

【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 17 年 12 月 22 日 (2005.12.22)

【公表番号】特表 2004-537506(P2004-537506A)

【公表日】平成 16 年 12 月 16 日 (2004.12.16)

【年通号数】公開・登録公報 2004-049

【出願番号】特願 2002-569152(P2002-569152)

【国際特許分類第 7 版】

C 07 J 1/00

A 61 K 31/5685

A 61 K 31/58

A 61 K 31/704

A 61 P 1/04

A 61 P 3/06

A 61 P 7/00

A 61 P 7/04

A 61 P 7/06

A 61 P 9/00

A 61 P 9/10

A 61 P 9/12

A 61 P 15/00

A 61 P 17/00

A 61 P 25/00

A 61 P 25/28

A 61 P 29/00

A 61 P 31/00

A 61 P 31/04

A 61 P 31/12

A 61 P 35/00

A 61 P 37/06

A 61 P 37/08

C 07 J 17/00

C 07 J 21/00

// C 07 M 7:00

【F I】

C 07 J 1/00

A 61 K 31/5685

A 61 K 31/58

A 61 K 31/704

A 61 P 1/04

A 61 P 3/06

A 61 P 7/00

A 61 P 7/04

A 61 P 7/06

A 61 P 9/00

A 61 P 9/10

A 61 P 9/12

A 61 P 15/00

A 61 P 17/00

A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 25/00 1 0 1
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 31/00
 A 6 1 P 31/04
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 37/08
 C 0 7 J 17/00
 C 0 7 J 21/00
 C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成17年3月1日(2005.3.1)

【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

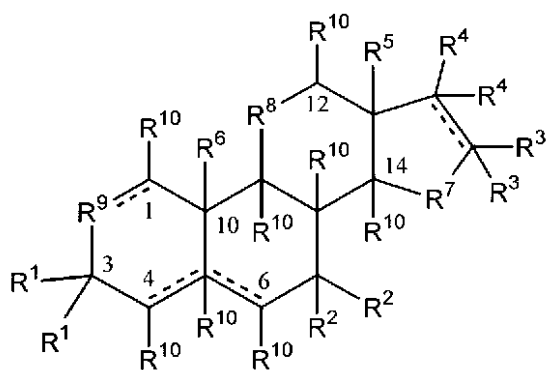
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

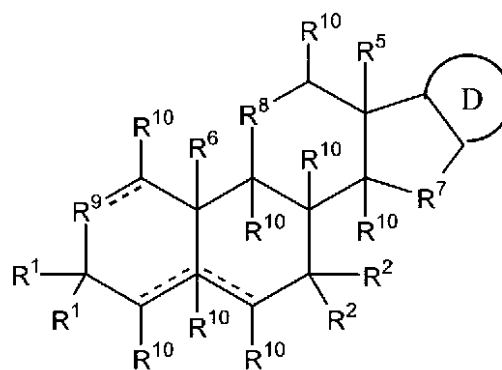
【請求項1】

下記構造：

【化1】



又は



(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 及び R^{10} は、それぞれ独立に $-H$ 、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=NOH$ 、 $=CH_2$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミド、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、アシル基、チオアシル基、カーボネート、カルバメート、ハロゲン、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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ヘテロ環、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ヌクレオシド、ヌクレオチド、オリゴヌクレオチド、スピロ環又はポリマーであるか、2つの隣接した $R^1 \sim R^6$ 及び R^{10} の1個又は複数は、

独立して選択されたアセタール、チオアセタール、ケタール又はチオケタールを含み、

1つの R^4 は、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、チオエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、チオエーテル、カルバメート、カーボネート、ポリマー、 $-OCH_3$ 及び $-OC_2H_5$ から選択されるエーテル又は、 $-O-C(O)-CH_3$ 及び $-O-C(O)-C_2H_5$ から選択されるエステルであり、もう一方の R^4 は、 $-H$ 、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、アシル、チオアシル、ヘテロ環、 $-SCN$ 又は $-CN$ であり、

R^7 は、 $-C(R^{10})_2-$ 、 $-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2-$ 、 $-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2-$ 、 $-C(R^{10})_2-O-C(R^{10})_2-$ 、 $-C(R^{10})_2-S-C(R^{10})_2-$ 、 $-C(R^{10})_2-NR^{PR}-C(R^{10})_2-$ 、 $-O-$ 、 $-O-C(R^{10})_2-$ 、 $-S-$ 、 $-S-C(R^{10})_2-$ 、 $-NR^{PR}-$ 又は $-NR^{PR}-C(R^{10})_2-$ であり、

R^8 及び R^9 は、独立に $-C(R^{10})_2-$ 、 $-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2-$ 、 $-O-$ 、 $-O-C(R^{10})_2-$ 、 $-S-$ 、 $-S-C(R^{10})_2-$ 、 $-NR^{PR}-$ 又は $-NR^{PR}-C(R^{10})_2-$ であるか、 R^8 又は R^9 の一方又は両方は、独立して存在せずに5員環を残し、

R^{13} は、独立に C_{1-6} アルキルであり、

R^{PR} は、独立に $-H$ 又は保護基であり、

Dは、ヘテロ環であるか飽和炭素原子を含む4 -、5 -、6 - 又は7 - 員環であり、ここで4 -、5 -、6 - 又は7 - 員環の1、2又は3個の環炭素原子は、 $-O-$ 、 $-S-$ 又は $-NR^{PR}-$ で置換されていてもよく、或いはヘテロ環の1、2又は3個の水素原子若しくは4 -、5 -、6 - 又は7 - 員環の1、2又は3個の水素原子は $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミド、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、アシル、チオアシル、カーボネート、カルバメート、チオアセタール、ハロゲン、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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ヘテロ環、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ヌクレオシド、ヌクレオチド、オリゴヌクレオチド、ポリマーで置換されているか、D中の1個又は複数の環炭素は、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=N-OH$ 、 $=CH_2$ 又はスピロ環で置換されているか、2つの隣接するD環炭素は、独立して選択されたアセタール、チオアセタール、ケタール又はチオケタール部分を含んでいるか、Dは、2個の5 - 又は6 - 員環（ここで環は縮合しているか、1個又は2個の結合によって連結されているか、又は代謝作用の前駆体若しくはその生物活性代謝物質である。但し、1つ、2つ、3つ以上の R^{10} の1、4、6、8、9、12及び14位は水素ではない、並びに

(a) 1つの R^1 は、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、 $-NH-C(O)-C_{1-20}$ の置換されていてもよいアルキル、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖又はポリマーであり、もう1つの R^1 は、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-NH-C_{1-20}$ の置換されていてもよいアルキル、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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又は置換されていてもよいヘテロ環である、或いは

(b) 1つの R^2 は、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、 $-NH-C(O)-C_{1-20}$ の置換されていてもよいアルキル、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステ

ル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖又はポリマーであり、もう1つの R^2 は、 $-CHO$ 、 $-CH_2S$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-NH-C_{1-20}$ の置換されていてもよいアルキル、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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又は置換されていてもよいヘテロ環である、或いは

(c) 1つの R^3 は、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、 $-NH-C(O)-C_{1-20}$ の置換されていてもよいアルキル、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖又はポリマーであり、もう1つの R^3 は、 $-H$ 、 $-CHO$ 、 $-CH_2S$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-NH-C_{1-20}$ の置換されていてもよいアルキル、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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又は置換されていてもよいヘテロ環である、或いは

(d) 二重結合は、5 - 6 位にあり、かつ1 - 2 位又は16 - 17 位にあってもよく、及び R^9 は $-CHR^{10}$ であって、 R^{10} は、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、 $-NH-C(O)-C_{1-20}$ の置換されていてもよいアルキル、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ポリマー又は C_{1-20} の置換されていてもよいアルキルである、或いは

(e) 二重結合は、5 - 6 位にあり、かつ1 - 2 位又は16 - 17 位にあってもよく、及び R^7 は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NH-$ 、 $-CHR^{10}$ であって、 R^{10} は、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $=O$ 、 $=S$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、エーテル、チオエーテル、エステル、チオエステル又は C_{1-20} の置換されていてもよいアルキルである、或いは

(f) 二重結合は、5 - 6 位にあり、かつ1 - 2 位又は16 - 17 位にあってもよく、及び R^8 は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NH-$ 、 $-CHR^{10}$ であって、 R^{10} は、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-F$ 又は C_{1-20} の置換されていてもよいアルキルである、或いは

(g) 二重結合は、5 - 6 位にあり、かつ1 - 2 位又は16 - 17 位にあってもよく、及び R^9 は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NH-$ 、 $-CHR^{10}$ であって、 R^{10} は、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $=O$ 、 $=S$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、エーテル、チオエーテル、エステル、チオエステル又は C_{1-20} の置換されていてもよいアルキルである)、

を有する化合物の、対象における血液細胞欠乏の治療用の薬剤を製造するための使用。

【請求項2】

1、4、6、8、9、12及び14位の1個又は2個の R^{10} が独立に、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $=O$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $=S$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、 C_1-C_8 の置換されていてもよいアルキル、チオエステル、チオエーテル、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、アミノ酸、アミド、カルボネート、カルバメート、ポリマー、 $-OCH_3$ 及び $-OC_2H_5$ から選択されるエーテル、又は $-O-C(O)-CH_3$ 及び $-O-C(O)-C_2H_5$ から選択されるエステルである請求項1記載の使用。

【請求項3】

(a) - 配置の R^4 は、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、チオエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、チオエーテル、カルバメート、アミド、カーボネート、ポリマー、 $-OCH_3$ 及び $-OC_2H_5$ から選択されるエーテル、又は $-O-C(O)-CH_3$ 及び $-O-C(O)-C_2H_5$ から選択されるエステルであり、- 配置の R^4 は、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、アシル、チオアシル、 $-SCN$ 又は $-CN$ である、或いは

(b) - 配置の R^4 は、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、チオエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、チオエーテル、カルバメート、アミド、カーボネート、ポリマー、 $-OCH_3$ 及び $-OC_2H_5$ から選択されるエーテル、又は $-O-C(O)-CH_3$ 及び $-O-C(O)-C_2H_5$ から選択されるエステルであり、- 配置の R^4 は、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、アシル、チオアシル、 $-SCN$ 又は $-CN$ である、
請求項 1 又は 2 に記載の使用。

【請求項 4】

(a) 4、6 及び 9 位の 1 個又は 2 個の R^{10} は、 $-F$ 、 $-Cl$ 及び $-OH$ から独立に選択され、或いは

(b) R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、 $-O-C(O)-O-C_{1-20}$ の置換されていてもよいアルキル、 $-O-C(O)-N-C_{1-20}$ の置換されていてもよいアルキル、 $-N-C(O)-O-C_{1-20}$ の置換されていてもよいアルキル又は $-S-C(O)-O-C_{1-20}$ の置換されていてもよいアルキルである、
請求項 1、2 又は 3 に記載の使用。

【請求項 5】

(a) 1 つの R^4 は、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、エステル、エーテル、カーボネート、アミノ酸又はカルバメートであり、もう 1 つの R^4 は、 $-CH_3$ 、 $-C_2H_5$ 、 $-CCCH$ 、 $-CCCH_3$ 、 $-CH=CH_2$ 又は C_{1-8} アルキルである、或いは (b) 9 位の R^{10} は $-F$ 又は $-Cl$ である、請求項 1、2、3 又は 4 に記載の使用。

【請求項 6】

対象が血小板減少症又は好中球減少症を有している、或いは対象が血小板減少症又は好中球減少症にかかっている疑いがある、請求項 1 記載の使用。

【請求項 7】

循環血液中又は組織中で、対象の循環血小板、赤血球、骨髓単球細胞又はそれらの前駆体細胞を検出可能に増加させる請求項 1 記載の使用。

【請求項 8】

対象の循環する 好中球又は血小板 を検出可能に増加させる請求項 7 記載の使用。

【請求項 9】

対象の循環する赤血球を検出可能に増加させる請求項 7 記載の使用。

【請求項 10】

対象が癌又は前癌を有する或いは血球欠乏が放射線曝露又は免疫抑制的化学療法であって癌化学療法もしくは糖質コルチコイド療法であってもよい免疫抑制的化学療法に関連する、請求項 7 記載の使用。

【請求項 11】

対象が腎不全を有する請求項 7 記載の使用。

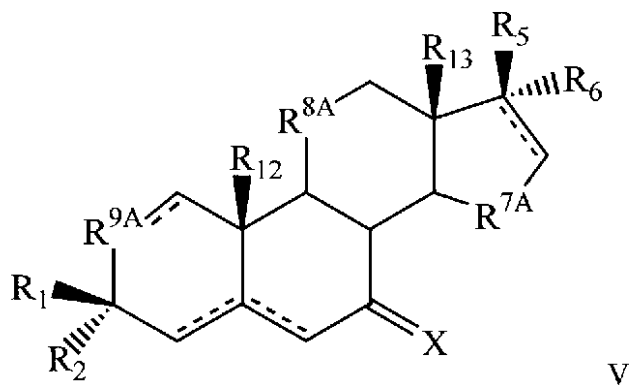
【請求項 12】

対象がヒト又は霊長類である請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の使用。

【請求項 13】

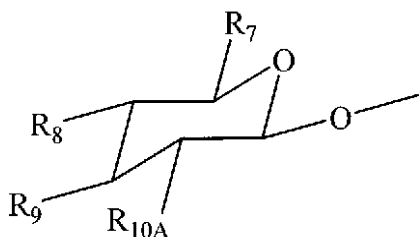
式 V の化合物：

【化 2】



又は薬剤として許容可能なその塩、エステル、アミド、プロドラッグ又は類縁体
 (ここで、点線は単一又は二重結合であり、Xは酸素、硫黄、 $=CH_2$ 又は $=NOH$ であ
 り、 R_1 及び R_2 の1つは $-H$ であり、もう一方は下記式：

【化 3】



を有するグルクロニド基であり、

R_7 はアルキル部分が置換されていてもよいアルキルエステルであり、 R_8 、 R_9 及び R_{10A} は、各々 $-OR_{14}$ であり、 R_{14} は $-H$ 、保護基又は置換されていてもよいアルキルであ
 り、

R_5 及び R_6 は、各々又は一緒になって、 $-H$ 、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $=O$ 、 $-SH$ 、 $=S$ 、 $-SR^{PR}$ 、エステル、チオエステル、エーテル、チオエーテル、カルボネート、カルバ
 メート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖又は置換されてい
 てもよいアルキルであり、

R_{7A} は、 $-C(R^{10})_2-$ 、 $-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2-$ 、 $-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2-$ 、 $-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2-O-C(R^{10})_2-$ 、 $-C(R^{10})_2-S-C(R^{10})_2-$ 、 $-C(R^{10})_2-NR^{PR}-C(R^{10})_2-$ 、 $-O-$ 、 $-O-C(R^{10})_2-$ 、 $-S-$ 、 $-S-C(R^{10})_2-$ 、 $-NR^{PR}$ - 又は $-NR^{PR}-C(R^{10})_2-$ であり、

R_{8A} 及び R_{9A} は、独立に $-C(R^{10})_2-$ 、 $-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2-$ 、 $-O-$ 、 $-O-C(R^{10})_2-$ 、 $-S-$ 、 $-S-C(R^{10})_2-$ 、 $-NR^{PR}$ - 又は $-NR^{PR}-C(R^{10})_2-$ であるか、 R_{8A} 又は R_{9A} の一方又は両方は、独立して存在せずに5員環を残し、

R^{10} は、各々独立して、 $-H$ 、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エ
 ステル、アミド、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、アシル基、チオアシル
 基、カーボネート、カルバメート、ハロゲン、置換されていてもよいアルキル、置換され
 ていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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ール、置換されていてもよいヘテロ環、置換され

ていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ヌクレオシド、ヌクレオチド、オリゴヌクレオチド又はポリマーであり、

R_{12} 及び R_{13} は独立して - H、- OH、- OR^{PR} 又は置換されていてもよいアルキルであり、

R^{PR} は独立して - H 又は保護基であり、

化合物は、1、4、6、8、9、12 及び 14 位の 1 個又は 2 個で、- OH、- OR^{PR}、- SR^{PR}、- N(R^{PR})₂、- O-Si-(R¹³)₃、- CHO、- CHS、- CH=N H、- CN、- SCN、- NO₂、- OSO₃H、- OPO₃H、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミド、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、アシル基、チオアシル基、カーボネート、カルバメート、ハロゲン、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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ヘテロ環、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ヌクレオシド、ヌクレオチド、オリゴヌクレオチド又はポリマーから独立に選択される部分と置換されていてもよい)。

【請求項 14】

R_{14} はエステル、或いは二重結合は 4 - 5 位又は 16 - 17 位に存在する、請求項 13 記載の化合物。

【請求項 15】

(a) R_{12} は - H であり、 R_{13} は - CH₃ 又は - C₂H₅ であり、(b) 1、4、6、8、12 及び 14 位の 1 個又は 2 個は置換され、(c) 9 位は置換され、9 位の当該置換は - F、- Cl、- OH 又は C_{1-20} の置換されていてもよいアルキルであってもよく、或いは (d) 二重結合は 5 - 6 位又は 1 - 2 位及び 5 - 6 位に存在する、請求項 13 又は 14 に記載の化合物。

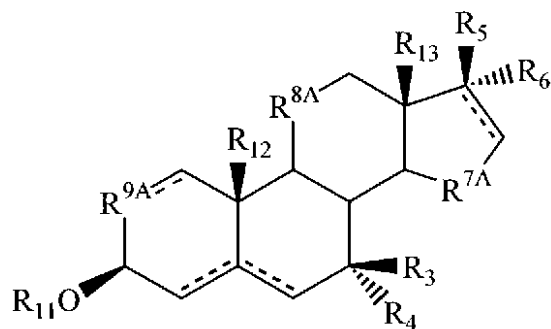
【請求項 16】

請求項 13、14 又は 15 の化合物及び 1 つ又は複数の賦形剤を含む製剤。

【請求項 17】

式 VII の化合物：

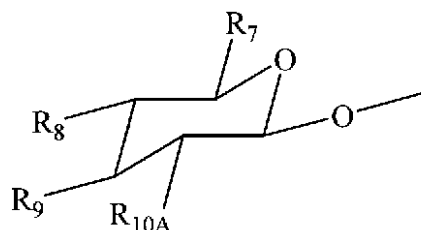
【化 4】



VII

又は薬剤として許容可能なその塩、エステル、アミド又はプロドラッグ
(ここで、点線は二重結合でもよく、 R_3 及び R_4 の 1 つは - H であり、もう一方は下記式：

【化 5】



を有するグルクロニド基であり、

R_7 はアルキル部分が置換されていてもよいアルキルエステルであり、

R_8 、 R_9 及び R_{10A} は、独立して $-OR_{14}$ であり、 R_{14} は $-H$ 、保護基又は置換されていてもよいアルキルであり、

R_5 及び R_6 は、各々又は一緒になって、 $-H$ 、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $=O$ 、 $-SH$ 、 $=S$ 、 $-SR^{PR}$ 、エステル、チオエステル、エーテル、チオエーテル、カルボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖又は置換されていてもよいアルキルであり、

R^{11} は $-H$ 又は保護基であり、

R^{7A} は、 $-C(R^{10})_2-$ 、 $-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2-$ 、 $-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2-$ 、 $-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2-O-C(R^{10})_2-$ 、 $-C(R^{10})_2-S-C(R^{10})_2-$ 、 $-C(R^{10})_2-NR^{PR}-C(R^{10})_2-$ 、 $-O-$ 、 $-O-C(R^{10})_2-$ 、 $-S-$ 、 $-S-C(R^{10})_2-$ 、 $-NR^{PR}$ 又は $-NR^{PR}-C(R^{10})_2-$ 、

R^{8A} 及び R^{9A} は、独立に $-C(R^{10})_2-$ 、 $-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2-$ 、 $-O-$ 、 $-O-C(R^{10})_2-$ 、 $-S-$ 、 $-S-C(R^{10})_2-$ 、 $-NR^{PR}$ 又は $-NR^{PR}-C(R^{10})_2-$ であるか、 R^{8A} 又は R^{9A} の一方又は両方は、独立して存在せずに5員環を残し、

R^{10} は、各々独立して、 $-H$ 、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミド、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、アシル基、チオアシル基、カーボネート、カルバメート、ハロゲン、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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ヘテロ環、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ヌクレオシド、ヌクレオチド、オリゴヌクレオチド又はポリマーであり、

R_{12} 及び R_{13} は独立して $-H$ 、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 又は置換されていてもよいアルキルであり、

R^{PR} は独立して $-H$ 又は保護基であり、

化合物は、1、4、6、8、9、12及び14位の1個又は2個で、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミド、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、アシル基、チオアシル基、カーボネート、カルバメート、ハロゲン、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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ヘテロ環、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ヌクレオシド、ヌクレオチド、オリゴヌクレオチド又はポリマーから独立に選択される部分と置換されていてもよい。

【請求項 18】

R_3 及び R_4 のうち的一方が水素原子であり、 R_1 及び R_2 のうち他方がグルクロニドである、請求項 17 記載の化合物。

【請求項 19】

R_5 及び R_6 のうち的一方が - H 又は置換されていてもよいアルキルであり、 R_5 及び R_6 のうち他方がアセトキシ及びプロピオンオキシから選択されるエステルである、請求項 17 記載の化合物。

【請求項 20】

R_{12} が - H 又は - CH_3 であり、 R_{13} が - CH_3 又は - C_2H_5 である、請求項 17、18 又は 19 に記載の化合物。

【請求項 21】

(i) 化合物は、メチル - 2, 3, 4 - トリ - O - アセチル - 1 - O - (3, 17 - ジアセトキシアンドロスト - 5 - エン - 7 - イル) - D - グルコピラノシドウロン酸、1 - O - (3, 17 - ジアセトキシアンドロスト - 5 - エン - 7 - イル) - D - グルコピラノシドウロン酸メチル又は 2, 3, 4 - トリ - O - アセチル - 1 - O - (3 - アセトキシ - 17 - オキソアンドロスト - 5 - エン - 7 - イル) - D - グルコピラノシドウロン酸メチル、若しくは薬剤として許容可能なその塩、エステル、エーテル、アミド、又はプロドラッグ、或いは

(ii) 1, 4, 6, 8, 12 及び 14 位の 1 個又は 2 個は置換され、或いは

(iii) 9 位は置換され、9 位の当該置換は - F、- Cl、- OH 又は C_{1-20} の置換されていてもよいアルキルであってもよく、或いは

(iv) 二重結合は 5 - 6 位又は 1 - 2 位及び 5 - 6 位に存在し、或いは

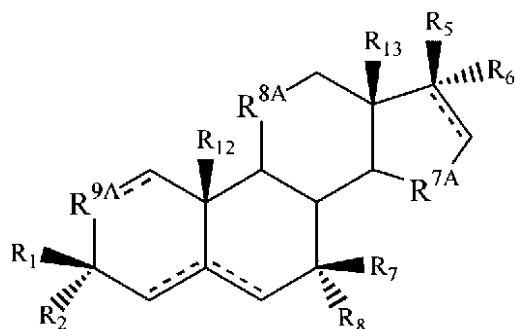
(v) R_{12} は - H であり、 R_{13} は - CH_3 又は - C_2H_5 である、

請求項 17 記載の化合物。

【請求項 22】

式 IX の化合物：

【化 6】



IX

又は薬剤として許容可能なその塩、エステル、アミド又はプロドラッグ

(ここで、 R_1 及び R_2 の一方は - H であり、もう一方は - O - C(O) - OR_{14} であって、 R_{14} は - H、保護基又は置換されていてもよいアルキルである、

R_5 及び R_6 の一方は、- H 又は置換されていてもよいアルキルであり、もう一方は、- OH、- OR^{PR} 、= O、- SH、= S、- SR^{PR} 、エステル、チオエステル、エーテル、チオエーテル、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖であり、

R_7 及び R_8 は、独立して又は一緒になって、- H、- OH、- OR^{PR} 、= O、- SH、= S、- SR^{PR} 、エステル、チオエステル、エーテル、チオエーテル、カルボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖又は置換されていてもよいアルキルであり、

R^{7A} は、 $-C(R^{10})_2$ 、 $-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2$ 、 $-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2$ 、 $-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2$ 、 $-C(R^{10})_2-O-C(R^{10})_2$ 、 $-C(R^{10})_2-S-C(R^{10})_2$ 、 $-C(R^{10})_2-NR^{PR}-C(R^{10})_2$ 、 $-O-$ 、 $-O-C(R^{10})_2$ 、 $-S-$ 、 $-S-C(R^{10})_2$ 、 $-NR^{PR}$ 又は $-NR^{PR}-C(R^{10})_2$ であり、

R^{8A} 及び R^{9A} は、独立に $-C(R^{10})_2$ 、 $-C(R^{10})_2-C(R^{10})_2$ 、 $-O-$ 、 $-O-C(R^{10})_2$ 、 $-S-$ 、 $-S-C(R^{10})_2$ 、 $-NR^{PR}$ 又は $-NR^{PR}-C(R^{10})_2$ であるか、 R^{8A} 又は R^{9A} の一方又は両方は、独立して存在せずに5員環を残し、

R^{10} は、各々独立して、 $-H$ 、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{PR}$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-CHO$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミド、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、アシル基、チオアシル基、カーボネート、カルバメート、ハロゲン、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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ヘテロ環、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ヌクレオシド、ヌクレオチド、オリゴヌクレオチド又はポリマーであり、

R_{12} 及び R_{13} は独立して $-H$ 、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 又は置換されていてもよいアルキルであり、

R^{PR} は独立して $-H$ 又は保護基であり、

化合物は、(i) 1、4、6、8、9、12及び14位の1個又は2個で、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-CHO$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミド、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、アシル基、チオアシル基、カーボネート、カルバメート、ハロゲン、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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ヘテロ環、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ヌクレオシド、ヌクレオチド、オリゴヌクレオチド及びポリマーから独立に選択される部分と置換されている、(ii) 二重結合は16-17位に存在する、或いは(iii) 化合物は、3-カルボメトキシアンドロスト-5-エン-7, 17-ジオン、3-カルボアリルオキシアンドロスト-5-エン-7, 17-ジオン、3-カルボエトキシアンドロスト-5-エン-7, 17-ジオン、3-カルボイソブトキシアンドロスト-5-エン-7, 17-ジオン、3-カルボオクチルオキシアンドロスト-5-エン-7, 17-ジオン、3-カルボ(9-フルオレニル)メトキシアンドロスト-5-エン-7, 17-ジオン、3-カルボメトキシアンドロスト-5-エン-7, 17-ジオール、3-カルボエトキシアンドロスト-5-エン-7, 17-ジオール、3-カルボオクチルオキシアンドロスト-5-エン-7, 17-ジオール又は薬剤として許容可能なそれらの塩、エステル、エーテル、アミド、若しくはプロドラッグである)。

【請求項23】

R_{14} がエステルである請求項22記載の化合物。

【請求項24】

R_1 及び R_2 のうちの一方が水素原子であり、 R_1 及び R_2 のうちの他方が $-O-C(O)-OR_{14}$ である、請求項22又は23に記載の化合物。

【請求項25】

R_{14} が、メチル、エチル、 n -プロピル、 i -プロピル、 n -ブチル、 sec -ブチル、 t -ブチル、ペンチル、ヘキシル、 n -オクチル、 n -ドデシル、1-エトキシエチル、9-フルオレニルメチル、 $-CH_2-C(O)CH_3$ 及び $-C(O)CH_3$ からなる群が

ら選択される請求項 2 3 又は 2 4 に記載の化合物。

【請求項 2 6】

R_5 及び R_6 が、独立して又は一緒になって、 $-H$ 、 $-OH$ 、 $=O$ 、 $-O-C(O)-OCH_3$ 、 $-O-C(O)-OC_2H_5$ 、 $-O-C(O)-OC_3H_7$ 、 $-O-C(O)-OC_4H_9$ 、 $-O-C(O)-OCH_2C_2H_3$ 、 $-O-C(O)-OCH_2C_3H_5$ 又は $-O-C(O)-O-(CH_2)_2-OC_2H_5$ である請求項 2 2 又は 2 3 に記載の化合物。

【請求項 2 7】

R_{12} が $-H$ であり、 R_{13} が $-CH_3$ 又は $-C_2H_5$ である、請求項 2 2 又は 2 3 に記載の化合物。

【請求項 2 8】

3 - カルボメトキシアンドロスト - 5 - エン - 7, 17 - ジオン、3 - カルボアシルオキシアンドロスト - 5 - エン - 7, 17 - ジオン、3 - カルボエトキシアンドロスト - 5 - エン - 7, 17 - ジオン、3 - カルボイソブトキシアンドロスト - 5 - エン - 7, 17 - ジオン、3 - ジカロメトキシアンドロスト - 5 - エン - 7 - オン、3 - カルボオクチルオキシアンドロスト - 5 - エン - 7, 17 - ジオン、3 - カルボ(9 - フルオレニル)メトキシアンドロスト - 5 - エン - 7, 17 - ジオン、3 - カルボメトキシアンドロスト - 5 - エン - 7, 17 - ジオール、3 - カルボエトキシアンドロスト - 5 - エン - 7, 17 - ジオール、及び 3 - カルボオクチルオキシアンドロスト - 5 - エン - 7, 17 - ジオールからなる群から選択される請求項 2 2 記載の化合物、又は薬剤として許容可能なその塩、エステル、エーテル、アミド又はプロドラッグ。

【請求項 2 9】

請求項 1 3、1 7、1 8、1 9、2 2、2 3、2 4、2 5、2 6、2 7 又は 2 8 の化合物及び 1 つ又は複数の賦形剤を含む製剤。

【請求項 3 0】

自己免疫疾患、免疫抑制性病状、感染、癌、前癌、炎症病状、神経病状、心血管的病状、肺病状又は放射線照射又は化学療法を必要とする対象におけるその副作用又は放射線照射の遅延した副作用若しくは望ましくない作用のうちの 1 つ又は複数によって引き起こされるか関係している疾病、病状又は徴候の治療のために薬剤を調製するための請求項 1、2、3、4、1 7、2 2 又は 2 8 記載の化合物の使用であって、

放射線照射の遅延的副作用の治療のために、放射線照射の 1 つ又は複数の遅延的副作用又は望ましくない作用を引き起こすか、又は、引き起こし得る放射線線量を対象が照射した後少なくとも 1 日から始めて薬剤を対象に投与するか対象の組織に送達し、或いは、放射線照射の 1 つ又は複数の遅延的副作用又は望ましくない作用を引き起こすか、又は、引き起こし得る放射線照射の計画されたクール of の少なくとも 1 部分線量分を対象に照射した後、少なくとも 1 日から始めて薬剤を対象に投与するか対象の組織に送達する、

前記化合物の使用。

【請求項 3 1】

対象が放射線照射の遅延的副作用又は望ましくない作用を有しているかその発現を受けており、対象が合計で少なくとも約 0.5 Gy ~ 約 300 Gy、少なくとも約 1 Gy ~ 約 200 Gy、少なくとも約 2 Gy ~ 約 150 Gy の放射線線量を受けたか、又は受けることになっており、対象が放射線線量を 1 回で受けるか、又は 2 回以上に分割して受ける請求項 3 0 記載の使用。

【請求項 3 2】

放射線療法の 1 つ又は複数の遅延的副作用と関係する徴候又は病状が、脳症、脊髄障害、吐き気、嘔吐、下痢、急性炎症、慢性炎症、浮腫、痛み、頭痛、憂鬱感、熱、不快、虚弱、脱毛、皮膚萎縮、皮膚潰瘍形成、皮膚損傷、角化症、毛細管拡張症、感染、形成不全、萎縮、繊維症、線維化肺肺炎、肺臓炎、骨髓發育不全、又は出血の 1 つ又は複数である請求項 3 1 記載の使用。

【請求項 3 3】

放射線照射の１つ又は複数の遅延的副作用又は望ましくない作用と関係する徴候又は病状が、骨髄細胞、内臓上皮、骨髄、睾丸、卵巣、脳神経又は組織、末梢神経、脊髄神経又は組織、又は皮膚上皮の１つ又は複数への放射線損傷によって引き起こされるか関係している請求項 3 2 記載の使用。

【請求項 3 4】

対象が、多発性硬化症、全身エリテマトーデス、慢性喘息、急性喘息、クローン病、潰瘍性大腸炎、骨関節炎、慢性関節リウマチ、乾癬関節炎、又は乾癬から選択される自己免疫疾患、アレルギー性又は炎症性病状を有するか、その発現を受けている請求項 3 0 記載の使用。

【請求項 3 5】

対象が、DNA ウイルス感染、RNA ウイルス感染、真菌感染、細菌感染、又は寄生動物感染から選択される感染を有するか、その発現を受けている請求項 3 0 記載の使用。

【請求項 3 6】

対象が、アルツハイマー病、パーキンソン病、筋萎縮性側索硬化症、不眠症、片頭痛、てんかん、精神分裂病、うつ病、又は記憶低下から選択される神経病状を有するか、その発現を受けている請求項 3 0 記載の使用。

【請求項 3 7】

対象が、鬱血性心筋症、異常発達心筋症、心筋繊維症、動脈瘤、動脈閉鎖疾病、アテローム性動脈硬化症、動脈硬化症、血栓症、脳梗塞、肥満、タイプ I 糖尿病、タイプ II 糖尿病、高血圧症、高脂質血症、コレステロール過剰血症、高グリセリド血症、又は脂肪酸代謝障害から選択される心血管又は代謝上の病状を有するか、その発現を受けている請求項 3 0 記載の使用。

【請求項 3 8】

対象が、乳癌、肺癌、結腸癌、前立腺癌、骨髄異常形成症候群、化学線による角化症、平滑筋腫、繊維筋腫、良性又は前癌症状の小腸ポリープ又は大腸ポリープ、良性前立腺肥大から選択される癌、前癌又は高増殖性病状の病状を有するか、その発現を受けている請求項 3 0 記載の使用。

【請求項 3 9】

対象が、慢性気管支炎、肺線維症、右心室肥大、肺性高血圧、気腫、喘息又は慢性閉塞性肺疾病から選択される肺疾患を有するか、その発現を受けている請求項 3 0 記載の使用。

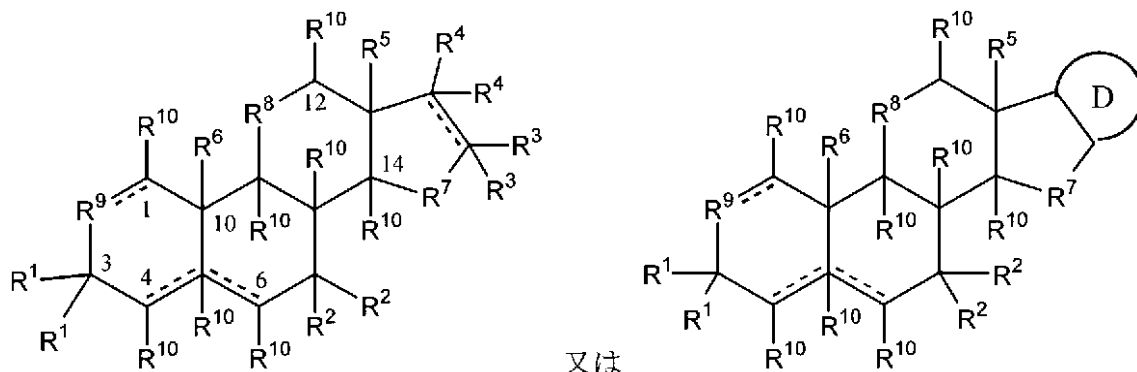
【請求項 4 0】

薬剤の製造のための請求項 1 7 又は 2 2 の化合物の使用。

【請求項 4 1】

下記構造：

【化 7】



(式中、R¹は、独立して又は一緒になって、-H、-OH、-OR^{PR}、-SR^{PR}、-N

(R^{PR})₂、=O、=S、=NOH、=CH₂、-O-Si-(R^{13})₃、-CHO、-CHS、-CH=NH、-CN、-SCN、-NO₂、-OSO₃H、-OPO₃H、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミド、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、アシル基、チオアシル基、カーボネート、カルバメート、ハロゲン、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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ヘテロ環、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ヌクレオシド、ヌクレオチド、オリゴヌクレオチド、ポリマー又はスピロ環であり、

R^2 、 R^3 、 R^5 、 R^6 及び R^{10} は、各々独立して又は一緒になって、-H、-OH、-OR^{PR}、-SR^{PR}、-N(R^{PR})₂、=O、=S、=NOH、=CH₂、-O-Si-(R^{13})₃、-CHO、-CHS、-CH=NH、-CN、-SCN、-NO₂、-OSO₃H、-OPO₃H、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミド、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、アシル基、チオアシル基、カーボネート、カルバメート、ハロゲン、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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ヘテロ環、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ヌクレオシド、ヌクレオチド、オリゴヌクレオチド、ポリマー、スピロ環であり、或いは

2つの隣接した $R^1 \sim R^6$ 及び R^{10} の1個又は複数は、独立して選択されたアセタール、チオアセタール、ケタール又はチオケタール部分を含み、或いは

R^4 は、独立して又は一緒になって、-OH、-OR^{PR}、-SR^{PR}、-N(R^{PR})₂、=S、=NOH、=CH₂、-O-Si-(R^{13})₃、-CHO、-CHS、-CH=NH、-CN、-SCN、-NO₂、-OSO₃H、-OPO₃H、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミド、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、アシル基、チオアシル基、カーボネート、カルバメート、ハロゲン、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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ヘテロ環、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ヌクレオシド、ヌクレオチド、オリゴヌクレオチド、ポリマー又はスピロ環であり、

R^7 は、-C(R^{10})₂-、-C(R^{10})₂-C(R^{10})₂-、-C(R^{10})₂-C(R^{10})₂-C(R^{10})₂-、-C(R^{10})₂-O-C(R^{10})₂-、-C(R^{10})₂-S-C(R^{10})₂-、-C(R^{10})₂-NR^{PR}-C(R^{10})₂-、-O-、-O-C(R^{10})₂-、-S-、-S-C(R^{10})₂-、-NR^{PR}-又は-NR^{PR}-C(R^{10})₂-であり、

R^8 及び R^9 は、独立に-C(R^{10})₂-、-C(R^{10})₂-C(R^{10})₂-、-O-、-O-C(R^{10})₂-、-S-、-S-C(R^{10})₂-、-NR^{PR}-又は-NR^{PR}-C(R^{10})₂-であるか、 R^8 又は R^9 の一方又は両方は、独立して存在せずに5員環を残し、

R^{13} は、独立にC₁₋₆アルキルであり、

R^{PR} は、独立に-H又は保護基であり、

Dは、ヘテロ環であるか飽和炭素原子を含む4-、5-、6-又は7-員環であり、ここで4-、5-、6-又は7-員環の1、2又は3個の環炭素原子は、-O-、-S-又は-NR^{PR}-で置換されていてもよく、又はヘテロ環の1、2又は3個の水素原子若しくは4-、5-、6-又は7-員環の1、2又は3個の水素原子は-OH、-OR^{PR}、-SR^{PR}、-N(R^{PR})₂、-O-Si-(R^{13})₃、-CHO、-CHS、-CH=NH、-CN、-SCN、-NO₂、-OSO₃H、-OPO₃H、=O、=S、=NOH、=CH₂、スピロ環、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミド、アミノ酸、ペプ

チド、エーテル、チオエーテル、アシル、チオアシル、カーボネート、カルバメート、チオアセタール、ハロゲン、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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ヘテロ環、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ヌクレオシド、ヌクレオチド、オリゴヌクレオチド、ポリマーで置換され、或いは、

2つの隣接するD環炭素は、独立して選択されたアセタール、チオアセタール、ケタール又はチオケタール部分を含み、或いはDは、2個の5-又は6-員環（ここで環は縮合しているか、1個又は2個の結合によって連結されているか、又は代謝作用の前駆体若しくはその生物活性代謝物質である。但し、1つ、2つ、3つの R^{10} の1、4、6、8、9、12及び14位は水素ではなく、及び以下の構造的特徴の1個又は複数が存在する：

(a) 1つの R^1 は、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、 $-NH-C(O)-C_{1-20}$ の置換されていてもよいアルキル、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖又はポリマーであり、もう1つの R^1 は、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-NH-C_{1-20}$ の置換されていてもよいアルキル、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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又は置換されていてもよいヘテロ環である、

(b) R^1 は $-H$ であり、 R^2 、 R^3 及び R^4 の各々のうちの1つは、独立に $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミド、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、アシル基、チオアシル基、カーボネート、カルバメート、ハロゲン、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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ヘテロ環、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖又はポリマーである、

(c) 1つの R^2 は、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、 $-NH-C(O)-C_{1-20}$ の置換されていてもよいアルキル、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖又はポリマーであり、及びもう1つの R^2 は、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-NH-C_{1-20}$ の置換されていてもよいアルキル、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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又は置換されていてもよいヘテロ環である、

(d) 1つの R^3 は、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、 $-NH-C(O)-C_{1-20}$ の置換されていてもよいアルキル、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖又はポリマーであり、もう1つの R^3 は、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-NH-C_{1-20}$ の置換されていてもよいアルキル、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキ

ル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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又は置換されていてもよいヘテロ環である、或いは

(e) 二重結合は 16 - 17 位にある)、
を有する化合物の薬剤を製造するための使用。

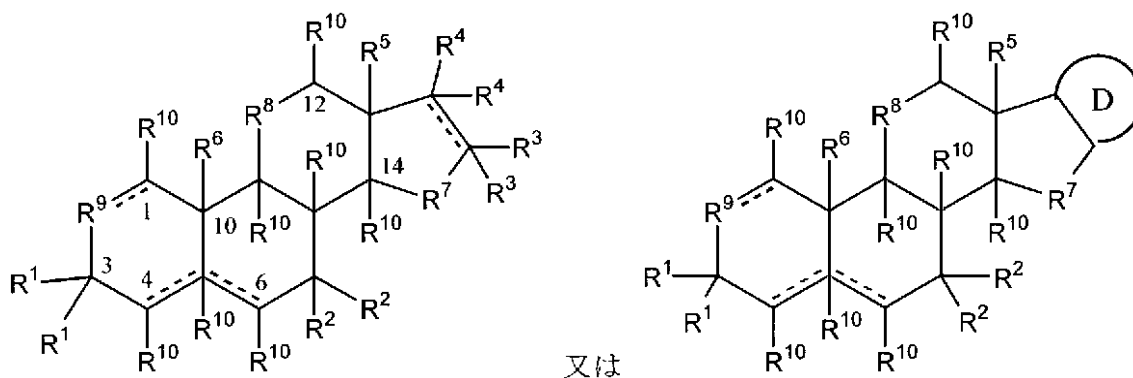
【請求項 42】

請求項 41 の化合物及び 1 つ又は複数の賦形剤を含む製剤であって、無菌腸管外液製剤、経口製剤、口腔製剤、舌下製剤又はエアロゾル製剤であってもよい、製剤。

【請求項 43】

下記構造：

【化 8】



(式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及びR¹⁰は、それぞれ独立して又は一緒になって、-H、-OH、-OR^{PR}、-SR^{PR}、-N(R^{PR})₂、-N₃、=O、=S、=NOH、=CH₂、-O-Si-(R¹³)₃、-CHO、-CHS、-CH=NH、-CN、-SCN、-NO₂、-OSO₃H、-OPO₃H、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミド、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、アシル基、チオアシル基、カーボネート、カルバメート、ハロゲン、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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ヘテロ環、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ヌクレオシド、ヌクレオチド、オリゴヌクレオチド、ポリマー、スピロ環であるか、2つの隣接したR¹~R⁶及びR¹⁰の1個又は複数は、独立して選択されたアセタール、チオアセタール、ケタール又はチオケタール部分を含み、或いは

R⁷は、-C(R¹⁰)₂-、-C(R¹⁰)₂-C(R¹⁰)₂-、-C(R¹⁰)₂-C(R¹⁰)₂-C(R¹⁰)₂-、-C(R¹⁰)₂-O-C(R¹⁰)₂-、-C(R¹⁰)₂-S-C(R¹⁰)₂-、-C(R¹⁰)₂-NR^{PR}-C(R¹⁰)₂-、-O-、-O-C(R¹⁰)₂-、-S-、-S-C(R¹⁰)₂-、-NR^{PR}-又は-NR^{PR}-C(R¹⁰)₂-であり、

R⁸及びR⁹は、独立に-C(R¹⁰)₂-、-C(R¹⁰)₂-C(R¹⁰)₂-、-O-、-O-C(R¹⁰)₂-、-S-、-S-C(R¹⁰)₂-、-NR^{PR}-又は-NR^{PR}-C(R¹⁰)₂-であるか、R⁸又はR⁹の一方又は両方は、独立して存在せずに5員環を残し、

R¹³は、独立にC₁~₆アルキルであり、

R^{PR}は、独立に-H又は保護基であり、

Dは、ヘテロ環であるか飽和炭素原子を含む4-、5-、6-又は7-員環であり、ここで4-、5-、6-又は7-員環の1、2又は3個の環炭素原子は、-O-、-S-又は-NR^{PR}-で置換されていてもよく、又はヘテロ環の1、2又は3個の水素原子若しくは4-、5-、6-又は7-員環の1、2又は3個の水素原子は-OH、-OR^{PR}、-S

R^{PR} 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=NOH$ 、 $=CH_2$ 、スピロ環、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミド、アミノ酸、ペプチド、エーテル、チオエーテル、アシル、チオアシル、カーボネート、カルバメート、チオアセタール、ハロゲン、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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ヘテロ環、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ヌクレオシド、ヌクレオチド、オリゴヌクレオチド又はポリマーで置換されているか、2つの隣接するD環炭素は、独立して選択されたアセタール、チオアセタール、ケタール又はチオケタール部分を含み、或いはDは、2個の5-又は6-員環（ここで環は縮合しているか、1個又は2個の結合によって連結されているか、又は代謝作用の前駆体若しくはその生物活性代謝物質である。但し、1つ、2つ、3つの R^{10} の1、4、6、8、9、12及び14位は水素ではなく、及び以下の構造的特徴の1個又は複数が存在する：

(a) 1位の R^{10} は、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $=O$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $=S$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-N_3$ 、 $=NOH$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、ハロゲン、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ポリマー、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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又は置換されていてもよいヘテロ環であり、1つの R^4 又は両方の R^4 は、独立にハロゲン、 $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $=S$ 、 $-SCN$ 、チオエーテル、 $-S-C(O)-$ 置換されていてもよいアルキル、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-N_3$ 、 $=NOH$ 、 $-NH-C(O)-$ 置換されていてもよいアルキル又は $-NH-C(O)-O-$ 置換されていてもよいアルキルである、或いは

(b) 1位の R^{10} は、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $=O$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $=S$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-N_3$ 、 $=NOH$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、ハロゲン、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ポリマー、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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又は置換されていてもよいヘテロ環であり、1つの R^2 又は両方の R^2 は、独立に $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $=S$ 、 $-SCN$ 、チオエーテル、 $-S-C(O)-$ 置換されていてもよいアルキル、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-N_3$ 、 $=NOH$ 、 $-NO_2$ 、 $-NH-C(O)-$ 置換されていてもよいアルキル又は $-NH-C(O)-O-$ 置換されていてもよいアルキルである、或いは

(c) 1位の R^{10} は、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $=O$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $=S$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-N_3$ 、 $=NOH$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、ハロゲン、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよいオリゴ糖、ポリマー、アシル、チオアシル、置換されたアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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又は置換されていてもよいヘテロ環であり、

1つの R^2 又は両方の R^2 は、独立に $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $=O$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $=S$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-N_3$ 、 $=NOH$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖又はポリマーであり、

1つの R^3 又は両方の R^3 は、独立に $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $=O$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $=S$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-N_3$ 、 $=NOH$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよいオリゴ糖又はポリマーであり、

1つの R^4 又は両方の R^4 は、独立に $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $=O$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $=S$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-N_3$ 、 $=NOH$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖又はポリマーである、或いは

(d) 1位の R^{10} は、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $=O$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $=S$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-N_3$ 、 $=NOH$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、 $-Cl$ 、 $-Br$ 、 $-I$ 、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ポリマー、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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又は置換されていてもよいヘテロ環であり、

1つの R^3 又は両方の R^3 は、独立に $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $=O$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $=S$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-N_3$ 、 $=NOH$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換された単糖、置換されていてもよいオリゴ糖又はポリマーであり、

1つの R^4 又は両方の R^4 は、独立に $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $=O$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $=S$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-N_3$ 、 $=NOH$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖又はポリマーであり、

R^8 は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NH-$ 、 $-CHSH-$ 、 $-CHSR^{PR}-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-CHN(R^{PR})_2-$ 、 $-CHN_3-$ 、 $-C(NO_2)-$ 、 $-CH(O-Si-(R^{13})_3)-$ 、 $-CH(SCN)-$ 、 $-CH(NO_2)-$ 、 $-CH(OSO_3H)-$ 、 $-CH(OPO_3H)-$ 、 $-CH(CHO)-$ 、 $-CH(CHS)-$ 、 $-CH(CH=NH)-$ 、 $-CH(CN)-$ 、 $-CH$ (チオエステル)、 $-CH$ (チオノエステル)、 $-CH$ (ホスホエス

テル) -、-CH(ホスホチオエステル) -、-CH(ホスホノエステル) -、-CH(ホスフィニエステル) -、-CH(亜硫酸エステル) -、-CH(硫酸エステル) -、-CH(アミノ酸) -、-CH(ペプチド) -、-CH(チオエーテル) -、-CH(N-C(O)-O-置換されていてもよいアルキル) -、-CH(N-C(O)-O-置換されていてもよいアルケニル) -、-CH(N-C(O)-O-置換されていてもよいアルキニル) -、-CH(置換されていてもよい単糖) -、-CH(置換されていてもよいオリゴ糖) -、-CH(ポリマー) -、-C(R¹⁰)₂-C(R¹⁰)₂-、-O-C(R¹⁰)₂-、-S-C(R¹⁰)₂-、NR^{PR}-C(R¹⁰)₂-、又はR⁸は存在せずに5員環を残し、

(e) 6位のR¹⁰は、-OH、-OR^{PR}、=O、-SH、-SR^{PR}、=S、-N(R^{PR})₂、-N₃、=NOH、-O-Si-(R¹³)₃、-SCN、-NO₂、-OSO₃H、-OPO₃H、-CHO、-CHS、-CH=NH、-CN、ハロゲン、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ポリマー、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロ環であり、

1つのR³又は両方のR³は、独立に-SH、-SR^{PR}、=S、-NHR^{PR}、-N₃、=NOH、-SCN、-NO₂、-NH-C(O)-置換されていてもよいアルキル又は-NH-C(O)-O-置換されていてもよいアルキル、チオエーテルであり、

1つのR⁴又は両方のR⁴は、独立に-OH、-OR^{PR}、=O、-SH、-SR^{PR}、=S、-N(R^{PR})₂、-N₃、=NOH、-O-Si-(R¹³)₃、-SCN、-NO₂、-OSO₃H、-OPO₃H、-CHO、-CHS、-CH=NH、-CN、ハロゲン、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ポリマー、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、置換されていてもよいアリール又は置換されていてもよいヘテロアリールである、或いは

(f) 6位のR¹⁰は、-OH、-OR^{PR}、=O、-SH、-SR^{PR}、=S、-N(R^{PR})₂、-N₃、=NOH、-O-Si-(R¹³)₃、-SCN、-NO₂、-OSO₃H、-OPO₃H、-CHO、-CHS、-CH=NH、-CN、ハロゲン、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ポリマー、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロ環であり、

1つのR¹又は両方のR¹は、独立に-H、-OH、-OR^{PR}、-SH、-SR^{PR}、=S、-N(R^{PR})₂、-N₃、=NOH、-O-Si-(R¹³)₃、-SCN、-NO₂、-OSO₃H、-OPO₃H、-CHO、-CHS、-CH=NH、-CN、ハロゲン、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ポリマー、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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又は置換されていてもよいヘテロ環であり、

1つのR²又は両方のR²は、独立に-SH、-SR^{PR}、=S、-NHR^{PR}、-N₃、=

NOH、-SCN、-NO₂、-NH-C(O)-置換されていてもよいアルキル又は-NH-C(O)-O-置換されていてもよいアルキル、チオエーテルであり、

1つのR⁴又は両方のR⁴は、独立に-OH、-OR^{PR}、=O、-SH、-SR^{PR}、=S、-N(R^{PR})₂、-N₃、=NOH、-O-Si-(R¹³)₃、-SCN、-NO₂、-OSO₃H、-OPO₃H、-CHO、-CHS、-CH=NH、-CN、ハロゲン、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ポリマー、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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又は置換されていてもよいヘテロ環である、或いは

(g) 6位のR¹⁰は、-OH、-OR^{PR}、=O、-SH、-SR^{PR}、=S、-N(R^{PR})₂、-N₃、=NOH、-O-Si-(R¹³)₃、-SCN、-NO₂、-OSO₃H、-OPO₃H、-CHO、-CHS、-CH=NH、-CN、ハロゲン、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ポリマー、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロ環であり、R⁷は、-O-、-NR^{PR}-、-S-、-C(R¹⁰)₂-C(R¹⁰)₂-、-C(R¹⁰)₂-C(R¹⁰)₂-C(R¹⁰)₂-、-C(R¹⁰)₂-O-C(R¹⁰)₂-、-C(R¹⁰)₂-S-C(R¹⁰)₂-、-C(R¹⁰)₂-NR^{PR}-C(R¹⁰)₂-、-O-C(R¹⁰)₂-、-S-C(R¹⁰)₂-又は-NR^{PR}-C(R¹⁰)₂-である、

(h) 6位のR¹⁰は、-OH、-OR^{PR}、=O、-SH、-SR^{PR}、=S、-N(R^{PR})₂、-N₃、=NOH、-O-Si-(R¹³)₃、-SCN、-NO₂、-OSO₃H、-OPO₃H、-CHO、-CHS、-CH=NH、-CN、-F、-Br、-I、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ポリマー、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロ環であり、R⁸は、-O-、-NR^{PR}-、-S-、-C(R¹⁰)₂-C(R¹⁰)₂-、-O-C(R¹⁰)₂-、-S-C(R¹⁰)₂-、NR^{PR}-C(R¹⁰)₂-、又はR⁸は存在せずに5員環を残し、或いは

(i) 6位のR¹⁰は、-OH、-OR^{PR}、=O、-SH、-SR^{PR}、=S、-N(R^{PR})₂、-N₃、=NOH、-O-Si-(R¹³)₃、-SCN、-NO₂、-OSO₃H、-OPO₃H、-CHO、-CHS、-CH=NH、-CN、-F、-Br、-I、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ポリマー、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロ環であり、R⁹は、-NR^{PR}-、-S-、-C(R¹⁰)₂-C(R¹⁰)₂-、-O-C(R¹⁰)₂-、-S-C(R¹⁰)₂-、NR^{PR}-C(R¹⁰)₂-、又はR⁹は存在せずに5員環を残し、或いは

(j) 6位のR¹⁰は、-OH、-OR^{PR}、=O、-SH、-SR^{PR}、=S、-N(R^{PR})₂、-N₃、=NOH、-O-Si-(R¹³)₃、-SCN、-NO₂、-OSO₃H、-OPO₃H、-CHO、-CHS、-CH=NH、-CN、-F、-Br、-I、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエ

ステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ポリマー、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロ環であり、

1つの R^1 又は両方の R^1 は、独立に $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $=S$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-N_3$ 、 $=NOH$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、ハロゲン、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ポリマー、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアルケニル、置換されていてもよいアルキニル、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又は置換されていてもよいヘテロ環であり、

R^9 は $-O-$ である、或いは

(k) 12位の R^{10} は、 $-OH$ 、 $-OR^{PR}$ 、 $=O$ 、 $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $=S$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-N_3$ 、 $=NOH$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OSO_3H$ 、 $-OPO_3H$ 、 $-CHO$ 、 $-CHS$ 、 $-CH=NH$ 、 $-CN$ 、ハロゲン、エステル、チオエステル、チオノエステル、ホスホエステル、ホスホチオエステル、ホスホノエステル、ホスフィニエステル、亜硫酸エステル、硫酸エステル、アミノ酸、ペプチド、アミド、エーテル、チオエーテル、カーボネート、カルバメート、置換されていてもよい単糖、置換されていてもよいオリゴ糖、ポリマー、アシル、チオアシル、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいヘテロアリール又は置換されていてもよいヘテロ環であり、

1つの R^2 又は両方の R^2 は、独立に $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $=S$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-N_3$ 、 $=NOH$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-S-C(O)-$ 置換されていてもよいアルキル、チオエーテル、 $-N-C(O)-$ 置換されていてもよいアルキル又は $-N-C(O)-O-$ 置換されていてもよいアルキルであり、又は

1つの R^3 又は両方の R^3 は、独立に $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $=S$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-N_3$ 、 $=NOH$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-S-C(O)-$ 置換されていてもよいアルキル、チオエーテル、 $-N-C(O)-$ 置換されていてもよいアルキル又は $-N-C(O)-O-$ 置換されていてもよいアルキルであり、又は

1つの R^4 又は両方の R^4 は、独立に $-SH$ 、 $-SR^{PR}$ 、 $=S$ 、 $-N(R^{PR})_2$ 、 $-N_3$ 、 $=NOH$ 、 $-O-Si-(R^{13})_3$ 、 $-SCN$ 、 $-NO_2$ 、 $-S-C(O)-$ 置換されていてもよいアルキル、チオエーテル、 $-N-C(O)-$ 置換されていてもよいアルキル又は $-N-C(O)-O-$ 置換されていてもよいアルキルである)、

を有する化合物の薬剤を調製するための使用。

【請求項44】

請求項43の化合物及び1つ又は複数の賦形剤を含む製剤であって、無菌腸管外液製剤、経口製剤、口腔製剤、舌下製剤又はエアロゾル製剤であってもよい、製剤。