

【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 07 D 401/04 | (2006.01) |
| C 07 D 403/04 | (2006.01) |
| C 07 D 413/04 | (2006.01) |
| C 07 D 487/04 | (2006.01) |
| A 61 K 31/4439 | (2006.01) |
| A 61 K 31/513 | (2006.01) |
| A 61 K 31/5355 | (2006.01) |
| A 61 K 31/506 | (2006.01) |
| A 61 K 31/519 | (2006.01) |
| A 61 P 31/12 | (2006.01) |
| A 61 P 31/14 | (2006.01) |
| A 61 P 31/16 | (2006.01) |
| A 61 P 1/16 | (2006.01) |
| A 61 P 43/00 | (2006.01) |

【F I】

| | |
|----------------|-------|
| C 07 D 401/04 | C S P |
| C 07 D 403/04 | |
| C 07 D 413/04 | |
| C 07 D 487/04 | 1 4 0 |
| A 61 K 31/4439 | |
| A 61 K 31/513 | |
| A 61 K 31/5355 | |
| A 61 K 31/506 | |
| A 61 K 31/519 | |
| A 61 P 31/12 | |
| A 61 P 31/14 | |
| A 61 P 31/16 | |
| A 61 P 1/16 | |
| A 61 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

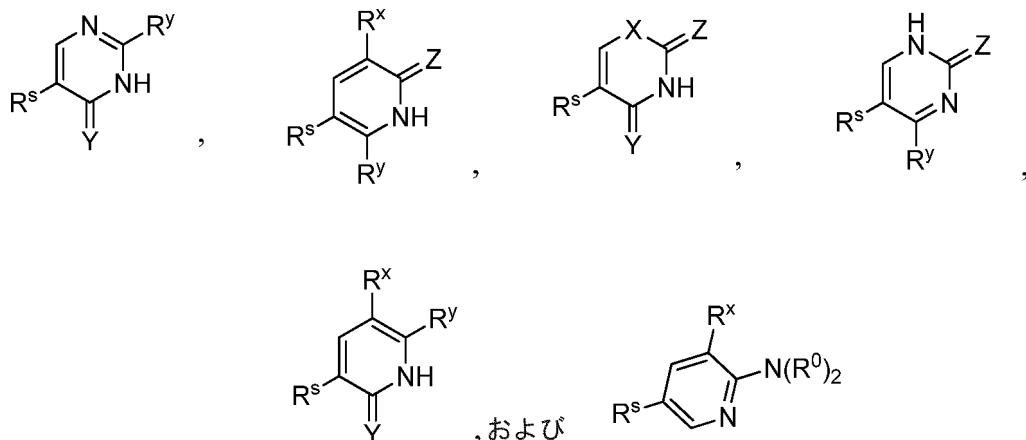
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

R^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】



からなる群より選択され、

X は、O、S、および $N R^{10}$ 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、 $O R^0$ 、 $C_1 \sim C_6$ 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；

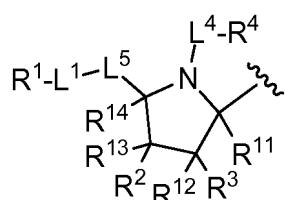
R^y は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $O R^0$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、CN、 $N(R^0)_2$ 、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

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 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、 $R^1 O C(O)-$ 、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^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。

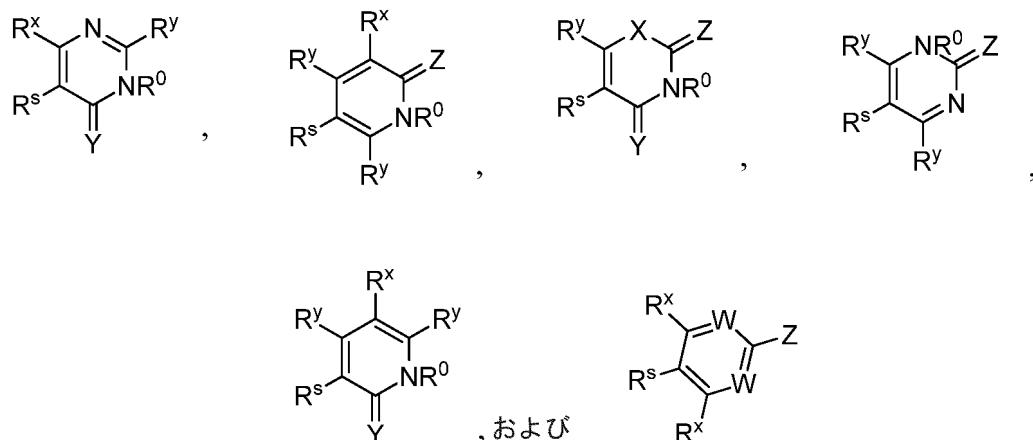
【請求項 2】

$R^s - B$ 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NR¹⁰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(R⁰)₂、NO₂、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；

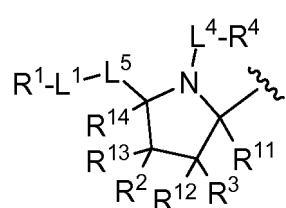
R^y は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 OR^0 、 $C_1 \sim C_6$ アルケニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキニル、CN、N(R⁰)₂、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

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 $-C(R^0)_2-$

N H - であり；

R¹は、H、C₁～C₆アルキル、アミノアシル、アミノチオニル、C₁～C₆アシル、R¹⁰O 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；

R²およびR³は、各々独立して、H、ハロゲン化物、アジド、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルケニル、C₁～C₆アルキニル、CN、OR⁰、R¹⁰O C(O) - 、またはSR⁰であり；

もしくは、R¹およびR²は一緒になって、またはR²およびR³は一緒になって、-OC(O)O-、-OC(S)O-、ホスホリル、およびC₁～C₆アルキルホスホリルからなる群より選択され；

もしくは、R²およびR³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；

R⁴は、発生毎に独立して、H、C₁～C₆アルキル、C₃～C₈シクロアルキル、C₁～C₆アルケニル、C₁～C₆アルキニル、C₁～C₆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；

R¹¹は、H、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルケニル、C₁～C₆アルキニル、OR⁰、およびCNからなる群より選択され；

R¹²およびR¹³は、各々独立して、H、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルケニル、C₁～C₆アルキニル、OR⁰、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

R¹⁴は、H、C₁～C₆アルキル、OR⁰、C₁～C₆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。

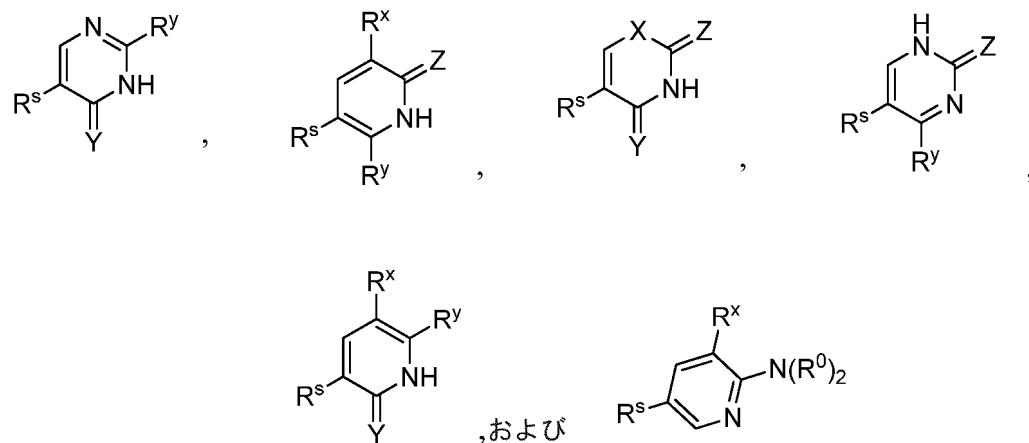
【請求項 3】

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NR¹⁰からなる群より選択され；

R¹⁰は、発生毎に独立して、H、C₁～C₆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、C₁～C₆アルキル、OR⁰、C₁～C₆アルケニル、C₁～C₆アルキニル、CN、N(R⁰)₂、NO₂、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；

R⁰は、発生毎に独立して、HまたはC₁～C₆アルキルであり；

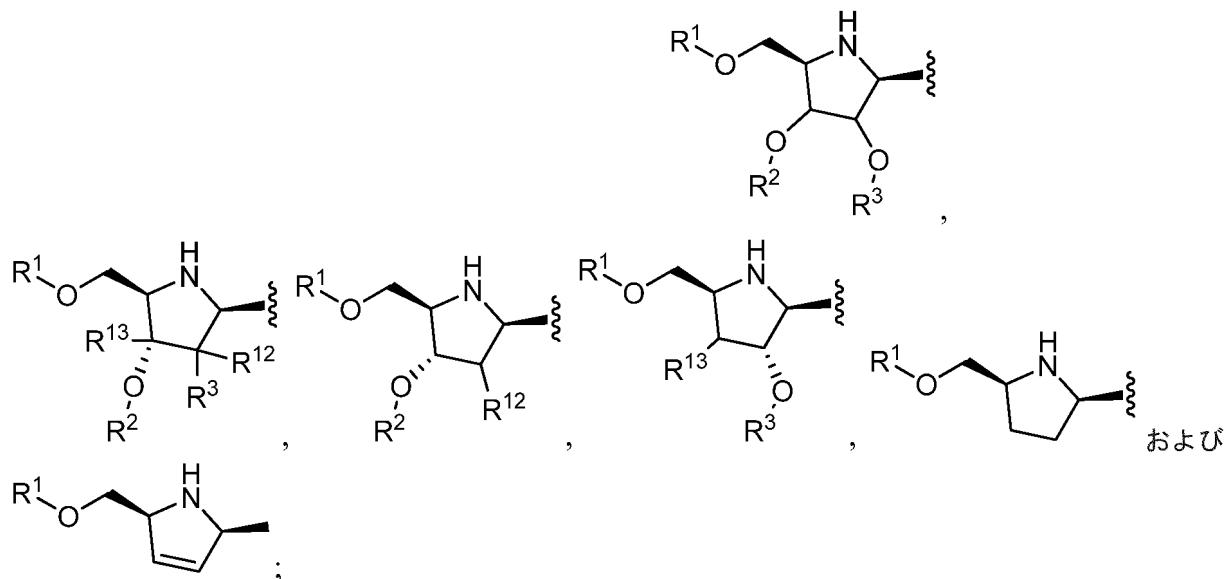
R^yは、H、C₁～C₆アルキル、OR⁰、C₁～C₆アルケニル、C₁～C₆アルキニル、CN、N(R⁰)₂、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

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

【化 6】



からなる群より選択され；

R¹ は、H、C₁～C₆アルキル、アミノアシル、アミノチオニル、C₁～C₆アシル、R¹OOC(=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；

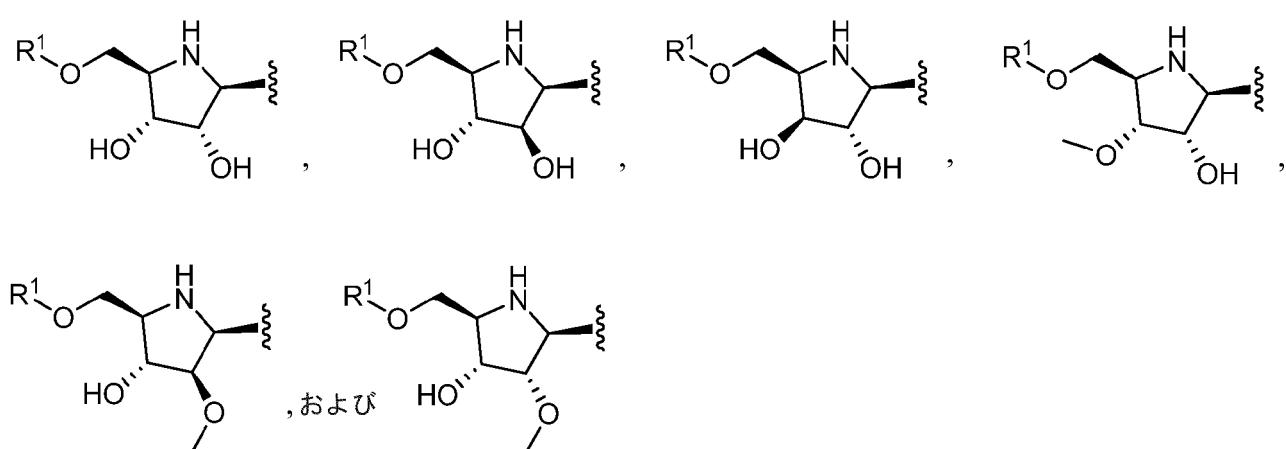
R² および R³ は、各々独立して、H、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルケニル、またはC₁～C₆アルキニルであり；

R¹² および R¹³ は、各々独立して、H、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルケニル、C₁～C₆アルキニル、OR⁰、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^s が

【化 7】

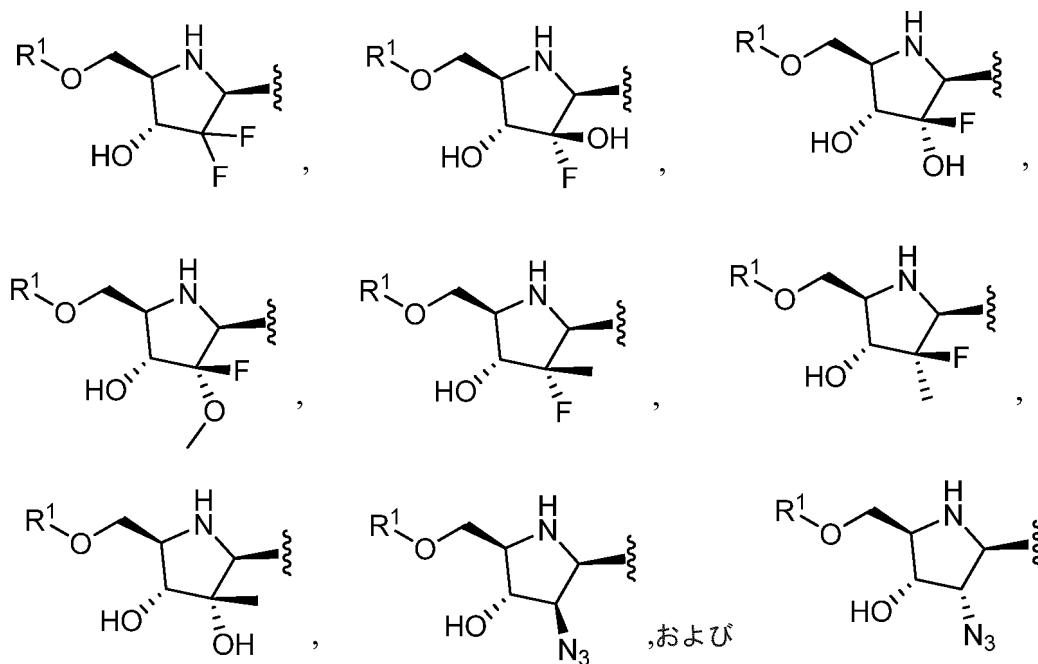


からなる群より選択される、請求項 1 から 3 いずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 5】

R^s が

【化 8】

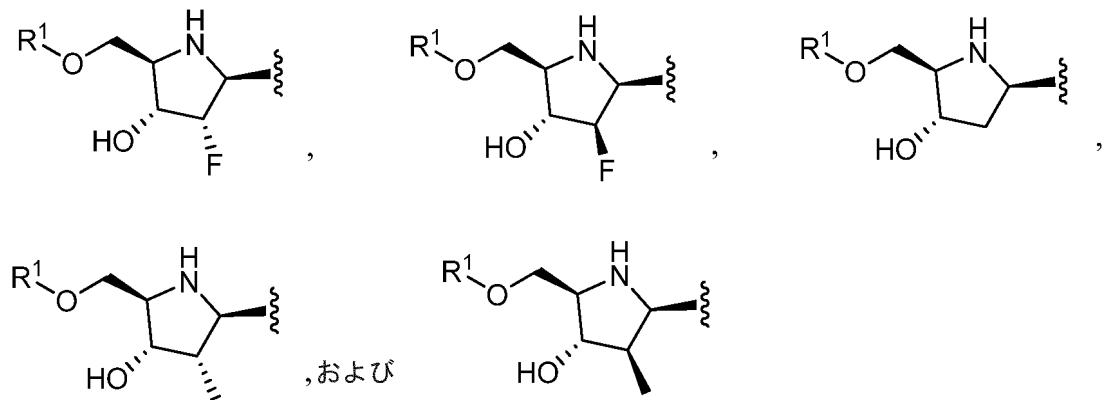


からなる群より選択される、請求項 1 から 3 いずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 6】

 R^s が

【化 9】

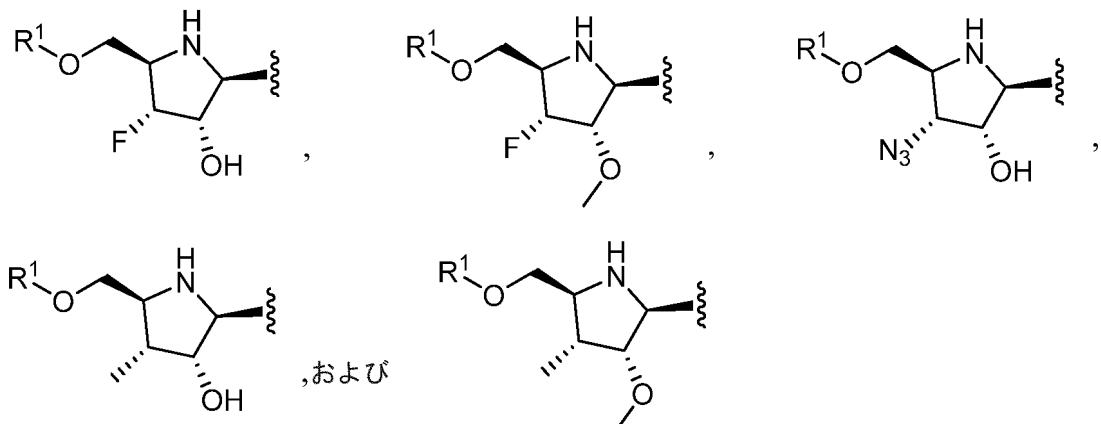


からなる群より選択される、請求項 1 から 3 いずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 7】

 R^s が

【化10】



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11】



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。

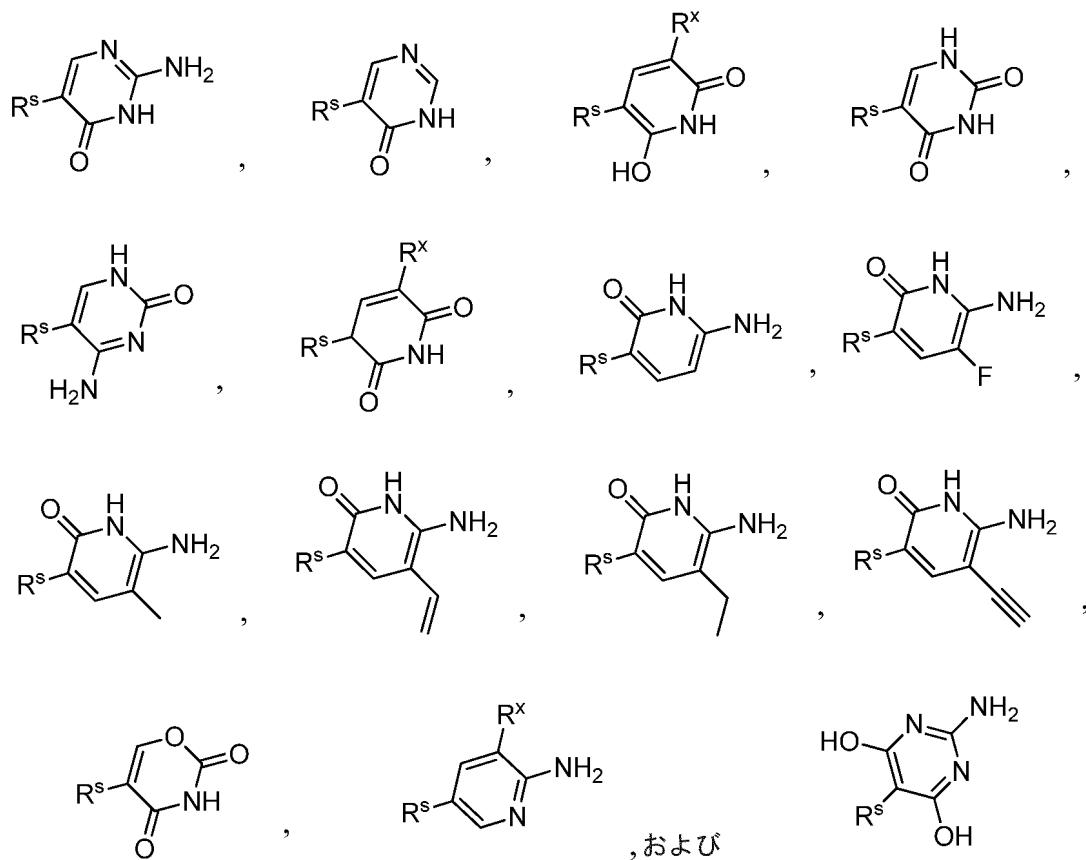
【請求項9】

 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12】



からなる群より選択され；

R^xが、H、C₁～C₆アルキル、OR⁰、C₁～C₆アルケニル、C₁～C₆アルキニル、CN、NH₂、アミノアルキル、NO₂、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11】

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12】

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13】

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14】

R^xがCN、NH₂、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。

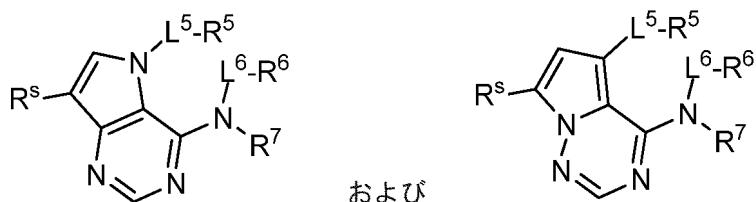
【請求項15】

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

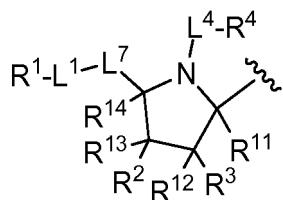
【化13】



からなる群より選択され；

R^sは、下記式

【化14】



により表され；

L¹は結合であり；L⁴、L⁵、およびL⁶は、各々独立して、結合または-C(R⁰)₂-O-であり；L⁷は、O、-CH₂-、-CH(C₁~C₆アルキル)-、-C(R⁰)₂-S-、または-C(R⁰)₂-NH-であり；R⁰は、発生毎に独立して、HまたはC₁~C₆アルキルであり；R¹は、H、C₁~C₆アルキル、アミノアシル、アミノチオニル、C₁~C₆アシル、R¹OOC(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；R²およびR³は、各々独立して、H、ハロゲン化物、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルケニル、C₁~C₆アルキニル、CN、OR⁰、R¹⁰OOC(O)-、またはSR⁰であり；もしくは、R¹およびR²は一緒になって、またはR²およびR³は一緒になって、-OC(O)O-、-OC(S)O-、ホスホリル、およびC₁~C₆アルキルホスホリルからなる群より選択され；もしくは、R²およびR³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；R⁴は、発生毎に独立して、H、C₁~C₆アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₁~C₆アルケニル、C₁~C₆アルキニル、C₁~C₆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；R¹⁰は、発生毎に独立して、H、C₁~C₆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；R⁵およびR⁶は、各々独立して、H、C₁~C₆アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、アラルキル、アラルキニル、C₁~C₆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R⁵は存在しないこともあります；R⁷はHであり；もしくはR⁶、R⁷、およびそれらが結合する窒素が一緒になって、-N=CR²⁰R²¹を表し；R²⁰およびR²¹は、各々独立して、H、C₁~C₆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；R¹¹は、H、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルケニル、C₁~C₆アルキニル、OR⁰、CN、およびハロゲン化物からなる群より選択され；R¹²およびR¹³は、各々独立して、H、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルケニル、C₁

~ C₆アルキニル、OR⁰、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択され；R¹⁴は、H、C₁~C₆アルキル、OR⁰、C₁~C₆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。

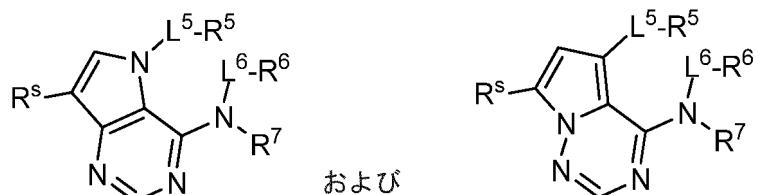
【請求項 1 6】

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

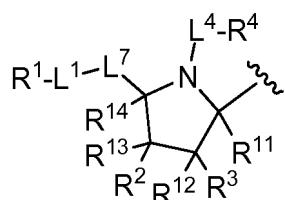
【化 1 5】



からなる群より選択され；

R^sは、下記式

【化 1 6】



により表され；

L¹、L⁴、L⁵、およびL⁶は、各々独立して、結合または-C(R⁰)₂-O-であり；

L⁷は、結合、O、-C(R⁰)₂-O-、-C(R⁰)₂-S-、または-C(R⁰)₂-NH-であり；

R⁰は、発生毎に独立して、HまたはC₁~C₆アルキルであり；

R¹は、H、C₁~C₆アルキル、アミノアシル、アミノチオニル、C₁~C₆アシル、R¹OC(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；

R²およびR³は、各々独立して、H、ハロゲン化物、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルケニル、C₁~C₆アルキニル、CN、OR⁰、R¹⁰OC(O)-、またはSR⁰であり；

もしくは、R¹およびR²は一緒になって、またはR²およびR³は一緒になって、-OC(O)O-、-OC(S)O-、ホスホリル、およびC₁~C₆アルキルホスホリルからなる群より選択され；

もしくは、R²およびR³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；

R⁴は、発生毎に独立して、H、C₁~C₆アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₁~C₆アルケニル、C₁~C₆アルキニル、C₁~C₆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；

R¹⁰は、発生毎に独立して、H、C₁~C₆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；

R⁵およびR⁶は、各々独立して、H、C₁~C₆アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、C₁~C₆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R⁵は存在しないこともあります；

R⁷はHであり；もしくはR⁶、R⁷、およびそれらが結合する窒素が一緒になって、-N=CR²⁰R²¹を表し；

R²⁰およびR²¹は、各々独立して、H、C₁~C₆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。

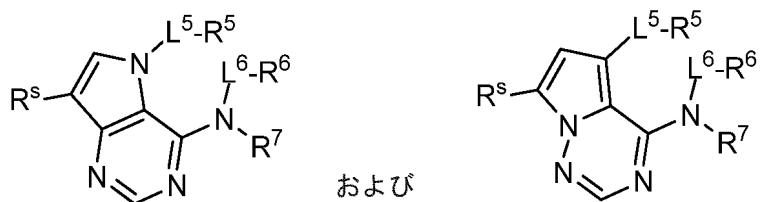
【請求項 17】

$R^s - B$ 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

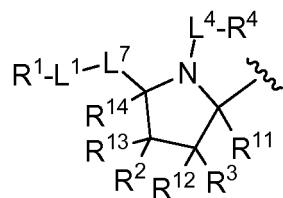
【化17】



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、 $R^1OOC(O)-$ 、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 、 $R^{10}OOC(O)-$ 、またはSR⁰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、 $R^{10}OOC(O)-$ 、またはSR⁰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、 $-OOC(O)O-$ 、 $-OOC(S)O-$ 、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、C₁～C₆アルキル、C₃～C₈シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、C₁～C₆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ます；

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 R²⁰ R²¹ を表す；

R^{20} および R^{21} は、各々独立して、H、C₁～C₆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、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルケニル、C₁～C₆アルキニル、OR⁰、およびCN からなる群より選択され；

R^{12} は、H、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルケニル、C₁～C₆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、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルケニル、C₁～C₆アルキニル、OR⁰、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、C₁～C₆アルキル、OR⁰、C₁～C₆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。

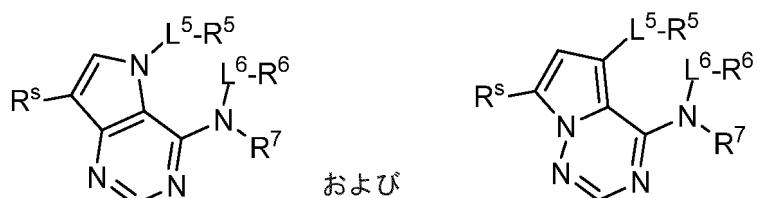
【請求項 18】

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

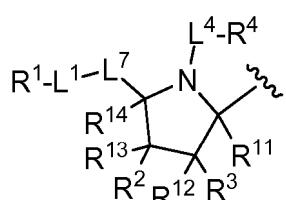
【化 19】



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(R⁰)₂-O- であり；

L^7 は、結合、O、-C(R⁰)₂-O-、-C(R⁰)₂-S-、または-C(R⁰)₂-NH- であり；

R^0 は、発生毎に独立して、H または C₁～C₆アルキルであり；

R^1 は、H、C₁～C₆アルキル、アミノアシル、アミノチオニル、C₁～C₆アシル、R¹OC(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、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルケニル、C₁～C₆アルキニル、CN、R¹⁰OC(O)-、またはSR⁰ であり；

R^3 は、H、ハロゲン化物、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルケニル、C₁～C₆アルキニル、CN、OR⁰、R¹⁰OC(O)-、またはSR⁰ 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C₁~C₆アルキルホスホリルからなる群より選択され；

もしくは、R²およびR³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；

R⁴は、発生毎に独立して、H、C₁~C₆アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₁~C₆アルケニル、C₁~C₆アルキニル、C₁~C₆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；

R¹⁰は、発生毎に独立して、H、C₁~C₆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；

R⁵およびR⁶は、各々独立して、H、C₁~C₆アルキル、C₃~C₈シクロアルキル、C₁~C₆アルケニル、C₁~C₆アルキニル、C₁~C₆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R⁵は存在しないこともあり；

R⁷はHであり；もしくはR⁶、R⁷、およびそれらが結合する窒素が一緒になって、-N=C R²⁰ R²¹を表し；

R²⁰およびR²¹は、各々独立して、H、C₁~C₆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；

R¹¹は、H、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルケニル、C₁~C₆アルキニル、OR⁰、およびCNからなる群より選択され；

R¹²は、C₁~C₆アルキル、OR⁰、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；

R¹³は、H、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルケニル、C₁~C₆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；

R¹⁴は、H、C₁~C₆アルキル、OR⁰、C₁~C₆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。

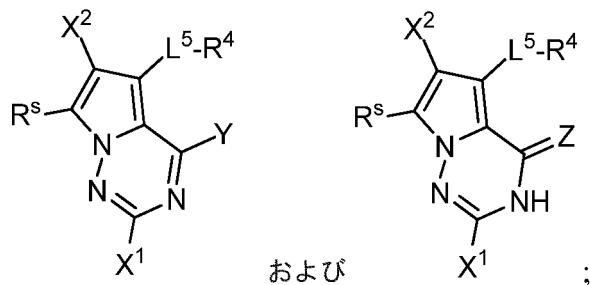
【請求項 19】

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

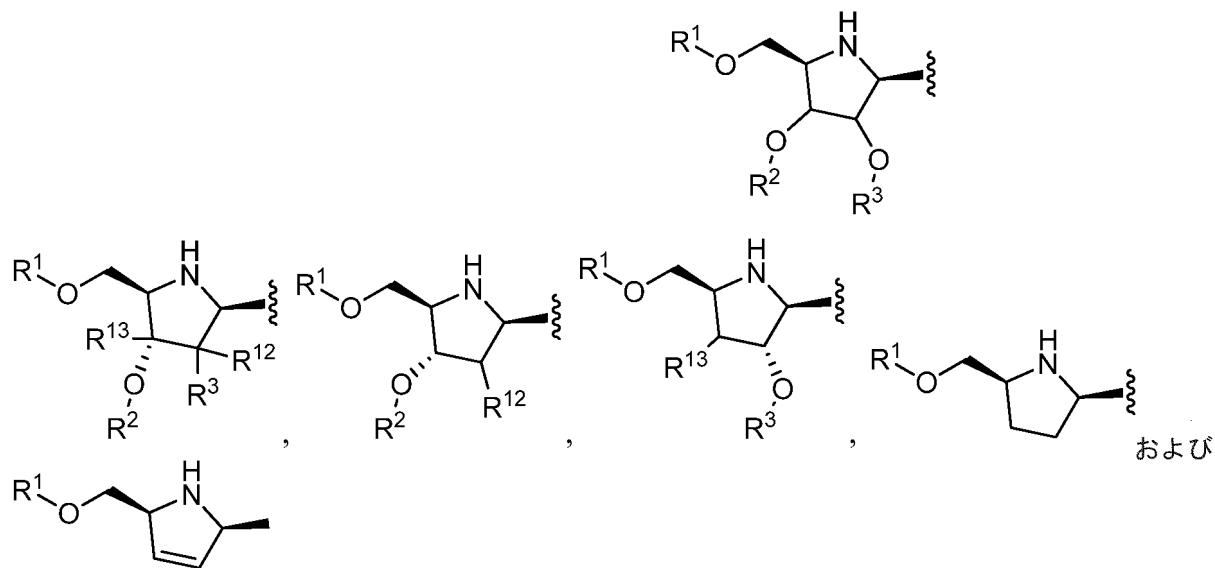
【化 21】



からなる群より選択され；

R^sは

【化 2 2】

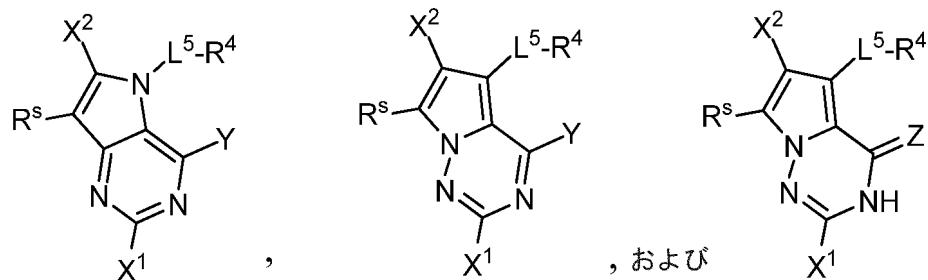


からなる群より選択され；

R¹は、H、C₁～C₆アルキル、アミノアシル、アミノチオニル、C₁～C₆アシル、R¹O 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；

R²およびR³は、各々独立して、H、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルケニル、またはC₁～C<

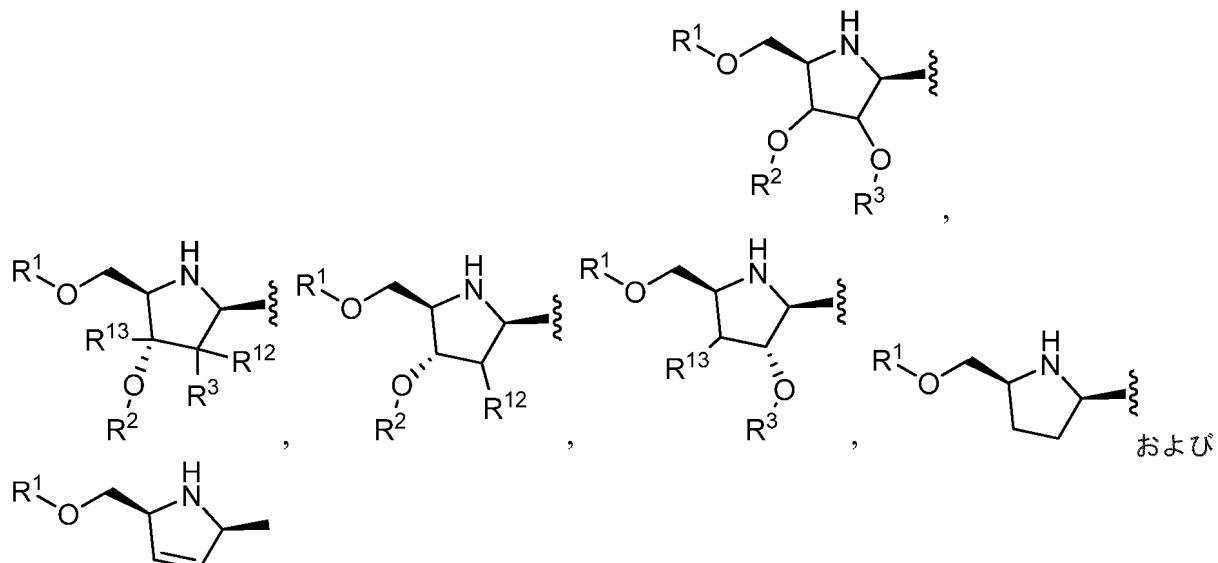
【化23】



からなる群より選択され；

R^sは

【化24】



からなる群より選択され；

R¹は、H、C₁～C₆アルキル、アミノアシル、アミノチオニル、C₁～C₆アシル、R¹OOC(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；

R²およびR³は、各々独立して、H、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルケニル、またはC₁～C₆アルキニルであり；

R¹⁰は、発生毎に独立して、H、C₁～C₆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；

R¹²およびR¹³は、各々独立して、H、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルケニル、C₁～C₆アルキニル、OR⁰、CN、アジド、およびハロゲン化物からなる群より選択され；

L⁵は、結合または-C(R⁰)₂-O-であり；

R⁰は、発生毎に独立して、HまたはC₁～C₆アルキルであり；

R⁴は、C₁～C₆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、C₁～C₆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R⁴は存在しないこともあります；

X¹は、H、N(R⁰)₂、SH、チオアルキル、OR⁰、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；

X²は、H、N(R⁰)₂、SH、チオアルキル、OR⁰、O-アリール、O-ヘテロアリール、アルケニル、アルキニル、C₁～C₆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、OR⁰、N(R⁵)(R⁶)、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。

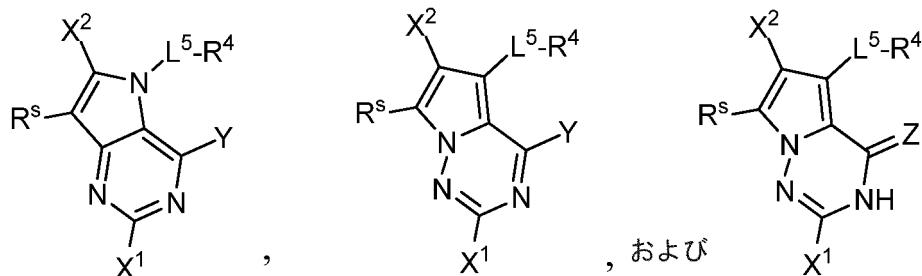
【請求項 21】

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

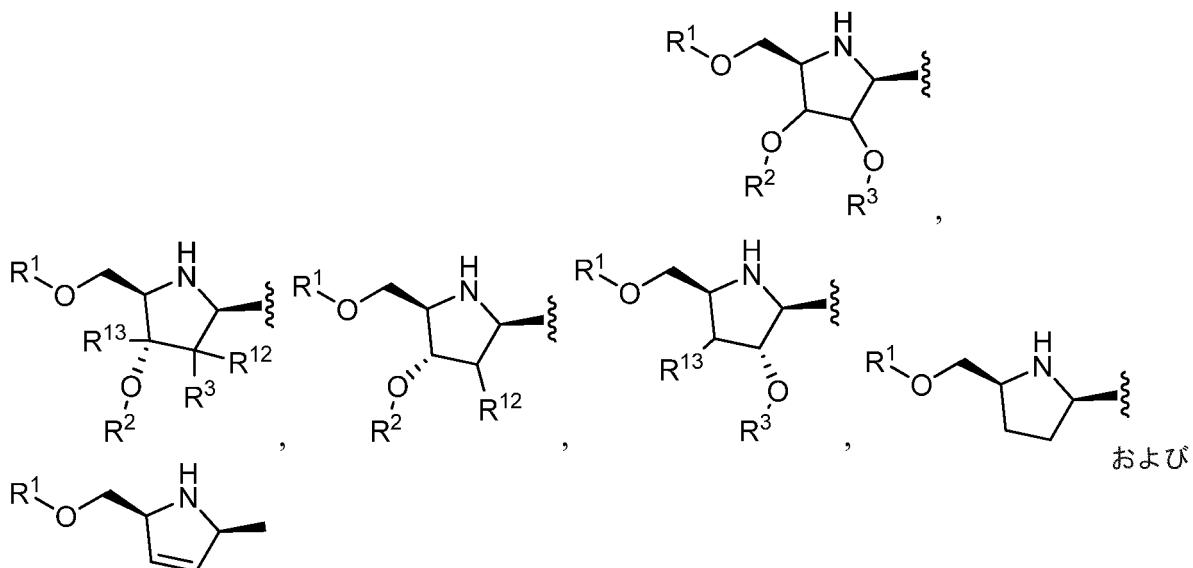
【化 25】



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^1 $\text{O} \text{C}(\text{O})^-$ 、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 $-\text{C}(\text{R}^0)_2-\text{O}-$ 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、またはカルボキシリ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ます；

X^1 は、H、 $\text{N}(\text{R}^0)_2$ 、 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、カルボキシリル、 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、OR⁰、N(R⁵)(R⁶)、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、C₁～C₆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。

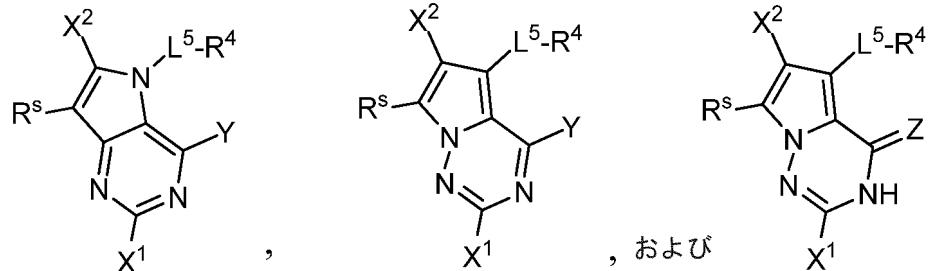
【請求項 2 2】

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

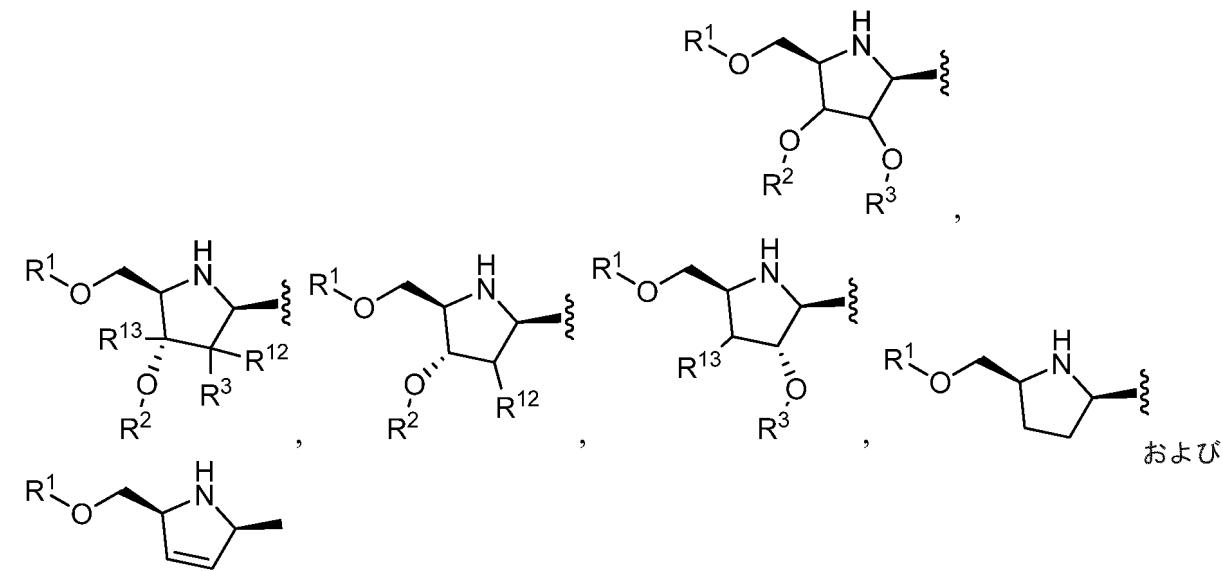
【化 2 7】



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、 $R^1OOC(O)^-$ 、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、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルケニル、またはC₁～C₆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、OR⁰、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、またはカルボキシリ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、OR⁰、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、OR⁰、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、カルボキシリル、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、OR⁰、 $N(R^5)(R^6)$ 、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

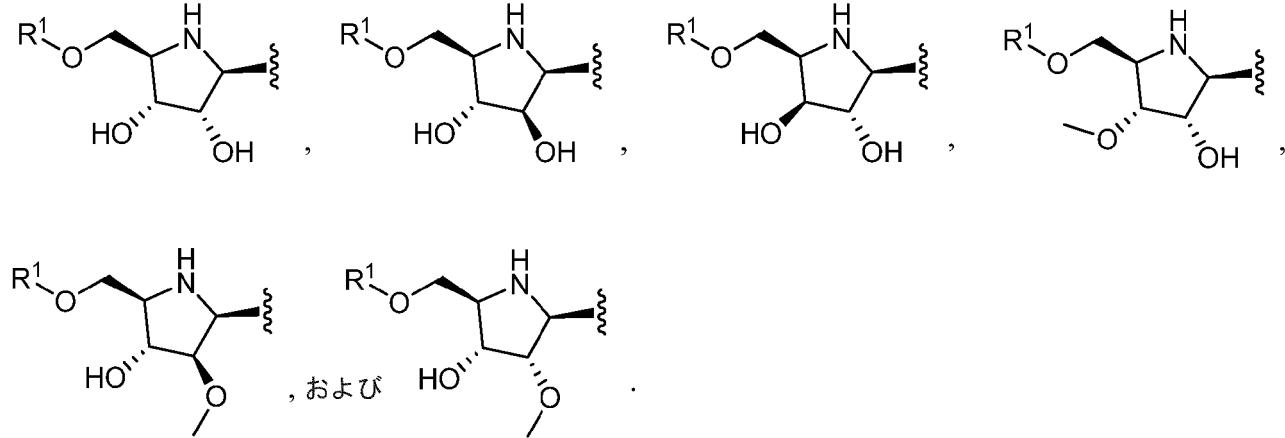
R^5 、 R^6 、およびそれらが結合する窒素が一緒になって、 $-N=C(R^{20})R^{21}$ を表し；

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23】

R^5 が

【化29】

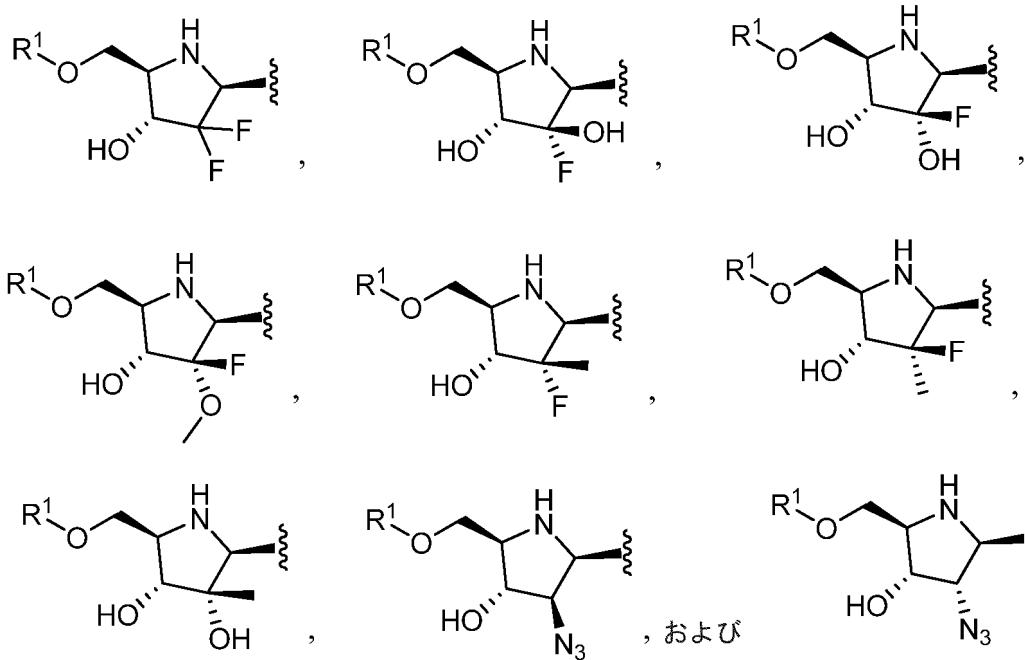


からなる群より選択される、請求項15から22いずれか1項記載の化合物。

【請求項24】

R^5 が

【化30】

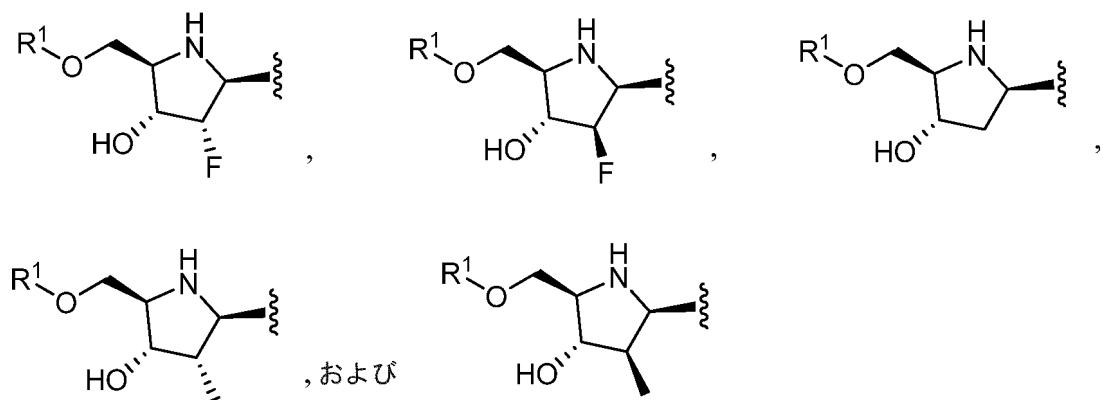


からなる群より選択される、請求項1_5から2_2いずれか1項記載の化合物。

【請求項25】

 R° が

【化31】

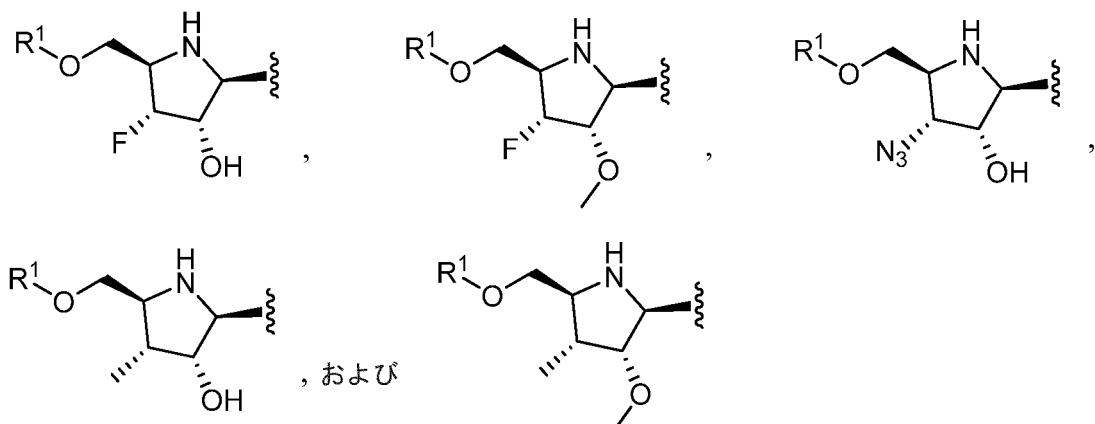


からなる群より選択される、請求項1_5から2_2いずれか1項記載の化合物。

【請求項26】

 R° が

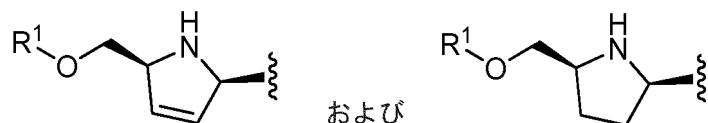
【化32】

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27】

 R^5 が

【化33】

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28】

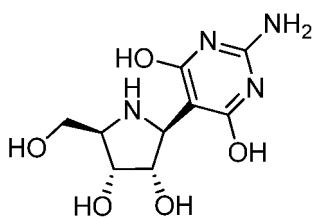
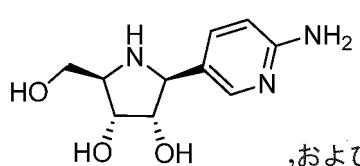
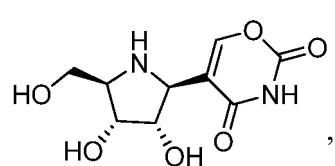
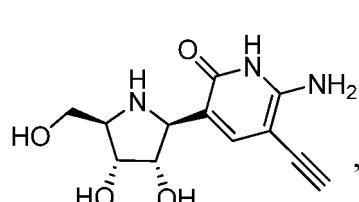
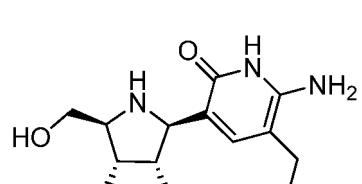
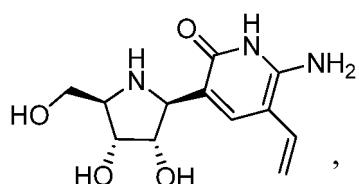
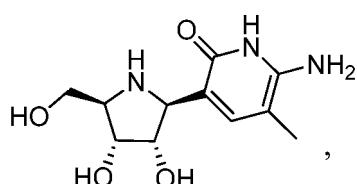
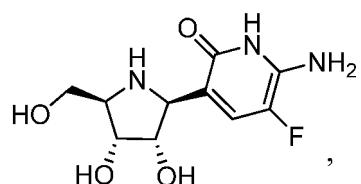
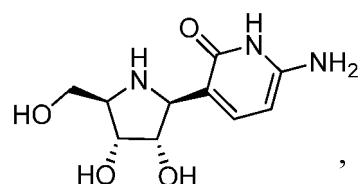
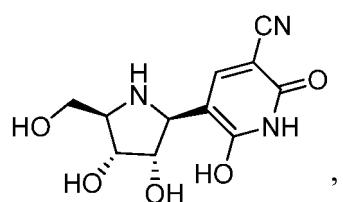
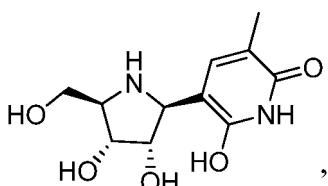
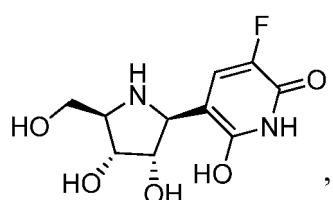
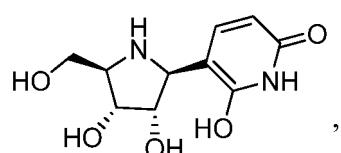
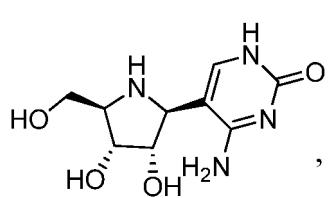
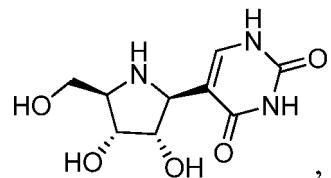
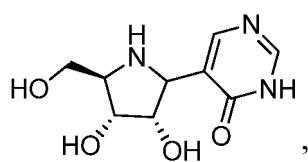
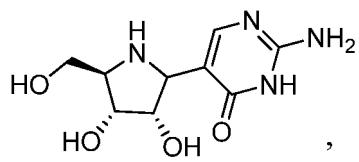
 $L^5 - R^5$ がHである、請求項15から18いずれか1項記載の化合物。

【請求項29】

 $L^4 - R^4$ がHである、請求項15から18いずれか1項記載の化合物。

【請求項30】

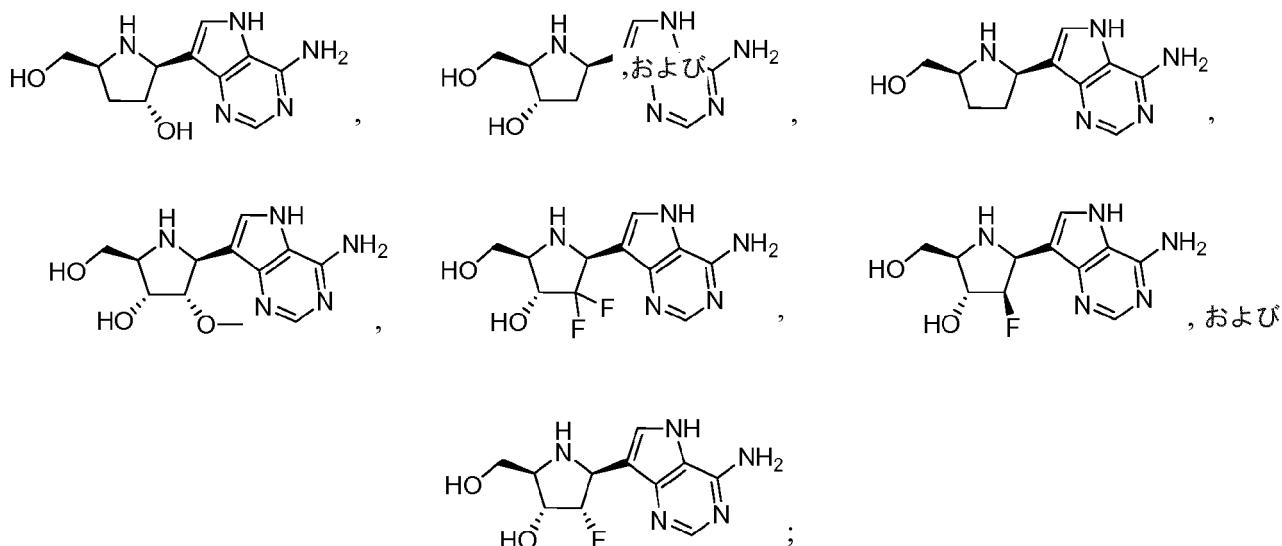
【化 3 4】



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】

前記ウイルスルが、R N A ウィ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 (S A R S) 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、ブンタトロウイルス、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、ブンタトロウイルス、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、S A R S 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 3 8】

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3 7記載の組成物。