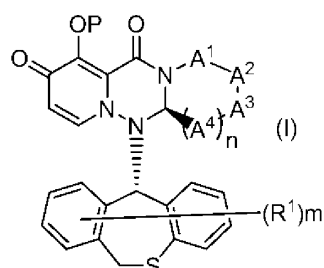


請求の範囲

[請求項1] 以下の式（I）で示される化合物またはその製薬上許容される塩を含有する医薬組成物。

[化1]



（式中、Pは水素原子またはプロドラッグを形成する基；

A¹は、CR^{1A}R^{1B}、SまたはO；

A²は、CR^{2A}R^{2B}、SまたはO；

A³は、CR^{3A}R^{3B}、SまたはO；

A⁴は、それぞれ独立してCR^{4A}R^{4B}、SまたはO；

ここで、A¹、A²、A³、A⁴、A¹に隣接する窒素原子、およびA⁴に隣接する炭素原子から構成される環の環構成原子のヘテロ原子の数は、1または2個であり；

R^{1A}およびR^{1B}は、それぞれ独立して、水素原子、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルキルオキシ、またはフェニル；

R^{2A}およびR^{2B}は、それぞれ独立して、水素原子、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルキルオキシ、またはフェニル；

R^{3A}およびR^{3B}は、それぞれ独立して、水素原子、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルキルオキシ、またはフェニル；

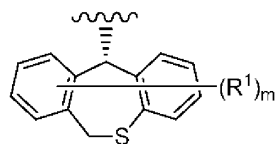
R^{4A}およびR^{4B}は、それぞれ独立して、水素原子、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルキルオキシ、またはフェニル；

R^{3A}およびR^{3B}は隣接する炭素原子と一緒に非芳香族炭素環または非芳香族複素環を形成してもよい；

mは1～2の整数；

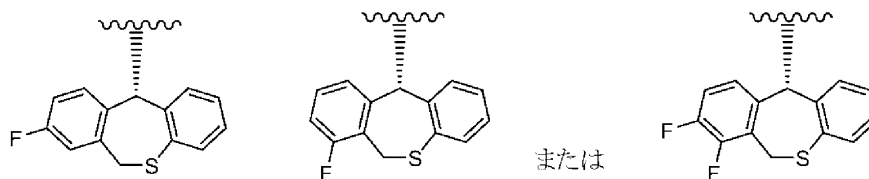
n は 1 ～ 2 の整数であり、

[化2]



で示される基が

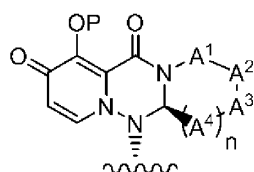
[化3]



である。)

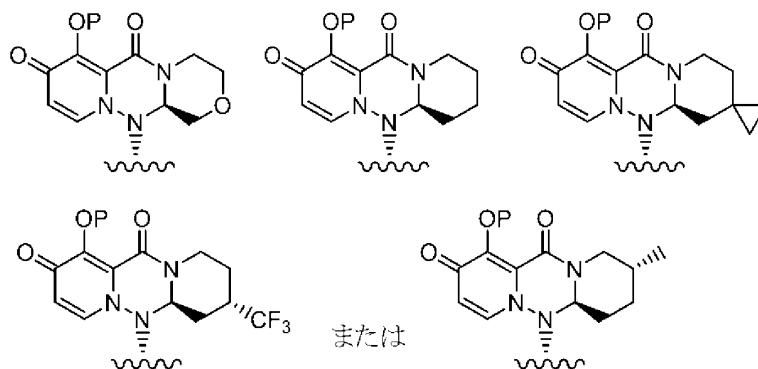
[請求項2]

[化4]



で示される基が

[化5]

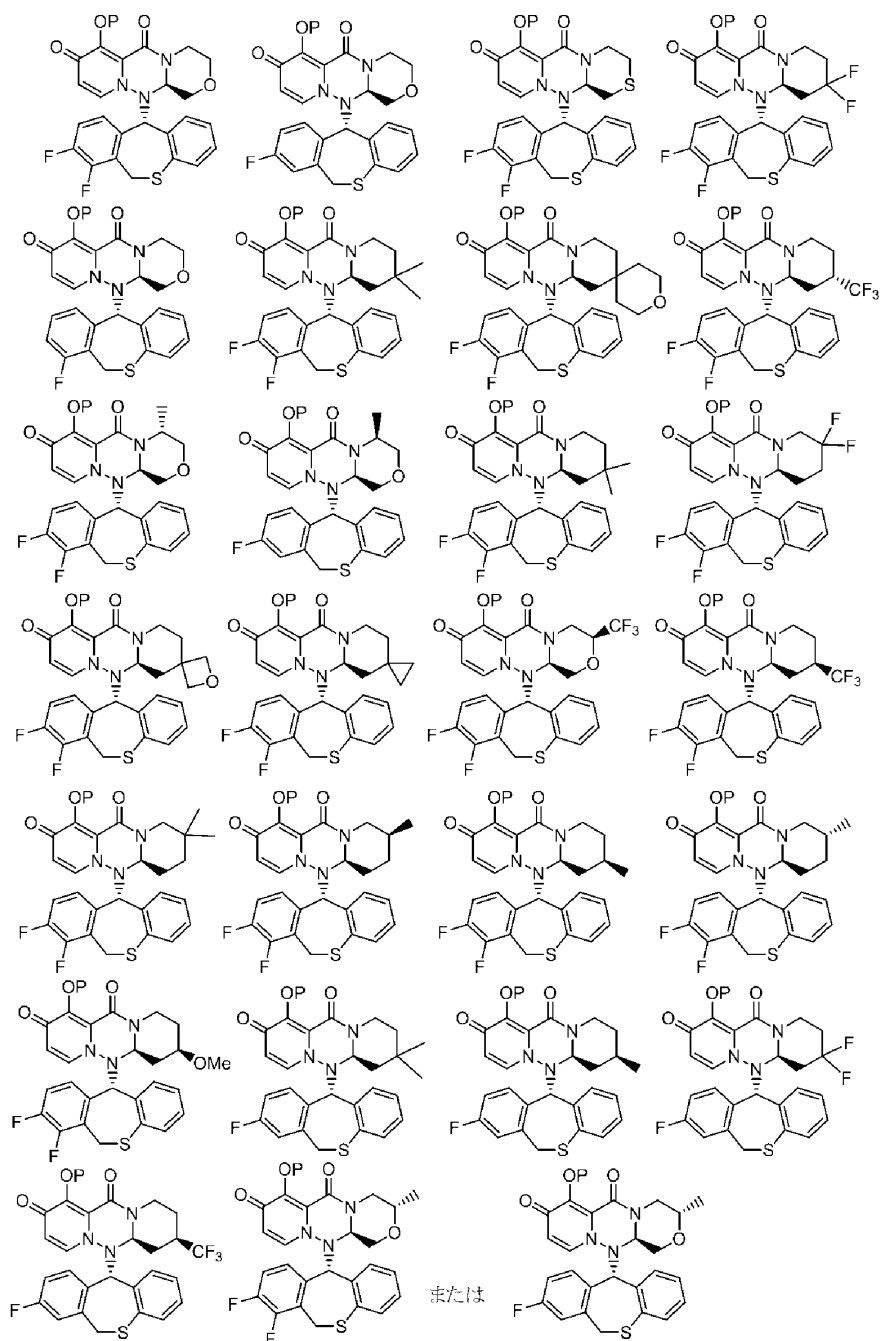


(式中の記号は請求項 1 と同意義)

である化合物またはその製薬上許容される塩を含有する請求項 1 記載の医薬組成物。

[請求項3] 以下のいずれかの式で示される化合物またはその製薬上許容される塩を含有する請求項1記載の医薬組成物。

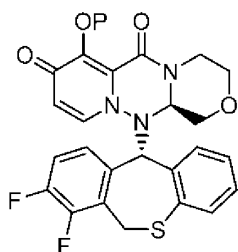
[化6]



(式中の記号は請求項1と同意義)

[請求項4] 以下の式で示される化合物またはその製薬上許容される塩を含有する請求項1記載の医薬組成物。

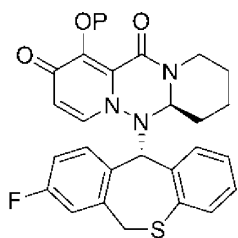
[化7]



(式中の記号は請求項1と同意義)

[請求項5] 以下の式で示される化合物またはその製薬上許容される塩を含有する請求項1記載の医薬組成物。

[化8]



(式中の記号は請求項1と同意義)

[請求項6] プロドラッグを形成する基が以下の式a)～a c)から選ばれる基：

- a) $-C(=O)-P^{R0}$ 、
- b) $-C(=O)-P^{R1}$ 、
- c) $-C(=O)-L-P^{R1}$ 、
- d) $-C(=O)-L-O-P^{R1}$ 、
- e) $-C(=O)-L-O-L-O-P^{R1}$ 、
- f) $-C(=O)-L-O-C(=O)-P^{R1}$ 、
- g) $-C(=O)-O-P^{R2}$ 、
- h) $-C(=O)-N(-K)(P^{R2})$ 、
- i) $-C(=O)-O-L-O-P^{R2}$ 、

- j) $-C(P^{R3})_2-O-P^{R4}$ 、
 k) $-C(P^{R3})_2-O-L-O-P^{R4}$ 、
 l) $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-P^{R4}$ 、
 m) $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-O-P^{R4}$ 、
 n) $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-N(-K)-P^{R4}$ 、
 o) $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-O-L-O-P^{R4}$ 、
 p) $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-O-L-N(P^{R4})_2$ 、
 q) $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-N(-K)-L-O-P^{R4}$ 、
 r) $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-N(-K)-L-N(P^{R4})_2$ 、
 s) $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-O-L-O-L-O-P^{R4}$ 、
 t) $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-O-L-N(-K)-C(=O)-P^{R4}$ 、
 u) $-C(P^{R3})_2-O-P(=O)(-P^{R5})_2$ 、
 v) $-C(P^{R3})_2-P^{R6}$ 、
 w) $-C(=N^+(P^{R7})_2)(-N(P^{R7})_2)$ 、
 x) $-C(P^{R3})_2-C(P^{R3})_2-C(=O)-O-P^{R2}$ 、
 y) $-C(P^{R3})_2-N(-K)-C(=O)-O-P^{R2}$ 、
 z) $-P(=O)(-P^{R8})(-P^{R9})$ 、
 a a) $-S(=O)_2-P^{R10}$ 、
 a b) $-P^{R11}$ 、および
 a c) $-C(P^{R3})_2-C(P^{R3})_2-O-P^{R2}$

(式中、Lは、直鎖もしくは分枝状のアルキレン、または直鎖もしくは分枝状のアルケニレンであり、

Kは、水素原子、または置換基群Aで置換されていてもよいアルキルであり、

P^{R0} は、置換基群Aで置換されていてもよいアルキル、または置換基群Aで置換されていてもよいアルケニルであり、

P^{R1} は、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環式基、置換基群Aで置換されていてもよい複素環式基、置換基群Aで置換されていてもよいアルキルアミノ、または置換基群Aで置換されていてもよいアルキルスルファニルであり、

P^{R2} は、置換基群Aで置換されていてもよいアルキル、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環式基、置換基群Aで置換されていてもよい複素環式基、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環アルキル、置換基群Aで置換されていてもよい複素環アルキル、またはトリアルキルシリルであり、

P^{R3} は、それぞれ独立して、水素原子、アルキルであり、

P^{R4} は、それぞれ独立して、置換基群Aで置換されていてもよいアルキル、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環式基、置換基群Aで置換されていてもよい複素環式基、置換基群Aで置換されていてもよいアルキルアミノ、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環アルキル、置換基群Aで置換されていてもよい複素環アルキル、またはトリアルキルシリルであり、

P^{R5} は、それぞれ独立して、ヒドロキシまたは OB_n であり、

P^{R6} は、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環式基、または置換基群Aで置換されていてもよい複素環式基であり、

P^{R7} は、それぞれ独立して、置換基群Aで置換されていてもよいアルキルであり、

P^{R8} は、置換基群Aで置換されていてもよいアルキルオキシであり、

、

P^{R9} は、置換基群Aで置換されていてもよいアルキルオキシ、置換基群Aで置換されていてもよいアルキルアミノ、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環オキシ、置換基群Aで置換されていてもよい複素環オキシ、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環アミノ、または置換基群Aで置換されていてもよい複素環アミノであり、ならびに

、

P^{R8} および P^{R9} は、隣接するリン原子と一緒にあって、置換基群Aで置換されていてもよい複素環を形成してもよく、

P^{R10} は、置換基群Aで置換されていてもよいアルキル、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環式基、置換基群Aで置換されていてもよい複素環式基、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環アルキル、または置換基群Aで置換されていてもよい複素環アルキルであり、ならびに

P^{R11} は、置換基群Aで置換されていてもよいアルキル、置換基群Aで置換されていてもよいアルケニル、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環式基、または置換基群Aで置換されていてもよい複素環式基である。

置換基群A；オキソ、アルキル、ヒドロキシアルキル、アミノ、アルキルアミノ、炭素環式基、複素環式基、炭素環アルキル、アルキルカルボニル、ハロゲン、ヒドロキシ、カルボキシ、アルキルカルボニルアミノ、アルキルカルボニルアミノアルキル、アルキルカルボニルオキシ、アルキルオキシカルボニル、アルキルオキシカルボニルアルキル、アルキルオキシカルボニルオキシ、アルキルアミノカルボニルオキシ、アルキルアミノアルキル、アルキルオキシ、シアノ、ニトロ、アジド、アルキルスルホニル、トリアルキルシリル、およびホスホ）である化合物またはその製薬上許容される塩を含有する請求項1～5のいずれかに記載の医薬組成物。

[請求項7]

プロドラッグを形成する基が以下の式から選ばれる基：

- a) $-C(=O)-P^{R0}$ 、
- b) $-C(=O)-P^{R1}$ 、
- g) $-C(=O)-O-P^{R2}$ 、
- h) $-C(=O)-N(-K)(P^{R2})$ 、
- i) $-C(=O)-O-L-O-P^{R2}$ 、

- l) $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-P^{R4}$ 、
 m) $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-O-P^{R4}$ 、
 o) $-C(P^{R3})_2-O-C(=O)-O-L-O-P^{R4}$ 、
 v) $-C(P^{R3})_2-P^{R6}$ 、
 x) $-C(P^{R3})_2-C(P^{R3})_2-C(=O)-O-P^{R2}$ 、
 y) $-C(P^{R3})_2-N(-K)-C(=O)-O-P^{R2}$ 、および
 z) $-P(=O)(-P^{R8})(-P^{R9})$

(式中、Lは、直鎖もしくは分枝状のアルキレン、
 Kは、水素原子、または置換基群Aで置換されていてもよいアルキルであり、

P^{R0} は、置換基群Aで置換されていてもよいアルキルであり、

P^{R1} は、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環式基、または置換基群Aで置換されていてもよい複素環式基であり、

P^{R2} は、置換基群Aで置換されていてもよいアルキル、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環式基、置換基群Aで置換されていてもよい複素環式基、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環アルキル、または置換基群Aで置換されていてもよい複素環アルキルであり、

P^{R3} は、それぞれ独立して、水素原子、またはアルキルであり、

P^{R4} は、置換基群Aで置換されていてもよいアルキル、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環式基、または置換基群Aで置換されていてもよい複素環式基であり、

P^{R6} は、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環式基、または置換基群Aで置換されていてもよい複素環式基であり、

P^{R8} は、置換基群Aで置換されていてもよいアルキルオキシであり、

P^{R9} は、置換基群Aで置換されていてもよいアルキルオキシ、置換基群Aで置換されていてもよいアルキルアミノ、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環オキシ、置換基群Aで置換されていてもよい複

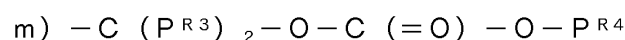
素環オキシ、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環アミノ、または置換基群Aで置換されていてもよい複素環アミノであり、ならびに P^{R8} および P^{R9} は、隣接するリン原子と一緒にあって、置換基群Aで置換されていてもよい複素環を形成してもよい。

置換基群A；オキシ、アルキル、アルキルアミノ、炭素環式基、複素環式基、アルキルカルボニル、ハロゲン、ヒドロキシ、アルキルカルボニルアミノ、アルキルカルボニルオキシ、アルキルオキシカルボニル、アルキルオキシカルボニルアルキル、アルキルアミノカルボニルオキシ、アルキルオキシ、ニトロ、アジド、アルキルスルホニル、およびトリアルキルシリル)

である化合物またはその製薬上許容される塩を含有する請求項6記載の医薬組成物。

[請求項8]

プロドラッグを形成する基が以下の式：



(式中、

P^{R3} は、それぞれ独立して、水素原子、またはアルキルであり、ならびに

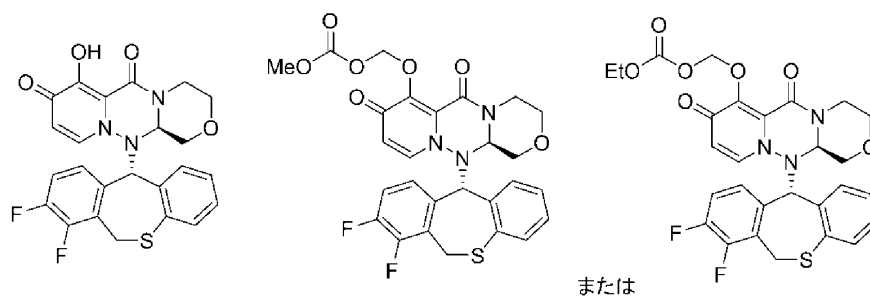
P^{R4} は、置換基群Aで置換されていてもよいアルキル、置換基群Aで置換されていてもよい炭素環式基、または置換基群Aで置換されていてもよい複素環式基である。

置換基群A；オキシ、アルキル、アルキルアミノ、炭素環式基、複素環式基、アルキルカルボニル、ハロゲン、ヒドロキシ、アルキルカルボニルアミノ、アルキルカルボニルオキシ、アルキルオキシカルボニル、アルキルオキシカルボニルアルキル、アルキルアミノカルボニルオキシ、アルキルオキシ、ニトロ、アジド、アルキルスルホニル、およびトリアルキルシリル)

である化合物またはその製薬上許容される塩を含有する請求項6記載の医薬組成物。

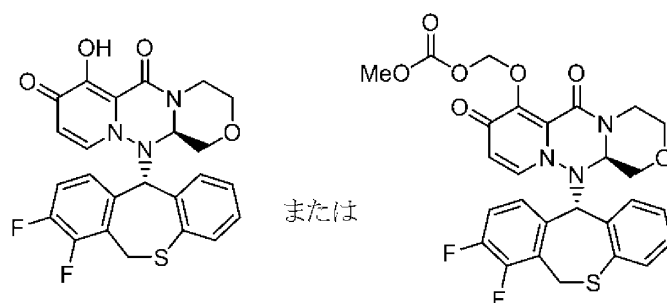
[請求項9] 以下のいずれかの式で示される化合物、またはその製薬上許容される塩を含有する医薬組成物。

[化9]



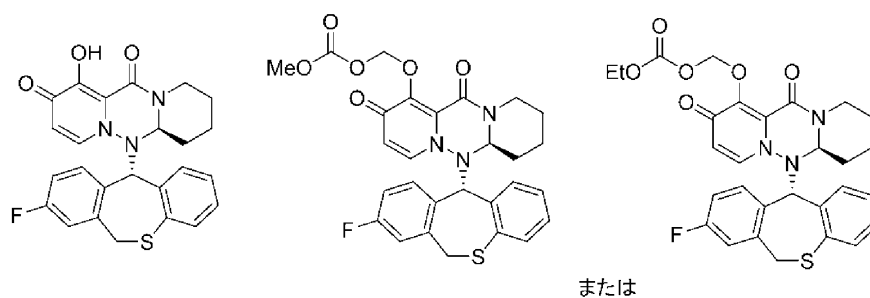
[請求項10] 以下のいずれかの式で示される化合物またはその製薬上許容される塩を含有する医薬組成物。

[化10]



[請求項11] 以下のいずれかの式で示される化合物またはその製薬上許容される塩を含有する医薬組成物。

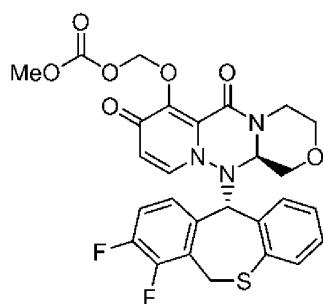
[化11]



[請求項12] 抗ウイルス剤である、請求項1～11のいずれかに記載の医薬組成物。

- [請求項13] キャップ依存的エンドヌクレアーゼ阻害剤である、請求項12記載の医薬組成物。
- [請求項14] インフルエンザ罹病期間を短縮するために用いられる、請求項1～11のいずれかに記載の医薬組成物。
- [請求項15] インフルエンザウイルスを減少させるために用いられる、請求項1～11のいずれかに記載の医薬組成物。
- [請求項16] 以下の式で示される化合物の結晶。

[化12]



- [請求項17] 粉末X線回折の 2θ の値が、 $8.6 \pm 0.2^\circ$ 、 $14.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $17.4 \pm 0.2^\circ$ 、 $20.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $24.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $26.3 \pm 0.2^\circ$ 、 $29.6 \pm 0.2^\circ$ および $35.4 \pm 0.2^\circ$ から選択される2つ以上の 2θ を有する、請求項16記載の結晶。
- [請求項18] 粉末X線回折の 2θ の値が、 $8.6 \pm 0.2^\circ$ 、 $14.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $17.4 \pm 0.2^\circ$ 、 $20.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $24.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $26.3 \pm 0.2^\circ$ 、 $29.6 \pm 0.2^\circ$ および $35.4 \pm 0.2^\circ$ である、請求項16記載の結晶。
- [請求項19] 図3に実質的に一致する粉末X線回折スペクトルにより特徴付けられる、請求項16記載の結晶。
- [請求項20] 請求項16～19のいずれかに記載の結晶を含有する医薬組成物。
- [請求項21] 抗ウイルス剤である、請求項20記載の医薬組成物。
- [請求項22] キャップ依存的エンドヌクレアーゼ阻害剤である、請求項21記載の医薬組成物。

- [請求項23] インフルエンザ罹病期間を短縮するために用いられる、請求項 1 6 ～ 1 9 のいずれかに記載の結晶を含有する医薬組成物。
- [請求項24] インフルエンザウイルスを減少させるために用いられる、請求項 1 6 ～ 1 9 のいずれかに記載の結晶を含有する医薬組成物。