求項1～3に関して前述で定義される通りであり、且つ、 $R^{30}$ は、 $C_1 \sim C_{20}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{20}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{20}$ アルケニル、及び $C_2 \sim C_{20}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アリールアルキル、及びアルキルアリールからなる群から選択され、あるいは

糖は、一般式(XVII)または(XVIII)

【化21】



(XVII)

(XVIII)

のものであり、

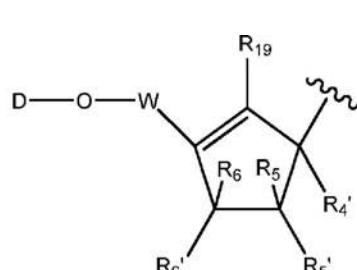
式中、

$R^2$ 、 $R^3$ 、 $Z$ 、及び $Y$ は、請求項1～3において前述で定義される通りであり、 $Y^2$ は、O、S、Se、またはNRであり、 $R$ は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、アリール、アルキルアリール、またはアリールアルキルであり、前記基は、請求項1において前述で定義される通りの1つ以上の置換基によって置換可能であり、

$R^{31}$ 、 $R^{31'}$ 、及び $R^{32}$ は、H、 $CH_3$ 、または $CH_2OR^{33}$ であり、 $R^{33}$ は、Hまたは $C_1 \sim C_6$ アシルであり、あるいは

糖は、一般式(XVIII)

【化22】



(XVIII)

の改質リボースであり、

式中、

$D$ 、 $W$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^{6'}$ 及び $R^{6'}$ は、請求項1～3において前述で定義される通りであり、

$R^{19}$ は、H、F、Cl、Br、I、 $N_3$ 、 $C(O)OH$ 、CN、 $C(O)NH_2$ 、 $C(S)NH_2$ 、 $C(O)OR$ 、またはRであり、

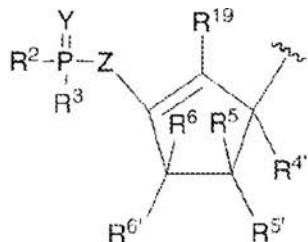
$R$ は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、アリール、アルキルアリール、またはアリールアルキルであり、前記基は、前述で定義される通りの1つ以上の置換基によって置換可能であり、

$D$ がHまたはアシルであり、 $W$ が $CH_2$ であり、 $R^{4'}$ 及び $R^{19}$ がHであるとき、 $R^{5'}$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^{6'}$ 、 $R^{6'}$ は、H、ハロゲン、 $OH$ 、 $SH$ 、 $OCH_3$ 、 $SC_3$ 、 $NH_2$ 、 $NHCH_3$ 、 $CH_3$ 、 $CH=CH_2$ 、CN、 $CH_2NH_2$ 、 $CH_2OH$ 、または $COOH$ ができる場合により、

$R^{6'}$  は、独立して、 $NHOH$ 、 $NHNH_2$ 、 $N_3$ 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(S)NH_2$ 、 $C(O)OR$ 、 $R$ 、 $OR$ 、 $SR$ 、 $SSR$ 、 $NHR$ 、及び $NR_2$ からなる群から選択され、あるいは

糖は、一般式 (XIX)

【化23】



(XIX)

の改質リボースであり、

式中、

$R^2$ 、 $R^3$ 、及び $Y$ は、請求項1～3に関して前述で定義される通りであり、

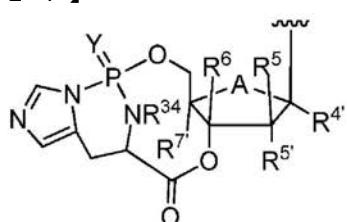
$R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$ 、及び $R^{6'}$ は、請求項1～3において前述で定義される通りであり、

$R^{19}$ は、 $H$ 、 $F$ 、 $C_1$ ～ $C_6$ アルキル、 $C_2$ ～ $C_6$ アルケニル、 $C_2$ ～ $C_6$ アルキニル、 $C_3$ ～ $C_6$ シクロアルキル、アリール、アルキルアリール、またはアリールアルキルであり、前記基は、請求項1～3に関連して前述で定義される通りの1つ以上の置換基によって任意で置換可能であり、あるいは

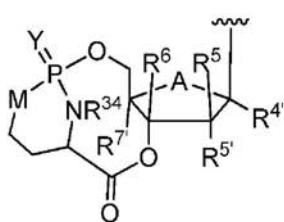
$R$ は、独立して、 $C_1$ ～ $C_6$ アルキル、 $C_2$ ～ $C_6$ アルケニル、 $C_2$ ～ $C_6$ アルキニル、 $C_3$ ～ $C_6$ シクロアルキル、アリール、アルキルアリール、またはアリールアルキルであり、前記基は、請求項1～3に関連して前述で定義される通りの1つ以上の置換基によって任意で置換可能であり、あるいは

糖は、式 (XX)、(XXI)、または(XXII)

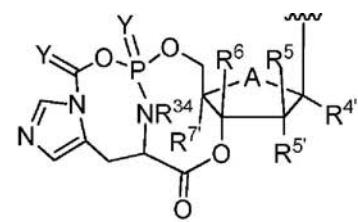
【化24】



(XX)



(XXI)



(XXII)

の1つを有し、

式中、

$R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$ 、 $Y$ 、 $A$ 、及び $R^{7'}$ は、請求項1～3に関して前述で定義される通りであり、

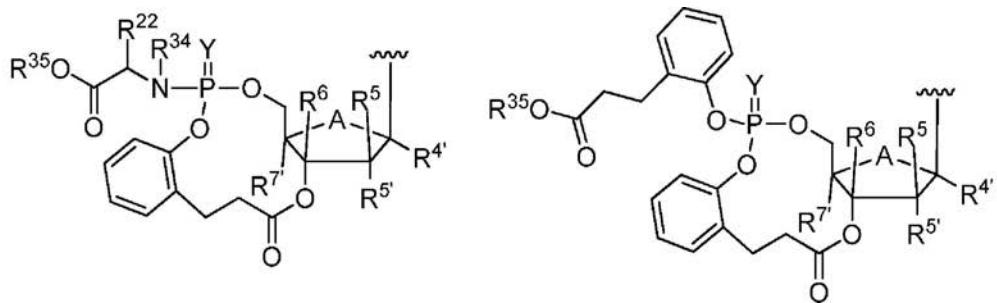
$R^{34}$ は、 $C_1$ ～ $C_6$ アルキルであり、

$M$ は、 $O$ 、 $S$ 、または $NR$ であり、

$R$ は、独立して、 $C_1$ ～ $C_6$ アルキル、 $C_2$ ～ $C_6$ アルケニル、 $C_2$ ～ $C_6$ アルキニル、 $C_3$ ～ $C_6$ シクロアルキル、アリール、アルキルアリール、またはアリールアルキルであり、前記基は、請求項1～3に関連して前述で定義される通りの1つ以上の置換基によって置換可能であり、あるいは

糖は、式 (XXII) または (XXIV)

## 【化25】



(XXII)

(XXIV)

の1つを有し、

式中、

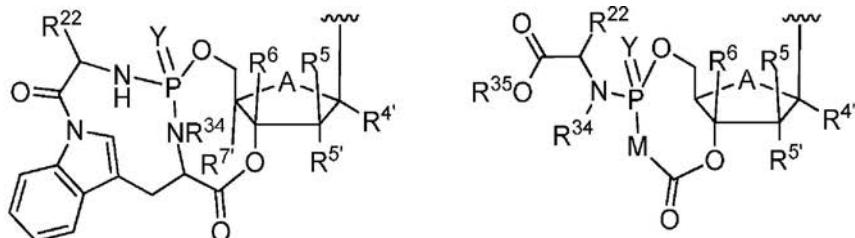
R<sup>4'</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>5'</sup>、R<sup>6</sup>、Y、A、R<sup>7'</sup>、R<sup>34</sup>は、請求項1～3に関して前述で定義される通りであり、

R<sup>35</sup>は、H、C<sub>1</sub>～<sub>10</sub>アルキル、またはC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル)-アミノ、フルオロ、C<sub>3</sub>～<sub>10</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～<sub>10</sub>シクロアルキルアルキル、シクロヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、または置換ヘテロアリール部位によって置換されたC<sub>1</sub>～<sub>10</sub>アルキルであり、前記置換基は、C<sub>1</sub>～<sub>5</sub>アルキル、或いは、C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルコキシ、ジ(C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル)-アミノ、フルオロ、C<sub>3</sub>～<sub>10</sub>シクロアルキル、またはC<sub>3</sub>～<sub>10</sub>シクロアルキルアルキルによって置換されたC<sub>1</sub>～<sub>5</sub>アルキルであり、

R<sup>22</sup>は、H、CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>Ph、CH<sub>2</sub>-インドール-3-イル、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H、CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O)NH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHC(NH)NH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>-イミダゾール-4-イル、CH<sub>2</sub>OH、CH(OH)CH<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>((4'-OH)-Ph)、CH<sub>2</sub>SH、またはC<sub>3</sub>～<sub>6</sub>シクロアルキルであり、あるいは

糖は、式(XXV)または(XXVI)

## 【化26】



(XXV)

(XXVI)

の1つを有し、

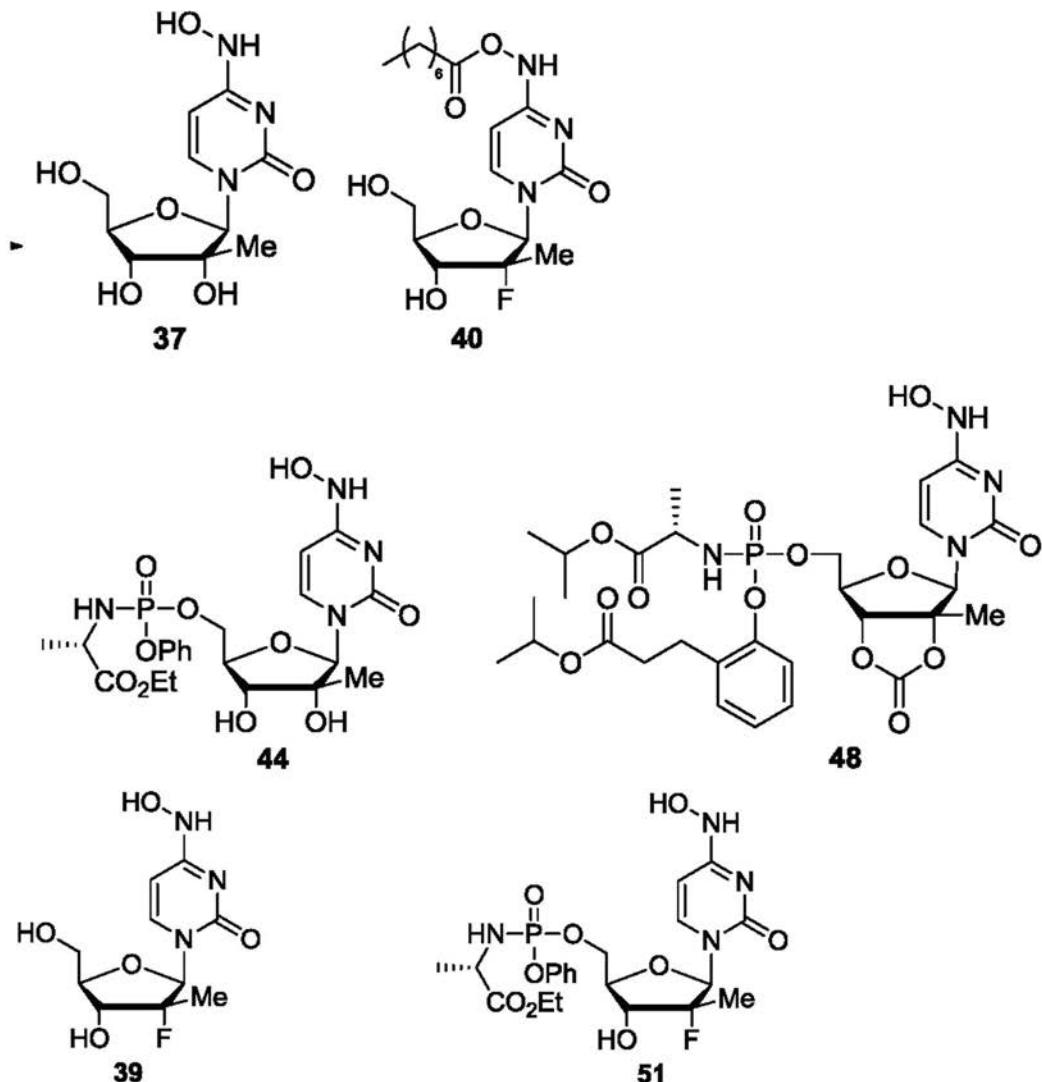
式中、

R<sup>4'</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>5'</sup>、R<sup>6</sup>、Y、M、R<sup>7'</sup>、R<sup>34</sup>、R<sup>35</sup>、R<sup>22</sup>は、請求項1～3に関して前述で定義される通りである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項8】

以下の式

【化 2 7】

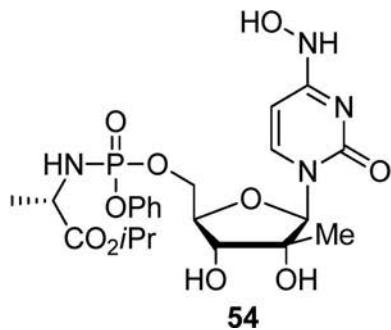


の1つからなる化合物、または薬学上許容可能なその塩。

### 【請求項 9】

### 以下の式

【化 2 8】



の化合物、または薬学上許容可能なその塩。

## 【請求項 10】

HIV-1またはHIV-2に感染した宿主を治療すること、HIV-1またはHIV-2感染を予防すること、或いは、宿主におけるHIV-1またはHIV-2感染の生物活性を低減させることに用いる薬剤の調製における請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物の使用であって、場合により、前記薬剤は、別の抗HIV剤を更に含む、使用。

## 【請求項 1 1】

H B V に感染した宿主を治療すること、H B V 感染を予防すること、或いは、宿主に

ける H B V 感染の生物活性を低減させることに用いる薬剤の調製における請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物の使用であって、場合により、前記薬剤は、別の抗 H B V 剤を更に含む、使用。

【請求項 1 2】

フラビウイルス、ノロウイルス、またはサポロウイルスに感染した宿主を治療すること、フラビウイルス、ノロウイルス、またはサポロウイルス感染を予防すること、或いは、宿主におけるフラビウイルス、ノロウイルス、またはサポロウイルス感染の生物活性を低減させることに用いる薬剤の調製における請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物の使用であって、場合により、前記薬剤は、別の抗フラビウイルス剤、抗ノロウイルス剤、または抗サポロウイルス剤を更に含む、使用。

【請求項 1 3】

H S V - 1 または H S V - 2 に感染した宿主を治療すること、H S V - 1 または H S V - 2 感染を予防すること、或いは、宿主における H S V - 1 または H S V - 2 感染の生物活性を低減させることに用いる薬剤の調製における請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物の使用であって、場合により、前記薬剤は、別の抗 H S V - 1 剤または抗 H S V - 2 剤を更に含む、使用。

【請求項 1 4】

癌の治療に用いる薬剤の調製における、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物の使用であって、場合により、前記薬剤は、別の抗癌剤を更に含む、使用。

【請求項 1 5】

前記 X<sup>2</sup> は、 C H<sub>2</sub> - O ( C O ) O - X<sup>5</sup> である、請求項 1 に記載の化合物。