

【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29年1月12日 (2017.1.12)

【公表番号】特表2016-504284(P2016-504284A)

【公表日】平成28年2月12日 (2016.2.12)

【年通号数】公開・登録公報2016-010

【出願番号】特願2015-542870(P2015-542870)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 413/04 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/513 (2006.01)

A 6 1 K 31/5355 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

A 6 1 P 31/16 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/04 C S P

C 0 7 D 403/04

C 0 7 D 413/04

C 0 7 D 487/04 1 4 0

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/513

A 6 1 K 31/5355

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 31/14

A 6 1 P 31/16

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成28年11月16日 (2016.11.16)

【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】

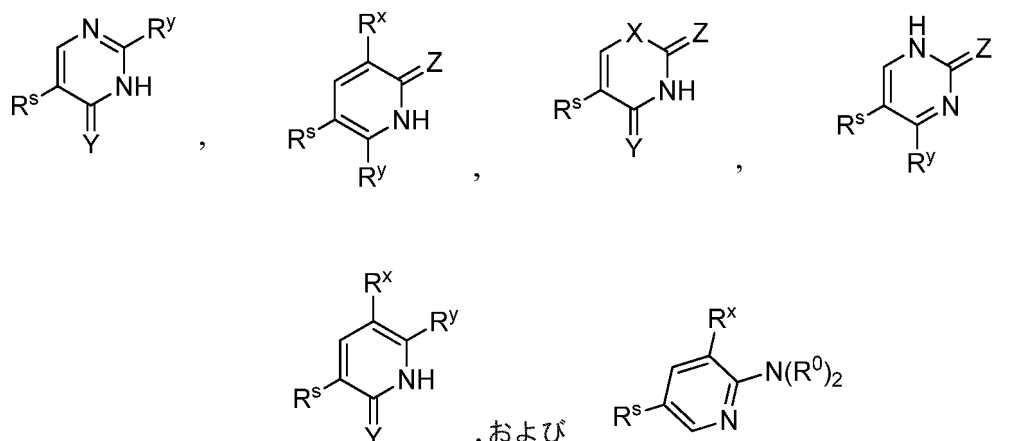
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

R<sup>s</sup> - B により表される化合物、またはその薬学的に許容される塩：  
ここで、

$R^s - B$  は

【化 1】



からなる群より選択され、

$X$  は、 $O$ 、 $S$ 、および  $NR^{10}$  からなる群より選択され；

$R^{10}$  は、発生毎に独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラ  
ルキル、およびヘテロアルキルからなる群より選択され；

$R^x$  は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $OR^0$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルケニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキニル、 $C$   
 $N$ 、 $N(R^0)_2$ 、 $NO_2$ 、アジド、ハロゲン化物、アリール、およびヘテロアリールから  
なる群より選択され；

$R^0$  は、発生毎に独立して、 $H$  または  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり；

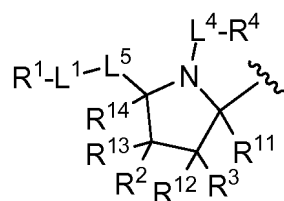
$R^y$  は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $OR^0$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルケニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキニル、 $C$   
 $N$ 、 $N(R^0)_2$ 、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$Y$  は、 $O$  および  $S$  からなる群より選択され；

$Z$  は、 $O$  および  $S$  からなる群より選択され；

$R^s$  は、下記式

【化 2】



により表され；

$L^1$  および  $L^4$  は、各々独立して、結合または  $-C(R^0)_2-O-$  であり；

$L^5$  は、結合、 $O$ 、 $-C(R^0)_2-O-$ 、 $-C(R^0)_2-S-$ 、または  $-C(R^0)_2-NH-$  であり；

$R^1$  は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、アミノアシル、アミノチオニル、 $C_1 \sim C_6$  アシル、 $R^1$   
 $^0OC(O)-$ 、ホスホリル、およびアミノホスホリルからなる群より選択され；

$R^2$  および  $R^3$  は、各々独立して、 $H$ 、ハロゲン化物、アジド、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1$   
 $\sim C_6$  アルケニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキニル、 $CN$ 、 $OR^0$ 、 $R^{10}OC(O)-$ 、または  $SR^0$   
であり；

もしくは、 $R^1$  および  $R^2$  は一緒になって、または  $R^2$  および  $R^3$  は一緒になって、 $-OC$   
 $(O)O-$ 、 $-OC(S)O-$ 、ホスホリル、および  $C_1 \sim C_6$  アルキルホスホリルからなる  
群より選択され；

もしくは、 $R^2$  および  $R^3$  は一緒になって、それらが結合する炭素原子の間に結合を形成  
し；

$R^4$  は、発生毎に独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C$

$C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、ホスホリル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^{11}$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $OR^0$ 、およびCNからなる群より選択され；

$R^{12}$ および $R^{13}$ は、各々独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $OR^0$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$R^{14}$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $OR^0$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択される。

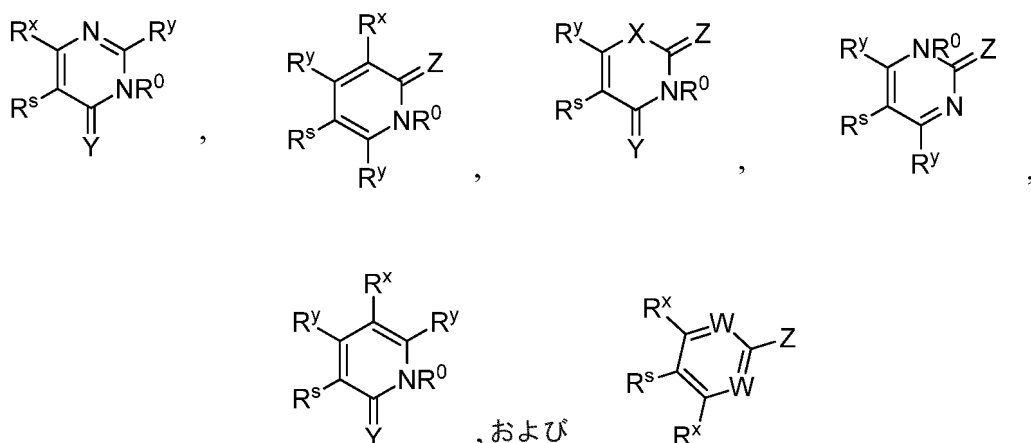
#### 【請求項2】

$R^s - B$ により表される化合物、またはその薬学的に許容される塩；

ここで、

$R^s - B$ は

#### 【化3】



からなる群より選択され、

$W$ は、発生毎に独立して、 $CR^x$ またはNであり；

$X$ は、O、S、および $NR^{10}$ からなる群より選択され；

$R^{10}$ は、発生毎に独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^x$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $OR^0$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、CN、 $N(R^0)_2$ 、 $NO_2$ 、アジド、ハロゲン化物、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され；

$R^0$ は、発生毎に独立して、Hまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

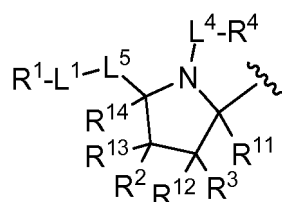
$R^y$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $OR^0$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、CN、 $N(R^0)_2$ 、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$Y$ は、OおよびSからなる群より選択され；

$Z$ は、OおよびSからなる群より選択され；

$R^s$ は、下記式

#### 【化4】



により表され；

$L^1$ および $L^4$ は、各々独立して、結合または $-C(R^0)_2-O-$ であり；

$L^5$ は、結合、O、 $-C(R^0)_2-O-$ 、 $-C(R^0)_2-S-$ 、または $-C(R^0)_2-$

NH-であり；

$R^1$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アミノアシル、アミノチオニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、 $R^{10}OC(O)-$ 、ホスホリル、およびアミノホスホリルからなる群より選択され；

$R^2$ および $R^3$ は、各々独立して、H、ハロゲン化物、アジド、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、CN、 $OR^0$ 、 $R^{10}OC(O)-$ 、または $SR^0$ であり；

もしくは、 $R^1$ および $R^2$ は一緒になって、または $R^2$ および $R^3$ は一緒になって、 $-OC(O)O-$ 、 $-OC(S)O-$ 、ホスホリル、および $C_1 \sim C_6$ アルキルホスホリルからなる群より選択され；

もしくは、 $R^2$ および $R^3$ は一緒になって、それらが結合する炭素原子の間に結合を形成し；

$R^4$ は、発生毎に独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、ホスホリル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^{11}$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $OR^0$ 、およびCNからなる群より選択され；

$R^{12}$ および $R^{13}$ は、各々独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $OR^0$ 、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$R^{14}$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $OR^0$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択される。

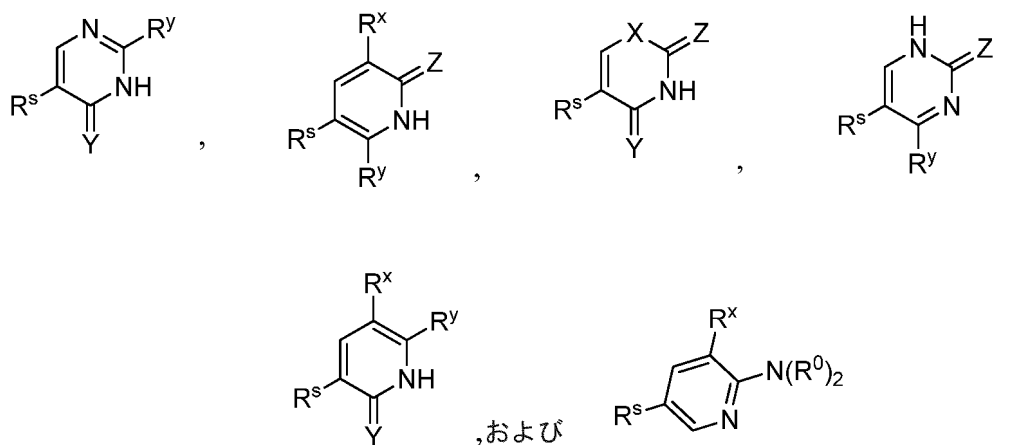
#### 【請求項3】

$R^s - B$ により表される化合物、またはその薬学的に許容される塩；

ここで、

$R^s - B$ は

#### 【化5】



からなる群より選択され；

$X$ は、O、S、および $NR^{10}$ からなる群より選択され；

$R^{10}$ は、発生毎に独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^x$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $OR^0$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、CN、 $N(R^0)_2$ 、 $NO_2$ 、アジド、ハロゲン化物、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され；

$R^0$ は、発生毎に独立して、Hまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

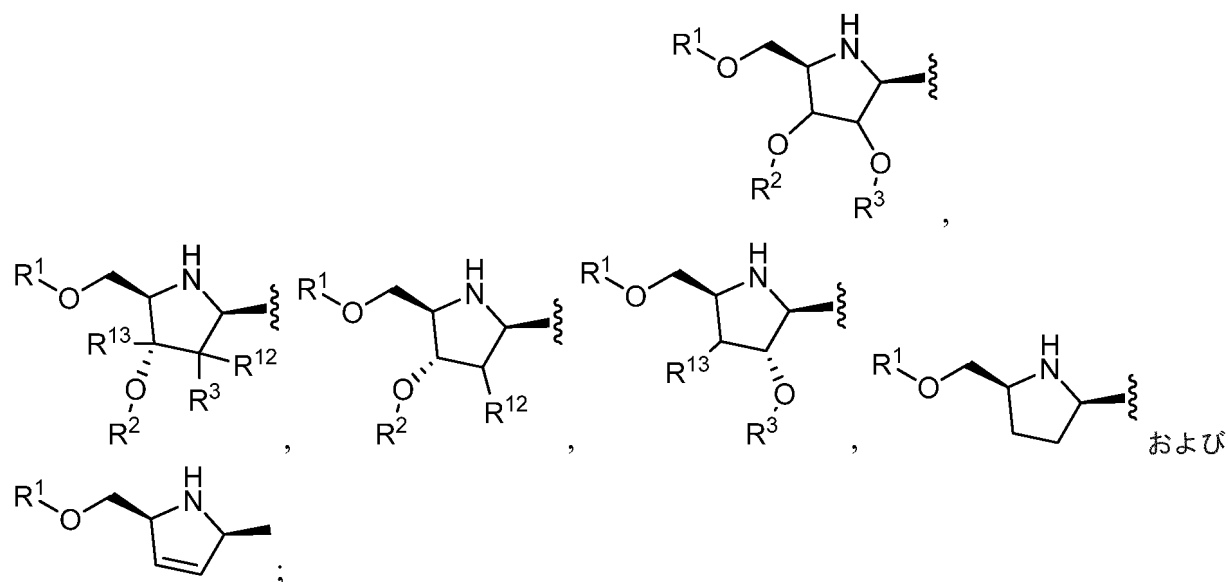
$R^y$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $OR^0$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、CN、 $N(R^0)_2$ 、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$Y$ は、OおよびSからなる群より選択され；

Z は、O および S からなる群より選択され；

R<sup>s</sup> は

【化 6】



からなる群より選択され；

R<sup>1</sup> は、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、アミノアシル、アミノチオニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アシル、R<sup>1</sup><sub>0</sub>OC(O)-、ホスホリル、およびアミノホスホリルからなる群より選択され；

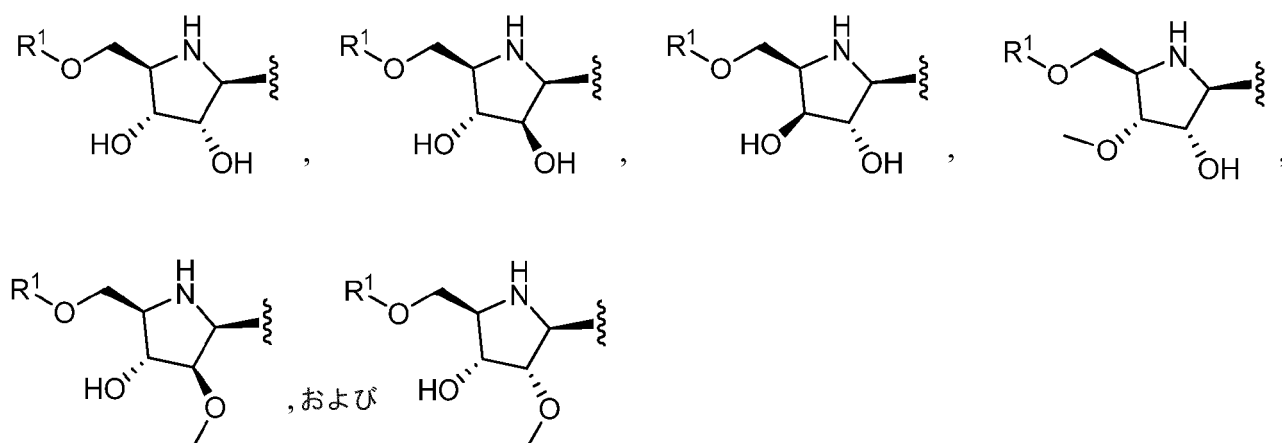
R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は、各々独立して、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、または C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキニルであり；

R<sup>12</sup> および R<sup>13</sup> は、各々独立して、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、OR<sup>0</sup>、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択される。

【請求項 4】

R<sup>s</sup> が

【化 7】

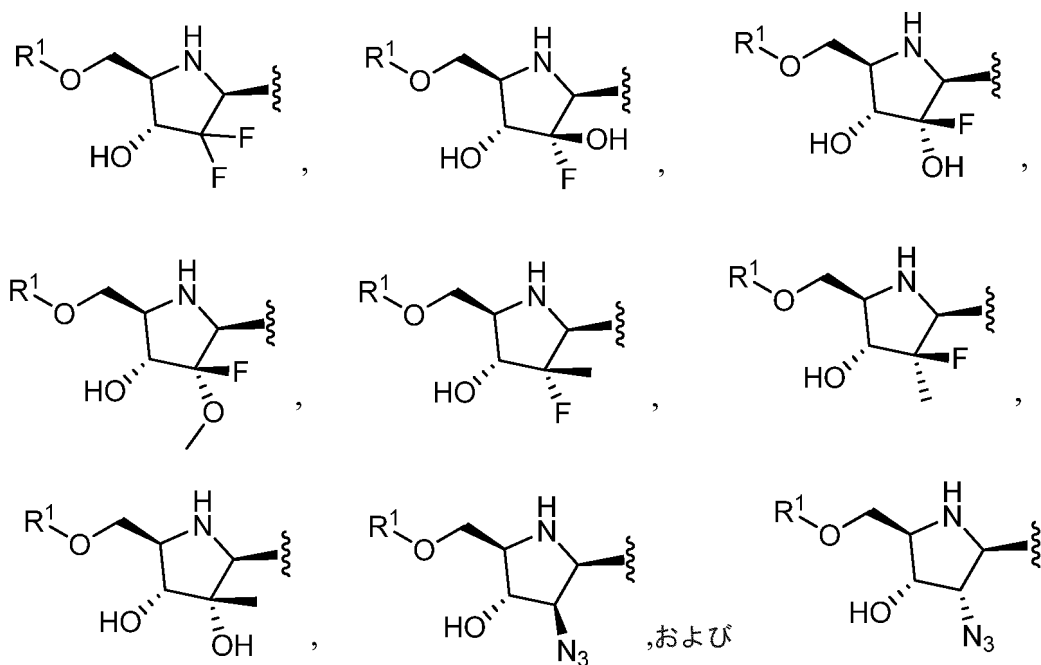


からなる群より選択される、請求項 1 から 3 いずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 5】

R<sup>s</sup> が

## 【化 8】

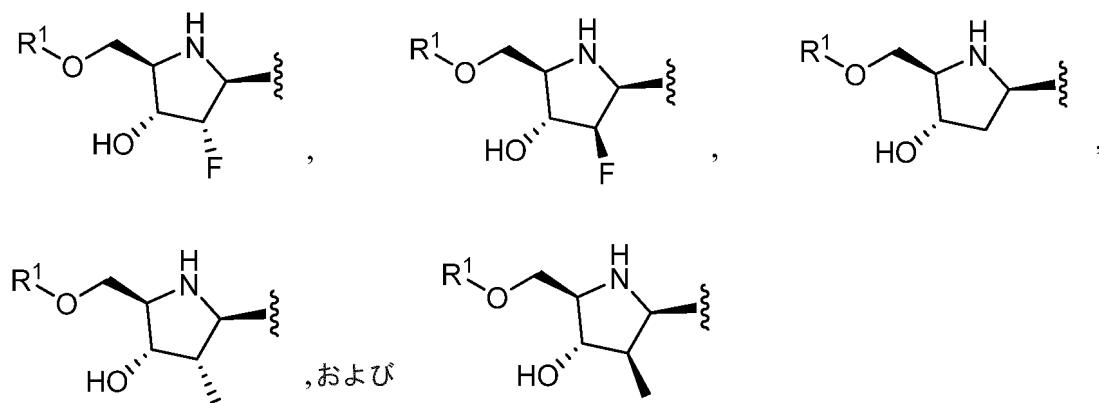


からなる群より選択される、請求項 1 から 3 いずれか 1 項記載の化合物。

## 【請求項 6】

R<sup>s</sup> が

## 【化 9】

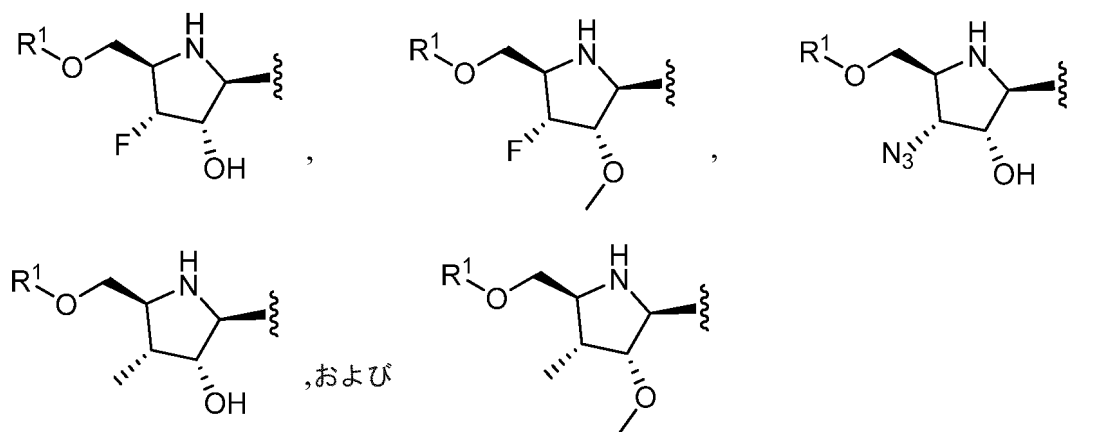


からなる群より選択される、請求項 1 から 3 いずれか 1 項記載の化合物。

## 【請求項 7】

R<sup>s</sup> が

## 【化 1 0】

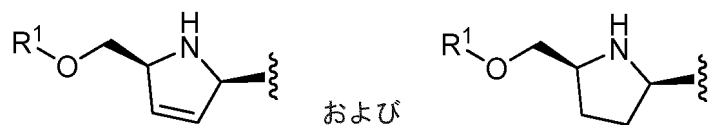


からなる群より選択される、請求項 1 から 3 いずれか 1 項記載の化合物。

## 【請求項 8】

$R^s$  が

## 【化 1 1】



からなる群より選択される、請求項 1 から 3 いずれか 1 項記載の化合物。

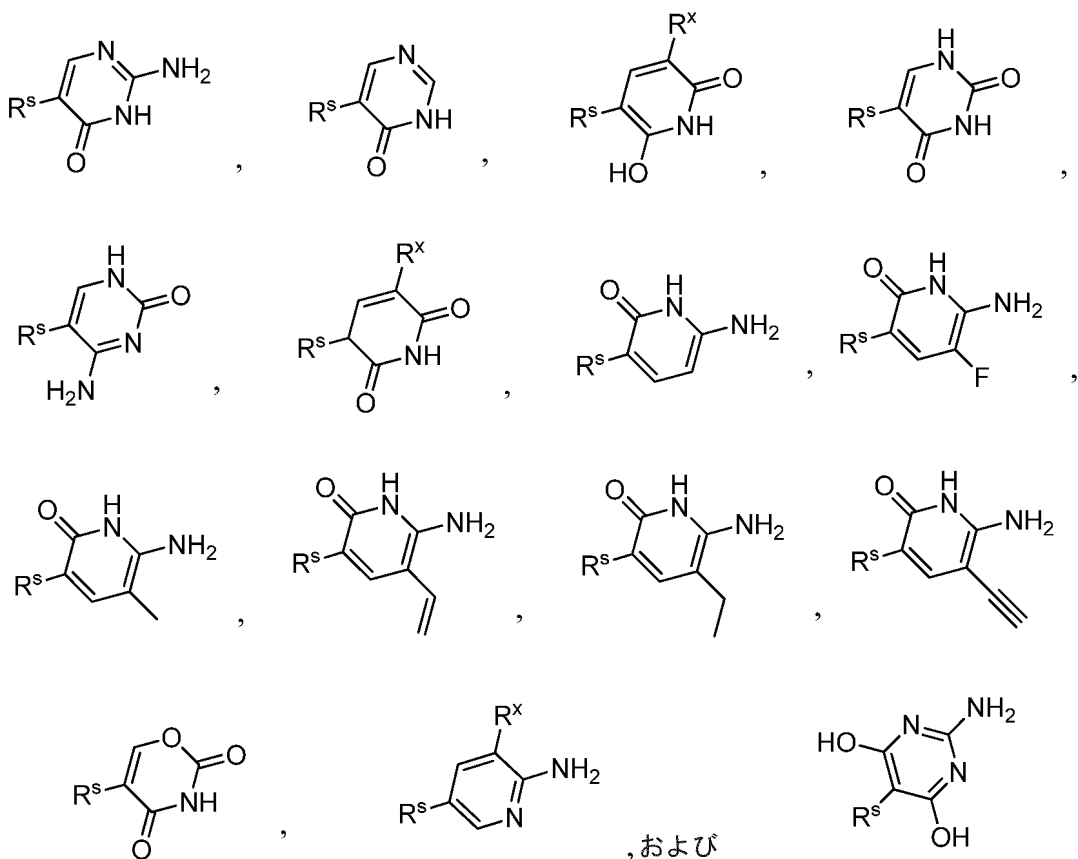
## 【請求項 9】

$R^1$  が H、メチル、またはエチルである、請求項 1 から 8 いずれか 1 項記載の化合物。

## 【請求項 10】

$R^s$  - B が

## 【化 1 2】



からなる群より選択され；

$R^x$  が、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $OR^0$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、C N、 $NH_2$ 、アミノアルキル、 $NO_2$ 、アジド、ハロゲン化物、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択される；

請求項 1 から 9 いずれか 1 項記載の化合物。

## 【請求項 1 1】

$R^x$  が F、Cl、Br、または I である、請求項 1 から 10 いずれか 1 項記載の化合物。

## 【請求項 1 2】

$R^x$  が H、メチル、エチル、またはプロピルである、請求項 1 から 10 いずれか 1 項記載の化合物。

## 【請求項 1 3】

$R^x$  がエテニルまたはエチニルである、請求項 1 から 10 いずれか 1 項記載の化合物。

## 【請求項 1 4】

$R^x$  が CN、 $NH_2$ 、またはアミノアルキルである、請求項 1 から 10 いずれか 1 項記載の化合物。

## 【請求項 1 5】

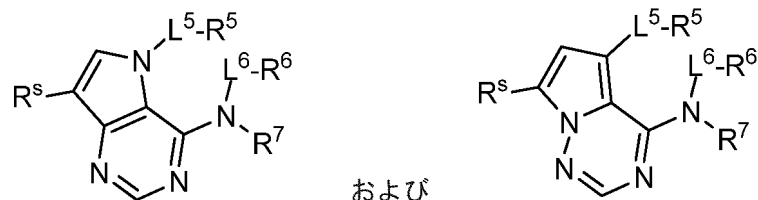
$R^s$  - B により表される化合物、またはその薬学的に許容される塩；

ここで、

$R^s$  - B は



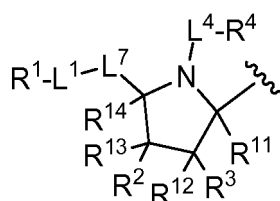
## 【化 1 3】



からなる群より選択され；

$R^s$ は、下記式

## 【化 1 4】



により表され；

$L^1$ は結合であり；

$L^4$ 、 $L^5$ 、および $L^6$ は、各々独立して、結合または $-C(R^0)_2-O-$ であり；

$L^7$ は、 $O$ 、 $-CH_2-$ 、 $-CH(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})-$ 、 $-C(R^0)_2-S-$ 、または $-C(R^0)_2-NH-$ であり；

$R^0$ は、発生毎に独立して、 $H$ または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

$R^1$ は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アミノアシル、アミノチオニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、 $R^{10}OC(O)-$ 、ホスホリル、およびアミノホスホリルからなる群より選択され；

$R^2$ および $R^3$ は、各々独立して、 $H$ 、ハロゲン化物、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $CN$ 、 $OR^0$ 、 $R^{10}OC(O)-$ 、または $SR^0$ であり；

もしくは、 $R^1$ および $R^2$ は一緒になって、または $R^2$ および $R^3$ は一緒になって、 $-OC(O)O-$ 、 $-OC(S)O-$ 、ホスホリル、および $C_1 \sim C_6$ アルキルホスホリルからなる群より選択され；

もしくは、 $R^2$ および $R^3$ は一緒になって、それらが結合する炭素原子の間に結合を形成し；

$R^4$ は、発生毎に独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、ホスホリル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^{10}$ は、発生毎に独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^5$ および $R^6$ は、各々独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、アルキルチオ、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；もしくは $R^5$ は存在しないこともあり；

$R^7$ は $H$ であり；もしくは $R^6$ 、 $R^7$ 、およびそれらが結合する窒素が一緒になって、 $-N=C(R^{20})R^{21}$ を表し；

$R^{20}$ および $R^{21}$ は、各々独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^{11}$ は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $OR^0$ 、 $CN$ 、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$R^{12}$ および $R^{13}$ は、各々独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1$

~ C<sub>6</sub>アルキニル、OR<sup>0</sup>、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択され；  
R<sup>14</sup>は、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、OR<sup>0</sup>、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択される。

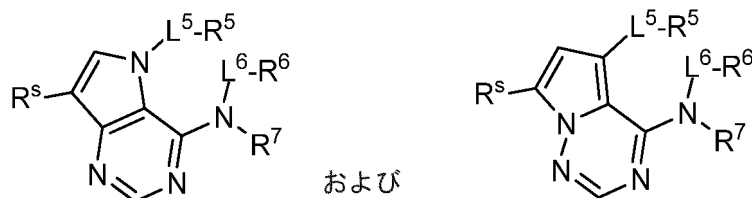
【請求項 16】

R<sup>s</sup> - B により表される化合物、またはその薬学的に許容される塩：

ここで、

R<sup>s</sup> - B は

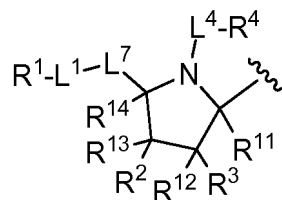
【化 15】



からなる群より選択され；

R<sup>s</sup>は、下記式

【化 16】



により表され；

L<sup>1</sup>、L<sup>4</sup>、L<sup>5</sup>、および L<sup>6</sup>は、各々独立して、結合または - C(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub> - O - であり；

L<sup>7</sup>は、結合、O、- C(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub> - O -、- C(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub> - S -、または - C(R<sup>0</sup>)<sub>2</sub> - NH - であり；

R<sup>0</sup>は、発生毎に独立して、HまたはC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルであり；

R<sup>1</sup>は、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、アミノアシル、アミノチオニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アシル、R<sup>10</sup>OC(O)-、ホスホリル、およびアミノホスホリルからなる群より選択され；

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、各々独立して、H、ハロゲン化物、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、CN、OR<sup>0</sup>、R<sup>10</sup>OC(O)-、またはSR<sup>0</sup>であり；

もしくは、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は一緒になって、またはR<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は一緒になって、- OC(O)O-、- OC(S)O-、ホスホリル、およびC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルホスホリルからなる群より選択され；

もしくは、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は一緒になって、それらが結合する炭素原子の間に結合を形成し；

R<sup>4</sup>は、発生毎に独立して、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アシル、ホスホリル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

R<sup>10</sup>は、発生毎に独立して、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>は、各々独立して、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アシル、アルキルチオ、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；もしくはR<sup>5</sup>は存在しないこともあり；

R<sup>7</sup>はHであり；もしくはR<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、およびそれらが結合する窒素が一緒になって、- N = C R<sup>20</sup> R<sup>21</sup>を表し；

R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、各々独立して、H、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、アミノ、アリール、ヘテロ

アリール、アラルキル、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^{11}$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $OR^0$ 、およびCNからなる群より選択され；

$R^{12}$ および $R^{13}$ は、各々独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $OR^0$ 、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$R^{14}$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $OR^0$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択される。

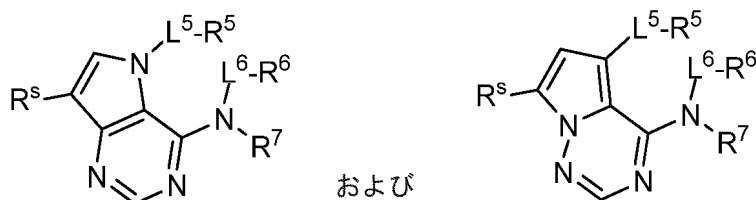
【請求項 17】

$R^s$  - B により表される化合物、またはその薬学的に許容される塩：

ここで、

$R^s$  - B は

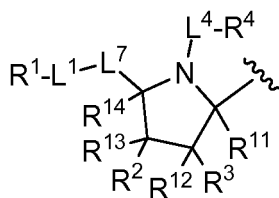
【化 17】



からなる群より選択され；

$R^s$ は、下記式

【化 18】



により表され；

$L^1$ 、 $L^4$ 、 $L^5$ 、および $L^6$ は、各々独立して、結合または $-C(R^0)_2-O-$ であり；

$L^7$ は、結合、O、 $-C(R^0)_2-O-$ 、 $-C(R^0)_2-S-$ 、または $-C(R^0)_2-NH-$ であり；

$R^0$ は、発生毎に独立して、Hまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

$R^1$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アミノアシル、アミノチオニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、 $R^{10}OC(O)-$ 、ホスホリル、およびアミノホスホリルからなる群より選択され；

$R^2$ は、H、ハロゲン化物、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、CN、 $OR^0$ 、 $R^{10}OC(O)-$ 、または $SR^0$ であり；

$R^3$ は、H、ハロゲン化物、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、CN、 $R^{10}OC(O)-$ 、または $SR^0$ であり；

もしくは、 $R^1$ および $R^2$ は一緒になって、または $R^2$ および $R^3$ は一緒になって、 $-OC(O)O-$ 、 $-OC(S)O-$ 、ホスホリル、および $C_1 \sim C_6$ アルキルホスホリルからなる群より選択され；

もしくは、 $R^2$ および $R^3$ は一緒になって、それらが結合する炭素原子の間に結合を形成し；

$R^4$ は、発生毎に独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、ホスホリル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^{10}$ は、発生毎に独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^5$ および $R^6$ は、各々独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、アルキルチオ、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；もしくは $R^5$ は存在しないこともあり；

$R^7$ は $H$ であり；もしくは $R^6$ 、 $R^7$ 、およびそれらが結合する窒素が一緒になって、 $-N=C(R^{20})R^{21}$ を表し；

$R^{20}$ および $R^{21}$ は、各々独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^{11}$ は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $OR^0$ 、および $CN$ からなる群より選択され；

$R^{12}$ は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $CN$ 、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$R^{13}$ は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $OR^0$ 、 $CN$ 、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$R^{14}$ は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $OR^0$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $CN$ 、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択される。

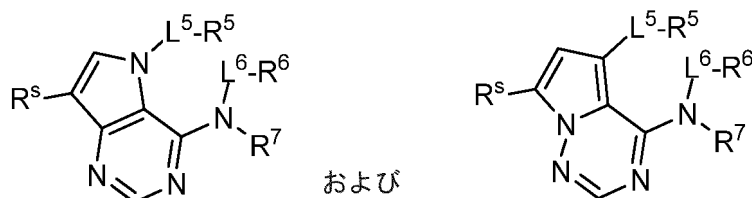
【請求項 18】

$R^s$  - B により表される化合物、またはその薬学的に許容される塩；

ここで、

$R^s$  - B は

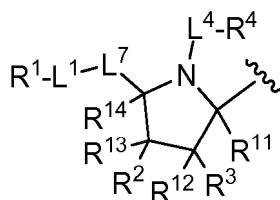
【化 19】



からなる群より選択され；

$R^s$  は、下記式

【化 20】



により表され；

$L^1$ 、 $L^4$ 、 $L^5$ 、および $L^6$ は、各々独立して、結合または $-C(R^0)_2-O-$ であり；

$L^7$ は、結合、 $O$ 、 $-C(R^0)_2-O-$ 、 $-C(R^0)_2-S-$ 、または $-C(R^0)_2-NH-$ であり；

$R^0$ は、発生毎に独立して、 $H$ または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

$R^1$ は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アミノアシル、アミノチオニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、 $R^{10}OC(O)-$ 、ホスホリル、およびアミノホスホリルからなる群より選択され；

$R^2$ は、 $H$ 、ハロゲン化物、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $CN$ 、 $R^{10}OC(O)-$ 、または $SR^0$ であり；

$R^3$ は、 $H$ 、ハロゲン化物、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $CN$ 、 $OR^0$ 、 $R^{10}OC(O)-$ 、または $SR^0$ であり；

もしくは、 $R^1$ および $R^2$ は一緒になって、または $R^2$ および $R^3$ は一緒になって、 $-OC$

(O)O-、-OC(S)O-、ホスホリル、および $C_1 \sim C_6$ アルキルホスホリルからなる群より選択され；

もしくは、 $R^2$ および $R^3$ は一緒になって、それらが結合する炭素原子の間に結合を形成し；

$R^4$ は、発生毎に独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、ホスホリル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^{10}$ は、発生毎に独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^5$ および $R^6$ は、各々独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、アルキルチオ、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；もしくは $R^5$ は存在しないこともあり；

$R^7$ はHであり；もしくは $R^6$ 、 $R^7$ 、およびそれらが結合する窒素が一緒になって、 $-N=C R^{20} R^{21}$ を表し；

$R^{20}$ および $R^{21}$ は、各々独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^{11}$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $OR^0$ 、およびCNからなる群より選択され；

$R^{12}$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $OR^0$ 、アルキニル、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$R^{13}$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$R^{14}$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $OR^0$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択される。

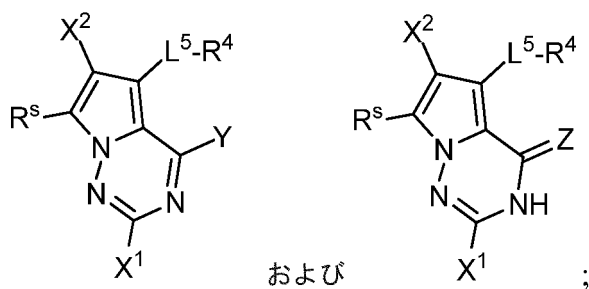
#### 【請求項 19】

$R^s$ -Bにより表される化合物、またはその薬学的に許容される塩；

ここで、

$R^s$ -Bは

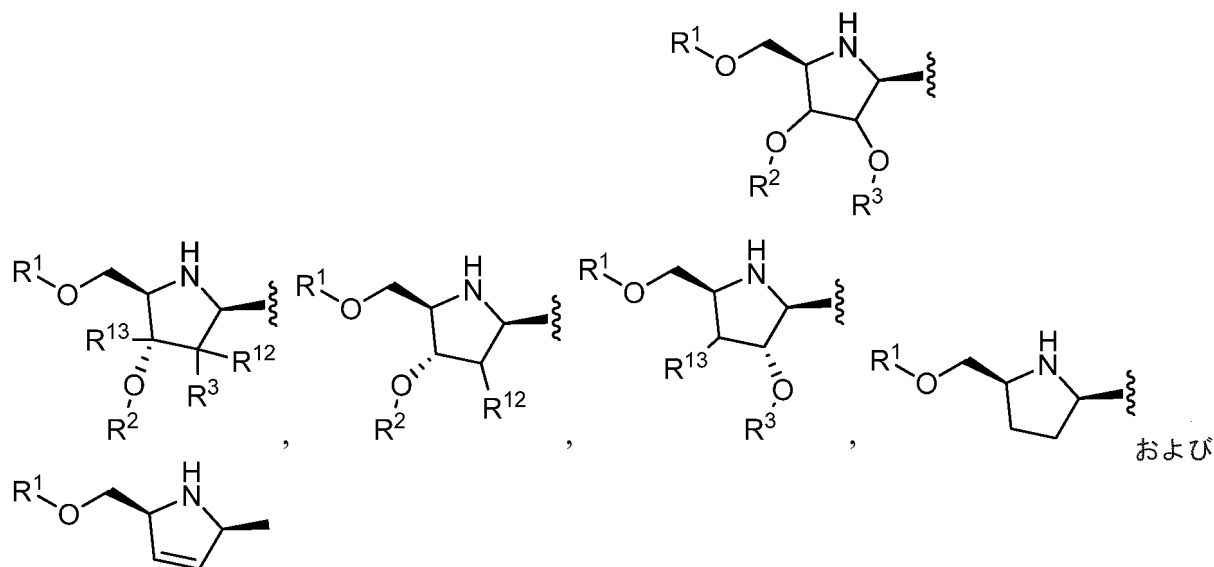
#### 【化 21】



からなる群より選択され；

$R^s$ は

## 【化 2 2】



からなる群より選択され；

$R^1$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アミノアシル、アミノチオニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、 $R^{10}OC(O)-$ 、ホスホリル、およびアミノホスホリルからなる群より選択され；

$R^2$ および $R^3$ は、各々独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、または $C_1 \sim C_6$ アルキニルであり；

$R^{10}$ は、発生毎に独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^{12}$ および $R^{13}$ は、各々独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $OR^0$ 、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$L^5$ は、結合または $-C(R^0)_2-O-$ であり；

$R^0$ は、発生毎に独立して、Hまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

$R^4$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、またはカルボキシルからなる群より選択され；もしくは $R^4$ は存在しないこともあり；

$X^1$ は、H、 $N(R^0)_2$ 、SH、チオアルキル、 $OR^0$ 、アルケニル、アルキニル、CN、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$X^2$ は、H、 $N(R^0)_2$ 、SH、チオアルキル、 $OR^0$ 、O-アリール、O-ヘテロアリール、アルケニル、アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、カルボキシル、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

Yは、H、 $OR^0$ 、 $N(R^5)(R^6)$ 、SH、チオアルキル、O-アリール、O-ヘテロアリール、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

Zは、OおよびSからなる群より選択され；

$R^5$ および $R^6$ は、各々独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、アルキルチオ、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；もしくは

$R^5$ 、 $R^6$ 、およびそれらが結合する窒素が一緒になって、 $-N=C(R^{20})R^{21}$ を表し；

$R^{20}$ および $R^{21}$ は、各々独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、およびヘテロアラルキルからなる群より選択される。

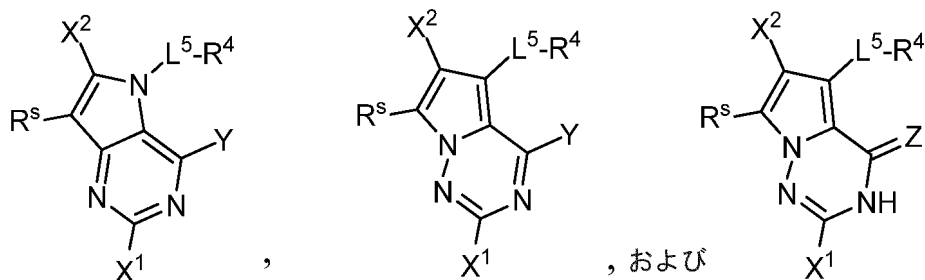
## 【請求項 20】

$R^s-B$ により表される化合物、またはその薬学的に許容される塩；

ここで、

$R^s-B$ は

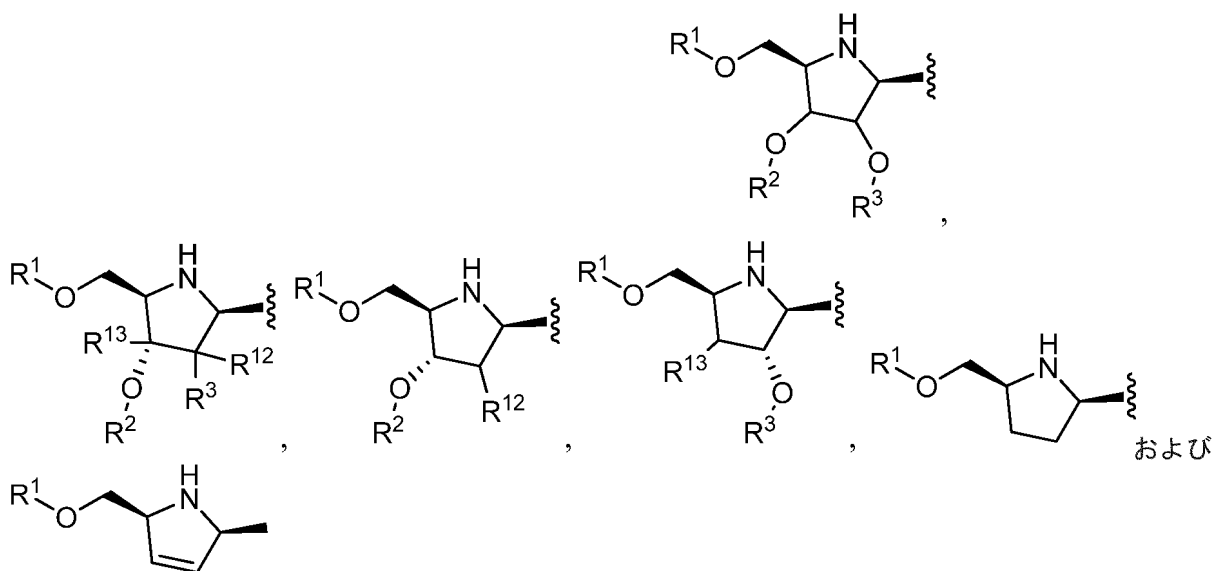
## 【化 2 3】



からなる群より選択され；

$R^s$  は

## 【化 2 4】



からなる群より選択され；

$R^1$  は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アミノアシル、アミノチオニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、 $R^{10}OC(O)-$ 、ホスホリル、およびアミノホスホリルからなる群より選択され；

$R^2$  および  $R^3$  は、各々独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、または  $C_1 \sim C_6$ アルキニルであり；

$R^{10}$  は、発生毎に独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラールキル、およびヘテロアラールキルからなる群より選択され；

$R^{12}$  および  $R^{13}$  は、各々独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $OR^0$ 、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$L^5$  は、結合または  $-C(R^0)_2-O-$  であり；

$R^0$  は、発生毎に独立して、Hまたは  $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

$R^4$  は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アラールキル、ヘテロアラールキル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、またはカルボキシルからなる群より選択され；もしくは  $R^4$  は存在しないこともあり；

$X^1$  は、H、 $N(R^0)_2$ 、SH、チオアルキル、 $OR^0$ 、アルケニル、アルキニル、CN、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$X^2$  は、H、 $N(R^0)_2$ 、SH、チオアルキル、 $OR^0$ 、O-アリール、O-ヘテロアリール、アルケニル、アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、カルボキシル、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

Y は、H、 $OR^0$ 、 $N(R^5)(R^6)$ 、SH、チオアルキル、O-アリール、O-ヘテロアリール、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

Z は、OおよびSからなる群より選択され；

$R^5$  および  $R^6$  が両方とも H ではないという条件で、 $R^5$  および  $R^6$  は、各々独立して、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_3 \sim C_8$  シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルケニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキニル、 $C_1 \sim C_6$  アシル、アルキルチオ、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキルからなる群より選択される。

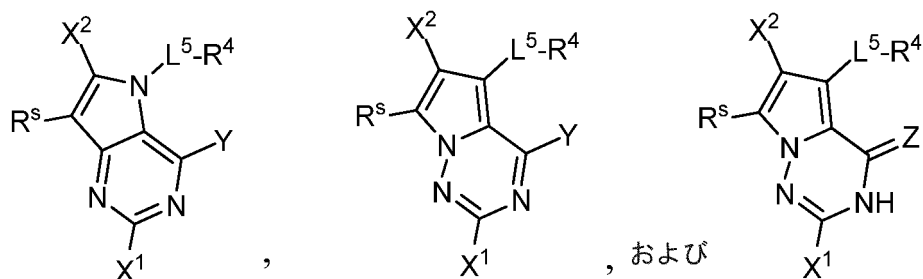
【請求項 21】

$R^s$  - B により表される化合物、またはその薬学的に許容される塩：

ここで、

$R^s$  - B は

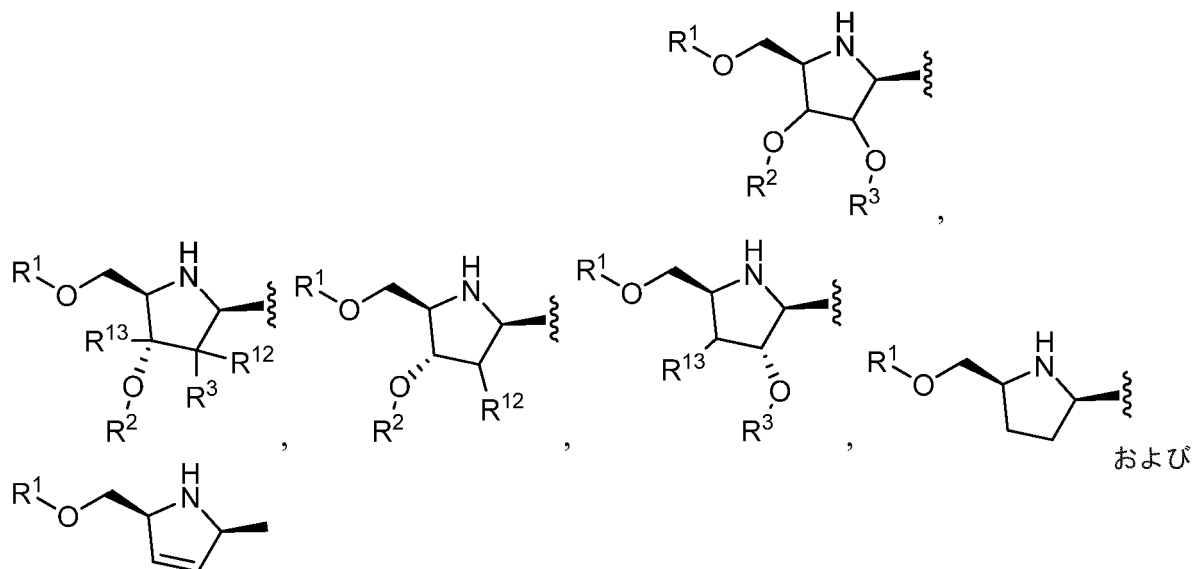
【化 25】



からなる群より選択され；

$R^s$  は

【化 26】



からなる群より選択され；

$R^1$  は、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、アミノアシル、アミノチオニル、 $C_1 \sim C_6$  アシル、 $R^{10} O C(O) -$ 、ホスホリル、およびアミノホスホリルからなる群より選択され；

$R^{10}$  は、発生毎に独立して、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^2$  および  $R^3$  は、各々独立して、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルケニル、または  $C_1 \sim C_6$  アルキニルであり；

$R^{12}$  および  $R^{13}$  は、各々独立して、H、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルケニル、 $C_1 \sim C_6$  アルキニル、 $OR^0$ 、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$R^0$  は、発生毎に独立して、H または  $C_1 \sim C_6$  アルキルであり；

$L^5$  は、結合または  $-C(R^0)_2-O-$  であり；

$R^4$  は、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキル、 $C_1 \sim C_6$  アシル、またはカルボキシルからなる群より選択され；もしくは  $R^4$  は存在しないこともあり；

$X^1$  は、H、 $N(R^0)_2$ 、SH、チオアルキル、 $OR^0$ 、アルケニル、アルキニル、CN



、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$X^2$ は、 $N(R^0)_2$ 、SH、チオアルキル、 $OR^0$ 、O - アリール、O - ヘテロアリール、アルケニル、アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、カルボキシル、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

Yは、H、 $OR^0$ 、 $N(R^5)(R^6)$ 、SH、チオアルキル、O - アリール、O - ヘテロアリール、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

Zは、OおよびSからなる群より選択され；

$R^5$ および $R^6$ は、各々独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、アルキルチオ、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；もしくは $R^5$ 、 $R^6$ 、およびそれらが結合する窒素が一緒になって、 $-N = CR^{20}R^{21}$ を表し；

$R^{20}$ および $R^{21}$ は、各々独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アミノ、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、およびヘテロアラルキルからなる群より選択される。

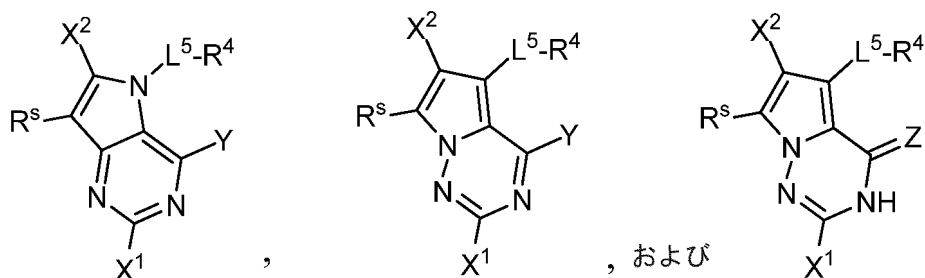
【請求項 2 2】

$R^s - B$ により表される化合物、またはその薬学的に許容される塩；

ここで、

$R^s - B$ は

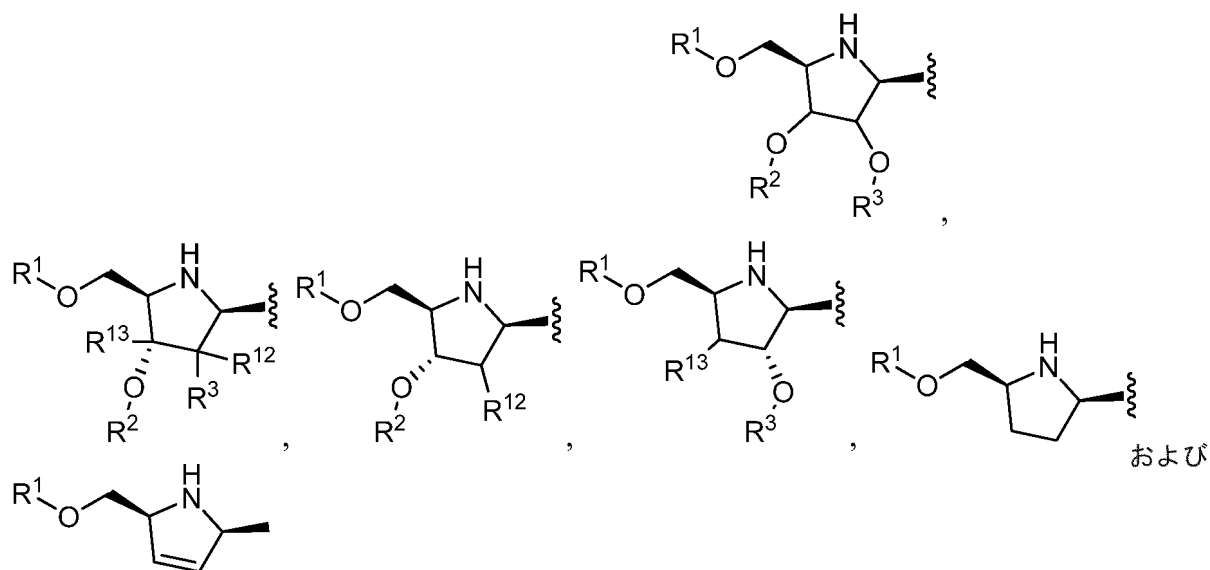
【化 2 7】



からなる群より選択され；

$R^s$ は

【化 2 8】



からなる群より選択され；

$R^1$ は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アミノアシル、アミノチオニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、 $R^1$   $^0O C(O) -$ 、ホスホリル、およびアミノホスホリルからなる群より選択され；

$R^2$ および $R^3$ は、各々独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、または $C_1 \sim C_6$ アルキニルであり；

$R^{10}$ は、発生毎に独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラ  
ルキル、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；

$R^{12}$ および $R^{13}$ は、各々独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1$   
 $\sim C_6$ アルキニル、 $OR^0$ 、 $CN$ 、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$R^0$ は、発生毎に独立して、 $H$ または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

$L^5$ は、結合または $-C(R^0)_2-O-$ であり；

$R^4$ は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、ア  
ラルキル、ヘテロアラルキル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、またはカルボキシルからなる群より選択  
され；もしくは $R^4$ は存在しないこともあり；

$X^1$ は、 $N(R^0)_2$ 、 $SH$ 、チオアルキル、 $OR^0$ 、アルケニル、アルキニル、 $CN$ 、お  
よびハロゲン化物からなる群より選択され；

$X^2$ は、 $H$ 、 $N(R^0)_2$ 、 $SH$ 、チオアルキル、 $OR^0$ 、 $O$ -アリール、 $O$ -ヘテロアリ  
ール、アルケニル、アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、カルボキシル、 $CN$ 、アジド、および  
ハロゲン化物からなる群より選択され；

$Y$ は、 $H$ 、 $OR^0$ 、 $N(R^5)(R^6)$ 、 $SH$ 、チオアルキル、 $O$ -アリール、 $O$ -ヘテ  
ロアリール、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

$Z$ は、 $O$ および $S$ からなる群より選択され；

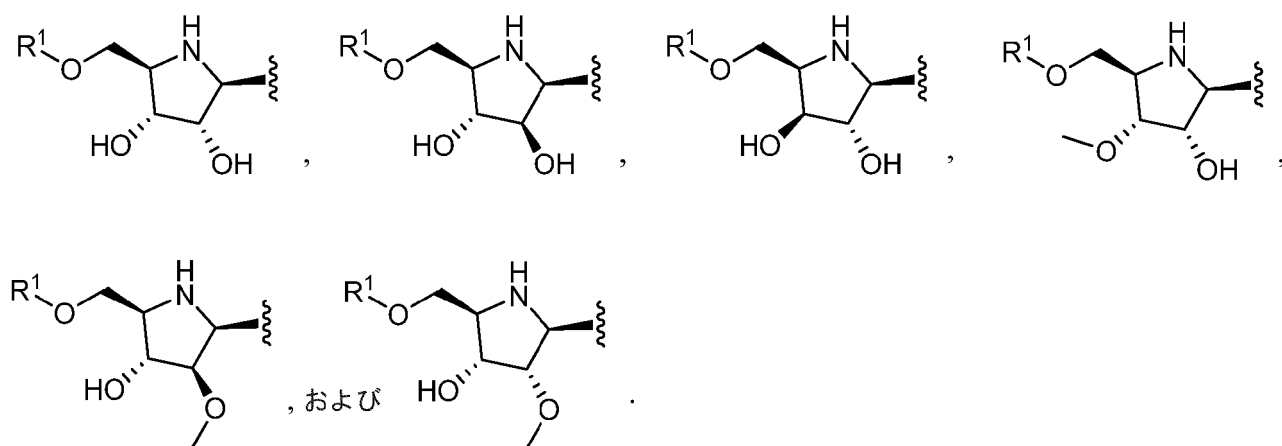
$R^5$ および $R^6$ は、各々独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $C$   
 $_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アシル、アルキルチオ、アリール、ア  
ラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアラルキルからなる群より選択され；もしくは  
 $R^5$ 、 $R^6$ 、およびそれらが結合する窒素が一緒になって、 $-N=CR^{20}R^{21}$ を表し；

$R^{20}$ および $R^{21}$ は、各々独立して、 $H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アミノ、アリール、ヘテロ  
アリール、アラルキル、およびヘテロアラルキルからなる群より選択される。

【請求項 23】

$R^s$ が

【化 29】

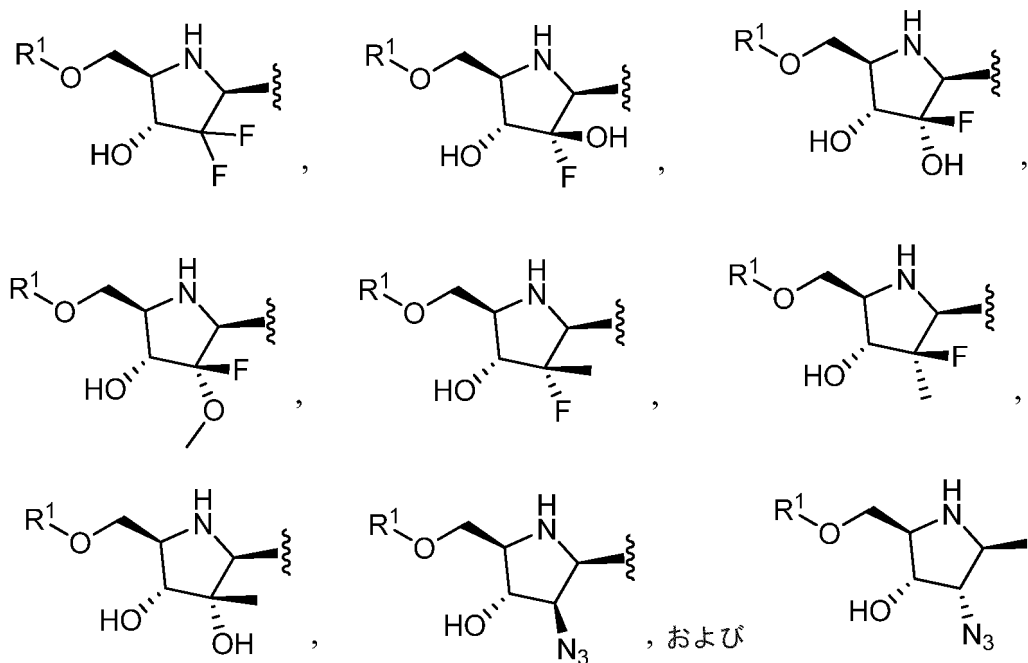


からなる群より選択される、請求項 15 から 22 いずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 24】

$R^s$ が

## 【化 3 0】

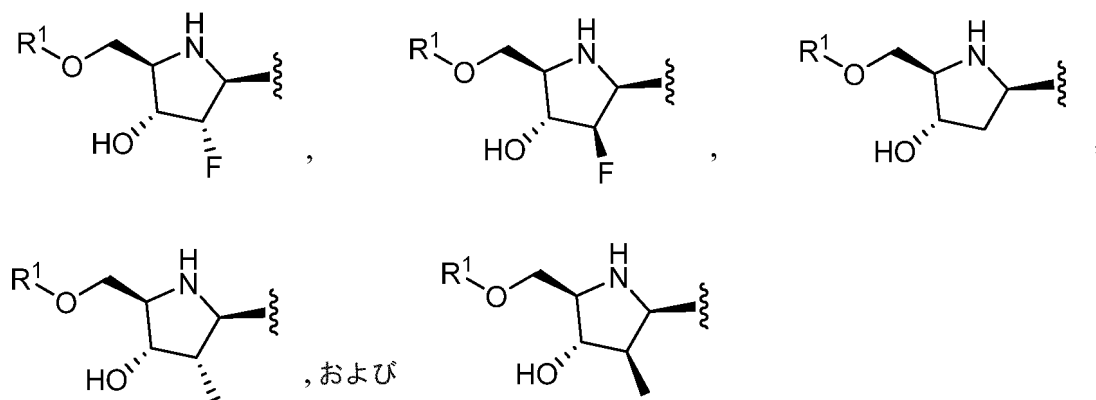


からなる群より選択される、請求項 1 5 から 2 2 いずれか 1 項記載の化合物。

## 【請求項 2 5】

R<sup>s</sup> が

## 【化 3 1】

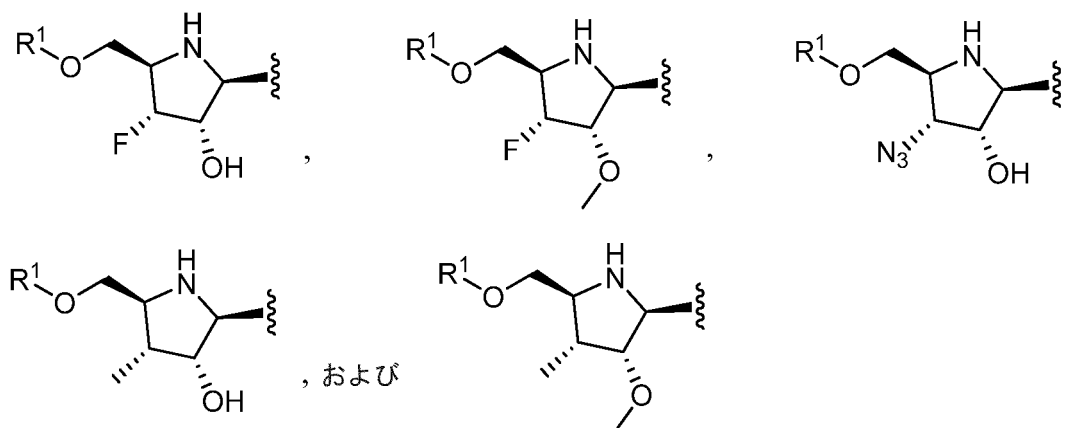


からなる群より選択される、請求項 1 5 から 2 2 いずれか 1 項記載の化合物。

## 【請求項 2 6】

R<sup>s</sup> が

## 【化 3 2】

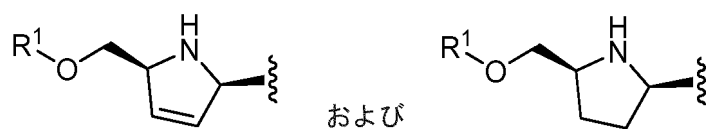


からなる群より選択される、請求項 1 5 から 2 2 いずれか 1 項記載の化合物。

## 【請求項 2 7】

$R^5$  が

## 【化 3 3】



からなる群より選択される、請求項 1 5 から 2 2 いずれか 1 項記載の化合物。

## 【請求項 2 8】

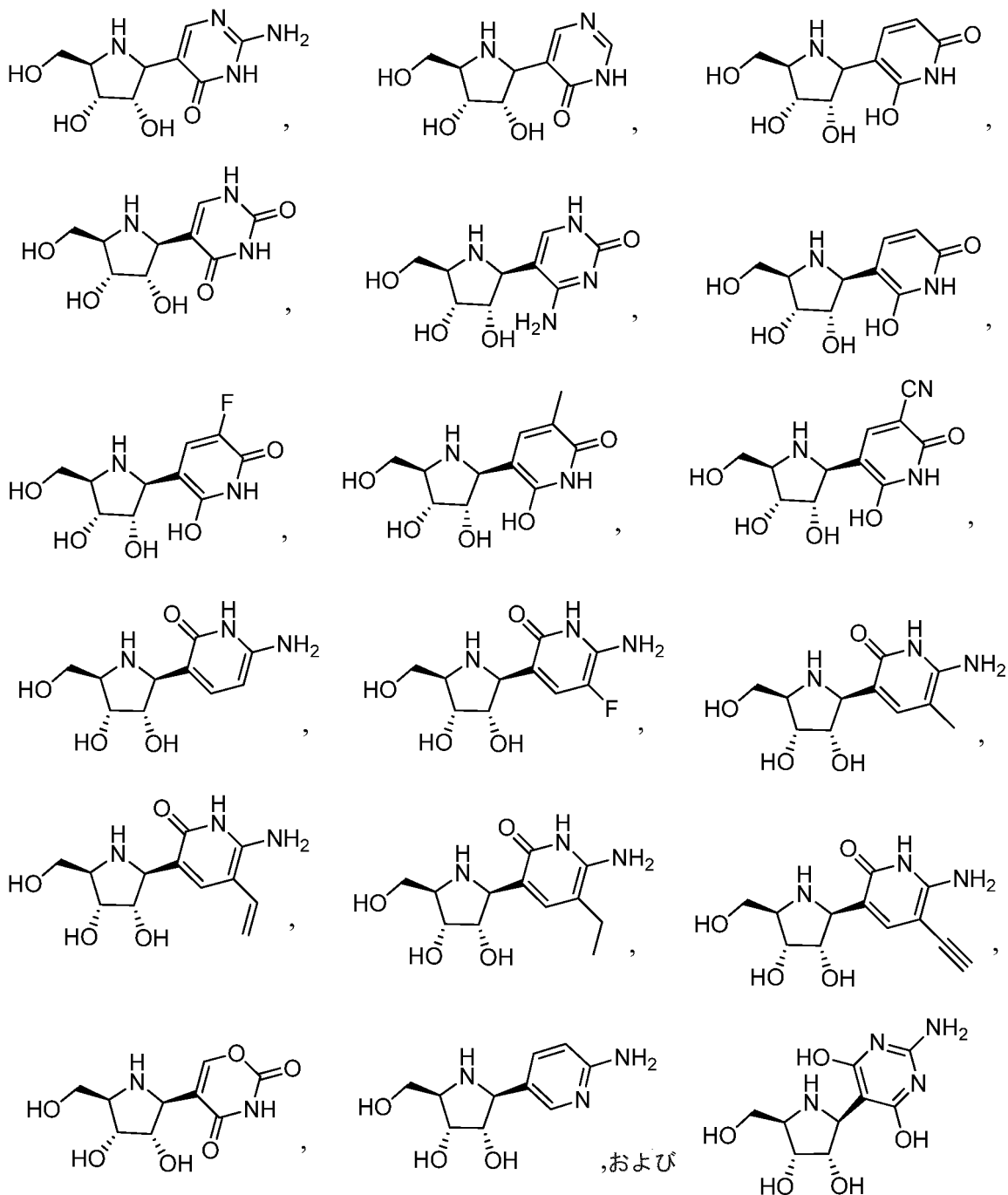
$L^5 - R^5$  が H である、請求項 1 5 から 1 8 いずれか 1 項記載の化合物。

## 【請求項 2 9】

$L^4 - R^4$  が H である、請求項 1 5 から 1 8 いずれか 1 項記載の化合物。

## 【請求項 3 0】

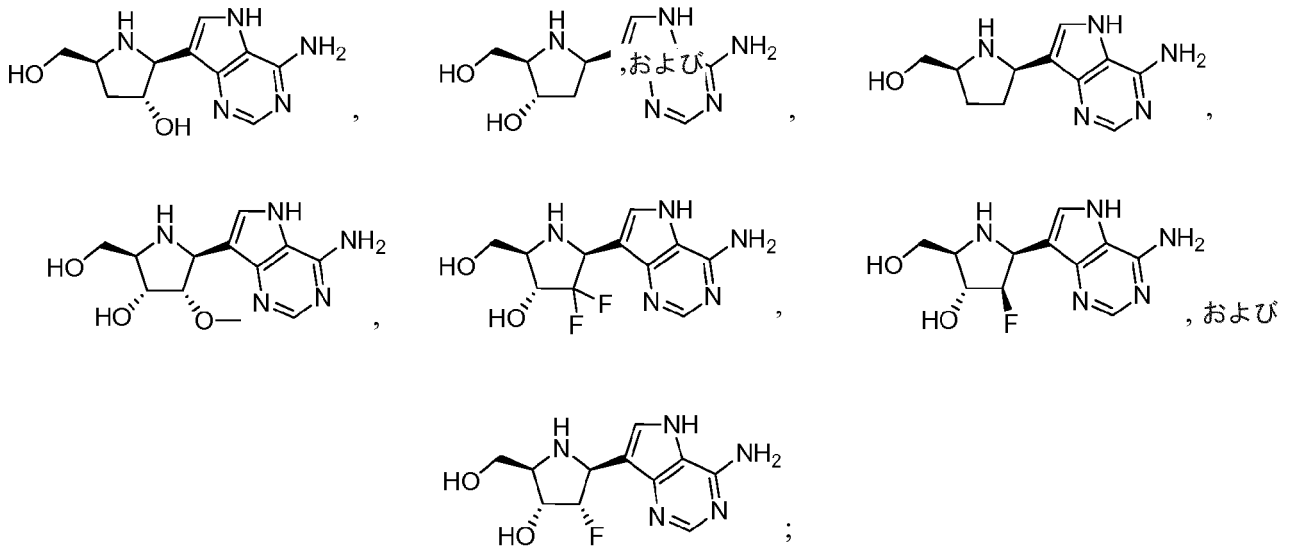
## 【化 3 4】



からなる群より選択される化合物、およびその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 3 1】

## 【化 3 5】



からなる群より選択される化合物、およびその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 3 2】

請求項 1 から 3 1 いずれか 1 項記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、および薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

## 【請求項 3 3】

請求項 1 から 3 1 いずれか 1 項記載の化合物を含む、ウイルス感染を治療するための医薬組成物。

## 【請求項 3 4】

前記ウイルスが、RNA ウイルスからなる群より選択される、請求項 3 3 記載の組成物。

## 【請求項 3 5】

前記ウイルスが、オルソミクソウイルス科、パラミクソウイルス科、アレナウイルス科、ブニヤウイルス科、フラビウイルス科、フィロウイルス科、トガウイルス科、ピコルナウイルス科、およびコロナウイルス科からなる群より選択される、請求項 3 4 記載の組成物。

## 【請求項 3 6】

前記ウイルスが、アデノウイルス、ライノウイルス、A 型肝炎ウイルス、C 型肝炎ウイルス、ポリオウイルス、麻疹ウイルス、エボラウイルス、コクサッキーウイルス、ウエストナイルウイルス、天然痘ウイルス、黄熱病ウイルス、デング熱ウイルス、A 型インフルエンザウイルス、B 型インフルエンザウイルス、ラッサ熱ウイルス、リンパ球性脈絡髄膜炎ウイルス、フニンウイルス、マチュポウイルス、グアナリトウイルス、ハンタウイルス、リフトバレー熱ウイルス、ラ・クロスウイルス、カリフォルニア脳炎ウイルス、クリミア・コンゴウイルス、マールブルグ・ウイルス、日本脳炎ウイルス、キャサヌール森林病ウイルス、ベネズエラウマ脳炎ウイルス、東部ウマ脳炎ウイルス、西部ウマ脳炎ウイルス、重症急性呼吸器症候群 (SARS) ウイルス、パラインフルエンザウイルス、呼吸器合胞体ウイルス、プンタトロウイルス、タカリベウイルス、およびピキンデウイルスからなる群より選択される、請求項 3 3 記載の組成物。

## 【請求項 3 7】

前記ウイルスが、アデノウイルス、デング熱ウイルス、マールブルグ・ウイルス、A 型インフルエンザウイルス、B 型インフルエンザウイルス、フニンウイルス、麻疹ウイルス、パラインフルエンザウイルス、ピキンデウイルス、プンタトロウイルス、呼吸器合胞体ウイルス、ライノウイルス、リフトバレー熱ウイルス、SARS ウイルス、タカリベウイルス、ベネズエラウマ脳炎ウイルス、ウエストナイルウイルス、および黄熱病ウイルスからなる群より選択される、請求項 3 6 記載の組成物。

**【請求項 38】**

前記ウイルスが、エボラウイルス、黄熱病ウイルス、マールブルグ・ウイルス、A型インフルエンザウイルス、およびB型インフルエンザウイルスからなる群より選択される、請求項37記載の組成物。