

【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18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-505499(P2005-505499A)
 【公表日】平成17年2月24日(2005.2.24)
 【年通号数】公開・登録公報2005-008
 【出願番号】特願2002-584819(P2002-584819)
 【国際特許分類】

C 0 7 H 19/10 (2006.01)
A 6 1 K 31/7072 (2006.01)
A 6 1 P 1/16 (2006.01)
A 6 1 P 9/00 (2006.01)
A 6 1 P 13/12 (2006.01)
A 6 1 P 15/00 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 25/28 (2006.01)
A 6 1 P 31/12 (2006.01)
A 6 1 P 31/18 (2006.01)
A 6 1 P 31/20 (2006.01)
A 6 1 P 31/22 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/02 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)

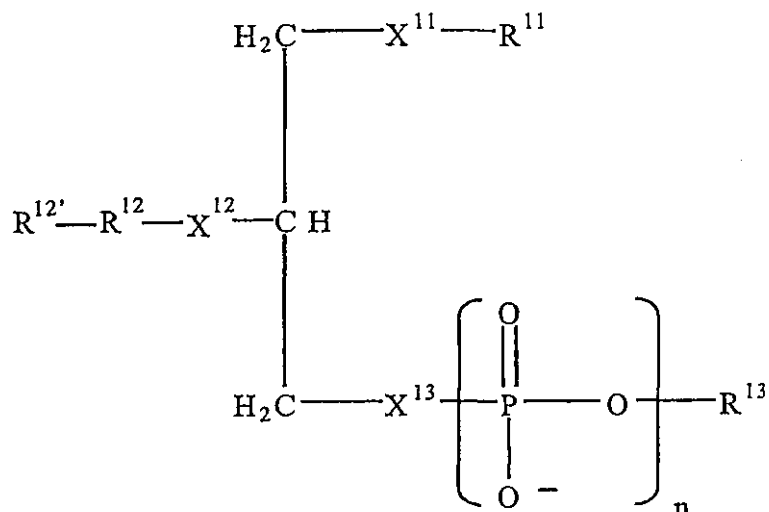
【F I】

C 0 7 H 19/10
 A 6 1 K 31/7072
 A 6 1 P 1/16
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 15/00
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 31/20
 A 6 1 P 31/22
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】
 【提出日】平成17年6月8日(2005.6.8)
 【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】

以下の式(III)：

【化1】



(III)

{ 式中、

R^{11} が、 $(\text{C}_1 - \text{C}_{16})$ アルキル、分岐のアルキル、アルケニル又はアルキニルであり；

R^{12} が、 $(\text{C}_1 - \text{C}_{16})$ アルキル、分岐のアルキル、アルケニル又はアルキニルであり；

$\text{R}^{12'}$ が、 $(\text{C}_1 - \text{C}_{16})$ アルキル、分岐のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、フェナルキル、又はアルコキシ若しくはヒドロキシ、無水物、あるいは水素であり、

但し、 $\text{R}^{12'}$ がヒドロキシではないとき、それは、場合によりリンカー部分Lを通して X^{12} に連結され、そして、場合により $\text{R}^{12'}$ は治療薬により末端で置換され、

Lが、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{NH}_2-$ 又は $-\text{NHC}(\text{O})-$ であり；

X^{11} が、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{NH}_2-$ 又は $-\text{NHC}(\text{O})-$ であり；

X^{12} が、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{NH}_2-$ 又は $-\text{NHC}(\text{O})-$ であり；

X^{13} が、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2-$ 、無水物又は $(\text{C}_1 - \text{C}_{16})$ アルコキシであり；

nが、0、1又は2であり；

R^{13} が、治療薬又は $-\text{R}^3\text{N}(\text{R}^6)(\text{R}^7)\text{R}^8$ であり；

R^3 が、 $(\text{C}_1 - \text{C}_8)$ アルキレンであり；そして

R^6 、 R^7 及び R^8 が、各々独立に $-\text{H}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_8)$ アルキル又は $(\text{C}_1 - \text{C}_8)$ アルコキシである。}

によって表される構造を有する化合物であって、さらに医薬として許容されるその塩又はそのプロドラッグのいずれかであってもよい上記化合物。

【請求項2】

式中、

R^{12} が、 $(\text{C}_8 - \text{C}_{12})$ アルキル、分岐のアルキル、アルケニル又はアルキニルであり；

$\text{R}^{12'}$ が、 $(\text{C}_1 - \text{C}_{16})$ フェナルキル、又はアルコキシ若しくはヒドロキシ、又は無水物であり、

但し、 $\text{R}^{12'}$ がヒドロキシではないとき、それは場合によりエーテル酸素を通して X^{12} に連結され；

R^{13} が、 $-\text{R}^3\text{N}(\text{R}^6)(\text{R}^7)\text{R}^8$ であり；そして

X^{12} が、 $-\text{O}-$ である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

前記 $\text{R}^{12'}$ が、治療薬により末端で置換される、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

前記 $R^{12'}$ が、 $-OCH_2C_6H_5$ 、 $-OH$ 又は $-O_2CCH_2CO_2H$ であり、かつ、前記 R^{12} が、場合により治療薬により末端で置換される、請求項2に記載の化合物。

【請求項5】

前記 $R^{12'}$ が、 $-O_2CCH_2CO_2-$ であり、かつ、前記 R^{12} が、治療薬により末端で置換される、請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

前記治療薬が、抗ウイルス剤及び抗癌剤から成る群から選ばれる薬剤を含む、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

前記治療薬が、プロテアーゼ阻害薬、ポリメラーゼ阻害薬、逆転写酵素阻害薬及びヌクレオシド・アナログから成る群から選ばれる薬剤を含む、請求項6に記載の化合物。

【請求項8】

前記抗ウイルス剤が、AZTである、請求項6に記載の化合物。

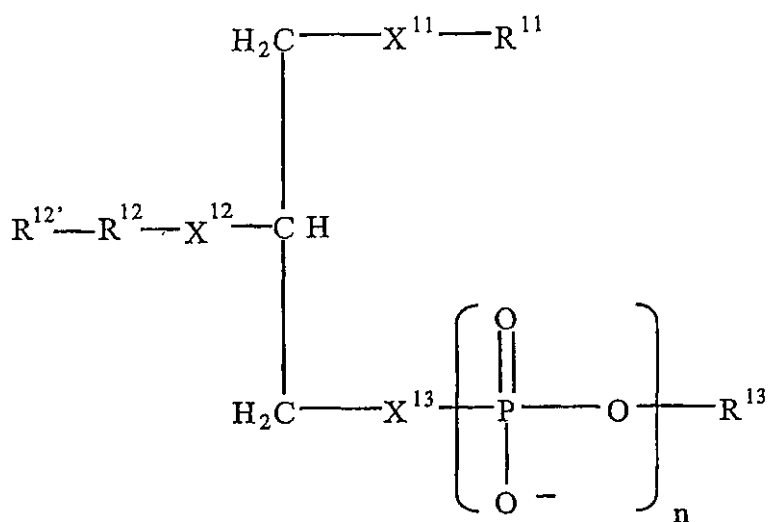
【請求項9】

前記抗癌剤が、ゲムシタピン、ara-C、5-アザシチジン、クラドリピン、フルクララビン、フルオロデオキシウリジン、シトシン・アラビノシド及び6-メルカプトプリンから成る群から選ばれる薬剤である、請求項6に記載の化合物。

【請求項10】

以下の式(III)：

【化2】



(III)

{ 式中、

R^{11} が、 $(C_1 - C_{16})$ アルキル、分岐のアルキル、アルケニル又はアルキニルであり；

R^{12} が、 $(C_1 - C_{16})$ アルキル、分岐のアルキル、アルケニル又はアルキニルであり；

$R^{12'}$ が、 $(C_1 - C_{16})$ フェナルキル、アルコキシ、無水物、又はヒドロキシであり、

但し、 $R^{12'}$ がヒドロキシではないとき、それはエーテル酸素を通して X^{12} に連結され、そして、 $R^{12'}$ が治療薬によって末端で置換され、

X^{11} が、 $-S-$ であり；

X^{12} が、 $-O-$ であり；

X^{13} が、 $-O-$ であり；

R^{13} が、 $-R^3N(R^6)(R^7)R^8$ であり；

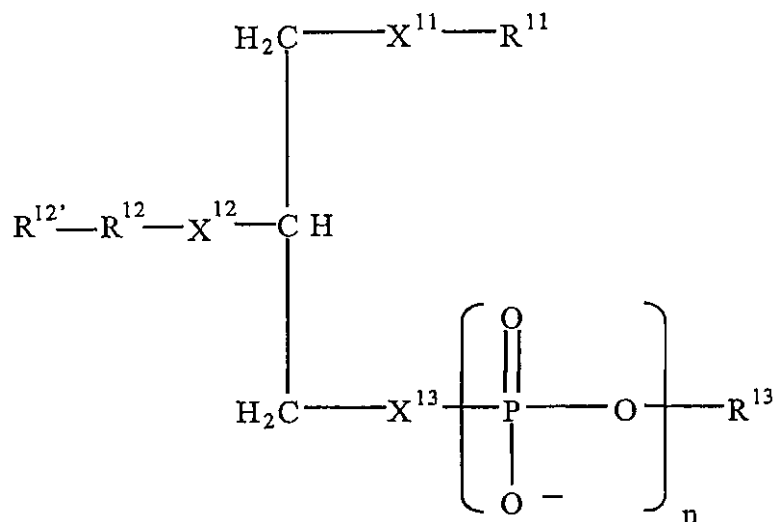
R^3 が、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ であり；そして

R^6 、 R^7 及び R^8 が、各々独立にメチルである。} によって表される構造を有する化合物であって、さらに医薬として許容されるその塩又はそのプロドラッグのいずれかであって
もよい上記化合物。

【請求項 1 1】

以下の式 (III)：

【化 3】



(III)

{ 式中、

R^{11} が、 $-\text{C}_{12}\text{H}_{25}$ であり；

R^{12} が、 $-(\text{CH}_2)_8$ であり；

$R^{12'}$ が、 $-\text{O}_2\text{CCH}_2\text{CO}_2\text{AZT}$ であり；

X^{11} が、 $-\text{S}-$ であり；

X^{12} が、 $-\text{O}-$ であり；

X^{13} が、 $-\text{O}-$ であり；

R^{13} が、 $-\text{R}^3\text{N}(\text{R}^6)(\text{R}^7)\text{R}^8$ であり；

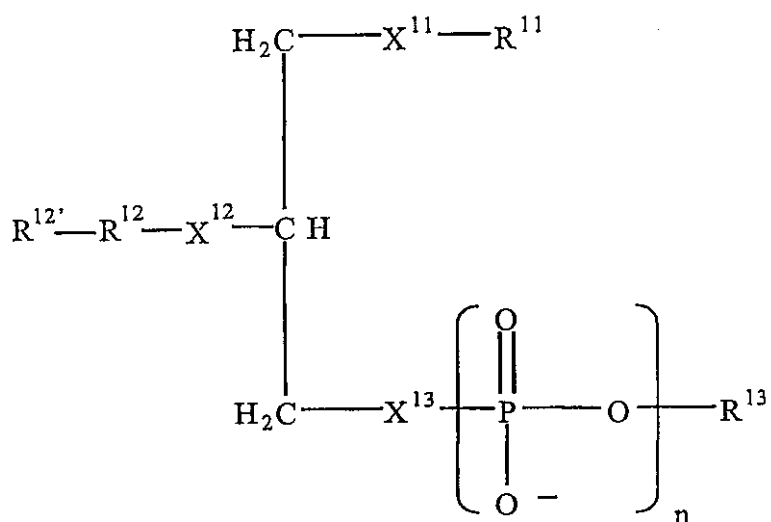
R^3 が、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ であり；そして

R^6 、 R^7 及び R^8 が、各々独立にメチルである。} によって表される構造を有する化合物であって、さらに医薬として許容されるその塩又はそのプロドラッグのいずれかであって
もよい上記化合物。

【請求項 1 2】

以下の式 (III)：

【化 4】



(III)

{ 式中、

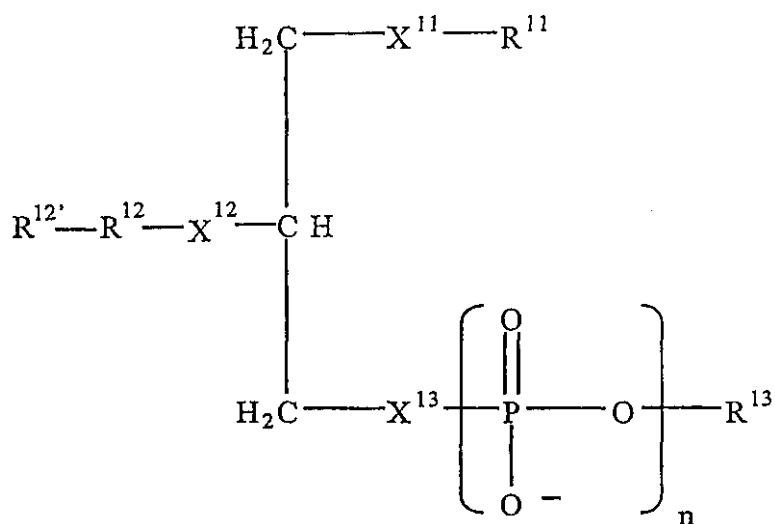
R¹¹ が、-C₁₂H₂₅であり；R¹² が、-(CH₂)₁₀であり；R^{12'} が、-O₂CCH₂CO₂AZTであり；X¹¹ が、-S-であり；X¹² が、-O-であり；X¹³ が、-O-であり；R¹³ が、-R³N(R⁶)(R⁷)R⁸であり；R³ が、-CH₂CH₂-であり；そして

R⁶、R⁷及びR⁸が、各々独立にメチルである。}によって表される構造を有する化合物であって、さらに医薬として許容されるその塩又はそのプロドラッグのいずれかであって
もよい上記化合物。

【請求項 13】

以下の式(III)：

【化5】



(III)

{ 式中、

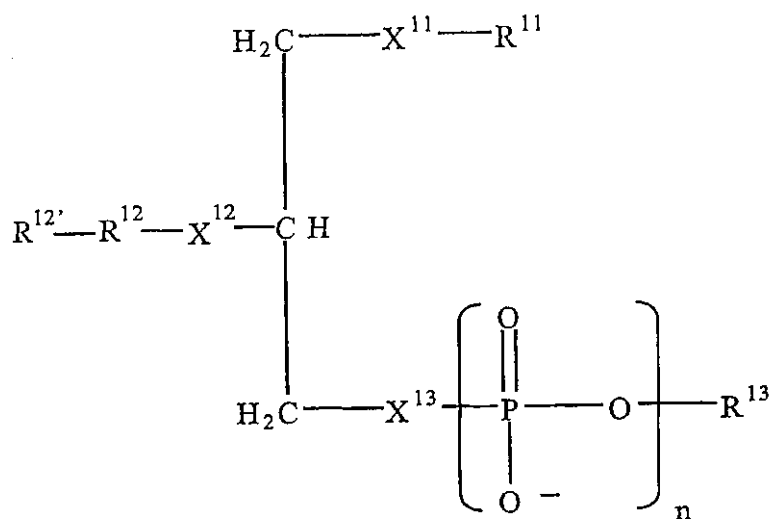
R¹¹ が、-C₁₂H₂₅であり；R¹² が、-(CH₂)₁₂であり；R^{12'} が、-O₂CCH₂CO₂AZTであり；X¹¹ が、-S-であり；X¹² が、-O-であり；X¹³ が、-O-であり；R¹³ が、-R³N(R⁶)(R⁷)R⁸であり；R³ が、-CH₂CH₂-であり；そして

R⁶、R⁷及びR⁸が、各々独立にメチルである。}によって表される構造を有する化合物であって、さらに医薬として許容されるその塩又はそのプロドラッグのいずれかであってもよい上記化合物。

【請求項14】

以下の式(III)：

【化6】



(III)

{ 式中、

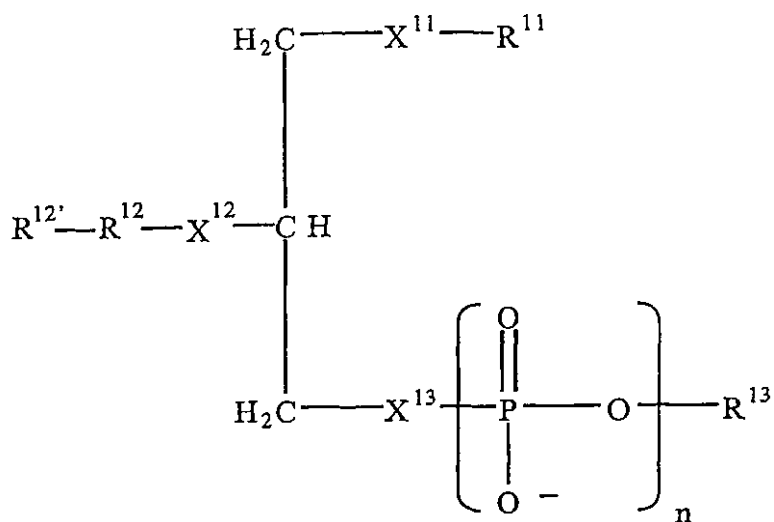
 R^{11} が、 $-\text{C}_{12}\text{H}_{25}$ であり； R^{12} が、 $-(\text{CH}_2)_{12}$ であり； $\text{R}^{12'}$ が、 $-\text{OH}$ であり； X^{11} が、 $-\text{S}-$ であり； X^{12} が、 $-\text{O}-$ であり； X^{13} が、 $-\text{O}-$ であり； R^{13} が、 $-\text{R}^3\text{N}(\text{R}^6)(\text{R}^7)\text{R}^8$ であり； R^3 が、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ であり；そして

R^6 、 R^7 及び R^8 が、各々独立にメチルである。} によって表される構造を有する化合物であって、さらに医薬として許容されるその塩又はそのプロドラッグのいずれかであって、もよい上記化合物。

【請求項15】

哺乳動物のウイルス感染症の治療用医薬組成物であって、以下の式(III)：

【化 7】



(III)

{ 式中、

 R^{11} が、(C₁-C₁₆)アルキル、分岐のアルキル、アルケニル又はアルキニルであり； R^{12} が、(C₁-C₁₆)アルキル、分岐のアルキル、アルケニル又はアルキニルであり； $\text{R}^{12'}$ が、(C₁-C₁₆)アルキル、分岐のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、フェナルキル、又はアルコキシ若しくはヒドロキシ、無水物、あるいは水素であり、但し、 $\text{R}^{12'}$ がヒドロキシではないとき、それは、場合によりリンカー部分Lを通して X^{12} に連結され、そして、場合により $\text{R}^{12'}$ が治療薬により末端で置換され、Lが、-O-、-S-、-NH₂-又は-NHC(O)-であり； X^{11} が、-O-、-S-、-NH₂-又は-NHC(O)-であり； X^{12} が、-O-、-S-、-NH₂-又は-NHC(O)-であり； X^{13} が、-O-、-S-、-CH₂-、無水物又は(C₁-C₁₆)アルコキシであり；

nが、0、1又は2であり；

 R^{13} が、治療薬又は $-\text{R}^3\text{N}(\text{R}^6)(\text{R}^7)\text{R}^8$ であり； R^3 が、(C₁-C₈)アルキレンであり；そして R^6 、 R^7 及び R^8 が、各々独立に-H、(C₁-C₈)アルキル又は(C₁-C₈)アルコキシである。}によって表される構造を有する化合物、又は医薬として許容されるその塩若しくはそのプロドラッグを、上記感染症を治療するために有効な量で含む前記医薬組成物。

【請求項 16】

前記ウイルス感染症が、HIV、肝炎ウイルス及びヘルペスウイルスから成る群から選ばれるウイルスによる感染症である、請求項15に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

前記HIVが、HIV-1及びHIV-2から成る群から選ばれる、請求項16に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

前記ウイルスが、A型肝炎、B型肝炎、C型肝炎、D型肝炎、E型肝炎及びG型肝炎ウイルスから成る群から選ばれる、請求項16に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

前記ウイルスが、単純ヘルペスウイルス1型、単純ヘルペスウイルス2型、水痘・帯状ヘルペスウイルス、サイトメガロウイルス、ライノウイルス、エプスタインバーウイルス、ヒト・ヘルペスウイルス6型、ヒト・ヘルペスウイルス7型、ヒト・ヘルペスウイルス8型

から成る群から選ばれる、請求項16に記載の医薬組成物。

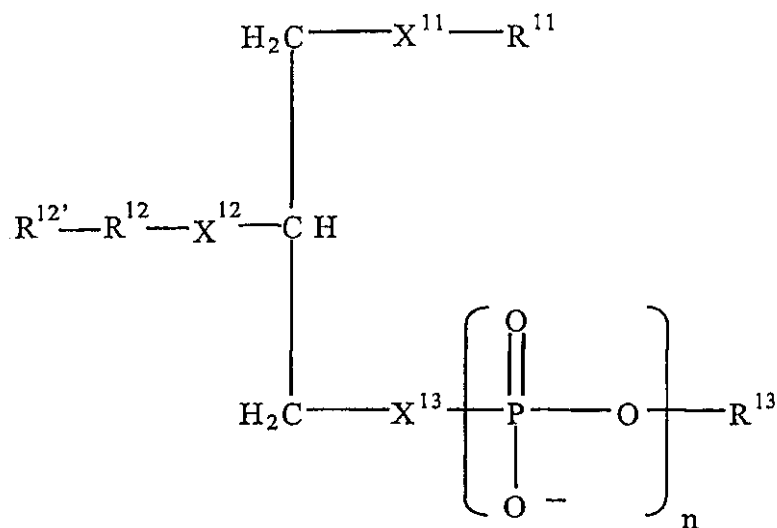
【請求項20】

前記哺乳動物がヒトである、請求項15に記載の医薬組成物。

【請求項21】

哺乳動物の、ヘルペスウイルスによる感染症を含むウイルス感染症の治療用医薬組成物であって、以下の式(III)：

【化8】



(III)

{ 式中、

R^{11} が、 $-\text{C}_{12}\text{H}_{25}$ であり；

R^{12} が、 $-(\text{CH}_2)_{12}$ であり；

$\text{R}^{12'}$ が、 $-\text{OH}$ であり；

X^{11} が、 $-\text{S}-$ であり；

X^{12} が、 $-\text{O}-$ であり；

X^{13} が、 $-\text{O}-$ であり；

R^{13} が、 $-\text{R}^3\text{N}(\text{R}^6)(\text{R}^7)\text{R}^8$ であり；

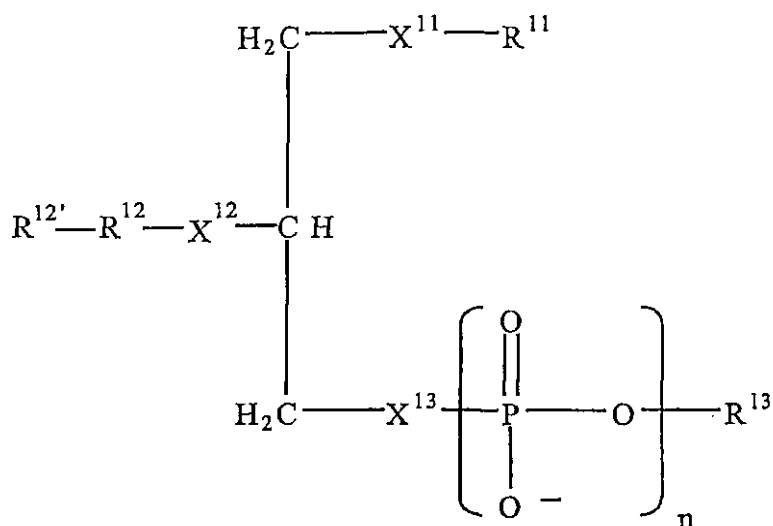
R^3 が、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ であり；そして

R^6 、 R^7 及び R^8 が、各々独立にメチルである。} によって表される構造を有する化合物、又は医薬として許容されるその塩若しくはそのプロドラッグを、上記感染症を治療するために有効な量で含む前記医薬組成物。

【請求項22】

哺乳動物の、ヘルペスウイルスによる感染症を含むウイルス感染症の治療用医薬組成物であって、以下の式(III)：

【化9】



(III)

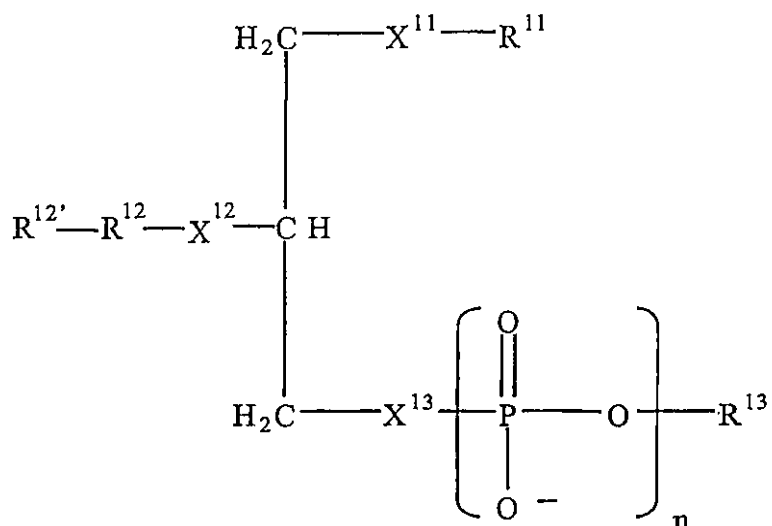
{ 式中、

 R^{11} が、 $-\text{C}_{12}\text{H}_{25}$ であり； R^{12} が、 $-(\text{CH}_2)_{12}$ であり； $\text{R}^{12'}$ が、 $-\text{OH}$ 又は $-\text{O}_2\text{CCH}_2\text{CO}_2\text{AZT}$ であり； X^{11} が、 $-\text{S}-$ であり； X^{12} が、 $-\text{O}-$ であり； X^{13} が、 $-\text{O}-$ であり； R^{13} が、 $-\text{R}^3\text{N}(\text{R}^6)(\text{R}^7)\text{R}^8$ であり； R^3 が、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ であり；そして R^6 、 R^7 及び R^8 が、各々独立にメチルである。} によって表される構造を有する化合物、又は医薬として許容されるその塩若しくはそのプロドラッグを、上記感染症を治療するために有効な量で含む前記医薬組成物。

【請求項23】

哺乳動物の、HIVによる感染症を含むウイルス感染症の治療用医薬組成物であって、以下の式(III)：

【化 1 0】



(III)

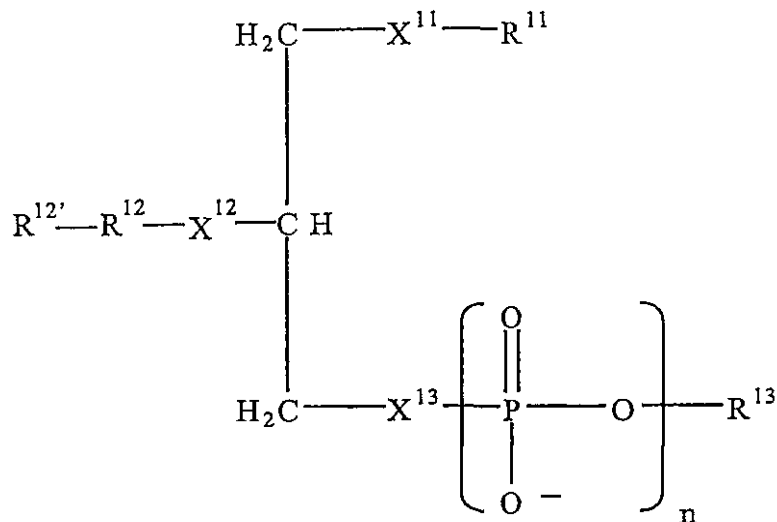
{ 式中、

R¹¹ が、-C₁₂H₂₅であり；R¹² が、-(CH₂)₈であり；R^{12'} が、-OH又は-O₂CCH₂CO₂AZTであり；X¹¹ が、-S-であり；X¹² が、-O-であり；X¹³ が、-O-であり；R¹³ が、-R³N(R⁶)(R⁷)R⁸であり；R³ が、-CH₂CH₂-であり；そしてR⁶、R⁷及びR⁸が、各々独立にメチルである。}によって表される構造を有する化合物、又は医薬として許容されるその塩若しくはそのプロドラッグを、上記感染症を治療するために有効な量で含む前記医薬組成物。

【請求項 2 4】

細胞内のウイルス複製の抑制用医薬組成物であって、以下の式(III)：

【化 1 1】



(III)

{ 式中、

R^{11} が、 $(\text{C}_1 - \text{C}_{16})$ アルキル、分岐のアルキル、アルケニル又はアルキニルであり；

R^{12} が、 $(\text{C}_1 - \text{C}_{16})$ アルキル、分岐のアルキル、アルケニル又はアルキニルであり；

$\text{R}^{12'}$ が、 $(\text{C}_1 - \text{C}_{16})$ アルキル、分岐のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、フェナルキル、又はアルコキシ若しくはヒドロキシ、無水物、あるいは水素であり、

但し、 $\text{R}^{12'}$ がヒドロキシではないとき、それは、場合によりリンカー部分Lを通して X^{12} に連結され、そして、場合により $\text{R}^{12'}$ が治療薬により末端で置換され、

Lが、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{NH}_2$ -又は $-\text{NHC}(\text{O})-$ であり；

X^{11} が、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{NH}_2$ -又は $-\text{NHC}(\text{O})-$ であり；

X^{12} が、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{NH}_2$ -又は $-\text{NHC}(\text{O})-$ であり；

X^{13} が、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2-$ 、無水物又は $(\text{C}_1 - \text{C}_{16})$ アルコキシであり；

nが、0、1又は2であり；

R^{13} が、治療薬又は $-\text{R}^3\text{N}(\text{R}^6)(\text{R}^7)\text{R}^8$ であり；

R^3 が、 $(\text{C}_1 - \text{C}_8)$ アルキレンであり；そして

R^6 、 R^7 及び R^8 が、各々独立に $-\text{H}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_8)$ アルキル又は $(\text{C}_1 - \text{C}_8)$ アルコキシである。}

によって表されるに構造を有する化合物、又は医薬として許容されるその塩若しくはそのプロドラッグを、細胞内のウイルス複製を抑制するために有効な量で含む前記医薬組成物

【請求項 2 5】

前記細胞が哺乳動物細胞である、請求項24に記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

前記哺乳動物細胞が、CNS細胞及びリンパ系細胞から成る群から選ばれる細胞である、請求項25に記載の医薬組成物。

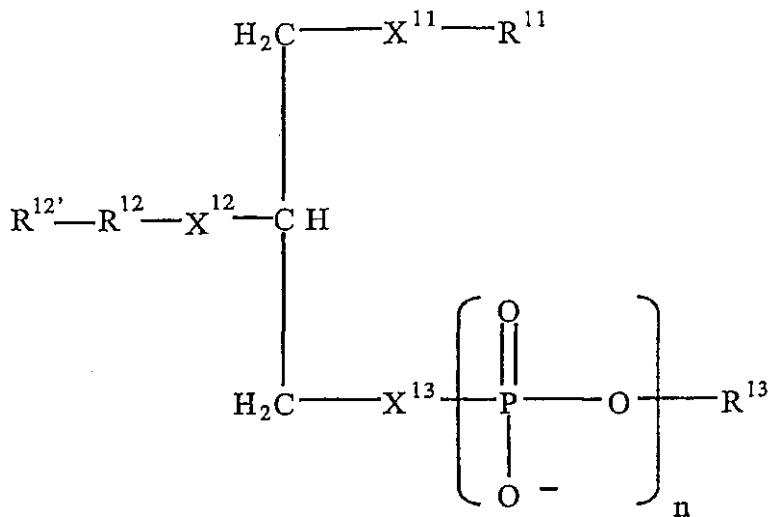
【請求項 2 7】

前記哺乳動物細胞が、神経膠星状細胞又はグリア細胞から成る群から選ばれる細胞である、請求項25に記載の医薬組成物。

【請求項 2 8】

哺乳動物の癌と闘うための医薬組成物であって、以下の式(III)：

【化 1 2】



(III)

{ 式中、

R¹¹ が、(C₁-C₁₆)アルキル、分岐のアルキル、アルケニル又はアルキニルであり；R¹² が、(C₁-C₁₆)アルキル、分岐のアルキル、アルケニル又はアルキニルであり；R^{12'} が、(C₁-C₁₆)アルキル、分岐のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、フェナルキル、又はアルコキシ若しくはヒドロキシ、無水物、あるいは水素であり、但し、R^{12'} がヒドロキシではないとき、それは、場合によりリンカー部分Lを通してX¹²に連結され、そして、場合によりR^{12'} が治療薬により末端で置換され、Lが、-O-、-S-、-NH₂-又は-NHC(O)-であり；X¹¹ が、-O-、-S-、-NH₂-又は-NHC(O)-であり；X¹² が、-O-、-S-、-NH₂-又は-NHC(O)-であり；X¹³ が、-O-、-S-、-CH₂-、無水物又は(C₁-C₁₆)アルコキシであり；

nが、0、1又は2であり；

R¹³ が、治療薬又は-R³N(R⁶)(R⁷)R⁸であり；R³ が、(C₁-C₈)アルキレンであり；そしてR⁶、R⁷及びR⁸が、各々独立に-H、(C₁-C₈)アルキル又は(C₁-C₈)アルコキシである。}

によって表されるに構造を有する化合物、又は医薬として許容されるその塩若しくはそのプロドラッグを、哺乳動物の癌と闘うために有効な量で含む前記医薬組成物。

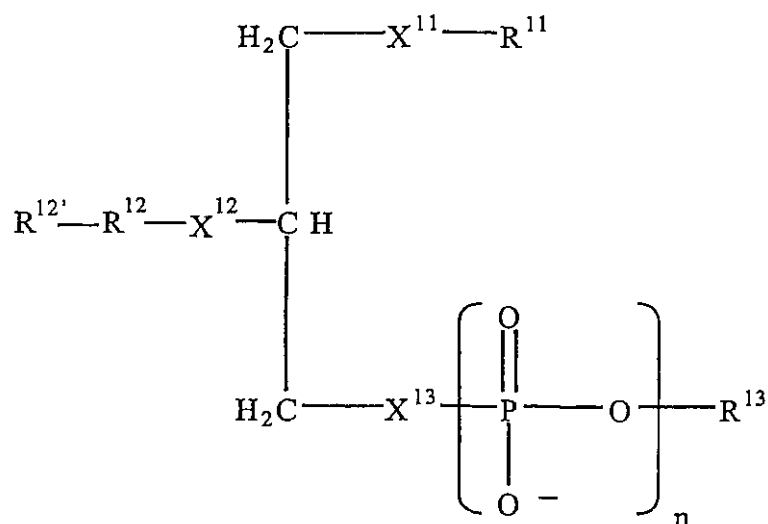
【請求項 29】

前記癌が、癌腫、肉腫、神経芽細胞腫、白血病、リンパ腫、及び固形腫瘍から成る群から選ばれる癌である、請求項28に記載の医薬組成物。

【請求項 30】

哺乳動物の病気の治療用医薬組成物であって、以下の式(III)：

【化 1 3】



(III)

{ 式中、

R¹¹ が、(C₁-C₁₆)アルキル、分岐のアルキル、アルケニル又はアルキニルであり；R¹² が、(C₁-C₁₆)アルキル、分岐のアルキル、アルケニル又はアルキニルであり；R^{12'} が、(C₁-C₁₆)アルキル、分岐のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、フェナルキル、又はアルコキシ若しくはヒドロキシ、無水物、あるいは水素であり、但し、R^{12'} がヒドロキシではないとき、それは、場合によりリンカー部分Lを通してX¹²に連結され、そして、場合によりR^{12'} が治療薬により末端で置換され、Lが、-O-、-S-、-NH₂-又は-NHC(O)-であり；X¹¹ が、-O-、-S-、-NH₂-又は-NHC(O)-であり；X¹² が、-O-、-S-、-NH₂-又は-NHC(O)-であり；X¹³ が、-O-、-S-、-CH₂-、無水物又は(C₁-C₁₆)アルコキシであり；

nが、0、1又は2であり；

R¹³ が、治療薬又は-R³N(R⁶)(R⁷)R⁸であり；R³ が、(C₁-C₈)アルキレンであり；そしてR⁶、R⁷及びR⁸が、各々独立に-H、(C₁-C₈)アルキル又は(C₁-C₈)アルコキシである。}

によって表されるに構造を有する化合物、又は医薬として許容されるその塩若しくはそのプロドラッグを、上記病気を治療するために有効な量で含む前記医薬組成物。

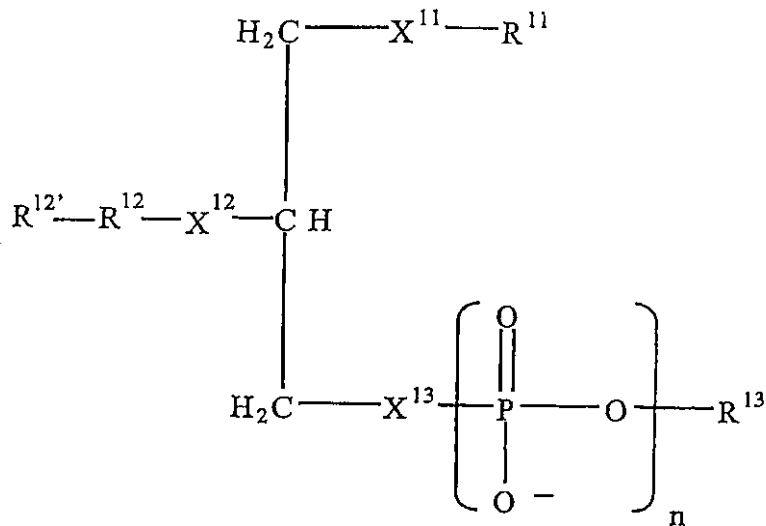
【請求項 3 1】

前記病気が、脳疾患、CNS疾患、リンパ系疾患、生殖系疾患、心疾患、腎臓病、及び肝疾患から成る群から選ばれる病気である、請求項30に記載の医薬組成物。

【請求項 3 2】

化合物及び医薬として許容される担体を含む医薬組成物であって、上記化合物が、以下の式(III)：

【化 1 4】



(III)

{ 式中、

R¹¹ が、(C₁-C₁₆)アルキル、分岐のアルキル、アルケニル又はアルキニルであり；R¹² が、(C₁-C₁₆)アルキル、分岐のアルキル、アルケニル又はアルキニルであり；R^{12'} が、(C₁-C₁₆)アルキル、分岐のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、フェナルキル、又はアルコキシ若しくはヒドロキシ、無水物、あるいは水素であり、但し、R^{12'} がヒドロキシではないとき、それは、場合によりリンカー部分Lを通してX¹²に連結され、そして、場合によりR^{12'} が治療薬により末端で置換され、Lが、-O-、-S-、-NH₂-又は-NHC(O)-であり；X¹¹ が、-O-、-S-、-NH₂-又は-NHC(O)-であり；X¹² が、-O-、-S-、-NH₂-又は-NHC(O)-であり；X¹³ が、-O-、-S-、-CH₂-、無水物又は(C₁-C₁₆)アルコキシであり；

nが、0、1又は2であり；

R¹³ が、治療薬又は-R³N(R⁶)(R⁷)R⁸であり；R³ が、(C₁-C₈)アルキレンであり；そしてR⁶、R⁷及びR⁸が、各々独立に-H、(C₁-C₈)アルキル又は(C₁-C₈)アルコキシである。}

によって表されるの構造を有する化合物であり、さらに医薬として許容されるその塩又はそのプロドラッグのいずれかであってもよい上記医薬組成物。

【請求項 3 3】

式中、

R¹² が、(C₈-C₁₂)アルキル、分岐のアルキル、アルケニル又はアルキニルであり；R^{12'} が、(C₁-C₁₆)フェナルキル、又はアルコキシ若しくはヒドロキシであり、但し、R^{12'} がヒドロキシではないとき、それは場合によりエーテル酸素を通してX¹²に連結され；R¹³ が、-R³N(R⁶)(R⁷)R⁸であり；そしてX¹² が、-O-である、請求項32に記載の医薬組成物。

【請求項 3 4】

前記R^{12'} が、治療薬により末端で置換される、請求項33に記載の医薬組成物。

【請求項 3 5】

前記R^{12'} が、-OCH₂C₆H₅、-OH又は-O₂CCH₂CO₂Hであり、かつ、前記R¹² が、場合により治療薬により末端で置換される、請求項33に記載の医薬組成物。

【請求項36】

前記 $R^{12'}$ が、 $-O_2CCH_2CO_2-$ であり、かつ、前記 R^{12} が、治療薬により末端で置換される、請求項35に記載の医薬組成物。

【請求項37】

前記治療薬が、抗ウイルス剤及び抗癌剤から成る群から選ばれる薬剤を含む、請求項36に記載の医薬組成物。

【請求項38】

前記治療薬が、プロテアーゼ阻害薬、ポリメラーゼ阻害薬、逆転写酵素阻害薬及びヌクレオシド・アナログから成る群から選ばれる薬剤を含む、請求項37に記載の医薬組成物。

【請求項39】

前記抗ウイルス剤が、AZTである、請求項37に記載の医薬組成物。

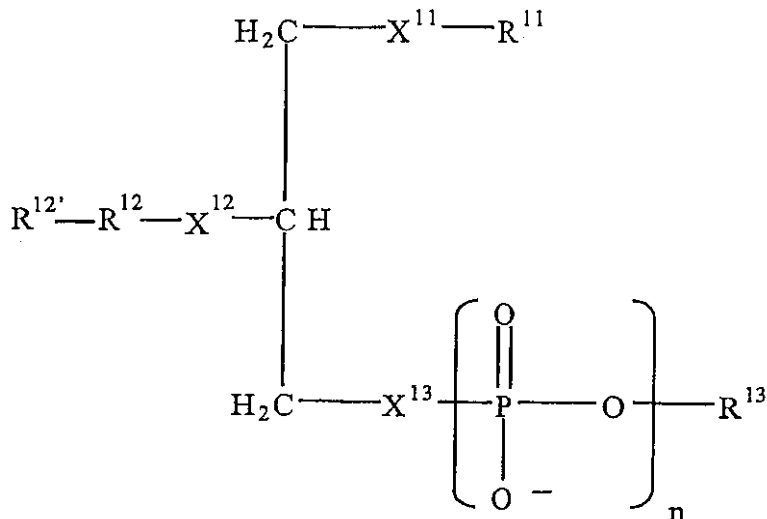
【請求項40】

前記抗癌剤が、ゲムシタピン、ara-C、5-アザシチジン、クラドリピン、フルクララビン、フルオロデオキシウリジン、シトシン・アラビノシド及び6-メルカプトプリンから成る群から選ばれる薬剤である、請求項37に記載の医薬組成物。

【請求項41】

化合物及び医薬として許容される担体を含む医薬組成物であって、上記化合物が、以下の式(III)：

【化15】



(III)

{ 式中、

R^{11} が、 $(C_1 - C_{16})$ アルキル、分岐のアルキル、アルケニル又はアルキニルであり；

R^{12} が、 $(C_1 - C_{16})$ アルキル、分岐のアルキル、アルケニル又はアルキニルであり；

$R^{12'}$ が、 $(C_1 - C_{16})$ フェナルキル、アルコキシ、無水物、又はヒドロキシであり、

但し、 $R^{12'}$ がヒドロキシではないとき、それはエーテル酸素を通して X^{12} に連結され、そして、 $R^{12'}$ が治療薬によって末端で置換され、

X^{11} が、 $-S-$ であり；

X^{12} が、 $-O-$ であり；

X^{13} が、 $-O-$ であり；

R^{13} が、 $-R^3N(R^6)(R^7)R^8$ であり；

R^3 が、 $-CH_2CH_2-$ であり；そして

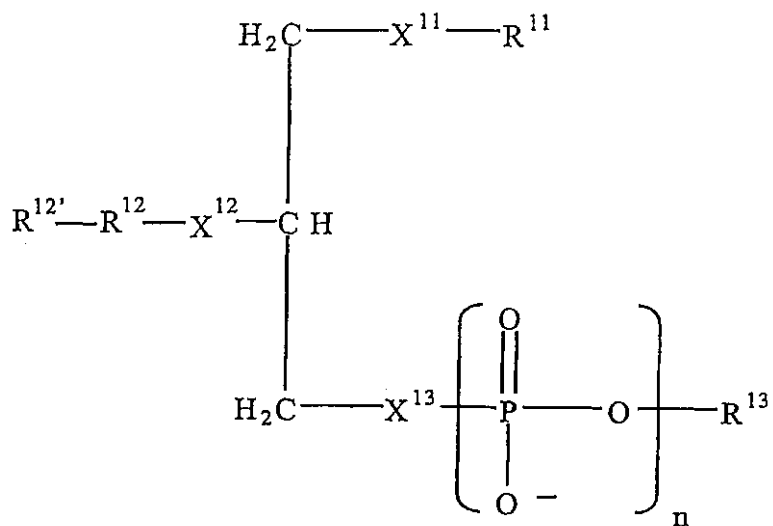
R^6 、 R^7 及び R^8 が、各々独立にメチルである。}によって表されるの構造を有する化合

物であり、さらに医薬として許容されるその塩又はそのプロドラッグのいずれかであってもよい上記医薬組成物。

【請求項 4 2】

化合物及び医薬として許容される担体を含む医薬組成物であって、上記化合物が、以下の式(III)：

【化 1 6】



(III)

{ 式中、

R^{11} が、 $-\text{C}_{12}\text{H}_{25}$ であり；

R^{12} が、 $-(\text{CH}_2)_8$ であり；

$\text{R}^{12'}$ が、 $-\text{O}_2\text{CCH}_2\text{CO}_2\text{AZT}$ であり；

X^{11} が、 $-\text{S}-$ であり；

X^{12} が、 $-\text{O}-$ であり；

X^{13} が、 $-\text{O}-$ であり；

R^{13} が、 $-\text{R}^3\text{N}(\text{R}^6)(\text{R}^7)\text{R}^8$ であり；

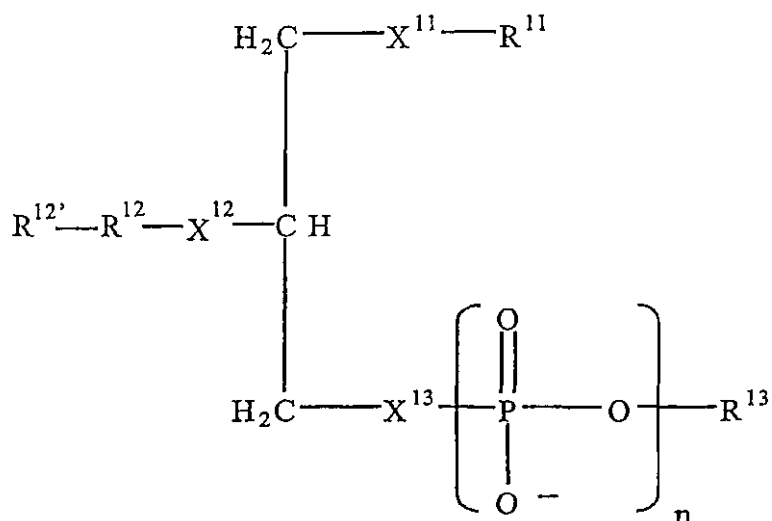
R^3 が、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ であり；そして

R^6 、 R^7 及び R^8 が、各々独立にメチルである。} によって表されるの構造を有する化合物であり、さらに医薬として許容されるその塩又はそのプロドラッグのいずれかであってもよい上記医薬組成物。

【請求項 4 3】

化合物及び医薬として許容される担体を含む医薬組成物であって、上記化合物が、以下の式(III)：

【化 1 7】



(III)

{ 式中、

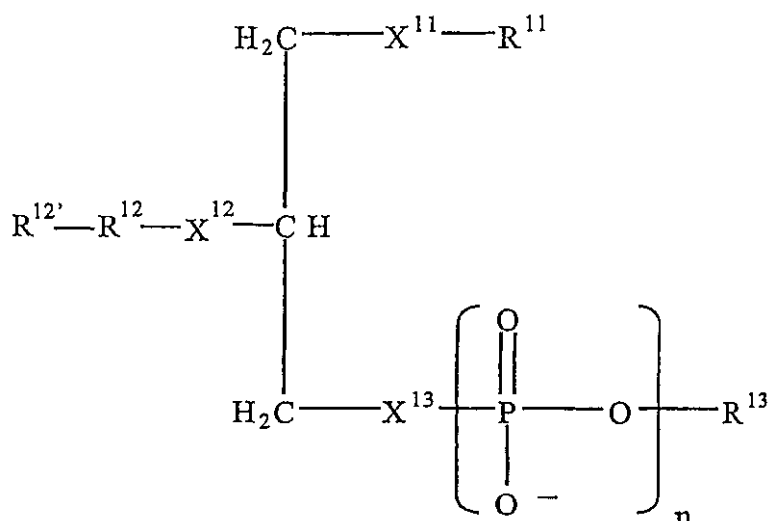
 R^{11} が、 $-\text{C}_{12}\text{H}_{25}$ であり； R^{12} が、 $-(\text{CH}_2)_{10}$ であり； $\text{R}^{12'}$ が、 $-\text{O}_2\text{CCH}_2\text{CO}_2\text{AZT}$ であり； X^{11} が、 $-\text{S}-$ であり； X^{12} が、 $-\text{O}-$ であり； X^{13} が、 $-\text{O}-$ であり； R^{13} が、 $-\text{R}^3\text{N}(\text{R}^6)(\text{R}^7)\text{R}^8$ であり； R^3 が、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ であり；そして

R^6 、 R^7 及び R^8 が、各々独立にメチルである。} によって表されるの構造を有する化合物であり、さらに医薬として許容されるその塩又はそのプロドラッグのいずれかであってもよい上記医薬組成物。

【請求項 4 4】

化合物及び医薬として許容される担体を含む医薬組成物であって、上記化合物が、以下の式 (III)：

【化 1 8】



(III)

{ 式中、

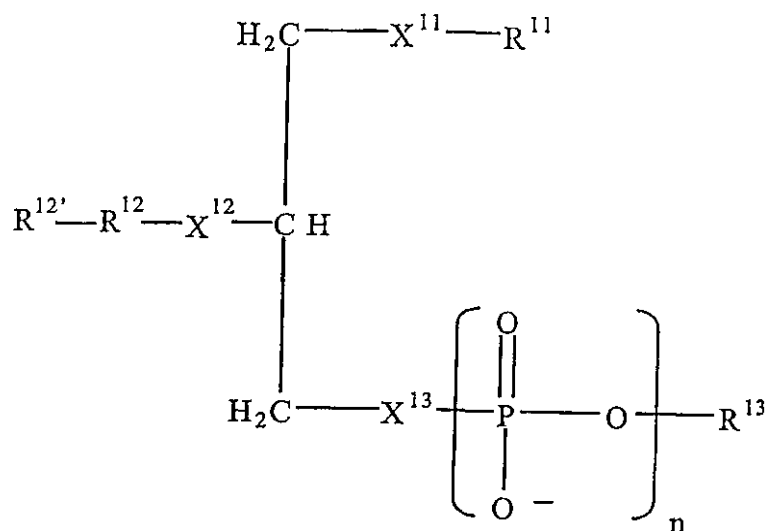
 R^{11} が、 $-\text{C}_{12}\text{H}_{25}$ であり； R^{12} が、 $-(\text{CH}_2)_{12}$ であり； $\text{R}^{12'}$ が、 $-\text{O}_2\text{CCH}_2\text{CO}_2\text{AZT}$ であり； X^{11} が、 $-\text{S}-$ であり； X^{12} が、 $-\text{O}-$ であり； X^{13} が、 $-\text{O}-$ であり； R^{13} が、 $-\text{R}^3\text{N}(\text{R}^6)(\text{R}^7)\text{R}^8$ であり； R^3 が、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ であり；そして

R^6 、 R^7 及び R^8 が、各々独立にメチルである。} によって表されるの構造を有する化合物であり、さらに医薬として許容されるその塩又はそのプロドラッグのいずれかであってもよい上記医薬組成物。

【請求項 4 5】

化合物及び医薬として許容される担体を含む医薬組成物であって、上記化合物が、以下の式 (III)：

【化 19】



(III)

{ 式中、

 R^{11} が、 $-\text{C}_{12}\text{H}_{25}$ であり； R^{12} が、 $-(\text{CH}_2)_{12}$ であり； $\text{R}^{12'}$ が、 $-\text{OH}$ であり； X^{11} が、 $-\text{S}-$ であり； X^{12} が、 $-\text{O}-$ であり； X^{13} が、 $-\text{O}-$ であり； R^{13} が、 $-\text{R}^3\text{N}(\text{R}^6)(\text{R}^7)\text{R}^8$ であり； R^3 が、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ であり；そして

R^6 、 R^7 及び R^8 が、各々独立にメチルである。} によって表されるの構造を有する化合物であり、さらに医薬として許容されるその塩又はそのプロドラッグのいずれかであってもよい上記医薬組成物。