

【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30年9月13日 (2018.9.13)

【公表番号】特表2017-519784(P2017-519784A)

【公表日】平成29年7月20日 (2017.7.20)

【年通号数】公開・登録公報2017-027

【出願番号】特願2016-575488(P2016-575488)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/7068 (2006.01)

A 6 1 K 31/7072 (2006.01)

A 6 1 K 31/708 (2006.01)

A 6 1 K 31/7125 (2006.01)

A 6 1 K 31/712 (2006.01)

A 6 1 K 48/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/7068

A 6 1 K 31/7072

A 6 1 K 31/708

A 6 1 K 31/7125

A 6 1 K 31/712

A 6 1 K 48/00

A 6 1 P 31/12

【手続補正書】

【提出日】平成30年8月2日 (2018.8.2)

【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

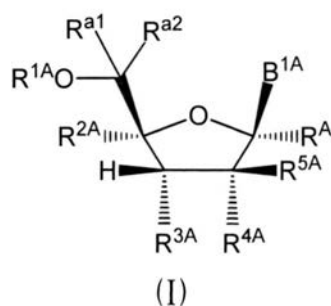
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

ウイルス感染を改善または処置するための、有効量の式 (I) の化合物、またはその薬学的に許容される塩を含む医薬組成物であって、前記式 (I) の化合物は、構造：

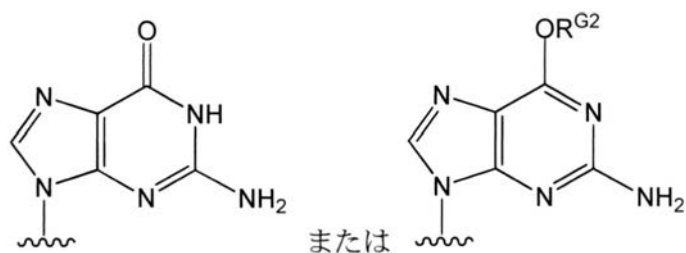
【化 1】



(式中：

B<sup>1A</sup> は、

## 【化 2】



であり、ここで、 $R^{G2}$  は、非置換  $C_{1 \sim 6}$  アルキルであり；

$R^{3A}$  は、ハロ、OH、 $-OC(=O)R^{4A}$  および非置換 O - 連結 - アミノ酸であり；

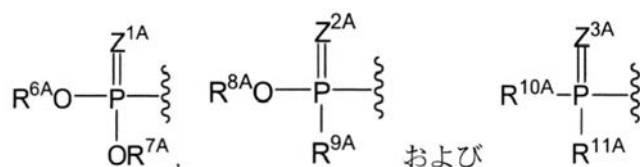
$R^{4A}$  は、OH またはハロであり；

$R^{a1}$  および  $R^{a2}$  は、独立して、水素または重水素であり；

$R^A$  は、水素または重水素であり；

$R^{1A}$  は、水素、

## 【化 3】



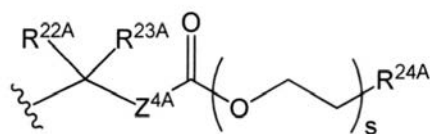
からなる群から選択され；

$R^{2A}$  は、ハロまたは  $-(CH_2)_{1 \sim 6}$  ハロゲンであり；

$R^{5A}$  は、非置換  $C_{1 \sim 6}$  アルキル、非置換  $C_{2 \sim 6}$  アルケニルおよび非置換  $C_{2 \sim 6}$  アルキニルからなる群から選択され；

$R^{6A}$  および  $R^{7A}$  は、非存在、水素、および

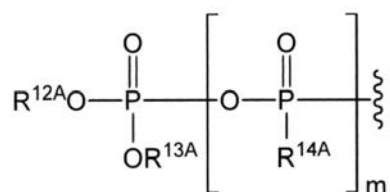
## 【化 4】



からなる群から独立して選択され；または

$R^{6A}$  は、

## 【化 5】



であり、 $R^{7A}$  は、非存在もしくは水素であり；

$R^{8A}$  は、非存在、水素、任意選択で置換されたフェニルまたは任意選択で置換されたナフチルであり；

$R^{9A}$  は、N - 連結アラニン、N - 連結アスパラギン、N - 連結アスパラギン酸塩、N - 連結システイン、N - 連結グルタミン酸塩、N - 連結グルタミン、N - 連結グリシン、N - 連結プロリン、N - 連結セリン、N - 連結チロシン、N - 連結アルギニン、N - 連結ヒスチジン、N - 連結イソロイシン、N - 連結ロイシン、N - 連結リシン、N - 連結メチオニン、N - 連結フェニルアラニン、N - 連結トレオニン、N - 連結トリプトファンおよびN - 連結バリンからなる群から選択される、任意選択で置換されたN - 連結 - アミノ酸、または任意選択で置換されたN - 連結 - アミノ酸エステル誘導体であり、前記任意選択で置換されたN - 連結 - アミノ酸エステル誘導体は、N - 連結アラニン、N - 連結アスパラギン、N - 連結アスパラギン酸塩、N - 連結システイン、N - 連結グルタミン酸塩、N - 連結グルタミン、N - 連結グリシン、N - 連結プロリン、N - 連結セリン、N - 連結チロシン、N - 連結アルギニン、N - 連結ヒスチジン、N - 連結イソロイシン、N - 連結ロイシン、N - 連結リシン、N - 連結メチオニン、N - 連結フェニルアラニン、N - 連結トレオニン、N - 連結トリプトファンおよびN - 連結バリンからなる群から選択されるN - 連結 - アミノ酸の非置換 $C_{1-6}$ アルキルエステル、任意選択で置換された $C_{3-6}$ シクロアルキルエステル、任意選択で置換された $C_6$ アリールエステル、任意選択で置換された $C_{10}$ アリールエステル、または任意選択で置換されたベンジルエステルであり；

$R^{10A}$  および $R^{11A}$  は、独立して、N - 連結アラニン、N - 連結アスパラギン、N - 連結アスパラギン酸塩、N - 連結システイン、N - 連結グルタミン酸塩、N - 連結グルタミン、N - 連結グリシン、N - 連結プロリン、N - 連結セリン、N - 連結チロシン、N - 連結アルギニン、N - 連結ヒスチジン、N - 連結イソロイシン、N - 連結ロイシン、N - 連結リシン、N - 連結メチオニン、N - 連結フェニルアラニン、N - 連結トレオニン、N - 連結トリプトファンおよびN - 連結バリンからなる群から選択される、任意選択で置換されたN - 連結 - アミノ酸、または任意選択で置換されたN - 連結 - アミノ酸エステル誘導体であり、前記任意選択で置換されたN - 連結 - アミノ酸エステル誘導体は、N - 連結アラニン、N - 連結アスパラギン、N - 連結アスパラギン酸塩、N - 連結システイン、N - 連結グルタミン酸塩、N - 連結グルタミン、N - 連結グリシン、N - 連結プロリン、N - 連結セリン、N - 連結チロシン、N - 連結アルギニン、N - 連結ヒスチジン、N - 連結イソロイシン、N - 連結ロイシン、N - 連結リシン、N - 連結メチオニン、N - 連結フェニルアラニン、N - 連結トレオニン、N - 連結トリプトファンおよびN - 連結バリンからなる群から選択されるN - 連結 - アミノ酸の非置換 $C_{1-6}$ アルキルエステル、任意選択で置換された $C_{3-6}$ シクロアルキルエステル、任意選択で置換された $C_6$ アリールエステル、任意選択で置換された $C_{10}$ アリールエステル、または任意選択で置換されたベンジルエステルであり；

$R^{12A}$  および $R^{13A}$  は、独立して、非存在または水素であり；

$R^{14A}$  は、O - またはOHであり；

$R^{22A}$  および $R^{23A}$  は、それぞれ水素であり；

$R^{24A}$  は、水素、任意選択で置換された $C_{1-24}$ アルキル、および任意選択で置換された-O-C $_{1-24}$ アルキルからなる群から選択され；

$R^{\prime\prime A}$  は、任意選択で置換された $C_{1-24}$ アルキルであり；

mは、0または1であり；

sは、0、1、2または3であり；

$Z^1A$ 、 $Z^2A$ 、 $Z^3A$ 、および $Z^4A$  は、それぞれ0である)を有し；

前記ウイルス感染は、コロナウイルス科 (Coronaviridae) ウイルス、トガウイルス科 (Togaviridae) ウイルス、ヘペウイルス科 (Hepeviridae) ウイルスおよびブニヤウイルス科 (Bunyaviridae) ウイルスからなる群から選択されるウイルスによって引き起こされる、医薬組成物。

## 【請求項 2】

前記ウイルスが、MERS-CoVである、請求項 1 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3】

前記ウイルスが、SARS-CoVである、請求項 1 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 4】

前記ウイルスが、ベネズエラウマ脳炎ウイルス (Venezuelan equine encephalitis virus) である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 5】

前記ウイルスが、チクングニヤウイルス (Chikungunya virus) である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 6】

前記ウイルスが、コロナウイルス (Coronavirus) である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 7】

$R^{2A}$  がフルオロである、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 8】

$R^{2A}$  が  $-(CH_2)_{1-6}F$  である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 9】

$R^{4A}$  が OH である、請求項 1 から 8 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 10】

$R^{4A}$  がフルオロである、請求項 1 から 8 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 11】

$R^{5A}$  が非置換  $C_{1-6}$  アルキルである、請求項 1 から 10 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 12】

$R^{5A}$  が非置換  $C_{2-6}$  アルキニルである、請求項 1 から 10 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

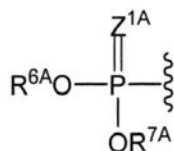
## 【請求項 13】

$R^{1A}$  が水素である、請求項 1 から 12 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 14】

$R^{1A}$  が、

## 【化 6】

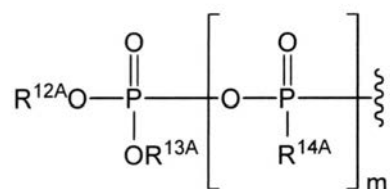


である、請求項 1 から 12 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 15】

$R^{6A}$  が、

## 【化 7】

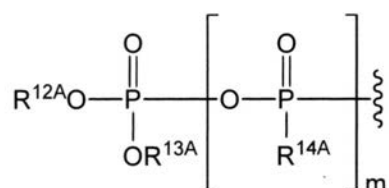


であり； $\text{R}^{7\text{A}}$ 、 $\text{R}^{12\text{A}}$  および  $\text{R}^{13\text{A}}$  が、独立して、非存在または水素であり； $m$  が 0 である、請求項 14 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 16】

$\text{R}^{6\text{A}}$  が、

## 【化 8】



であり； $\text{R}^{7\text{A}}$ 、 $\text{R}^{12\text{A}}$  および  $\text{R}^{13\text{A}}$  が、独立して、非存在または水素であり； $\text{R}^{14\text{A}}$  が、 $\text{O}^-$  または  $\text{OH}$  であり； $m$  が 1 である、請求項 14 に記載の医薬組成物。

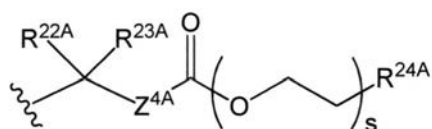
## 【請求項 17】

$\text{R}^{6\text{A}}$  および  $\text{R}^{7\text{A}}$  が、独立して、非存在または水素である、請求項 14 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 18】

$\text{R}^{6\text{A}}$  および  $\text{R}^{7\text{A}}$  が、独立して、

## 【化 9】



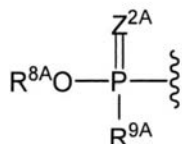
## 【請求項 19】

$\text{R}^{6\text{A}}$  および  $\text{R}^{7\text{A}}$  が、それぞれイソプロピルオキシカルボニルオキシメチルである、請求項 18 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 20】

$\text{R}^{1\text{A}}$  が、

## 【化 10】



である、請求項 1 から 12 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 1】

$R^{8A}$  が非置換フェニルである、請求項 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

$R^{9A}$  が、N - 連結アラニン、N - 連結アスパラギン、N - 連結アスパラギン酸塩、N - 連結システイン、N - 連結グルタミン酸塩、N - 連結グルタミン、N - 連結グリシン、N - 連結プロリン、N - 連結セリン、N - 連結チロシン、N - 連結アルギニン、N - 連結ヒスチジン、N - 連結イソロイシン、N - 連結ロイシン、N - 連結リシン、N - 連結メチオニン、N - 連結フェニルアラニン、N - 連結トレオニン、N - 連結トリプトファンおよび N - 連結バリンからなる群から選択される、任意選択で置換された N - 連結 - アミノ酸、または任意選択で置換された N - 連結 - アミノ酸エステル誘導体であり、前記任意選択で置換された N - 連結 - アミノ酸エステル誘導体は、N - 連結アラニン、N - 連結アスパラギン、N - 連結アスパラギン酸塩、N - 連結システイン、N - 連結グルタミン酸塩、N - 連結グルタミン、N - 連結グリシン、N - 連結プロリン、N - 連結セリン、N - 連結チロシン、N - 連結アルギニン、N - 連結ヒスチジン、N - 連結イソロイシン、N - 連結ロイシン、N - 連結リシン、N - 連結メチオニン、N - 連結フェニルアラニン、N - 連結トレオニン、N - 連結トリプトファンおよび N - 連結バリンからなる群から選択される N - 連結 - アミノ酸の非置換  $C_{1-6}$  アルキルエステル、任意選択で置換された  $C_{3-6}$  シクロアルキルエステル、任意選択で置換された  $C_6$  アリールエステル、任意選択で置換された  $C_{10}$  アリールエステル、または任意選択で置換されたベンジルエステルである、請求項 20 から 21 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

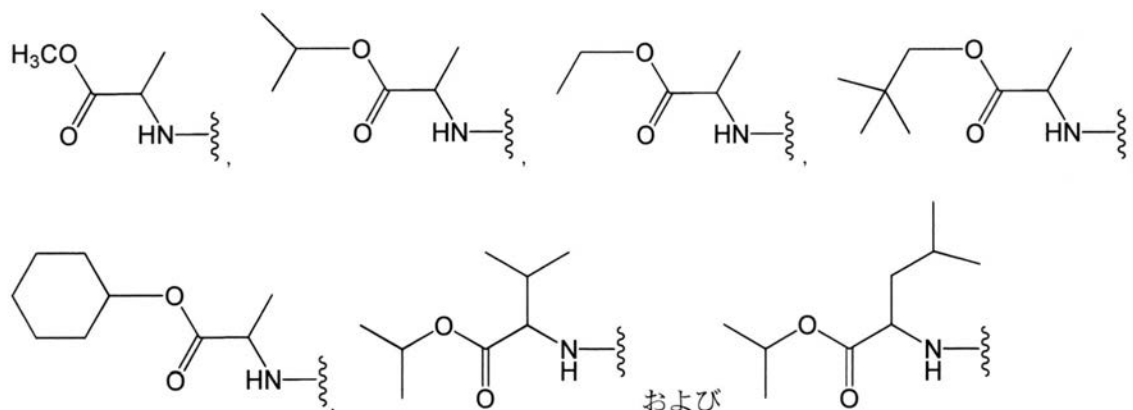
【請求項 2 3】

$R^{9A}$  が、N - 連結アラニン、N - 連結イソロイシン、N - 連結ロイシンおよび N - 連結バリンからなる群から選択される N - 連結 - アミノ酸の非置換  $C_{1-6}$  アルキルエステル、または非置換  $C_{3-6}$  シクロアルキルエステルである、請求項 20 から 21 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 4】

$R^{9A}$  が、

【化 1 1】

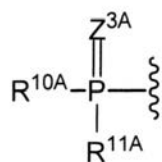


からなる群から選択される、請求項 22 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

$R^{1A}$  が、

## 【化 1 2】



である、請求項 1 から 1 2 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 6】

$R^{10A}$  および  $R^{11A}$  が、独立して、N - 連結アラニン、N - 連結アスパラギン、N - 連結アスパラギン酸塩、N - 連結システイン、N - 連結グルタミン酸塩、N - 連結グルタミン、N - 連結グリシン、N - 連結プロリン、N - 連結セリン、N - 連結チロシン、N - 連結アルギニン、N - 連結ヒスチジン、N - 連結イソロイシン、N - 連結ロイシン、N - 連結リシン、N - 連結メチオニン、N - 連結フェニルアラニン、N - 連結トレオニン、N - 連結トリプトファンおよび N - 連結バリンからなる群から選択される、任意選択で置換された N - 連結 - アミノ酸、または任意選択で置換された N - 連結 - アミノ酸エステル誘導体であり、前記任意選択で置換された N - 連結 - アミノ酸エステル誘導体は、N - 連結アラニン、N - 連結アスパラギン、N - 連結アスパラギン酸塩、N - 連結システイン、N - 連結グルタミン酸塩、N - 連結グルタミン、N - 連結グリシン、N - 連結プロリン、N - 連結セリン、N - 連結チロシン、N - 連結アルギニン、N - 連結ヒスチジン、N - 連結イソロイシン、N - 連結ロイシン、N - 連結リシン、N - 連結メチオニン、N - 連結フェニルアラニン、N - 連結トレオニン、N - 連結トリプトファンおよび N - 連結バリンからなる群から選択される N - 連結 - アミノ酸の非置換  $C_1 \sim 6$  アルキルエステル、任意選択で置換された  $C_3 \sim 6$  シクロアルキルエステル、任意選択で置換された  $C_6$  アリールエステル、任意選択で置換された  $C_{10}$  アリールエステル、または任意選択で置換されたベンジルエステルである、請求項 2 5 に記載の医薬組成物。

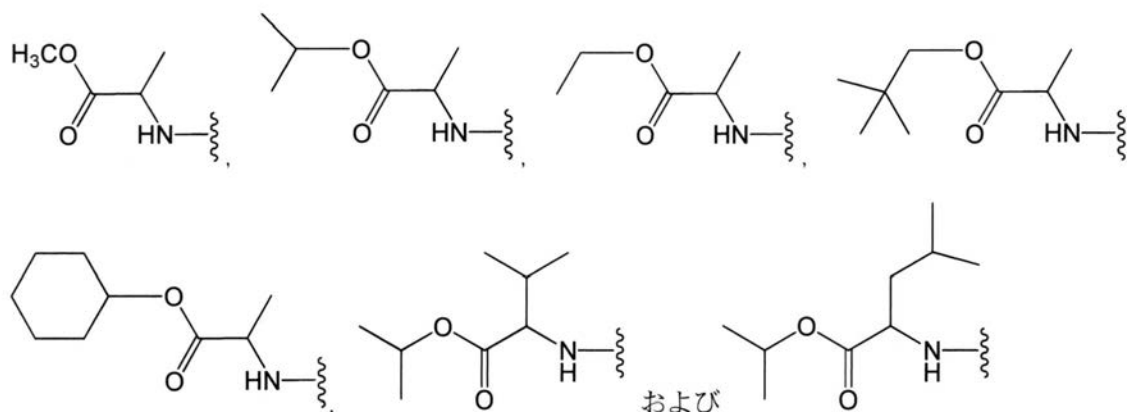
## 【請求項 2 7】

$R^{10A}$  および  $R^{11A}$  が、独立して、N - 連結アラニン、N - 連結イソロイシン、N - 連結ロイシンおよび N - 連結バリンからなる群から選択される N - 連結 - アミノ酸の非置換  $C_1 \sim 6$  アルキルエステル、または非置換  $C_3 \sim 6$  シクロアルキルエステルである、請求項 2 5 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 8】

$R^{10A}$  および  $R^{11A}$  が、独立して、

## 【化 1 3】



からなる群から選択される、請求項 2 6 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 9】

$R^{3A}$  がフルオロである、請求項 1 から 28 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 30】

$R^{3A}$  が OH である、請求項 1 から 28 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 31】

$R^A$  が水素である、請求項 1 から 30 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

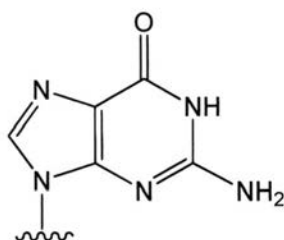
【請求項 32】

$R^{a1}$  および  $R^{a2}$  が、両方とも水素である、請求項 1 から 31 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 33】

$B^{1A}$  が、

【化 14】

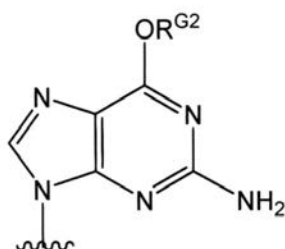


である、請求項 1 から 32 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 34】

$B^{1A}$  が、

【化 15】



であり、ここで、 $R^{G2}$  は、 $-CH_2CH_3$  である、請求項 1 から 32 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 35】

$R^{2A}$  が、F であり；

$R^{3A}$  が、OH または F であり；

$R^{4A}$  が、OH または F であり；

$R^{5A}$  が、メチルまたはエチニルである、

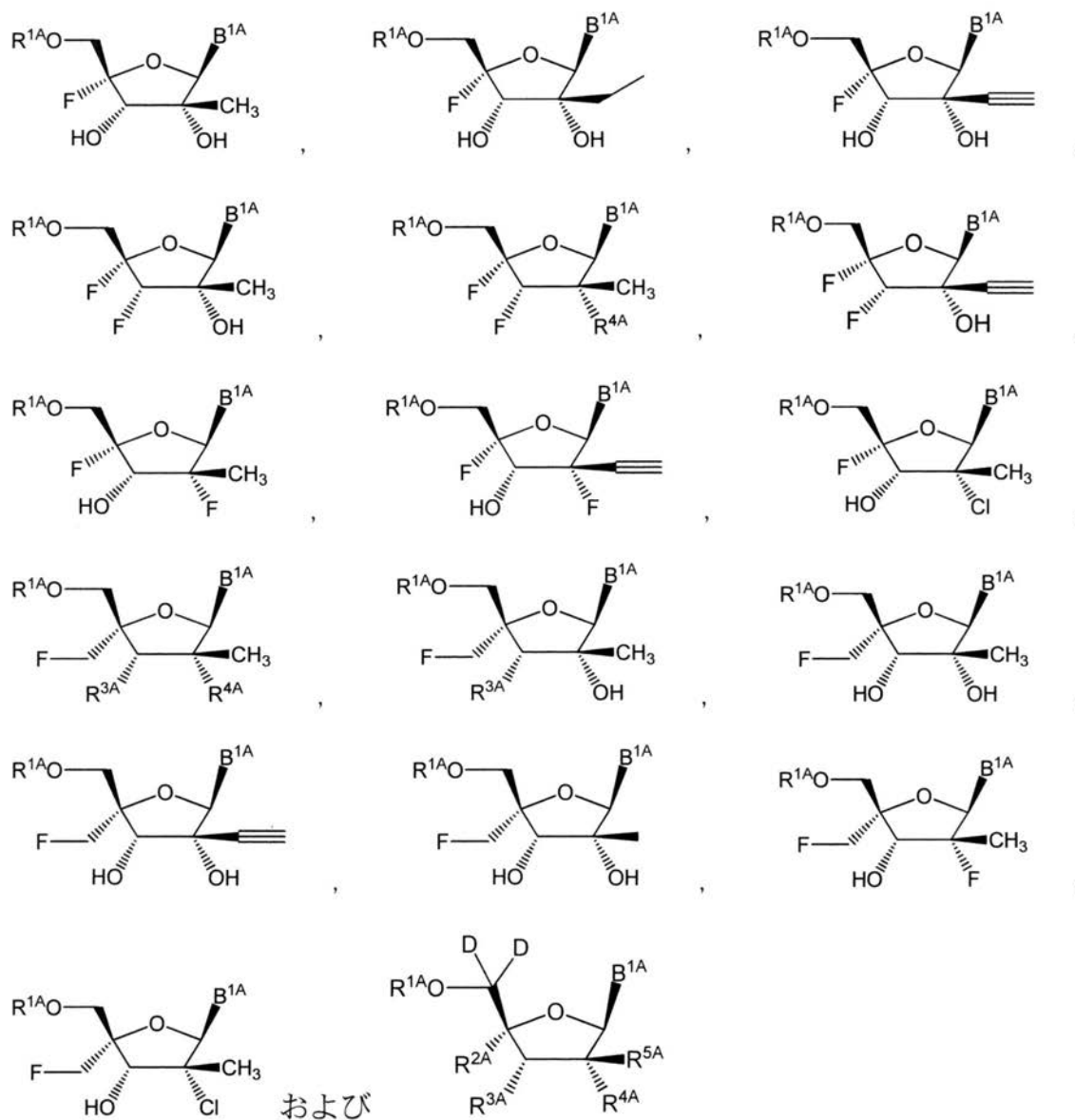
請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 36】

前記式 (I) の化合物が、



## 【化 16】

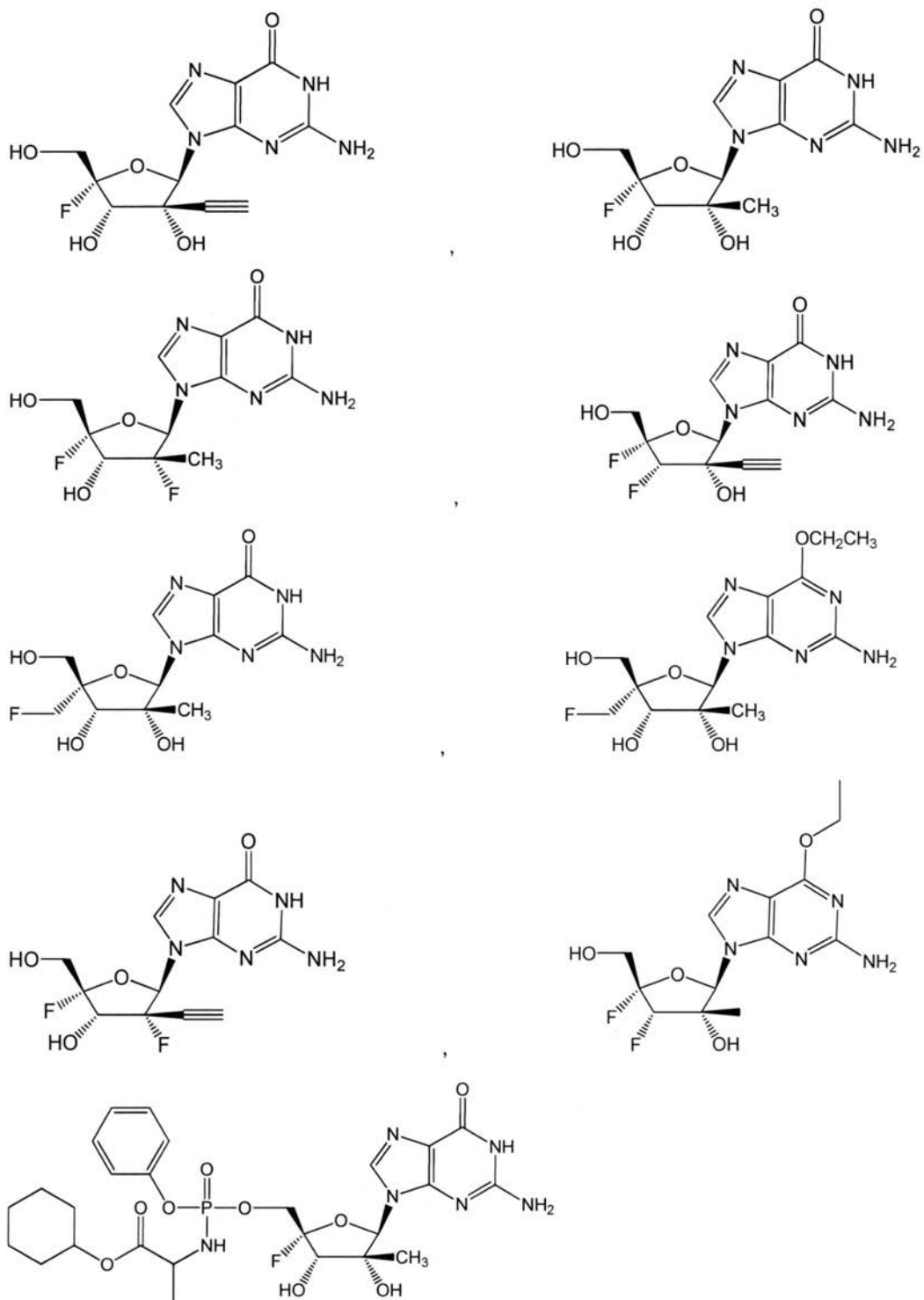


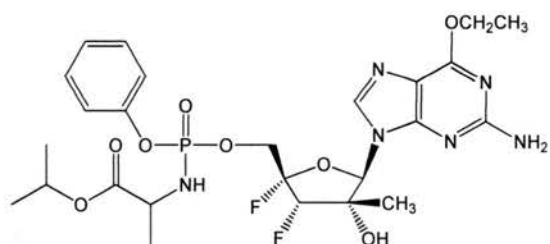
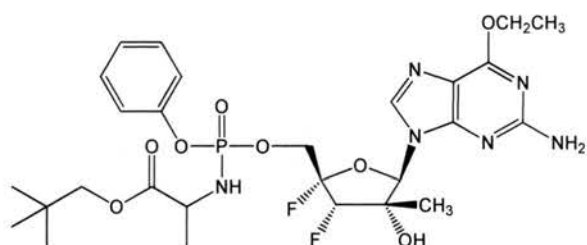
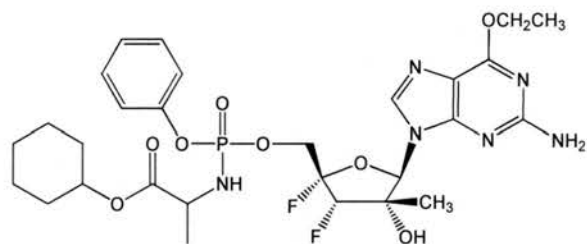
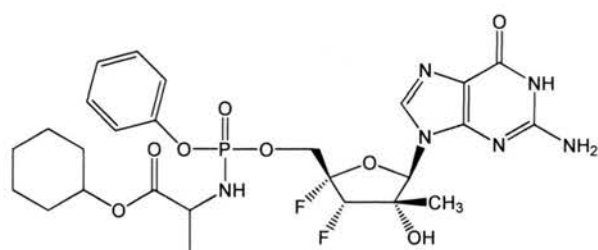
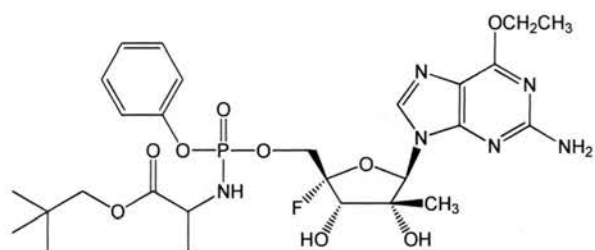
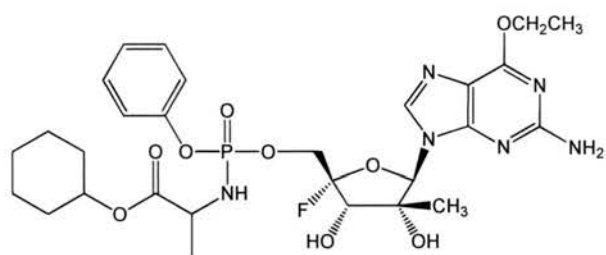
または前述のいずれかの薬学的に許容される塩からなる群から選択される、請求項 1 から 30、33 または 34 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

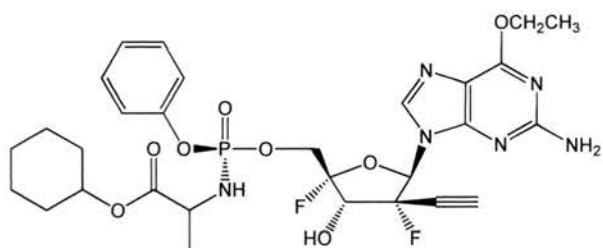
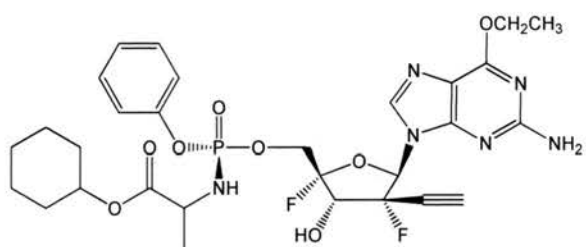
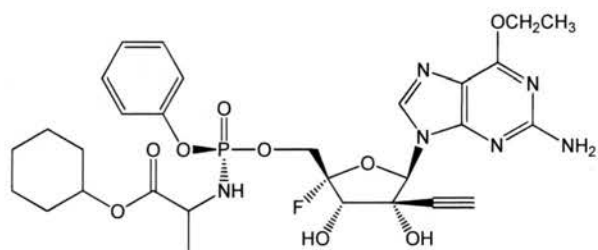
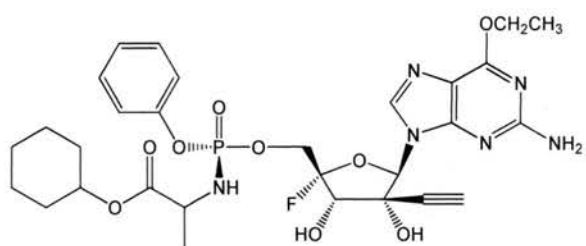
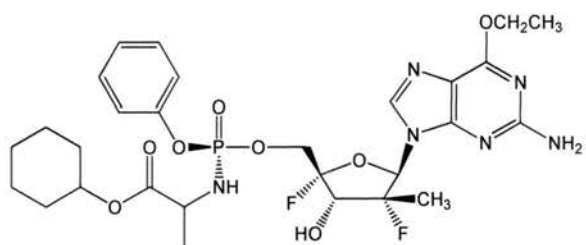
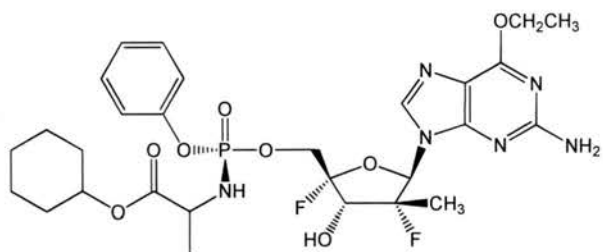
## 【請求項 37】

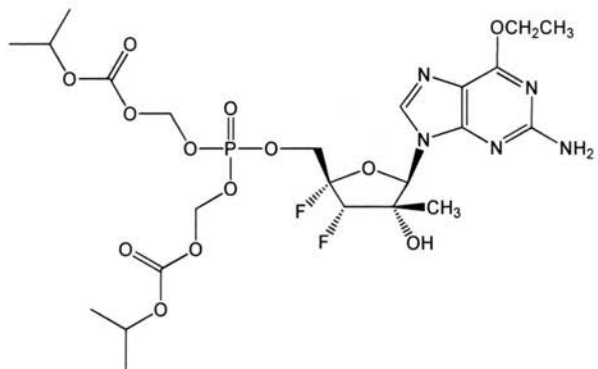
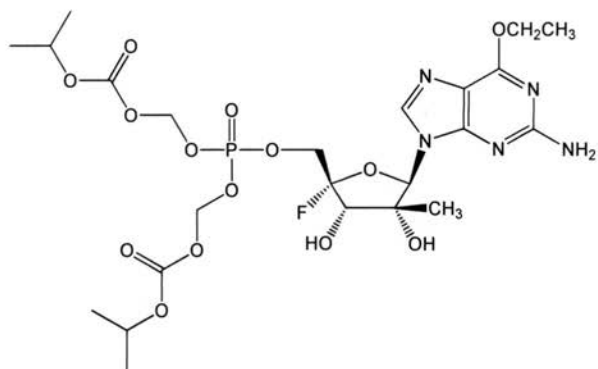
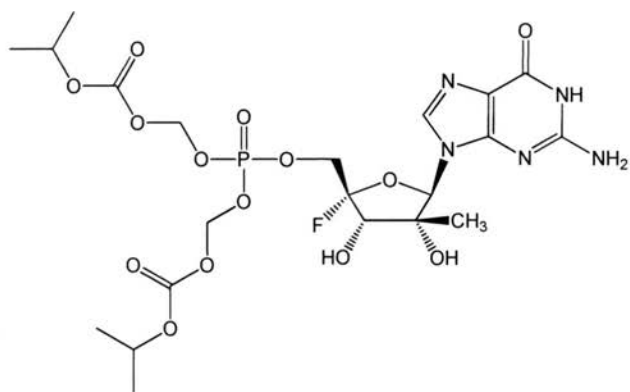
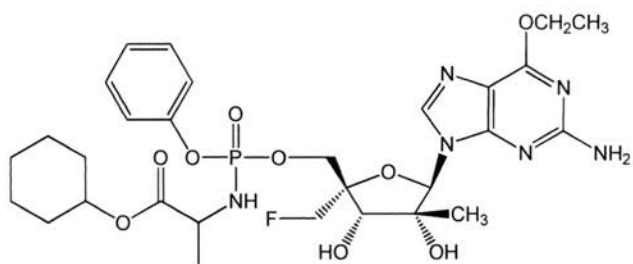
前記化合物が、

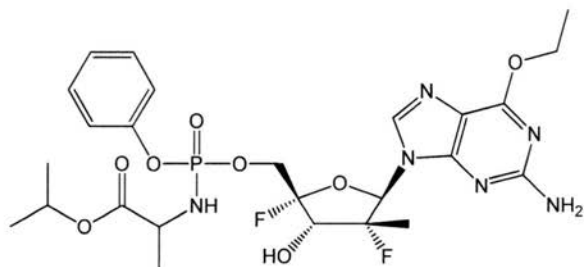
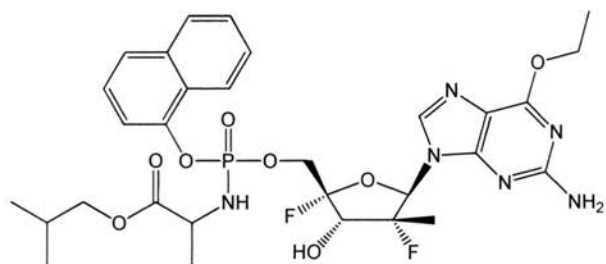
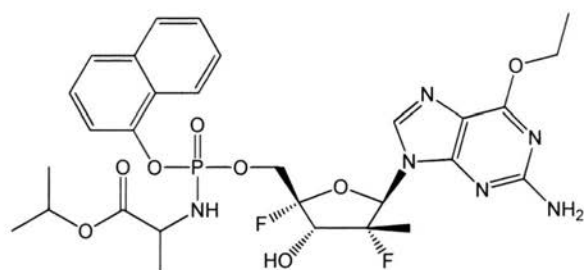
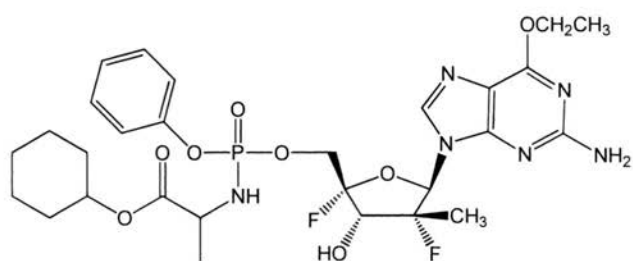
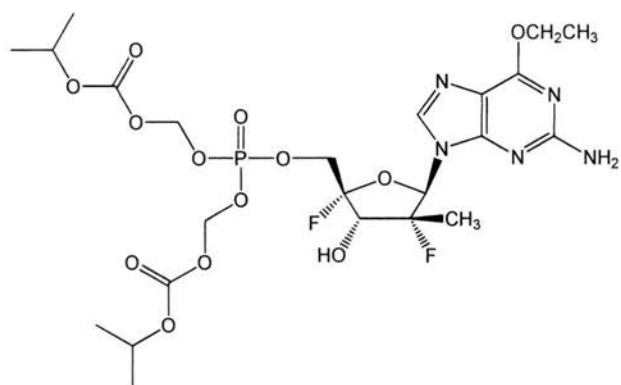
【化 17】

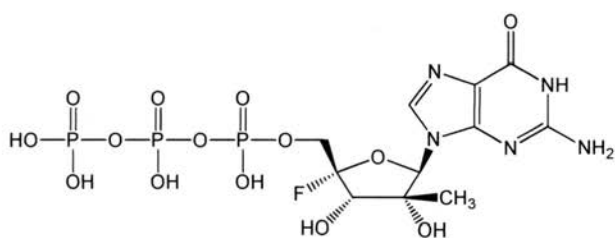
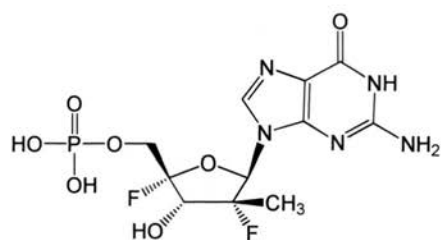
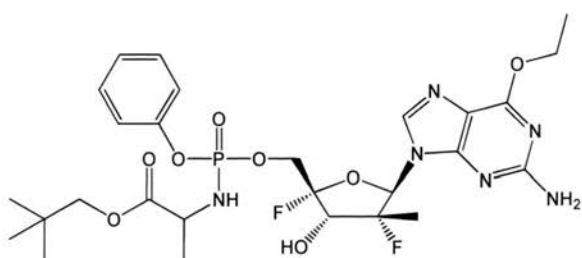
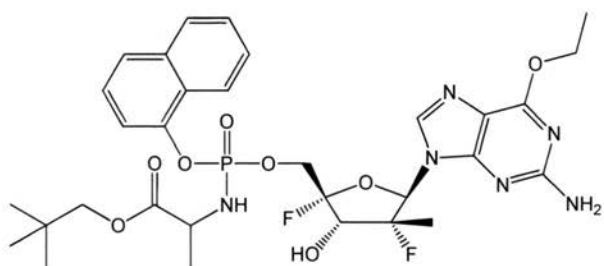
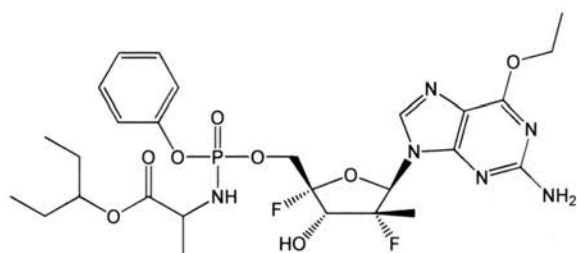
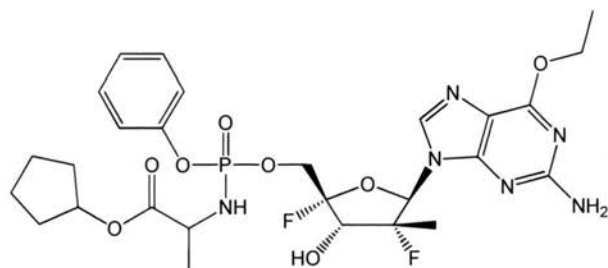
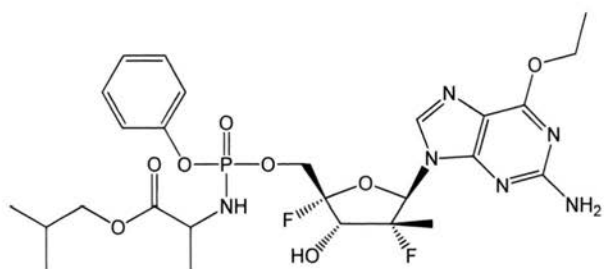


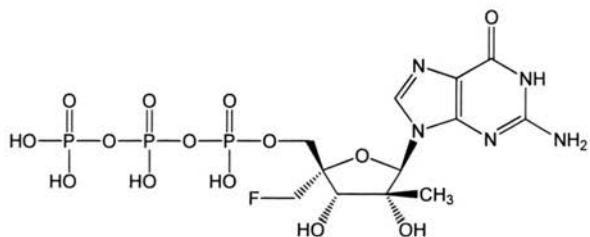
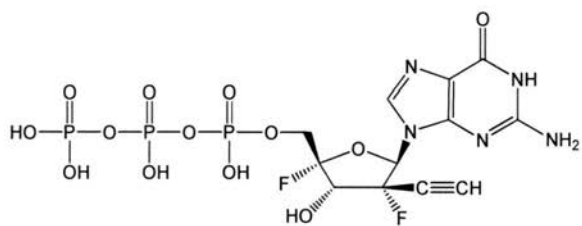
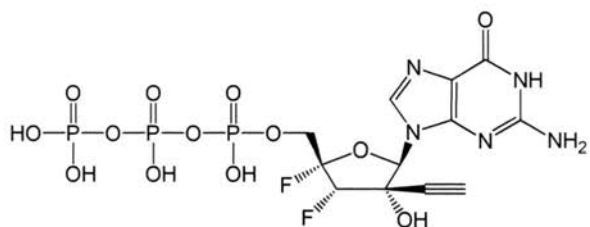
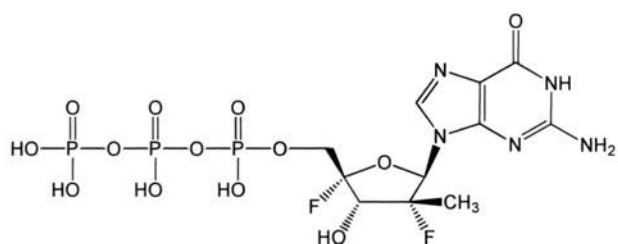
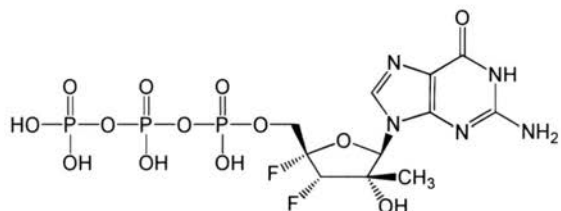
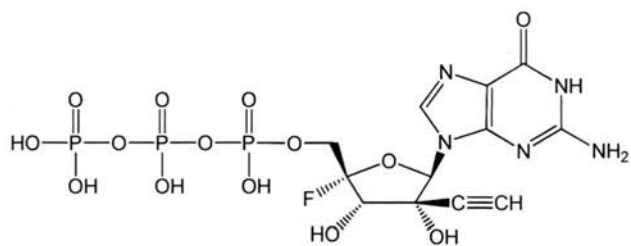




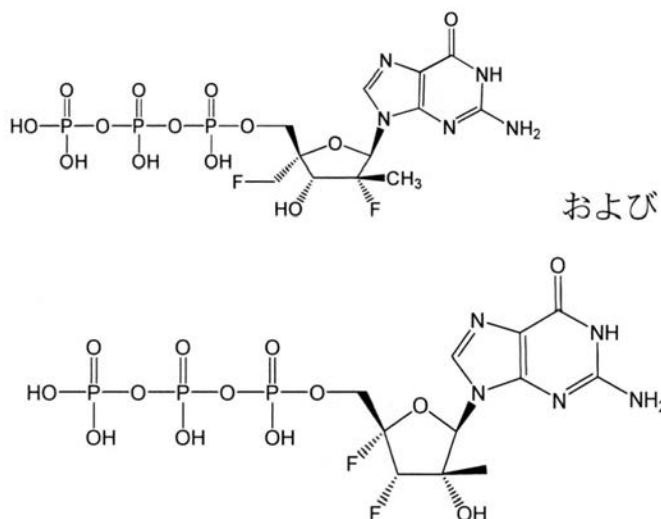










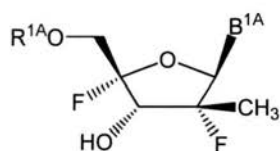


または前述のいずれかの薬学的に許容される塩からなる群から選択される、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 38】

前記式 (I) の化合物が、

【化 18】

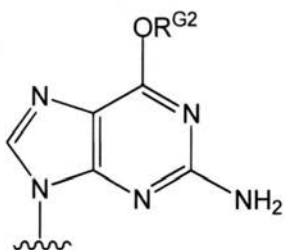


またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 39】

B<sup>1A</sup> が、

【化 19】



であり、ここで、R<sup>G2</sup> は、-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> である、請求項 38 に記載の医薬組成物。

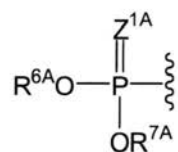
【請求項 40】

R<sup>1A</sup> が H である、請求項 38 に記載の医薬組成物。

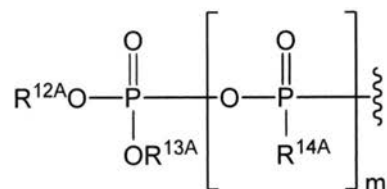
【請求項 41】

R<sup>1A</sup> が、

【化 2 0】

であり； $\text{R}^{6\text{A}}$ が、

【化 2 1】

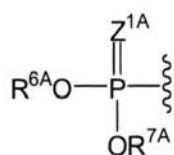


であり； $\text{R}^{7\text{A}}$ 、 $\text{R}^{12\text{A}}$ および $\text{R}^{13\text{A}}$ が、独立して、非存在または水素であり； $m$ が1であり； $\text{R}^{14\text{A}}$ が、 $\text{O}^-$ または $\text{OH}$ である、請求項38に記載の医薬組成物。

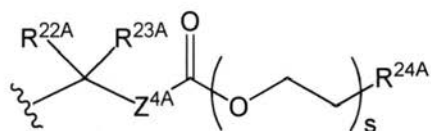
【請求項42】

 $\text{R}^{1\text{A}}$ が、

【化 2 2】

であり、 $\text{R}^{6\text{A}}$ および $\text{R}^{7\text{A}}$ が、それぞれ

【化 2 3】

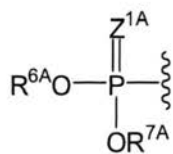


であり； $s$ が0であり； $\text{R}^{22\text{A}}$ および $\text{R}^{23\text{A}}$ が、それぞれ水素であり； $\text{R}^{24\text{A}}$ が、非置換tert-ブチルである、請求項38に記載の医薬組成物。

【請求項43】

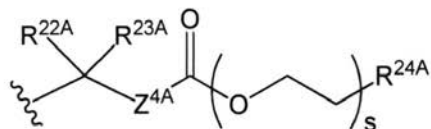
 $\text{R}^{1\text{A}}$ が、

【化 2 4】



であり、 $R^{6A}$  および  $R^{7A}$  が、それぞれ

【化 2 5】

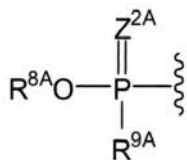


であり； $s$  が 0 であり； $R^{22A}$  および  $R^{23A}$  が、それぞれ水素であり； $R^{24A}$  が、非置換  $O$  - イソプロピルである、請求項 38 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 4】

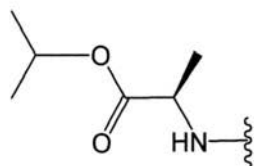
$R^{1A}$  が、

【化 2 6】



であり、 $R^{8A}$  が非置換フェニルであり； $R^{9A}$  が、

【化 2 7】

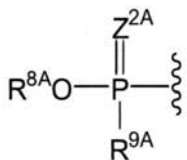


である、請求項 38 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 5】

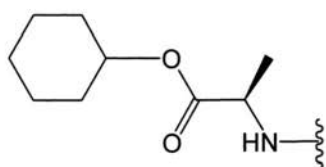
$R^{1A}$  が、

【化 2 8】



であり、 $R^{8A}$  が非置換フェニルであり； $R^{9A}$  が、

【化 2 9】

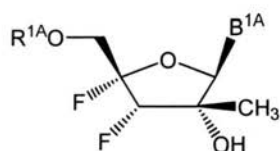


である、請求項 3 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 6】

前記式 ( I ) の化合物が、

【化 3 0】

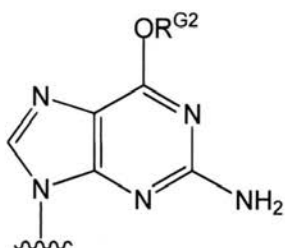


またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 4 7】

B<sup>1A</sup> が、

【化 3 1】



であり、ここで、R<sup>G2</sup> は、-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> である、請求項 4 6 に記載の医薬組成物。

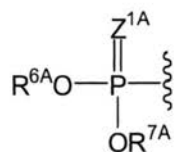
【請求項 4 8】

R<sup>1A</sup> が H である、請求項 4 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 9】

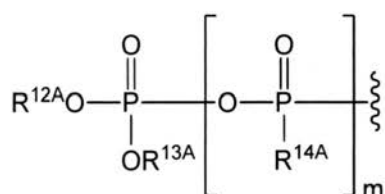
R<sup>1A</sup> が、

【化 3 2】



であり；R<sup>6A</sup> が、

## 【化 3 3】

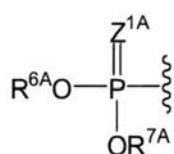


であり； $\text{R}^{7\text{A}}$ 、 $\text{R}^{12\text{A}}$  および  $\text{R}^{13\text{A}}$  が、独立して、非存在または水素であり； $m$  が 1 であり； $\text{R}^{14\text{A}}$  が、 $\text{O}^-$  または  $\text{OH}$  である、請求項 46 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 50】

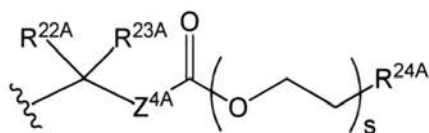
$\text{R}^{1\text{A}}$  が、

## 【化 3 4】



であり、 $\text{R}^{6\text{A}}$  および  $\text{R}^{7\text{A}}$  が、それぞれ

## 【化 3 5】

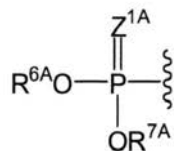


であり； $s$  が 0 であり； $\text{R}^{22\text{A}}$  および  $\text{R}^{23\text{A}}$  が、それぞれ水素であり； $\text{R}^{24\text{A}}$  が、非置換 *tert*-ブチルである、請求項 46 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 51】

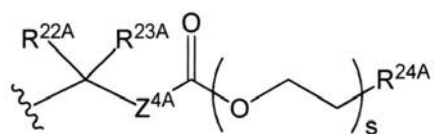
$\text{R}^{1\text{A}}$  が、

## 【化 3 6】



であり、 $\text{R}^{6\text{A}}$  および  $\text{R}^{7\text{A}}$  が、それぞれ

## 【化 3 7】

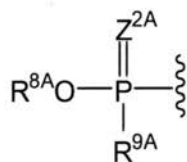


であり； $s$  が 0 であり； $R^{22A}$  および  $R^{23A}$  が、それぞれ水素であり； $R^{24A}$  が、非置換  $\alpha$ -イソプロピルである、請求項 46 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 52】

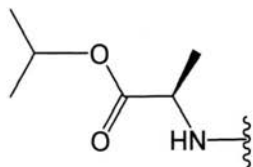
$R^{1A}$  が、

## 【化 3 8】



であり、 $R^{8A}$  が非置換フェニルであり； $R^{9A}$  が、

## 【化 3 9】

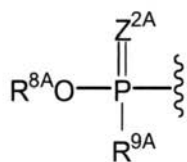


である、請求項 46 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 53】

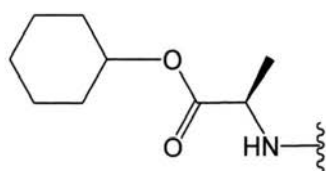
$R^{1A}$  が、

## 【化 4 0】



であり、 $R^{8A}$  が非置換フェニルであり； $R^{9A}$  が、

## 【化 4 1】

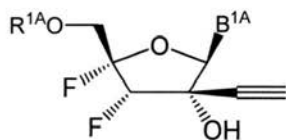


である、請求項 46 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 4】

前記式 ( I ) の化合物が、

【化 4 2】

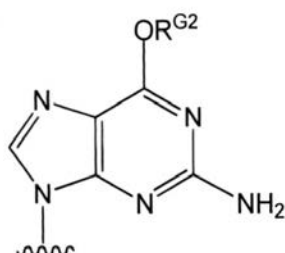


またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 5 5】

B<sup>1A</sup> が、

【化 4 3】



であり、ここで、R<sup>G 2</sup> は、-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> である、請求項 5 4 に記載の医薬組成物。

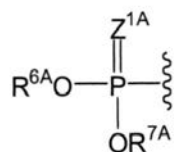
【請求項 5 6】

R<sup>1A</sup> が H である、請求項 5 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 7】

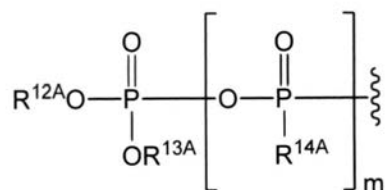
R<sup>1A</sup> が、

【化 4 4】



であり；R<sup>6A</sup> が、

【化 4 5】

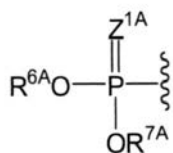


であり；R<sup>7A</sup>、R<sup>12A</sup> および R<sup>13A</sup> が、独立して、非存在または水素であり；m が 1 であり；R<sup>14A</sup> が、O<sup>-</sup> または OH である、請求項 5 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 8】

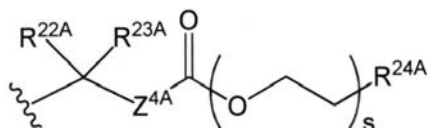
R<sup>1A</sup> が、

【化 4 6】



であり、 $R^{6A}$  および  $R^{7A}$  が、それぞれ

【化 4 7】

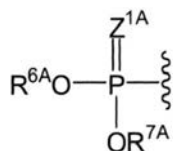


であり； $s$  が 0 であり； $R^{22A}$  および  $R^{23A}$  が、それぞれ水素であり； $R^{24A}$  が、非置換 *tert*-ブチルである、請求項 54 に記載の医薬組成物。

【請求項 59】

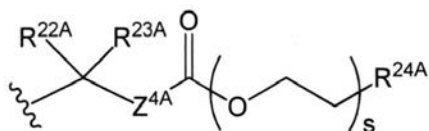
$R^{1A}$  が、

【化 4 8】



であり、 $R^{6A}$  および  $R^{7A}$  が、それぞれ

【化 4 9】

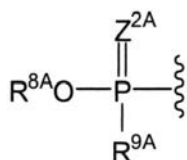


であり； $s$  が 0 であり； $R^{22A}$  および  $R^{23A}$  が、それぞれ水素であり； $R^{24A}$  が、非置換 *o*-イソプロピルである、請求項 54 に記載の医薬組成物。

【請求項 60】

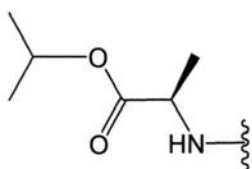
$R^{1A}$  が、

【化 5 0】





であり、 $R^{8A}$  が非置換フェニルであり； $R^{9A}$  が、  
【化 5 1】

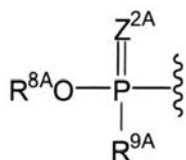


である、請求項 5 4 に記載の医薬組成物。

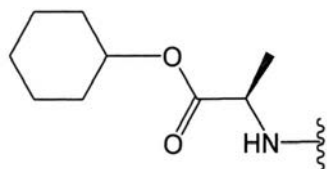
【請求項 6 1】

$R^{1A}$  が、

【化 5 2】



であり、 $R^{8A}$  が非置換フェニルであり； $R^{9A}$  が、  
【化 5 3】

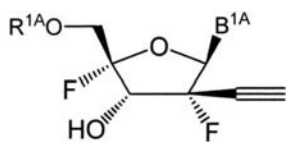


である、請求項 5 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 6 2】

前記式 (I) の化合物が、

【化 5 4】

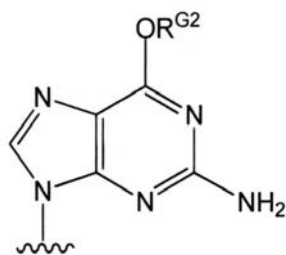


またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 6 3】

$B^{1A}$  が、

【化 5 5】



であり、ここで、 $R^{G2}$  は、 $-CH_2CH_3$  である、請求項 6 2 に記載の医薬組成物。

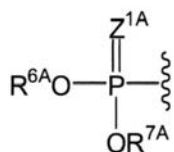
【請求項 6 4】

$R^{1A}$  が H である、請求項 6 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 6 5】

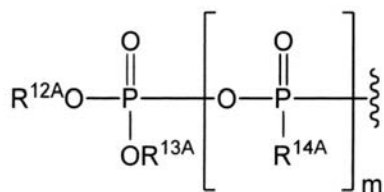
$R^{1A}$  が、

【化 5 6】



であり； $R^{6A}$  が、

【化 5 7】

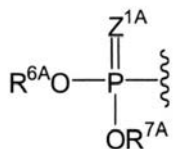


であり； $R^{7A}$ 、 $R^{12A}$  および  $R^{13A}$  が、独立して、非存在または水素であり； $m$  が 1 であり； $R^{14A}$  が、 $O^-$  または  $OH$  である、請求項 6 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 6 6】

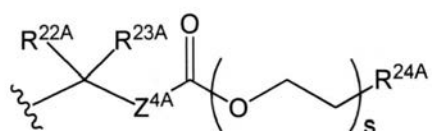
$R^{1A}$  が、

【化 5 8】



であり、 $R^{6A}$  および  $R^{7A}$  が、それぞれ

【化 5 9】

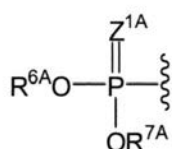


であり； $s$  が 0 であり； $R^{22A}$  および  $R^{23A}$  が、それぞれ水素であり； $R^{24A}$  が、非置換 *tert*-ブチルである、請求項 62 に記載の医薬組成物。

【請求項 67】

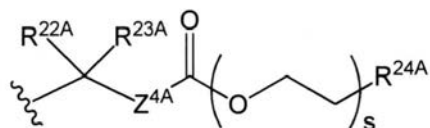
$R^{1A}$  が、

【化 60】



であり、 $R^{6A}$  および  $R^{7A}$  が、それぞれ

【化 61】

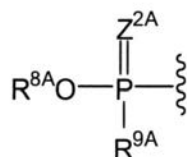


であり； $s$  が 0 であり； $R^{22A}$  および  $R^{23A}$  が、それぞれ水素であり； $R^{24A}$  が、非置換 *O*-イソプロピルである、請求項 62 に記載の医薬組成物。

【請求項 68】

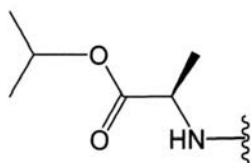
$R^{1A}$  が、

【化 62】



であり、 $R^{8A}$  が非置換フェニルであり； $R^{9A}$  が、

【化 63】

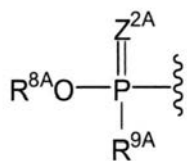


である、請求項 6 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 6 9】

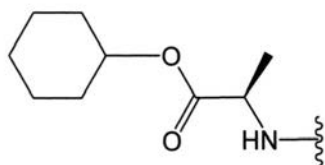
$R^{1A}$  が、

【化 6 4】



であり、 $R^{8A}$  が非置換フェニルであり； $R^{9A}$  が、

【化 6 5】

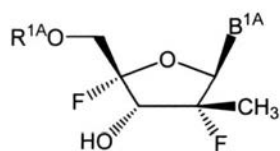


である、請求項 6 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 7 0】

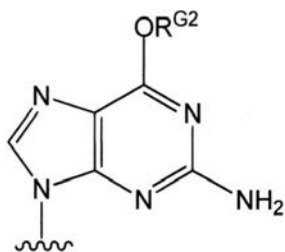
前記化合物が、

【化 6 6】



、またはその薬学的に許容される塩であり、ここで、 $B^{1A}$  は、

【化 6 7】

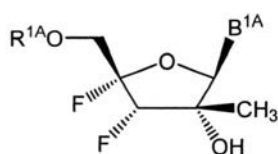


であり； $R^{G2}$  は  $-CH_2CH_3$  であり； $R^{1A}$  は水素である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 7 1】

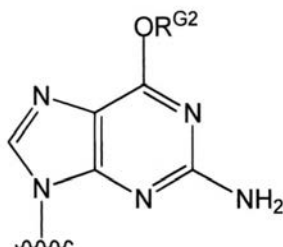
前記化合物が、

【化 6 8】



、またはその薬学的に許容される塩であり、ここで、 $B^{1A}$ は、

【化 6 9】

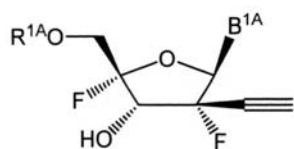


であり； $R^{G2}$ は $-CH_2CH_3$ であり； $R^{1A}$ は水素である、請求項1から6のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 7 2】

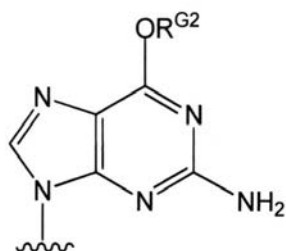
前記化合物が、

【化 7 0】



、またはその薬学的に許容される塩であり、ここで、 $B^{1A}$ は、

【化 7 1】

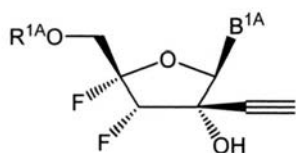


であり； $R^{G2}$ は $-CH_2CH_3$ であり； $R^{1A}$ は水素である、請求項1から6のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 7 3】

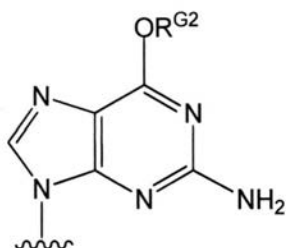
前記化合物が、

【化 7 2】



、またはその薬学的に許容される塩であり、ここで、 $B^{1A}$ は、

【化 7 3】

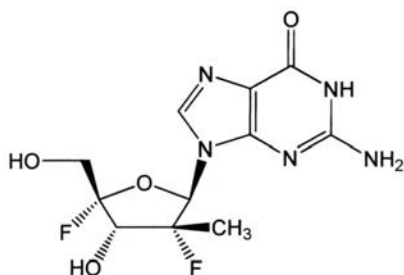


であり； $R^{G2}$ は $-CH_2CH_3$ であり； $R^{1A}$ は水素である、請求項1から6のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 7 4】

前記化合物が、

【化 7 4】

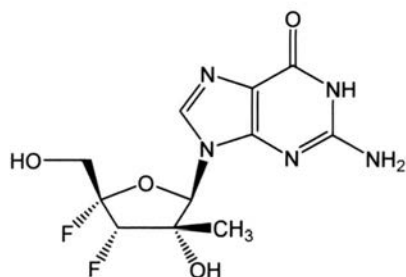


またはその薬学的に許容される塩である、請求項1から6のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 7 5】

前記化合物が、

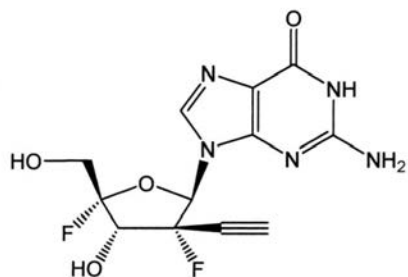
【化 7 5】



またはその薬学的に許容される塩である、請求項1から6のいずれか一項に記載の医薬組成物。

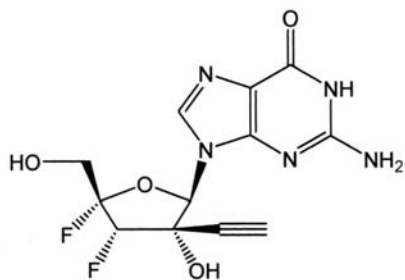
【請求項 7 6】

前記化合物が、  
【化 7 6】



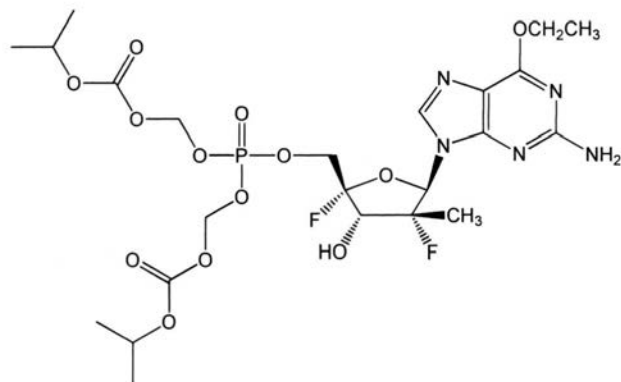
またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 7 7】  
前記化合物が、  
【化 7 7】



またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

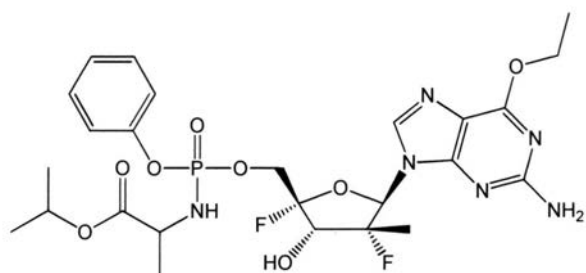
【請求項 7 8】  
前記化合物が、  
【化 7 8】



またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 7 9】  
前記化合物が、

## 【化 7 9】

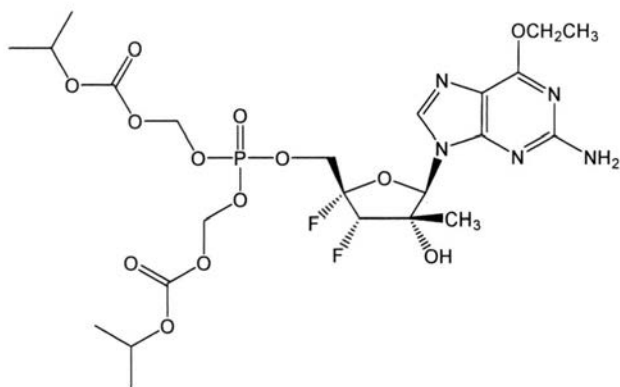


またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 8 0】

前記化合物が、

## 【化 8 0】

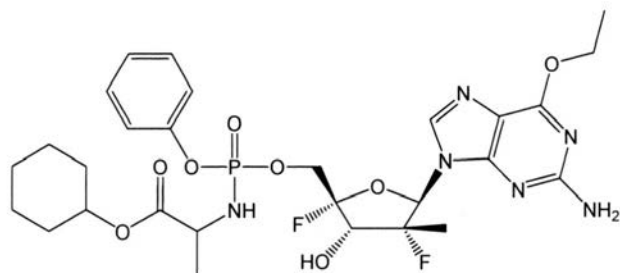


またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 8 1】

前記化合物が、

## 【化 8 1】



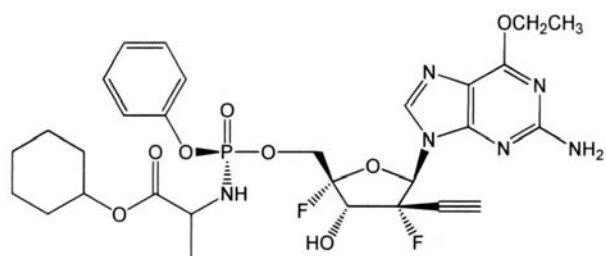
またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 8 2】

前記化合物が、



## 【化 8 2】

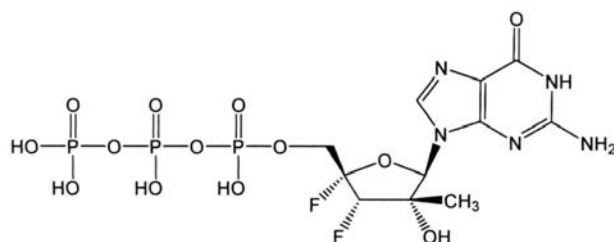


またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 8 3】

前記化合物が、

## 【化 8 3】

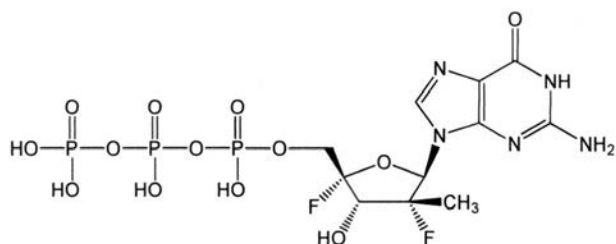


またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 8 4】

前記化合物が、

## 【化 8 4】

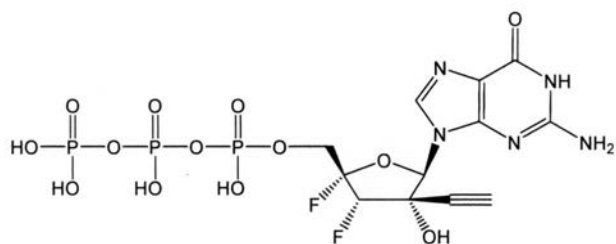


またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 8 5】

前記化合物が、

【化 8 5】

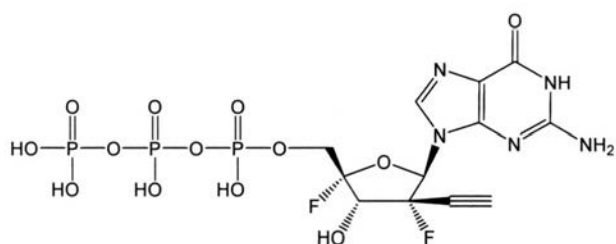


またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 8 6】

前記化合物が、

【化 8 6】

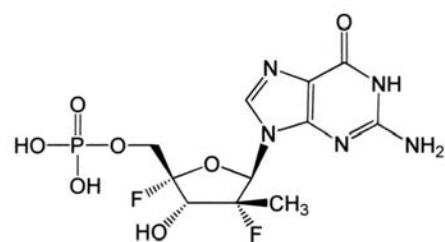


またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 8 7】

前記化合物が、

【化 8 7】



またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の医薬組成物。