

【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2月12日(2016.2.12)

【公表番号】特表2015-503506(P2015-503506A)

【公表日】平成27年2月2日(2015.2.2)

【年通号数】公開・登録公報2015-007

【出願番号】特願2014-548912(P2014-548912)

【国際特許分類】

C 07 H	19/06	(2006.01)
C 07 H	19/10	(2006.01)
C 07 H	19/16	(2006.01)
C 07 H	19/20	(2006.01)
A 61 K	31/7068	(2006.01)
A 61 K	31/7072	(2006.01)
A 61 K	31/7076	(2006.01)
A 61 P	31/12	(2006.01)
A 61 P	31/16	(2006.01)

【F I】

C 07 H	19/06	C S P
C 07 H	19/10	
C 07 H	19/16	
C 07 H	19/20	
A 61 K	31/7068	
A 61 K	31/7072	
A 61 K	31/7076	
A 61 P	31/12	
A 61 P	31/16	

【手続補正書】

【提出日】平成27年12月18日(2015.12.18)

【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

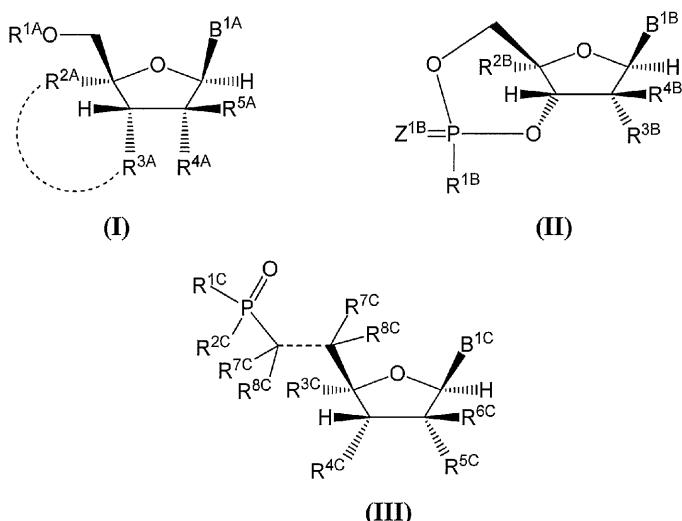
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)、式(II)、および式(III)から選択される化合物、または上記のものの医薬的に許容される塩：

【化1】

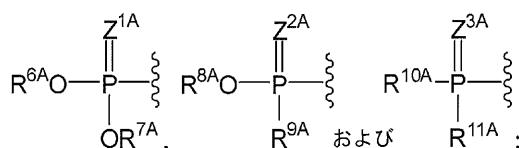


式中、

B^{1A} 、 B^{1B} および B^{1C} は独立して、置換されていてもよい複素環式塩基、または保護されたアミノ基を有する置換されていてもよい複素環式塩基である；

R^{1A} は、水素、置換されていてもよいアシル、置換されていてもよいO-結合アミノ酸、

【化2】



からなる群から選択される；

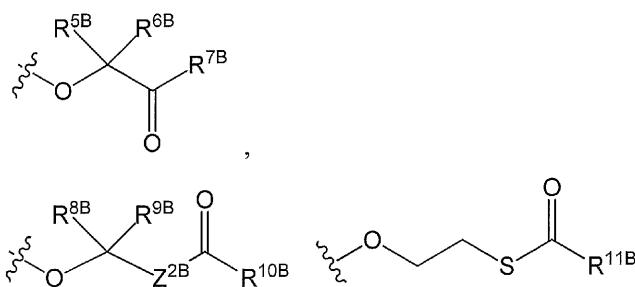
式(I)の破線(-----)が、非存在であり；

R^{2A} は、非置換のC_{1~6}アルキル、ハロゲン置換されたC_{1~6}アルキル、ヒドロキシ置換されたC_{1~6}アルキル、アルコキシ置換されたC_{1~6}アルキル、スルフェニル置換されたC_{1~6}アルキル、置換されていてもよいC_{2~6}アルケニル、置換されていてもよいC_{2~6}アルキニル、置換されていてもよいC_{3~6}シクロアルキル、置換されていてもよい-O-C_{1~6}アルキル、置換されていてもよい-O-C_{3~6}アルケニル、置換されていてもよい-O-C_{3~6}アルキニルおよびシアノからなる群から選択され；

R^{3A} は、OH、-OC(=O)R'、^A および置換されていてもよいO-結合アミノ酸からなる群から選択される；

R^{1B} は、O⁻、OH、

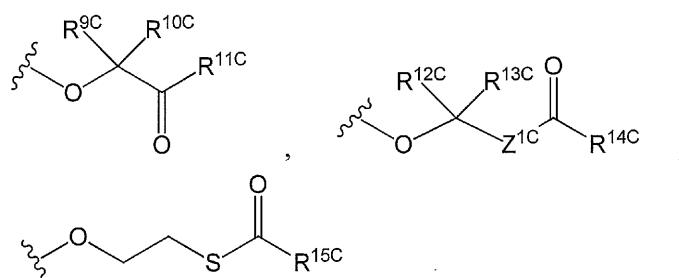
【化3】



、置換されていてもよいN-結合アミノ酸および置換されていてもよいN-結合アミノ酸エステル誘導体からなる群から選択される；

R^{1C} および R^{2C} は独立して、 O^- 、 OH 、置換されていてもよい $C_{1~6}$ アルコキシ

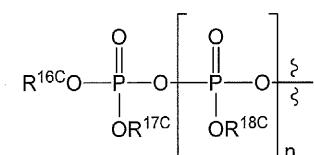
【化4】



、置換されていてもよい N -結合アミノ酸および置換されていてもよい N -結合アミノ酸エステル誘導体からなる群から選択される；あるいは

R^{1C} は、

【化5】



であり、 R^{2C} は、 O^- または OH である；

R^{2B} および R^{3C} は独立して、置換されていてもよい $C_{1~6}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{2~6}$ アルケニル、置換されていてもよい $C_{2~6}$ アルキニル、置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルキル、置換されていてもよい $-O-C_{1~6}$ アルキル、置換されていてもよい $-O-C_{3~6}$ アルケニル、置換されていてもよい $-O-C_{3~6}$ アルキニルおよびシアノからなる群から選択される；

R^{4C} は、 OH 、 $-OC(=O)R'$ および置換されていてもよい O -結合アミノ酸からなる群から選択される；

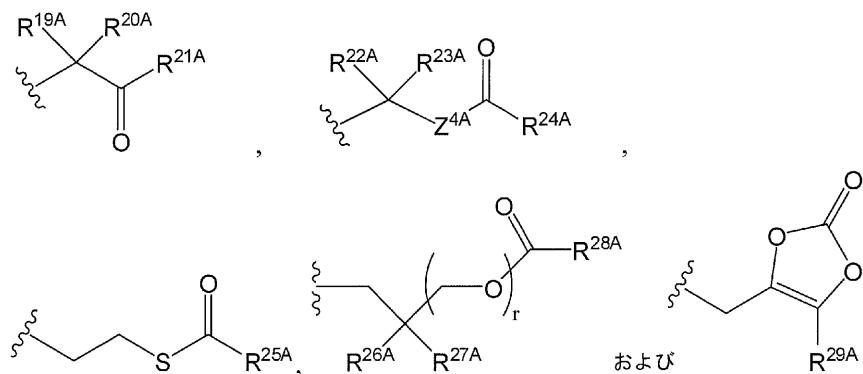
R^{4A} はフルオロまたはクロロである；

R^{3B} および R^{5C} は独立して、ハロゲンである；

R^{5A} 、 R^{4B} および R^{6C} は独立して、水素またはハロゲンである；

R^{6A} 、 R^{7A} および R^{8A} は独立して、非存在、水素、置換されていてもよい $C_{1~2}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{2~24}$ アルケニル、置換されていてもよい $C_{2~24}$ アルキニル、置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルキル、置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルケニル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいアリール ($C_{1~6}$ アルキル)、置換されていてもよい $*-(CR^{15A}R^{16A})_p-O-C_{1~24}$ アルキル、置換されていてもよい $*-(CR^{17A}R^{18A})_q-O-C_{1~24}$ アルケニル、

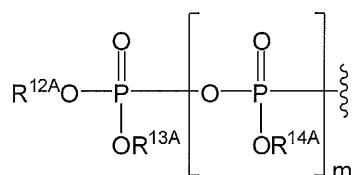
【化6】



からなる群から選択される；あるいは

R 6 A は、

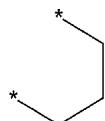
【化 7】



であり、 R^{7A} は、非存在または水素である；あるいは

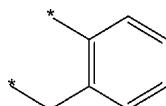
$R^{6/A}$ および $R^{7/A}$ は一緒にあって、置換されていてもよい

【化 8 】



および置換されていてもよい

【化 9 】



からなる群から選択される成分を形成し、ただし、この場合、R^{6A}およびR^{7A}につながっている酸素と、リンと、該成分とは、6員～10員環系を形成する；

R^9A は独立して、置換されていてもよい $C_{1~2~4}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{2~2~4}$ アルケニル、置換されていてもよい $C_{2~2~4}$ アルキニル、置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルキル、置換されていてもよい $C_{3~6}$ シクロアルケニル、 NR^3 R^3 A 、置換されていてもよい N - 結合アミノ酸および置換されていてもよい N - 結合アミノ酸エステル誘導体からなる群から選択される；

R^{10A} および R^{11A} は独立して、置換されていてもよい N-結合アミノ酸または置換されていてもよい N-結合アミノ酸エステル誘導体である：

R^{12A} , R^{13A} および R^{14A} は独立して、非存在または水素である：

各 $R^{1-5}A$ 、各 $R^{1-6}A$ 、各 $R^{1-7}A$ および各 $R^{1-8}A$ は独立して、水素、置換されていてよい。アルキルまたはアルコキシである。

アルキルまたはアルコートである;
 $R_{19}A$ 、 $R_{20}A$ 、 $R_{22}A$ 、 $R_{23}A$ 、 R_5B 、 R_6B 、 R_8B 、 R_9B 、 R_9C 、
 $R_{10}C$ 、 $R_{12}C$ および $R_{13}C$ は独立して、水素、置換されていてもよい C_{1-24} アルキルおよび置換されていてもよいアリールからなる群から選択される。

アルキルおよび置換されていてよいアリールからなる群から選択される、
 $R^{2\ 1\ A}$ 、 $R^{2\ 4\ A}$ 、 $R^{7\ B}$ 、 $R^{1\ 0\ B}$ 、 $R^{1\ 1\ C}$ および $R^{1\ 4\ C}$ は独立して、水素、置換されていてもよい $C_{1\sim2\ 4}$ アルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよい $-O-C_{1\sim2\ 4}$ アルキルおよび置換されていてもよい $-O-$ アリールからなる群から選択される：

$R^{2,5}A$ 、 $R^{2,9}A$ 、 $R^{1,1}B$ および $R^{1,5}C$ は独立して、水素、置換されていてよい
 $C_{1,2,3,4}$ アルキルおよび置換されていてよいアリールからなる群から選択される：

R¹ C⁶ および R¹ C⁷ は独立して 非存在または水素である：

R^{2-6A} および R^{2-7A} は独立して、非存在または示素である；
 C_{2-8} オルガニルカルボニル、
 C_{2-8} アルコキシカルボニルおよび 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る置換されていてもよい置換基である；

$R^{2,8,A}$ は、水素、置換されていてもよい $C_{1 \sim 2,4}$ -アルキル、置換されていてもよい $C_{2 \sim 2,4}$ アルケニル、置換されていてもよい $C_{2 \sim 2,4}$ アルキニル、置換されていてもよい $C_{3 \sim 6}$ シクロアルキルおよび置換されていてもよい $C_{3 \sim 6}$ シクロアルケニルから

なる群から選択される；

$R^{3,0}A$ および $R^{3,1}A$ は独立して、水素、置換されていてもよい $C_{1 \sim 2,4}$ - アルキル、置換されていてもよい $C_{2 \sim 2,4}$ アルケニル、置換されていてもよい $C_{2 \sim 2,4}$ アルキニル、置換されていてもよい $C_{3 \sim 6}$ シクロアルキルおよび置換されていてもよい $C_{3 \sim 6}$ シクロアルケニルからなる群から選択される；

式 (I I I) について、- - - - - は、単結合または二重結合である；

- - - - - が、単結合であるとき、各 R^7C および各 R^8C は独立して、水素またはハロゲンである；

- - - - - が、二重結合であるとき、各 R^7C は、非存在であり、各 R^8C は独立して、水素またはハロゲンである；

$R^{',,}A$ および $R^{',,}C$ は独立して、置換されていてもよい $C_{1 \sim 2,4}$ - アルキルである；

m および n は独立して、0 または 1 である；

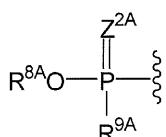
p および q は独立して、1、2 および 3 からなる群から選択される；

r は、1 または 2 である；

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

ただし、 $\underline{R^{1A}}$ が、

【化 10】



(式中、 R^{8A} は、非置換の $C_{1 \sim 4}$ アルキル、またはハロゲンもしくはメチルでパラ置換されていてもよいフェニルであり、 R^{9A} は、グリシン、アラニン、バリン、ロイシン、フェニルアラニン、トリプトファン、メチオニンおよびプロリンからなる群から選択されるアミノ酸のメチルエステル、エチルエステル、イソプロピルエステル、n-ブチルエステル、ベンジルエステルまたはフェニルエステルである) であり； R^{3A} が、OH であり； R^{4A} が、フルオロであり； R^{5A} が、フルオロまたは水素であり； B^{1A} が、非置換のウラシルであるとき； R^{2A} は、-OCH₃ とすることができない；

ただし、 $\underline{R^{1A}}$ が、H であり； R^{3A} が、OH であり； R^{4A} が、フルオロであり； R^{5A} が、フルオロであり； B^{1A} が、非置換のシトシンであるとき； R^{2A} は、アレニルとすることが~~でき~~；および

ただし、 $\underline{R^{1A}}$ が、H であり； R^{3A} が、OH であり； R^{4A} が、フルオロであり； R^{5A} が、フルオロであり； B^{1A} が、非置換のシトシンであるとき； R^{2A} は、エチニルとすることができない。

【請求項 2】

式 (I) の化合物である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^{1A} が、H である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^{1A} が、置換されていてもよいアシルである、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 5】

前記置換されていてもよいアシルが、-C(=O)R^{3,9A} であり、R^{3,9A} が、置換されていてもよい $C_{1 \sim 1,2}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{2 \sim 1,2}$ アルケニル、置換されていてもよい $C_{2 \sim 1,2}$ アルキニル、置換されていてもよい $C_{3 \sim 8}$ シクロアルキル、置換されていてもよい $C_{5 \sim 8}$ シクロアルケニル、置換されていてもよい $C_{6 \sim 1,0}$ アリール、置換されていてもよいヘテロアリール、置換されていてもよいヘテロシクリル、置換されていてもよいアリール ($C_{1 \sim 6}$ アルキル)、置換されていてもよいヘテロア

リール (C₁ ~ 6 アルキル) および置換されていてもよいヘテロシクリル (C₁ ~ 6 アルキル) からなる群から選択される、請求項 4 に記載の化合物。

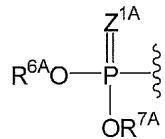
【請求項 6】

R^{3 9 A} が、置換または非置換 C₁ ~ 1₂ アルキルである、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

R^{1 A} が、

【化 1 1】



である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 8】

R^{6 A} および R^{7 A} がともに水素、またはともに不存在である、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

R^{6 A} および R^{7 A} の一方が、水素であり、R^{6 A} および R^{7 A} の他方が、置換されていてもよい C₁ ~ 2₄ アルキル、置換されていてもよい C₂ ~ 2₄ アルケニル、置換されていてもよい C₂ ~ 2₄ アルキニル、置換されていてもよい C₃ ~ 6 シクロアルキル、置換されていてもよい C₃ ~ 6 シクロアルケニル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリールおよび置換されていてもよいアリール (C₁ ~ 6 アルキル) からなる群から選択される、または R^{6 A} および R^{7 A} の両方が独立して、置換されていてもよい C₁ ~ 2₄ アルキル、置換されていてもよい C₂ ~ 2₄ アルケニル、置換されていてもよい C₂ ~ 2₄ アルキニル、置換されていてもよい C₃ ~ 6 シクロアルキル、置換されていてもよい C₃ ~ 6 シクロアルケニル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリールおよび置換されていてもよいアリール (C₁ ~ 6 アルキル) からなる群から選択される、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 10】

R^{6 A} および R^{7 A} が、ともに置換されていてもよい C₁ ~ 2₄ アルキル、ともに置換されていてもよい C₂ ~ 2₄ アルケニル、ともに * - (C R^{1 5 A} R^{1 6 A})_p - O - C₁ ~ 2₄ アルキル、または、ともに * - (C R^{1 7 A} R^{1 8 A})_q - O - C₂ ~ 2₄ アルケニルである、請求項 7 に記載の化合物。

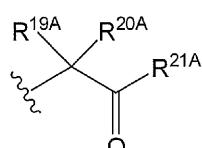
【請求項 11】

R^{6 A} および R^{7 A} が、ともに置換されていてもよいアリール、または、ともに置換されていてもよいアリール (C₁ ~ 6 アルキル) である請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 12】

R^{6 A} および R^{7 A} がともに、

【化 1 2】

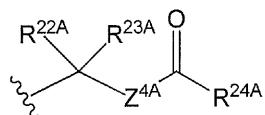


である、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 13】

R^{6 A} および R^{7 A} がともに、

【化13】

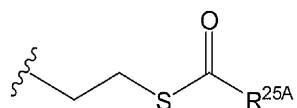


である、請求項7に記載の化合物。

【請求項14】

R^{6A}およびR^{7A}がともに、

【化14】

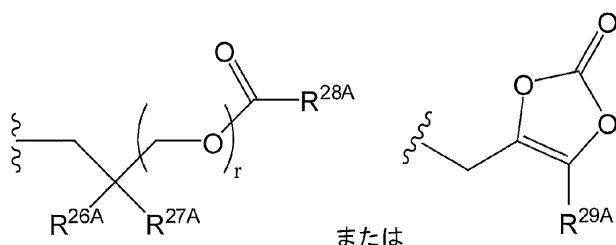


である、請求項7に記載の化合物。

【請求項15】

R^{6A}およびR^{7A}がともに、

【化15】

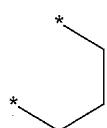


である、請求項7に記載の化合物。

【請求項16】

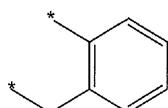
R^{6A}およびR^{7A}が一緒になって、置換されていてもよい

【化16】



および置換されていてもよい

【化17】

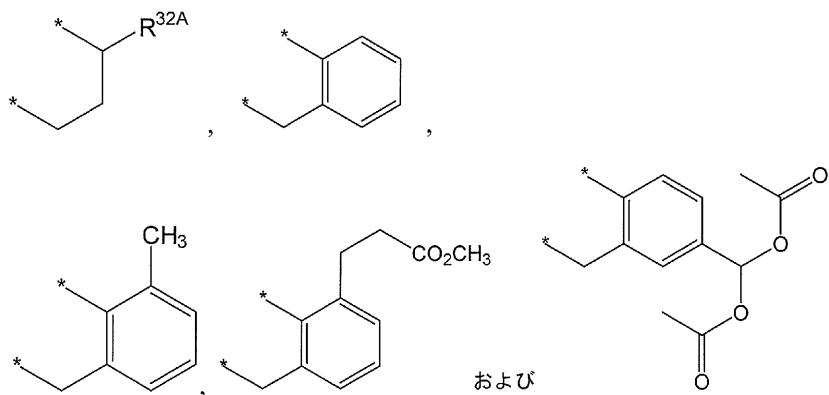


からなる群から選択される成分を形成することができ、ただし、この場合、R^{6A}およびR^{7A}につながっている酸素と、リンと、該成分とは、6員～10員環系を形成する、請求項7に記載の化合物。

【請求項17】

R^{6A}およびR^{7A}が一緒になって、

【化18】



(式中、R^{32A}は、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリールまたは置換されていてもよいヘテロシクリルである)からなる群から選択される成分を形成することができる、請求項16に記載の化合物。

【請求項18】

Z^{1A}が、Oである、請求項2～17のいずれか一項に記載の化合物。

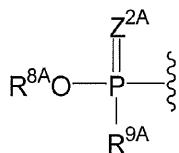
【請求項19】

Z^{1A}が、Sである、請求項2～17のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項20】

R^{1A}が、

【化19】



である、請求項2に記載の化合物。

【請求項21】

R^{8A}が、非存在、水素、置換されていてもよいC_{1～24}アルキル、置換されていてもよいC_{2～24}アルケニル、置換されていてもよいC_{2～24}アルキニル、置換されていてもよいC_{3～6}シクロアルキルおよび置換されていてもよいC_{3～6}シクロアルケニルからなる群から選択され；R^{9A}が独立して、置換されていてもよいC_{1～24}アルキル、置換されていてもよいC_{2～24}アルケニル、置換されていてもよいC_{2～24}アルキニル、置換されていてもよいC_{3～6}シクロアルキル、置換されていてもよいC_{3～6}シクロアルケニルおよびNR^{30A}R^{31A}からなる群から選択され、R^{30A}およびR^{31A}は独立して、水素、置換されていてもよいC_{1～24}アルキル、置換されていてもよいC_{2～24}アルケニル、置換されていてもよいC_{2～24}アルキニル、置換されていてもよいC_{3～6}シクロアルキルおよび置換されていてもよいC_{3～6}シクロアルケニルからなる群から選択される、請求項20に記載の化合物。

【請求項22】

R^{8A}が、非存在、水素または置換されていてもよいアリールであり；R^{9A}が、置換されていてもよいN-結合アミノ酸または置換されていてもよいN-結合アミノ酸エステル誘導体である、請求項20に記載の化合物。

【請求項23】

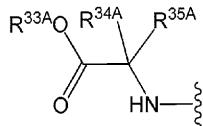
R^{9A}が、アラニン、アスパラギン、アスパラギン酸、システイン、グルタミン酸、グルタミン、グリシン、プロリン、セリン、チロシン、アルギニン、ヒスチジン、イソロイシン、ロイシン、リシン、メチオニン、フェニルアラニン、トレオニン、トリプトファン、バリン、オルニチン、ハイブシン、2-アミノイソ酪酸、デヒドロアラニン、-アミノ酪酸、シトルリン、-アラニン、-エチル-グリシン、-プロピル-グリシン、

ノルロイシンおよびそれらのエステル誘導体からなる群から選択される、請求項 2 2 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

R^{33A} が、構造

【化 2 0】



(式中、 R^{33A} は、水素、置換されていてもよい $C_{1 \sim 6}$ - アルキル、置換されていてもよい $C_{3 \sim 6}$ シクロアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアリール ($C_{1 \sim 6}$ アルキル) および置換されていてもよいハロアルキルからなる群から選択される； R^{34A} は、水素、置換されていてもよい $C_{1 \sim 6}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{1 \sim 6}$ ハロアルキル、置換されていてもよい $C_{3 \sim 6}$ シクロアルキル、置換されていてもよい C_6 アリール、置換されていてもよい $C_{1 \sim 10}$ アリールおよび置換されていてもよいアリール ($C_{1 \sim 6}$ アルキル) からなる群から選択される； R^{35A} は、水素または置換されていてもよい $C_{1 \sim 4}$ - アルキルである；あるいは R^{34A} および R^{35A} は一緒になって、置換されていてもよい $C_{3 \sim 6}$ シクロアルキルを形成する) を有する、請求項 2 2 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

Z^{2A} が、O である、請求項 2 0 ~ 2 4 のいずれか一項に記載の化合物。

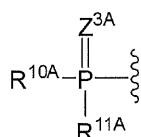
【請求項 2 6】

Z^{2A} が、S である、請求項 2 0 ~ 2 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 7】

R^{1A} が、

【化 2 1】



である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 2 8】

R^{10A} および R^{11A} がともに、置換されていてもよい N - 結合アミノ酸または置換されていてもよい N - 結合アミノ酸エステル誘導体である、請求項 2 7 に記載の化合物。

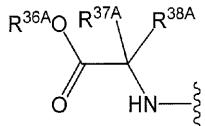
【請求項 2 9】

R^{10A} および R^{11A} が独立して、アラニン、アスパラギン、アスパラギン酸、システイン、グルタミン酸、グルタミン、グリシン、プロリン、セリン、チロシン、アルギニン、ヒスチジン、イソロイシン、ロイシン、リシン、メチオニン、フェニルアラニン、トレオニン、トリプトファン、バリン、オルニチン、ハイブシン、2 - アミノイソ酪酸、デヒドロアラニン、-アミノ酪酸、シトルリン、-アラニン、-エチル - グリシン、-プロピル - グリシン、ノルロイシンおよびそれらのエステル誘導体からなる群から選択される、請求項 2 8 に記載の化合物。

【請求項 3 0】

R^{10A} および R^{11A} が独立して、構造

【化22】



(式中、 $\text{R}^{3\sim 6A}$ は、水素、置換されていてもよい $\text{C}_{1\sim 6}$ -アルキル、置換されていてもよい $\text{C}_{3\sim 6}$ シクロアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアリール($\text{C}_{1\sim 6}$ アルキル)および置換されていてもよいハロアルキルからなる群から選択される; $\text{R}^{3\sim 7A}$ は、水素、置換されていてもよい $\text{C}_{1\sim 6}$ アルキル、置換されていてもよい $\text{C}_{1\sim 6}$ ハロアルキル、置換されていてもよい $\text{C}_{3\sim 6}$ シクロアルキル、置換されていてもよい C_6 アリール、置換されていてもよい C_{10} アリールおよび置換されていてもよいアリール($\text{C}_{1\sim 6}$ アルキル)からなる群から選択される; $\text{R}^{3\sim 8A}$ は、水素または置換されていてもよい $\text{C}_{1\sim 4}$ -アルキルである; あるいは $\text{R}^{3\sim 7A}$ および $\text{R}^{3\sim 8A}$ は一緒にになって、置換されていてもよい $\text{C}_{3\sim 6}$ シクロアルキルを形成する)を有する、請求項28に記載の化合物。)

【請求項31】

Z^{3A} が、Oである、請求項27~30のいずれか一項に記載の化合物。

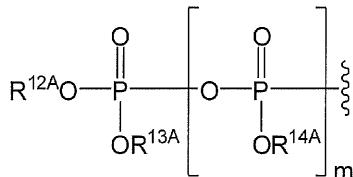
【請求項32】

Z^{3A} が、Sである、請求項27~30のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項33】

R^{6A} が、

【化23】



である; および R^{7A} は、水素または非存在である、請求項2に記載の化合物。

【請求項34】

m が、0であり、 $\text{R}^{1\sim 2A}$ および $\text{R}^{1\sim 3A}$ が独立して、非存在または水素である、請求項33に記載の化合物。

【請求項35】

m が、1であり、 $\text{R}^{1\sim 2A}$ 、 $\text{R}^{1\sim 3A}$ および $\text{R}^{1\sim 4A}$ が独立して、非存在または水素である、請求項33に記載の化合物。

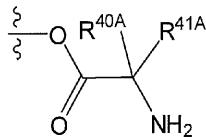
【請求項36】

R^{1A} が、置換されていてもよいO-結合アミノ酸である、請求項2に記載の化合物。

【請求項37】

R^{1A} が、

【化24】



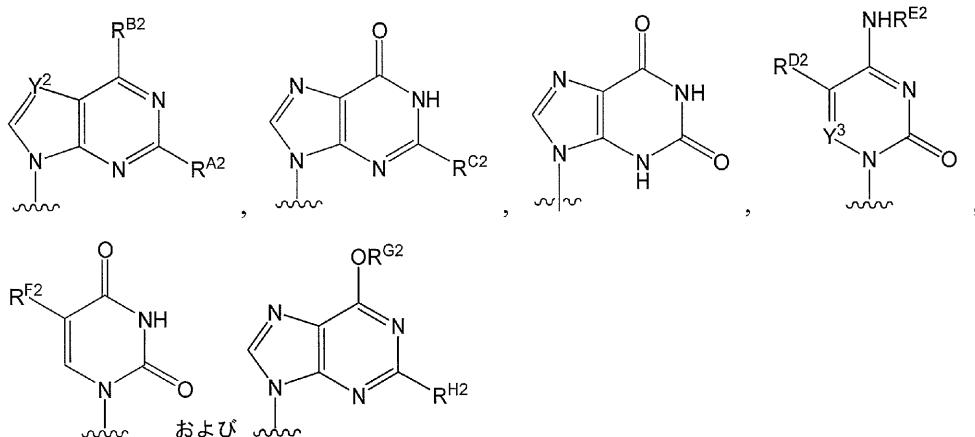
(式中、 $\text{R}^{4\sim 0A}$ は、水素、置換されていてもよい $\text{C}_{1\sim 6}$ アルキル、置換されていてもよい $\text{C}_{1\sim 6}$ ハロアルキル、置換されていてもよい $\text{C}_{3\sim 6}$ シクロアルキル、置換されていてもよい C_6 アリール、置換されていてもよい C_{10} アリールおよび置換されていてもよいアリール($\text{C}_{1\sim 6}$ アルキル)からなる群から選択される; $\text{R}^{4\sim 1A}$ は、水素または

置換されていてもよい $C_{1\sim 4}$ -アルキルであり；あるいは R^{40A} および R^{41A} は一緒になって、置換されていてもよい $C_{3\sim 6}$ シクロアルキルを形成する)である、請求項2に記載の化合物。

【請求項38】

B^{1A} が、

【化25】



からなる群から選択され、

式中、

R^{A2} は、水素、ハロゲンおよび NHR^{J2} からなる群から選択され、ただし、この場合、 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る；

R^{B2} は、ハロゲンまたは NHR^W2 であり、ただし、この場合、 R^W2 は、水素、置換されていてもよい $C_{1\sim 6}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{2\sim 6}$ アルケニル、置換されていてもよい $C_{3\sim 8}$ 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る；

R^{C2} は、水素または NHR^O2 であり、ただし、この場合、 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る；

R^{D2} は、水素、ハロゲン、置換されていてもよい $C_{1\sim 6}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{2\sim 6}$ アルケニルおよび置換されていてもよい $C_{2\sim 6}$ アルキニルからなる群から選択される；

R^{E2} は、水素、ヒドロキシ、置換されていてもよい $C_{1\sim 6}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{3\sim 8}$ 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る；

R^{F2} は、水素、ハロゲン、置換されていてもよい $C_{1\sim 6}$ アルキル、置換されていてもよい $C_{2\sim 6}$ アルケニルおよび置換されていてもよい $C_{2\sim 6}$ アルキニルからなる群から選択される；

Y^2 および Y^3 は独立して、Nまたは CR^I2 であり、ただし、この場合、 R^I2 は、水素、ハロゲン、置換されていてもよい $C_{1\sim 6}$ -アルキル、置換されていてもよい $C_{2\sim 6}$ -アルケニルおよび置換されていてもよい $C_{2\sim 6}$ -アルキニルからなる群から選択される；

R^{G2} は、置換されていてもよい $C_{1\sim 6}$ アルキルである；

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

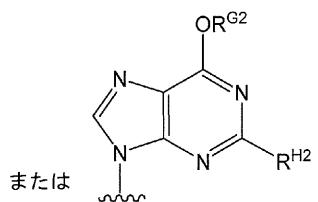
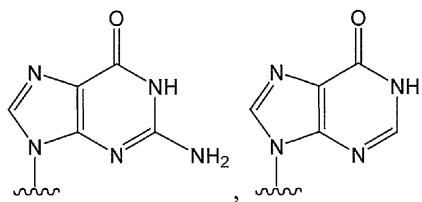
R^K2 、 R^L2 、 R^M2 、 R^N2 、 R^P2 、 R^Q2 、 R^R2 、 R^S2 、 R^U2 および R^V2 は独立して、 $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{2\sim 6}$ アルケニル、 $C_{2\sim 6}$ アルキニル、 $C_{3\sim 6}$ シクロアルキル、 $C_{3\sim 6}$ シクロアルケニル、 $C_{6\sim 10}$ アリール、ヘテロアリール、ヘテロアリシクリル、アリール($C_{1\sim 6}$ アルキル)、ヘテロアリール($C_{1\sim 6}$ アルキル)

) およびヘテロアリシクリル (C₁ ~ C₆ アルキル) からなる群から選択される、請求項 2 ~ 3 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 3 9】

B¹ A が、

【化 2 6】

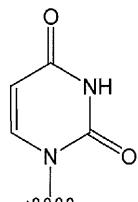


である、請求項 3 8 に記載の化合物。

【請求項 4 0】

B¹ A が、

【化 2 7】

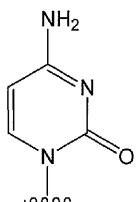


である、請求項 3 8 に記載の化合物。

【請求項 4 1】

B¹ A が、

【化 2 8】

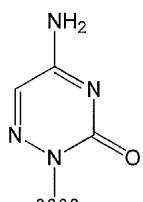


である、請求項 3 8 に記載の化合物。

【請求項 4 2】

B¹ A が、

【化 2 9】



である、請求項 3 8 に記載の化合物。

【請求項 4 3】

R^{2A} がハロゲン置換された C₁ ~ ₆ アルキル、またはスルフェニル置換された C₁ ~ ₆ アルキルである、請求項 2 ~ 4 2 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 4 4】

R^{2A} が、ハロゲン置換された C₁ ~ ₆ アルキルである、請求項 4 3 に記載の化合物。

【請求項 4 5】

R^{2A} が、非置換の C₁ ~ ₆ アルキルである、請求項 2 ~ 4 2 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 4 6】

R^{2A} が、置換されていてもよい C₂ ~ ₆ アルケニル、置換されていてもよい C₂ ~ ₆ アルキニル、または置換されていてもよい C₃ ~ ₆ シクロアルキルである、請求項 2 ~ 4 2 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 4 7】

R^{2A} が、置換されていてもよい -O-C₁ ~ ₆ アルキル、置換されていてもよい -O-C₃ ~ ₆ アルキニルである、請求項 2 ~ 4 2 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 4 8】

R^{2A} が、シアノである、請求項 2 ~ 4 2 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 4 9】

R^{3A} が、OH である、請求項 2 ~ 4 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5 0】

R^{3A} が、-OC(=O)R' ' A である、請求項 2 ~ 4 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5 1】

R' ' A が、置換されていてもよい C₁ ~ ₈ アルキルである、請求項 5 0 に記載の化合物。

【請求項 5 2】

R^{3A} が、O-結合アミノ酸である、請求項 2 ~ 4 8 のいずれか一項に記載の化合物。

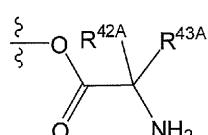
【請求項 5 3】

前記 O-結合アミノ酸が、アラニン、アスパラギン、アスパラギン酸、システイン、グルタミン酸、グルタミン、グリシン、プロリン、セリン、チロシン、アルギニン、ヒスチジン、イソロイシン、ロイシン、リシン、メチオニン、フェニルアラニン、トレオニン、トリプトファン、バリン、オルニチン、ハイブシン、2-アミノイソ酪酸、デヒドロアラニン、-アミノ酪酸、シトルリン、-アラニン、-エチル-グリシン、-プロピル-グリシンおよびノルロイシンからなる群から選択される、請求項 5 2 に記載の化合物。

【請求項 5 4】

R^{3A} が、

【化 3 0】



(式中、R^{4 2 A} は、水素、置換されていてもよい C₁ ~ ₆ アルキル、置換されていてもよい C₁ ~ ₆ ハロアルキル、置換されていてもよい C₃ ~ ₆ シクロアルキル、置換されていてもよい C₆ アリール、置換されていてもよい C₁₀ アリールおよび置換されていてもよいアリール (C₁ ~ ₆ アルキル) からなる群から選択される；R^{4 3 A} は、水素または置換されていてもよい C₁ ~ ₄ - アルキルである；あるいは R^{4 2 A} および R^{4 3 A} は一緒になって、置換されていてもよい C₃ ~ ₆ シクロアルキルを形成する) である、請求項 2 ~ 4 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5 5】

R^{5A} が、水素である、請求項 2 ~ 5 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5 6】

R^{5A} が、ハロゲンである、請求項 2 ~ 5 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5 7】

R^{5A} が、フルオロである、請求項 5 6 に記載の化合物。

【請求項 5 8】

R^{4A} が、フルオロである、請求項 2 ~ 5 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5 9】

式 (I I) の化合物である、請求項 1 に記載の化合物。

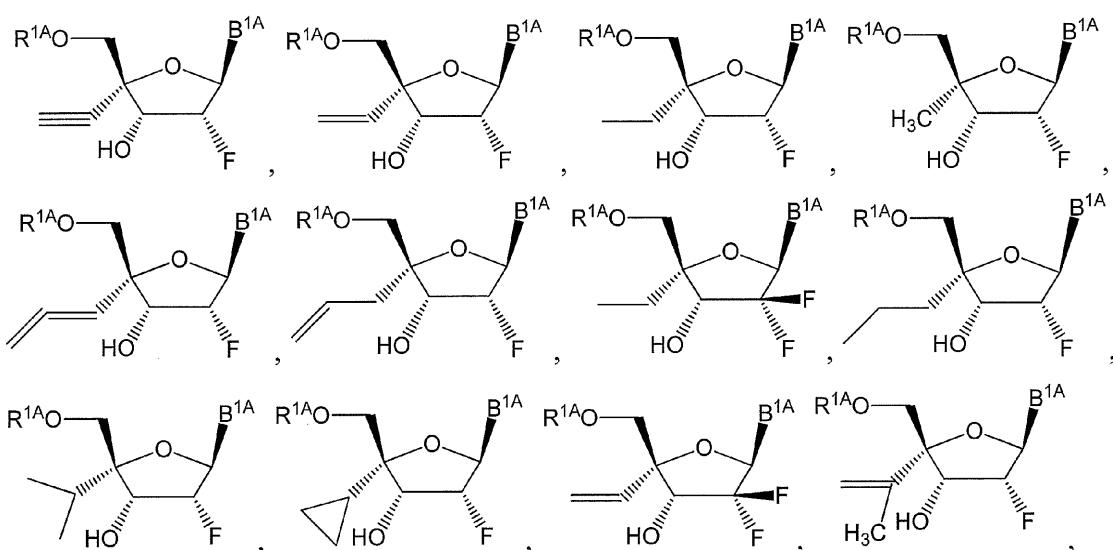
【請求項 6 0】

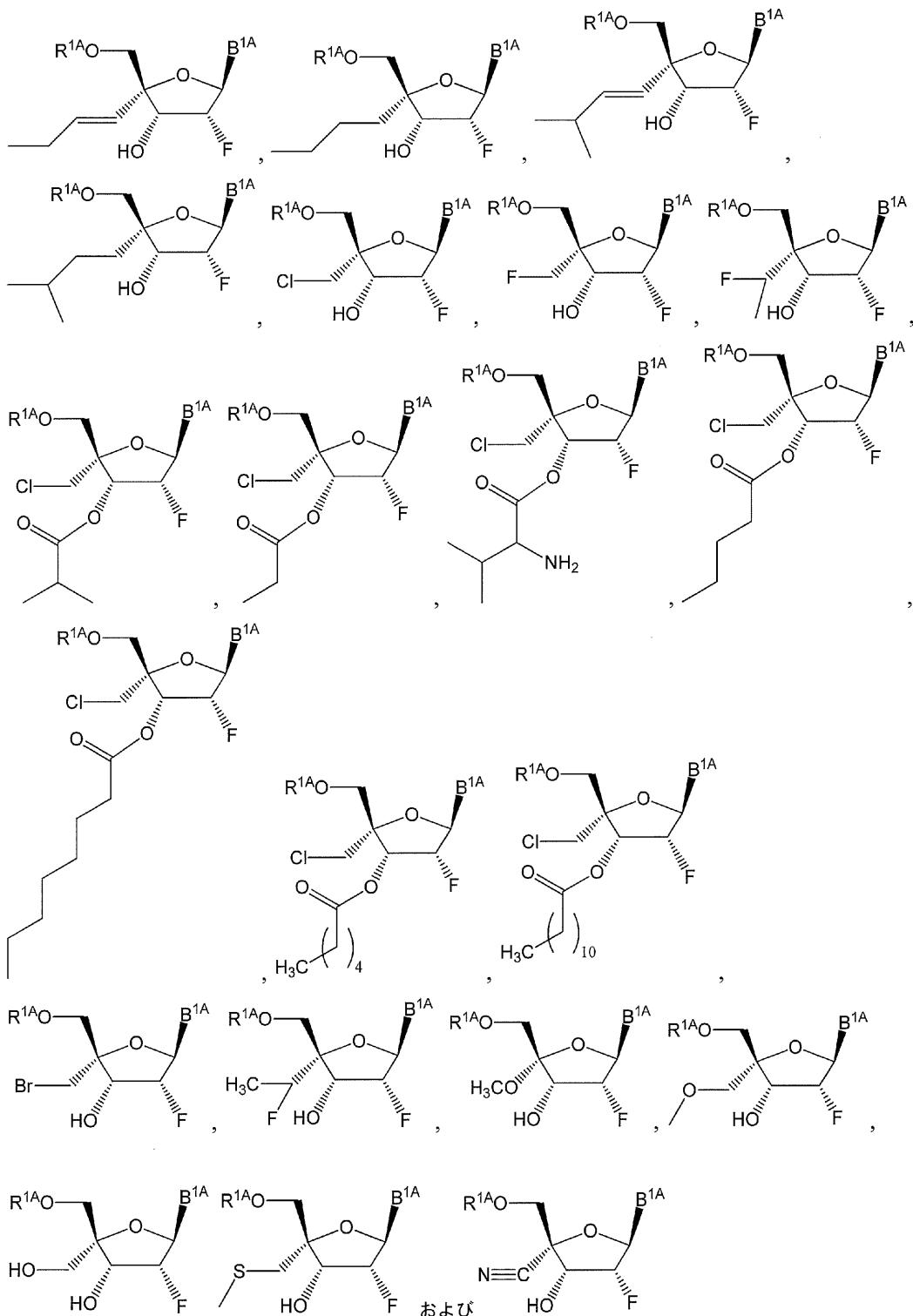
式 (I I I) の化合物である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6 1】

式 (I) の化合物が、

【化 3 1】



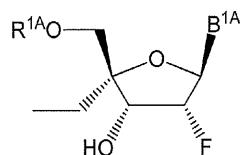


からなる群、または上記のものの医薬的に許容される塩から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 6 2】

式(Ⅰ)の化合物が、

【化 3 2】

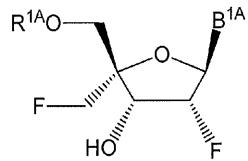


、またはその医薬的に許容される塩から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 6 3】

式 (I) の化合物が、

【化 3 3】

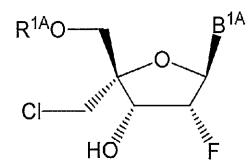


、またはその医薬的に許容される塩から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 6 4】

式 (I) の化合物が、

【化 3 4】

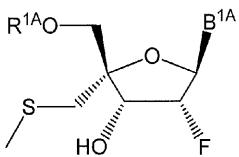


、またはその医薬的に許容される塩から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 6 5】

式 (I) の化合物が、

【化 3 5】

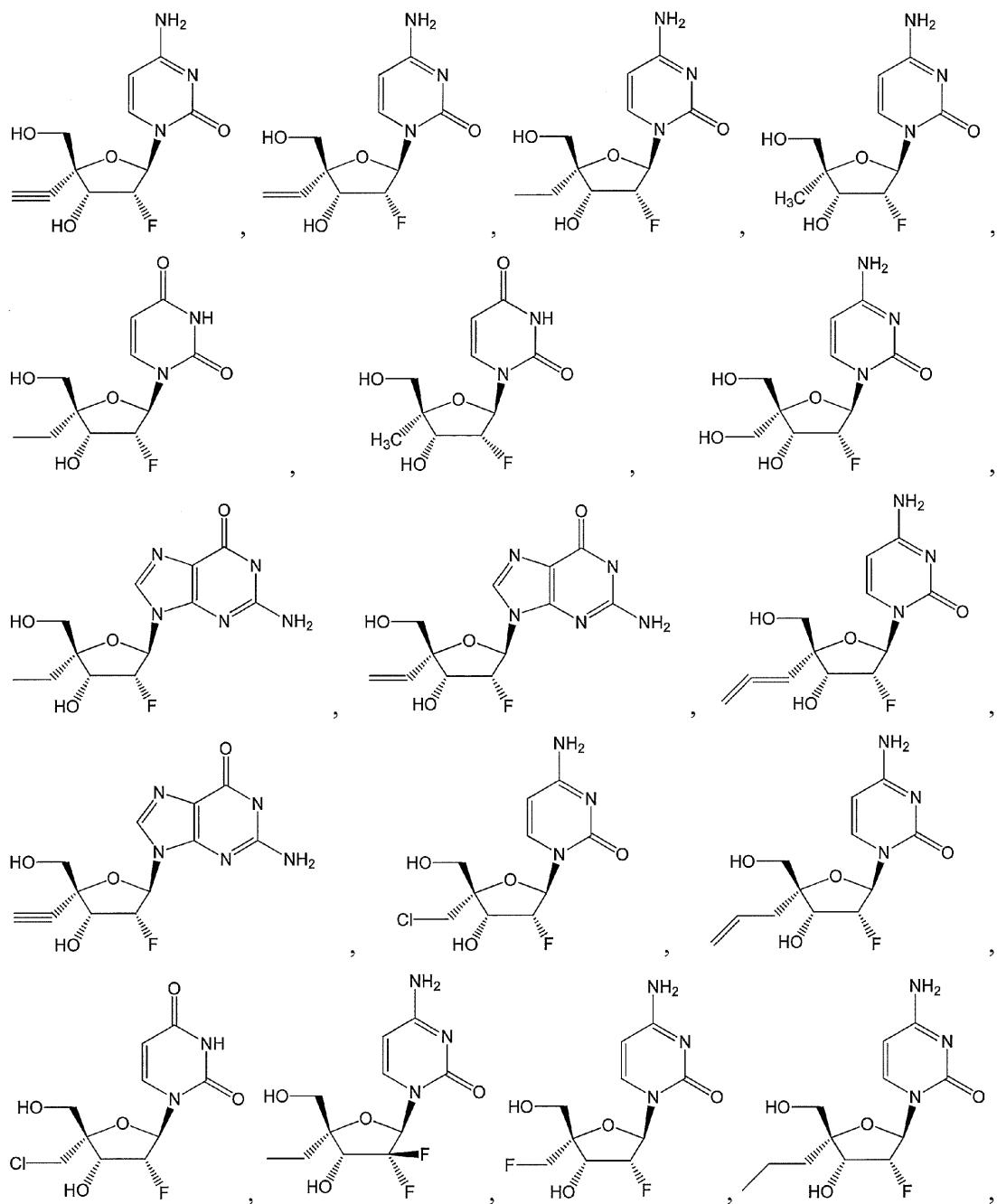


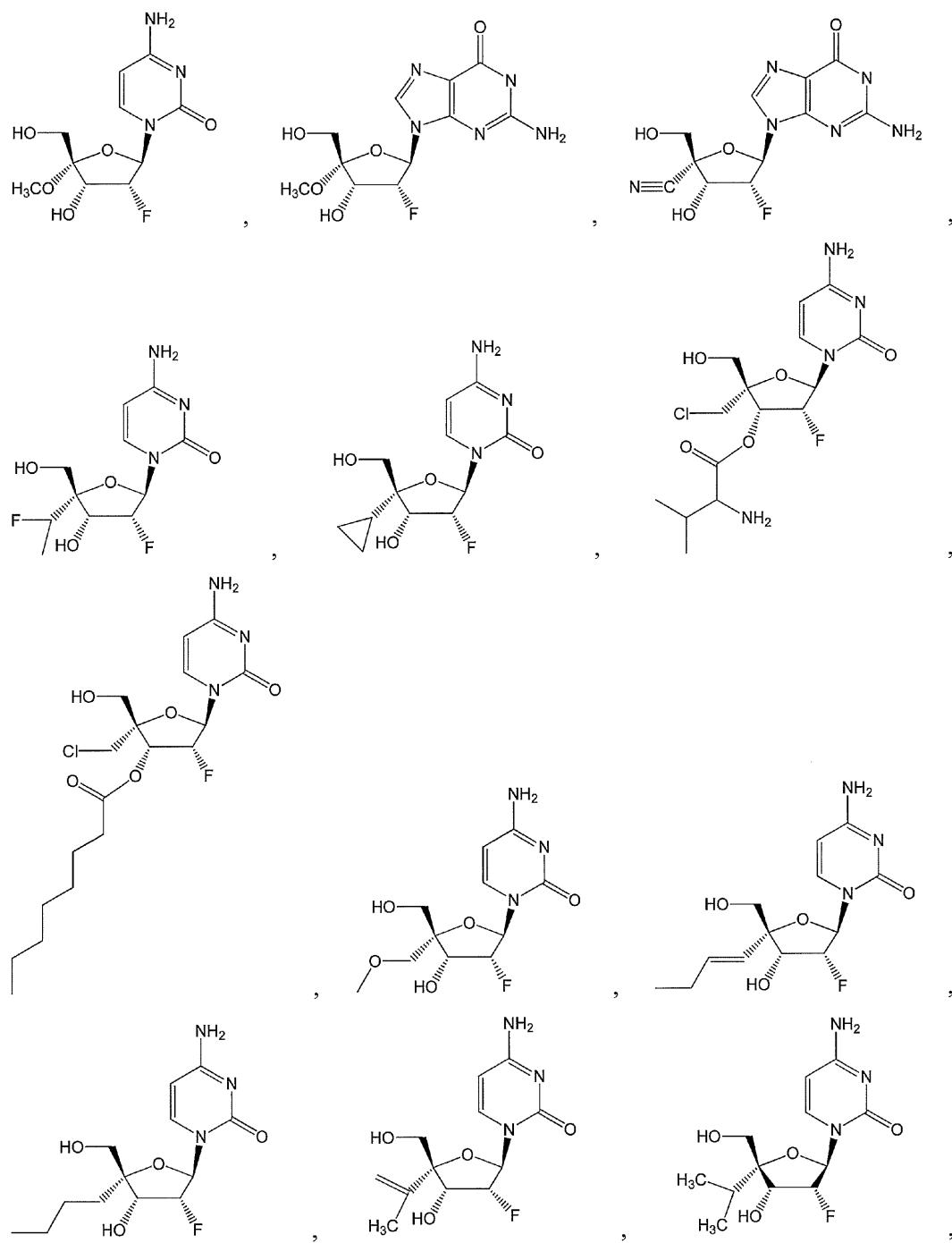
、またはその医薬的に許容される塩から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

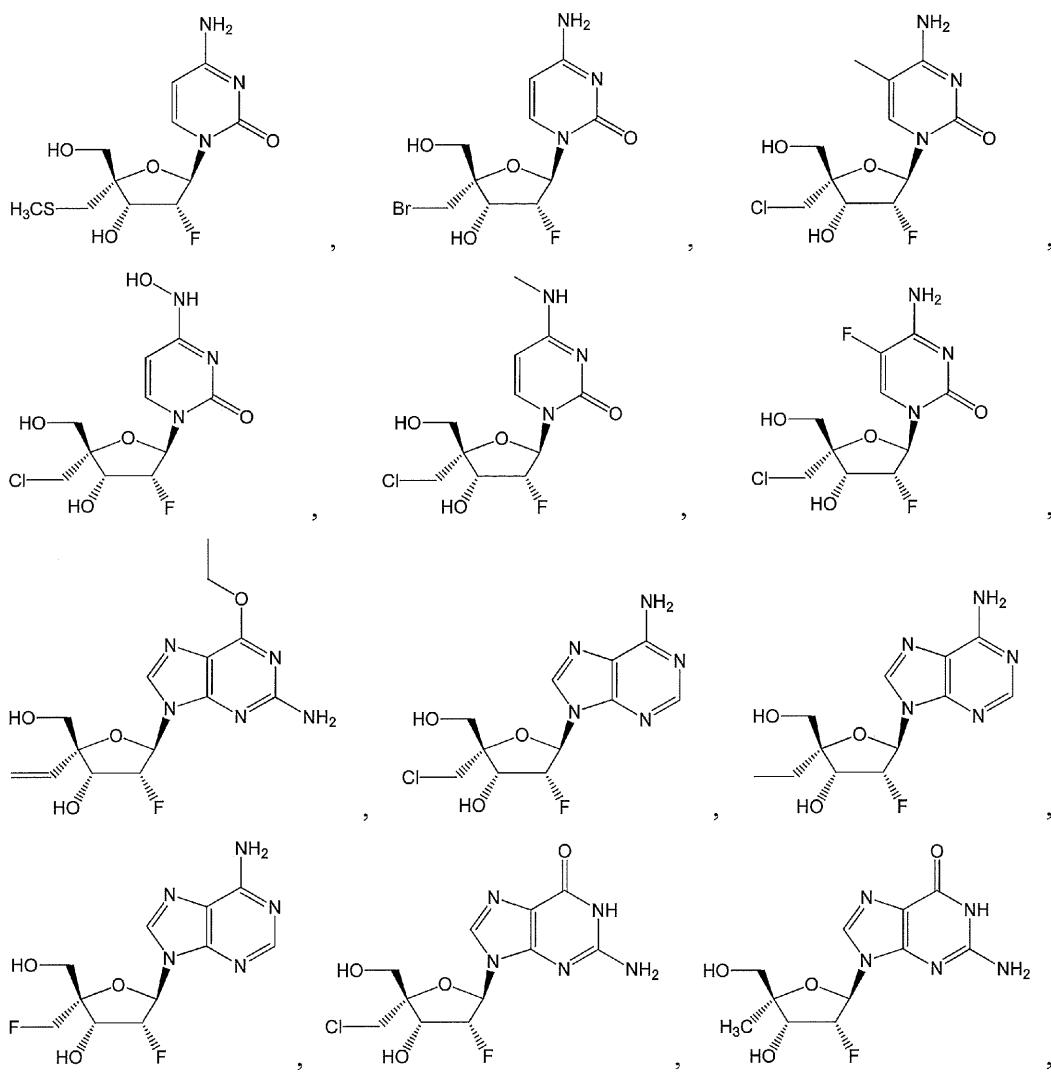
【請求項 6 6】

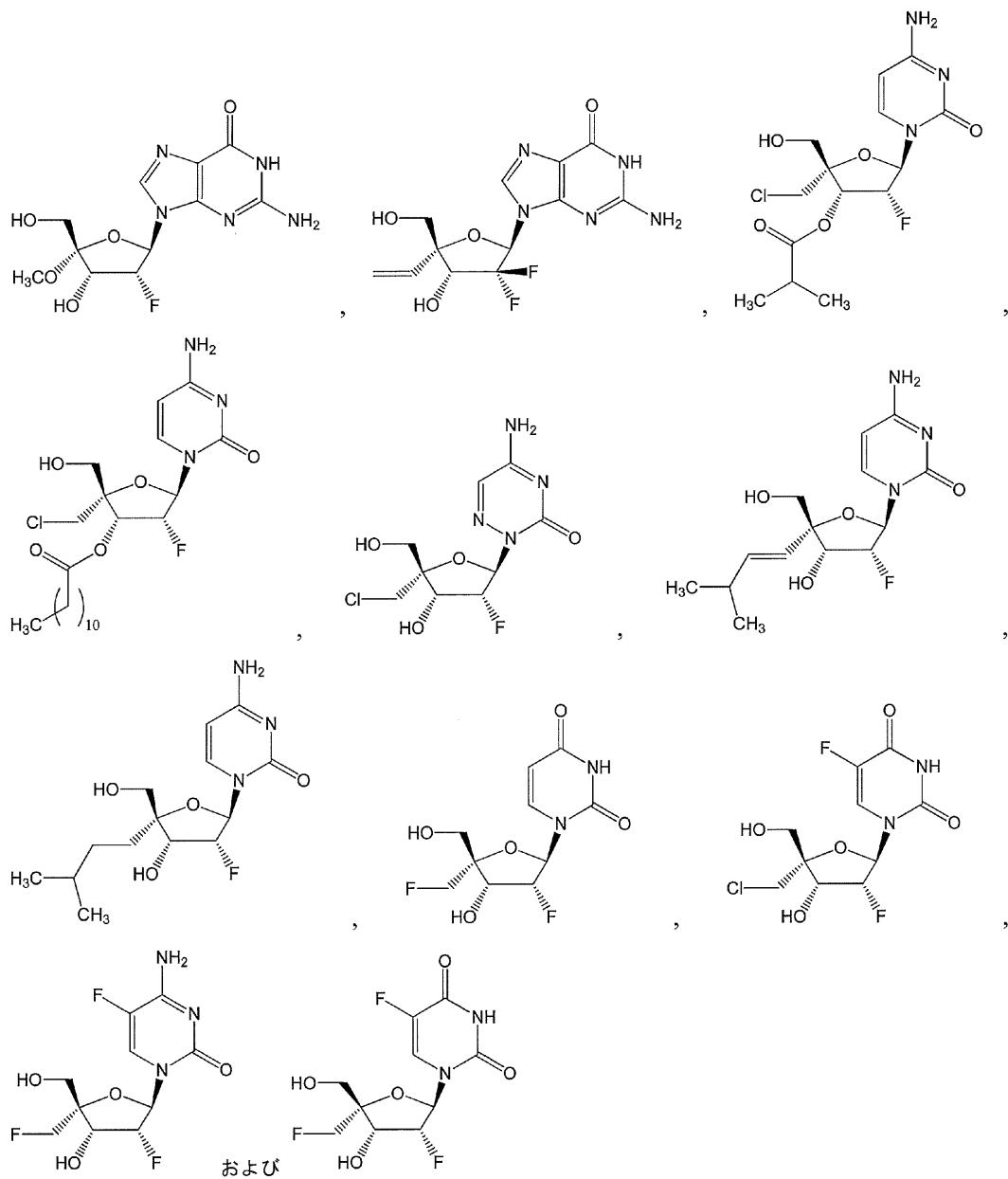
式 (I) の化合物が、

【化 3 6】







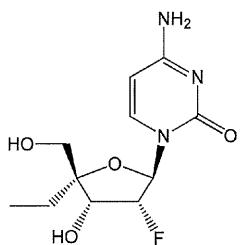


からなる群、または上記のものの医薬的に許容される塩から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 6 7】

式 (I) の化合物が、

【化 3 7】

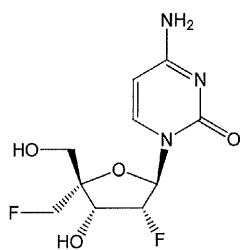


、またはその医薬的に許容される塩から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 6 8】

式 (I) の化合物が、

【化 3 8】

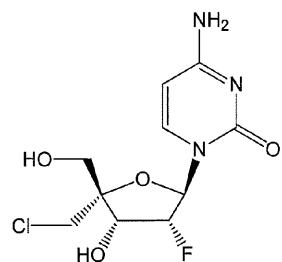


、またはその医薬的に許容される塩から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 6 9】

式 (I) の化合物が、

【化 3 9】

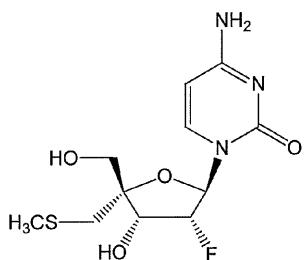


、またはその医薬的に許容される塩から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 7 0】

式 (I) の化合物が、

【化 4 0】

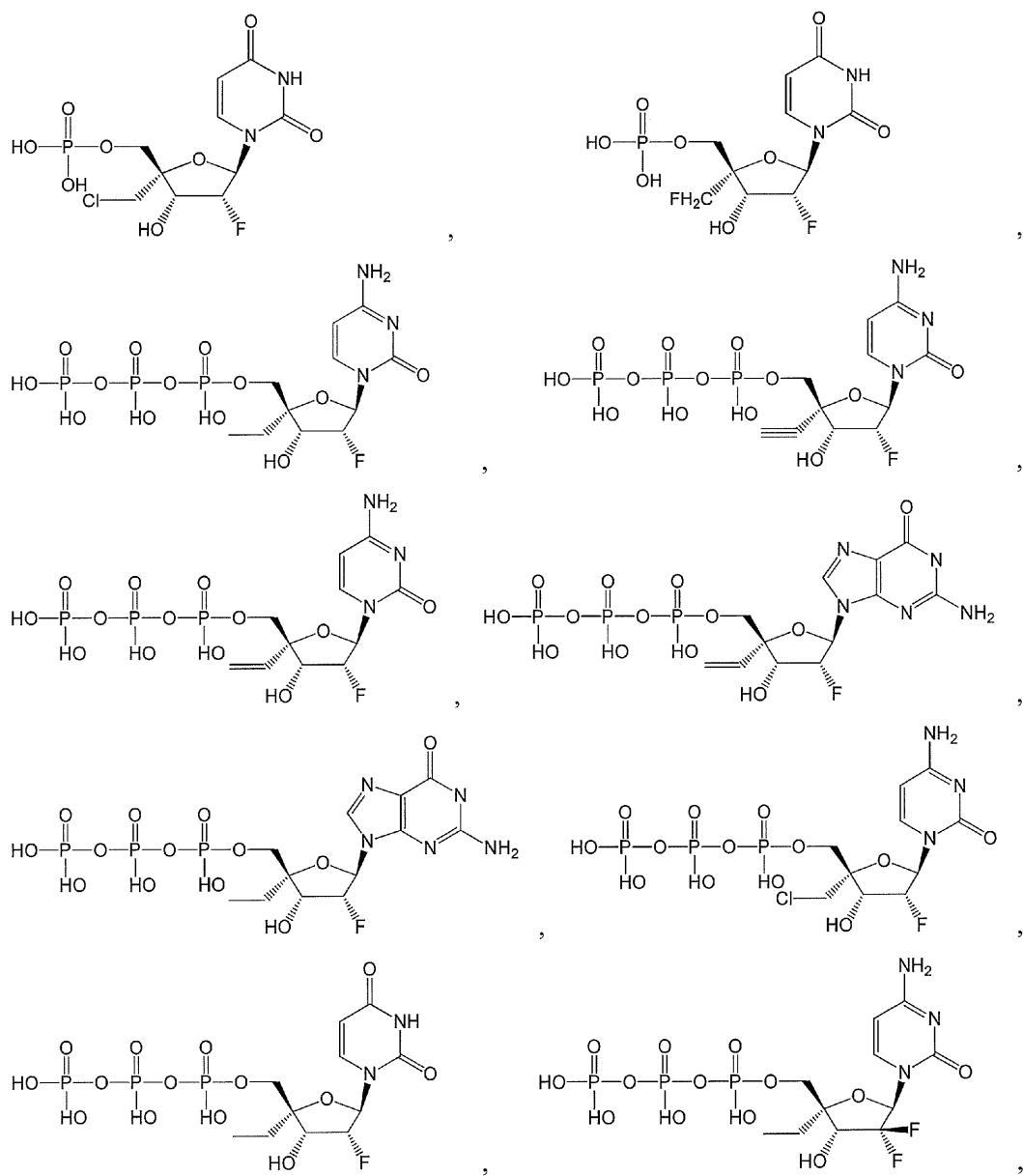


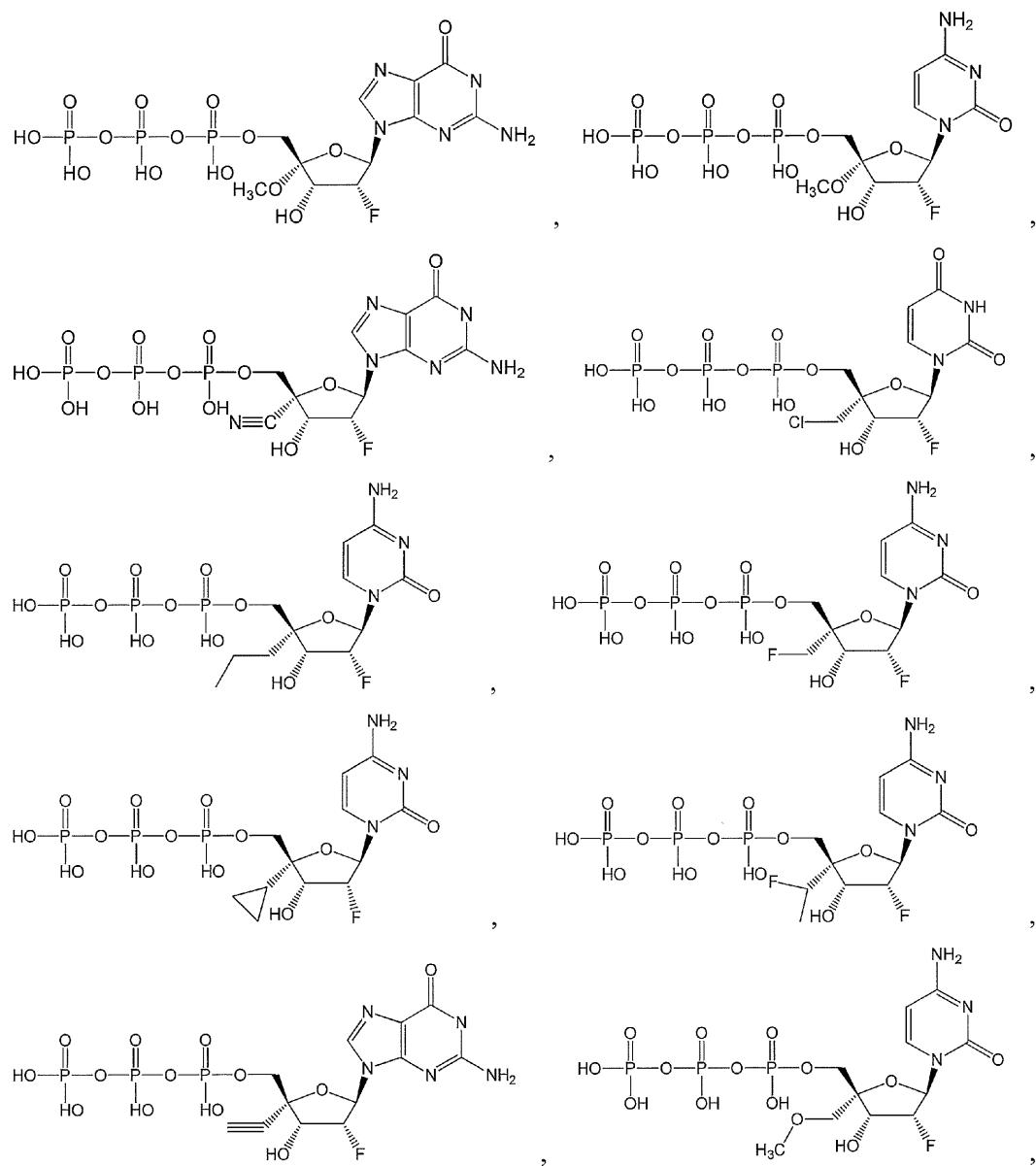
、またはその医薬的に許容される塩から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

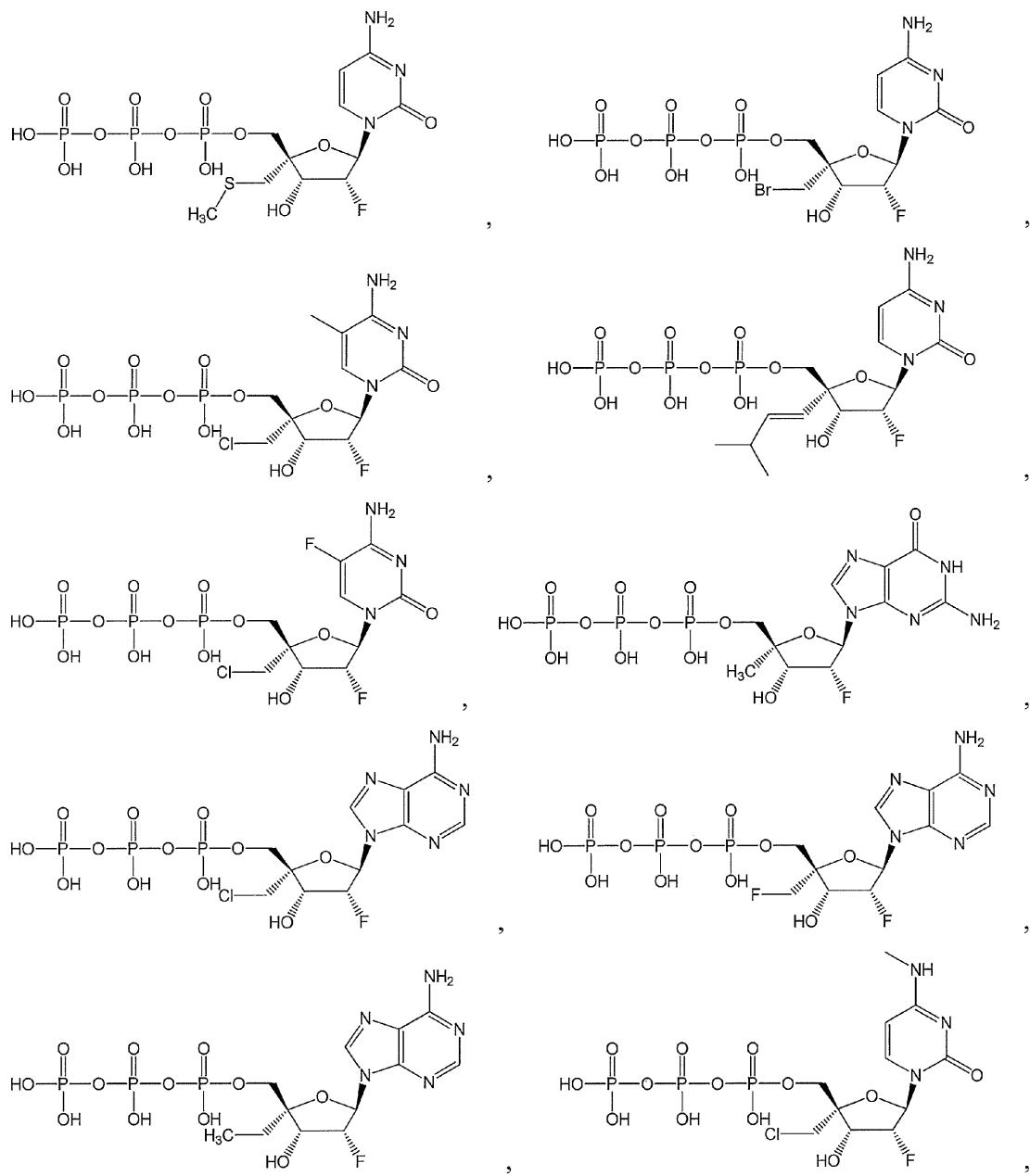
【請求項 7 1】

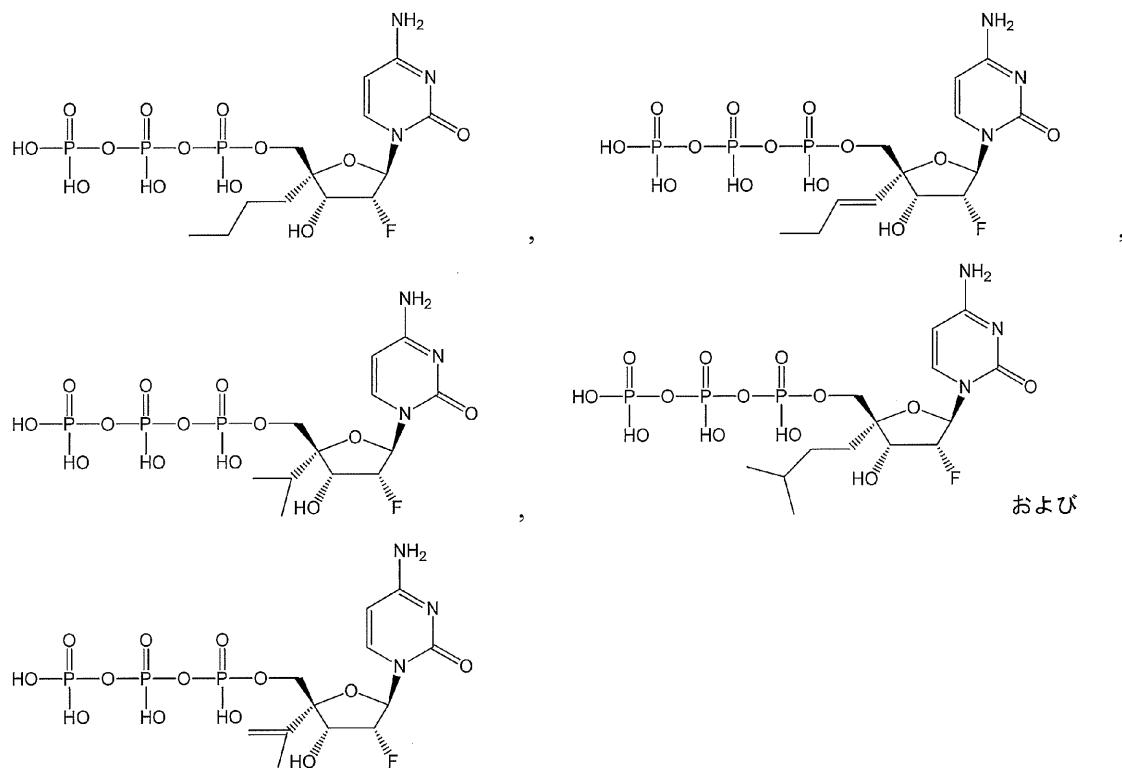
式 (I) の化合物が、

【化 4 1】







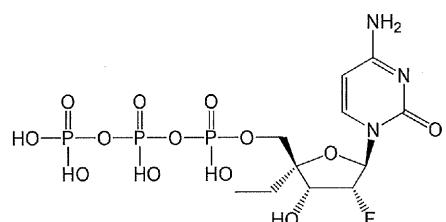


からなる群、または上記のものの医薬的に許容される塩から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 7 2】

式 (I) の化合物が、

【化 4 2】

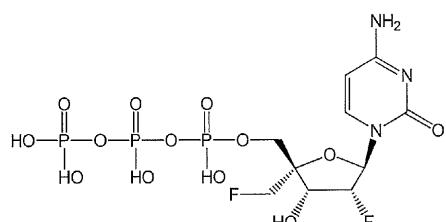


、またはその医薬的に許容される塩から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 7 3】

式 (I) の化合物が、

【化 4 3】

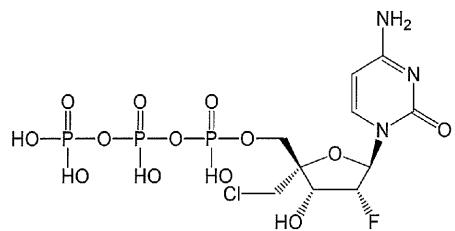


、またはその医薬的に許容される塩から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 7 4】

式 (I) の化合物が、

【化44】

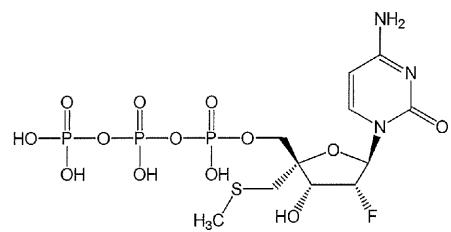


、またはその医薬的に許容される塩から選択される、請求項2に記載の化合物。

【請求項75】

式(I)の化合物が、

【化45】

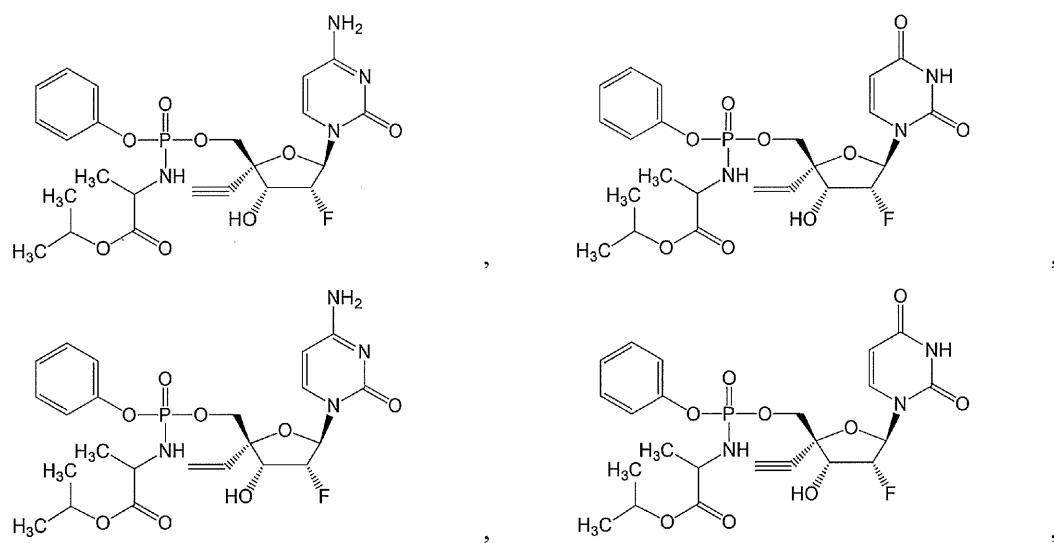


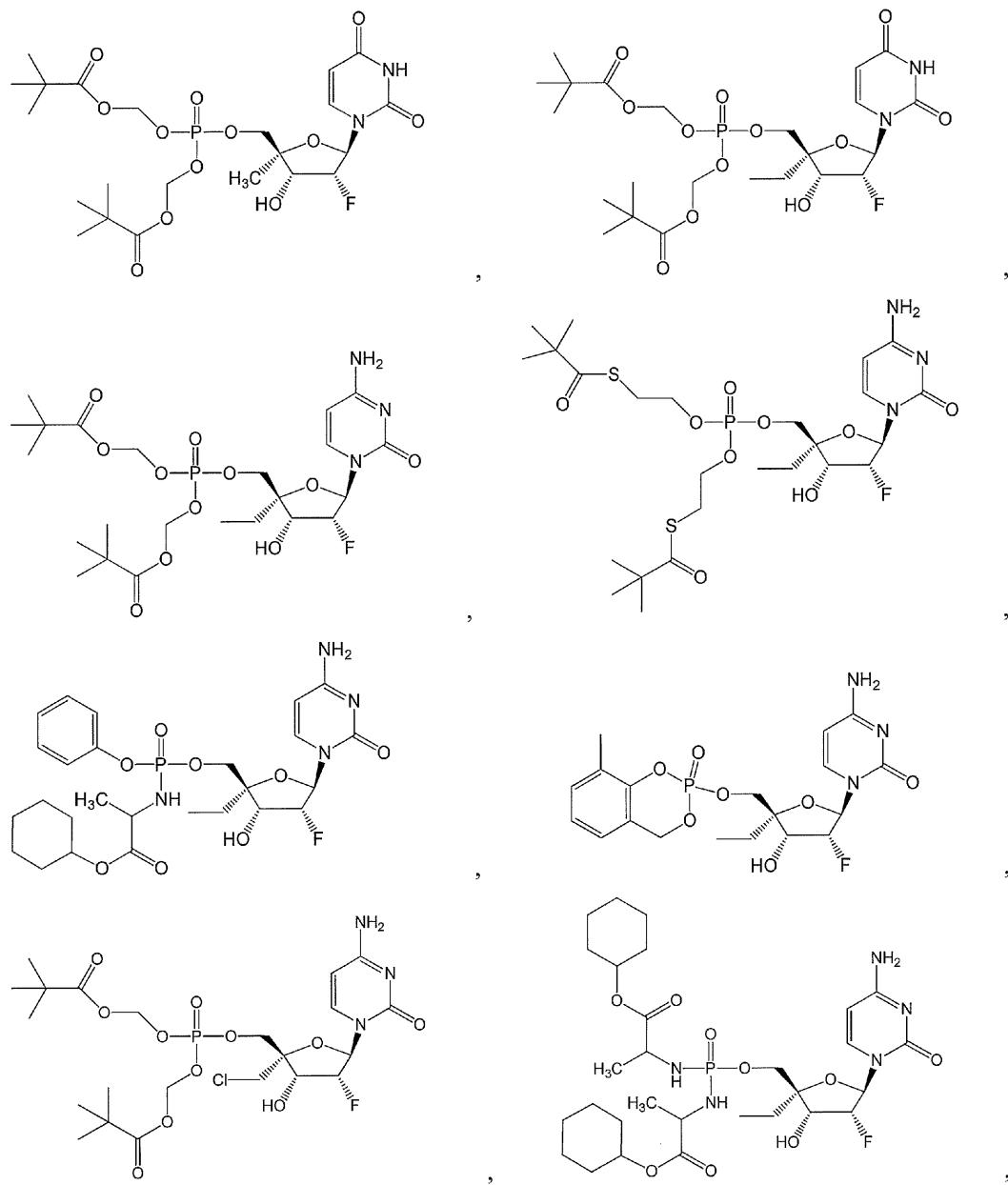
、またはその医薬的に許容される塩から選択される、請求項2に記載の化合物。

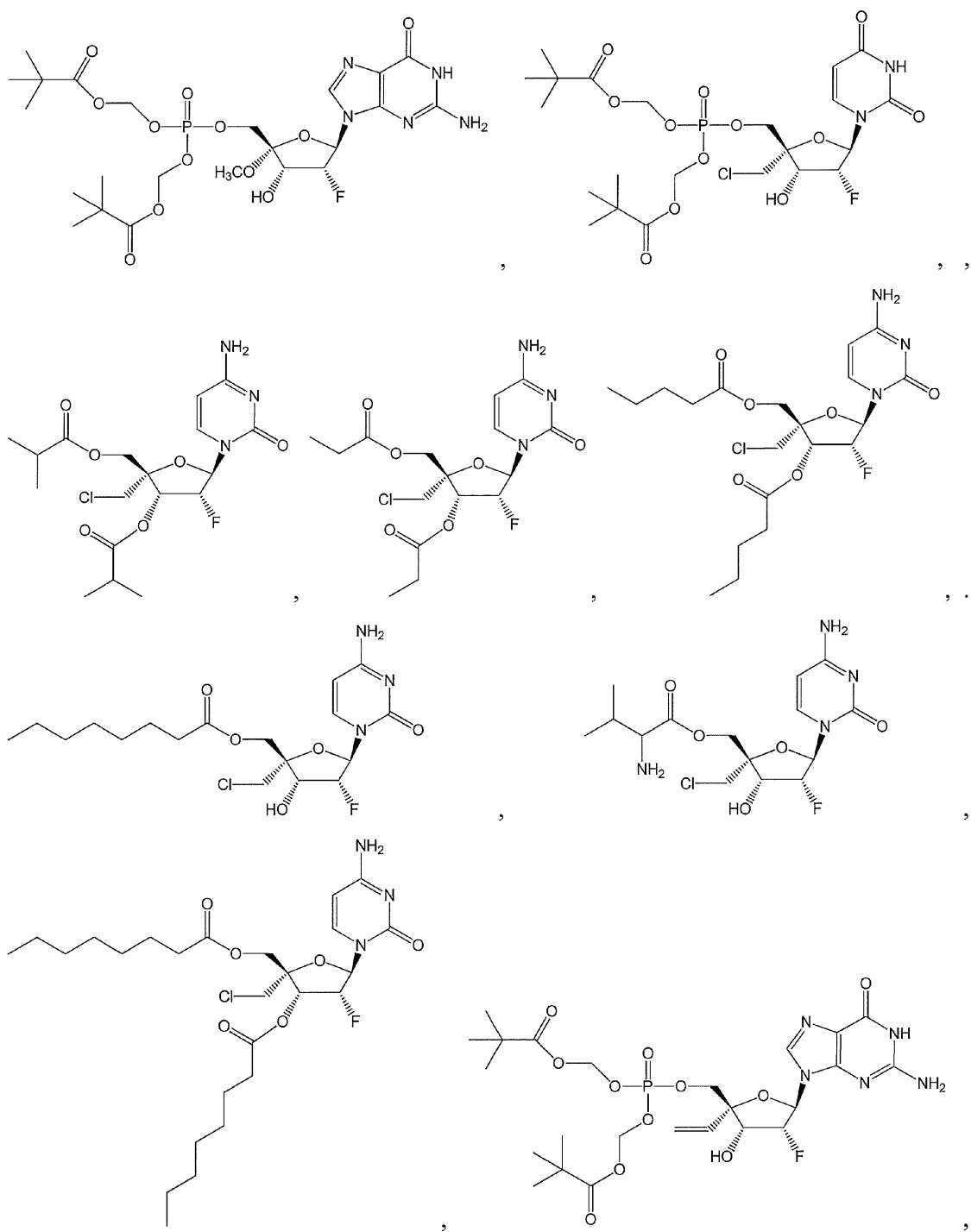
【請求項76】

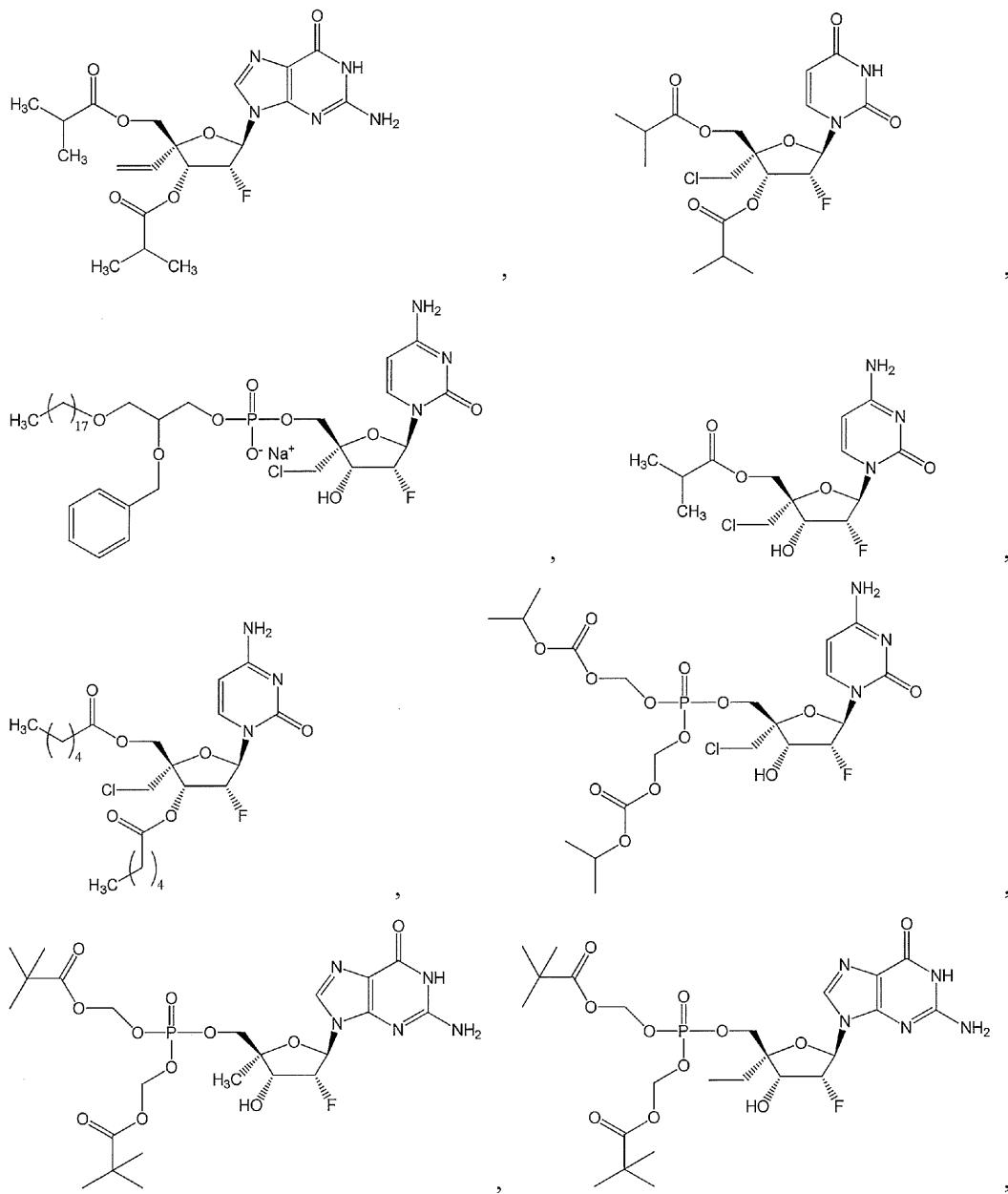
式(I)の化合物が、

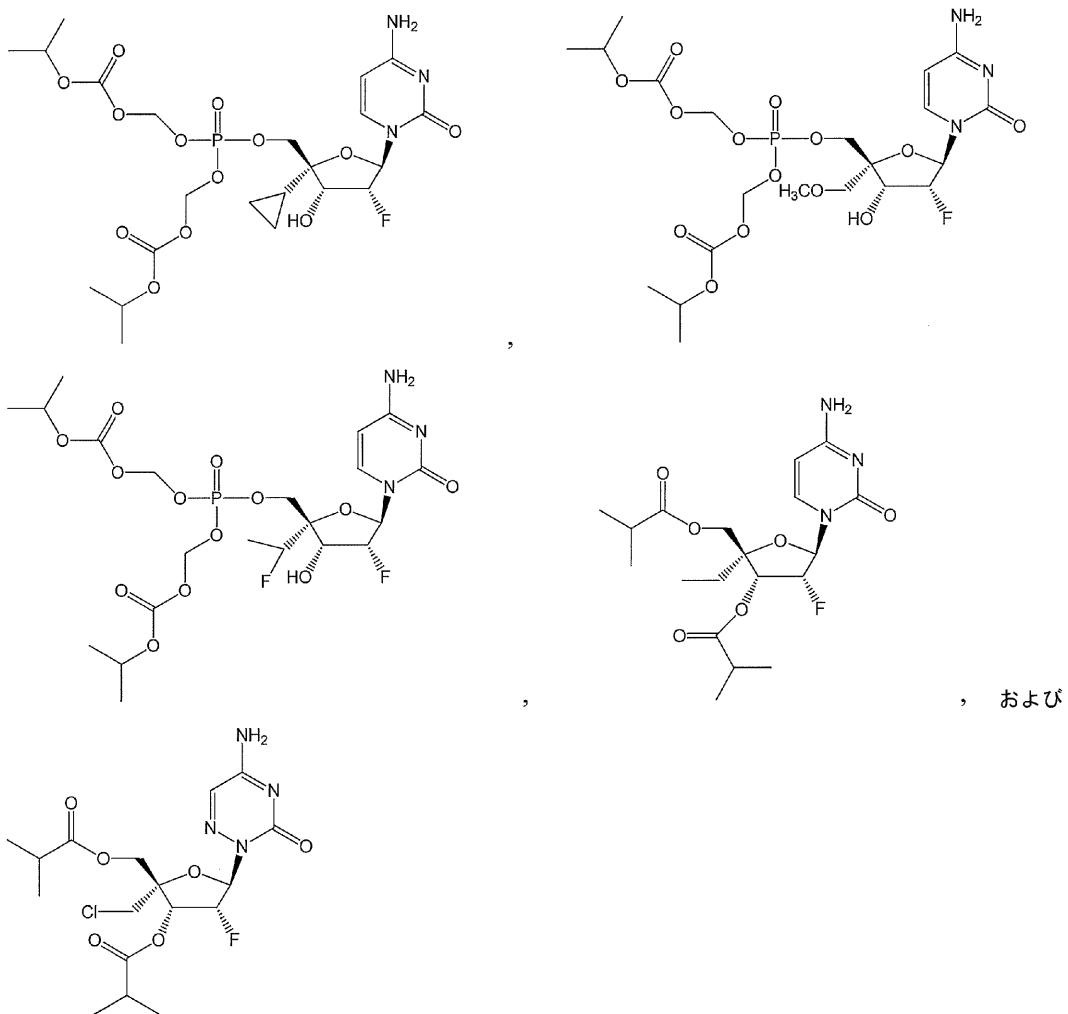
【化46】





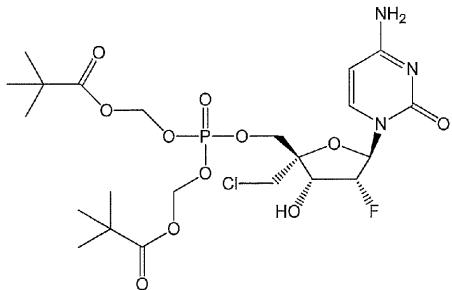






【請求項 7 7】

式 (I) の化合物が、
【化 4 7】

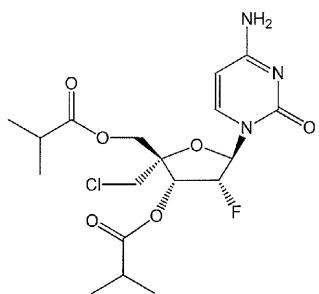


、またはその医薬的に許容される塩から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 7 8】

式 (I) の化合物が、

【化48】

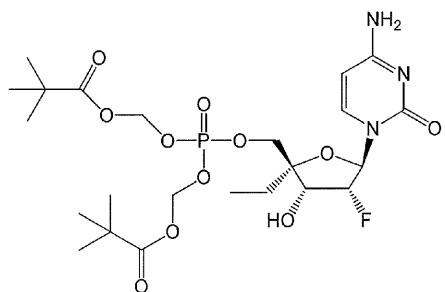


、またはその医薬的に許容される塩から選択される、請求項2に記載の化合物。

【請求項79】

式(I)の化合物が、

【化49】

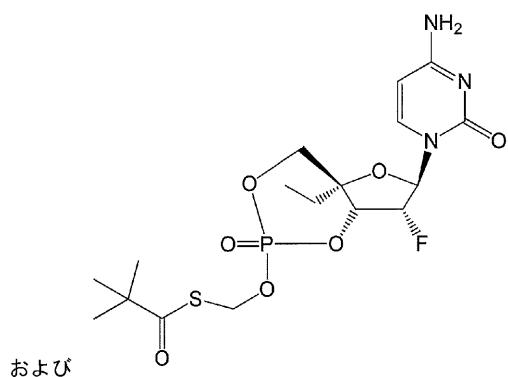
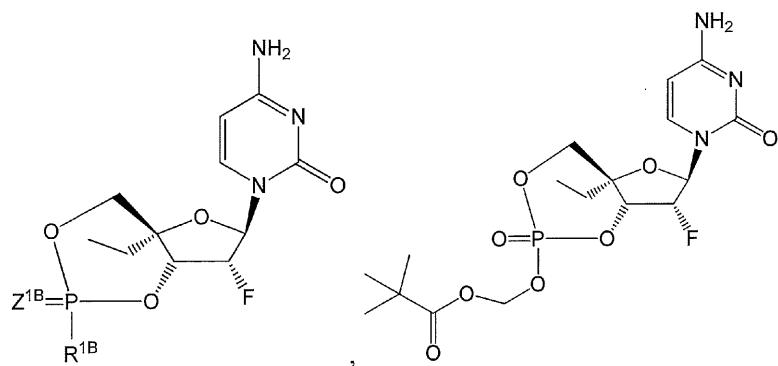


、またはその医薬的に許容される塩から選択される、請求項2に記載の化合物。

【請求項80】

式(II)の化合物が、

【化50】

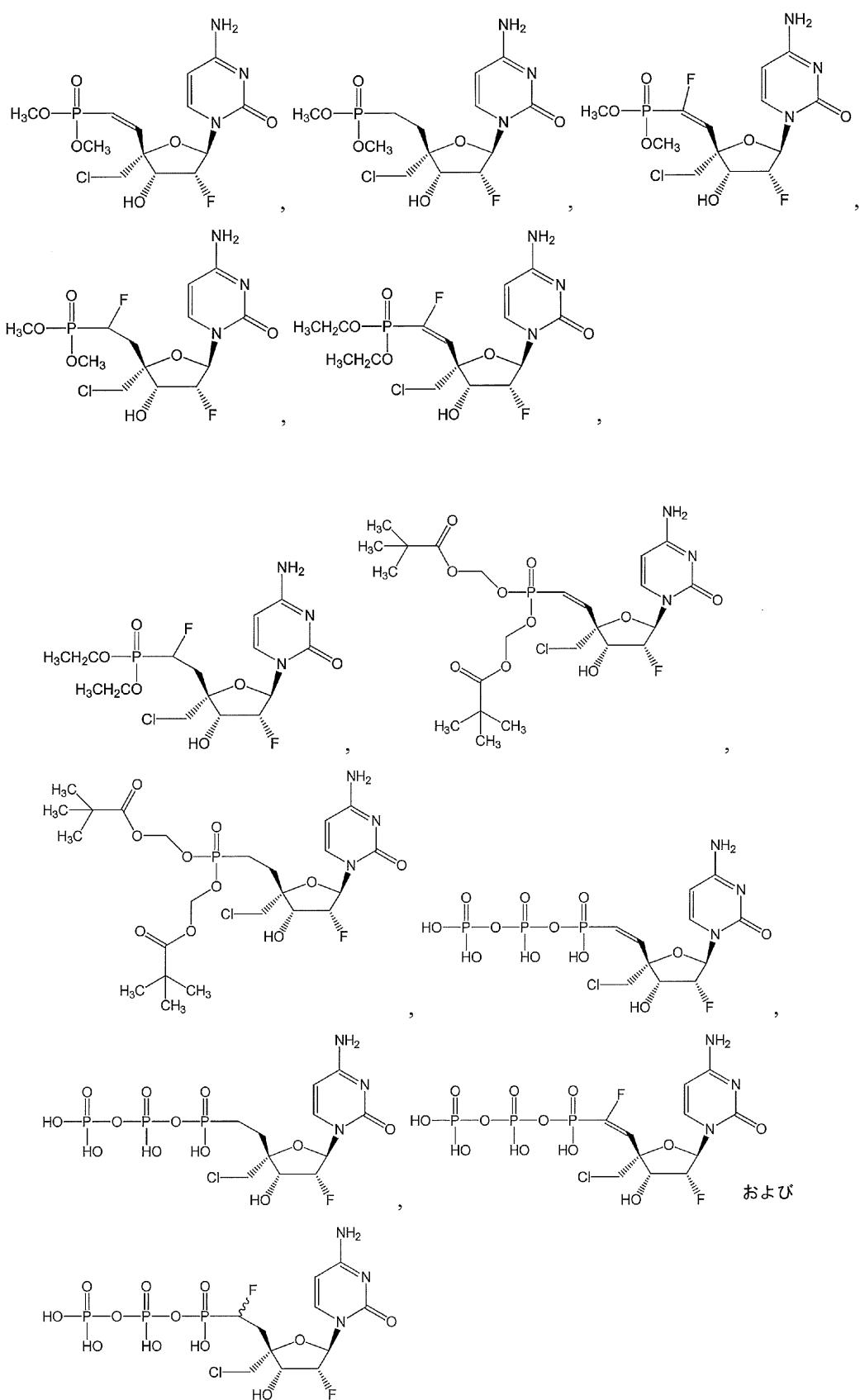


からなる群、またはその医薬的に許容される塩から選択される、請求項59に記載の化合物。

【請求項81】

式 (I I I) の化合物が、

【化 5 1】



からなる群、または上記のものの医薬的に許容される塩から選択される、請求項 60 に記載の化合物。

【請求項 8 2】

ウイルス感染症に罹患していると同定される対象においてパラミクソウイルスによるウイルス感染症およびオルソミクソウイルスによるウイルス感染症から選択されるウイルス感染症を改善または処置するための、請求項1～81のいずれか一項に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩。

【請求項83】

パラミクソウイルスおよびオルソミクソウイルスから選択されるウイルスの複製を阻害するための、請求項1～81のいずれか一項に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩。

【請求項84】

パラミクソウイルスおよびオルソミクソウイルスから選択されるウイルスに感染した細胞と接触させるための、請求項1～81のいずれか一項に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩。

【請求項85】

前記化合物は、1つまたは複数の薬剤と組み合わせて用いられ、ウイルス感染症が、パラミクソウイルスによるウイルス感染症およびオルソミクソウイルスによるウイルス感染症から選択される、1つまたは複数の薬剤と組み合わせたウイルス感染症を改善または処置するための、請求項1～81のいずれか一項に記載の化合物、またはその医薬的に許容される塩。

【請求項86】

前記ウイルス感染症が、パラミクソウイルスによるウイルス感染症である、請求項82～85のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項87】

前記パラミクソウイルスによるウイルス感染症が、ニューモウイルス感染症である、請求項86に記載の化合物。

【請求項88】

前記ニューモウイルスによるウイルス感染症が、ヒト呼吸器合胞体ウイルス (respiratory syncytial virus) 感染症である、請求項87に記載の化合物。

【請求項89】

前記ウイルス感染症が、オルソミクソウイルスによるウイルス感染症である、請求項82～85のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項90】

前記オルソミクソウイルスによるウイルス感染症が、インフルエンザである、請求項89に記載の化合物。

【請求項91】

前記オルソミクソウイルスによるウイルス感染症が、インフルエンザウイルス感染症であり、前記1つまたは複数の薬剤が、アマンタジン、リマンタジン、ザナミビル、オセルタミビル、ペラミビル、ラニナミビル、ファビピラビル、f l u d a s e、A D S - 8 9 0 2、I F N - b、ベラプロストおよびV G X - 3 4 0 0 X からなる群から選択される、請求項85に記載の化合物。

【請求項92】

前記インフルエンザが、インフルエンザA型、インフルエンザB型およびインフルエンザC型からなる群から選択される、請求項90～91のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項93】

前記インフルエンザが、H 1 N 1 およびH 3 N 2 からなる群から選択される、請求項90～91のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項94】

前記パラミクソウイルスによるウイルス感染症が、ヒト呼吸器合胞体ウイルス (respiratory syncytial virus) 感染症であり、前記1つまたは複数の薬剤が、リバビリン、パリビズマブ、R S V - I G I V、A L N - R S V 0 1、B M S - 4 3 3 7 7 1、R F I - 6 4 1、R S V 6 0 4、M D T - 6 3 7、B T A 9 8 8 1、T M C - 3 5 3 1 2 1、M B

X - 3 0 0 、 Y M - 5 3 4 0 3 、 R V 5 6 8 および R S V - F 粒子ワクチンからなる群から選択される、請求項 8 5 に記載の化合物。