

【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20年4月3日(2008.4.3)

【公表番号】特表2007-525520(P2007-525520A)  
 【公表日】平成19年9月6日(2007.9.6)  
 【年通号数】公開・登録公報2007-034  
 【出願番号】特願2007-501005(P2007-501005)  
 【国際特許分類】

C 0 7 H 17/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 31/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 31/10 (2006.01)  
 A 6 1 P 33/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 31/12 (2006.01)  
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 1/00 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/7052 (2006.01)  
 C 0 7 H 17/08 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/7048 (2006.01)  
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)

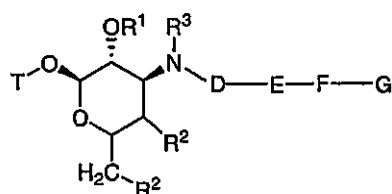
【 F I 】

C 0 7 H 17/00  
 A 6 1 P 31/04  
 A 6 1 P 31/10  
 A 6 1 P 33/00  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 31/12  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 1/00  
 A 6 1 K 31/7052  
 C 0 7 H 17/08 B  
 A 6 1 K 31/7048  
 A 6 1 P 43/00 1 2 3

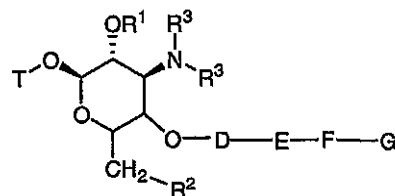
【手続補正書】  
 【提出日】平成20年2月15日(2008.2.15)  
 【手続補正1】  
 【補正対象書類名】特許請求の範囲  
 【補正対象項目名】全文  
 【補正方法】変更  
 【補正の内容】  
 【特許請求の範囲】  
 【請求項1】

次式を有する化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、N - オキシド  
 またはプロドラッグ：

## 【化1】



I



II

または

ここで、

Tは、14員、15員または16員のマクロライドであり、該マクロライドは、大環の環炭素原子によって、連結されている；

R<sup>1</sup>およびR<sup>3</sup>は、別個に、以下からなる群から選択される：(a) H、(b) C<sub>1</sub>-6アルキル基、(c) C<sub>2</sub>-6アルケニル基、(d) C<sub>2</sub>-6アルキニル基、(e) -C(O)R<sup>5</sup>、(f) -C(O)OR<sup>5</sup>、(g) -C(O)-NR<sup>4</sup>R<sup>4</sup>R<sup>4</sup>R<sup>4</sup>、(h) -C(S)R<sup>5</sup>、(i) -C(S)OR<sup>5</sup>、(j) -C(O)SR<sup>5</sup>または(k) -C(S)-NR<sup>4</sup>R<sup>4</sup>R<sup>4</sup>R<sup>4</sup>；

R<sup>2</sup>は、水素または-OR<sup>1 2</sup>である；

Dは、以下からなる群から選択される：

(a) 単結合、(b) C<sub>1</sub>-6アルキル基、(c) C<sub>2</sub>-6アルケニル基；(d) C<sub>2</sub>-6アルキニル基；(e) -C(O)-X-、(f) -C(O)O-X-、(g) -C(O)NR<sup>4</sup>R<sup>4</sup>-X-、(h) -C(=NR<sup>4</sup>)-X-、(i) -C(=NR<sup>4</sup>)O-X-、(j) -C(=NR<sup>4</sup>)N-X-、(k) -SO<sub>2</sub>-X-、(l) -C(NR<sup>4</sup>)NR<sup>4</sup>-X-、(m) -C(S)-X-、(n) -C(S)NR<sup>4</sup>-X-、(o) -C(NR<sup>4</sup>)S-X-または(p) -C(O)S-X-であって、ここで、

i) すぐ上のDの(b)~(d)のいずれかの0個~2個の炭素原子は、必要に応じて、O、S(O)<sub>p</sub>およびNR<sup>4</sup>からなる群から選択される部分で置き換えられ、

ii) すぐ上の該基(b)~(d)の各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上のR<sup>5</sup>基で置換され、

iii) あるいは、R<sup>5</sup>が(b)~(d)上の任意の置換基として存在するとき、R<sup>3</sup>およびR<sup>5</sup>は、それらが結合する原子と一緒に3員~7員環を形成でき、そして

iv) Xは、(aa) C<sub>1</sub>-6アルキル基、(bb) C<sub>2</sub>-6アルケニル基または(cc) C<sub>2</sub>-6アルキニル基からなる群から選択され、ここで、(aa)~(cc)基の各々は、必要に応じて、1個またはそれ以上のR<sup>5</sup>基で置換されている；

Fは、以下からなる群から選択される：

(a) 単結合、(b) C<sub>1</sub>-6アルキル基、(c) C<sub>2</sub>-6アルケニル基、(d) C<sub>2</sub>-6アルキニル基であって、ここで、

i) すぐ上のFの(b)~(d)の0個~2個の炭素原子は、必要に応じて、O、S(O)<sub>p</sub>およびNR<sup>4</sup>からなる群から選択される部分で置き換えられ、

ii) すぐ上のFの(b)~(d)のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上のR<sup>5</sup>基で置換され、そして

iii) すぐ上のFの(b)~(d)のいずれかは、必要に応じて、C<sub>1</sub>-6アルキル-R<sup>5</sup>基で置換されている；

Eは、以下からなる群から選択される：

(a) 3員~10員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、

(b) 3員~10員飽和、不飽和または芳香族炭素環、

(c) -W-[3員~10員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウか

らなる群から選択される]、

(d) - W - [3員~10員飽和、不飽和または芳香族炭素環]、

(e) - C(O) -、(f) - C(O)O -、(g) - C(O)NR<sup>4</sup> -、(h) - C(=NR<sup>4</sup>) -、(i) - C(=NR<sup>4</sup>)O -、(j) - C(=NR<sup>4</sup>)NR<sup>4</sup> -、(k) - OC(O) -、(l) - OC(O)O -、(m) - OC(O)NR<sup>4</sup> -、(n) - NR<sup>4</sup>C(O) -、(o) - NR<sup>4</sup>C(O)O -、(p) - NR<sup>4</sup>C(O)NR<sup>4</sup> -、(q) - NR<sup>4</sup>C(=NR<sup>4</sup>)NR<sup>4</sup> -、(r) - S(O)<sub>p</sub> -、(s) - NR<sup>4</sup>S(O)<sub>2</sub> -、(t) - S(O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、(u) - C(N-OR<sup>4</sup>) -、(v) - CH<sub>2</sub> -、(w) - C(N-NR<sup>4</sup>R<sup>4</sup>) -、(x) - C(S)NR<sup>4</sup> -、(y) - NR<sup>4</sup>C(S) -、(z) - C(S)O -、または(aa) - OC(S) - であって、ここで、

i) すぐ上の(a)~(d)のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上のR<sup>5</sup>基で置換されている；そして

ii) Wは、以下からなる群から選択される：

(aa) - OCO -、(bb) - OC(O)O -、(cc) - OC(O)NR<sup>4</sup> -、(dd) - NR<sup>4</sup>C(O)O -、(ee) - OCNOR<sup>4</sup> -、(ff) - NR<sup>4</sup>-C(O)O -、(gg) - C(S)(NR<sup>4</sup>) -、(hh) - NR<sup>4</sup> -、(ii) - OC(S)O -、(jj) - OC(S)NR<sup>4</sup> -、(kk) - NR<sup>4</sup>C(S)O -、(ll) - OC(S)NOR<sup>4</sup> -、(mm) - C(S)O -、(nn) -、OC(S) -、(oo) - C(O) -、(pp) - C(O)O -、(qq) - C(O)NR<sup>4</sup> -、(rr) - C(=NR<sup>4</sup>) -、(ss) - C(=NR<sup>4</sup>)O -、(tt) - C(=NR<sup>4</sup>)NR<sup>4</sup> -、(uu) - OC(O) -、(vv) - OC(O)O -、(ww) - OC(O)NR<sup>4</sup> -、(xx) - NR<sup>4</sup>C(O) -、(yy) - NR<sup>4</sup>C(O)O -、(zz) - NR<sup>4</sup>C(O)NR<sup>4</sup> -、(aaa) - NR<sup>4</sup>C(=NR<sup>4</sup>)NR<sup>4</sup> -、(bbb) - S(O)<sub>p</sub> -、(ccc) - NR<sup>4</sup>S(O)<sub>2</sub> -、(ddd) - S(O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、(eee) - C(N-OR<sup>4</sup>) -、(fff) - C(N-NR<sup>4</sup>R<sup>4</sup>) -、(ggg) - C(S)NR<sup>4</sup> - または(hhh) - NR<sup>4</sup>C(S) -；

Gは、以下からなる群から選択される：(a) B' および (b) B' - Z - B'' であって、ここで、

i) 各B' およびB'' は、別個に、以下からなる群から選択される：(aa) アリール基、(bb) ヘテロアリール基、(cc) ピアリール基、(dd) 縮合二環式または三環式飽和、不飽和または芳香族環系であって、該芳香族環系は、必要に応じて、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、(ee) 3員~10員飽和または不飽和複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、(ff) 3員~10員飽和または不飽和炭素環であって、ここで、各(aa)~(ff)は、必要に応じて、1個またはそれ以上のR<sup>1</sup>基で置換されている；そして

ii) Zは、以下からなる群から選択される：(aa) 単結合、(bb) C<sub>1-2</sub>アルキル基、(cc) C<sub>2</sub>アルケニル基、(dd) C<sub>2</sub>アルキニル基、(ee) - C(O) -、(ff) - C(O)O -、(gg) - C(O)NR<sup>4</sup> -、(hh) - C(=NR<sup>4</sup>) -、(ii) - C(=NR<sup>4</sup>)O -、(jj) - C(=NR<sup>4</sup>)NR<sup>4</sup> -、(kk) - S(O)<sub>p</sub> -、(ll) - OC(O) -、(mm) - C(S) -、(nn) - C(S)NR<sup>4</sup> -、(oo) - C(NR<sup>4</sup>)S -、(pp) - C(O)S -、(qq) - O -、(rr) - NR<sup>4</sup> -、(ss) - NR<sup>4</sup>C(O) -、(tt) - OC(NR<sup>4</sup>) -、(uu) - NC(NR<sup>4</sup>) -、(vv) - C(S)O -、(ww) - SC(O) - または(xx) - OC(S) -；

R<sup>4</sup>は、各存在において、別個に、以下からなる群から選択される：

(a) H、(b) C<sub>1-6</sub>アルキル基、(c) C<sub>2-6</sub>アルケニル基、(d) C<sub>2-6</sub>アルキニル基、(e) C<sub>6-10</sub>飽和、不飽和または芳香族炭素環、(f) 3員~12員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、(g

) - C(O) - C<sub>1-6</sub> アルキル、(h) - C(O) - C<sub>2-6</sub> アルケニル、(i) - C(O) - C<sub>2-6</sub> アルキニル、(j) - C(O) - C<sub>6-10</sub> 飽和、不飽和または芳香族炭素環、(k) - C(O) - 3員~12員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、(l) - C(O)O - C<sub>1-6</sub> アルキル、(m) - C(O)O - C<sub>2-6</sub> アルケニル、(n) - C(O)O - C<sub>2-6</sub> アルキニル、(o) - C(O)O - C<sub>6-10</sub> 飽和、不飽和または芳香族炭素環、p) - C(O)O - 3員~12員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、および q) - C(O)NR<sup>6</sup>R<sup>6</sup> であって、

ここで、(b)~(p)のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上のR<sup>5</sup>基で置換されている、

あるいは、NR<sup>4</sup>R<sup>4</sup>は、R<sup>4</sup>基が結合する窒素原子を含有する3員~7員飽和、不飽和または芳香環を形成し、ここで、該環は、必要に応じて、該R<sup>4</sup>基が結合する窒素原子以外の位置で、1個またはそれ以上の部分で置換されており、該部分は、O、S(O)<sub>p</sub>、NおよびNR<sup>8</sup>からなる群から選択される；

R<sup>5</sup>は、以下からなる群から選択される：

(a) R<sup>7</sup>、(b) C<sub>1-8</sub> アルキル基、(c) C<sub>2-8</sub> アルケニル基、(d) C<sub>2-8</sub> アルキニル基、(e) C<sub>3-12</sub> 飽和、不飽和または芳香族炭素環、および(f) 3員~12員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択されるか、または2個のR<sup>5</sup>基は、同じ炭素原子上に存在するとき、それらが結合する炭素原子と一緒にあって、スピロ3員~6員炭素環または複素環を形成でき、該炭素環または複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される；

ここで、すぐ上の(b)~(f)のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上のR<sup>7</sup>基で置換されている；

R<sup>6</sup>は、各存在において、別個に、以下からなる群から選択される：

(a) H、(b) C<sub>1-6</sub> アルキル基、(c) C<sub>2-6</sub> アルケニル基、(d) C<sub>2-6</sub> アルキニル基、(e) C<sub>3-10</sub> 飽和、不飽和または芳香族炭素環、および(f) 3員~10員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択され、ここで、(b)~(f)のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上の部分で置換されており、該部分は、以下からなる群から選択される：

(aa) カルボニル基、(bb) ホルミル基、(cc) F、(dd) Cl、(ee) Br、(ff) I、(gg) CN、(hh) NO<sub>2</sub>、(ii) - OR<sup>8</sup>、(jj) - S(O)<sub>p</sub>R<sup>8</sup>、(kk) - C(O)R<sup>8</sup>、(ll) - C(O)OR<sup>8</sup>、(mm) - OC(O)R<sup>8</sup>、(nn) - C(O)NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>、(oo) - OC(O)NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>、(pp) - C(=NR<sup>8</sup>)R<sup>8</sup>、(qq) - C(R<sup>8</sup>)(R<sup>8</sup>)OR<sup>8</sup>、(rr) - C(R<sup>8</sup>)<sub>2</sub>O C(O)R<sup>8</sup>、(ss) - C(R<sup>8</sup>)(OR<sup>8</sup>)(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>、(tt) - NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>、(uu) - NR<sup>8</sup>OR<sup>8</sup>、(vv) - NR<sup>8</sup>C(O)R<sup>8</sup>、(ww) - NR<sup>8</sup>C(O)OR<sup>8</sup>、(xx) - NR<sup>8</sup>C(O)NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>、(yy) - NR<sup>8</sup>S(O)<sub>r</sub>R<sup>8</sup>、(zz) - C(OR<sup>8</sup>)(OR<sup>8</sup>)R<sup>8</sup>、(ab) - C(R<sup>8</sup>)<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup> (ac) = NR<sup>8</sup>、(ad) - C(S)NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>、(ae) - NR<sup>8</sup>C(S)R<sup>8</sup>、(af) - OC(S)NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>、(ag) - NR<sup>8</sup>C(S)OR<sup>8</sup>、(ah) - NR<sup>8</sup>C(S)NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>、(ai) - SC(O)R<sup>8</sup>、(aj) C<sub>1-8</sub> アルキル基、(ak) C<sub>2-8</sub> アルケニル基、(al) C<sub>2-8</sub> アルキニル基、(am) C<sub>1-8</sub> アルコキシ基、(an) C<sub>1-8</sub> アルキルチオ基、(ao) C<sub>1-8</sub> アシル基、(ap) - CF<sub>3</sub>、(aq) - SCF<sub>3</sub>、(ar) C<sub>3-10</sub> 飽和、不飽和または芳香族炭素環、および(as) 3員~10員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上の

ヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、

あるいは、 $\text{NR}^6\text{R}^6$  は、 $\text{R}^6$  基が結合する窒素原子を含有する 3 員 ~ 10 員飽和、不飽和または芳香環を形成し、ここで、該環は、必要に応じて、該  $\text{R}^6$  基が結合する窒素原子以外の位置で、1 個またはそれ以上の部分で置換されており、該部分は、 $\text{O}$ 、 $\text{S}(\text{O})_p$ 、 $\text{N}$  および  $\text{NR}^8$  からなる群から選択される；

あるいは、 $\text{CR}^6\text{R}^6$  は、カルボニル基を形成する；

$\text{R}^7$  は、各存在において、以下からなる群から選択される：

(a)  $\text{H}$ 、(b)  $=\text{O}$ 、(c)  $\text{F}$ 、(d)  $\text{Cl}$ 、(e)  $\text{Br}$ 、(f)  $\text{I}$ 、(g)  $-\text{CF}_3$ 、(h)  $-\text{CN}$ 、(i)  $-\text{N}_3$ 、(j)  $-\text{NO}_2$ 、(k)  $-\text{NR}^6(\text{CR}^6\text{R}^6)_t\text{R}^9$ 、(l)  $-\text{OR}^9$ 、(m)  $-\text{S}(\text{O})_p\text{C}(\text{R}^6\text{R}^6)_t\text{R}^9$ 、(n)  $-\text{C}(\text{O})(\text{CR}^6\text{R}^6)_t\text{R}^9$ 、(o)  $-\text{OC}(\text{O})(\text{CR}^6\text{R}^6)_t\text{R}^9$ 、(p)  $-\text{SC}(\text{O})(\text{CR}^6\text{R}^6)_t\text{R}^9$ 、(q)  $-\text{C}(\text{O})\text{O}(\text{CR}^6\text{R}^6)_t\text{R}^9$ 、(r)  $-\text{NR}^6\text{C}(\text{O})(\text{CR}^6\text{R}^6)_t\text{R}^9$ 、(s)  $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^6(\text{CR}^6\text{R}^6)_t\text{R}^9$ 、(t)  $-\text{C}(=\text{NR}^6)(\text{CR}^6\text{R}^6)_t\text{R}^9$ 、(u)  $-\text{C}(=\text{NNR}^6\text{R}^6)(\text{CR}^6\text{R}^6)_t\text{R}^9$ 、(v)  $-\text{C}(=\text{NNR}^6\text{C}(\text{O})\text{R}^6)(\text{CR}^6\text{R}^6)_t\text{R}^9$ 、(w)  $-\text{C}(=\text{NOR}^9)(\text{CR}^6\text{R}^6)_t\text{R}^9$ 、(x)  $-\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{O}(\text{CR}^6\text{R}^6)_t\text{R}^9$ 、(y)  $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^6(\text{CR}^6\text{R}^6)_t\text{R}^9$ 、(z)  $-\text{NR}^6\text{C}(\text{O})\text{NR}^6(\text{CR}^6\text{R}^6)_t\text{R}^9$ 、(aa)  $-\text{NR}^6\text{S}(\text{O})_p(\text{CR}^6\text{R}^6)_t\text{R}^9$ 、(bb)  $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^6(\text{CR}^6\text{R}^6)_t\text{R}^9$ 、(cc)  $-\text{NR}^6\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^6(\text{CR}^6\text{R}^6)_t\text{R}^9$ 、(dd)  $-\text{NR}^6\text{R}^6$ 、(ee)  $-\text{NR}^6(\text{CR}^6\text{R}^6)$ 、(ff)  $-\text{OH}$ 、(gg)  $-\text{NR}^6\text{R}^6$ 、(hh)  $-\text{OCH}_3$ 、(ii)  $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^6$ 、(jj)  $-\text{NC}(\text{O})\text{R}^6$ 、(kk)  $\text{C}_{1-6}$  アルキル基、(ll)  $\text{C}_{2-6}$  アルケニル基、(mm)  $\text{C}_{2-6}$  アルキニル基、(nn)  $-\text{C}_{3-10}$  飽和、不飽和または芳香族炭素環、および (oo) 3 員 ~ 10 員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1 個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択され、ここで、(kk) ~ (oo) のいずれかは、必要に応じて、1 個またはそれ以上の  $\text{R}^9$  基で置換されている；

あるいは、2 個の  $\text{R}^7$  基は、 $-\text{O}(\text{CH}_2)_u\text{O}-$  を形成し得る；

$\text{R}^8$  は、以下からなる群から選択される：

(a)  $\text{R}^5$ 、(b)  $\text{H}$ 、(c)  $\text{C}_{1-6}$  アルキル基、(d)  $\text{C}_{2-6}$  アルケニル基、(e)  $\text{C}_{2-6}$  アルキニル基、(f)  $\text{C}_{3-10}$  飽和、不飽和または芳香族炭素環、(g) 3 員 ~ 10 員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1 個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、(h)  $-\text{C}(\text{O})-\text{C}_{1-6}$  アルキル、(i)  $-\text{C}(\text{O})-\text{C}_{1-6}$  アルケニル、(j)  $-\text{C}(\text{O})-\text{C}_{1-6}$  アルキニル、(k)  $-\text{C}(\text{O})-\text{C}_{3-10}$  飽和、不飽和または芳香族炭素環、および (l)  $-\text{C}(\text{O})-\text{C}_{3-10}$  飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1 個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択され、

ここで、(c) ~ (k) のいずれかは、必要に応じて、1 個またはそれ以上の部分で置換されており、該部分は、以下からなる群から選択される：(aa)  $\text{H}$ 、(bb)  $\text{F}$ 、(cc)  $\text{Cl}$ 、(dd)  $\text{Br}$ 、(ee)  $\text{I}$ 、(ff)  $\text{CN}$ 、(gg)  $\text{NO}_2$ 、(hh)  $\text{OH}$ 、(ii)  $\text{NH}_2$ 、(jj)  $\text{NH}(\text{C}_{1-6}$  アルキル)、(kk)  $\text{N}(\text{C}_{1-6}$  アルキル) $_2$ 、(ll)  $\text{C}_{1-6}$  アルコキシ基、(mm) アリール基、(nn) 置換アリール基、(oo) ヘテロアリール基、(pp) 置換ヘテロアリール基、および qq)  $\text{C}_{1-6}$  アルキル基であって、該アルキル基は、必要に応じて、1 個またはそれ以上の部分で置換されており、該部分は、アリール基、置換アリール基、ヘテロアリール基、置換ヘテロアリール基、 $\text{F}$ 、 $\text{Cl}$ 、 $\text{Br}$ 、 $\text{I}$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{SCF}_3$  および  $\text{OH}$  からなる群から選択される；

$\text{R}^9$  は、各存在において、別個に、以下からなる群から選択される：

(a)  $R^{10}$ 、(b)  $C_{1-6}$  アルキル基、(c)  $C_{2-6}$  アルケニル基、(d)  $C_{2-6}$  アルキニル基、e)  $C_{3-10}$  飽和、不飽和または芳香族炭素環、および f) 3員~10員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択され、ここで、(b)~(f)のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上の  $R^{10}$  基で置換されている；

$R^{10}$  は、各存在において、別個に、以下からなる群から選択される：

(a) H、(b) = O、(c) F、(d) Cl、(e) Br、(f) I、(g) - CF<sub>3</sub>、(h) - CN、(i) - NO<sub>2</sub>、(j) - NR<sup>6</sup>R<sup>6</sup>、(k) - OR<sup>6</sup>、(l) - S(O)<sub>p</sub>R<sup>6</sup>、(m) - C(O)R<sup>6</sup>、(n) - C(O)OR<sup>6</sup>、(o) - OC(O)R<sup>6</sup>、(p) NR<sup>6</sup>C(O)R<sup>6</sup>、(q) - C(O)NR<sup>6</sup>R<sup>6</sup>、(r) - C(=NR<sup>6</sup>)R<sup>6</sup>、(s) - NR<sup>6</sup>C(O)NR<sup>6</sup>R<sup>6</sup>、(t) - NR<sup>6</sup>S(O)<sub>p</sub>R<sup>6</sup>、(u) - S(O)<sub>p</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>6</sup>、(v) - NR<sup>6</sup>S(O)<sub>p</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>6</sup>、(w)  $C_{1-6}$  アルキル基、(x)  $C_{2-6}$  アルケニル基、(y)  $C_{2-6}$  アルキニル基、(z)  $C_{3-10}$  飽和、不飽和または芳香族炭素環、および (aa) 3員~10員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択され、

ここで、(w)~(aa)のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上の部分で置換されており、該部分は、 $R^6$ 、F、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、-OR<sup>6</sup>、-NH<sub>2</sub>、-NH( $C_{1-6}$  アルキル)、-N( $C_{1-6}$  アルキル)<sub>2</sub>、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルチオ基、および  $C_{1-6}$  アシル基からなる群から選択される；

$R^{11}$  は、各存在において、別個に、以下からなる群から選択される：

(a) カルボニル基、(b) ホルミル基、(c) F、(d) Cl、(e) Br、(f) I、(g) CN、(h) NO<sub>2</sub>、(i) OR<sup>8</sup>、(j) - S(O)<sub>p</sub>R<sup>8</sup>、(k) - C(O)R<sup>8</sup>、(l) - C(O)OR<sup>8</sup>、(m) - OC(O)R<sup>8</sup>、(n) - C(O)NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>、(o) - OC(O)NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>、(p) - C(=NR<sup>8</sup>)R<sup>8</sup>、(q) - C(R<sup>8</sup>)(R<sup>8</sup>)OR<sup>8</sup>、(r) - C(R<sup>8</sup>)<sub>2</sub>OC(O)R<sup>8</sup>、(s) - C(R<sup>8</sup>)(OR<sup>8</sup>)(CH<sub>2</sub>)<sub>r</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>、(t) - NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>、(u) - NR<sup>8</sup>OR<sup>8</sup>、(v) - NR<sup>8</sup>C(O)R<sup>8</sup>、(w) - NR<sup>8</sup>C(O)OR<sup>8</sup>、(x) - NR<sup>8</sup>C(O)NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>、(y) - NR<sup>8</sup>S(O)<sub>r</sub>R<sup>8</sup>、(z) - C(OR<sup>8</sup>)(OR<sup>8</sup>)R<sup>8</sup>、(aa) - C(R<sup>8</sup>)<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>、(bb) = NR<sup>8</sup>、(cc) - C(S)NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>、(dd) - NR<sup>8</sup>C(S)R<sup>8</sup>、(ee) - OC(S)NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>、(ff) - NR<sup>8</sup>C(S)OR<sup>8</sup>、(gg) - NR<sup>8</sup>C(S)NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>、(hh) - SC(O)R<sup>8</sup>、(ii)  $C_{1-8}$  アルキル基、(jj)  $C_{2-8}$  アルケニル基、(kk)  $C_{2-8}$  アルキニル基、(ll)  $C_{1-8}$  アルコキシ基、(mm)  $C_{1-8}$  アルキルチオ基、(nn)  $C_{1-8}$  アシル基、(oo)  $C_{3-10}$  飽和、不飽和または芳香族炭素環、および (pp) 3員~10員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択され、ここで、(ii)~(kk)は、必要に応じて、1個またはそれ以上の  $R^5$  基で置換されている；

$R^{12}$  は、以下からなる群から選択される：

(a) H、(b)  $C_{1-6}$  アルキル基、(c)  $C_{2-6}$  アルケニル基、(d)  $C_{2-6}$  アルキニル基、(e) - C(O)R<sup>5</sup>、(f) - C(O)OR<sup>5</sup>、(g) - C(O)NR<sup>4</sup>R<sup>4</sup>R<sup>4</sup>R<sup>4</sup>、(h) - C(S)R<sup>5</sup>、(i) - C(S)OR<sup>5</sup>、(j) - C(O)SR<sup>5</sup>、(k) - C(S)NR<sup>4</sup>R<sup>4</sup>R<sup>4</sup>R<sup>4</sup>、(l)  $C_{3-10}$  飽和、不飽和または芳香族炭素環、または (m) 3員~10員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択され、(n) - ( $C_{1-6}$  アルキル) -  $C_{3-10}$  飽和、不飽和または芳香族炭素環、または (o) - ( $C_{1-6}$  アルキル) - 3員~10員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択され、

ここで、(a) ~ (d) および (1) ~ (o) は、必要に応じて、1個またはそれ以上の R<sup>5</sup> 基で置換されている；

p は、各存在において、0、1または2である；

r は、各存在において、0、1または2である；

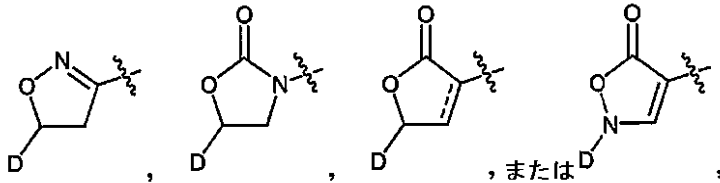
t は、各存在において、0、1または2である；

u は、各存在において、1、2、3または4である；

但し、

i) T が 14員または 15員マクロライドであるとき、D - E は、

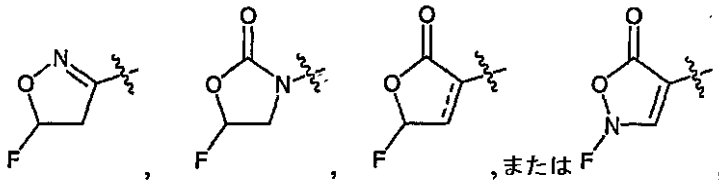
【化 2】



ではなく

ii) T が 14員または 15員マクロライドであるとき、F - B' は、

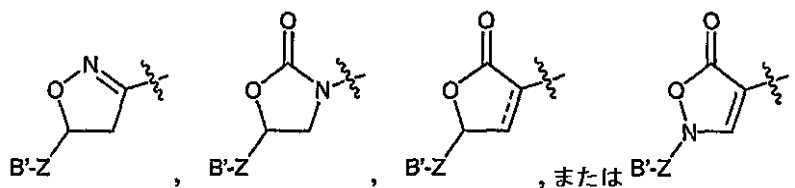
【化 3】



ではなく、

iii) T が 14員または 15員マクロライドであるとき、B' - Z - B'' は、

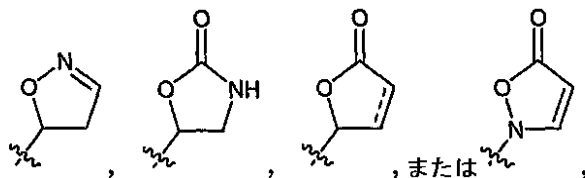
【化 4】



ではなく、

iv) T が 14員または 15員マクロライドであるとき、R<sup>1 1</sup> は、

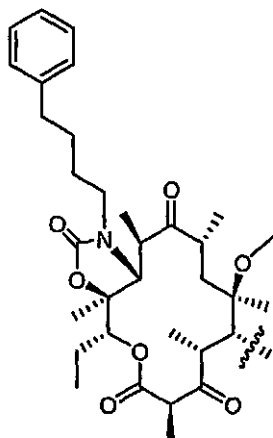
【化 5】



ではなく、

v) 該化合物が式 I を有し、そして T が、

## 【化6】



であるとき、Dは、単結合または  $-CH_2-$  ではなく、

v i ) 該化合物が式 I を有し、そしてTが14員または15員マクロライドであるとき、 $-D-E-F-$  は、 $-CH_2-$  ではなく、

v i i ) 該化合物が式 I であり、そしてTが14員または15員マクロライドであるとき、 $-D-E-F-G-$  は、以下の表で列挙した化学部分から選択される化学部分ではない、化合物：

## 【化7】

表 A


そして

v i i i ) 該化合物が式 I I を有し、そしてTが16員マクロライドであるとき、

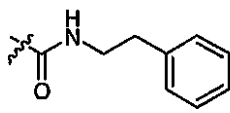
i .  $-D-E-$  は、その単量体状炭素によって結合されたグリコシドではなく、

i i .  $-D-E-F-G$  は、 $C_1 \sim 4$  (アルキル)、 $C_2 \sim 4$  (アルケニル) または  $C_2 \sim 4$  (アルキニル) 鎖でなく、該鎖は、5員~10員単環式または二環式炭素環または複素環に結合されているか、または5員または6員炭素環または複素環に結合されており、該5員または6員炭素環または複素環は、さらに、5員または6員炭素環または複素環に結合されており、該炭素環または複素環のいずれかは、必要に応じて、( a a ) - O H、( b b ) - F、( c c ) - C l、( d d ) - I および ( e e ) - N O <sub>2</sub> からなる群から選択される1個またはそれ以上の基で置換されている、そして

i i i .  $-D-E-F-G-$  は、表 B で列挙した化学部分から選択される化学部分ではない、化合物：

【化 8】

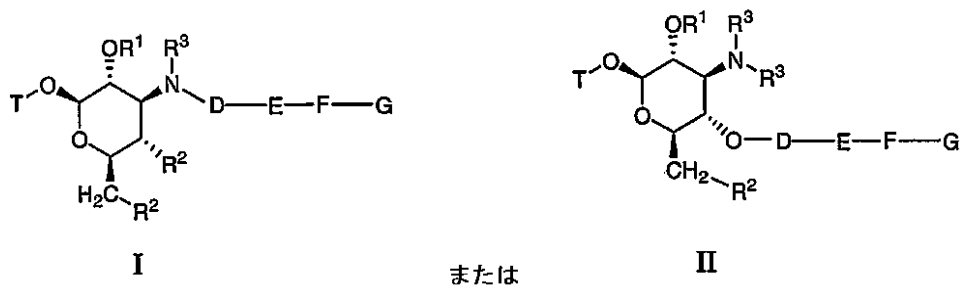
表 B

	<p>-(t-ブトキシカルボキシ)-3-(3-キノリル)</p>
---	----------------------------------

【請求項 2】

次式を有するか、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、N - オキシドまたはプロドラッグである、請求項 1 に記載の化合物：

【化 9】

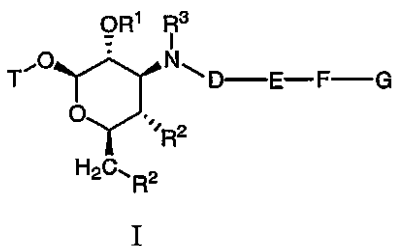


ここで、T、D、E、F、G、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は、請求項 1 に記載したとおりである、  
化合物。

【請求項 3】

次式を有するか、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、N - オキシドまたはプロドラッグである、請求項 1 または 2 に記載の化合物：

【化 10】

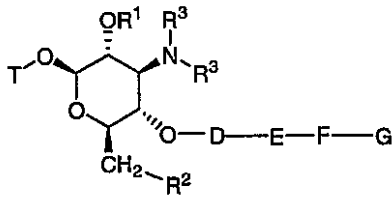


ここで、T、D、E、F、G、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は、請求項 1 に記載したとおりである、  
化合物。

【請求項 4】

次式を有するか、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、N - オキシドまたはプロドラッグである、請求項 1 または 2 に記載の化合物：

## 【化 1 1】



## II

ここで、T、D、E、F、G、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>は、請求項1に記載したとおりである、

化合物。

## 【請求項5】

Tが、大環の環炭素原子によって連結された14員または15員マクロライドである、請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項6】

Gが、B'である、請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項7】

B'が、以下からなる群から選択される、請求項6に記載の化合物：(a)アリール基、(b)ヘテロアリール基、(c)ピアリール基、および(d)縮合二環式または三環式不飽和または芳香族環系であって、該環系は、必要に応じて、1個またはそれ以上のカルボニル基および1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択され、ここで、各(a)～(d)は、必要に応じて、1個またはそれ以上のR<sup>1</sup>基で置換されている、

化合物。

## 【請求項8】

Eが、以下である、請求項6に記載の化合物：

(a) 3員～10員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、(b) 3員～10員飽和、不飽和または芳香族炭素環、(c) -W-[3員～10員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される]、(d) -W-[3員～10員飽和、不飽和または芳香族炭素環]、(e) -C(O)-、(f) -C(O)O-、(g) -C(O)NR<sup>4</sup>-、(h) -C(=NR<sup>4</sup>)-、(i) -C(=NR<sup>4</sup>)O-、(j) -C(=NR<sup>4</sup>)NR<sup>4</sup>-、(k) -OC(O)-、(l) -OC(O)O-、(m) -OC(O)NR<sup>4</sup>-、(n) -NR<sup>4</sup>C(O)-、(o) -NR<sup>4</sup>C(O)O-、(p) -NRC(O)NR<sup>4</sup>-、(q) -NR<sup>4</sup>C(=NR<sup>4</sup>)NR<sup>4</sup>-、(r) -S(O)<sub>p</sub>-、(s) -NR<sup>4</sup>S(O)<sub>2</sub>-、(t) -S(O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>-、(u) -C(N-OR<sup>4</sup>)-、(v) -C(N-NR<sup>4</sup>R<sup>4</sup>)-、(w) -C(S)NR<sup>4</sup>-、(x) -NRC(S)-、(y) -C(S)O-、または(z) -OC(S)-であって、ここで、

i) すぐ上の(a)～(d)のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上のR<sup>5</sup>基で置換されている；そして

ii) Wは、以下からなる群から選択される：

(aa) -OCO-、(bb) -OC(O)O-、(cc) -OC(O)NR<sup>4</sup>-、(dd) -NR<sup>4</sup>C(O)O-、(ee) -OCNOR<sup>4</sup>-、(ff) -NR<sup>4</sup>-C(O)O-、(gg) -C(S)(NR<sup>4</sup>)-、(hh) -NR<sup>4</sup>-、(ii) -OC(S)O-、(jj) -OC(S)NR<sup>4</sup>-、(kk) -NR<sup>4</sup>C(S)O-、(ll) -OC(S)NOR<sup>4</sup>-、(mm) -C(S)O-、(nn) -OC(S)-、(oo) -C(

O) -、(pp) - C(O)O -、(qq) - C(O)NR<sup>4</sup> -、(rr) - C(=NR<sup>4</sup>) -、(ss) - C(=NR<sup>4</sup>)O -、(tt) - C(=NR<sup>4</sup>)NR<sup>4</sup> -、(uu) - OC(O) -、(vv) - OC(O)O -、(ww) - OC(O)NR<sup>4</sup> -、(xx) - NR<sup>4</sup>C(O) -、(yy) - NR<sup>4</sup>C(O)O -、(zz) - NR<sup>4</sup>C(O)NR<sup>4</sup> -、(aaa) - NR<sup>4</sup>C(=NR<sup>4</sup>)NR<sup>4</sup> -、(bbb) - S(O)<sub>p</sub> -、(ccc) - NR<sup>4</sup>S(O)<sub>2</sub> -、(ddd) - S(O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、(eee) - C(N-OR<sup>4</sup>) -、(fff) - C(N-NR<sup>4</sup>R<sup>4</sup>) -、(ggg) - C(S)NR<sup>4</sup> - または (hhh) - NR<sup>4</sup>C(S) -。

【請求項 9】

Dが、(a) C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル基、(b) C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル基および(c) C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル基からなる群から選択され、ここで、

i) すぐ上のDの(a) ~ (c)のいずれかにおける0個 ~ 2個の炭素原子が、必要に応じて、O、S(O)<sub>p</sub> およびNR<sup>4</sup> からなる群から選択される部分で置き換えられ、

ii) すぐ上のDの(a) ~ (c)のいずれかが、必要に応じて、1個またはそれ以上のR<sup>5</sup> 基で置換されている；そして

Fが、(a) 単結合、(b) C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル基、(c) C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル基および(d) C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル基からなる群から選択され、ここで、

i) すぐ上のFの(b) ~ (d)のいずれかにおける0個 ~ 2個の炭素原子が、必要に応じて、O、S(O)<sub>p</sub> およびNR<sup>4</sup> からなる群から選択される部分で置き換えられている；

ii) すぐ上のFの(b) ~ (d)のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上のR<sup>5</sup> 基で置換されている；そして

iii) すぐ上のFの(b) ~ (d)のいずれかは、必要に応じて、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル - R<sup>5</sup> で置換されている、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 10】

Eが、以下からなる群から選択される、請求項 9 に記載の化合物：

(a) 3員 ~ 10員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、

(b) 3員 ~ 10員飽和、不飽和または芳香族炭素環、

(c) -W- [ 3員 ~ 10員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される ]、

(d) -W- [ 3員 ~ 10員飽和、不飽和または芳香族炭素環 ]、

(e) - C(O) -、(f) - C(O)O -、(g) - C(O)NR<sup>4</sup> -、(h) - C(=NR<sup>4</sup>) -、(i) - C(=NR<sup>4</sup>)O -、(j) - C(=NR<sup>4</sup>)NR<sup>4</sup> -、(k) - OC(O) -、(l) - OC(O)O -、(m) - OC(O)NR<sup>4</sup> -、(n) - NR<sup>4</sup>C(O) -、(o) - NR<sup>4</sup>C(O)O -、(p) - NR<sup>4</sup>C(O)NR<sup>4</sup> -、(q) - NR<sup>4</sup>C(=NR<sup>4</sup>)NR<sup>4</sup> -、(r) - S(O)<sub>p</sub> -、(s) - NR<sup>4</sup>S(O)<sub>2</sub> -、(t) - S(O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、(u) - C(N-OR<sup>4</sup>) -、(v) - CH<sub>2</sub> -、(w) - C(N-NR<sup>4</sup>R<sup>4</sup>) -、(x) - C(S)NR<sup>4</sup>、(Y) - NR<sup>4</sup>C(S) -、(Z) - C(S)O - または (aa) - OC(S) - であって、ここで、

i) すぐ上の(a) ~ (d)のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上のR<sup>5</sup> 基で置換されている；そして

ii) Wは、以下からなる群から選択される：(aa) - OCO -、(bb) - OC(O)O -、(cc) - OC(O)NR<sup>4</sup> -、(dd) - NR<sup>4</sup>C(O)O -、(ee) - OCNR<sup>4</sup> -、(ff) - NR<sup>4</sup>-C(O)O -、(gg) - C(S)(NR<sup>4</sup>) -、(hh) - NR<sup>4</sup>、(ii) - OC(S)O -、(jj) - OC(S)NR<sup>4</sup> -、(kk) - NR<sup>4</sup>C(S)O -、(ll) - OC(S)NR<sup>4</sup> -、(mm) - C(S)O -、(nn) - OC(S)、(oo) - C(O) -、(pp) - C(O)O -、(qq) -

C(O)NR<sup>4</sup> -、(rr) - C(=NR<sup>4</sup>) -、(ss) - C(=NR<sup>4</sup>)O -、(tt) - C(=NR<sup>4</sup>)NR<sup>4</sup> -、(uu) - OC(O) -、(vv) - OC(O)O -、(ww) - OC(O)NR<sup>4</sup> -、(xx) - NR<sup>4</sup>C(O) -、(yy) - NR<sup>4</sup>C(O)O -、(zz) - NR<sup>4</sup>C(O)NR<sup>4</sup> -、(aaa) - NR<sup>4</sup>C(=NR<sup>4</sup>)NR<sup>4</sup> -、(bbb) - S(O)<sub>p</sub> -、(ccc) - NR<sup>4</sup>S(O)<sub>2</sub> -、(ddd) - S(O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、(eee) - C(N-OR<sup>4</sup>) -、(fff) - C(N-NR<sup>4</sup>R<sup>4</sup>) -、(ggg) - C(S)NR<sup>4</sup> - または (hhh) - NR<sup>4</sup>C(S) -。

【請求項 11】

E が、以下からなる群から選択される、請求項 10 に記載の化合物：

(a) 3員～10員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、および

(b) 3員～10員飽和、不飽和または芳香族炭素環であって、

ここで、すぐ上の(a)および(b)は、必要に応じて、1個またはそれ以上のR<sup>5</sup>基で置換されている、  
化合物。

【請求項 12】

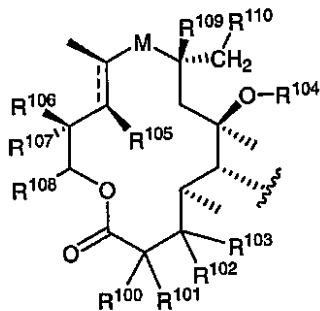
E が、以下からなる群から選択される、請求項 9 に記載の化合物：

(a) - C(O) -、(b) - C(O)O -、(c) - C(O)NR<sup>4</sup> -、(d) - C(=NR<sup>4</sup>) -、(e) - C(=NR<sup>4</sup>)O -、(f) - C(=NR<sup>4</sup>)NR<sup>4</sup> -、(g) - OC(O) -、(h) - OC(O)O -、(i) - OC(O)NR<sup>4</sup> -、(j) - NR<sup>4</sup>C(O) -、(k) - NR<sup>4</sup>C(O)O -、(l) - NR<sup>4</sup>C(O)NR<sup>4</sup> -、(m) - NR<sup>4</sup>C(=NR<sup>4</sup>)NR<sup>4</sup> -、(n) - S(O)<sub>p</sub> -、(o) - NR<sup>4</sup>S(O)<sub>2</sub> -、(p) - S(O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup> -、(q) - C(N-OR<sup>4</sup>) -、(r) - CH<sub>2</sub> -、(s) - C(N-NR<sup>4</sup>R<sup>4</sup>) -、(t)、- C(S)NR<sup>4</sup>、(u) - NR<sup>4</sup>C(S) -、(v) - C(S)O および (w) - OC(S) -。

【請求項 13】

T が、

【化 12】



である、請求項 1～12 のいずれか 1 項に記載の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、N-オキシドまたはプロドラッグ：

M は、以下からなる群から選択される：

(a) - C(O) -、(b) - CH(-OR<sup>114</sup>) -、(c) - NR<sup>114</sup> - CH<sub>2</sub> -、(d) - CH<sub>2</sub> - NR<sup>114</sup> -、(e) - CH(NR<sup>114</sup>R<sup>114</sup>) -、(f) - C(=NNR<sup>114</sup>R<sup>114</sup>) -、(g) - NR<sup>114</sup> - C(O) -、(h) - C(O)NR<sup>114</sup> -、(i) - C(=NR<sup>114</sup>) - および (j) - CR<sup>115</sup>R<sup>115</sup> -、(k) - C(=NOR<sup>127</sup>) -；

R<sup>100</sup> は、H および C<sup>1</sup>～<sup>6</sup>アルキルからなる群から選択される；

R<sup>101</sup> は、以下からなる群から選択される：(a) H、(b) Cl、(c) F、(d)

) Br、(e) I、(f) - NR<sup>1 1 4</sup> R<sup>1 1 4</sup>、(g) - NR<sup>1 1 4</sup> C(O) R<sup>1 1 4</sup>、(h) - OR<sup>1 1 4</sup>、(i) - OC(O) R<sup>1 1 4</sup>、(j) - OC(O) OR<sup>1 1 4</sup>、(k) - OC(O) NR<sup>1 1 4</sup> R<sup>1 1 4</sup>、(l) - O - C<sub>1-6</sub>アルキル、(m) - OC(O) - C<sub>1-6</sub>アルキル、(n) - OC(O) O - C<sub>1-6</sub>アルキル、(o) - OC(O) NR<sup>1 1 4</sup> - C<sub>1-6</sub>アルキル、(p) C<sub>1-6</sub>アルキル、(q) C<sub>1-6</sub>アルケニル、(r) C<sub>1-6</sub>アルキニルであって、

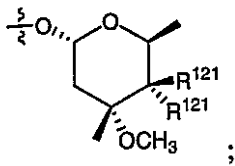
ここで、(l) ~ (r)のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上のR<sup>1 1 5</sup>基で置換されている；

R<sup>1 0 2</sup>は、Hである；

R<sup>1 0 3</sup>は、以下からなる群から選択される：

(a) H、(b) - OR<sup>1 1 4</sup>、(c) - O - C<sub>1-6</sub>アルキル - R<sup>1 1 5</sup>、(d) - OC(O) R<sup>1 1 4</sup>、(e) - OC(O) - C<sub>1-6</sub>アルキル - R<sup>1 1 5</sup>、(f) - OC(O) OR<sup>1 1 4</sup>、(g) - OC(O) O - C<sub>1-6</sub>アルキル - R<sup>1 1 5</sup>、(h) - OC(O) NR<sup>1 1 4</sup> R<sup>1 1 4</sup>、(i) - OC(O) NR<sup>1 1 4</sup> - C<sub>1-6</sub>アルキル - R<sup>1 1 5</sup>、および(j)

【化13】



あるいは、R<sup>1 0 2</sup>とR<sup>1 0 3</sup>とは、一緒になって、カルボニル基を形成する；  
あるいは、R<sup>1 0 1</sup>とR<sup>1 0 3</sup>とは、一緒になって、これらの2個の基が結合する各々の炭素間の単結合であり、それにより、R<sup>1 0 0</sup>およびR<sup>1 0 2</sup>が結合する炭素間で、二重結合を作製する；

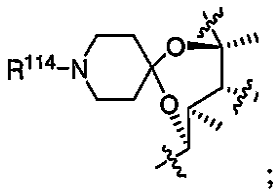
あるいは、R<sup>1 0 1</sup>とR<sup>1 0 3</sup>とは、一緒になって、エポキシド部分である；

R<sup>1 0 4</sup>は、以下からなる群から選択される：

(a) H、(b) R<sup>1 1 4</sup>、(c) - C(O) R<sup>1 1 4</sup> (d) - C(O) OR<sup>1 1 4</sup> (e) - C(O) NR<sup>1 1 4</sup> R<sup>1 1 4</sup>、(f) - C<sub>1-6</sub>アルキル - K - R<sup>1 1 4</sup>、(g) - C<sub>2-6</sub>アルケニル - K - R<sup>1 1 4</sup> および (h) - C<sub>2-6</sub>アルキニル - K - R<sup>1 1 4</sup>；

あるいは、R<sup>1 0 3</sup>とR<sup>1 0 4</sup>とは、それらが結合する原子と一緒に、以下を形成する：

【化14】



Kは、以下からなる群から選択される：

(a) - C(O) -、(b) - C(O) O -、(c) - C(O) NR<sup>1 1 4</sup> -、(d) - C(=NR<sup>1 1 4</sup>) -、(e) - C(=NR<sup>1 1 4</sup>) O -、(f) - C(=NR<sup>1 1 4</sup>) NR<sup>1 1 4</sup> -、(g) - OC(O) -、(h) - OC(O) O -、(i) - OC(O) NR<sup>1 1 4</sup> -、(j) - NR<sup>1 1 4</sup> C(O) -、(k) - NR<sup>1 1 4</sup> C(O) O -、(l) - NR<sup>1 1 4</sup> C(O) NR<sup>1 1 4</sup> -、(m) - NR<sup>1 1 4</sup> C(=NR<sup>1 1 4</sup>) NR<sup>1 1 4</sup> - および (o) - S(O)<sub>p</sub> -；

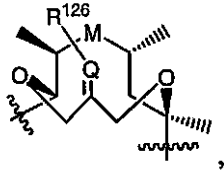
R<sup>1 0 5</sup>は、以下からなる群から選択される：

(a) R<sup>1 1 4</sup>、(b) - OR<sup>1 1 4</sup>、(c) - NR<sup>1 1 4</sup> R<sup>1 1 4</sup>、(d) - O - C

$1 \sim 6$  アルキル -  $R^{115}$ 、(e) -  $C(O) - R^{114}$ 、(f) -  $C(O) - C_{1 \sim 6}$   
 アルキル -  $R^{115}$ 、(g) -  $OC(O) - R^{114}$ 、(h) -  $OC(O) - C_{1 \sim 6}$   
 アルキル -  $R^{115}$ 、(i) -  $OC(O)O - R^{114}$ 、(j) -  $OC(O)O - C_{1 \sim 6}$   
 アルキル -  $R^{115}$ 、(k) -  $OC(O)NR^{114}R^{114}$ 、(l) -  $OC(O)NR^{114} - C_{1 \sim 6}$  アルキル -  $R^{115}$ 、(m) -  $C(O) - C_{2 \sim 6}$  アルケニル -  $R^{115}$  ;  
 および (n) -  $C(O) - C_{2 \sim 6}$  アルキニル -  $R^{115}$  ;

あるいは、 $R^{104}$  と  $R^{105}$  とは、それらが結合する原子と一緒にあって、以下を形成する：

## 【化15】

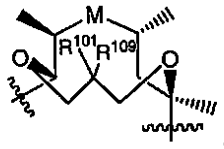


ここで、

Qは、CHまたはNであり、そして $R^{126}$ は、 $-OR^{114}$ 、 $-NR^{114}$ または $R^{114}$ である；

あるいは、 $R^{104}$  と  $R^{105}$  とは、それらが結合する原子と一緒にあって、以下を形成する：

## 【化16】



ここで、

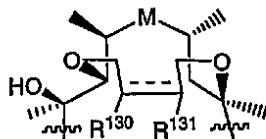
i)  $R^{101}$ は、上で定義したとおりである；

ii) あるいは、 $R^{101}$  と  $R^{109}$  とは、一緒になって、カルボニル基を形成し得る；

iii) あるいは、 $R^{101}$  と  $R^{109}$  とは、一緒になって、 $-O(CR^{116}R^{116})_2O$  - 基を形成し得る；

あるいは、 $R^{104}$  と  $R^{105}$  とは、それらが結合する原子と一緒にあって、以下を形成する：

## 【化17】



i)  $R^{130}$ は、 $-OH$ 、 $=C(O)$ または $R^{114}$ であり、

ii)  $R^{131}$ は、 $-OH$ 、 $=C(O)$ または $R^{114}$ であり、

iii) あるいは、 $R^{130}$  と  $R^{131}$  とは、それらが結合する炭素と一緒にあって、3員～7員飽和、不飽和または芳香族炭素環または複素環を形成し、該炭素環または複素環は、必要に応じて、1個またはそれ以上の $R^{114}$ 基で置換できる；

$R^{106}$ は、以下からなる群から選択される：(a) -  $OR^{114}$ 、(b) -  $C_{1 \sim 6}$  アルコキシ -  $R^{115}$ 、(c) -  $C(O)R^{114}$ 、(d) -  $OC(O)R^{114}$ 、(e) -  $OC(O)OR^{114}$ 、(f) -  $OC(O)NR^{114}R^{114}$  および (g) -  $NR$

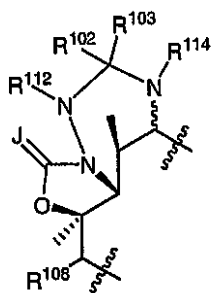
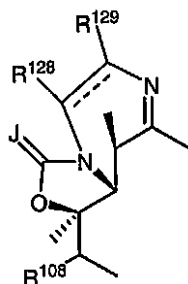
$114R114$ 、

あるいは、 $R105$ と $R106$ とは、それらが結合する原子と一緒にあって、以下からなる群から選択される化学部分を介して、互いに結合することにより、5員環を形成する：

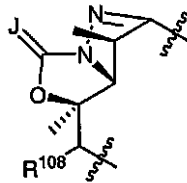
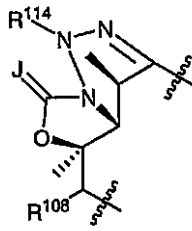
(a)  $-OC(R115)_2O-$ 、(b)  $-OC(O)O-$ 、(c)  $-OC(O)NR114-$ 、(d)  $-NR114C(O)O-$ 、(e)  $-OC(O)NOR114-$ 、(f)  $-NOR114-C(O)O-$ 、(g)  $-OC(O)NNR114R114-$ 、(h)  $-NNR114R114-C(O)O-$ 、(i)  $-OC(O)C(R115)_2-$ 、(j)  $-C(R115)_2C(O)O-$ 、(k)  $-OC(S)O-$ 、(l)  $-OC((S)NR114-$ 、(m)  $-NR114C(S)O-$ 、(n)  $-OC(S)NOR114-$ 、(o)  $-NOR114-C(S)O-$ 、(p)  $-OC(S)NNR114R114-$ 、(q)  $-NNR114R114-C(S)O-$ 、(r)  $-OC(S)C(R115)_2-$  および (s)  $-C(R115)_2C(S)O-$ ；

あるいは、Mと $R105$ と $R106$ とは、それらが結合する原子と一緒にあって、以下を形成する：

【化18】



## 【化 19】

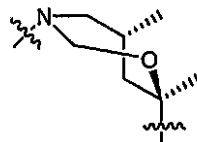
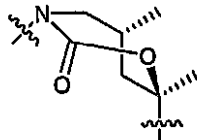
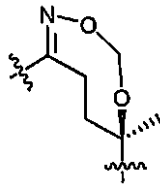


ここで、Jは、O、SおよびNR<sup>114</sup>からなる群から選択される；

あるいは、MとR<sup>104</sup>とは、それらが結合する原子と一緒にあって、以下を形成する

:

## 【化 20】



R<sup>107</sup>は、以下からなる群から選択される：

(a) H、(b) -C<sub>1-4</sub>アルキル、(c) -C<sub>2-4</sub>アルケニルであって、該-C<sub>2-4</sub>アルケニルは、C<sub>1-12</sub>アルキルまたは1個またはそれ以上のハロゲンで置換されている、(d) -C<sub>2-4</sub>アルキニルであって、該-C<sub>2-4</sub>アルキニルは、さらに、C<sub>1-12</sub>アルキルまたは1個またはそれ以上のハロゲンで置換できる、(e) アリールまたはヘテロアリールであって、該アリールまたはヘテロアリールは、さらに、C<sub>1-12</sub>アルキルまたは1個またはそれ以上のハロゲンで置換できる、(f) -C(O)H、(g) -COOH、(h) -CN、(i) -COOR<sup>114</sup>、(j) -C(O)NR<sup>114</sup>、(k) -C(O)R<sup>114</sup>および(l) -C(O)SR<sup>114</sup>であって、ここで、(b)は、さらに、1個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基は、以下からなる群から選択される：(aa) -OR<sup>114</sup>、(bb) ハロゲン、(cc) -SR<sup>114</sup>、(dd) C<sub>1-12</sub>アルキルであって、該C<sub>1-12</sub>アルキルは、さらに、ハ

ロゲン、ヒドロキシル、 $C_{1-6}$  アルコキシまたはアミノで置換できる、 $(ee) - OR^{114}$ 、 $(ff) - SR^{114}$ 、 $(gg) - NR^{114}R^{114}$ 、 $(hh) - CN$ 、 $(ii) - NO_2$ 、 $(jj) - NC(O)R^{114}$ 、 $(kk) - COOR^{114}$ 、 $(II) - N_3$ 、 $(mm) = N - O - R^{114}$ 、 $(nn) = NR^{114}$ 、 $(oo) = N - NR^{114}R^{114}$ 、 $(pp) = N - NH - C(O)R^{114}$  および  $(qq) = N - NH - C(O)NR^{114}R^{114}$  ;

あるいは、 $R^{106}$  と  $R^{107}$  とは、それらが結合する原子と一緒にあって、エポキシド、カルボニル、オレフィン、置換オレフィン、または  $C_3 \sim C_7$  炭素環、カーボネートまたはカーバメートを形成し、ここで、該カーバメートの窒素は、さらに、 $C_1 \sim C_6$  アルキルで置換できる ;

$R^{108}$  は、以下からなる群から選択される :

(a)  $C_{1-6}$  アルキル、(b)  $C_{2-6}$  アルケニルおよび (c)  $C_{2-6}$  アルキニルであって、

ここで、(a) ~ (c) のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上の  $R^{114}$  基で置換されている ;

$R^{111}$  は、H および  $-C(O)R^{114}$  からなる群から選択される ;

$R^{112}$  は、H、OH および  $OR^{114}$  からなる群から選択される ;

$R^{113}$  は、以下からなる群から選択される :

(a) H、(b)  $R^{114}$ 、(c)  $-C_{1-6}$  アルキル - K -  $R^{114}$ 、(d)  $-C_{2-6}$  アルケニル - K -  $R^{114}$  および (e)  $-C_{2-6}$  アルキニル - K -  $R^{114}$  であって、

ここで、(c) ~ (e) のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上の  $R^{115}$  基で置換されている ;

$R^{114}$  は、各存在において、別個に、以下からなる群から選択される :

(a) H、(b)  $C_{1-6}$  アルキル、(c)  $C_{2-6}$  アルケニル、(d)  $C_{2-6}$  アルキニル、(e)  $C_{6-10}$  飽和、不飽和または芳香族炭素環、(f) 3員 ~ 12員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、(g)  $-C(O) - C_{1-6}$  アルキル、(h)  $-C(O) - C_{2-6}$  アルケニル、(i)  $-C(O) - C_{2-6}$  アルキニル、(j)  $-C(O) - C_{6-10}$  飽和、不飽和または芳香族炭素環、(k)  $-C(O) - 3$ 員 ~ 12員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、(l)  $-C(O)O - C_{1-6}$  アルキル、(m)  $-C(O)O - C_{2-6}$  アルケニル、(n)  $-C(O)O - C_{2-6}$  アルキニル、(o)  $-C(O)O - C_{6-10}$  飽和、不飽和または芳香族炭素環、(p)  $-C(O)O - 3$ 員 ~ 12員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、および (q)  $-C(O)NR^{116}R^{116}$ 、

ここで、(b) ~ (p) のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上の  $R^{115}$  基で置換されており、ここで、(b) ~ (d) のいずれかの1個またはそれ以上の非末端炭素部分は、必要に応じて、酸素、イオウ、 $S(O)_p$  または  $-NR^{116}$  で置き換えられる、

あるいは、 $NR^{114}R^{114}$  は、3員 ~ 7員飽和、不飽和または芳香環を形成し、該環は、該  $R^{114}$  基が結合する窒素原子、および必要に応じて、1個またはそれ以上の部分を含み、該部分は、O、 $S(O)_p$ 、N および  $NR^{118}$  からなる群から選択される ;

$R^{115}$  は、以下からなる群から選択される :

(a)  $R^{117}$ 、(b)  $C_{1-8}$  アルキル、(c)  $C_{2-8}$  アルケニル、(d)  $C_{2-8}$  アルキニル、(e)  $C_{3-12}$  飽和、不飽和または芳香族炭素環、(f) 3員 ~ 12員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択され、ここで

、(b)～(f)のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上の $R^{117}$ 基で置換されている；

$R^{116}$ は、各存在において、別個に、以下からなる群から選択される：

(a) H、(b)  $C_{1-6}$  アルキル、(c)  $C_{2-6}$  アルケニル、(d)  $C_{2-6}$  アルキニル、(e)  $C_{3-10}$  飽和、不飽和または芳香族炭素環、および(f) 3員～10員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択され、

ここで、(b)～(d)のいずれかの1個またはそれ以上の非末端炭素部分は、必要に応じて、酸素、 $S(O)_p$ または $-NR^{114}$ で置き換えられ、ここで、(b)～(f)のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上の部分で置換されており、該部分は、以下からなる群から選択される：

(aa) カルボニル、(bb) ホルミル、(cc) F、(dd) Cl、(ee) Br、(ff) I、(gg) CN、(hh)  $N_3$ 、(ii)  $NO_2$ 、(jj)  $OR^{118}$ 、(kk)  $-S(O)_p R^{118}$ 、(ll)  $-C(O)R^{118}$ 、(mm)  $C(O)OR^{118}$ 、(nn)  $-OC(O)R^{118}$ 、(oo)  $-C(O)NR^{118}R^{118}$ 、(pp)  $-OC(O)NR^{118}R^{118}$ 、(qq)  $-C(=NR^{118})R^{118}$ 、(rr)  $-C(R^{118})(R^{118})OR^{118}$ 、(ss)  $-C(R^{118})_2OC(O)R^{118}$ 、(tt)  $-C(R^{118})(OR^{118})(CH_2)_r NR^{118}R^{118}$ 、(uu)  $-NR^{118}R^{118}$ ；(vv)  $-NR^{118}OR^{118}$ 、(ww)  $-NR^{118}C(O)R^{118}$ 、(xx)  $-NR^{118}C(O)OR^{118}$ 、(yy)  $-NR^{118}C(O)NR^{118}R^{118}$ 、(zz)  $-NR^{118}S(O)_r R^{118}$ 、(ab)  $-C(OR^{118})(OR^{118})R^{118}$ 、(ac)  $-C(R^{118})_2NR^{118}R^{118}$ 、(ad)  $=NR^{118}$ 、(ae)  $-C(S)NR^{118}R^{118}$ 、(af)  $-NR^{118}C(S)R^{118}$ 、(ag)  $-OC(S)NR^{118}R^{118}$ 、(ah)  $-NR^{118}C(S)OR^{118}$ 、(ai)  $-NR^{118}C(S)NR^{118}R^{118}$ 、(aj)  $-SC(O)R^{118}$ 、(ak)  $C_{1-8}$  アルキル、(al)  $C_{2-8}$  アルケニル、(am)  $C_{2-8}$  アルキニル、(an)  $C_{1-8}$  アルコキシ、(ao)  $C_{1-8}$  アルキルチオ、(ap)  $C_{1-8}$  アシル、(aq) 飽和、不飽和または芳香族 $C_{3-10}$ 炭素環、および(ar) 飽和、不飽和または芳香族3員～10員複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、

あるいは、 $NR^{116}R^{116}$ は、3員～10員飽和、不飽和または芳香環を形成し、該環は、該 $R^{116}$ 基が結合する窒素原子、および必要に応じて、1個またはそれ以上の部分を含み、該部分は、O、 $S(O)_p$ 、Nおよび $NR^{118}$ からなる群から選択される；

あるいは、 $CR^{116}R^{116}$ は、カルボニル基を形成する；

$R^{117}$ は、各存在において、以下からなる群から選択される：

(a) H、(b) = O、(c) F、(d) Cl、(e) Br、(f) I、(g)  $(CR^{116}R^{116})_r CF_3$ 、(h)  $(CR^{116}R^{116})_r CN$ 、(i)  $(CR^{116}R^{116})_r NO_2$ 、(j)  $(CR^{116}R^{116})_r NR^{116}(CR^{116}R^{116})_t R^{119}$ 、(k)  $(CR^{116}R^{116})_r OR^{119}$ 、(l)  $(CR^{116}R^{116})_r S(O)_p(CR^{116}R^{116})_t R^{119}$ 、(m)  $(CR^{116}R^{116})_r C(O)(CR^{116}R^{116})_t R^{119}$ 、(n)  $(CR^{116}R^{116})_r OC(O)(CR^{116}R^{116})_t R^{119}$ 、(o)  $(CR^{116}R^{116})_r SC(O)(CR^{116}R^{116})_t R^{119}$ 、(p)  $(CR^{116}R^{116})_r C(O)O(CR^{116}R^{116})_t R^{119}$ 、(q)  $(CR^{116}R^{116})_r NR^{116}C(O)(CR^{116}R^{116})_t R^{119}$ 、(r)  $(CR^{116}R^{116})_r C(O)NR^{116}(CR^{116}R^{116})_t R^{119}$ 、(s)  $(CR^{116}R^{116})_r C(=NR^{116})(CR^{116}R^{116})_t R^{119}$ 、(t)  $(CR^{116}R^{116})_r C(=NNR^{116}R^{116})(CR^{116}R^{116})_t R^{119}$ 、(u)  $(CR^{116}R^{116})_r C(=N$

$NR^{116}C(O)R^{116}$ 、 $(CR^{116}R^{116})_tR^{119}$ 、 $(v)(CR^{116}R^{116})_rC(=NOR^{119})(CR^{116}R^{116})_tR^{119}$ 、 $(w)(CR^{116}R^{116})_rNR^{116}C(O)O(CR^{116}R^{116})_tR^{119}$ 、 $(x)(CR^{116}R^{116})_rOC(O)NR^{116}(CR^{116}R^{116})_tR^{119}$ 、 $(y)(CR^{116}R^{116})_rNR^{116}C(O)NR^{116}(CR^{116}R^{116})_tR^{119}$ 、 $(z)(CR^{116}R^{116})_rNR^{116}S(O)_p(CR^{116}R^{116})_tR^{119}$ 、 $(aa)(CR^{116}R^{116})_rS(O)_pNR^{116}(CR^{116}R^{116})_tR^{119}$ 、 $(bb)(CR^{116}R^{116})_rNR^{116}S(O)_pNR^{116}(CR^{116}R^{116})_tR^{119}$ 、 $(cc)(CR^{116}R^{116})_rNR^{116}R^{116}$ 、 $(dd)C_{1-6}$ アルキル、 $(ee)C_{2-6}$ アルケニル、 $(ff)C_{2-6}$ アルキニル、 $(gg)(CR^{116}R^{116})_r-C_{3-10}$ 飽和、不飽和または芳香族炭素環、および $(hh)(CR^{116}R^{116})_r-3員\sim 10員$ 飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択され、

ここで、 $(dd)\sim(hh)$ のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上の $R^{119}$ 基で置換されている；

あるいは、2個の $R^{117}$ 基は、 $-O(CH_2)_uO-$ を形成し得る；

$R^{118}$ は、以下からなる群から選択される：

$(a)H$ 、 $(b)C_{1-6}$ アルキル、 $(c)C_{2-6}$ アルケニル、 $(d)C_{2-6}$ アルキニル、 $(e)C_{3-10}$ 飽和、不飽和または芳香族炭素環、 $(f)3員\sim 10員$ 飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、 $(g)-C(O)-C_{1-6}$ アルキル、 $(h)-C(O)-C_{1-6}$ アルケニル、 $(g)-C(O)-C_{1-6}$ アルキニル、 $(i)-C(O)-C_{3-10}$ 飽和、不飽和または芳香族炭素環、および $(j)-C(O)-3員\sim 10員$ 飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択され、

ここで、 $(b)\sim(j)$ のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上の部分で置換されており、該部分は、以下からなる群から選択される： $(aa)H$ 、 $(bb)F$ 、 $(cc)Cl$ 、 $(dd)Br$ 、 $(ee)I$ 、 $(ff)CN$ 、 $(gg)NO_2$ 、 $(hh)OH$ 、 $(ii)NH_2$ 、 $(jj)NH(C_{1-6}$ アルキル)、 $(kk)N(C_{1-6}$ アルキル) $_2$ 、 $(ll)C_{1-6}$ アルコキシ、 $(mm)$ アリール、 $(nn)$ 置換アリール、 $(oo)$ ヘテロアリール、 $(pp)$ 置換ヘテロアリール、および $(qq)C_{1-6}$ アルキルであって、必要に応じて、該 $C_{1-6}$ アルキルは、1個またはそれ以上の部分で置換されており、該部分は、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、 $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、 $I$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ および $OH$ からなる群から選択される；

$R^{119}$ は、各存在において、別個に、以下からなる群から選択される：

$(a)R^{120}$ 、 $(b)C_{1-6}$ アルキル、 $(c)C_{2-6}$ アルケニル、 $(d)C_{2-6}$ アルキニル、 $(e)C_{3-10}$ 飽和、不飽和または芳香族炭素環、および $(f)3員\sim 10員$ 飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択され、ここで、 $(b)\sim(f)$ のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上の $R^{119}$ 基で置換されている；

$R^{120}$ は、各存在において、別個に、以下からなる群から選択される：

$(a)H$ 、 $(b)=O$ 、 $(c)F$ 、 $(d)Cl$ 、 $(e)Br$ 、 $(f)I$ 、 $(g)(CR^{116}R^{116})_rCF_3$ 、 $(h)(CR^{116}R^{116})_rCN$ 、 $(i)(CR^{116}R^{116})_rNO_2$ 、 $(j)(CR^{116}R^{116})_rNR^{116}R^{116}$ 、 $(k)(CR^{116}R^{116})_rOR^{114}$ 、 $(l)(CR^{116}R^{116})_rS(O)_pR^{116}$ 、 $(m)(CR^{116}R^{116})_rC(O)R^{116}$ 、 $(n)(CR^{116}R^{116})_rC(O)OR^{116}$ 、 $(o)(CR^{116}R^{116})_rOC(O)R^{116}$ 、 $(p)(C$

$R^{116}R^{116}$ )<sub>r</sub>NR<sup>116</sup>C(O)R<sup>116</sup>、(q)(CR<sup>116</sup>R<sup>116</sup>)<sub>r</sub>C(O)NR<sup>116</sup>R<sup>116</sup>、(r)(CR<sup>116</sup>R<sup>116</sup>)<sub>r</sub>C(=NR<sup>116</sup>)R<sup>116</sup>、(s)(CR<sup>116</sup>R<sup>116</sup>)<sub>r</sub>NR<sup>116</sup>C(O)NR<sup>116</sup>R<sup>116</sup>、(t)(CR<sup>116</sup>R<sup>116</sup>)<sub>r</sub>NR<sup>116</sup>S(O)<sub>p</sub>R<sup>116</sup>、(U)(CR<sup>116</sup>R<sup>116</sup>)<sub>r</sub>S(O)<sub>p</sub>NR<sup>116</sup>R<sup>116</sup>、(v)(CR<sup>116</sup>R<sup>116</sup>)<sub>r</sub>NR<sup>116</sup>S(O)<sub>p</sub>NR<sup>116</sup>R<sup>116</sup>、(w)C<sub>1-6</sub>アルキル、(x)C<sub>2-6</sub>アルケニル、(y)C<sub>2-6</sub>アルキニル、(z)(CR<sup>116</sup>R<sup>116</sup>)<sub>r</sub>-C<sub>3-10</sub>飽和、不飽和または芳香族炭素環、および(aa)(CR<sup>116</sup>R<sup>116</sup>)<sub>r</sub>-3員~10員飽和、不飽和または芳香族複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択され、

ここで、(w)~(aa)のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上の部分で置換されており、該部分は、R<sup>116</sup>、F、Cl、Br、I、CN、NO<sub>2</sub>、-OR<sup>116</sup>、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1-6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1-6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、C<sub>1-6</sub>アルキルチオおよびC<sub>1-6</sub>アシルからなる群から選択される；

R<sup>121</sup>は、各存在において、別個に、以下からなる群から選択される：

(a)H、(b)-OR<sup>118</sup>、(c)-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-OC(O)R<sup>118</sup>、(d)-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-OC(O)NR<sup>118</sup>R<sup>118</sup>、(e)-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-OC(O)NR<sup>118</sup>R<sup>118</sup>、(f)-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-C(O)NR<sup>118</sup>R<sup>118</sup>、(g)-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-NR<sup>118</sup>C(O)R<sup>118</sup>、(h)-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-NR<sup>118</sup>C(O)OR<sup>118</sup>、(i)-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-NR<sup>118</sup>C(O)NR<sup>118</sup>R<sup>118</sup>、(j)-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-NR<sup>118</sup>C(=N(H))NR<sup>118</sup>R<sup>118</sup>、(k)-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-S(O)<sub>p</sub>R<sup>118</sup>、(l)-O-C<sub>2-6</sub>アルケニル-OC(O)R<sup>118</sup>、(m)-O-C<sub>2-6</sub>アルケニル-OC(O)OR<sup>118</sup>、(n)-O-C<sub>2-6</sub>アルケニル-OC(O)NR<sup>118</sup>R<sup>118</sup>、(o)-O-C<sub>2-6</sub>アルケニル-C(O)NR<sup>118</sup>R<sup>118</sup>、(p)-O-C<sub>2-6</sub>アルケニル-NR<sup>118</sup>C(O)R<sup>118</sup>、(q)-O-C<sub>2-6</sub>アルケニル-NR<sup>118</sup>C(O)OR<sup>118</sup>、(r)-O-C<sub>2-6</sub>アルケニル-NR<sup>118</sup>C(O)NR<sup>118</sup>R<sup>118</sup>、(s)-O-C<sub>2-6</sub>アルケニル-NR<sup>118</sup>C(=N(H))NR<sup>118</sup>R<sup>118</sup>、(t)-O-C<sub>2-6</sub>アルケニル-S(O)<sub>p</sub>R<sup>118</sup>、(u)-O-C<sub>2-6</sub>アルキニル-OC(O)R<sup>118</sup>、(v)-O-C<sub>2-6</sub>アルキニル-OC(O)OR<sup>118</sup>、(w)-O-C<sub>2-6</sub>アルキニル-OC(O)NR<sup>118</sup>R<sup>118</sup>、(x)-O-C<sub>2-6</sub>アルキニル-C(O)NR<sup>118</sup>R<sup>118</sup>、(y)-O-C<sub>2-6</sub>アルキニル-NR<sup>118</sup>C(O)OR<sup>118</sup>、(z)-O-C<sub>2-6</sub>アルキニル-NR<sup>118</sup>C(O)OR<sup>118</sup>、(aa)-O-C<sub>2-6</sub>アルキニル-NR<sup>118</sup>C(O)NR<sup>118</sup>R<sup>118</sup>、(bb)-O-C<sub>2-6</sub>アルキニル-NR<sup>118</sup>C(=N(H))NR<sup>118</sup>R<sup>118</sup>、(cc)-O-C<sub>2-6</sub>アルキニル-S(O)<sub>p</sub>R<sup>118</sup>；および(dd)-NR<sup>118</sup>R<sup>118</sup>；

あるいは、2個のR<sup>121</sup>基は、一緒になって、=O、=NOR<sup>118</sup>または=NNR<sup>118</sup>R<sup>118</sup>を形成する；

R<sup>122</sup>は、R<sup>115</sup>である；

R<sup>123</sup>は、以下からなる群から選択される：

(a)R<sup>116</sup>、(b)F、(c)Cl、(d)Br、(e)I、(f)CN、(g)NO<sub>2</sub>および(h)-OR<sup>114</sup>；

あるいは、R<sup>122</sup>とR<sup>123</sup>とは、一緒になって、-O(CH<sub>2</sub>)<sub>u</sub>O-である；

R<sup>124</sup>は、各存在において、別個に、以下からなる群から選択される：

(a)H、(b)F、(c)Cl、(d)Br、(e)I、(f)CN、(g)-OR<sup>114</sup>、(h)-NO<sub>2</sub>、(i)-NR<sup>114</sup>R<sup>114</sup>、(j)C<sub>1-6</sub>アルキル、(k)C<sub>1-6</sub>アシルおよび(l)C<sub>1-6</sub>アルコキシ；

R<sup>125</sup>は、以下からなる群から選択される：

(a)C<sub>1-6</sub>アルキル、(b)C<sub>2-6</sub>アルケニル、(c)C<sub>2-6</sub>アルキニル、(

d)  $C_{1-6}$  アシル、(e)  $C_{1-6}$  アルコキシ、(f)  $C_{1-6}$  アルキルチオ、(g) 飽和、不飽和または芳香族  $C_{5-10}$  炭素環、(h) 飽和、不飽和または芳香族 5員~10員複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、(i)  $-O-C_{1-6}$  アルキル-飽和、不飽和または芳香族 5員~10員複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、(j)  $-NR^{114}-C_{1-6}$  アルキル-飽和、不飽和または芳香族 5員~10員複素環であって、該複素環は、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、(k) 飽和、不飽和または芳香族 10員二環式環系であって、該環系は、必要に応じて、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、(l) 飽和、不飽和または芳香族 13員三環式環系であって、該環系は、必要に応じて、1個またはそれ以上のヘテロ原子を含有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される、(m)  $-OR^{114}$ 、(n)  $-NR^{114}R^{114}$ 、(o)  $-S(O)_pR^{114}$ 、および (p)  $-R^{124}$  であって、

ここで、(a)~(l)のいずれかは、必要に応じて、1個またはそれ以上の  $R^{115}$  基で置換されている；

あるいは、 $R^{125}$  と 1 個の  $R^{124}$  基とは、それらが結合する原子と一緒にあって、5員~7員飽和または不飽和炭素環を形成し、該炭素環は、必要に応じて、1個またはそれ以上の  $R^{115}$  基で置換されている；または 5員~7員飽和または不飽和複素環を形成し、該複素環は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される 1 個またはそれ以上の原子を含有し、そして、必要に応じて、1個またはそれ以上の  $R^{115}$  基で置換されている；

$R^{126}$  は、各存在において、別個に、以下からなる群から選択される：

(a) 水素、(b) 電子吸引基、(c) アリール、(d) 置換アリール、(e) ヘテロアリール、(f) 置換ヘテロアリール、および (g)  $C_{1-6}$  アルキルであって、該  $C_{1-6}$  アルキルは、必要に応じて、1個またはそれ以上の  $R^{115}$  基で置換されている；

あるいは、いずれかの  $R^{126}$  およびいずれかの  $R^{123}$  は、それらが結合する原子と一緒にあって、5員~7員飽和または不飽和炭素環を形成し、該炭素環は、必要に応じて、1個またはそれ以上の  $R^{115}$  基で置換されている；または 5員~7員飽和または不飽和複素環を形成し、該複素環は、窒素、酸素およびイオウからなる群から選択される 1 個またはそれ以上の原子を含有し、そして、必要に応じて、1個またはそれ以上の  $R^{115}$  基で置換されている；

$R^{109}$  は、H または F である；

$R^{127}$  は、 $R^{114}$ 、単糖類または二糖類（アミノ糖および八口糖、 $-(CH_2)_n-(O-CH_2CH_2-)_m-O(CH_2)_pCH_3$  または  $-(CH_2)_n-(O-CH_2CH_2-)_m-OH$  を含めて）である；

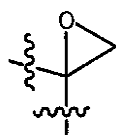
$R^{128}$  は、 $R^{114}$  である；

$R^{129}$  は、 $R^{114}$  である；

$R^{110}$  は、 $R^{114}$  である；

あるいは、 $R^{109}$  および  $R^{110}$  は、それらが結合する炭素と一緒にあって、以下を形成する：

【化 21】



あるいは、 $R^{128}$  および  $R^{129}$  は、それらが結合する炭素と一緒にあって、3員~6員飽和、不飽和または芳香族炭素環または複素環を形成し、該炭素環または複素環は、

必要に応じて、1個またはそれ以上の  $R^{114}$  基で置換され得る；

mは、各存在において、0、1、2、3、4または5である；

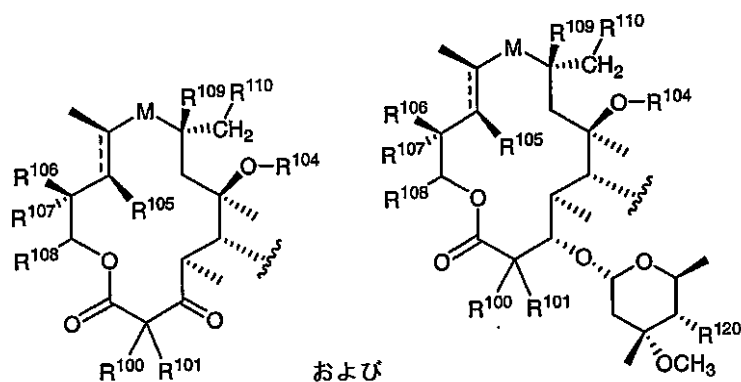
nは、各存在において、1、2または3である、

化合物。

【請求項14】

Tが、以下からなる群から選択されるマクロライドである、請求項1～13のいずれか1項に記載の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、N-オキシドまたはプロドラッグ：

【化22】

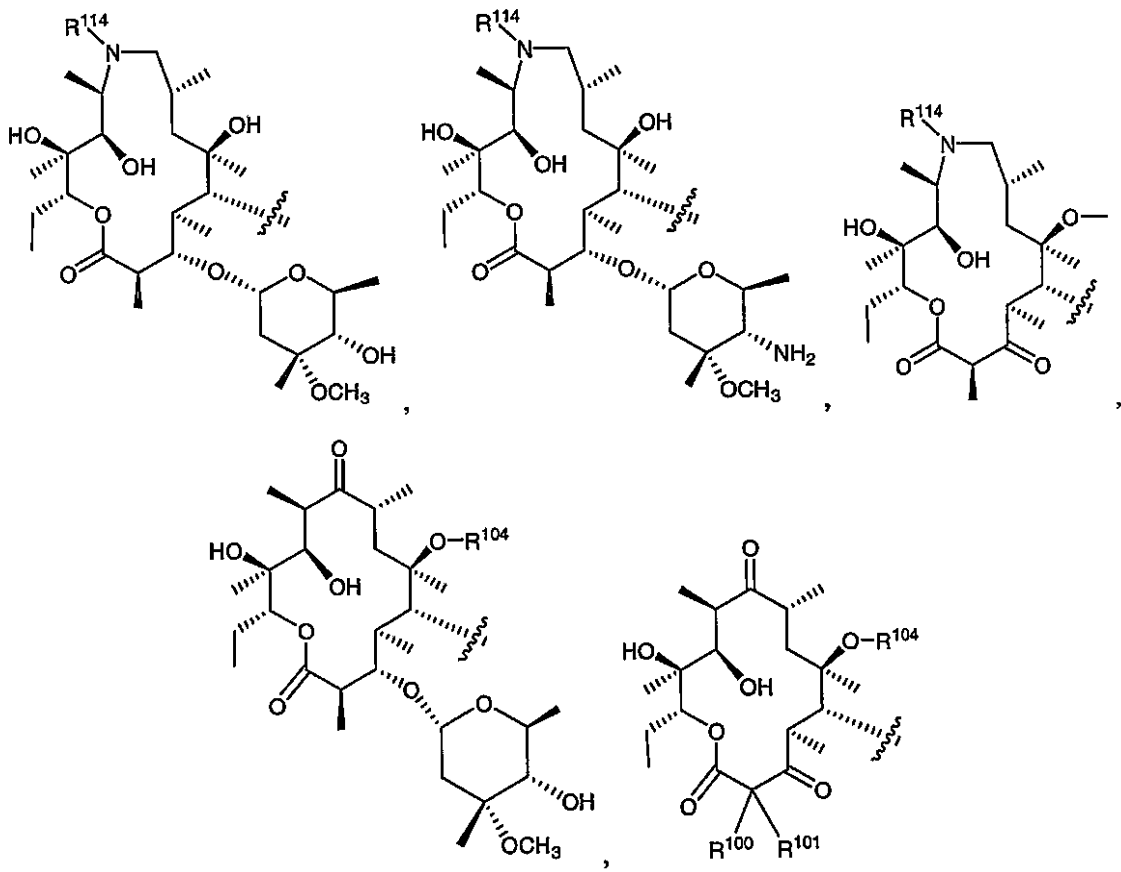


ここで、M、 $R^{100}$ 、 $R^{101}$ 、 $R^{104}$ 、 $R^{105}$ 、 $R^{106}$ 、 $R^{107}$ 、 $R^{108}$ 、 $R^{109}$ 、 $R^{110}$  および  $R^{120}$  は、請求項13に記載したとおりである、化合物。

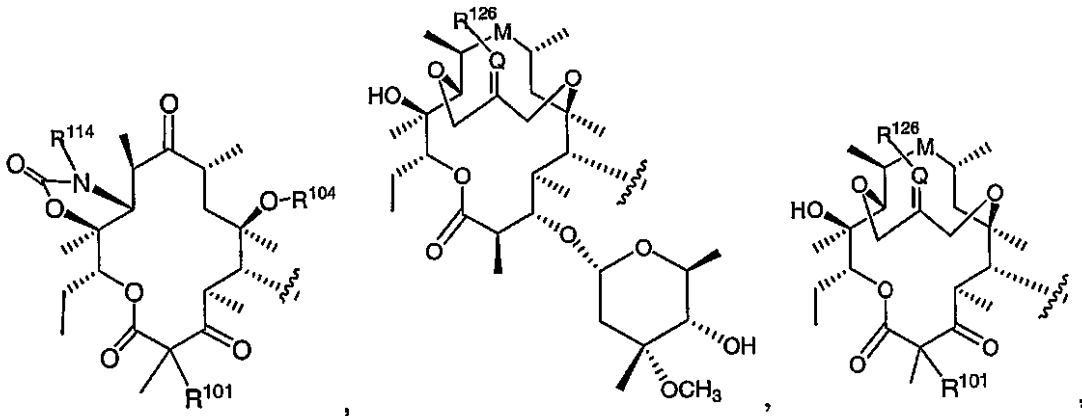
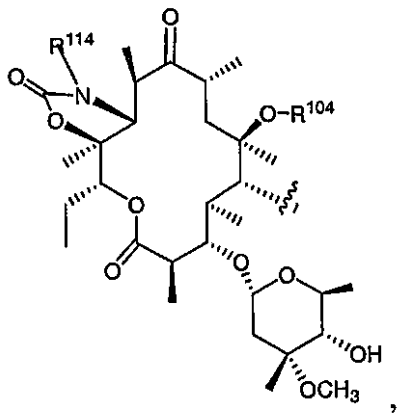
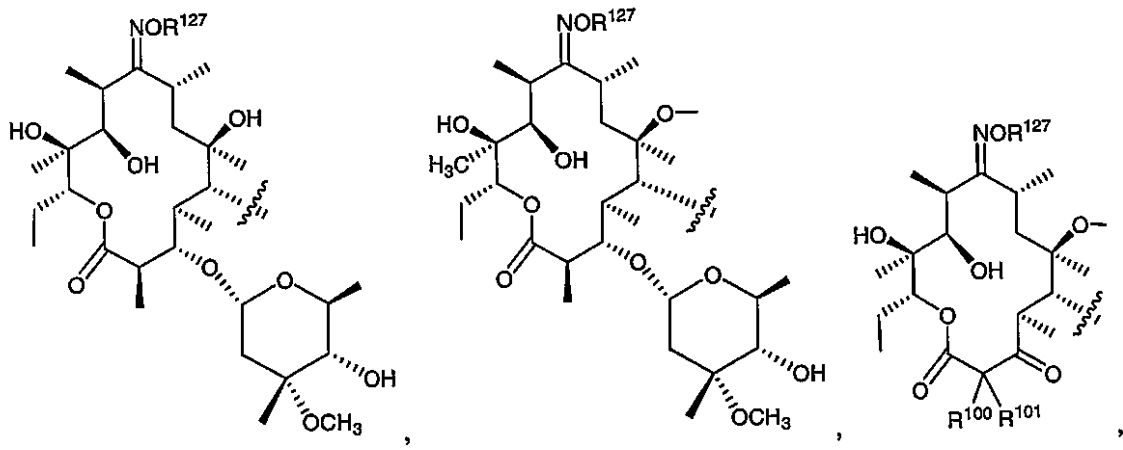
【請求項15】

Tが、以下からなる群から選択されるマクロライドである、請求項1～14のいずれか1項に記載の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、N-オキシドまたはプロドラッグ：

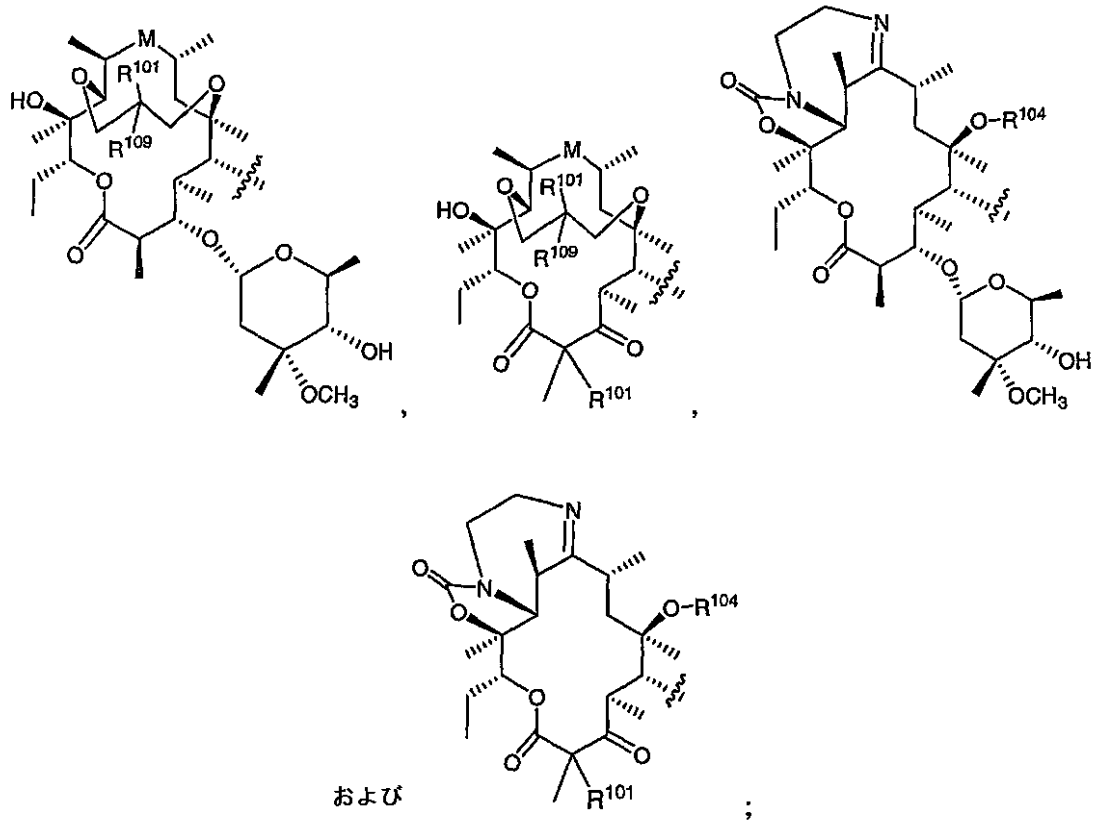
【化 2 3】



【化 2 4】



## 【化 2 5】

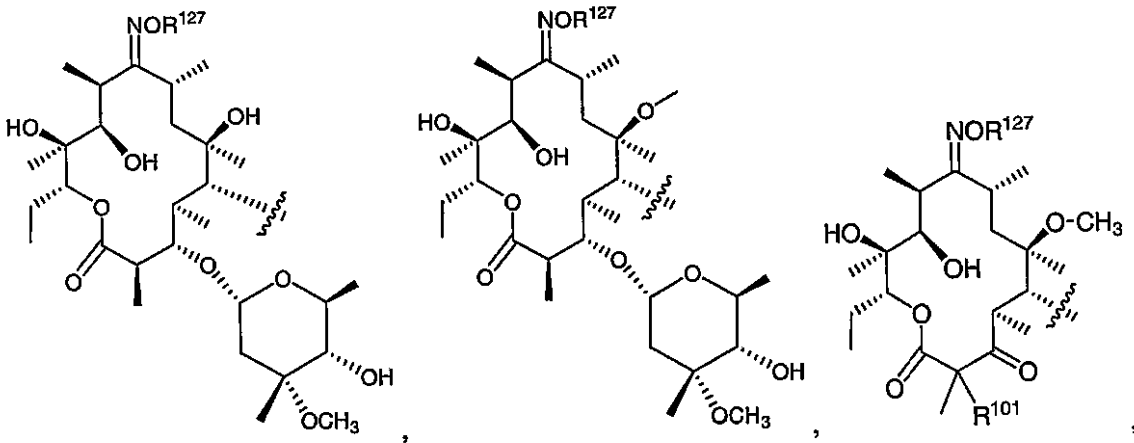
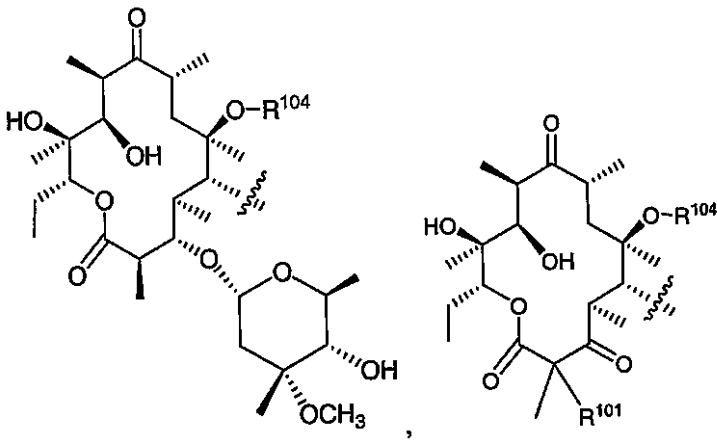
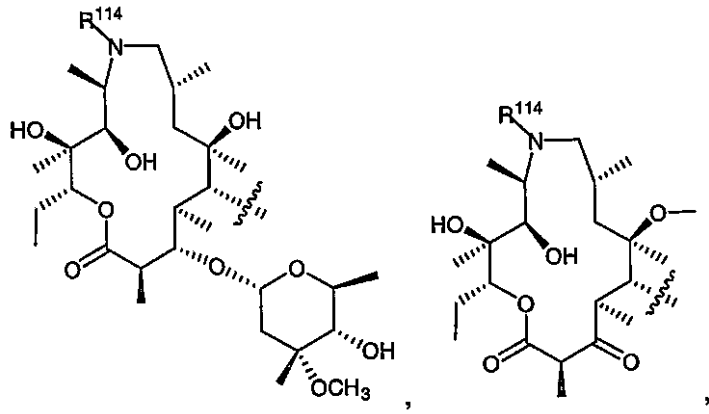


ここで、M、 $R^{100}$ 、 $R^{101}$ 、 $R^{102}$ 、 $R^{104}$ 、 $R^{109}$ 、 $R^{114}$ 、 $R^{126}$  および  $R^{127}$  は、請求項 13 に記載したとおりである、化合物。

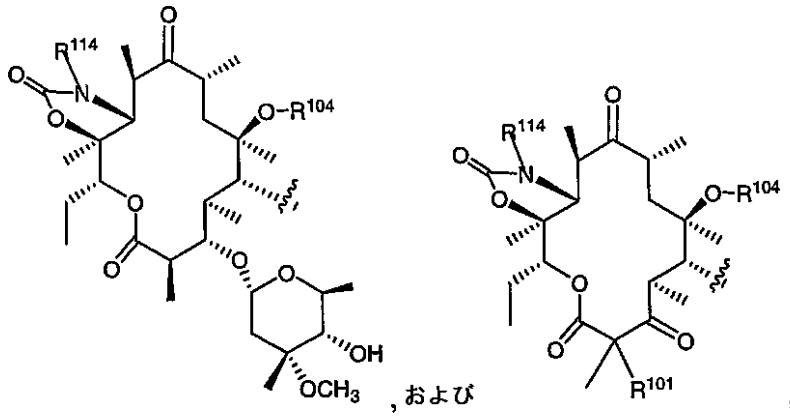
## 【請求項 16】

T が、以下からなる群から選択されるマクロライドである、請求項 1 ~ 15 のいずれか 1 項に記載の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、N - オキシドまたはプロドラッグ：

【化 2 6】



## 【化 2 7】

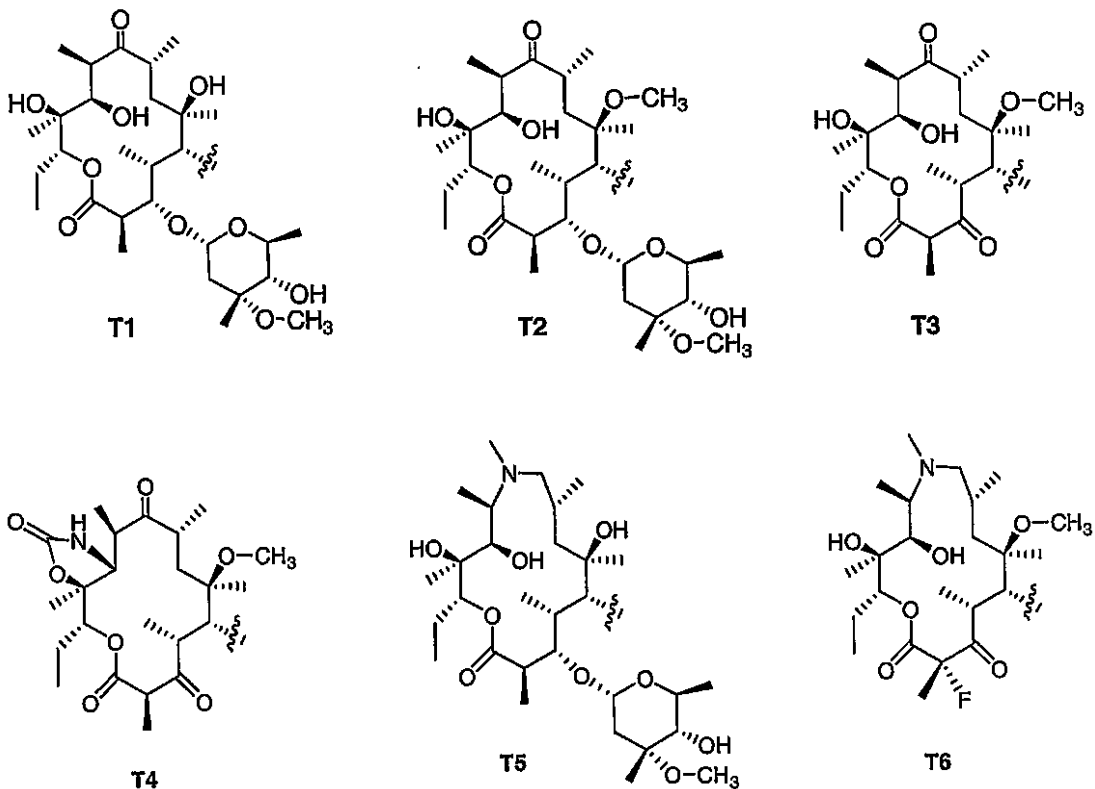


ここで、M、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>104</sup>、R<sup>114</sup>、R<sup>109</sup>およびR<sup>127</sup>は、請求項13に記載したとおりである、化合物。

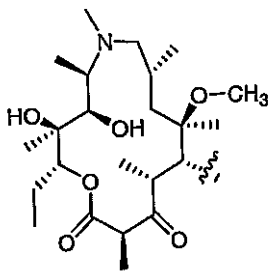
## 【請求項17】

Tが、T1～T33からなる群から選択されるマクロライドである、請求項1～16のいずれか1項に記載の化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、N-オキシドまたはプロドラッグ：

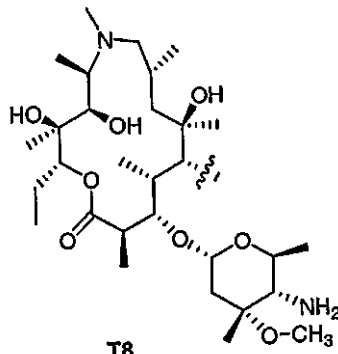
## 【化 2 8】



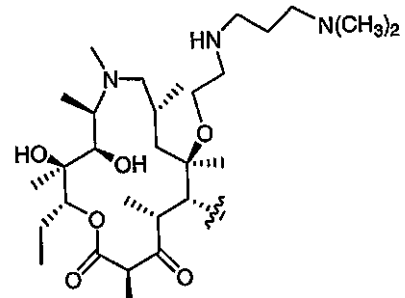
## 【化 2 9】



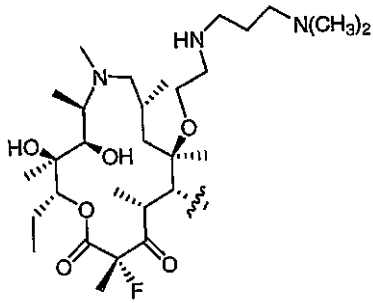
T7



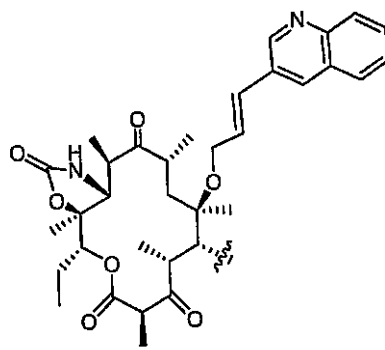
T8



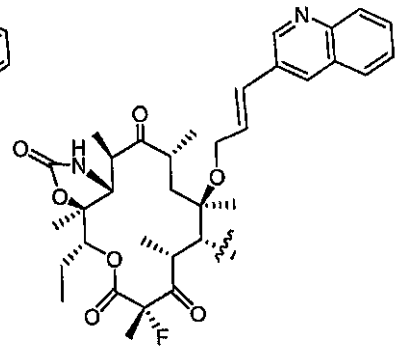
T9



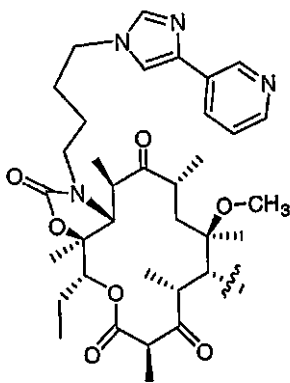
T10



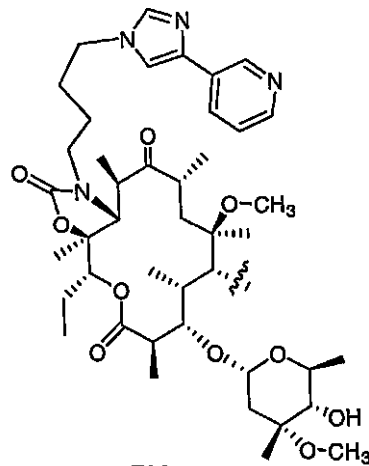
T11



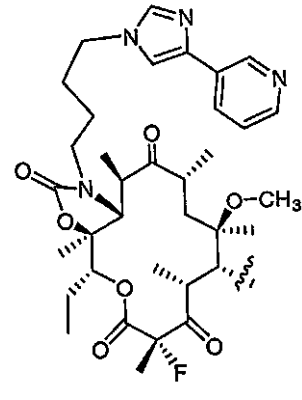
T12



T13

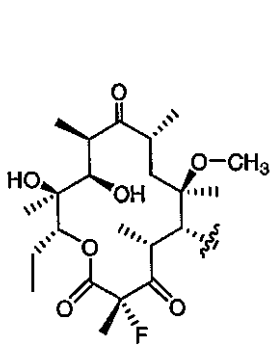


T14

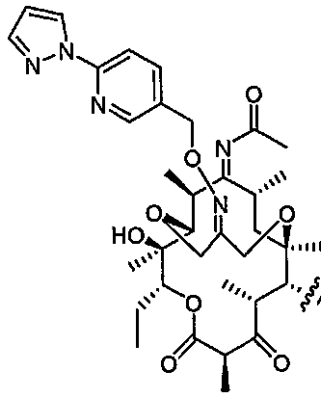


T15

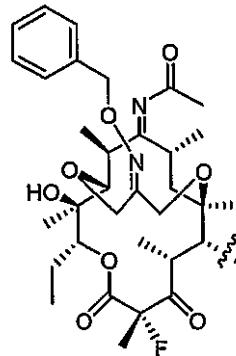
【化 3 0】



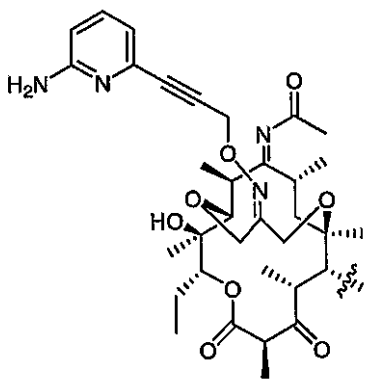
T16



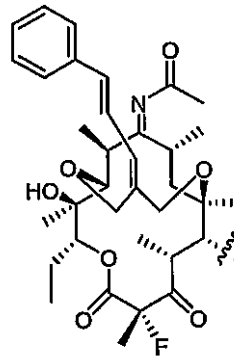
T17



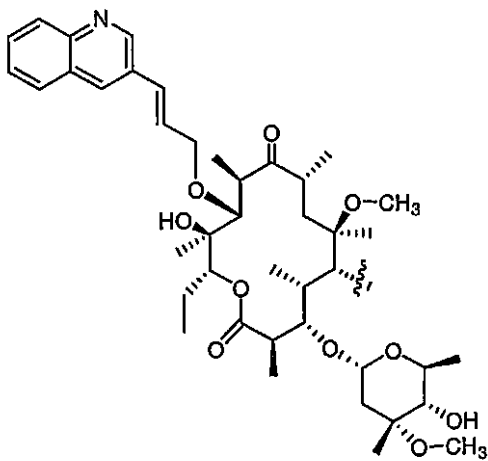
T18



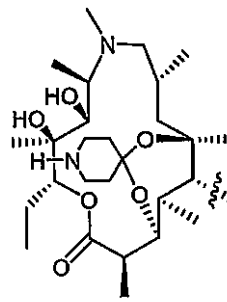
T19



T20



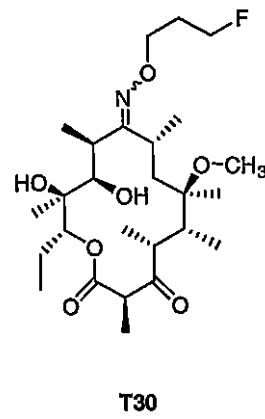
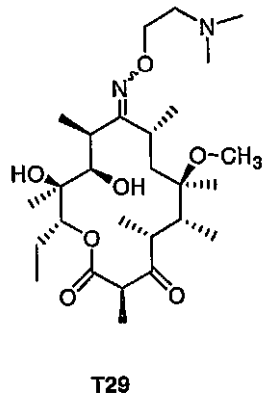
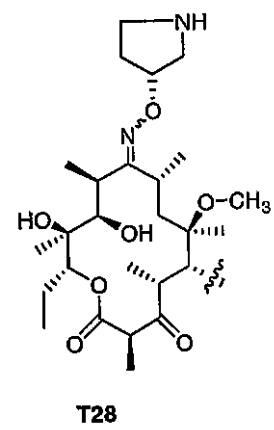
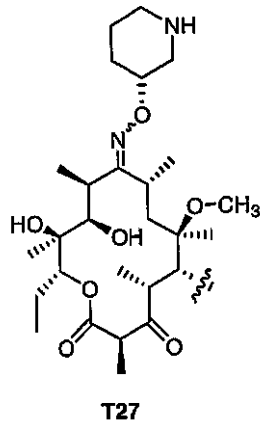
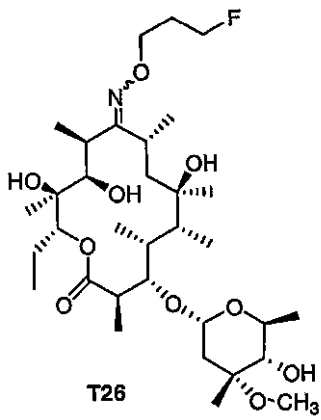
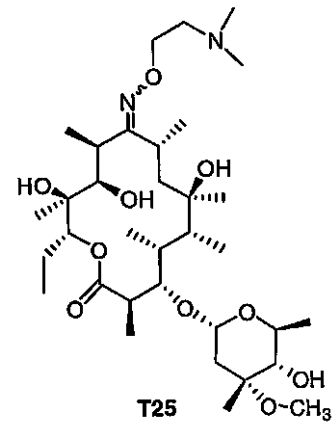
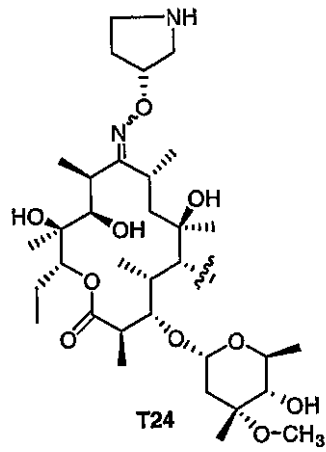
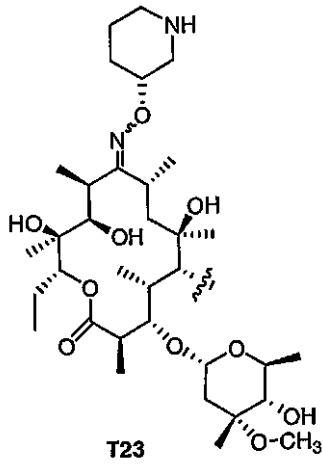
T21



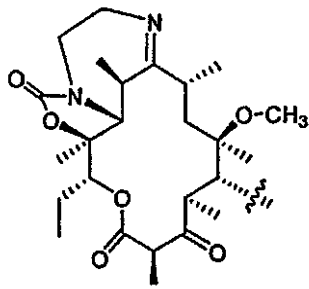
T22

;

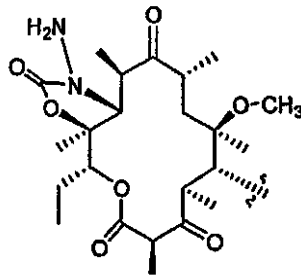
【化 3 1】



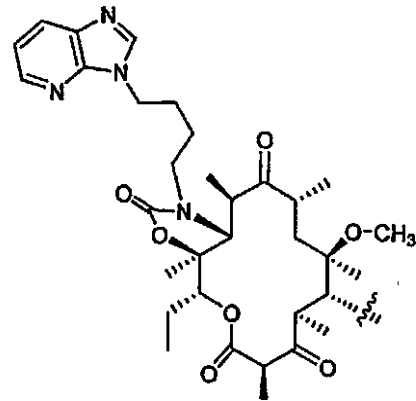
## 【化 3 2】



T31



T32



T33

## 【請求項 1 8】

表 1 または 1 3 で列挙した構造のいずれか 1 つに対応する構造を有する化合物、あるいはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、N - オキシドまたはプロドラッグ。

## 【請求項 1 9】

請求項 1 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の化合物と、薬学的に受容可能なキャリアとを含有する、医薬組成物。

## 【請求項 2 0】

哺乳動物における疾患状態を処置または予防するための組成物であって、有効量の請求項 1 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、組成物。

## 【請求項 2 1】

哺乳動物における微生物感染を処置するための組成物であって、有効量の請求項 1 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、組成物。

## 【請求項 2 2】

哺乳動物における真菌感染を処置するための組成物であって、有効量の請求項 1 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、組成物。

## 【請求項 2 3】

哺乳動物における寄生虫病を処置するための組成物であって、有効量の請求項 1 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、組成物。

## 【請求項 2 4】

哺乳動物における増殖疾患を処置するための組成物であって、有効量の請求項 1 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、組成物。

## 【請求項 2 5】

哺乳動物におけるウイルス感染を処置するための組成物であって、有効量の請求項 1 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、組成物。

## 【請求項 2 6】

哺乳動物における炎症疾患を処置するための組成物であって、有効量の請求項 1 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、組成物。

## 【請求項 2 7】

哺乳動物における胃腸運動障害を処置するための組成物であって、有効量の請求項 1 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、組成物。

## 【請求項 2 8】

ナンセンスまたはミスセンス突然変異により引き起こされるか媒介される哺乳動物における疾患状態を処置または予防するための組成物であって、該ナンセンスまたはミスセンス突然変異の発現を抑制する有効量の請求項 1 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、組成物。

## 【請求項 2 9】

前記組成物が、経口的、非経口的または局所的に投与されるのに適切である、請求項 20 ~ 26 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 30】

請求項 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の化合物を合成する方法。

【請求項 31】

請求項 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の化合物を含有する医療用デバイス。

【請求項 32】

前記医療用デバイスが、ステントである、請求項 31 に記載の医療用デバイス。