

【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18年4月13日(2006.4.13)

【公表番号】特表2005-524628(P2005-524628A)

【公表日】平成17年8月18日(2005.8.18)

【年通号数】公開・登録公報2005-032

【出願番号】特願2003-562142(P2003-562142)

【国際特許分類】

**C 0 7 K 5/023 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/70 (2006.01)**

**A 6 1 P 1/16 (2006.01)**

**A 6 1 P 31/14 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

**C 0 7 K 7/02 (2006.01)**

**C 1 2 N 9/99 (2006.01)**

**A 6 1 K 38/00 (2006.01)**

**A 6 1 K 38/21 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 K 5/023 Z N A

A 6 1 K 31/70

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 31/14

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 K 7/02

C 1 2 N 9/99

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 37/66 G

【手続補正書】

【提出日】平成18年2月23日(2006.2.23)

【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

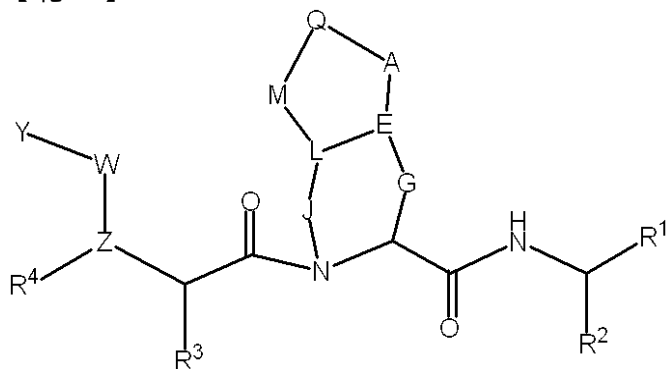
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

化合物、または該化合物の鏡像異性体、立体異性体、回轉異性体、互変異性体、ラセミ体もしくはプロドラッグ、または該化合物もしくは該プロドラッグの医薬上許容される塩もしくは溶媒和物であって、該化合物は式I：

## 【化 1】



式 I

[ 式中、

Y は、以下からなる群より選択され：アルキル、アルキル - アリール、ヘテロアルキル、ヘテロアリール、アリール - ヘテロアリール、アルキル - ヘテロアリール、シクロアルキル、アルキルオキシ、アルキル - アリールオキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、シクロアルキルオキシ、アルキルアミノ、アリールアミノ、アルキル - アリールアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、シクロアルキルアミノおよびヘテロシクロアルキルアミノ、ただし Y は所望により  $X^{11}$  または  $X^{12}$  で置換されてもよく；

$X^{11}$  は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキル - アルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、アリール、アルキルアリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、アルキルヘテロアリールまたはヘテロアリールアルキルであり、ただし  $X^{11}$  はさらに所望により  $X^{12}$  で置換されてもよく；

$X^{12}$  は、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、チオ、アルキルチオ、アリールチオ、アミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アルキルスルホンアミド、アリールスルホンアミド、カルボキシ、カルボアルコキシ、カルボキシアミド、アルコキシカルボニルアミノ、アルコキシカルボニルオキシ、アルキルウレイド、アリールウレイド、ハロゲン、シアノまたはニトロであり、ただし上記アルキル、アルコキシおよびアリールはさらに所望により  $X^{12}$  から独立して選択される部分で置換されてもよく；

$R^1$  は、 $COOR^8$  であり；ここで  $R^5$  は、 $COOR^8$ 、 $CONR^9R^{10}$ 、 $CF_3$ 、 $C_2F_5$ 、 $C_3F_7$ 、 $CF_2R^6$  または  $R^6$  であり、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $R^9$  および  $R^{10}$  以下からなる群より独立して選択され：H、アルキル、アリール、ヘテロアルキル、ヘテロアリール、シクロアルキル、シクロアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、 $[CH(R^{1'})]_pCOOR^{11}$ 、 $[CH(R^{1'})]_pCONR^{12}R^{13}$ 、 $[CH(R^{1'})]_pSO_2R^{11}$ 、 $[CH(R^{1'})]_pCOR^{11}$ 、 $[CH(R^{1'})]_pCH(OH)R^{11}$ 、 $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})COOR^{11}$ 、 $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONR^{12}R^{13}$ 、 $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})R'$ 、 $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONHCH(R^{3'})COOR^{11}$ 、 $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONHCH(R^{3'})CONR^{12}R^{13}$ 、 $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONHCH(R^{3'})CONHCH(R^{4'})COOR^{11}$ 、 $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONHCH(R^{3'})CONHCH(R^{4'})CONR^{12}R^{13}$ 、 $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONHCH(R^{3'})CONHCH(R^{4'})CONHCH(R^{5'})CONR^{12}R^{13}$ 、ここで  $R^{1'}$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、および  $R'$  は独立して以下からなる群より選択される：H、アルキル、アリール、ヘテロアルキル、ヘテロアリール、シクロアルキル、アルキル - アリ

ール、アルキル - ヘテロアリール、アリール - アルキルおよびヘテロアルキル；

Z は、O、N、CHまたはCRから選択され；

Wは存在してもよくまたは存在しなくてもよく、Wが存在する場合、Wは、C=O、C=S、C(=N-CN)またはSO<sub>2</sub>から選択され；

Qは存在してもよくまたは存在しなくてもよく、Qが存在する場合、Qは、CH、N、P、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>、(CHR)<sub>p</sub>、(CRR')<sub>p</sub>、O、NR、SまたはSO<sub>2</sub>であり；Qが存在しない場合、Mは存在してもよくまたは存在しなくてもよく；QおよびMが存在しない場合、AはLに直接結合しており；

Aは、O、CH<sub>2</sub>、(CHR)<sub>p</sub>、(CHR-CHR')<sub>p</sub>、(CRR')<sub>p</sub>、NR、SまたはSO<sub>2</sub>であり；

Eは、CH、N、CR、またはA、LもしくはGに向けての二重結合であり；

Gは存在してもよくまたは存在しなくてもよく、Gが存在する場合、Gは、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>、(CHR)<sub>p</sub>または(CRR')<sub>p</sub>であり；Gが存在しない場合、Jは存在し、Eは、Gが結合するように式I中の炭素原子に直接結合しており；

Jは存在してもよくまたは存在しなくてもよく、Jが存在する場合、Jは、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>、(CHR)<sub>p</sub>または(CRR')<sub>p</sub>、SO<sub>2</sub>、NH、NRまたはOであり；Jが存在しない場合、Gは存在し、Eは、Jに結合するように式I中に示されるNに直接結合しており；

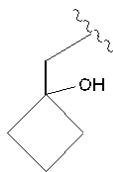
Lは存在してもよくまたは存在しなくてもよく、Lが存在する場合、Lは、CH、CR、O、SまたはNRであり；Lが存在しない場合、Mは存在してもよくまたは存在しなくてもよく、Mが存在し、Lが存在しない場合、MはEに直接独立して結合し、JはEに直接独立して結合し；

Mは存在してもよくまたは存在しなくてもよく、Mが存在する場合、MはO、NR、S、SO<sub>2</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>、(CHR)<sub>p</sub>、(CHR-CHR')<sub>p</sub>または(CRR')<sub>p</sub>であり；

pは0～6の数であり；そして

R、R'、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は、独立して、H；C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>アルキル；C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>アルケニル；C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>シクロアルキル；C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキル、アルコキシ、アリーロキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アミノ、アミド、エステル、カルボン酸、カルバメート、尿素、ケトン、アルデヒド、シアノ、ニトロ、ハロゲン；(シクロアルキル)アルキルおよび(ヘテロシクロアルキル)アルキル(ここで、該シクロアルキルは3～8個の炭素原子および0～6個の酸素、窒素、硫黄またはリン原子を含み、該アルキルは1～6個の炭素原子を含む)；アリール；ヘテロアリール；アルキル-アリール；アルキル-ヘテロアリール；およびさらにR<sub>2</sub>に関して基

【化2】



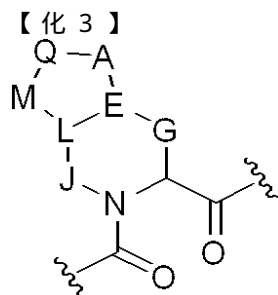
からなる群より選択され；

ここで、アルキル、ヘテロアルキル、アルケニル、ヘテロアルケニル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキルおよびヘテロシクロアルキル部分は、所望により化学的に適切に置換されてもよく、「置換」なる語は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アルキル、シクロアルキル、複素環、ハロゲン、ヒドロキシ、チオ、アルコキシ、アリーロキシ、アルキルチオ、アリールチオ、アミノ(R<sub>2</sub>について以外)、アミド、エステル、カルボン酸、カルバメート、尿素、ケトン、アルデヒド、シアノ、ニトロ、スルホンアミド、スルホキシド、スルホン、スルホニル尿素、ヒドラジドおよびヒドロキサメートからなる群より選択される1個以上の部分での、所望による化学的に適切な置換を

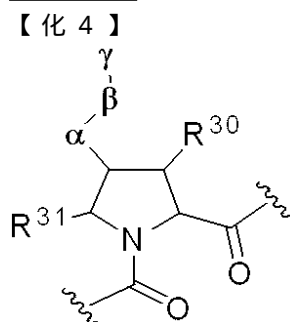
いい；

さらにここで、式 I 中の単位 N - C - G - E - L - J - N は、5 員環式環構造または 6 員環式環構造のいずれかを表し、ただし該単位 N - C - G - E - L - J - N が 5 員環式環構造を表すか、または N、C、G、E、L、J、N、A、Q および M を含む式 I 中の二環式環構造が 5 員環式環構造を表す場合、該 5 員環式環構造は環式環の一部としてカルボニル基を欠き、

ただし式 I において W が C = O であり、部分：



が構造：



ここで、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、独立して、H、アルキル、アルケニル、アリール、アラキル、アラケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアリールアルキルであり、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は、所望により、アルキル、アリール、アラキル、アルコキシ、アリールオキシ、アラコキシ、シクロアルキル、シクロアルコキシ、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルオキシ、ヘテロシクリルアルキル、ケト、ヒドロキシ、アミノ、アルキルアミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ、アラカノイルアミノ、カルボキシ、カルボキシアルキル、カルボキシアミドアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、ホルミル、アセチル、スルホニルまたはスルホンアミドから選択される 1 ~ 3 個の  $R^{33}$  置換基で置換され、 $R^{33}$  置換基は、所望により、アルキル、アリール、アラキル、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルオキシ、ケト、ヒドロキシ、アミノ、アルカノイルアミノ、アロイルアミノ、カルボキシ、カルボキシアルキル、カルボキシアミドアルキル、ハロ、シアノ、ニトロ、ホルミル、スルホニルまたはスルホンアミドで置換され得、

は、結合、 $-C(H)(R^{34})-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$  または  $-N(R^{35})-$  であり、 $R^{34}$  は、H、アルキル、アルケニル、アリール、アラキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアラキルであり、そして所望により 1 ~ 3 個の  $R^{33}$  置換基で置換され、 $R^{35}$  は、H、アルキル、アリール、アラキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラカノイル、 $-C(O)R^{36}$ 、 $-SO_2R^{36}$  またはカルボキシアミドであり、そして所望により 1 ~ 3 個の  $R^{33}$  置換基で置換されるか、または  $R^{35}$  および はそれらが結合する原子と一緒に、所望により 1 ~ 3 個の  $R^{33}$  置換基で置換された窒素含有単または二環式環系を形成し、 $R^{36}$  は、アルキル、アリール、アラキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルア

ルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアラルキルであり；

は、結合、 $-CH_2-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)C(O)-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、または $-S(O)R^{3'4'}$ であり；

は、アルキル、アルケニル、アリール、アラルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキル、 $-OR^{3'7'}$ または $-N(R^{3'7'})_2$ であり、ここで任意の炭素原子は所望により $R^{3'3'}$ で置換され、 $R^{3'7'}$ は、独立して、H、アルキル、アルケニル、アリール、アラルキル、アラルケニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロシクリルアルケニル、ヘテロアリールまたはヘテロアラルキルであり、 $R^{3'7'}$ の任意の炭素は所望により $R^{3'3'}$ で置換される

を表す場合、

$R^{1'0'}$ はHであり、 $R^{8'}$ および $R^{9'}$ は独立して、 $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})COOR^{1'1'}$ 、 $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONR^{1'2'}R^{1'3'}$ 、 $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})R'$ 、 $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONHCH(R^{3'})COOR^{1'1'}$ 、 $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONHCH(R^{3'})CONR^{1'2'}R^{1'3'}$ 、 $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONHCH(R^{3'})CONHCH(R^{4'})COOR^{1'1'}$ 、 $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONHCH(R^{3'})CONHCH(R^{4'})CONR^{1'2'}R^{1'3'}$ 、 $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONHCH(R^{3'})CONHCH(R^{4'})CONHCH(R^{5'})COOR^{1'1'}$ および $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONHCH(R^{3'})CONHCH(R^{4'})CONHCH(R^{5'})CONR^{1'2'}R^{1'3'}$ からなる群より選択され；

ただしP2位のプロリンは修飾されており、ここでP2位はケトアミド基から2番目のアミノ酸に対応する位置である]で示される一般構造を有する化合物。

#### 【請求項2】

$R^{1'}$ が $-C(O)C(O)NR^{9'}R^{1'0'}$ であり；

$R^{9'}$ がHであり；

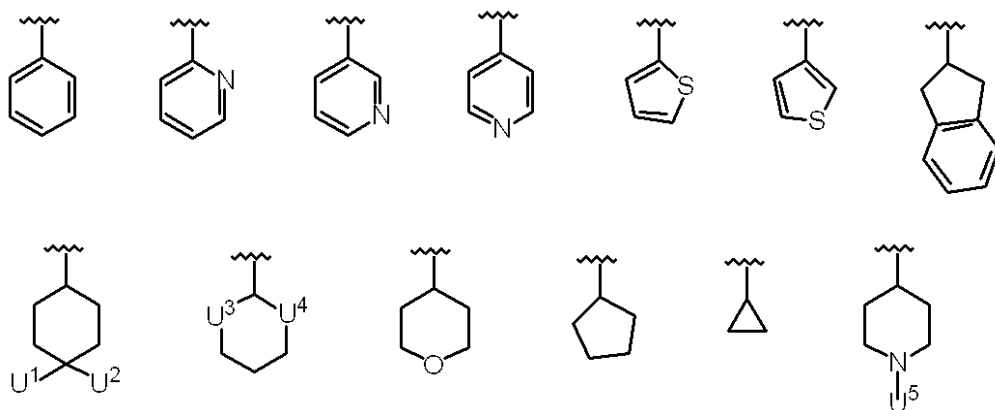
$R^{1'0'}$ が、H、 $-R^{1'4'}$ 、 $CH(R^{1'})COOR^{1'1'}$ 、 $CH(R^{1'})CH(R^{1'})COOR^{1'1'}$ 、 $CH(R^{1'})CONR^{1'2'}R^{1'3'}$ 、 $CH(R^{1'})CH(R^{1'})SO_2R^{1'1'}$ 、 $CH(R^{1'})CH(R^{1'})SO_2NR^{1'2'}R^{1'3'}$ 、 $CH(R^{1'})CH(R^{1'})COR^{1'1'}$ 、 $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})COOR^{1'1'}$ 、 $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})CONR^{1'2'}R^{1'3'}$ または $CH(R^{1'})CONHCH(R^{2'})(R')$ であり、 $R^{1'4'}$ が、H、アルキル、アリール、ヘテロアルキル、ヘテロアリール、シクロアルキル、アルキル-アリール、アルキル-ヘテロアリール、アリール-アルキル、アルケニル、アルキニルまたはヘテロアラルキルであり、 $R^{1'}$ がHまたはアルキルであり、 $R^{2'}$ が、フェニル、置換フェニル、ヘテロ原子置換フェニル、チオフェニル、シクロアルキル、ピペリジルまたはピリジルであり、

$R^{1'1'}$ が、H、メチル、エチル、アリル、tert-ブチル、ベンジル、-メチルベンジル、-ジメチルベンジル、1-メチルシクロプロピルまたは1-メチルシクロペンチルであり；

$R'$ がヒドロキシメチルまたは $CH_2CONR^{1'2'}R^{1'3'}$ であり；

$R^{2'}$ が、独立して、以下からなる群より選択され；

## 【化 5】



## [ 式中、

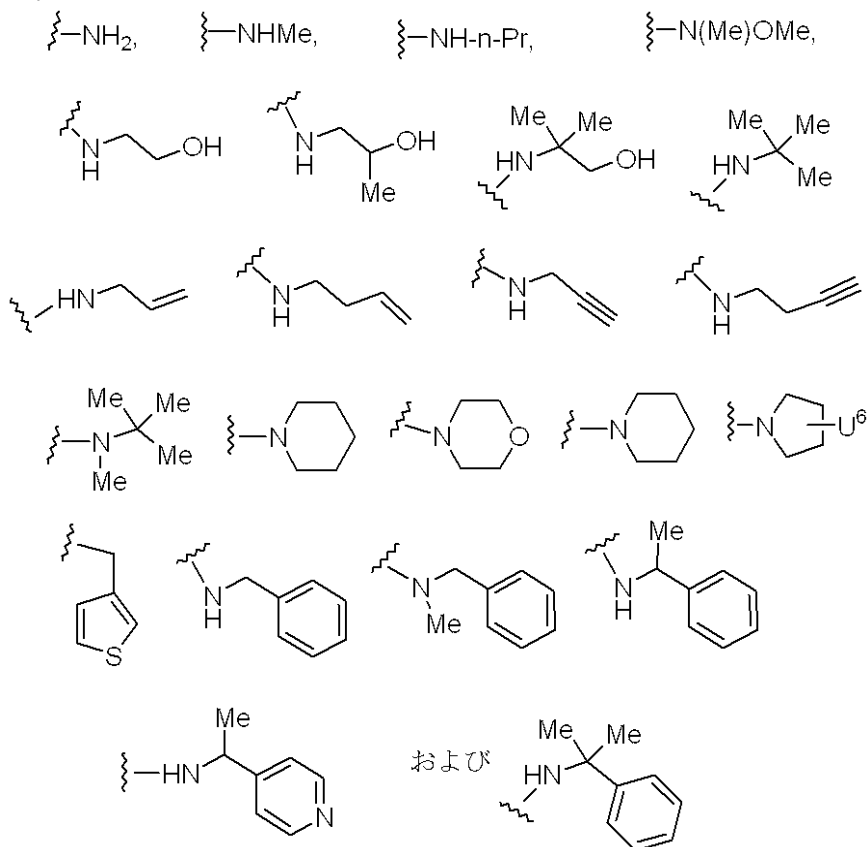
$U^1$  および  $U^2$  は、同じでもよくまたは異なってもよく、 $H$ 、 $F$ 、 $CH_2COOH$ 、 $CH_2COOMe$ 、 $CH_2CONH_2$ 、 $CH_2CONHMe$ 、 $CH_2CONMe_2$ 、アジド、アミノ、ヒドロキシル、置換アミノ、置換ヒドロキシルから選択され；

$U^3$  および  $U^4$  は、同じでもよくまたは異なってもよく、 $O$  および  $S$  から選択され；

$U^5$  は、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、ヘテロアルキルスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアルキルカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アルコキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、ヘテロアリールオキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、アリールアミノカルボニル、ヘテロアリールアミノカルボニルまたはそれらの組み合わせからなる部分より選択される]；

$NR^{12}R^{13}$  が、以下からなる群より選択され：

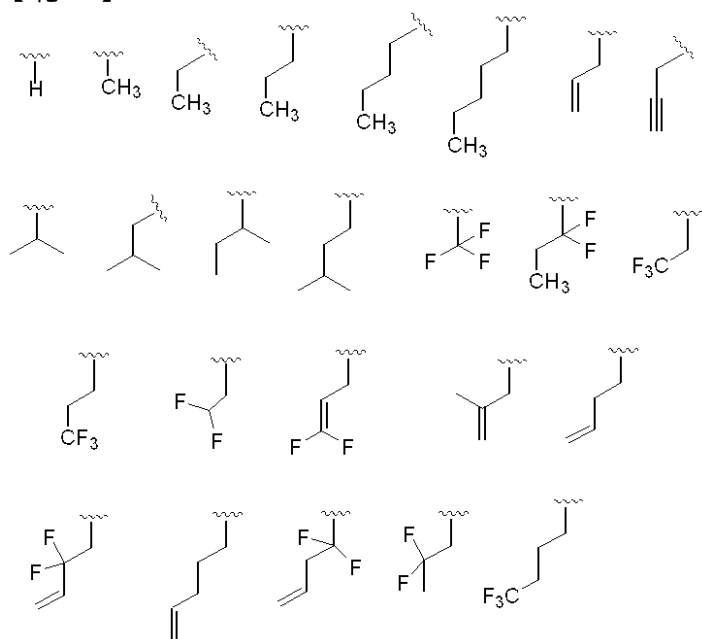
## 【化 6】



[ 式中、 $U^6$  は、 $H$ 、 $OH$ または $CH_2OH$ である ]、そして

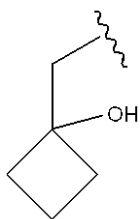
【請求項 3】

【化 7】

[illegible]

および

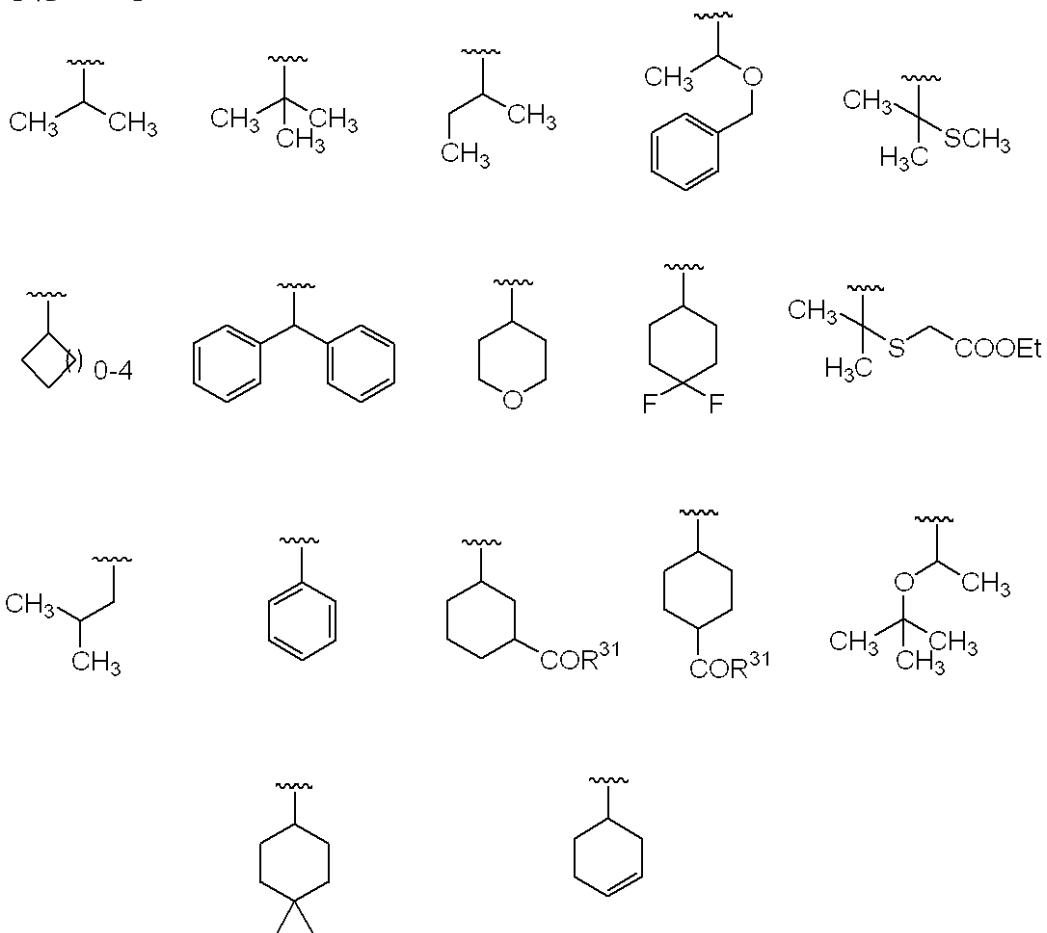
## 【化 9】



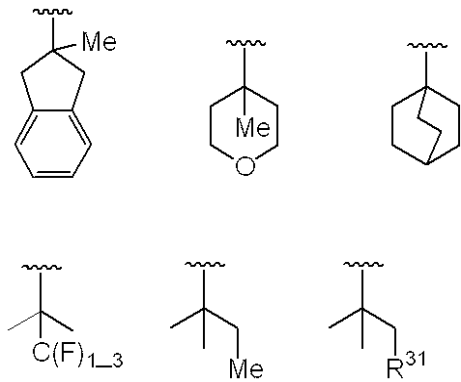
## 【請求項 4】

$R^3$  が以下からなる群より選択される、請求項 2 記載の化合物：

## 【化 10】



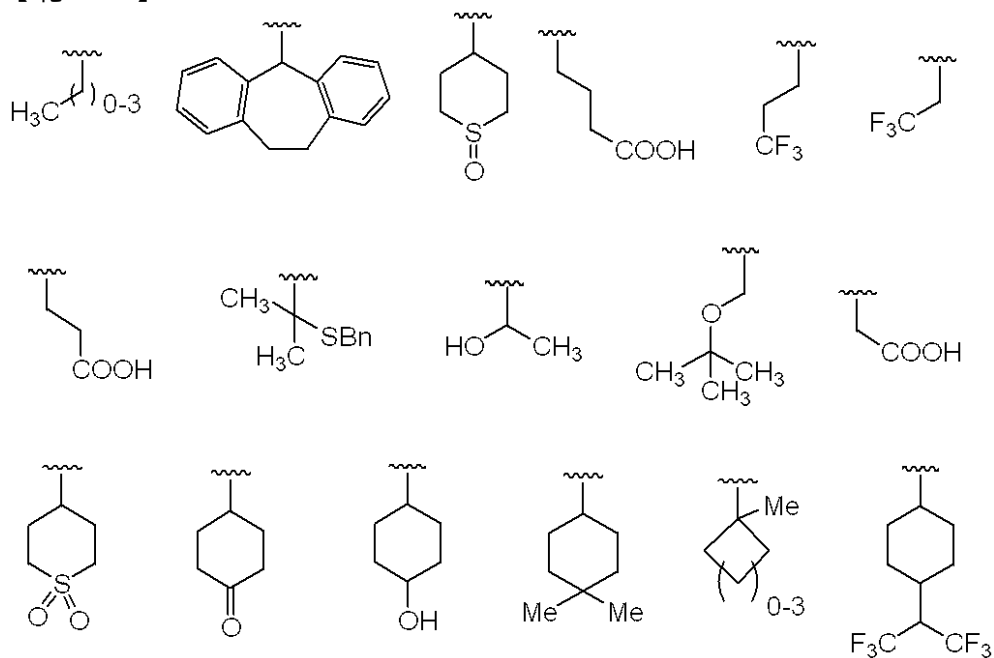
## 【化 11】



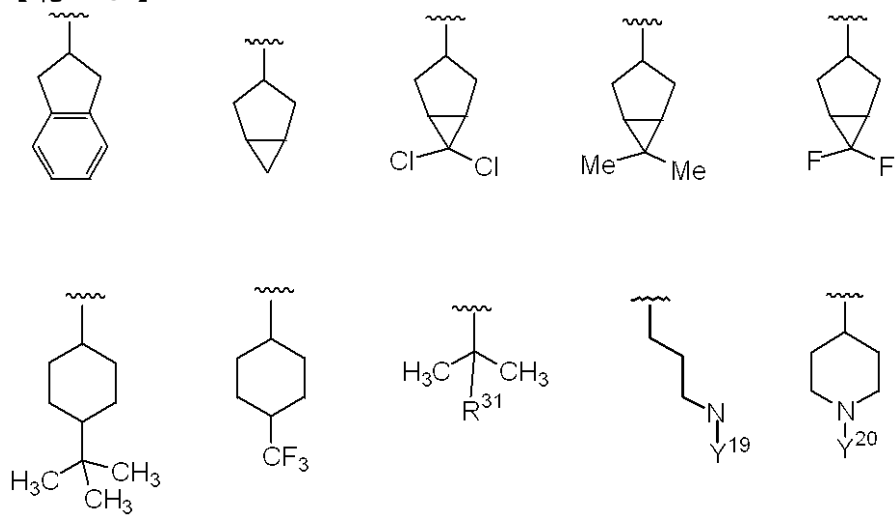
[ 式中、 $R^{51} = H$ 、 $COCH_3$ 、 $COOtBu$ または $CONHtBu$ である ] ；



## 【化 1 2】



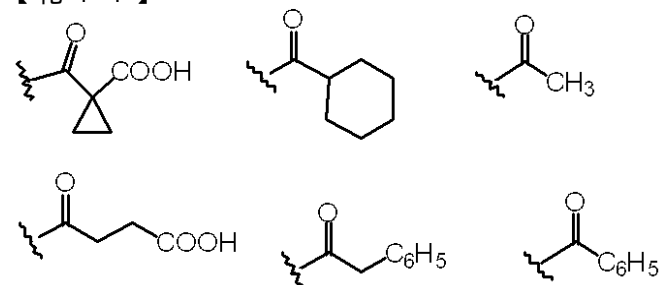
## 【化 1 3】



[ 式中、 $R^{31} = OH$  または  $O$ -アルキルであり；

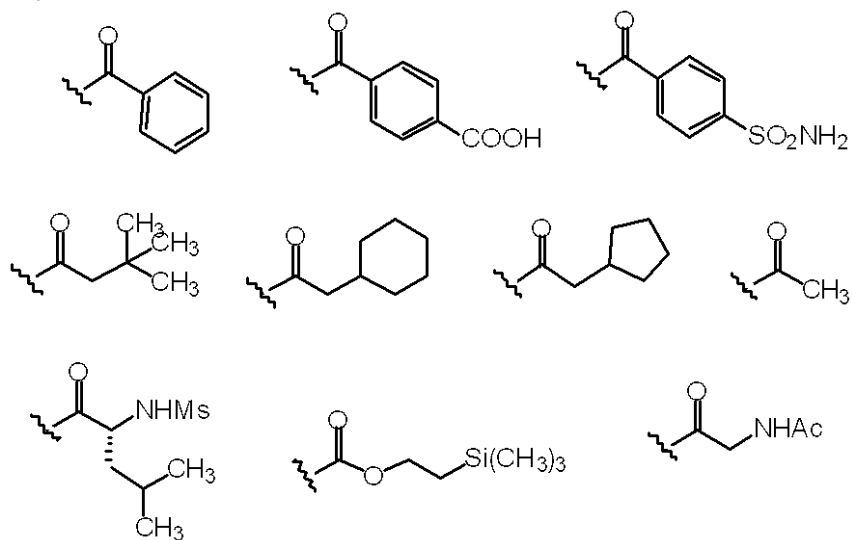
$Y^{19}$  は以下の部分から選択され：

## 【化 1 4】



$Y^{20}$  は以下の部分から選択される：

## 【化 1 5】

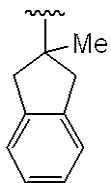


]。

## 【請求項 5】

R<sup>3</sup> が以下である、請求項 4 記載の化合物：

## 【化 1 6】



## 【請求項 6】

Z が N であり、R<sup>4</sup> が H である、請求項 4 記載の化合物。

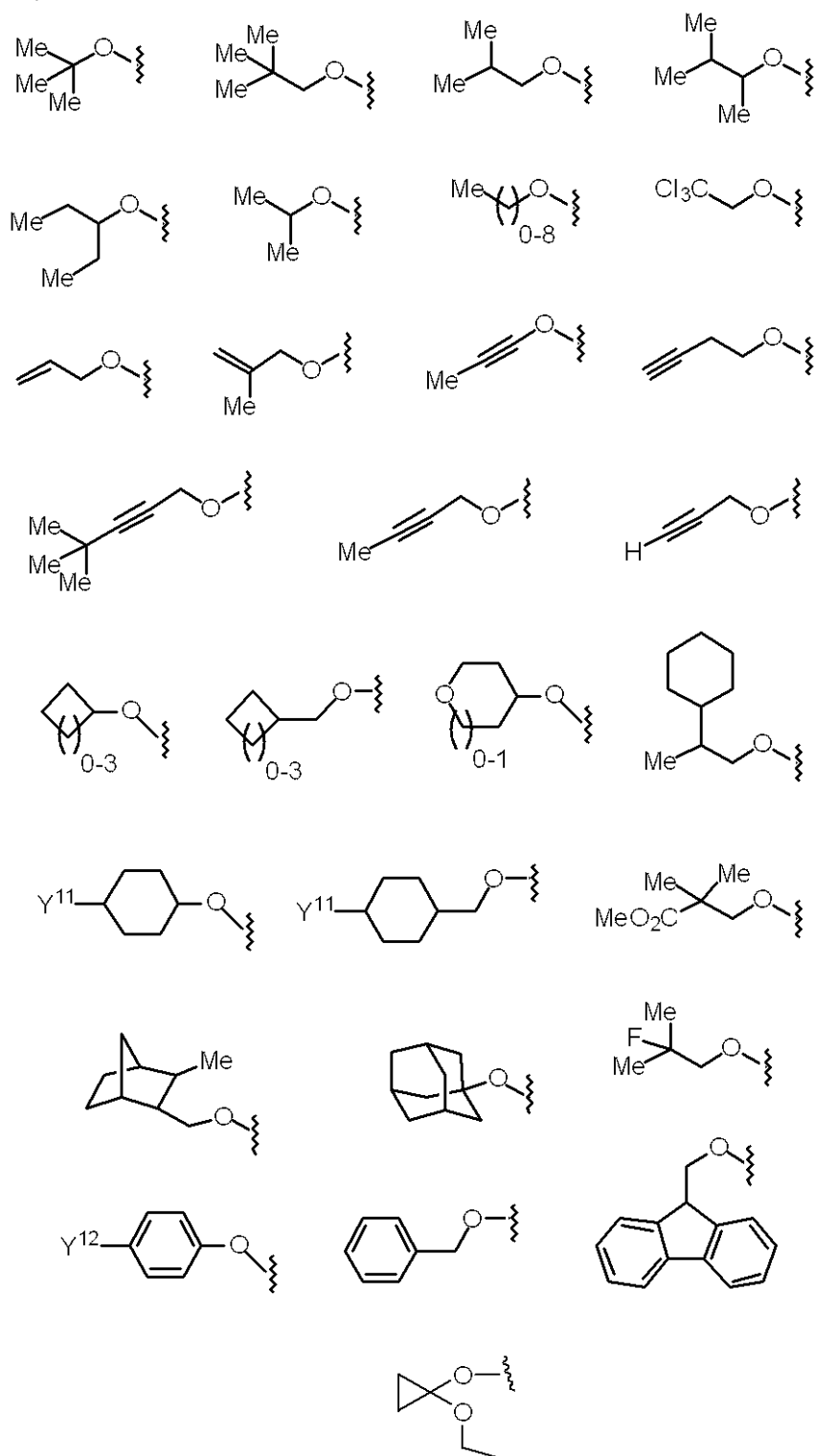
## 【請求項 7】

W が C = O である、請求項 6 記載の化合物。

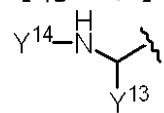
## 【請求項 8】

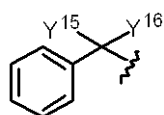
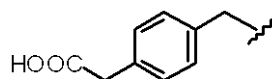
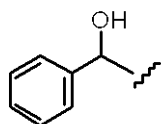
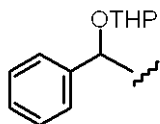
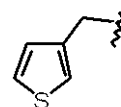
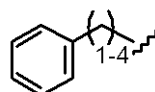
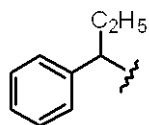
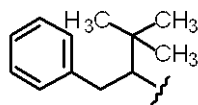
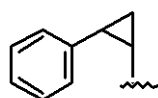
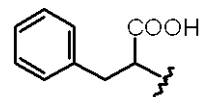
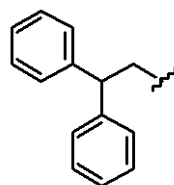
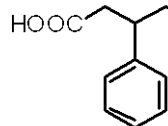
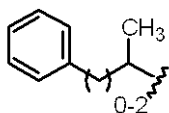
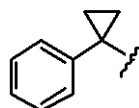
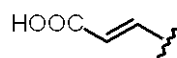
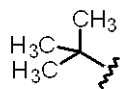
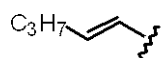
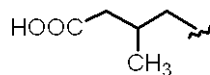
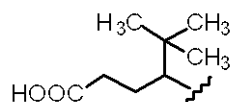
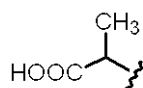
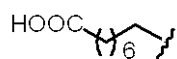
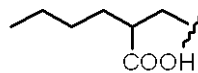
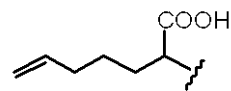
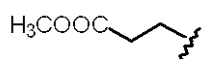
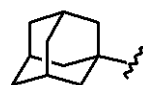
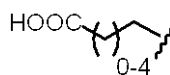
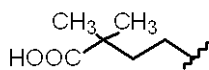
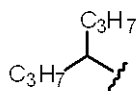
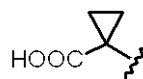
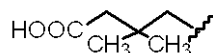
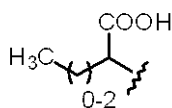
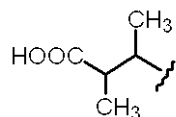
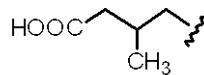
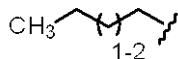
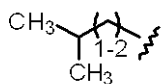
Y が以下の部分から選択される、請求項 7 記載の化合物：

## 【化 1 7】

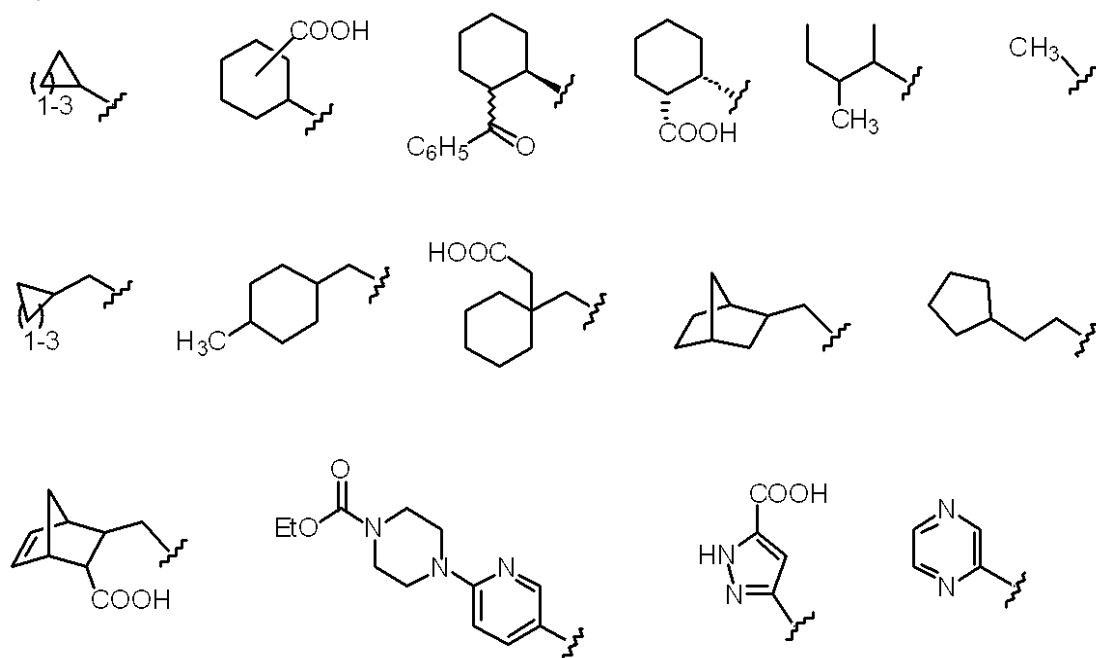


## 【化 1 8】

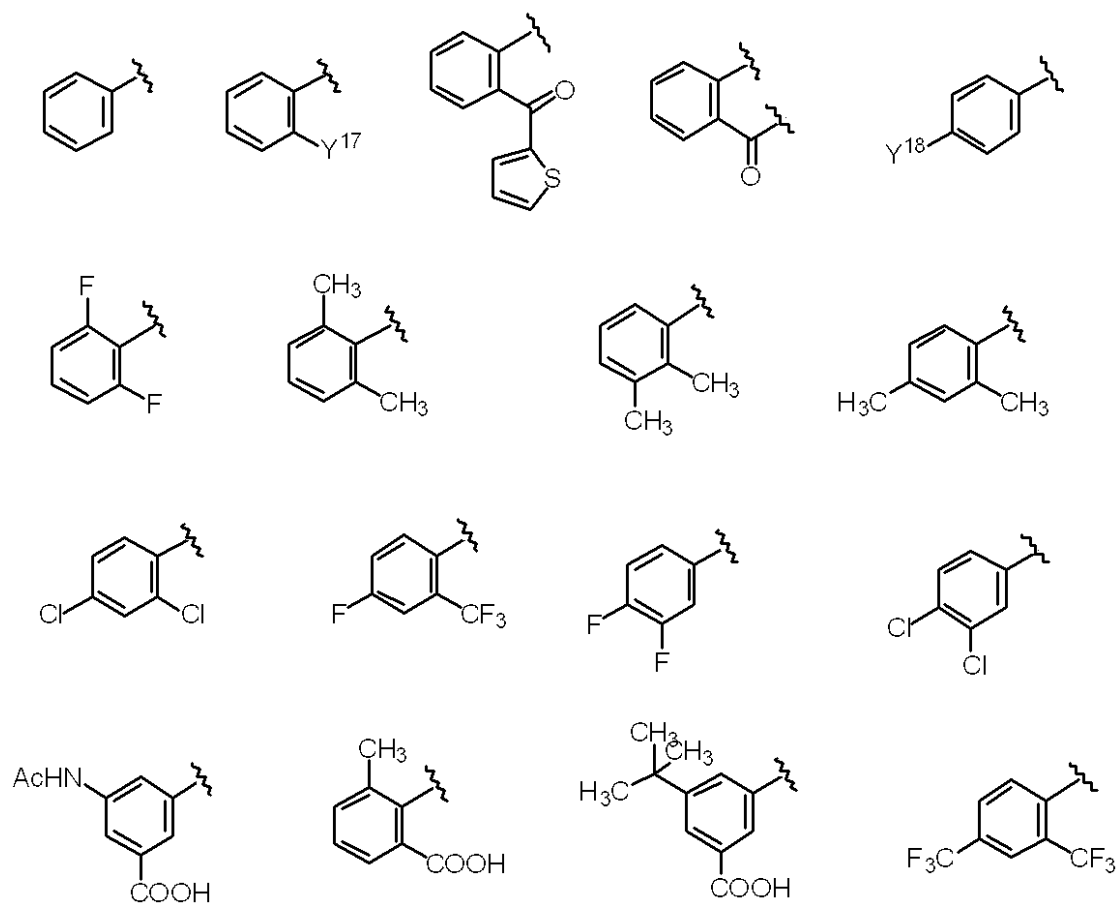


CC(C)(C)C

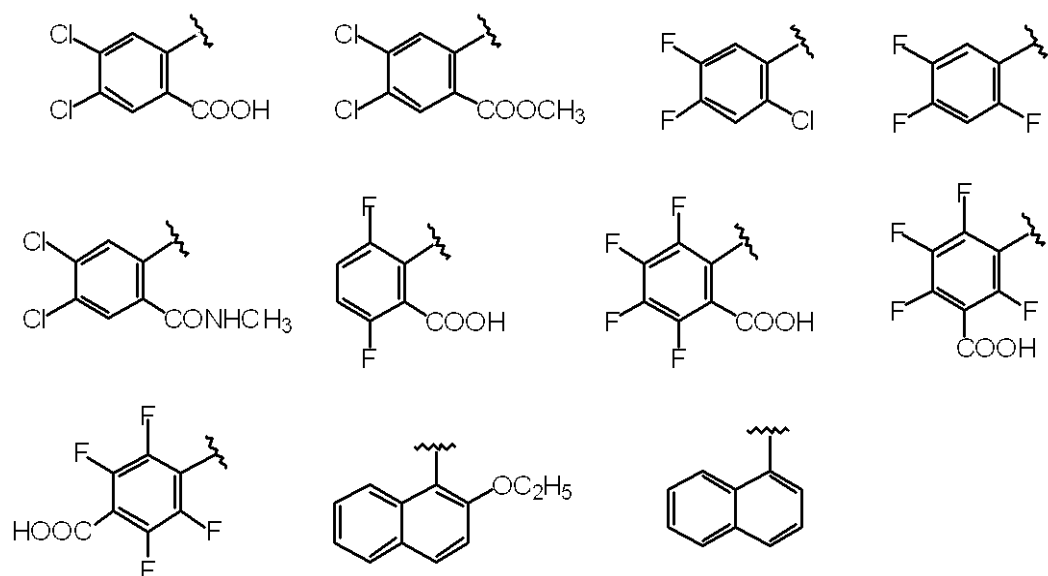
## 【化 2 0】



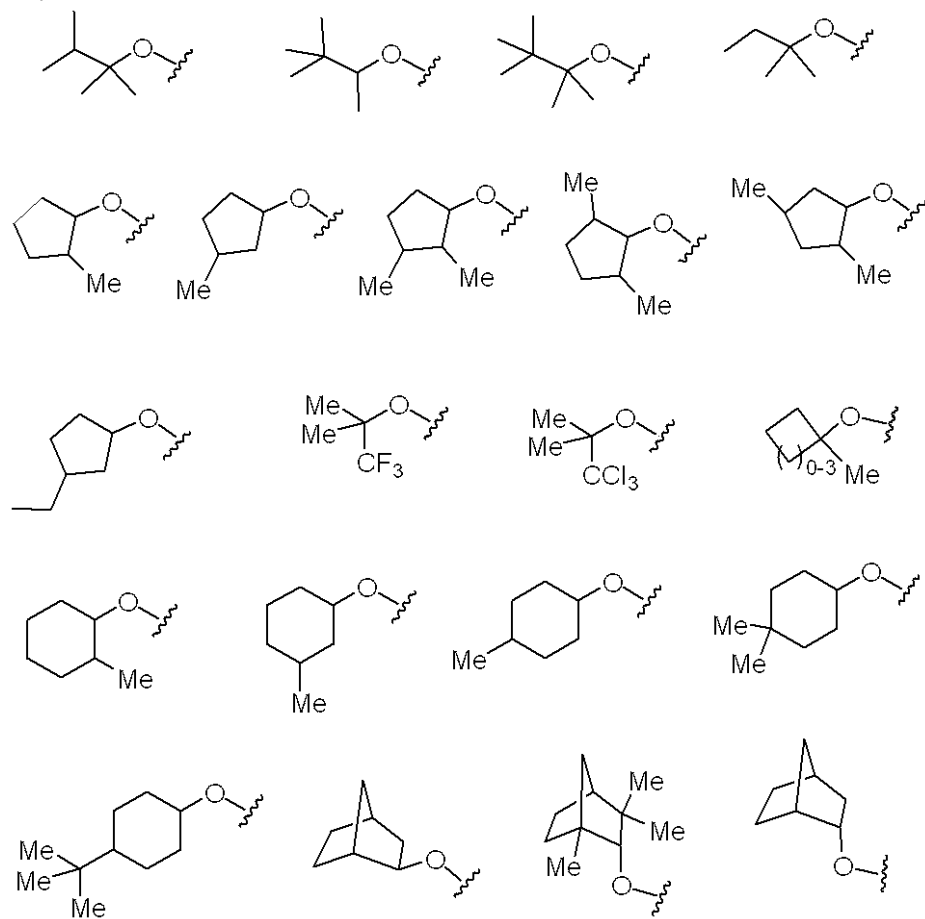
## 【化 2 1】



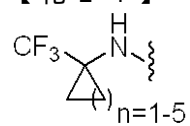
## 【化 2 2】

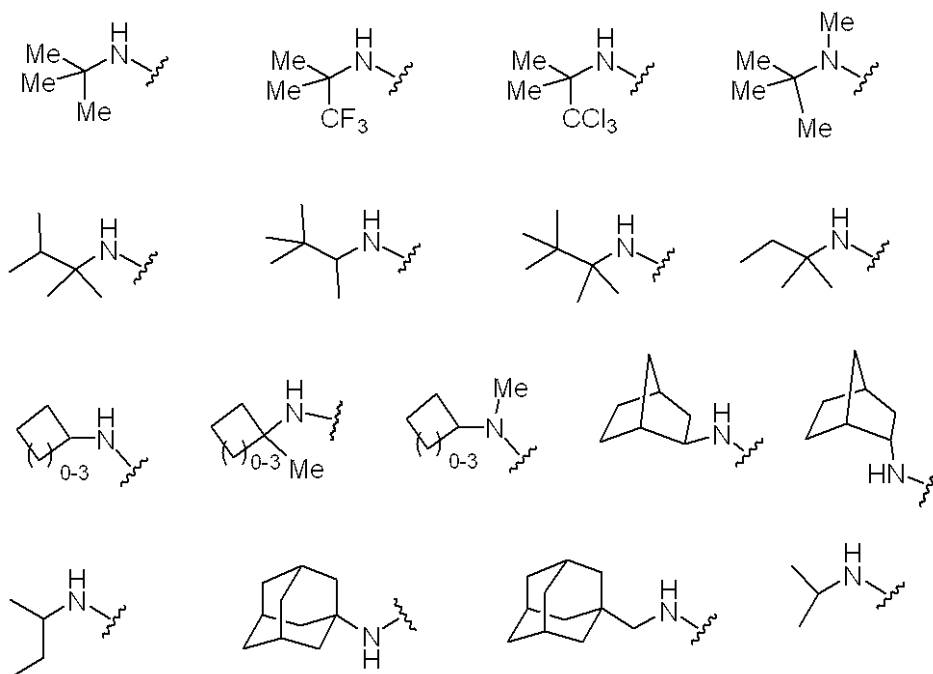


## 【化 2 3】



## 【化 2 4】





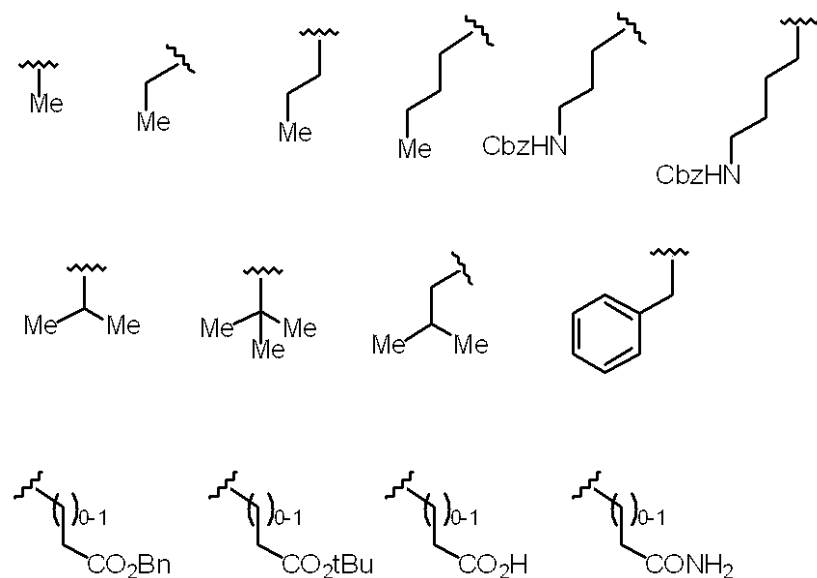
[ 式中、

$Y^{1.1}$  は、H、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OEt$ 、 $-OMe$ 、 $-Ph$ 、 $-OPh$ 、 $-NHMe$ 、 $-NHAc$ 、 $-NHPh$ 、 $-CH(Me)_2$ 、1-トリアゾリル、1-イミダゾリルおよび $NHCH_2COOH$ からなる群より選択され；

$Y^{1.2}$  は、H、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OMe$ 、 $-OMe$ 、F、ClおよびBrからなる群より選択され；

$Y^{1.3}$  は、以下の部分からなる群より選択され：

【化25】



$Y^{1.4}$  は、 $MeS(O_2)-$ 、 $-Ac$ 、 $-Boc$ 、 $-iBoc$ 、 $-Cbz$ または $-Alloc$ であり；

$Y^{1.5}$  および  $Y^{1.6}$  は、同じでもよくまたは異なってもよく、独立して、アルキル、アリール、ヘテロアルキル、およびヘテロアリールから選択され；

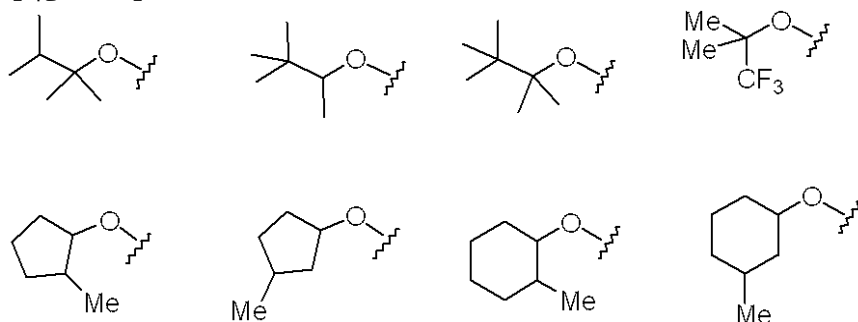
$Y^{1.7}$  は、 $-CF_3$ 、 $-NO_2$ 、 $-C(O)NH_2$ 、 $-OH$ 、 $-C(O)OCH_3$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OC_6H_5$ 、 $-C_6H_5$ 、 $-C(O)C_6H_5$ 、 $-NH_2$ 、または $-C(O)OH$ であり；そして

$Y^{1-8}$  は、 $C(O)OCH_3$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(CH_3)_2$ 、 $F$ 、 $-OCH_3$ 、 $-C(H_2)C(O)OH$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-S(O_2)NH_2$ 、または  $-N(H)C(O)CH_3$  である】。

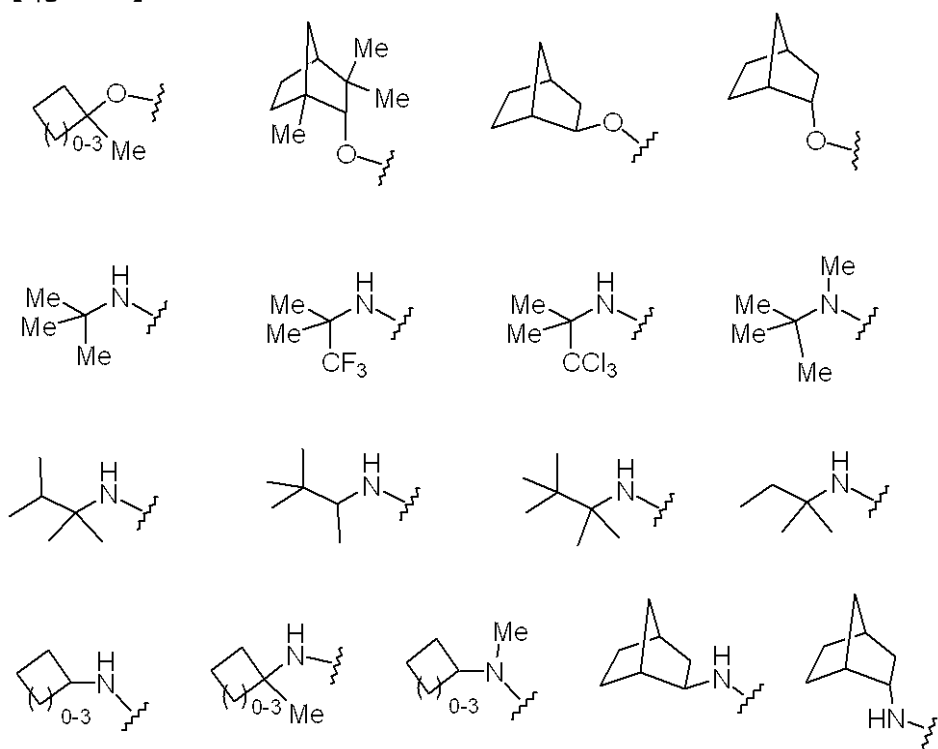
【請求項 9】

Y が以下からなる群より選択される、請求項 8 記載の化合物：

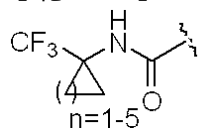
【化 2 6】



【化 2 7】

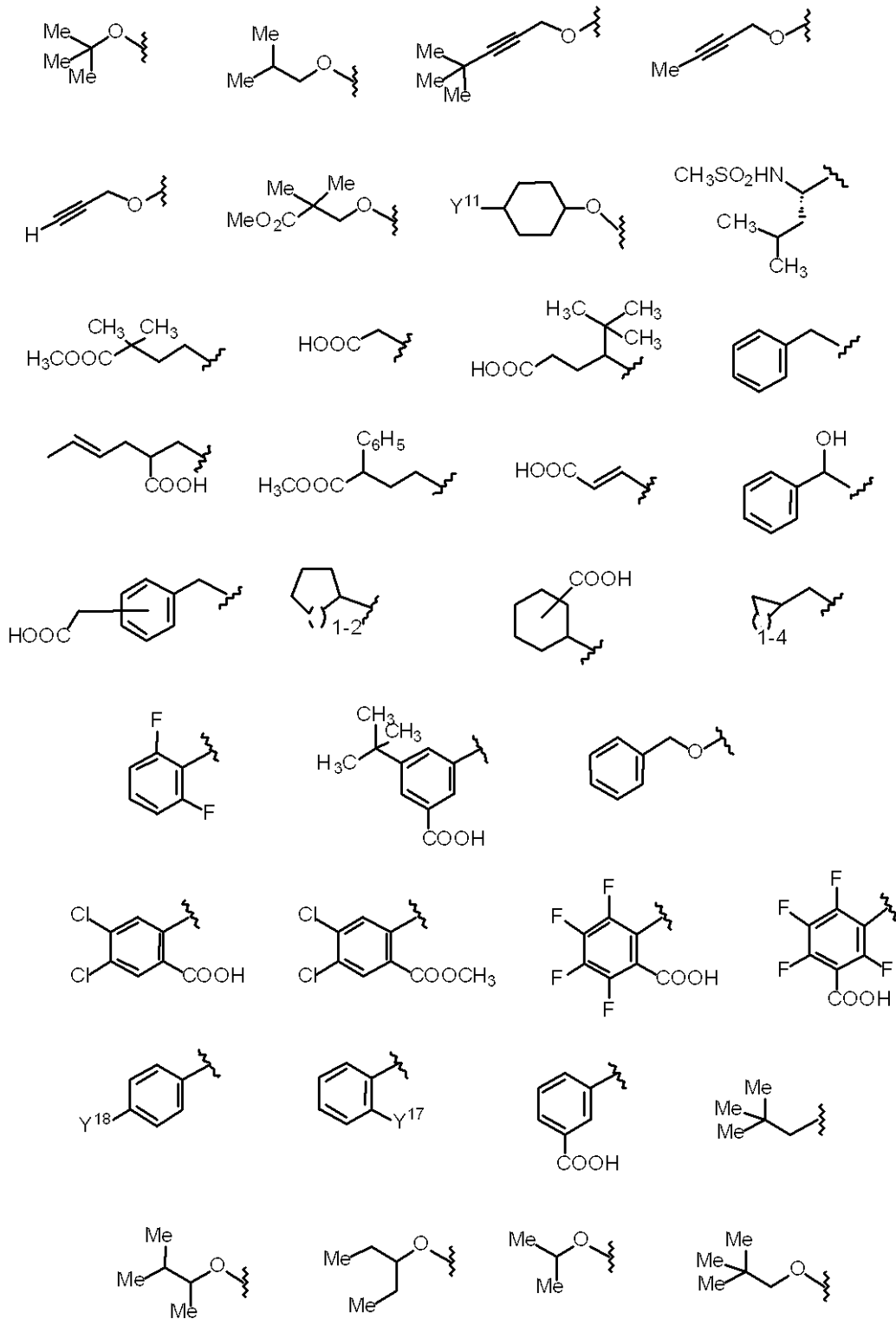


【化 2 8】





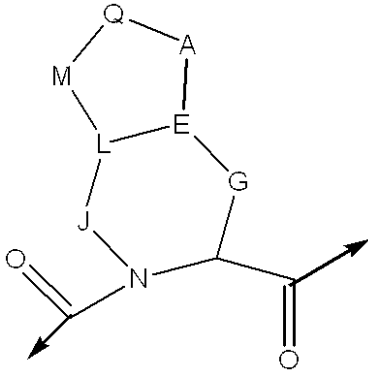
## 【化 2 9】



[ 式中、  
 $Y^{17} = CF_3$ 、 $NO_2$ 、 $CONH_2$ 、 $OH$ 、 $NH_2$  または  $COOH$  であり；  
 $Y^{18} = F$ 、 $COOH$  である ]。

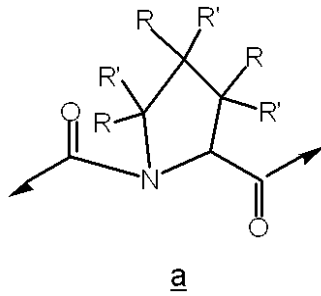
部分：

## 【化 3 1】



が、

## 【化 3 2】

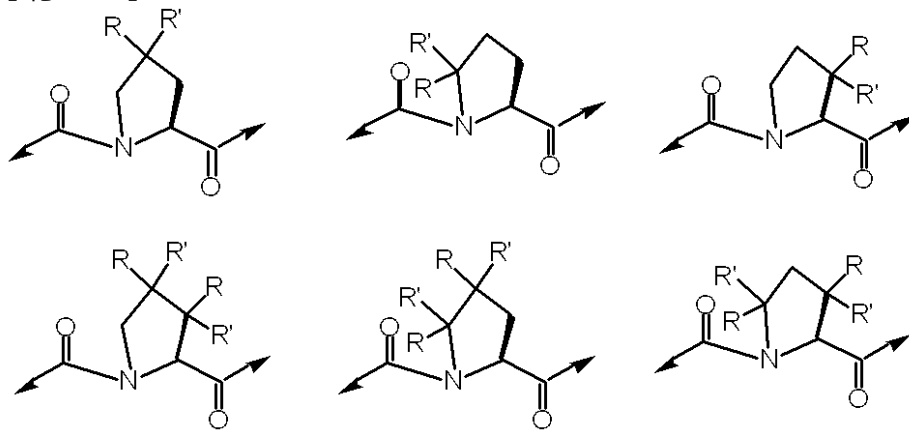


である、請求項 10 記載の化合物。

## 【請求項 15】

構造 a が以下の構造から選択される、請求項 14 記載の化合物：

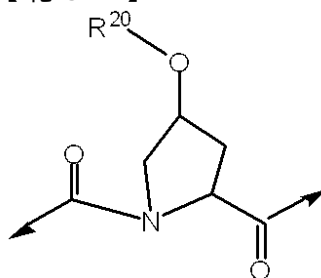
## 【化 3 3】



## 【請求項 16】

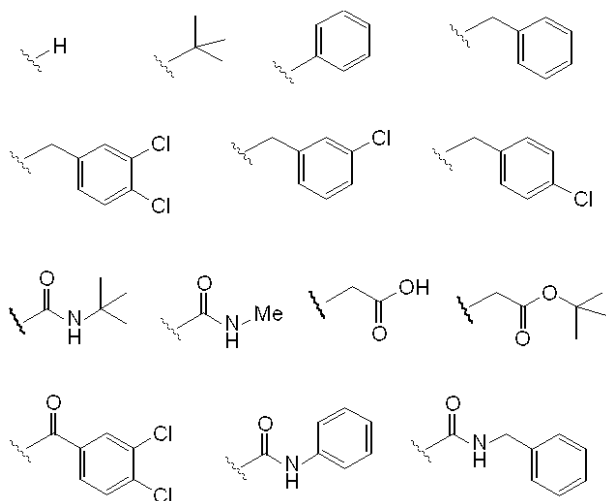
構造 a が以下である、請求項 14 記載の化合物：

## 【化 3 4】



[ 式中、 $R^{20}$  は以下の構造から選択される：

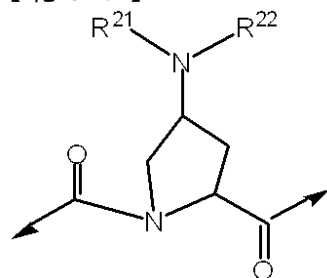
【化 3 5】



【請求項 17】

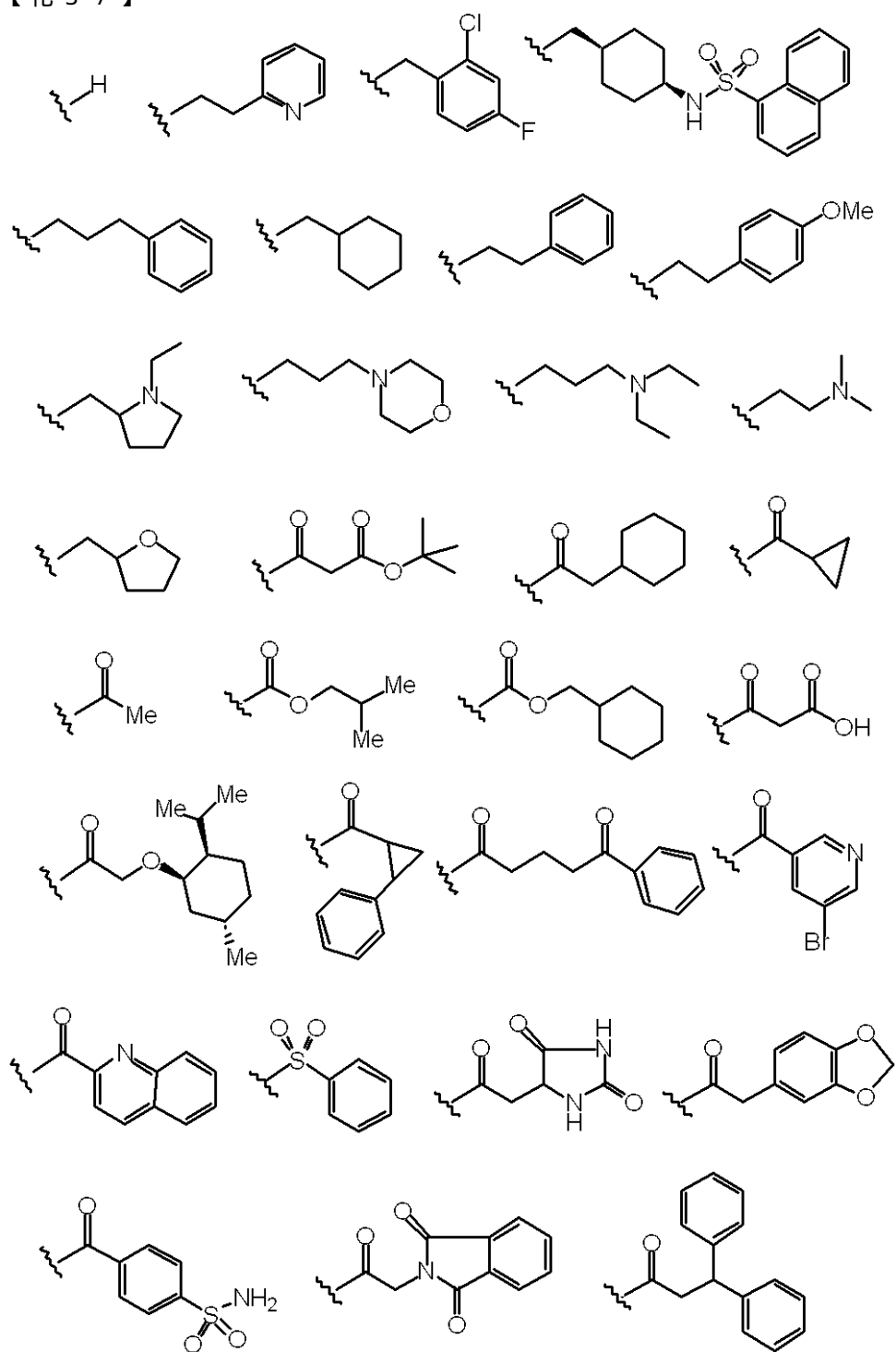
構造 a が以下である、請求項 14 記載の化合物：

【化 3 6】



[ 式中、 $R^{21}$  および  $R^{22}$  は、同じでもよくまたは異なってもよく、独立して、以下の構造からなる群より選択される：

## 【化 3 7】

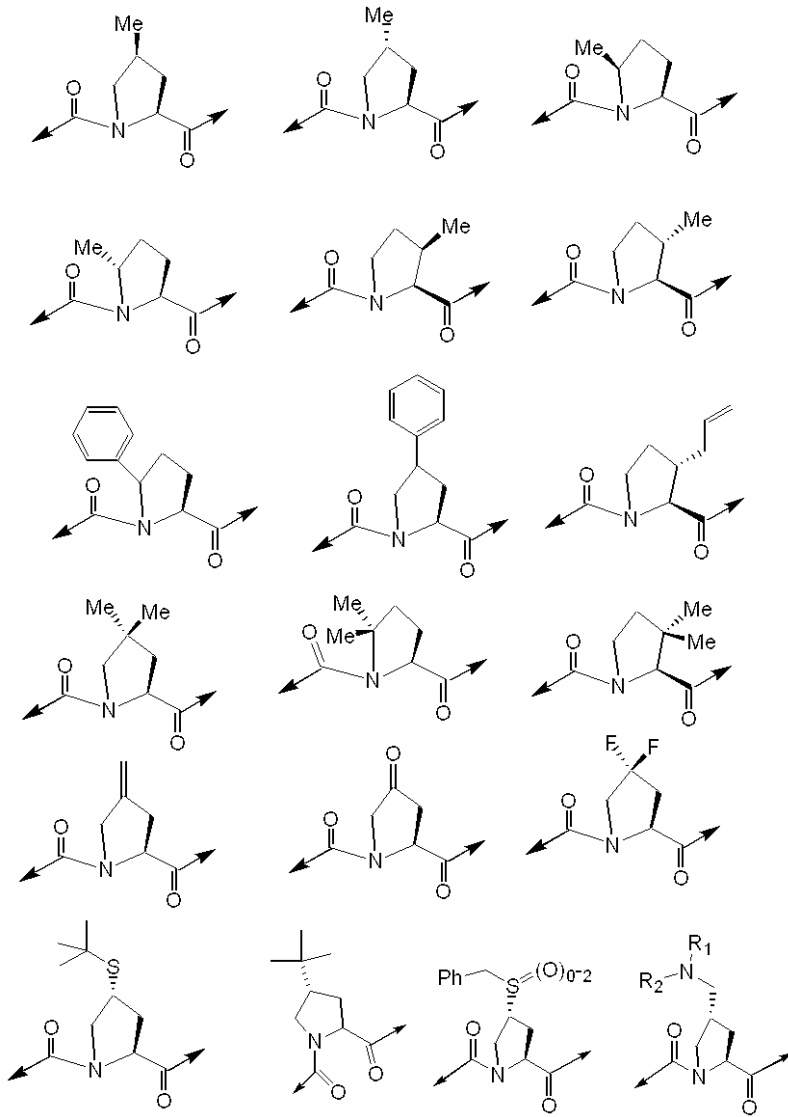


]。

## 【請求項 1 8】

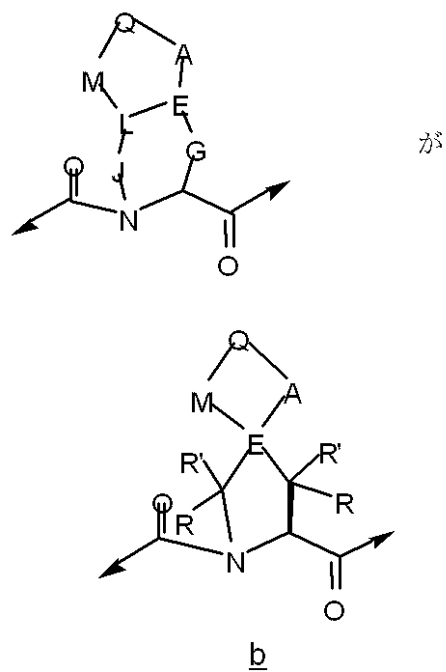
構造 a が以下の構造からなる群より選択される、請求項 1 4記載の化合物：

## 【化 3 8】



## 【請求項 19】

## 【化 3 9】



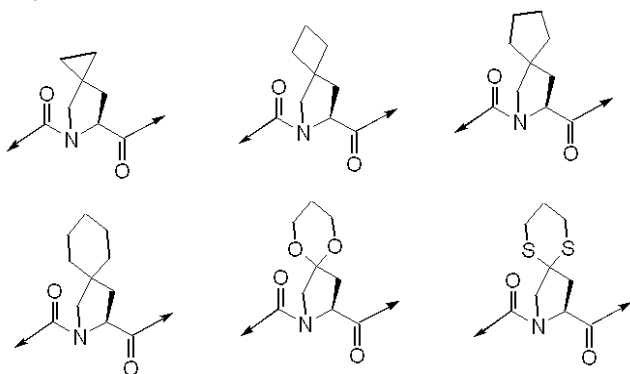
[ 式中、Qは存在してもよくまたは存在しなくてもよく、Qが存在しない場合、MはAに直接結合している ]

である、請求項10記載の化合物。

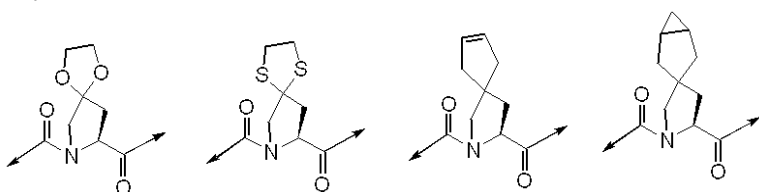
【請求項20】

構造bが、以下の構造から選択される、請求項19記載の化合物：

【化40】

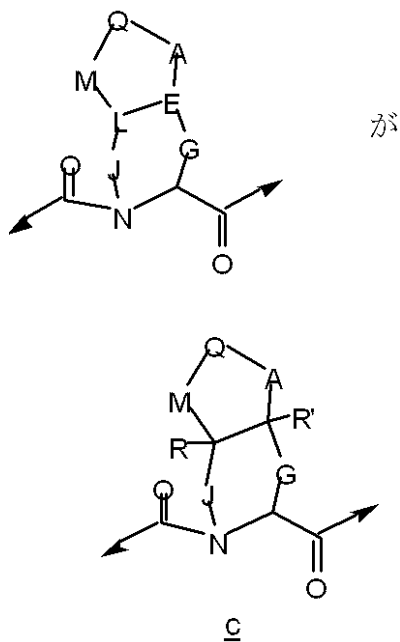


【化41】



【請求項21】

【化42】



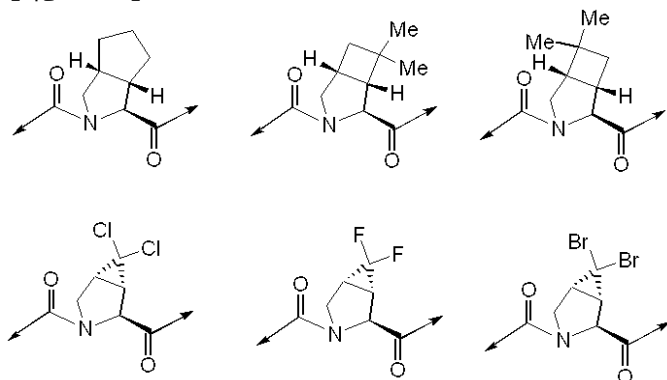
[ 式中、GおよびJは同じでもよくまたは異なってもよく、独立して、 $(CH_2)_p$ 、 $(CHR)_p$ 、 $(CHR-CHR')$ 、および $(CRR')$ からなる群より選択され；  
AおよびMは同じでもよくまたは異なってもよく、独立して、O、S、 $S(O_2)$ 、 $N(R)$ 、 $(CH_2)_p$ 、 $(CHR)_p$ 、 $(CHR-CHR')$ 、および $(CRR')$ からなる群より選択され；そして

Qは、 $\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}(\text{R})$ 、 $\text{C}(\text{RR}')$ 、 $\text{N}(\text{H})$ 、 $\text{N}(\text{R})$ 、 $\text{O}$ 、 $\text{S}$ 、 $\text{S}(\text{O}_2)$ 、 $\text{N}(\text{R})$ 、 $(\text{CH}_2)_p$ 、 $(\text{CHR})_p$  または  $(\text{CRR}')_p$  である ]  
 である、請求項 10 記載の化合物。

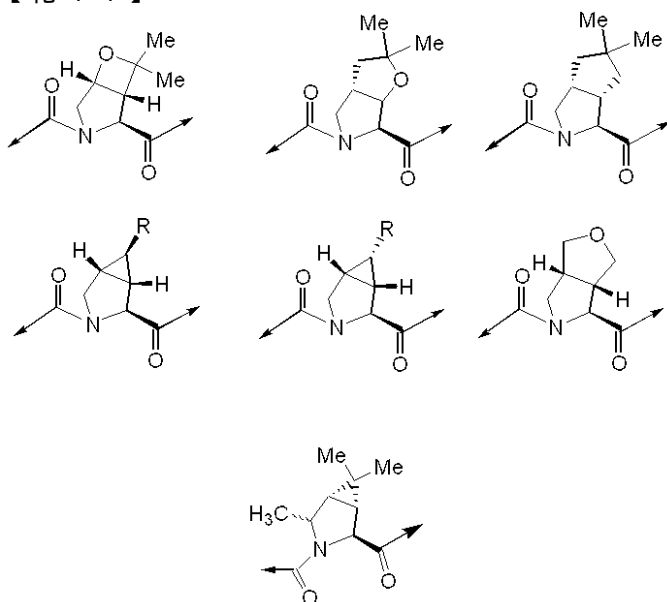
【請求項 22】

構造 c が以下の構造から選択される、請求項 21 記載の化合物：

【化 43】

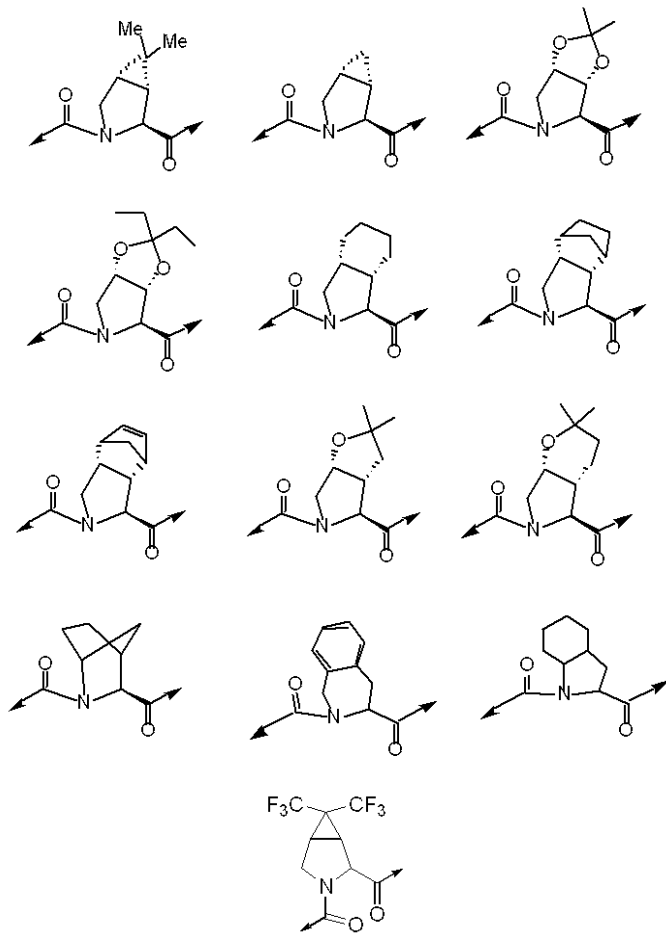


【化 44】

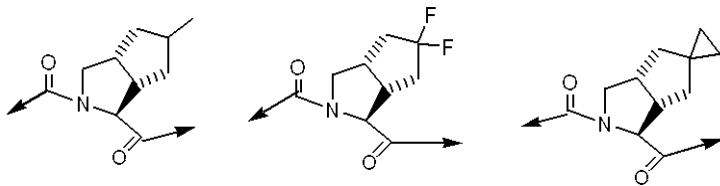




## 【化 4 5】

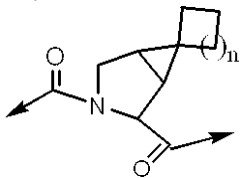


## 【化 4 6】



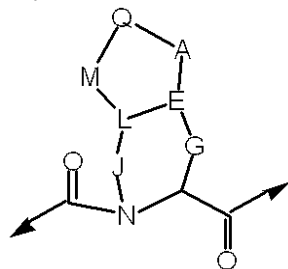
および

## 【化 4 7】

[ 式中、 $n = 0 - 4$ である ]。

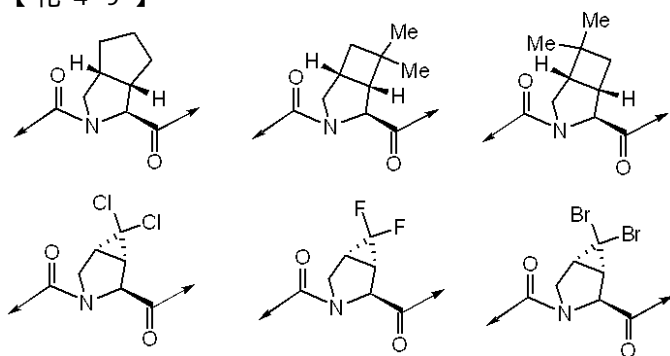
【請求項 2 3】

## 【化 4 8】

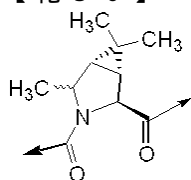


が以下の構造から選択される、請求項 10 記載の化合物：

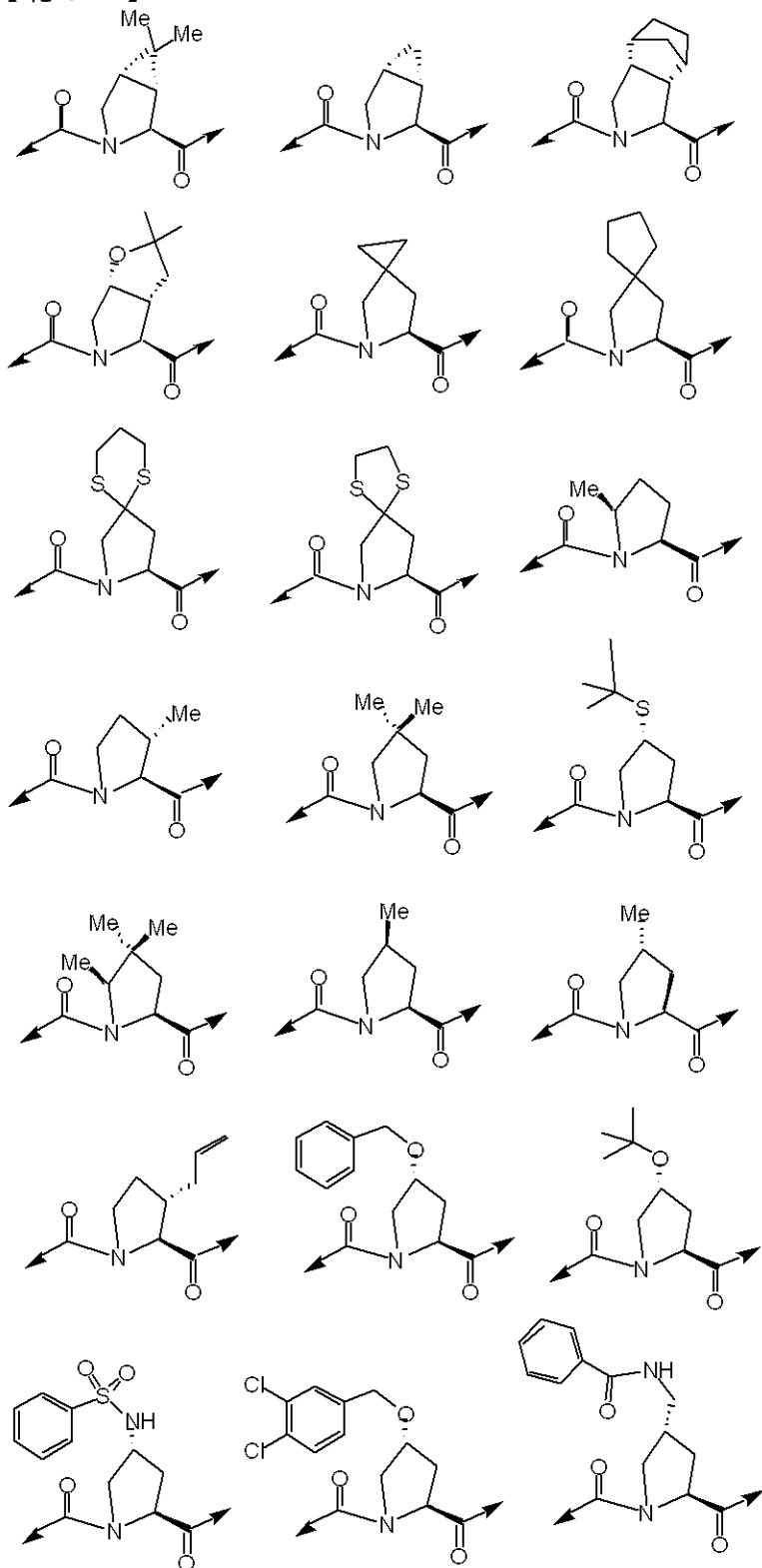
## 【化 4 9】



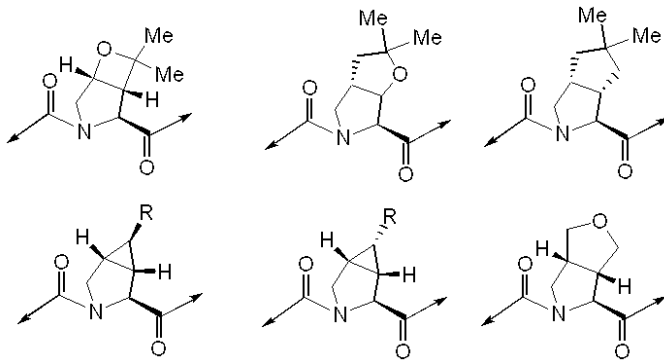
## 【化 5 0】



## 【化 5 1】

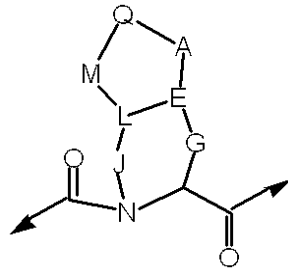


## 【化 5 2】



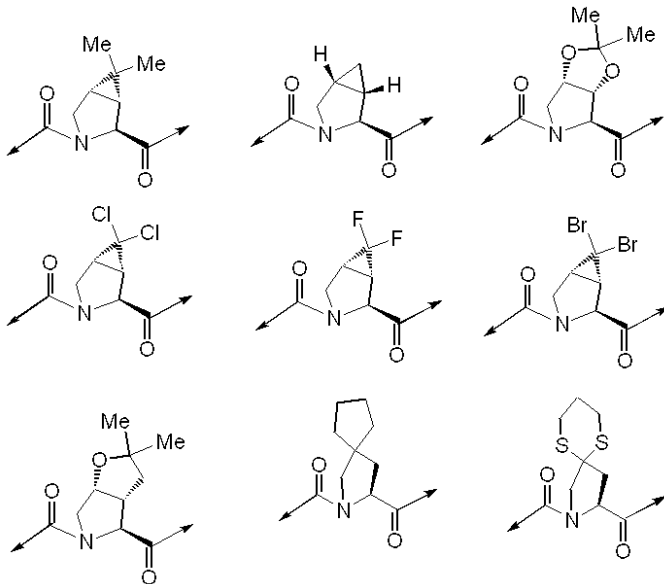
## 【請求項 2 4】

## 【化 5 3】

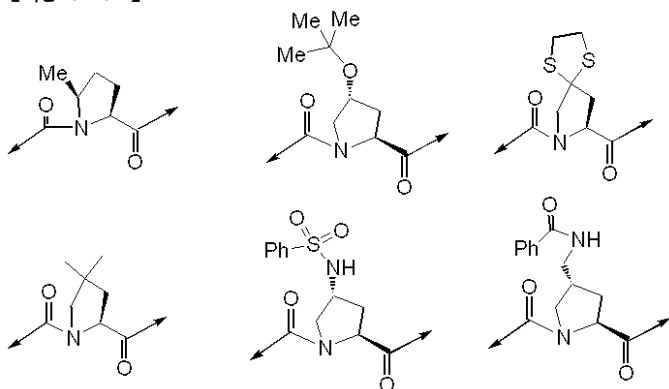


が、以下の構造から選択される、請求項 2 3記載の化合物：

## 【化 5 4】

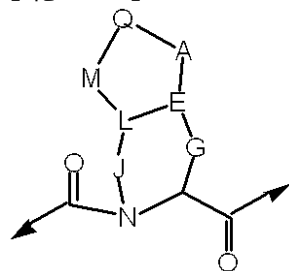


## 【化 5 5】



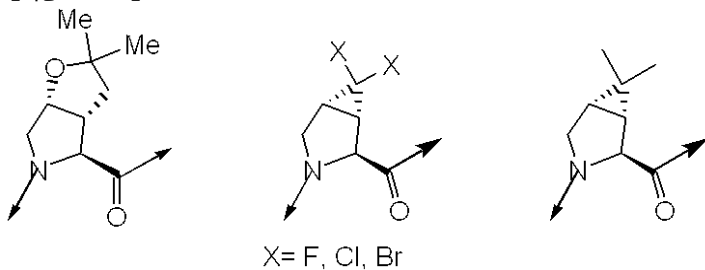
## 【請求項 2 5】

## 【化 5 6】



が、以下の構造から選択される、請求項 2 3記載の化合物：

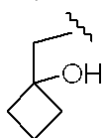
## 【化 5 7】



## 【請求項 2 6】

$R^2$  が以下の部分である、請求項 1 記載の化合物：

## 【化 5 8】



## 【請求項 2 7】

有効成分として少なくとも 1 つの請求項 1 記載の化合物を含む医薬組成物。

## 【請求項 2 8】

HCV 関連障害の処置における使用のための、請求項 2 7記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 9】

さらに医薬上許容される担体を含む、請求項 2 7記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 0】

さらに少なくとも 1 つの抗ウイルス剤を含有する、請求項 2 9記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 1】

さらにインターフェロンを含有する、請求項 3 0記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 2】

抗ウイルス剤がリバビリンであり、インターフェロンが - インターフェロンまたは PEG 化インターフェロンである、請求項 3 1 記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 3】

HCV 関連障害の処置用医薬組成物の製造における請求項 1 記載の化合物の使用であって、該医薬組成物は少なくとも 1 つの請求項 1 記載の化合物の治療有効量を含み、処置を必要とする患者に投与される、使用。

## 【請求項 3 4】

投与が経口または皮下である、請求項 3 3 記載の使用。

## 【請求項 3 5】

HCV 関連障害を処置するための医薬の製造における請求項 1 記載の化合物の使用。

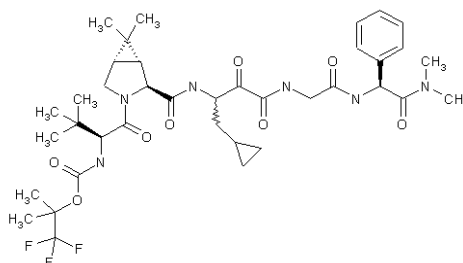
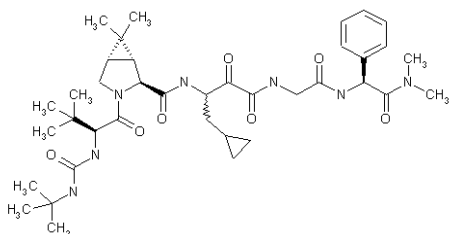
## 【請求項 3 6】

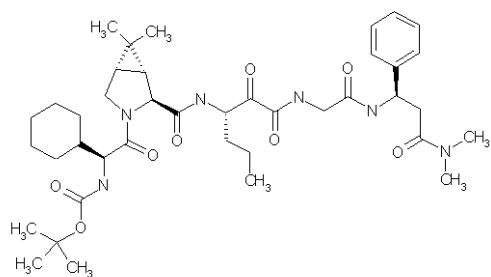
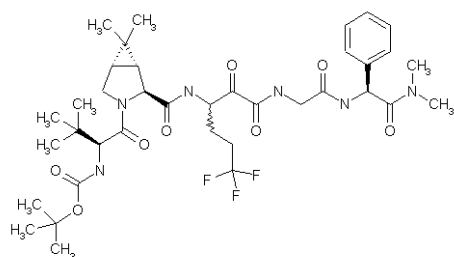
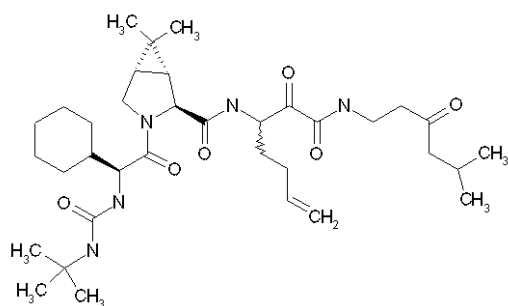
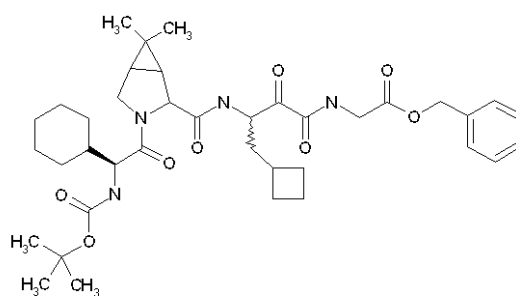
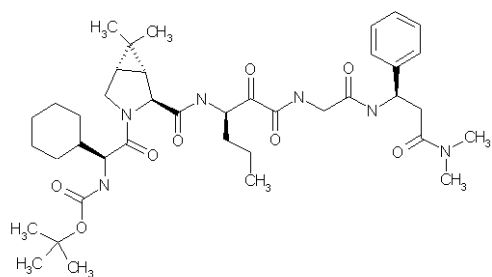
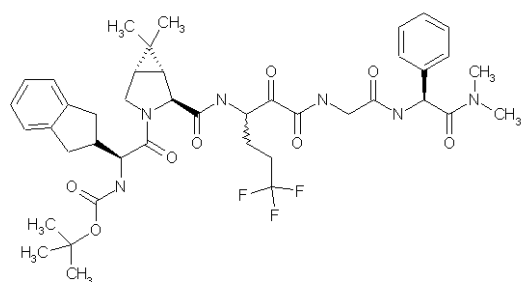
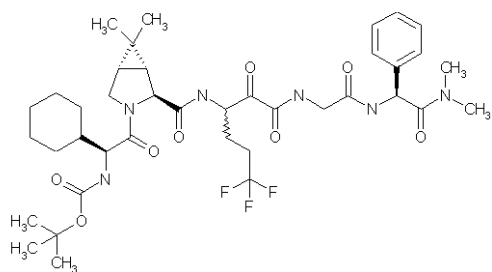
HCV 関連障害を処置するための医薬組成物の製造方法であって、少なくとも 1 つの請求項 1 記載の化合物および医薬上許容される担体を緊密に接触させる工程を包含する方法。

## 【請求項 3 7】

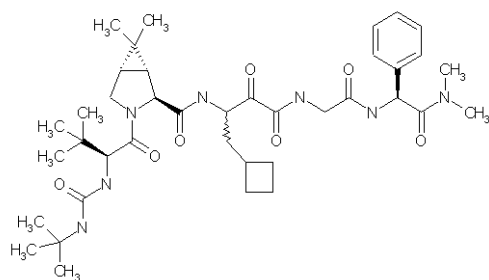
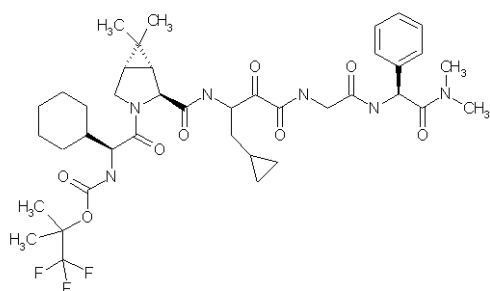
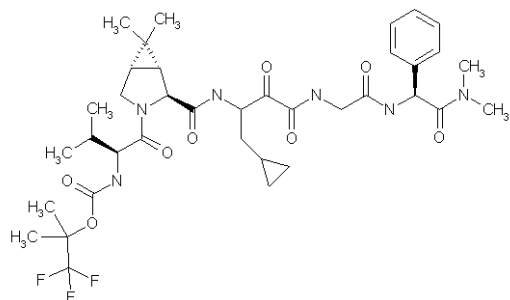
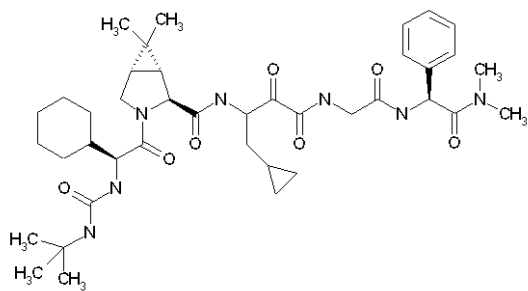
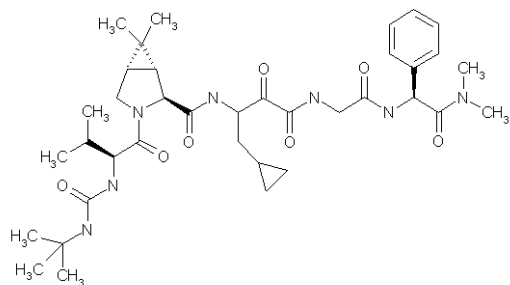
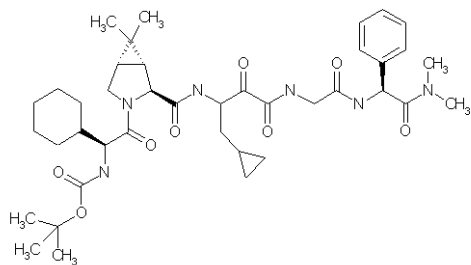
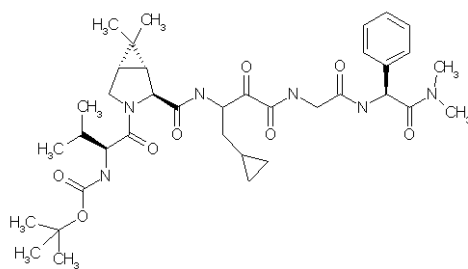
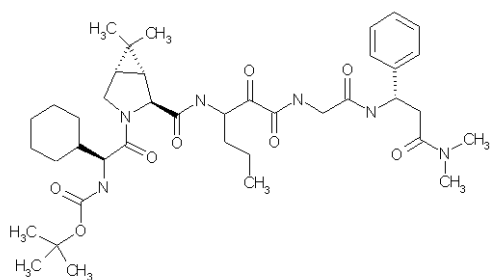
HCV プロテアーゼ阻害活性を示す化合物、または該化合物の鏡像異性体、立体異性体、回転異性体、互変異性体、ラセミ体およびプロドラッグ、または該化合物もしくは該プロドラッグの医薬上許容される塩もしくは溶媒和物であって、下記に列挙した構造で表される化合物から選択される化合物：

## 【化 5 9】



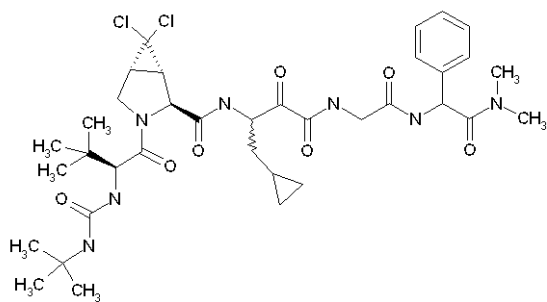
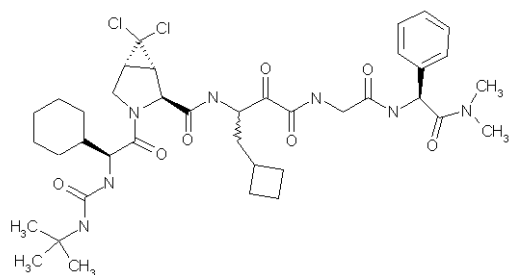
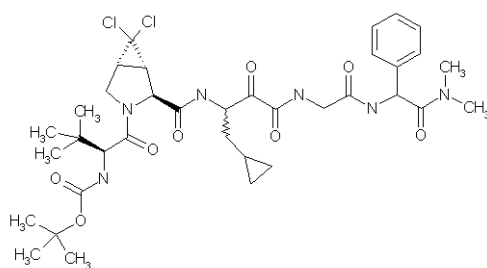
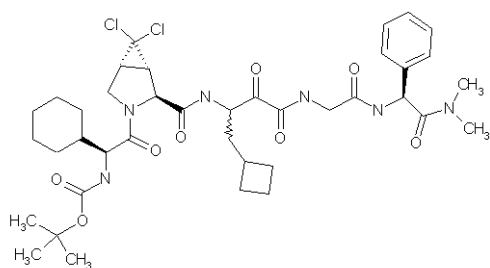
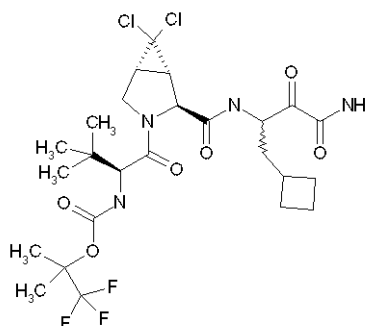
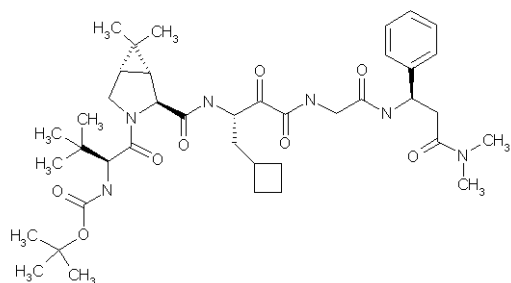
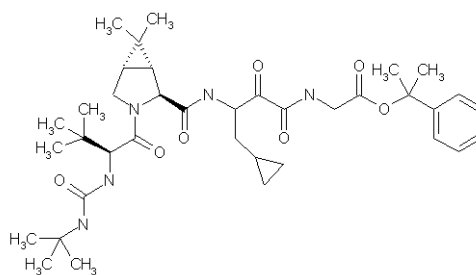
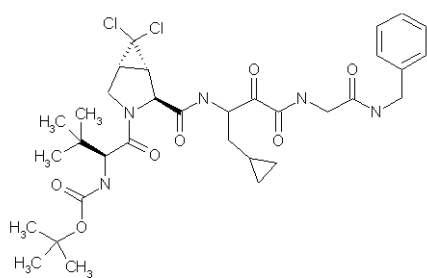
[illegible]

## 【化 6 1】

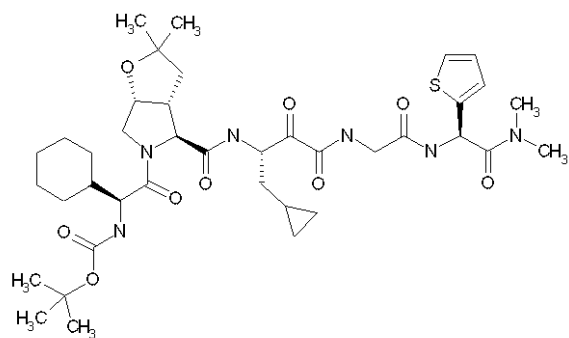
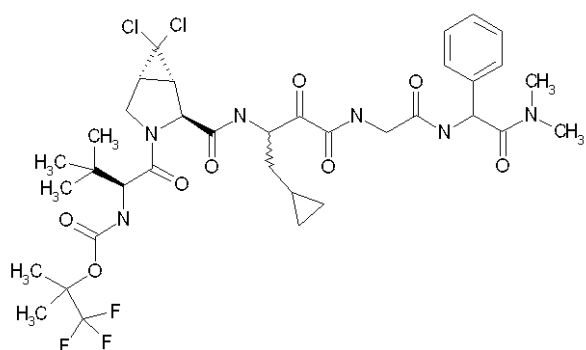
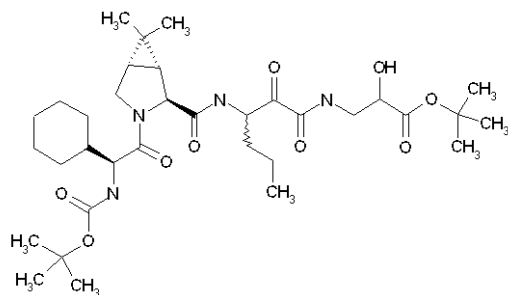
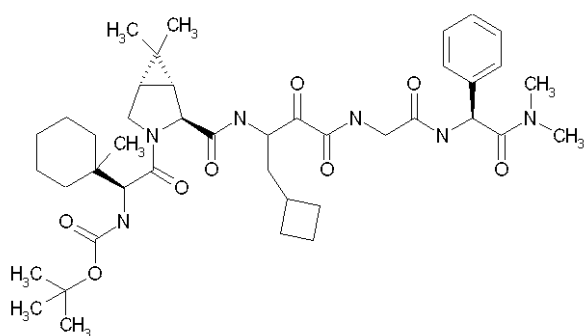
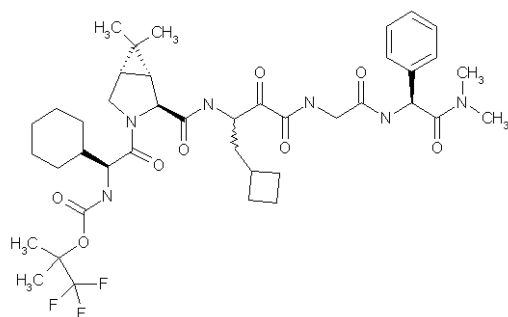
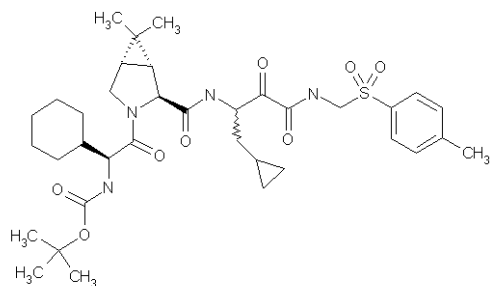
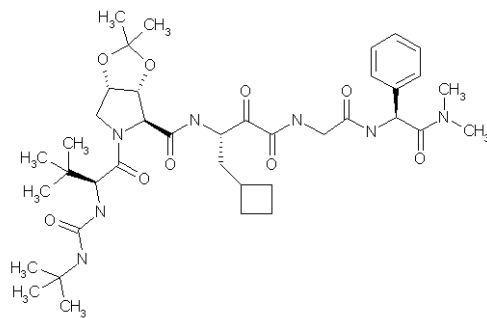
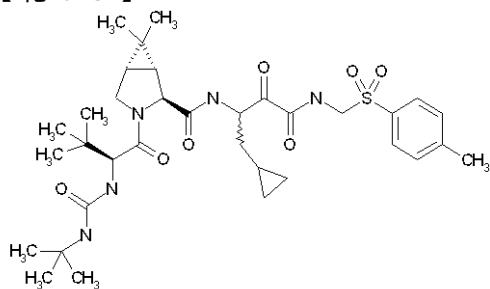




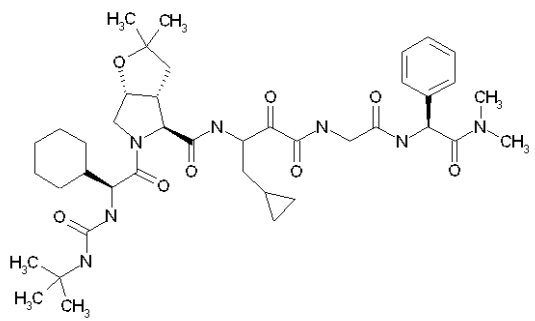
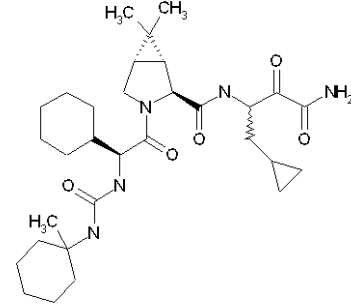
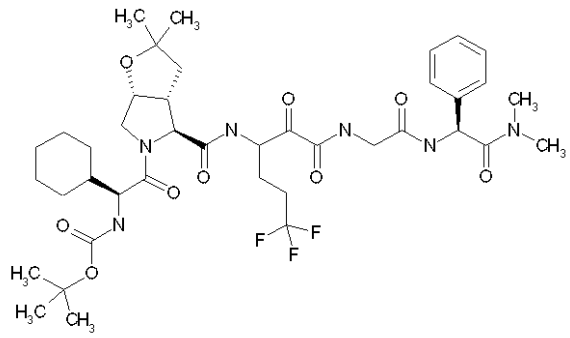
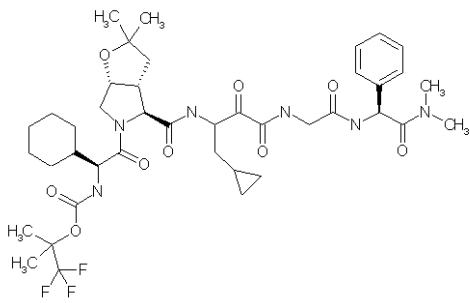
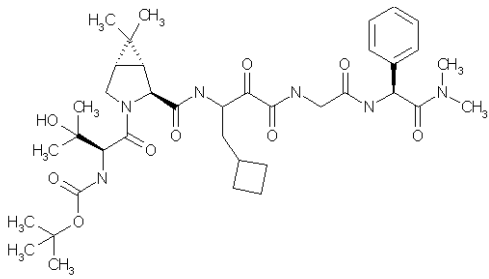
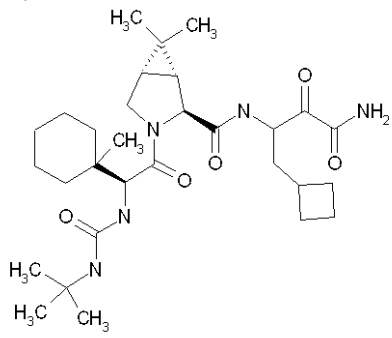
## 【化 6 2】



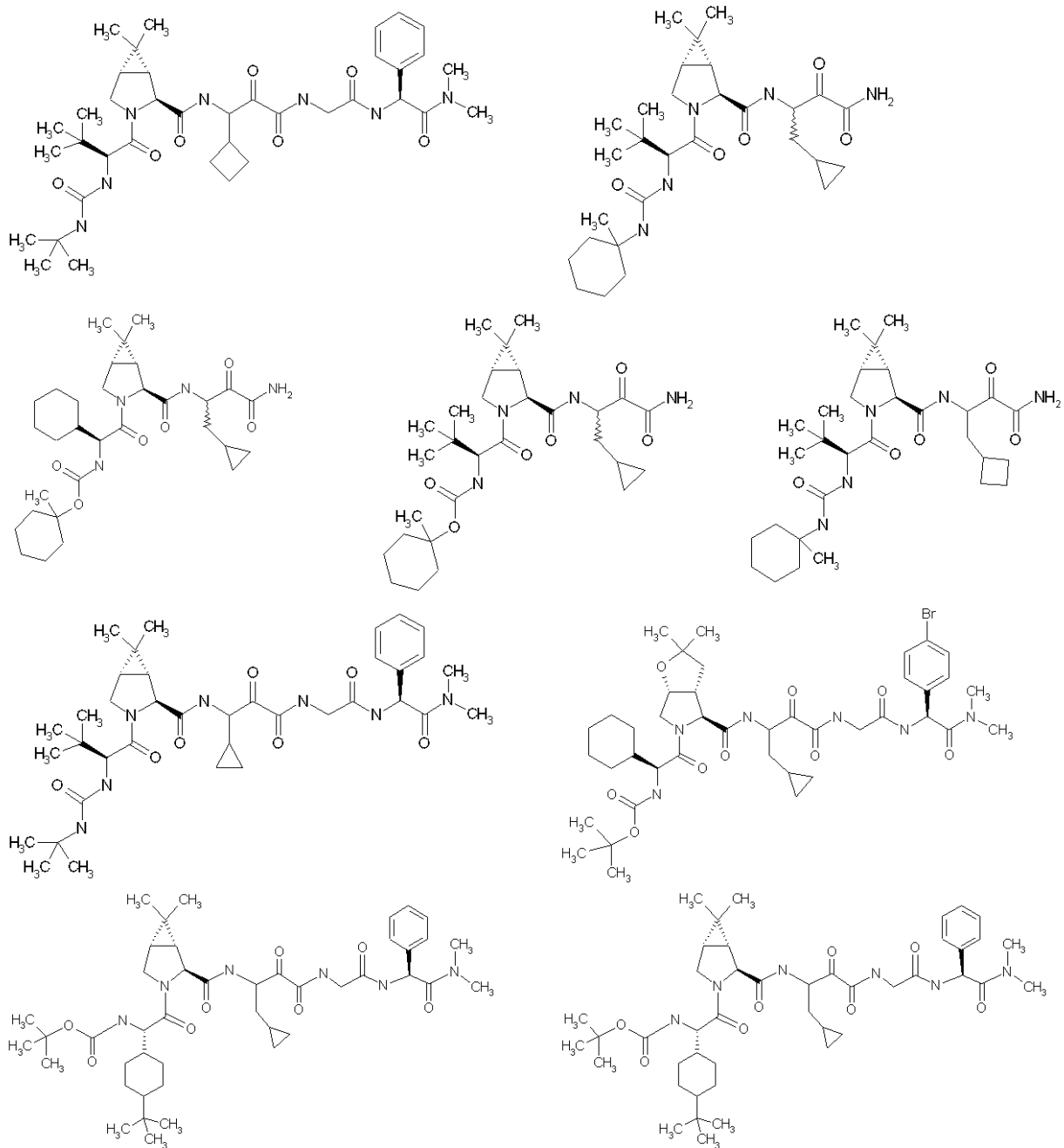
## 【化 6 3】



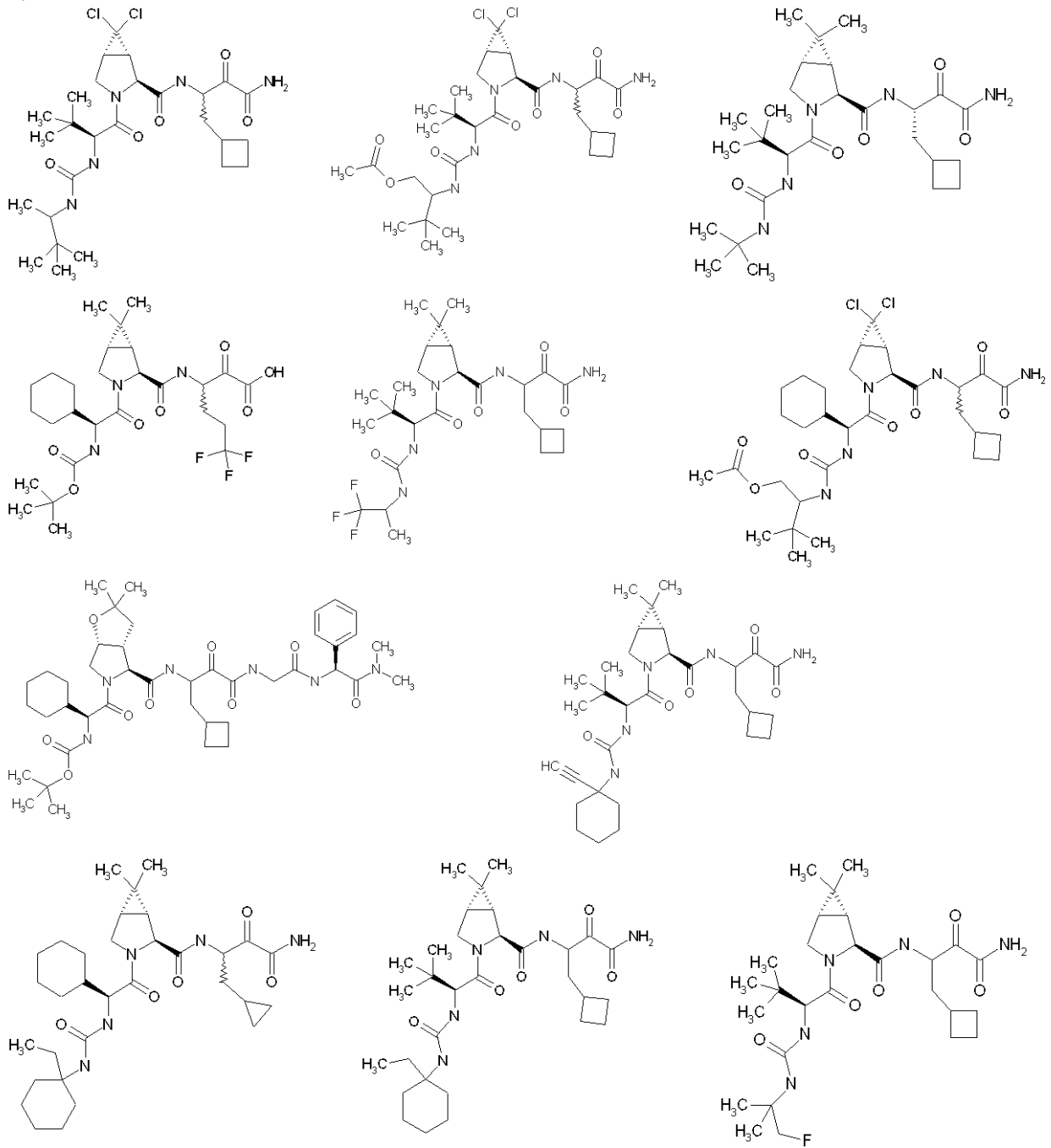
## 【化 6 4】



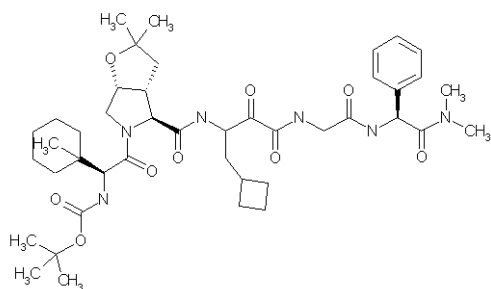
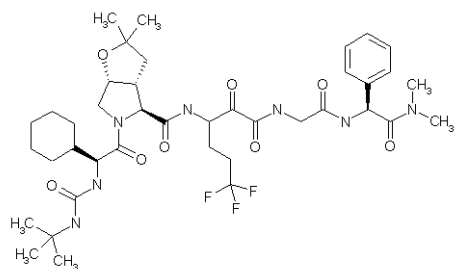
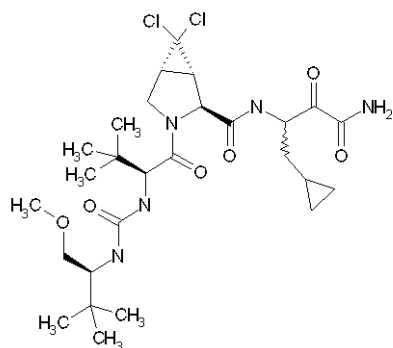
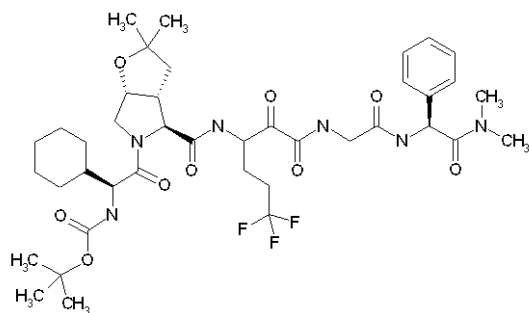
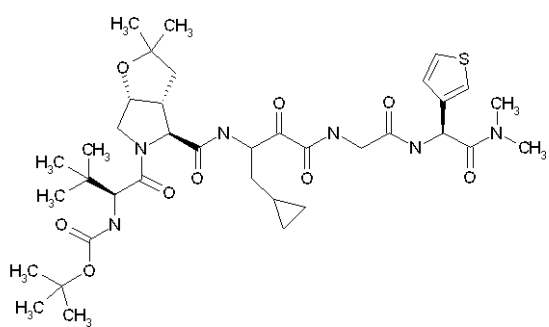
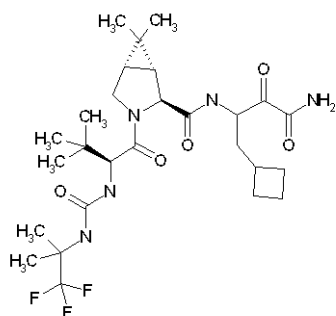
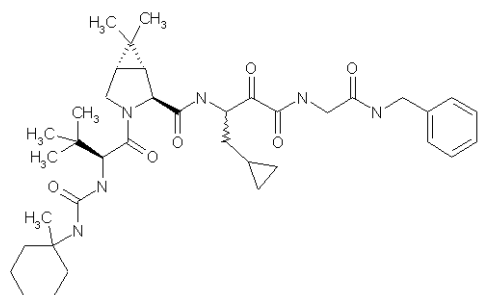
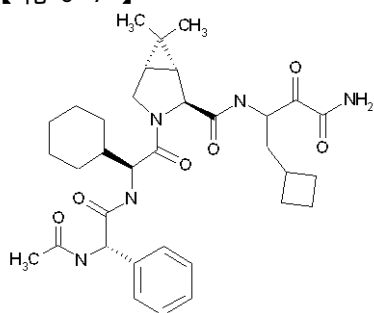
## 【化 6 5】



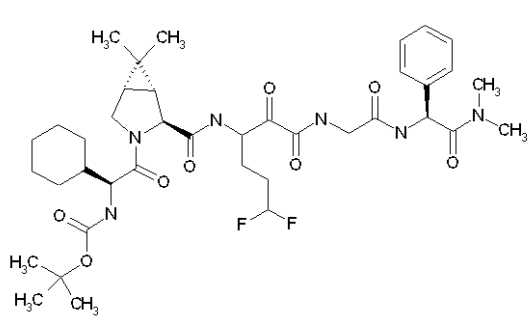
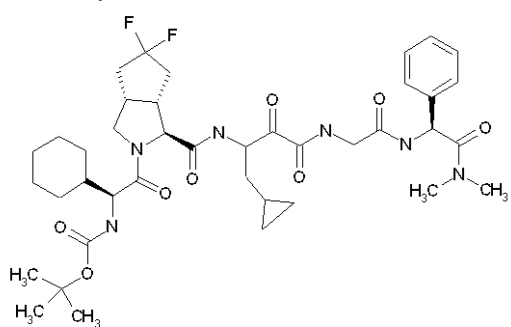
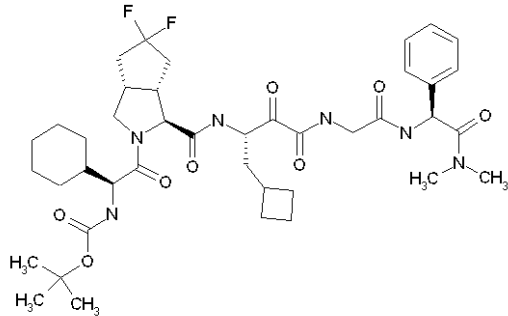
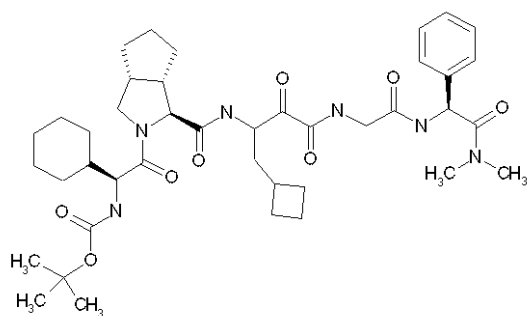
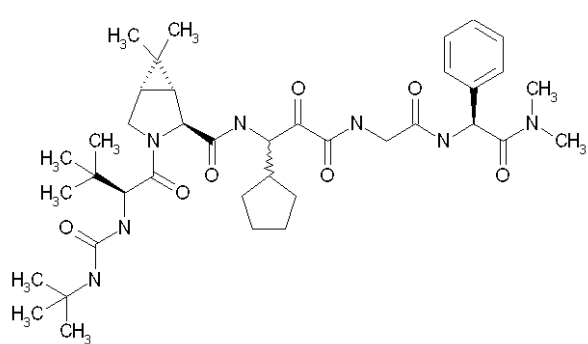
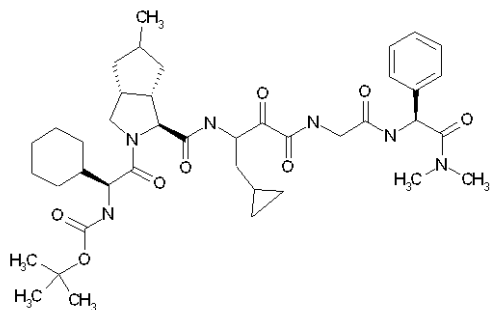
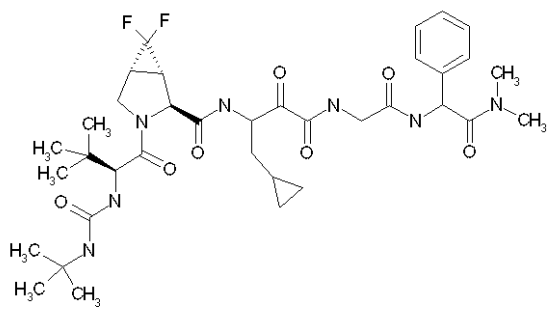
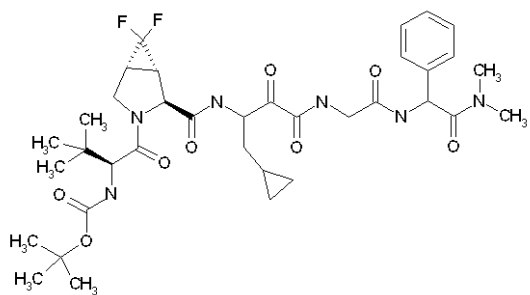
## 【化 6 6】



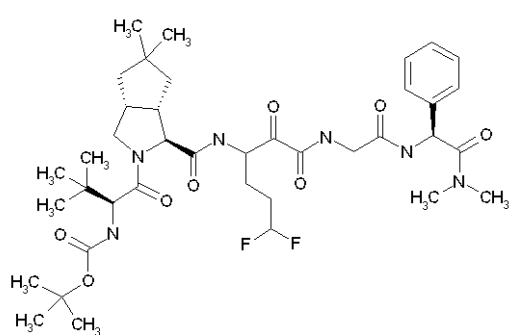
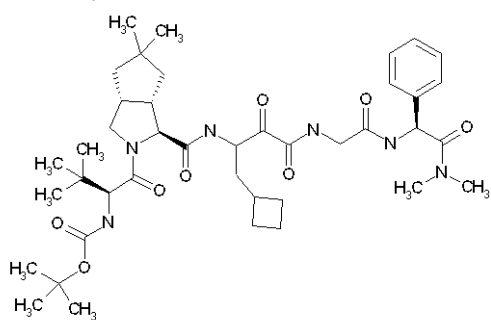
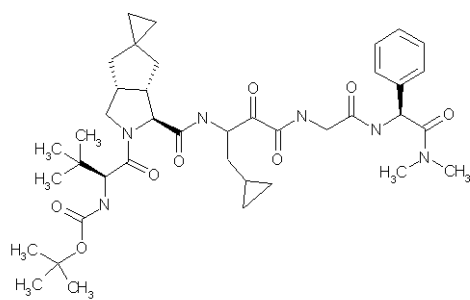
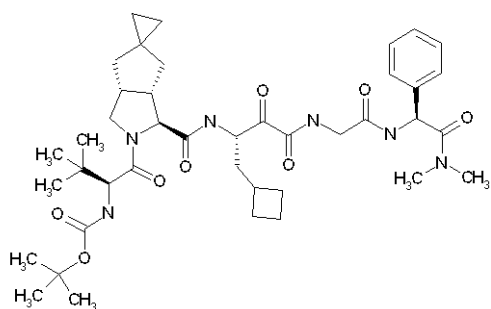
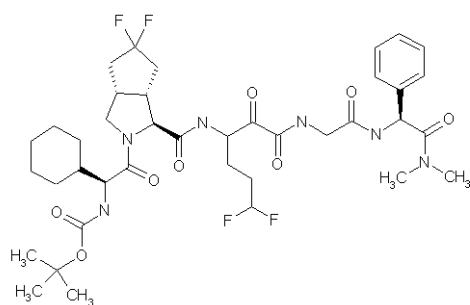
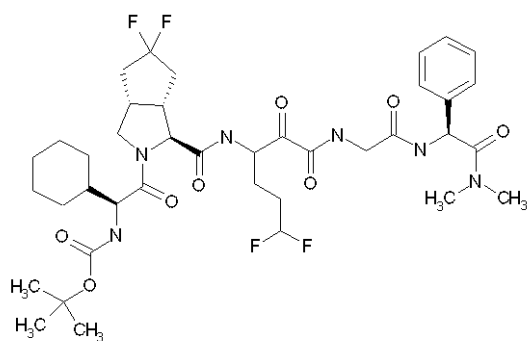
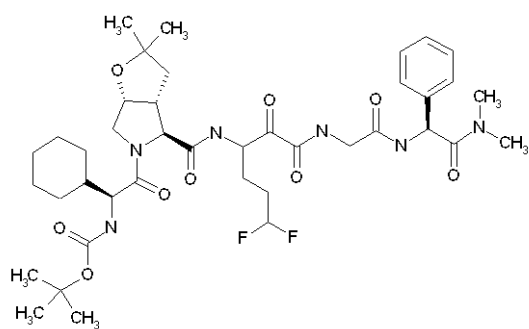
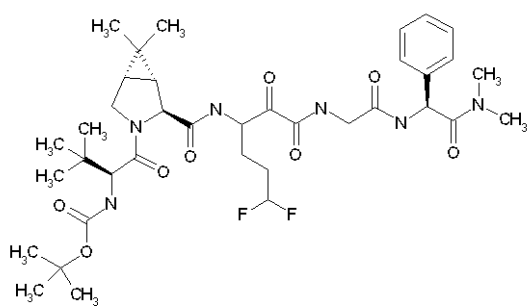
## 【化 67】



## 【化 6 8】

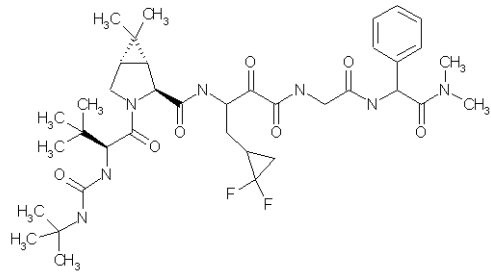
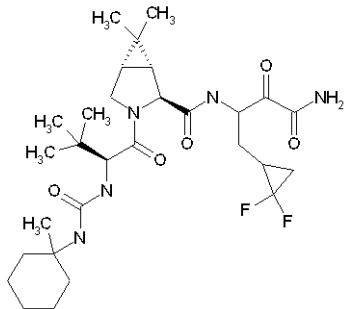
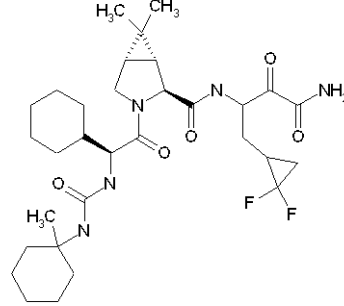
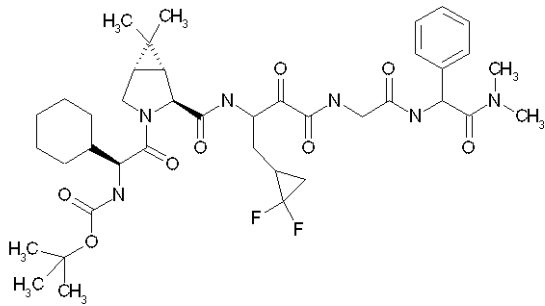
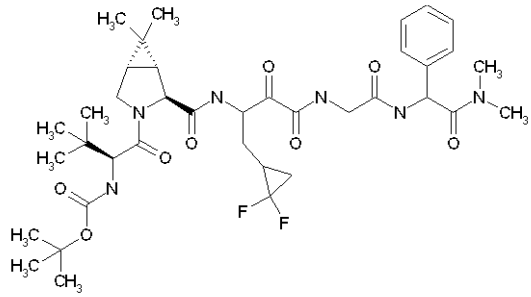
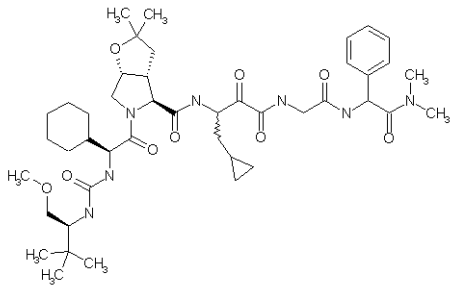
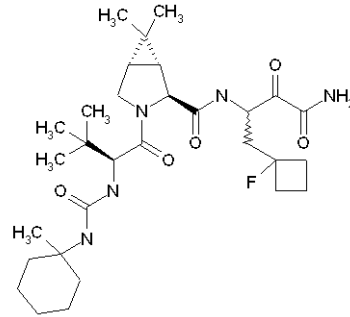
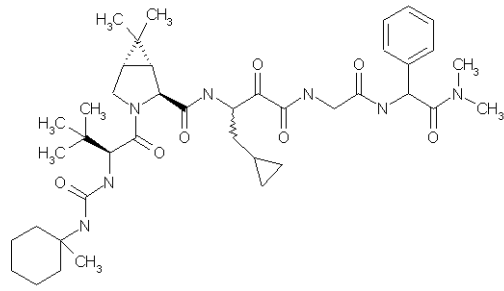


## 【化 6 9】

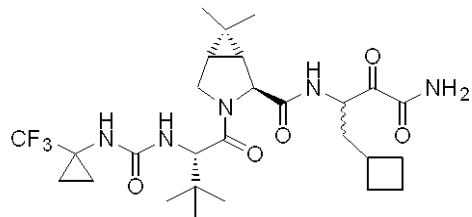
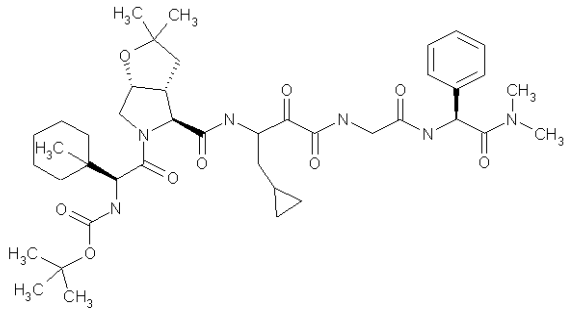




## 【化 7 0】



## 【化 7 1】



および

## 【請求項 38】

H C V 関連障害処置用医薬組成物であって、1 種以上の請求項 3 7 記載の化合物の治療有効量および医薬上許容される担体を含有する組成物。

【請求項 3 9】

さらに抗ウイルス剤を含む、請求項 3 8 記載の医薬組成物。

【請求項 4 0】

さらにインターフェロンまたは P E G - インターフェロン 結合体を含む、請求項 3 9 記載の医薬組成物。

【請求項 4 1】

抗ウイルス剤がリバビリンであり、インターフェロンが - インターフェロンである、請求項 4 0 記載の医薬組成物。

【請求項 4 2】

C 型肝炎ウイルス関連障害の処置用医薬組成物の製造における請求項 3 7 記載の化合物の使用であって、該医薬組成物が 1 種以上の請求項 3 7 記載の化合物の有効量を含む、使用。

【請求項 4 3】

H C V プロテアーゼを、1 種以上の請求項 3 7 記載の化合物と接触させる工程を包含する、C 型肝炎ウイルス (H C V) プロテアーゼ活性の調節方法。

【請求項 4 4】

1 つ以上の C 型肝炎の症状の処置、予防または改善用医薬組成物の製造における請求項 3 7 記載の化合物の使用であって、該医薬組成物が 1 種以上の請求項 3 7 記載の化合物の有効量を含む、使用。

【請求項 4 5】

H C V プロテアーゼが N S 3 / N S 4 a プロテアーゼである、請求項 4 3 記載の方法。

【請求項 4 6】

化合物が H C V N S 3 / N S 4 a プロテアーゼを阻害する、請求項 4 4 記載の使用。

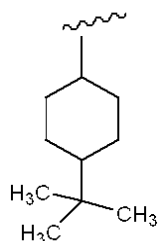
【請求項 4 7】

C 型肝炎ウイルス (H C V) ポリペプチドのプロセシングの調節方法であって、ポリペプチドがプロセシングされる条件下で H C V ポリペプチドを含む組成物を 1 種以上の請求項 3 7 記載の化合物と接触させる工程を包含する方法。

【請求項 4 8】

$R^3$  が以下である、請求項 4 記載の化合物：

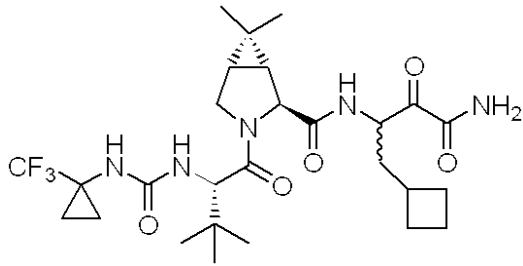
【化 7 2】



【請求項 4 9】

H C V プロテアーゼ阻害活性を示す化合物、または該化合物の鏡像異性体、立体異性体、回転異性体、互変異性体、ラセミ体もしくはプロドラッグ、または該化合物もしくは該プロドラッグの医薬上許容される塩もしくは溶媒和物であって、該化合物は以下に示す構造で表される化合物である化合物：

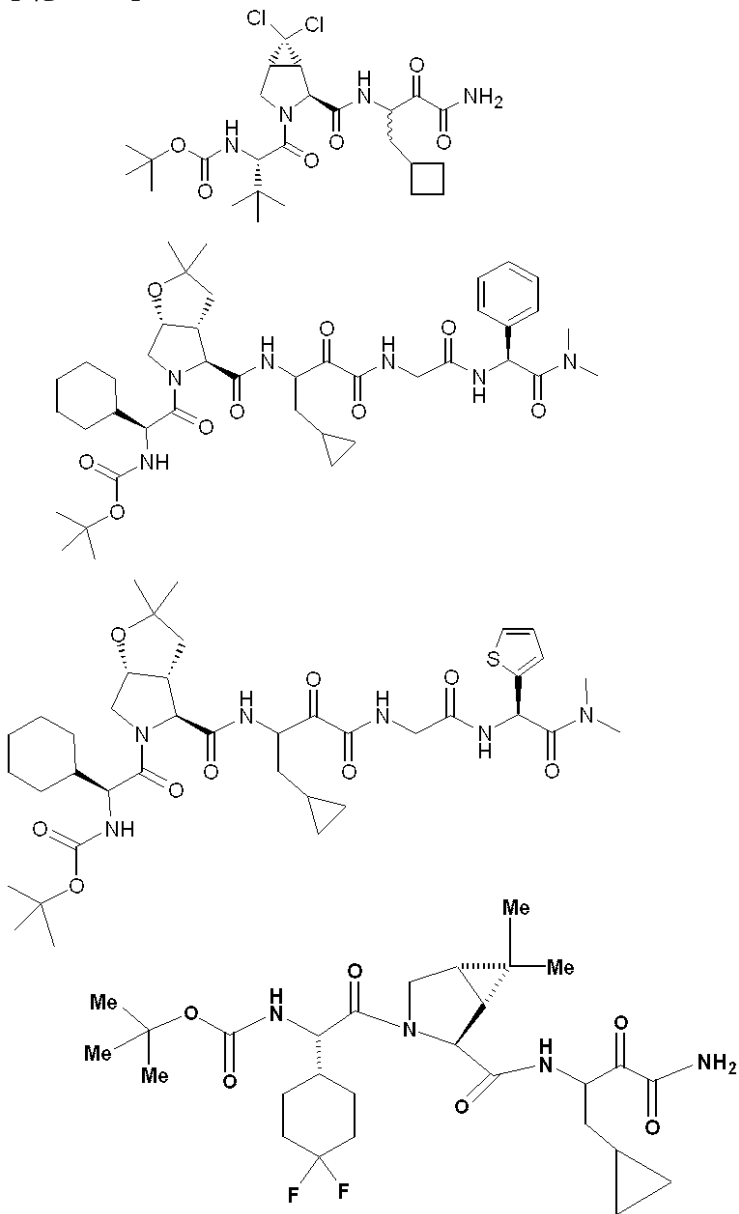
## 【化 7 3】



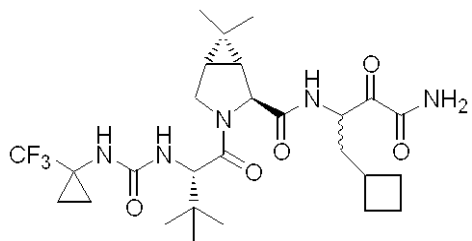
## 【請求項 5 0】

有効成分として以下から選択される化合物、または該化合物の鏡像異性体、立体異性体、回転異性体、互変異性体、ラセミ体もしくはプロドラッグ、または該化合物もしくは該プロドラッグの医薬上許容される塩もしくは溶媒和物を含む医薬組成物：

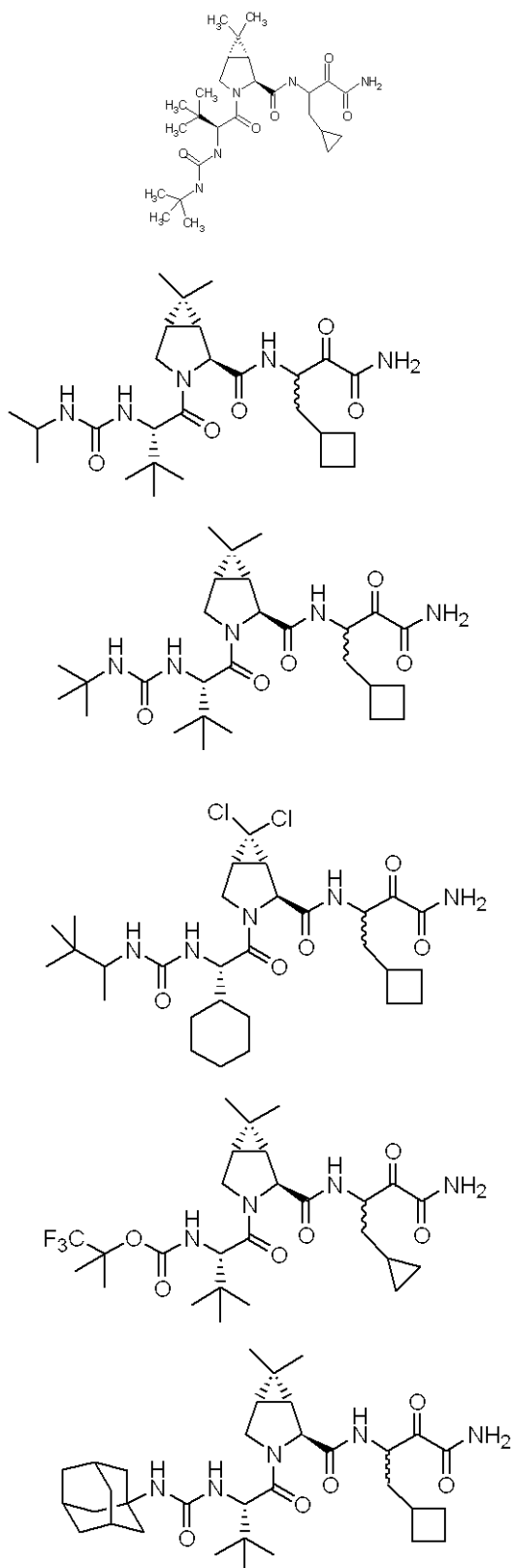
## 【化 7 4】



【化 7 5】



## 【化 7 6】



## 【請求項 5 1】

さらに抗ウイルス剤を含有する、請求項 5 0記載の医薬組成物。

## 【請求項 5 2】

さらにインターフェロンまたはPEG-インターフェロン 結合体を含有する、請求項 5 1記載の医薬組成物。

## 【請求項 5 3】

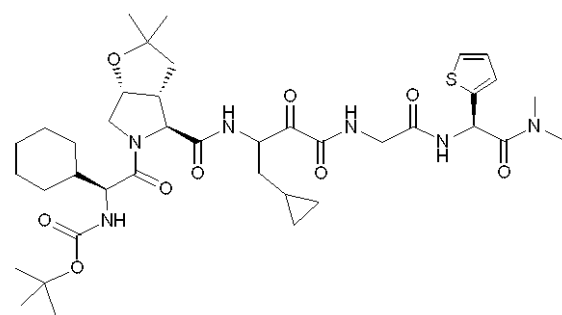
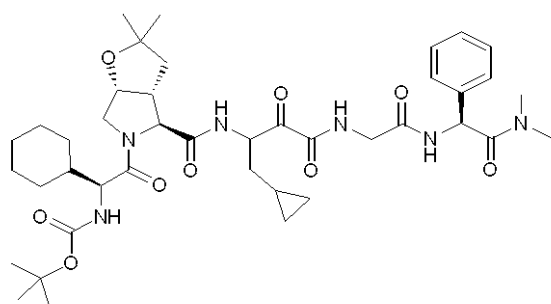
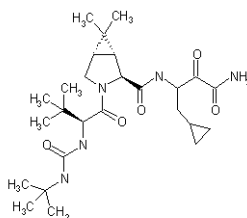
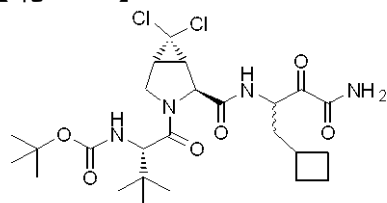
抗ウイルス剤がリバビリンであり、インターフェロンが -インターフェロンである、

請求項 5 2 記載の医薬組成物。

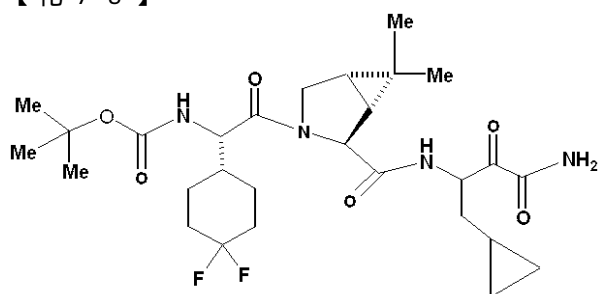
【請求項 5 4】

H C V 関連障害の処置用医薬組成物の製造における、以下から選択される化合物、または該化合物の鏡像異性体、立体異性体、回轉異性体、互変異性体、ラセミ体もしくはプロドラッグ、または該化合物もしくは該プロドラッグの医薬上許容される塩もしくは溶媒和物の使用であって、該医薬組成物は治療有効量の該化合物を含み、処置を必要とする患者に投与される、使用：

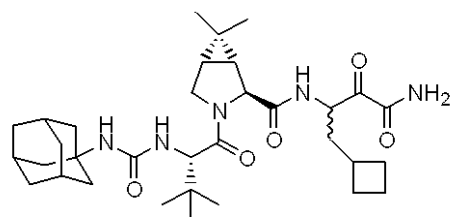
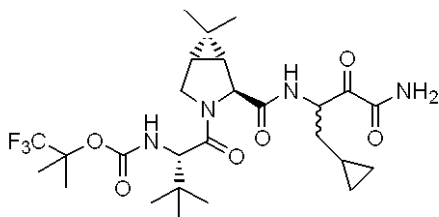
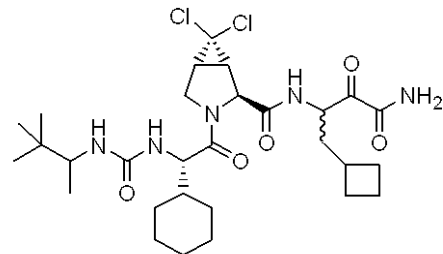
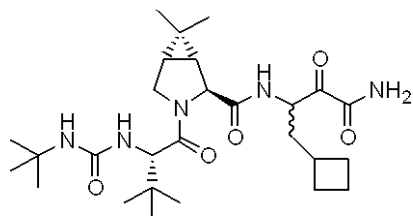
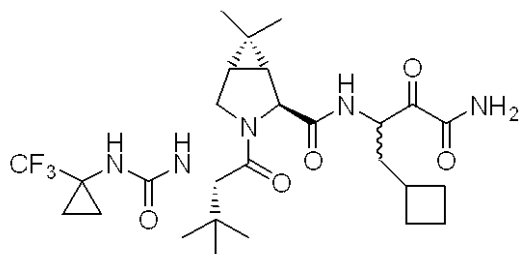
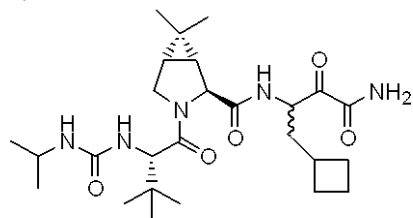
【化 7 7】



【化 7 8】



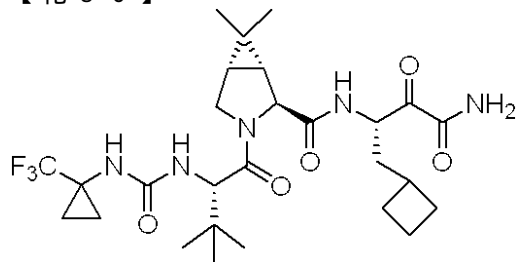
## 【化 7 9】



## 【請求項 5 5】

下記式を有する請求項 4 9 記載の化合物：

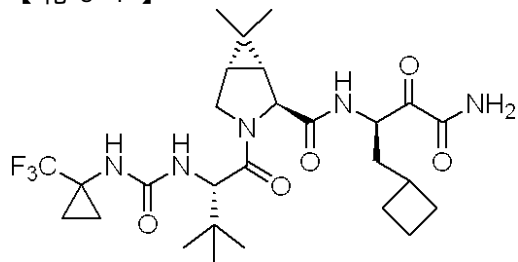
## 【化 8 0】



## 【請求項 5 6】

下記式を有する請求項 4 9 記載の化合物：

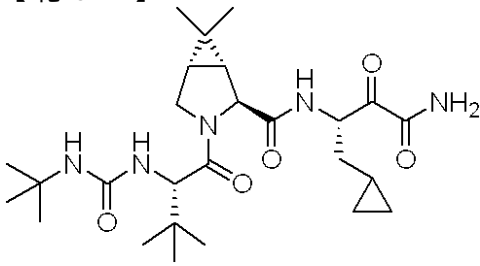
## 【化 8 1】



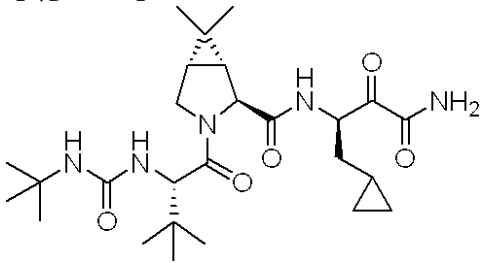
## 【請求項 5 7】

化合物が以下から選択される請求項 5 0 記載の医薬組成物：

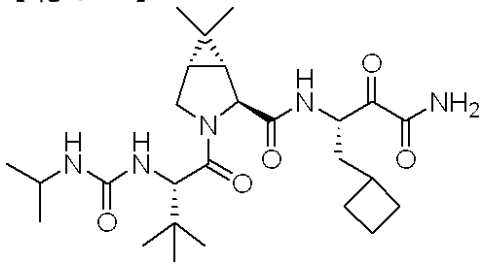
【化 8 2】



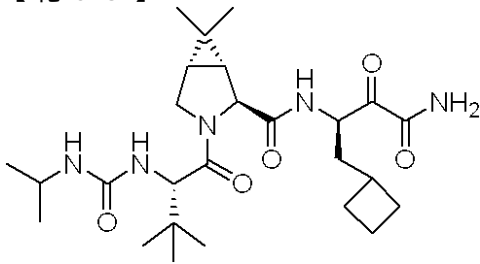
【化 8 3】



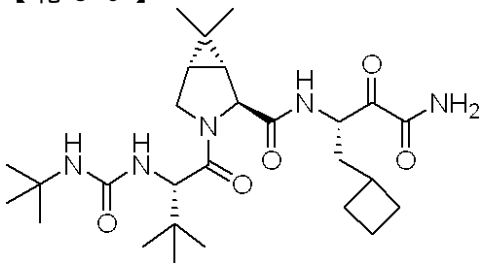
【化 8 4】



【化 8 5】

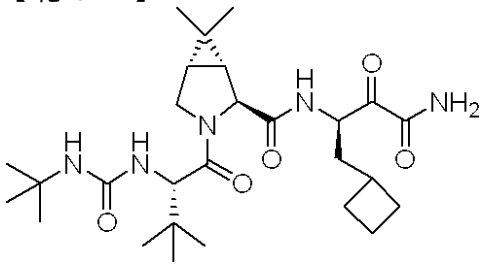


【化 8 6】

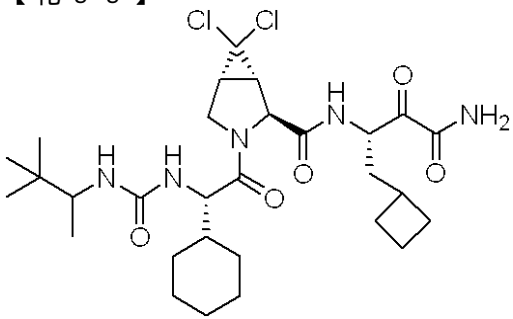




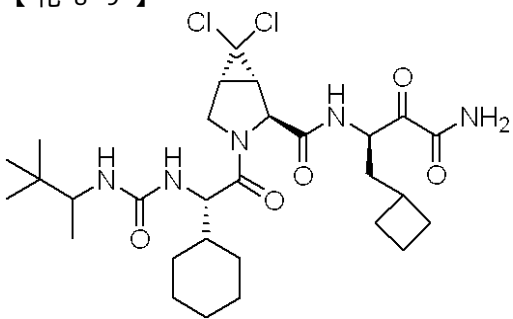
【化 8 7】



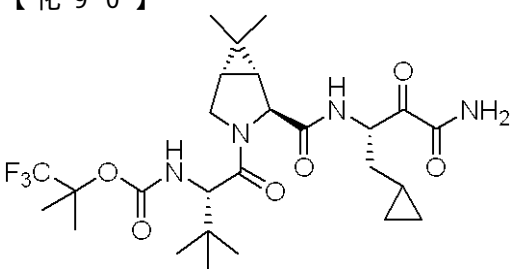
【化 8 8】



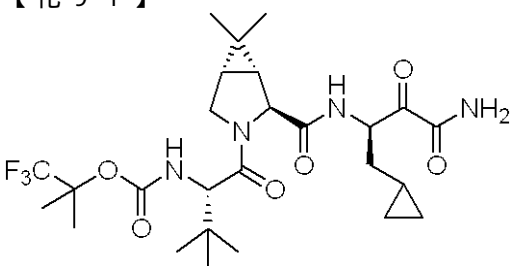
【化 8 9】



【化 9 0】



【化 9 1】

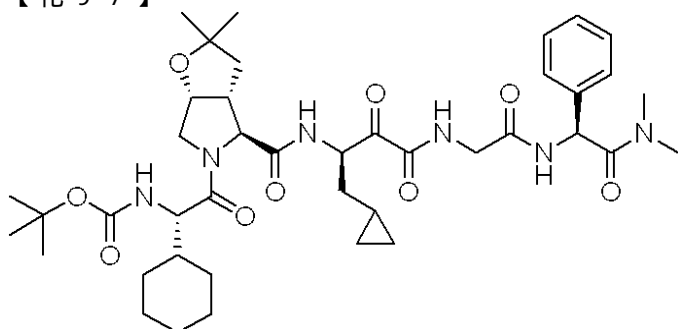


CC(C)(C)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C1CCC1)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C2CCC2)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C3C4C5C6C7C8C9C4C5C6C7C8C9)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C10C11C12C13C14C15C16C11C12C13C14C15)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C17C18C19C20C21C22C17C18C19C20C21)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C23C24C25C26C27C28C23C24C25C26C27)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C29C30C31C32C33C34C29C30C31C32C33)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C35C36C37C38C39C40C35C36C37C38C39)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C41C42C43C44C45C46C41C42C43C44C45)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C47C48C49C50C51C52C47C48C49C50C51)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C53C54C55C56C57C58C53C54C55C56C57)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C59C60C61C62C63C64C59C60C61C62C63)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C65C66C67C68C69C70C65C66C67C68C69)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C71C72C73C74C75C76C71C72C73C74C75)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C77C78C79C80C81C82C77C78C79C80C81)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C83C84C85C86C87C88C83C84C85C86C87)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C89C90C91C92C93C94C89C90C91C92C93)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C95C96C97C98C99C100C95C96C97C98C99)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C101C102C103C104C105C106C101C102C103C104C105)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C107C108C109C110C111C112C107C108C109C110C111)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C113C114C115C116C117C118C113C114C115C116C117)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C119C120C121C122C123C124C119C120C121C122C123)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C125C126C127C128C129C130C125C126C127C128C129)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C131C132C133C134C135C136C131C132C133C134C135)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C137C138C139C140C141C142C137C138C139C140C141)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C143C144C145C146C147C148C143C144C145C146C147)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C149C150C151C152C153C154C149C150C151C152C153)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C155C156C157C158C159C160C155C156C157C158C159)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C161C162C163C164C165C166C161C162C163C164C165)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C167C168C169C170C171C172C167C168C169C170C171)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C173C174C175C176C177C178C173C174C175C176C177)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C179C180C181C182C183C184C179C180C181C182C183)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C185C186C187C188C189C190C185C186C187C188C189)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C191C192C193C194C195C196C191C192C193C194C195)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C197C198C199C200C201C202C197C198C199C200C201)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C203C204C205C206C207C208C203C204C205C206C207)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C209C210C211C212C213C214C209C210C211C212C213)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C215C216C217C218C219C220C215C216C217C218C219)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C221C222C223C224C225C226C221C222C223C224C225)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C227C228C229C230C231C232C227C228C229C230C231)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C233C234C235C236C237C238C233C234C235C236C237)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C239C240C241C242C243C244C239C240C241C242C243)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C245C246C247C248C249C250C245C246C247C248C249)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C251C252C253C254C255C256C251C252C253C254C255)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C257C258C259C260C261C262C257C258C259C260C261)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C263C264C265C266C267C268C263C264C265C266C267)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C269C270C271C272C273C274C269C270C271C272C273)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C275C276C277C278C279C280C275C276C277C278C279)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C281C282C283C284C285C286C281C282C283C284C285)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C287C288C289C290C291C292C287C288C289C290C291)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C293C294C295C296C297C298C293C294C295C296C297)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C299C300C301C302C303C304C299C300C301C302C303)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C305C306C307C308C309C310C305C306C307C308C309)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C311C312C313C314C315C316C311C312C313C314C315)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C317C318C319C320C321C322C317C318C319C320C321)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C323C324C325C326C327C328C323C324C325C326C327)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C329C330C331C332C333C334C329C330C331C332C333)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C335C336C337C338C339C340C335C336C337C338C339)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C341C342C343C344C345C346C341C342C343C344C345)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C347C348C349C350C351C352C347C348C349C350C351)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C353C354C355C356C357C358C353C354C355C356C357)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C359C360C361C362C363C364C359C360C361C362C363)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C365C366C367C368C369C370C365C366C367C368C369)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C371C372C373C374C375C376C371C372C373C374C375)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C377C378C379C380C381C382C377C378C379C380C381)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C383C384C385C386C387C388C383C384C385C386C387)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C389C390C391C392C393C394C389C390C391C392C393)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C395C396C397C398C399C400C395C396C397C398C399)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C401C402C403C404C405C406C401C402C403C404C405)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C407C408C409C410C411C412C407C408C409C410C411)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](C413C414C415C416C417C418C413C414C415C416C417)C(=O)NCC(=O)N[C@@H](

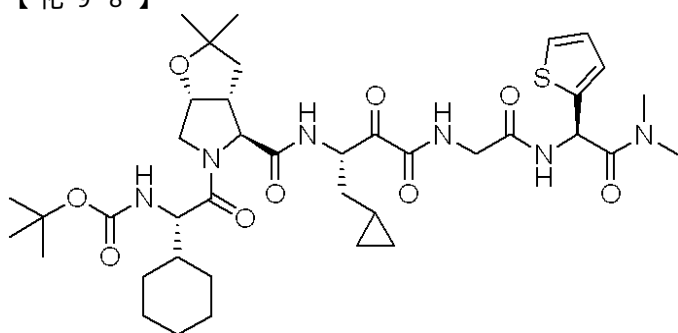
Chemical structure of compound 10, showing a bicyclic amide, a pyrrolidine ring, and a cyclobutyl group.

CC(C)(C)OC(=O)N[C@@H](C(C)(C)C)C(=O)N[C@@H](C1CC2CC(C1)CC2)C(=O)N[C@@H](C3CC(C)(C)CC3)C(=O)NCC(C)(C)OC(=O)NC(C)(C)C(=O)N1CCC(CC1)C(=O)NC(C)C(=O)NCC2(CCCC2)C(=O)C(=O)NCN(C)C(=O)[C@H](c1ccccc1)NC(=O)CN[C@@H](C2CC2)C(=O)N[C@@H](C3CC4CC(C(C3)C4)C5CC(C(C5)C)C6CC(C(C6)C)C7CC(C(C7)C)C8CC(C(C8)C)C9CC(C(C9)C)C)C(=O)N[C@@H](C10CC10)C(=O)N1CC(C(C1)C(C2C(C(C)C)OC2C1)C)C

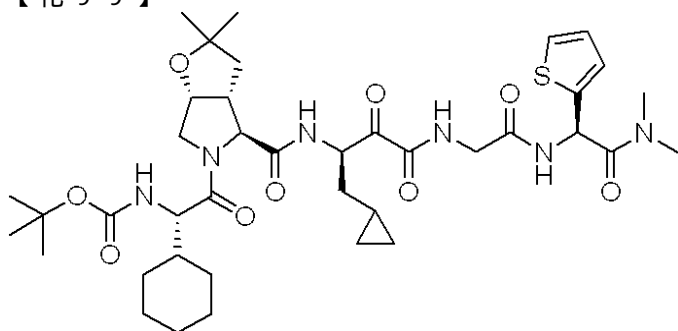
【化 9 7】



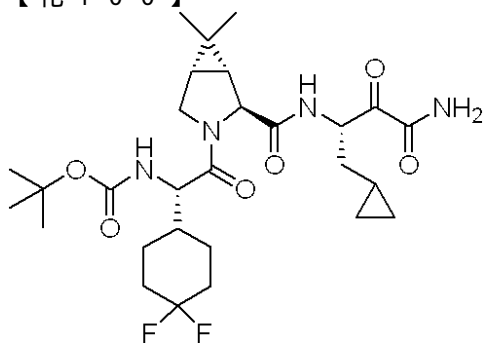
【化 9 8】



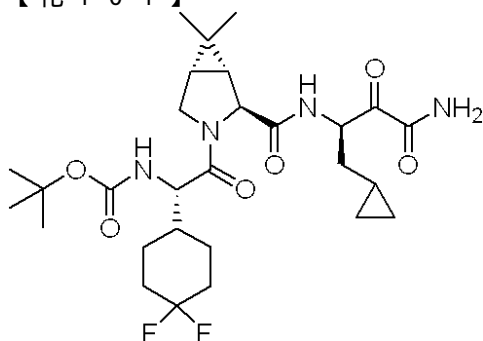
【化 9 9】



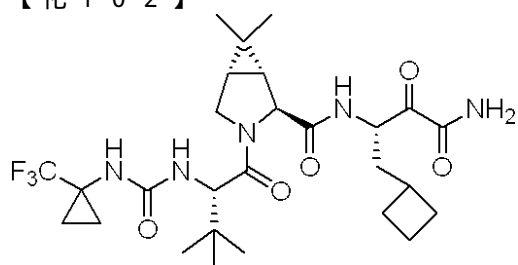
【化 1 0 0】



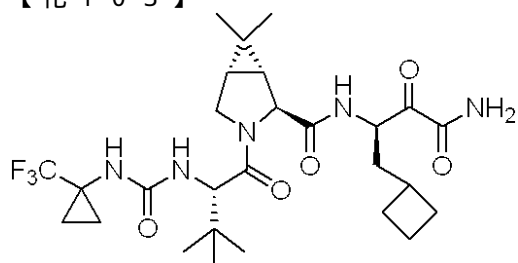
## 【化 1 0 1】



## 【化 1 0 2】



## 【化 1 0 3】



## 【請求項 5 8】

さらに抗ウイルス剤を含む、請求項 5 7記載の医薬組成物。

## 【請求項 5 9】

さらにインターフェロンまたは PEG 化インターフェロン 結合体を含む、請求項 5 8記載の医薬組成物。

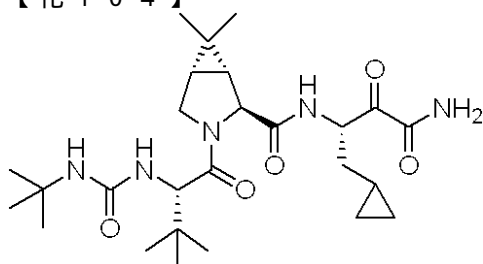
## 【請求項 6 0】

抗ウイルス剤がリバビリンであり、インターフェロンが  $\alpha$ -インターフェロンである、請求項 5 9記載の医薬組成物。

## 【請求項 6 1】

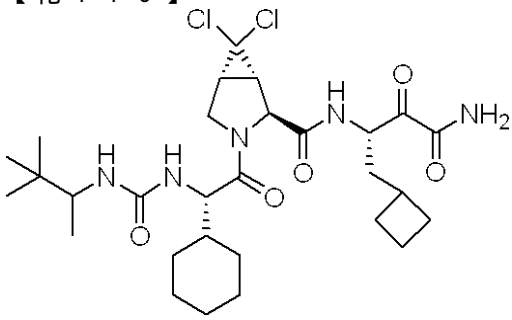
化合物が以下から選択される請求項 5 4記載の使用：

## 【化 1 0 4】

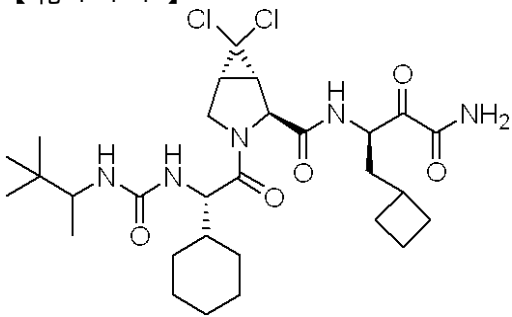


CC(C)(C)NC(=O)NC(C)(C)C(=O)N[C@@H](C(=O)N)C[C@H](C1CC1)C(=O)NCC(C)NC(=O)NC(=O)C(C)(C)C(=O)N[C@@H](C1CCC1)C(=O)N[C@H](C2CC(C)C2)C(=O)C3CC(C)C3CC(C)NC(=O)NC(=O)C(C)(C)C(=O)N[C@@H](C(=O)N)C[C@H](C1CCC1)C(=O)NCC(C)(C)NC(=O)NC(=O)C[C@H](C(C)(C)C)C(=O)N[C@@H](C(=O)N)C[C@H](C1CCC1)C(=O)NCC(C)(C)NC(=O)NC(=O)C(C)(C)C(=O)N[C@@H](C(=O)N)C[C@H]1C=CC=C1

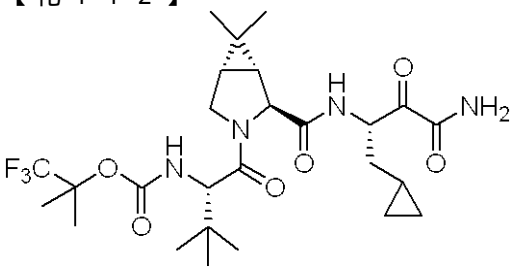
## 【化 1 1 0】



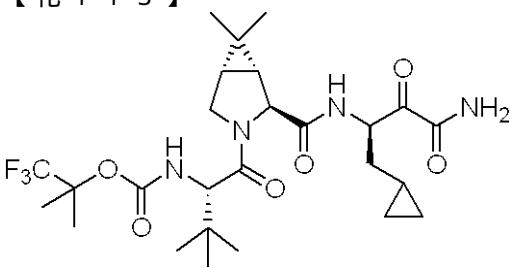
## 【化 1 1 1】



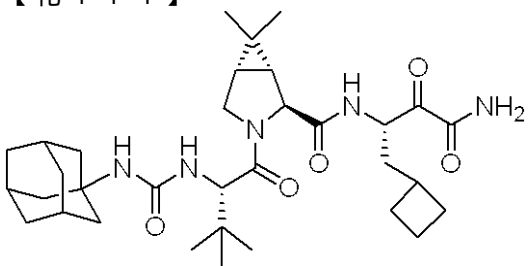
## 【化 1 1 2】



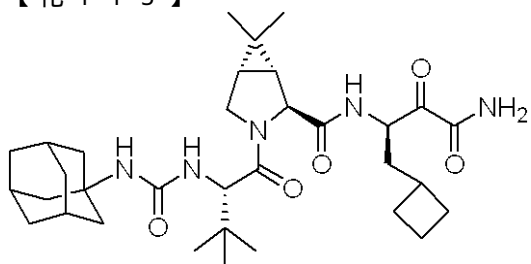
## 【化 1 1 3】



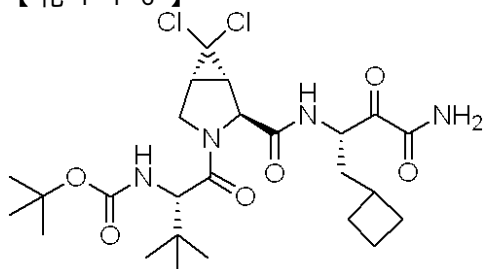
## 【化 1 1 4】



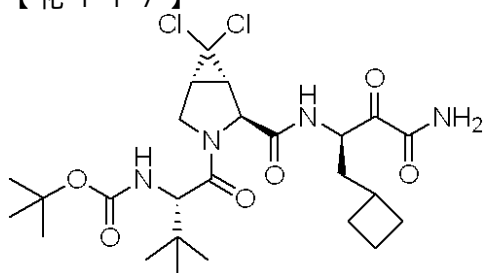
【化 1 1 5】



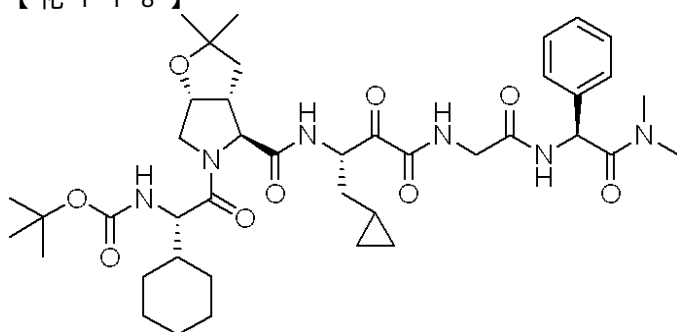
【化 1 1 6】



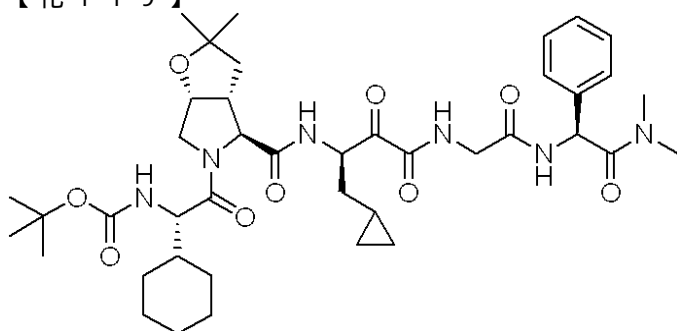
【化 1 1 7】



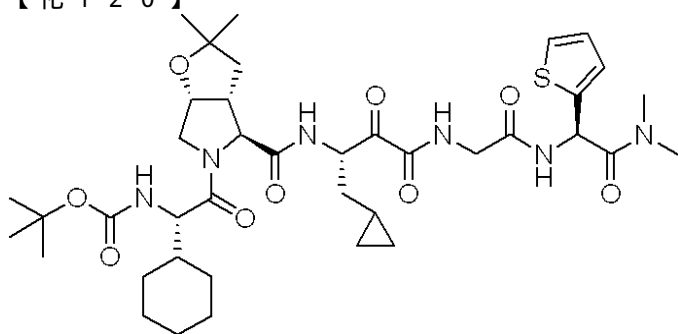
【化 1 1 8】



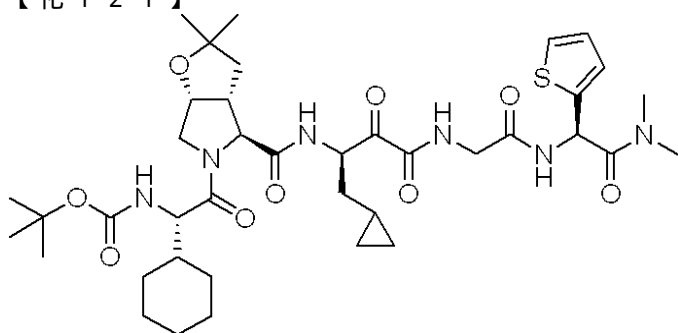
【化 1 1 9】



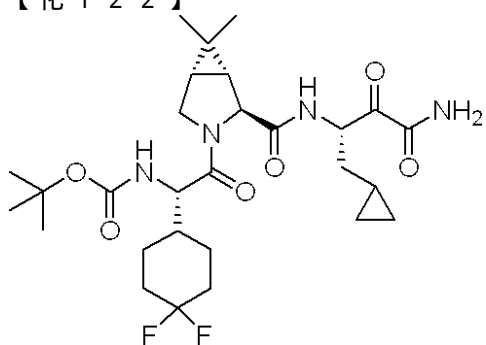
【化 1 2 0】



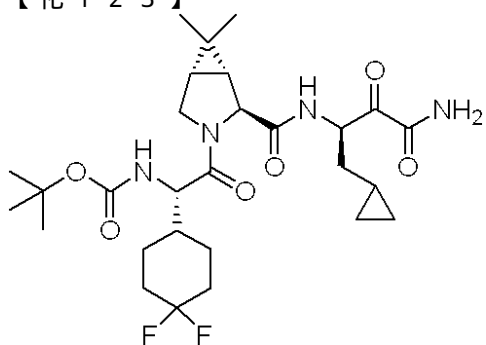
【化 1 2 1】



【化 1 2 2】

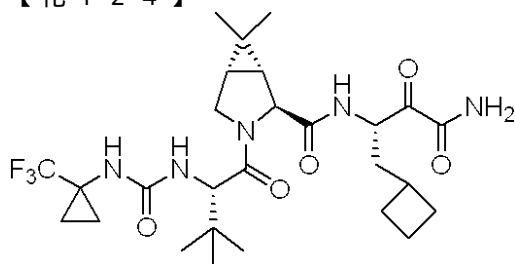


【化 1 2 3】

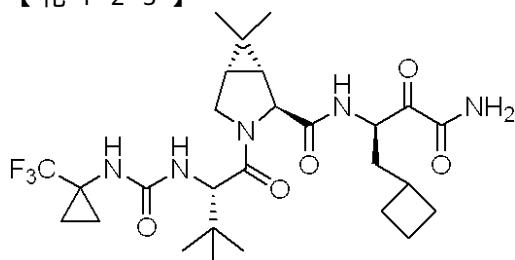




## 【化 1 2 4】



## 【化 1 2 5】



## 【請求項 6 2】

請求項 1 記載の化合物から選択される化合物であって、該化合物の鏡像異性体、立体異性体、回転異性体、互変異性体、ラセミ体およびプロドラッグ、ならびに該化合物または該プロドラッグの医薬上許容される塩または溶媒和物を包含する化合物を有効成分として含有し、さらにインターフェロンを含有する医薬組成物。

## 【請求項 6 3】

インターフェロンが  $\alpha$ -インターフェロンまたは PEG 化インターフェロンである、請求項 6 2 記載の医薬組成物。

## 【請求項 6 4】

経口または皮下投与に適切である、請求項 6 3 記載の医薬組成物。

## 【請求項 6 5】

請求項 3 7 記載の化合物から選択される化合物であって、該化合物の鏡像異性体、立体異性体、回転異性体、互変異性体、ラセミ体およびプロドラッグ、ならびに該化合物または該プロドラッグの医薬上許容される塩または溶媒和物を包含する化合物を有効成分として含有し、さらにインターフェロンを含有する医薬組成物。

## 【請求項 6 6】

インターフェロンが  $\alpha$ -インターフェロンまたは PEG 化インターフェロンである、請求項 6 5 記載の医薬組成物。

## 【請求項 6 7】

経口または皮下投与に適切である、請求項 6 6 記載の医薬組成物。

## 【請求項 6 8】

さらにインターフェロンを含む、請求項 5 0 記載の医薬組成物。

## 【請求項 6 9】

インターフェロンが  $\alpha$ -インターフェロンまたは PEG 化インターフェロンである、請求項 6 8 記載の医薬組成物。

## 【請求項 7 0】

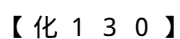
経口または皮下投与に適切である、請求項 6 9 記載の医薬組成物。

## 【請求項 7 1】

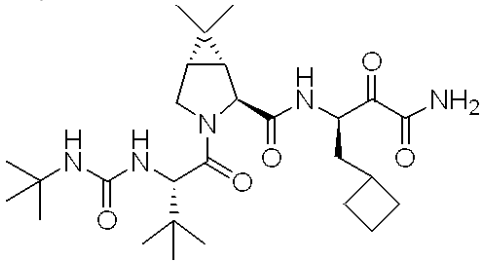
さらに抗ウイルス剤を含有する、請求項 6 2 記載の医薬組成物。

## 【請求項 7 2】

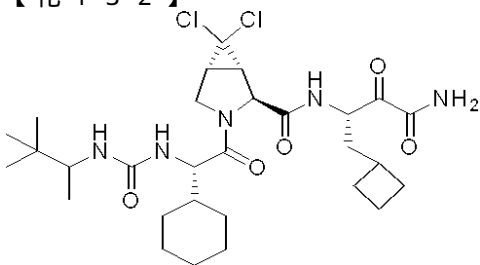
請求項 5 5 または 5 6 の化合物から選択される化合物であって、該化合物のプロドラッグ、および該化合物または該プロドラッグの医薬上許容される塩または溶媒和物を包含する化合物を有効成分として含有し、さらにインターフェロンを含有する医薬組成物。



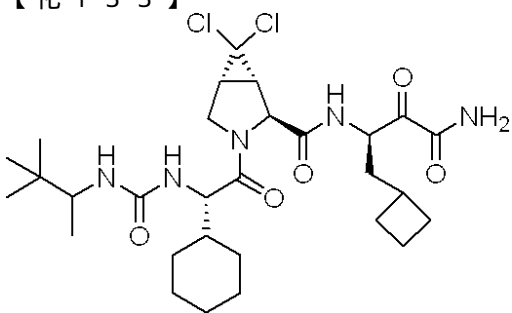
【化 1 3 1】



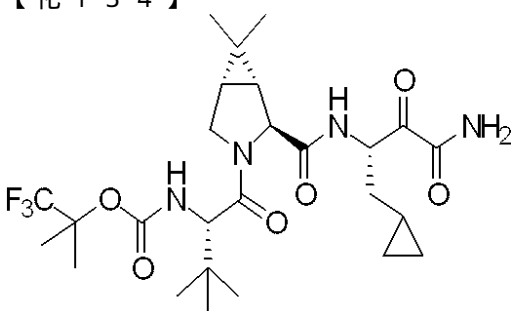
【化 1 3 2】



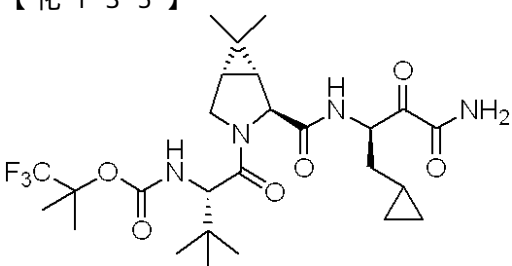
【化 1 3 3】



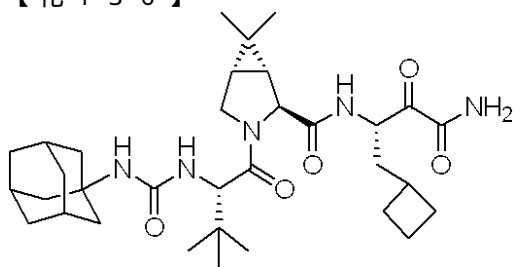
【化 1 3 4】



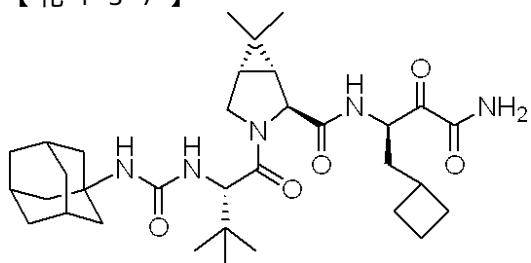
【化 1 3 5】



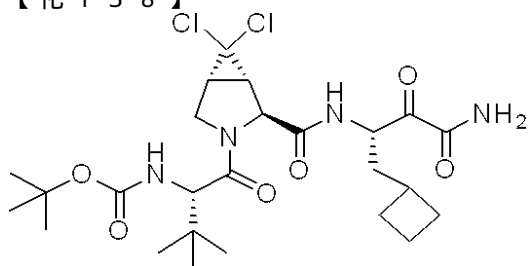
## 【化 1 3 6】



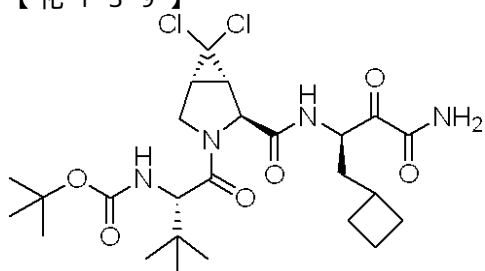
## 【化 1 3 7】



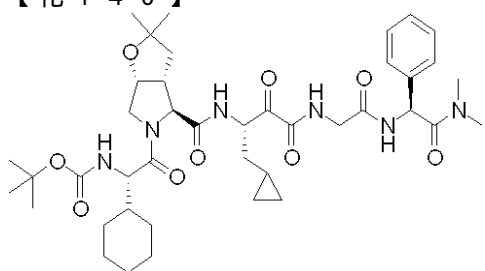
## 【化 1 3 8】



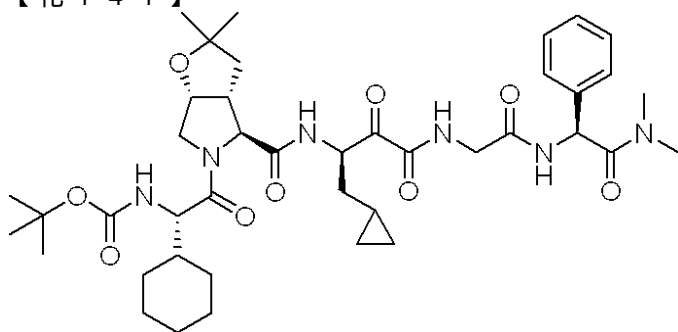
## 【化 1 3 9】



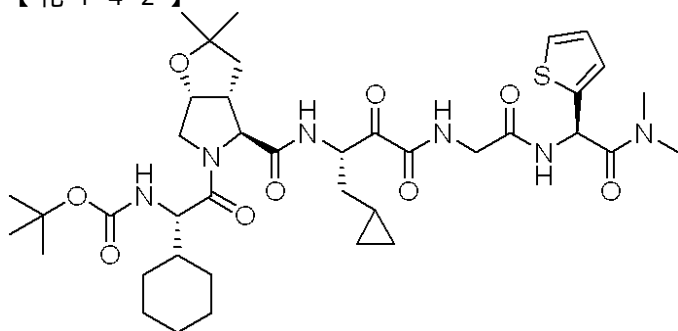
## 【化 1 4 0】



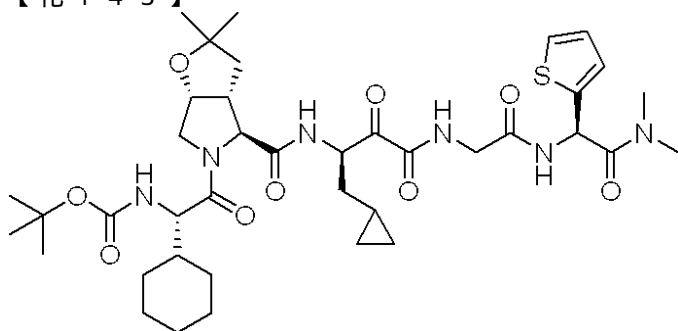
【化 1 4 1】



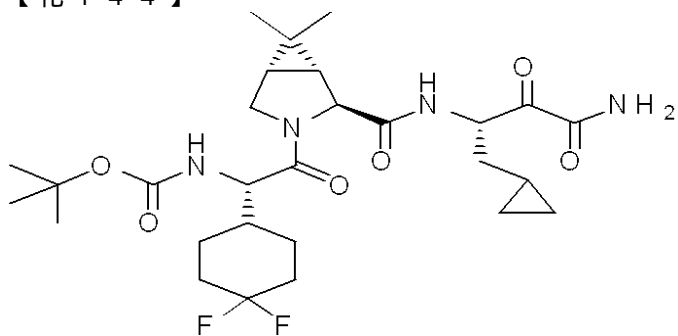
【化 1 4 2】



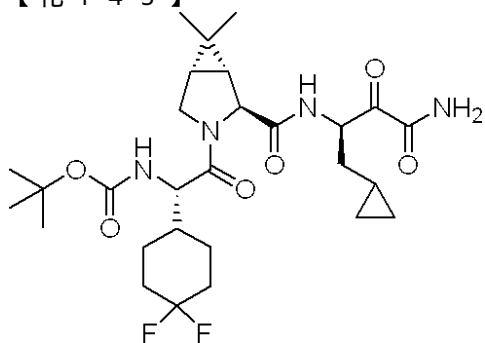
【化 1 4 3】



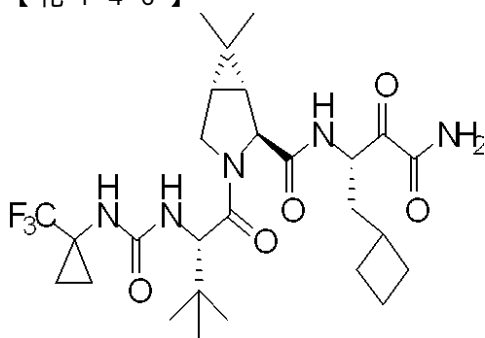
【化 1 4 4】



【化 1 4 5】



【化 1 4 6】



【化 1 4 7】

