

【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 0 7 H 19/06 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 31/20 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/22 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/7068 (2006.01)

C 0 7 H 19/10 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 H 19/06

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 31/20

A 6 1 P 31/14

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 P 31/22

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 31/7068

C 0 7 H 19/10

A 6 1 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

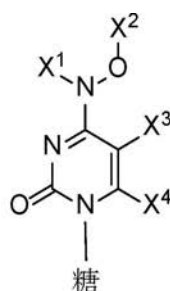
【補正の内容】

【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、 $C_1 \sim 20$ 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、 $C_3 \sim 10$ 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 $C_1 \sim 20$ アルキルであり、

前記置換基は、 $C_1 \sim 6$ 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 $C_3 \sim 10$ シクロアルキルによって置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり、

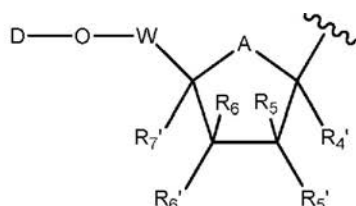
X^5 は、独立して、 $C_1 \sim 20$ アルキル、脂肪族アルコールから誘導された炭素鎖、或いは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アルコキシ、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、または置換ヘテロアリールによって置換された $C_1 \sim 20$ アルキルであり、前記置換基は、 $C_1 \sim 6$ アルキル、或いは、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ジ($C_1 \sim C_6$ アルキル) - アミノ、フルオロ、または $C_3 \sim 10$ シクロアルキルによって置換された $C_1 \sim 6$ アルキルであり、

X^3 及び X^4 はそれぞれ、独立して、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ 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、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、及び $C_2 \sim 6$ アルキニルからなる群から選択され、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、及び $C_2 \sim 6$ 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、

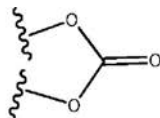
Aは、O、S、 CH_2 、 CHF 、 CF_2 、 $C=CH_2$ 、 $C=CHF$ 、または $C=CF_2$ であり、

$R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 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 、 $\text{C}(\text{S})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}$ 、 R 、 OR 、 SR 、 SSR 、 NHR 、及び NR_2 からなる群から選択され、

$\text{R}^{5'}$ 及び $\text{R}^{6'}$ 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_2 であり、D が H またはアシルであり、W が CH_2 であり、 $\text{R}^{4'}$ 及び $\text{R}^{7'}$ が H であるとき、 R^5 、 $\text{R}^{5'}$ 、 R^6 、 $\text{R}^{6'}$ は、H、ハロゲン、OH、SH、 OCH_3 、 SCH_3 、 NH_2 、 NHCH_3 、 CH_3 、 $\text{CH}=\text{CH}_2$ 、CN、 CH_2NH_2 、 CH_2OH 、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、 $\text{R}^{7'}$ 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、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim 6$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ シクロアルキル、($\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ 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る、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

$\text{R}^{6'}$ は、独立して、 NHOH 、 NHNH_2 、 N_3 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{S})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}$ 、 R 、 OR 、 SR 、 SSR 、 NHR 、及び NR_2 からなる群から選択され、R は、独立して、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim 6$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim 6$ アルキニル、 $\text{C}_3 \sim 6$ シクロアルキル、($\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ 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る、請求項 2 に記載の化合物。

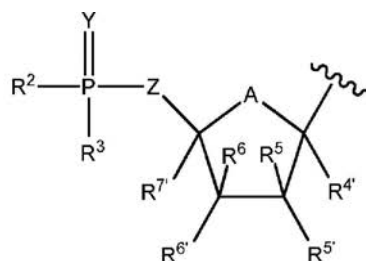
【請求項 4】

$\text{R}^{7'}$ は、独立して、H、F、Cl、Br、I、 N_3 、 $\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、CN、 CH_2OH 、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{S})\text{NH}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}$ 、及び R からなる群から選択され、R は、独立して、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim 6$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim 6$ アルキニル、 $\text{C}_3 \sim 6$ シクロアルキル、($\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ 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る、請求項 2 に記載の化合物。

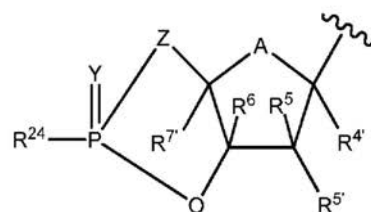
【請求項 5】

糖は、一般式 (III) または (IV)

【化 4】



(III)



(IV)

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_2 、 CL_2CL_2 、 CL_2OCL_2 、 CL_2SCL_2 、 CL_2O 、 OCL_2 、及び L_2NHCCL_2 からなる群から選択され、L は、独立して、H、F、 $\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim 6$ アルケニル、及び $\text{C}_2 \sim 6$ アルキニルからなる群から選択され、 $\text{C}_1 \sim 6$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim$

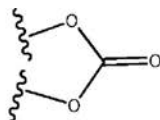
$_6$ アルケニル、及び $C_2 \sim _6$ アルキニルはそれぞれ、1つ以上のヘテロ原子を任意で含むことができ、

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 、 $R^{5'}$ 、 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】



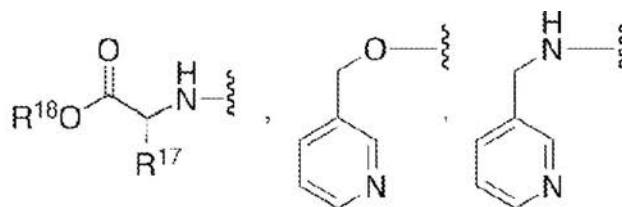
を形成することができ、

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、 $C_1 \sim _6$ アルキル、 $C_2 \sim _6$ アルケニル、及び $C_2 \sim _6$ アルキニル、 $C_3 \sim _6$ 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、OR¹⁵、

【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、 $(CH_2)_0 \sim _6 CO_2 R^{16}$ 及び $(CH_2)_0 \sim _6 CON(R^{16})_2$ 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、

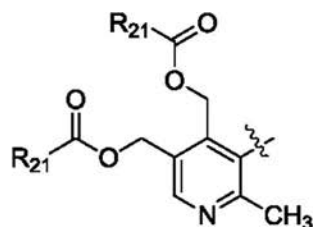
R^{17} は、天然L-アミノ酸において生じる基、 $C_1 \sim _6$ アルキル、 $C_2 \sim _6$ アルケニル、 $C_2 \sim _6$ アルキニル、 $C_3 \sim _6$ シクロアルキル、アリール、アルキルアリール、またはアリールアルキルから選択され、前記基は、請求項1において前述で定義される通りの1つ以上の置換基によって置換可能であり、

R^{18} は、H、 $C_1 \sim _{20}$ 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、 $C_1 \sim _6$ 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、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、またはシクロ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^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) OR⁸であって、 R^8 は、H、Li、Na、K、 $C_1 \sim _{20}$ アルキル、 $C_3 \sim _6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim _6$ ハロアルキル、または、 $C_1 \sim _6$ アルキル、 $C_2 \sim _6$ アルケニル、 $C_2 \sim _6$ アルキニル、 $C_1 \sim _6$ アルコキシ、 $(CH_2)_0 \sim _6 CO_2 R^{9a}$ 、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、 $-NH SO_2 C_1 \sim _6$ アルキル、 $-SO_2 N(R^{9a})_2$ 、 $-SO_2 C_1 \sim _6$ 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、

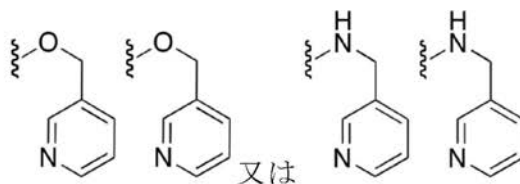
式中、 R^{21} は、以下に定義される通りであり、

R^{9a} は、独立して、H、 $C_1 \sim 20$ 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、 $C_1 \sim 6$ 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
 ~ 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^{9b} は、 $-OR^{9a}$ または $-N(R^{9a})_2$ である、 OR^8

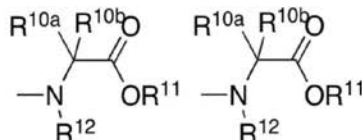
(b)

【化 8】



(c)

【化 9】



であって、 R^{10a} 及び R^{10b} は、

(i) H、 $C_1 \sim 10$ アルキル、 $-(CH_2)_rNR^{9a}_2$ 、 $C_1 \sim 6$ ヒドロキシアルキル、 $-CH_2SH$ 、 $-(CH_2)_2S(O)_pMe$ 、 $-(CH_2)_3NHC(=NH)NH_2$ 、(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、 $-(CH_2)_mCOR^{9b}$ 、アリール、及びアリール - $C_1 \sim 3$ 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、 $C_1 \sim 10$ アルキル、 $C_1 \sim 6$ 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^{10a} はHであり、且つ、 R^{10b} と 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、

(iii) R^{10a} と R^{10b} は一緒に $(CH_2)_n$ であり環を形成する、

(iv) R^{10a} 及び R^{10b} はともに $C_1 \sim 6$ アルキルである、或いは、

(v) R^{10a} はHであり、且つ、 R^{10b} は、H、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 $CH(CH_3)_2$ 、 $CH_2CH(CH_3)_2$ 、 $CH(CH_3)CH_2CH_3$ 、 CH_2Ph 、 CH_2 - インドール - 3 - イル、 $-CH_2CH_2SCH_3$ 、 CH_2CO_2H 、 $CH_2C(O)NH_2$ 、 CH_2CH_2COOH 、 $CH_2CH_2C(O)NH_2$ 、 $CH_2CH_2CH_2CH_2NH_2$ - $CH_2CH_2CH_2NHC(NH)NH_2$ 、 CH_2 - イミダゾール - 4 - イル、 CH_2OH 、 $CH(OH)CH_3$ 、 $CH_2((4' - OH) - Ph)$ 、 CH_2SH 、または $C_3 \sim 10$ 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、

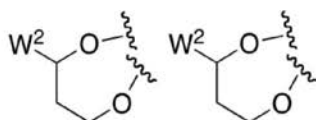
R^{11} は、H、 $C_1 \sim_{10}$ アルキル、或いは、 $C_1 \sim_6$ アルキル、 $C_1 \sim_6$ アルコキシ、ジ($C_1 \sim_6$ アルキル) - アミノ、フルオロ、 $C_3 \sim_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim_{10}$ シクロアルキルアルキル、シクロヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、または置換ヘテロアリールによって置換された $C_1 \sim_{10}$ アルキルであり、前記置換基は、 $C_1 \sim_5$ アルキル、或いは、 $C_1 \sim_6$ アルキル、 $C_1 \sim_6$ 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} 、 CO_2R^{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、 $CO_2N(R^{9a})_2$ 、 SR^{9a} 、 $-NH SO_2 C_1 \sim_6$ アルキル、 $-SO_2 N(R^{9a})_2$ 、 $-SO_2 C_1 \sim_6$ 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、

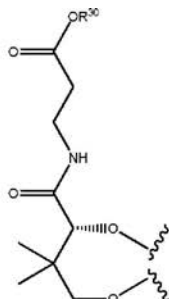
R^{9a} は、独立して、H または $C_1 \sim_6$ アルキルであり、

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)

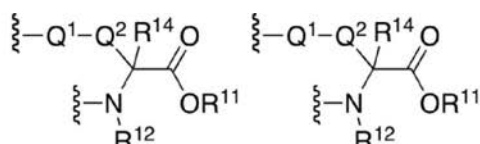
【化 1 2】



であって、 R^{13} は、 H 、 $C_1 \sim_{10}$ アルキル、または $C_1 \sim_6$ 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部位によって置換された $C_1 \sim_{10}$ アルキルからなる群から選択され、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、

(h) R^2 と R^3 が一体になって環、

【化 1 3】



形成することができ、式中、 R^{14} は、

(i) H、 $C_1 \sim_{10}$ アルキル、 $-(CH_2)_rNR_2^{9a}$ 、 $C_1 \sim_6$ ヒドロキシアルキル、 $-CH_2SH$ 、 $-(CH_2)_2S(O)_pMe$ 、 $-(CH_2)_3NHC(=NH)NH_2$ 、(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、 $-(CH_2)_mCOR^{9b}$ 、アリール、アリール- $C_1 \sim_3$ アルキル、ヘテロアリール、及びヘテロアリール- $C_1 \sim_3$ 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、 $C_1 \sim_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim_6$ 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、

(i i) R¹⁴は、H、CH₃、CH₂CH₃、CH(CH₃)₂、CH₂CH(CH₃)₂、CH(CH₃)CH₂CH₃、CH₂Ph、CH₂-インドール-3-イル、-CH₂CH₂SCCH₃、CH₂CO₂H、CH₂C(O)NH₂、CH₂CH₂COOH、CH₂CH₂C(O)NH₂、CH₂CH₂CH₂CH₂NH₂、CH₂CH₂CH₂NHC(NH)NH₂、CH₂-イミダゾール-4-イル、CH₂OH、CH(OH)CH₃、CH₂((4'-OH)-Ph)、CH₂SH、またはC₃~₁₀シクロアルキルであり、

p は $0 \sim 2$ であり、

r は $1 \sim 6$ であり、

m は、 $0 \sim 3$ であり、

Q¹は、NR^{9a}、O、またはSであり、

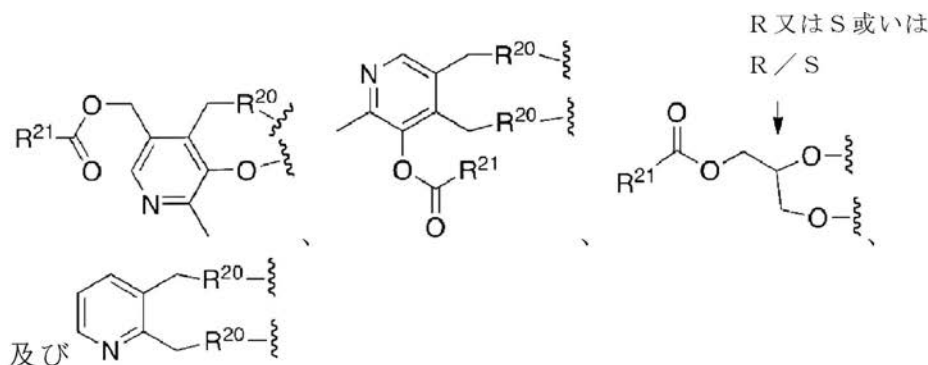
Q²は、C₁～₁₀アルキル、C₁～₆ヒドロキシアルキル、アリール及びアリール-C₁～₃アルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリール-C₁～₃アルキルであり、前記アリール基及びヘテロアリール基は、ヒドロキシル、C₁～₁₀アルキル、C₁～₆アルコキシ、フルオロ、及びクロロからなる群から選択される基によって任意で置換され、

R¹¹は、H、C₁~₁₀アルキル、またはC₁~₆アルキル、C₁~₆アルコキシ、ジ(C₁~₆アルキル)-アミノ、フルオロ、C₃~₁₀シクロアルキル、C₃~₁₀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部位によって置換されたC₁~₁₀アルキルであり、前記置換基は、C₁~₅アルキル、或いは、C₁~₆アルキル、C₁~₆アルコキシ、ジ(C₁~₆アルキル)-アミノ、フルオロ、C₃~₁₀シクロアルキル、またはC₃~₁₀シクロアルキルアルキルによって置換されたC₁~₅アルキルであり、

R¹²は、HまたはC₁~₃アルキルであり、或いは、R^{14b}及びR¹²は、一緒に(C₂H₅)₂~₄であり隣接するN原子及びC原子を含む環を形成する、

(i) R^2 と R^3 が一体になって、

【化 1 4】



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^{20} は、OまたはNHであり、

R^{21} は、H、 $C_1 \sim 20$ アルキル、 $C_1 \sim 20$ アルケニル、脂肪酸から誘導された炭素鎖、並びに、 $C_1 \sim 6$ 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 $C_1 \sim 20$ アルキルからなる群から選択され、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、

(j) R^3 が、OH、 O^-K^+ 、 O^-Li^+ 、または O^-Na^+ である場合、 R^2 が一リン酸エステルまたは二リン酸エステルである。

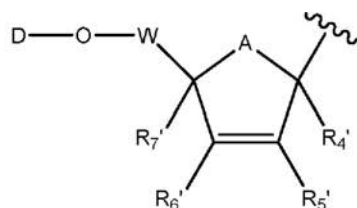
【請求項 6】

$R^{7'}$ は、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 1 5】



(V)

のリボースまたは改質リボースであり、

式中、

Dは、H、 $C(O)R^1$ 、 $C(O)OR^1$ 、二リン酸エステル、または三リン酸エステルであり、

R^1 は、独立して、 $C_1 \sim 20$ 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、 $C_1 \sim 6$ 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 $C_1 \sim 5$ アルキルであり、

Wは、 CL_2 または CL_2CL_2 であり、Lは、独立して、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$

アルケニル、及び $C_2 \sim 6$ アルキニルからなる群から選択され、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、及び $C_2 \sim 6$ 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、 $C_2 \sim 6$ 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、

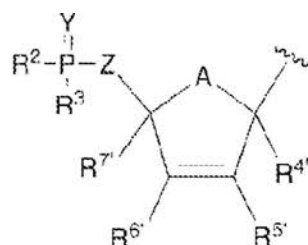
A が O または CH_2 であり、 D が H またはアシルであり、 W が CH_2 であり、 $R^{4'}$ 及び $R^{7'}$ が H であるとき、 $R^{5'}$ 及び $R^{6'}$ は、 H 、ハロゲン、 OH 、 SH 、 OCH_3 、 SCH_3 、 NH_2 、 $NHCH_3$ 、 CH_3 、 $CH=CH_2$ 、 CN 、 CH_2NH_2 、 CH_2OH 、または $COOH$ であることができず、場合により、

$R^{5'}$ 及び $R^{6'}$ は、独立して、 $NHOH$ 、 $NHNH_2$ 、 N_3 、 $C(O)NH_2$ 、 $C(S)NH_2$ 、 $C(O)OR$ 、 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 、 SCH_3 、 NH_2 、 $NHCH_3$ 、 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、

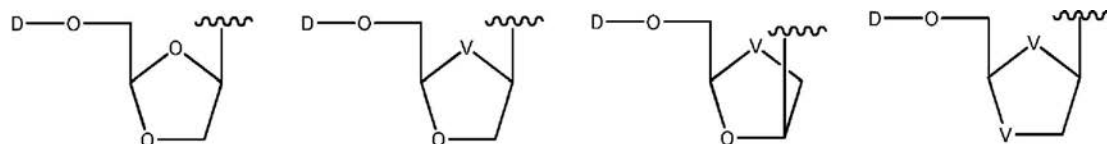
A が O または S であるとき、 $R^{7'}$ は、 OH 、 SH 、 NH_2 、 $NHOH$ 、 $NHNH_2$ 、 OR 、 SR 、 SSR 、 NHR 、または NR_2 であることができず、

R は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ 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任意で置換可能であり、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、 $C_2 \sim 6$ 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、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)、(VIII)、(IX)、及び (X)

【化 17】



(VII)

(VIII)

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

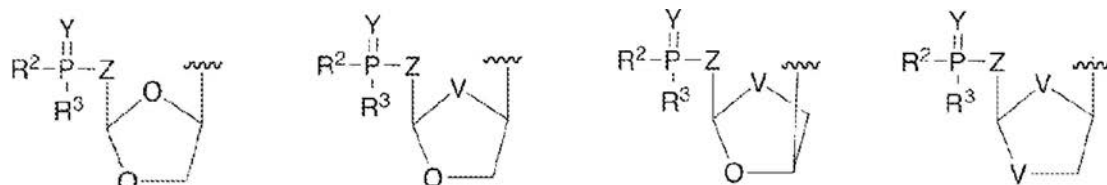
V は、個々に、S または Se であり、

R^1 は、独立して、 $C_1 \sim 20$ 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、 $C_3 \sim 10$ 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、 $C_1 \sim C_6$ 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、 $C_3 \sim 10$ 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、

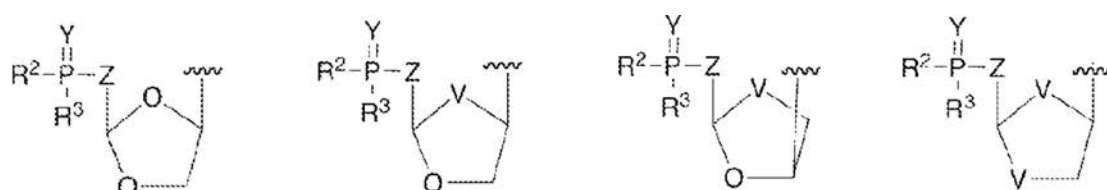
D は、H またはアシルであることができず、あるいは

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、

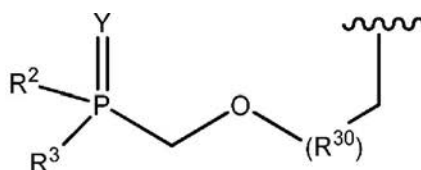
式中、

V は、個々に、S または Se であり、

R^2 、 R^3 、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、

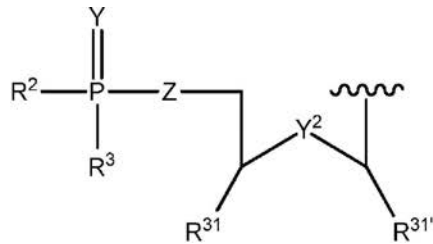
式中、

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、

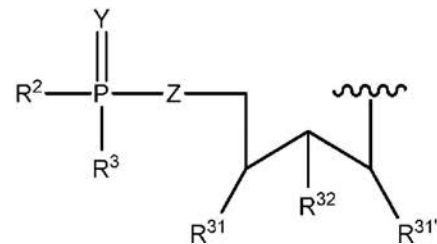
R^{30} は、 $C_1 \sim 20$ アルキル、 $C_2 \sim 20$ アルキル、 $C_2 \sim 20$ アルケニル、及び $C_2 \sim 20$ アルキニル、 $C_3 \sim 10$ シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アリールアルキル、及びアルキルアリールからなる群から選択され、あるいは

糖は、一般式 (XVI) または (XVII)

【化 2 1】



(XVI)



(XVII)

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、

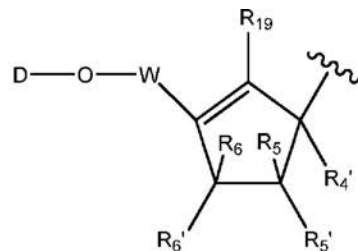
R は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、アリール、アルキルアリール、またはアリールアルキルであり、前記基は、請求項 1 において前述で定義される通りの 1 つ以上の置換基によって置換可能であり、

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 2 2】



(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、

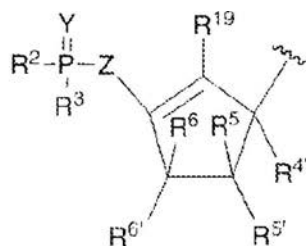
R は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、アリール、アルキルアリール、またはアリールアルキルであり、前記基は、前述で定義される通りの 1 つ以上の置換基によって置換可能であり、

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 、 SCH_3 、 NH_2 、 $NHCH_3$ 、 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、

$R^{6'}$ 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、

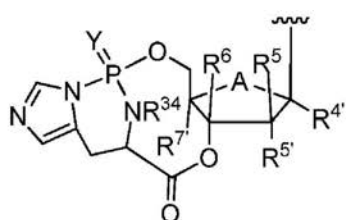
$R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 、及び $R^{6'}$ は、請求項 1 ~ 3 において前述で定義される通りであり、

R^{19} は、 H 、 F 、 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、且つ、

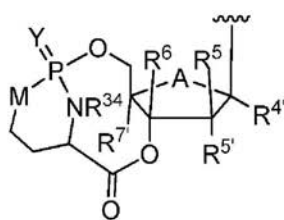
R は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、アリール、アルキルアリール、またはアリールアルキルであり、前記基は、請求項 1 ~ 3 に関連して前述で定義される通りの 1 つ以上の置換基によって任意で置換可能であり、あるいは

糖は、式 (XX)、(XXI)、または (XXII)

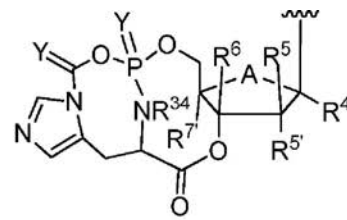
【化 24】



(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、

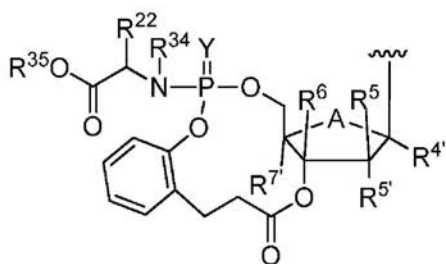
R^{34} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

M は、 O 、 S 、または NR であり、

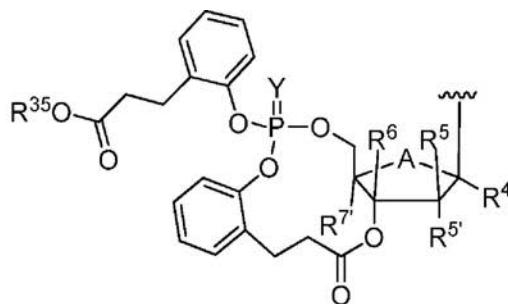
R は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、アリール、アルキルアリール、またはアリールアルキルであり、前記基は、請求項 1 ~ 3 に関連して前述で定義される通りの 1 つ以上の置換基によって置換可能であり、あるいは

糖は、式 (XXIII) または (XXIV)

【化 2 5】



(XXIII)



(XXIV)

の 1 つを有し、

式中、

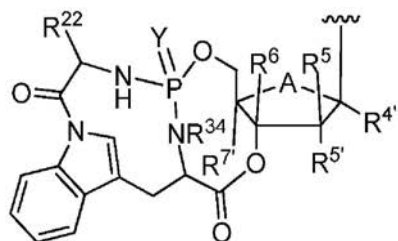
$R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 、 Y 、 A 、 $R^{7'}$ 、 R^{34} は、請求項 1～3 に関して前述で定義される通りであり、

R^{35} は、 H 、 $C_1 \sim_{10}$ アルキル、または $C_1 \sim_6$ 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部位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、

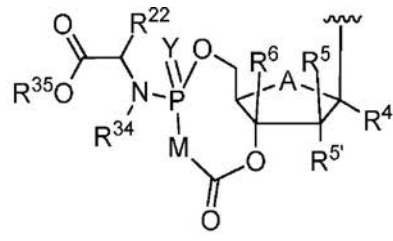
R^{22} は、 H 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 $CH(CH_3)_2$ 、 $CH_2CH(CH_3)_2$ 、 $CH(CH_3)CH_2CH_3$ 、 CH_2Ph 、 CH_2 -インドール-3-イル、 $-CH_2CH_2SCH_3$ 、 CH_2CO_2H 、 $CH_2C(O)NH_2$ 、 CH_2CH_2COOH 、 $CH_2CH_2C(O)NH_2$ 、 $CH_2CH_2CH_2NH_2$ 、 $CH_2CH_2CH_2NHC(NH)NH_2$ 、 CH_2 -イミダゾール-4-イル、 CH_2OH 、 $CH(OH)CH_3$ 、 $CH_2((4'-OH)-Ph)$ 、 CH_2SH 、または $C_3 \sim_6$ シクロアルキルであり、あるいは

糖は、式 (XXV) または (XXVI)

【化 2 6】



(XXV)



(XXVI)

の 1 つを有し、

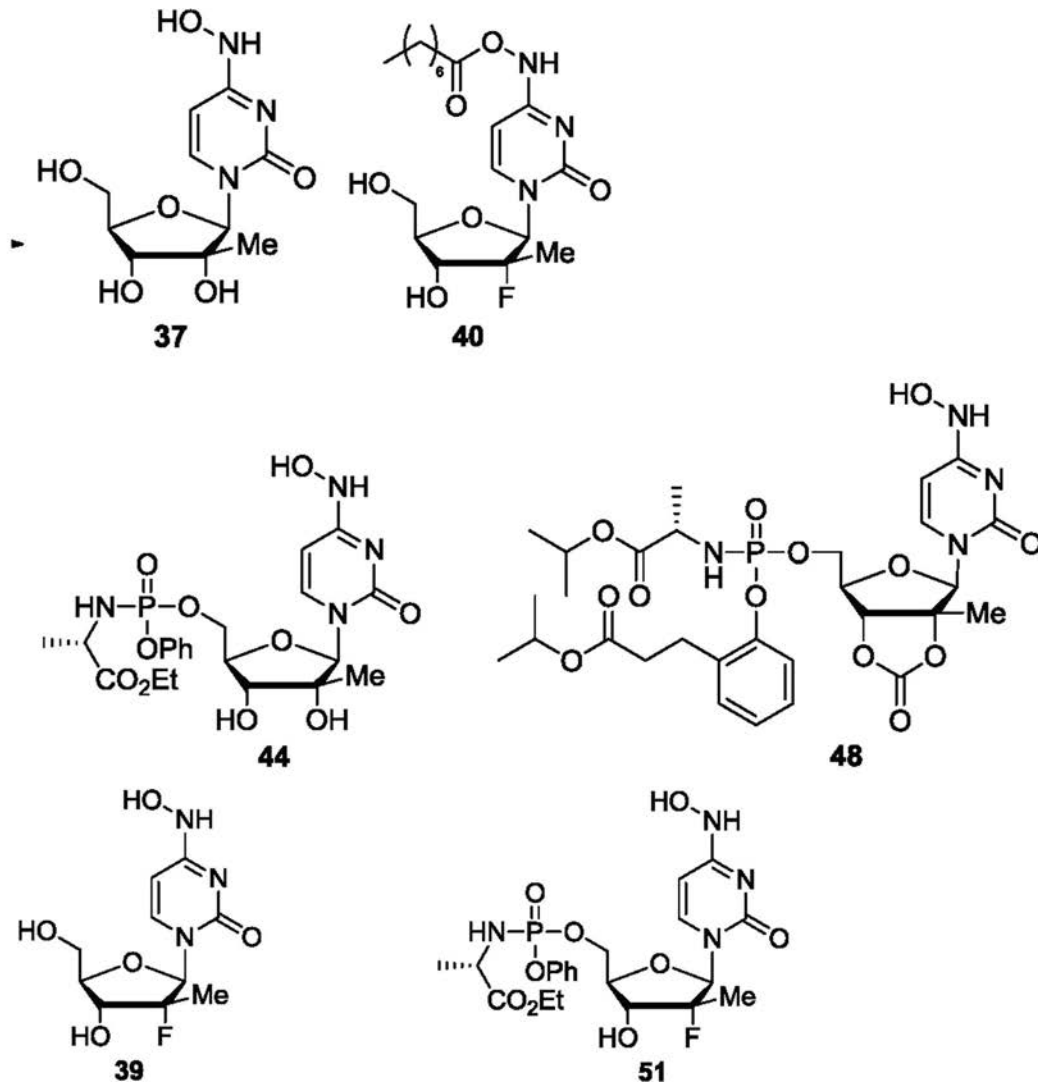
式中、

$R^{4'}$ 、 R^5 、 $R^{5'}$ 、 R^6 、 Y 、 M 、 $R^{7'}$ 、 R^{34} 、 R^{35} 、 R^{22} 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】

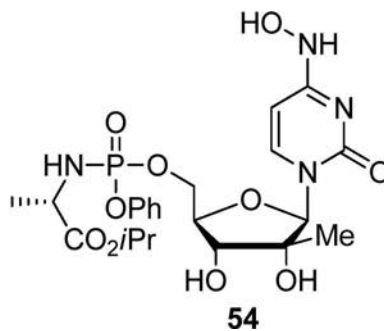


の 1 つからなる化合物、または薬学上許容可能なその塩。

【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】

H I V - 1 または H I V - 2 に感染した宿主を治療すること、H I V - 1 または H I V - 2 感染を予防すること、或いは、宿主における H I V - 1 または H I 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 I V 剤を更に含む、使用。

【請求項 11】

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、宿主にお

けるHBV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HBV剤を更に含む、使用。

【請求項12】

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13】

HSV-1またはHSV-2に感染した宿主を治療すること、HSV-1またはHSV-2感染を予防すること、或いは、宿主におけるHSV-1またはHSV-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HSV-1剤または抗HSV-2剤を更に含む、使用。

【請求項14】

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15】

前記 X^2 は、 $CH_2-O(CO)O-X^5$ である、請求項1に記載の化合物。