

【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30年7月12日(2018.7.12)

【公表番号】特表2017-517567(P2017-517567A)

【公表日】平成29年6月29日(2017.6.29)

【年通号数】公開・登録公報2017-024

【出願番号】特願2017-513597(P2017-513597)

【国際特許分類】

C 07 K	7/00	(2006.01)
A 61 K	38/00	(2006.01)
A 61 K	45/00	(2006.01)
A 61 P	31/04	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
A 61 K	31/43	(2006.01)
A 61 K	31/397	(2006.01)
A 61 K	31/545	(2006.01)
A 61 K	31/407	(2006.01)
A 61 K	31/165	(2006.01)
A 61 K	31/351	(2006.01)
A 61 K	31/496	(2006.01)
A 61 K	31/335	(2006.01)
C 07 K	5/10	(2006.01)

【F I】

C 07 K	7/00	
A 61 K	37/02	
A 61 K	45/00	
A 61 P	31/04	
A 61 P	43/00	1 2 1
A 61 K	31/43	
A 61 K	31/397	
A 61 K	31/545	
A 61 K	31/407	
A 61 K	31/165	
A 61 K	31/351	
A 61 K	31/496	
A 61 K	31/335	
C 07 K	5/10	

【手続補正書】

【提出日】平成30年5月21日(2018.5.21)

【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

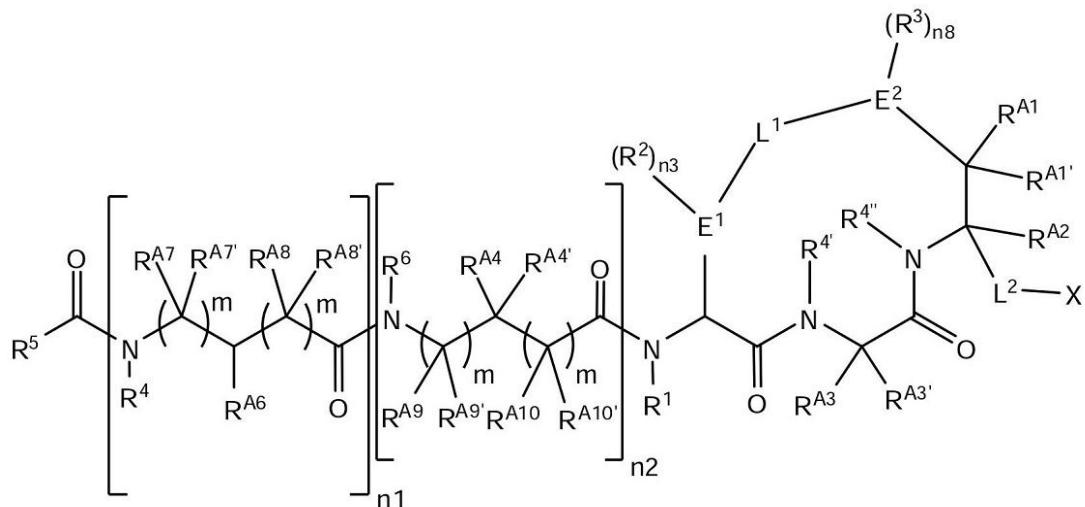
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物、あるいは、その薬学的に許容可能な塩、溶媒和物またはプロドラッグであって、

【化 1】



式 (I)

式中：

$E^1$  は、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>7</sub>) アルケニル、(C<sub>2</sub> - C<sub>7</sub>) アルキニル、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、またはアリールであり、

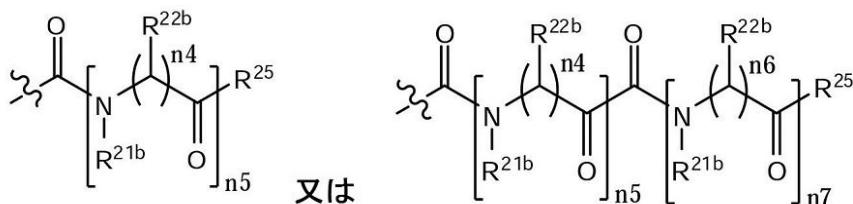
$E^2$  は、(C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)アルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、またはアリールであり、

$L^1$  は単結合、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NR^4-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CH_2O-$ 、 $-OCH_2$   
 $-CH_2S-$ 、 $-SCH_2-$ 、 $-CH_2NR^4-$ 、 $-NR^4CH_2-$ 、 $-NR^4C(O)-$ 、 $-C(O)NR^4-$ 、 $-NR^4S(O)_2-$ 、 $-S(O)_2NR^4-$ 、 $-NR^4C(O)NR^4-$ 、 $-NR^4C(O)O-$ 、 $-OC(O)NR^4-$ 、または  $OH$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、ハロゲン、 $(C_1-C_6)$  アルキルで随意に置換された  $(C_1-C_4)$  アルキレンであり、

$L^2$  は単結合または随意に置換された ( $C_1 - C_6$ ) アルキレンであり、

$X$  は  $-CH_2OH$ 、 $-CH(OH)CH_3$ 、 $-N(R^4)CH(R^{2-4})CN$ 、 $-NHCH(R^{2-4})C(O)CH_3$ 、 $-NHN(R^{2-4})C(O)CH_3$ 、 $-NHCH(R^{2-4})CH=CHS(O)_2CH_3$ 、 $-NHCH(R^{2-4})CH=CHS(O)_2NH_2$ 、

【化 2】

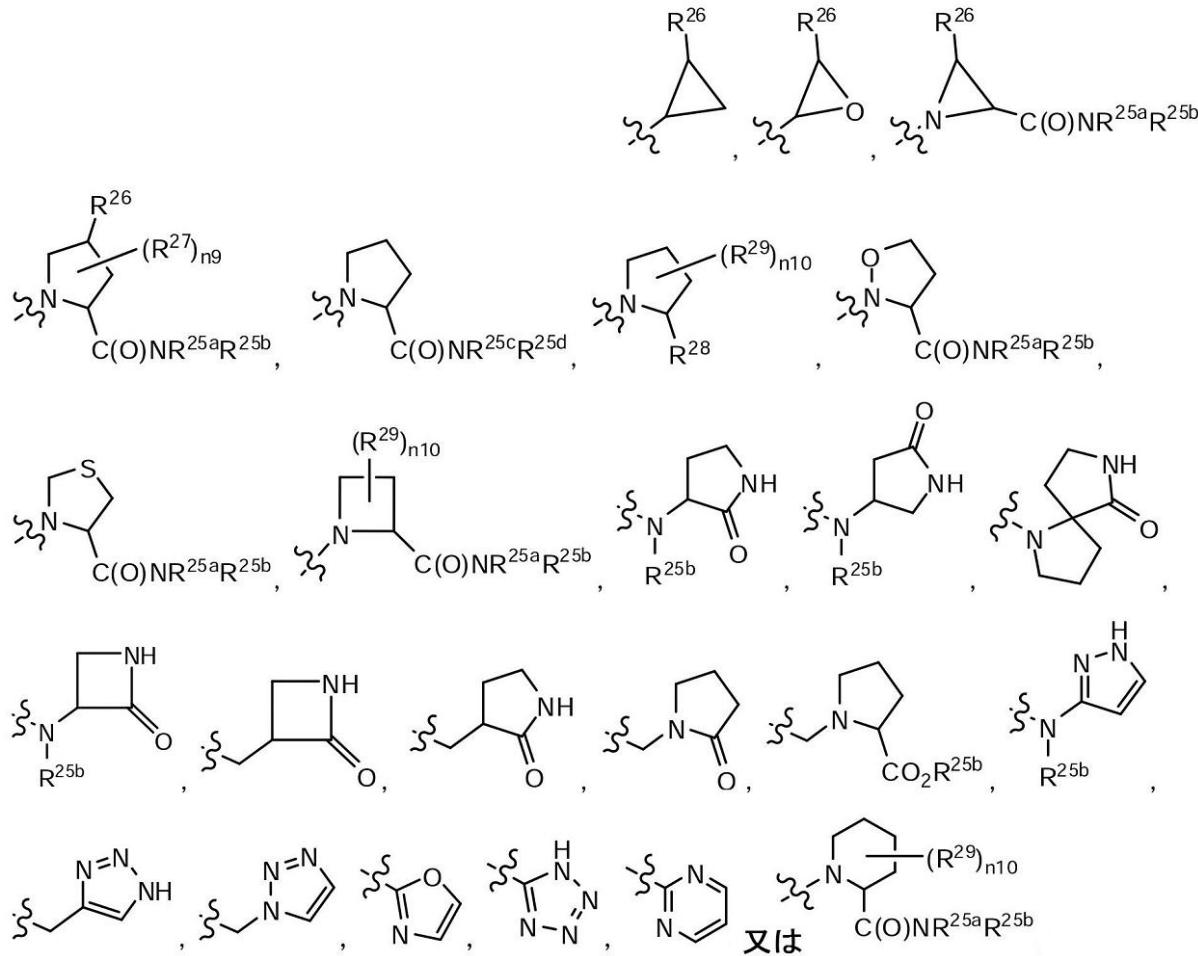


であり、

ここで、 $n_4$ 、 $n_5$ 、および $n_6$ はそれぞれ独立して、1、2、または3であり、 $n_7$ は0、1、または2であり、 $R^{2-1^b}$ と $R^{2-2^b}$ はそれぞれの出現時に、独立して、水素、ヒドロキシ、( $C_1 - C_6$ )アルキル、( $C_3 - C_7$ )シクロアルキル、5から7員のヘテロアリール、5から7員のヘテロシクリル、または( $C_6 - C_{10}$ )アリールであり、ここで、任意のアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、またはヘテロアリールは、1～3のJで随意に置換され、 $R^{2-4}$ はHまたは( $C_1 - C_6$ )アルキルであり、 $R^{2-5}$ は、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>Cl、-CH<sub>2</sub>OR<sup>2-5^b</sup>、-CH<sub>2</sub>R<sup>3-0</sup>、-C

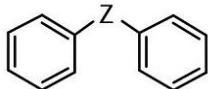
$(R^{2-6})_2C(O)NH_2$ 、 $-CH_2SO_2N(R^{2-5}b)_2$ 、 $-CH_2N(R^{2-5}b)$   
 $)SO_2(C_1-C_6\text{アルキル})$ 、 $-CH_2PO_3H$ 、 $-CH_2P(O)(OH)OCH_3$ 、 $-CH_2OC(O)CH_3$ 、 $-CH_2OC(O)R^{3-0}$ 、 $-CH_2CO_2R^{2-5}b$ 、  
 $-CF_2CO_2R^{2-5}b$ 、 $-CH_2CH_2CO_2R^{2-5}b$ 、 $-CH_2CH_2C(O)N(H)CH(R^{2-6})CO_2R^{2-5}b$ 、 $-CH_2N(H)CH(R^{2-6})C(O)N(H)R^{2-5}b$ 、  
 $-CH_2CH_2R^{3-0}$ 、 $-CH=CHR^{3-0}$ 、 $-CH=CHSO_2R^{2-5}b$ 、

【化 3】



であり、 $R^{2-5a}$  は  $H$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $NH_2$ 、 $SO_2$  ( $C_1 - C_6$ ) アルキル、または隨意に置換されたアルキルであり、 $R^{2-5b}$  はそれぞれ独立して  $H$ 、または隨意に置換されたアルキルであり、 $R^{2-5c}$  は  $H$  または隨意に置換されたアルキルであり、 $R^{2-5d}$  は  $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、または  $NH_2$  であり、 $R^{2-6}$  はそれぞれ独立して  $H$ 、ハロ、または ( $C_1 - C_6$ ) アルキルであり、 $R^{2-7}$  はそれぞれ独立して  $-OH$ 、ハロ、( $C_1 - C_6$ ) アルキルであり、あるいは、 $R^{2-6}$  と  $R^{2-7}$  は結合してシクロアルキル環を形成し、 $R^{2-8}$  は  $H$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH_2NH_2$ 、 $-C(O)CH_3$ 、または ( $C_1 - C_6$ ) アルキルであり、 $R^{2-9}$  はそれぞれ独立して  $-OH$ 、ハロ、または ( $C_1 - C_6$ ) アルキルであり、 $R^{3-0}$  はヘテロシクリル、ヘテロアリール、またはアリールであり、 $n=1, 2$ 、または  $3$  であり、 $n=10$  は  $0, 1, 2, 3$ 、または  $4$  であり、 $R^5$  はアリール、ヘテロアリール、または約  $1-22$  の炭素原子の直鎖または分枝鎖のアルキル鎖であり、ここで、 $R^5$  は、それが直接あるいは  $O$  または  $NR^4$  を介して結合しているカルボニル炭素に結合することで、アミド、カルバメート、または尿素結合をそれぞれ提供し、鎖内にまたは鎖の末端で、隨意に隨意されたアリール、隨意に置換されたヘテロアリール、または隨意に置換された

## 【化4】



を含み、ここで、Zは単結合、O、S、NH、CH<sub>2</sub>、またはC=Cであり、あるいは、R<sup>5</sup>は、鎖内に少なくとも1つの-O-または-N(R<sup>4</sup>)-を含む、約1-22の炭素原子の直鎖または分枝鎖のアルキル鎖であり、

各々のR<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>はそれぞれ独立して、ヒドロキシ、ニトロ、ハロ、シアノ、グリコシリオキシ、アミノ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、OR<sup>4</sup><sup>0</sup>、または式(I)の化合物を提供するための生理学的な条件下で切断可能な基であり、R<sup>2</sup>またはR<sup>3</sup>はそれぞれヒドロキシであり、任意の炭素原子はJで随意に置換され、

R<sup>4</sup><sup>0</sup>はそれぞれ独立して-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルまたは-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル-NR<sup>4</sup><sup>1</sup>R<sup>4</sup><sup>2</sup>であり、

R<sup>4</sup><sup>1</sup>とR<sup>4</sup><sup>2</sup>はそれぞれ水素、-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ヘテロアルキル、-C(O)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-C(O)N(R<sup>4</sup><sup>3</sup>)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>4</sup><sup>3</sup>)<sub>2</sub>であり、あるいは、R<sup>4</sup><sup>1</sup>とR<sup>4</sup><sup>2</sup>とそれらが結合する窒素原子は、ヘテロシクロアルキル環を形成し、

R<sup>4</sup><sup>3</sup>はそれぞれ独立して水素または-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルであり、あるいは、2つのR<sup>4</sup><sup>3</sup>とそれらが結合する窒素原子は、ヘテロシクロアルキル環を形成し、

n<sub>1</sub>とn<sub>2</sub>は独立して0または1であり、

n<sub>3</sub>とn<sub>8</sub>は独立して0、1、または2であり、

それぞれのmは独立して0または1であり、

R<sup>1</sup>は水素または1~3のJで随意に置換された(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルであり、

あるいは、R<sup>1</sup>はE<sup>1</sup>と一緒に環を形成し、

R<sup>4</sup>、R<sup>4</sup>'、およびR<sup>4</sup>''はそれぞれの出現時に、独立して、水素、または、1~3のJで随意に置換された(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルであり、

R<sup>6</sup>は、水素、または1~3のJで随意に置換された(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルであり、あるいは、R<sup>6</sup>はR<sup>A</sup><sup>4</sup>と一緒に環を形成し、

R<sup>A</sup><sup>1</sup>、R<sup>A</sup><sup>1</sup>、R<sup>A</sup><sup>2</sup>、R<sup>A</sup><sup>3</sup>、R<sup>A</sup><sup>3</sup>、R<sup>A</sup><sup>4</sup>、R<sup>A</sup><sup>4</sup>、R<sup>A</sup><sup>7</sup>、R<sup>A</sup><sup>7</sup>、R<sup>A</sup><sup>8</sup>、R<sup>A</sup><sup>8</sup>、R<sup>A</sup><sup>9</sup>、R<sup>A</sup><sup>9</sup>、R<sup>A</sup><sup>10</sup>、およびR<sup>A</sup><sup>10</sup>は、それぞれの出現時に、独立して、水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)シクロアルキル、5から7員のヘテロアリール、5から7員のヘテロシクリル、または(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリールであり、任意のアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、またはヘテロアリールは、1~3のJで随意に置換され、

R<sup>A</sup><sup>6</sup>はH、アミノ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)シクロアルキル、5から7員のヘテロアリール、5から7員のヘテロシクリル、または(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリールであり、ここで、任意のアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、またはヘテロアリールは1~3のJで随意に置換され、

Jはそれぞれ独立してハロゲン、R'、OR'、CN、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pN(R')<sub>2</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pSR'、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pS(O)<sub>2</sub>R'、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pS(O)<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pSO<sub>3</sub>R'、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pC(O)R'、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pC(O)OR'、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pC(O)N(R')<sub>2</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pOC(O)N(R')<sub>2</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pNH-C(O)R'、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pN(R')SO<sub>2</sub>R'、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pN(R')C(O)OR'、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pN(R')C(O)R'、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pN(R')C(O)N(R')<sub>2</sub>、または(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pC(=NH)N(R')<sub>2</sub>であり、ここでpは4であり、それぞれのR'は、それぞれの出現時に、独立して、水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-アルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-シクロアルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-シクロアルケニル、アリール、またはヘテロアリールであ

り、ここで、任意のアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール、またはヘテロアリールは、F、Cl、Br、I、-CN、-NO<sub>2</sub>、-OH、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-OCH<sub>3</sub>、-NH<sub>2</sub>、-N((C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル)、-、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>シクロアルキル、またはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ヘテロアルキルから選択された置換基で随意に置換される、化合物。

## 【請求項2】

R<sup>A1</sup>、R<sup>A1</sup>、R<sup>4</sup>、およびR<sup>4</sup>はHである、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項3】

L<sup>2</sup>は単結合であり、R<sup>1</sup>はCH<sub>3</sub>である、請求項2に記載の化合物。

## 【請求項4】

n<sub>1</sub>は1であり、n<sub>2</sub>は1である、請求項3に記載の化合物。

## 【請求項5】

R<sup>A2</sup>、R<sup>A3</sup>、R<sup>A3</sup>、R<sup>A4</sup>、R<sup>A4</sup>、R<sup>A7</sup>、R<sup>A7</sup>、R<sup>A8</sup>、R<sup>A8</sup>、R<sup>A9</sup>、R<sup>A9</sup>、R<sup>A10</sup>、および、R<sup>A10</sup>は各々独立して、水素または1~3のJで随意に置換された(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルである、請求項4に記載の化合物。

## 【請求項6】

R<sup>A6</sup>は1~3のJで随意に置換された(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルである、請求項5に記載の化合物。

## 【請求項7】

n<sub>1</sub>は0であり、n<sub>2</sub>は1である、請求項3に記載の化合物。

## 【請求項8】

R<sup>A2</sup>、R<sup>A3</sup>、R<sup>A3</sup>、R<sup>A4</sup>、R<sup>A4</sup>、R<sup>A9</sup>、R<sup>A9</sup>、R<sup>A10</sup>、およびR<sup>A10</sup>は各々独立して、水素または1~3のJで随意に置換された(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルである、請求項7に記載の化合物。

## 【請求項9】

R<sup>4</sup>は水素である、請求項8に記載の化合物。

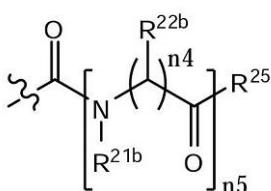
## 【請求項10】

n<sub>1</sub>は0であり、n<sub>2</sub>は0である、請求項3に記載の化合物。

## 【請求項11】

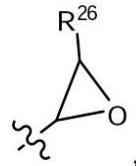
Xは、

## 【化5】



であり、R<sup>2</sup>~<sup>5</sup>は、

## 【化6】

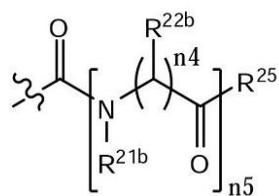


であり、R<sup>2</sup>~<sup>6</sup>は水素または-CH<sub>3</sub>である、請求項10に記載の化合物。

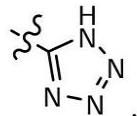
## 【請求項12】

Xは、

【化7】

であり、R<sup>2~5</sup>は、

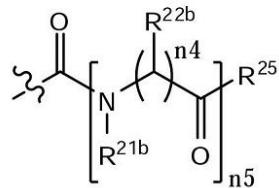
【化8】

である、請求項10に記載の化合物。

【請求項13】

Xは、

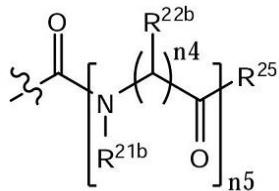
【化9】

であり、R<sup>2~5</sup>は-C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>である、請求項10に記載の化合物。

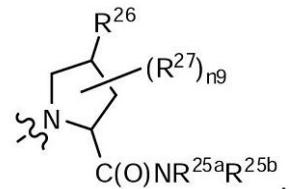
【請求項14】

Xは、

【化10】

であり、R<sup>2~5</sup>は、

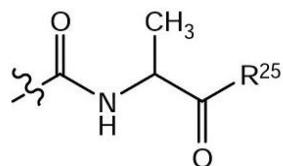
【化11】

である、請求項10に記載の化合物。

【請求項15】

Xは、

## 【化12】

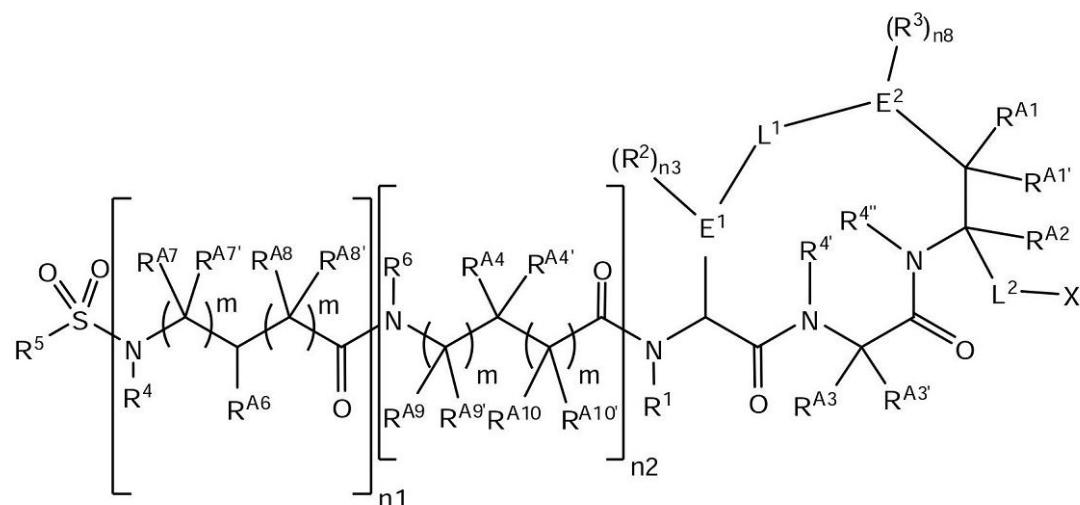


である、請求項13に記載の化合物。

## 【請求項16】

式(IV)の化合物、あるいは、その薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、またはプロドラッグであって、

## 【化13】



式(IV)

式中：

E<sup>1</sup>は、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)アルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、またはアリールであり、

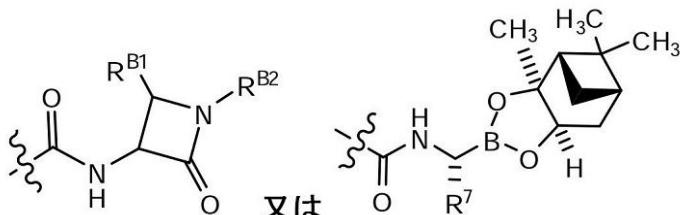
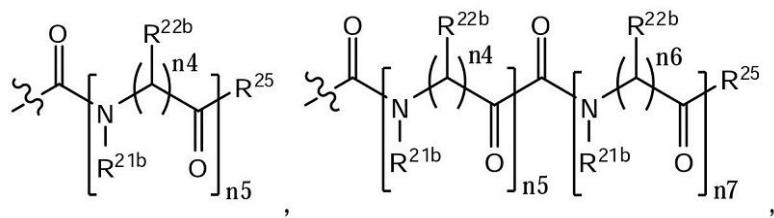
E<sup>2</sup>は、(C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)アルケニル、(C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)アルキニル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、またはアリールであり、

L<sup>1</sup>は単結合、-O-、-S-、-NR<sup>4</sup>-、-C(O)-、-CH<sub>2</sub>O-、-OCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>S-、-SCH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>-、-NR<sup>4</sup>CH<sub>2</sub>-、-NR<sup>4</sup>C(O)-、-C(O)NR<sup>4</sup>-、-NR<sup>4</sup>S(O)<sub>2</sub>-、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>-、-NR<sup>4</sup>C(O)NR<sup>4</sup>-、-NR<sup>4</sup>C(O)O-、-OC(O)NR<sup>4</sup>-、またはOH、CN、NO<sub>2</sub>、ハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルで随意に置換された(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキレンであり、

L<sup>2</sup>は単結合または随意に置換された(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキレンであり、

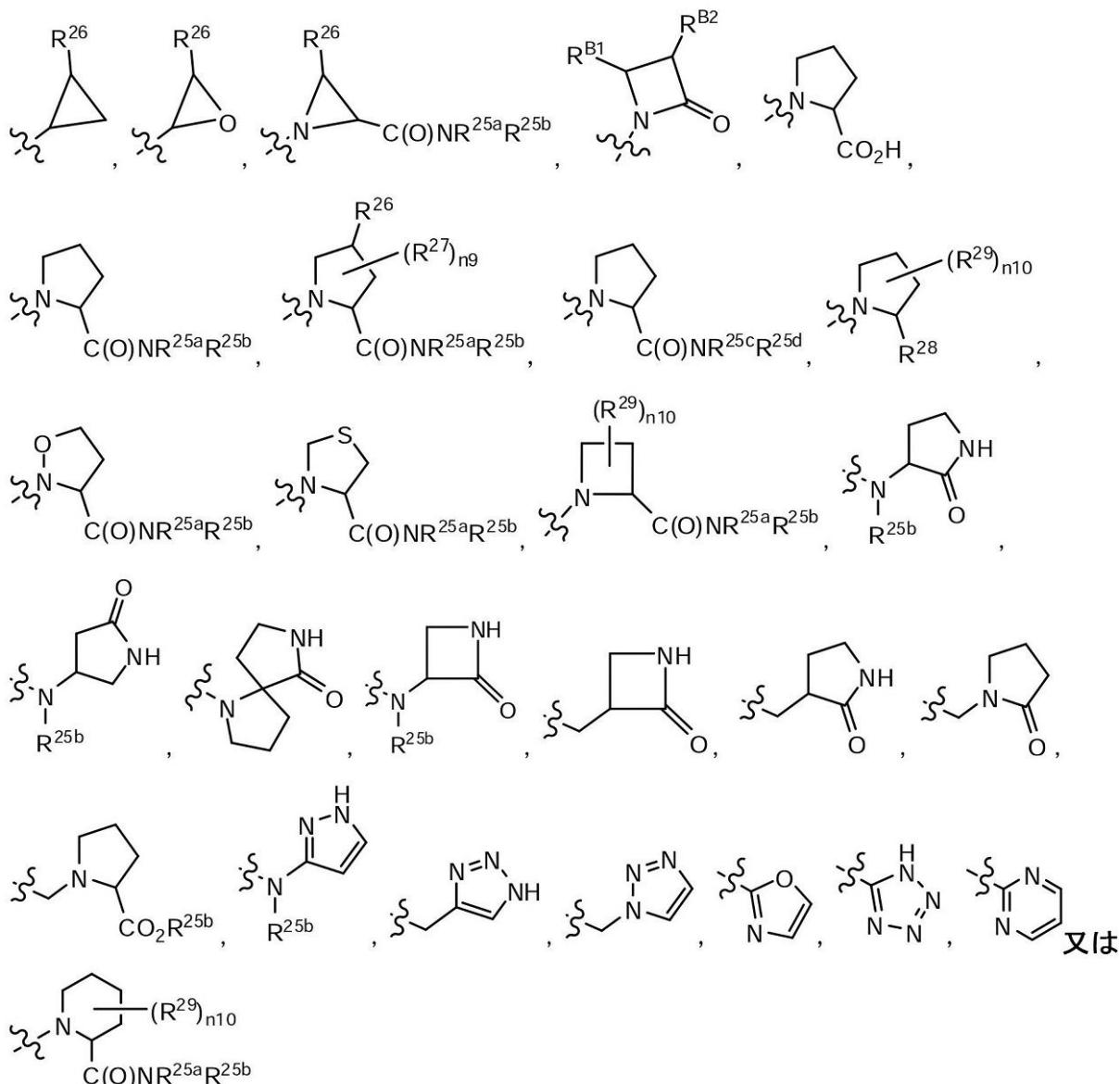
Xは、-CO<sub>2</sub>H、-CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H、-C(=O)NHC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>C(=O)H、-CH<sub>2</sub>C(=O)H、-C(=O)N(H)CH(R<sup>7</sup>)B(OR<sup>B</sup><sub>3</sub>)(OR<sup>B</sup><sub>4</sub>)、-CH<sub>2</sub>OH、-CH(OH)CH<sub>3</sub>、-N(R<sup>4</sup>)CH(R<sup>2</sup>4)CN、-NHCH(R<sup>2</sup>4)C(O)CH<sub>3</sub>、-NHN(R<sup>2</sup>4)C(O)CH<sub>3</sub>、-NHCH(R<sup>2</sup>4)CH=CHS(O)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-NHCH(R<sup>2</sup>4)CH=CHS(O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、

【化14】



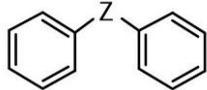
であり、ここで、 $n_4$ 、 $n_5$ 、および $n_6$ はそれぞれ独立して、1、2、または3であり、 $n_7$ は、0、1、または2であり、 $R^7$ はH、メチル、エチル、または $-CH_2OH$ であり、あるいは、 $R^7$ と $R^{B3}$ はホウ素原子と一緒に、5または6員のホウ素含有環を形成し、 $R^{B3}$ と $R^{B4}$ はそれぞれ独立して、H、( $C_1 - C_6$ )アルキル、 $-CH_2CO$ 、 $-CH_2CH_2CO_2H$ であり、あるいは、 $R^{B3}$ と $R^{B4}$ はホウ素原子と一緒に、隨意に置換された5または6員のホウ素含有環を形成し、 $R^{21b}$ と $R^{22b}$ はそれぞれの出現時に、独立して、水素、ヒドロキシ、( $C_1 - C_6$ )アルキル、( $C_3 - C_7$ )シクロアルキル、5から7員のヘテロアリール、5から7員のヘテロシクリル、または( $C_6 - C_{10}$ )アリールであり、ここで、任意のアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、またはヘテロアリールは、1～3のJで隨意に置換され、 $R^{24}$ はHまたは( $C_1 - C_6$ )アルキルであり、 $R^{25}$ は、H、OH、 $OR^C$ 、 $NR^{25a}R^{25b}$ 、 $-CH_3$ 、 $-CH_2Cl$ 、 $-CH_2OR^{25b}$ 、 $-CH_2R^{30}$ 、 $-C(R^{26})_2C(O)NH_2$ 、 $-CH_2SO_2N(R^{25b})_2$ 、 $-CH_2N(R^{25b})SO_2(C_1 - C_6)$ アルキル)、 $-CH_2PO_3H$ 、 $-CH_2P(O)(OH)OCH_3$ 、 $-CH_2O(CO)CH_3$ 、 $-CH_2OC(O)R^{30}$ 、 $-CH_2CO_2R^{25b}$ 、 $-CF_2CO_2R^{25b}$ 、 $-CH_2CH_2CO_2R^{25b}$ 、 $-CH_2CH_2C(O)N(R^{25b})_2$ 、 $-CH_2CH_2C(O)N(H)CH(R^{26})CO_2R^{25b}$ 、 $-CH_2N(H)CH(R^{26})C(O)N(H)R^{25b}$ 、 $-CH_2CH_2R^{30}$ 、 $-N(H)CH_2(R^3)^0$ 、 $-CH=CHR^{30}$ 、 $-CH=CHSO_2R^{25b}$ 、

【化 1 5】



であり、R<sup>B-1</sup>とR<sup>B-2</sup>が各々独立して、H、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)シクロアルキル、OR<sup>C</sup>、C(=O)N(R<sup>C</sup>)<sub>2</sub>、OC(=O)N(R<sup>C</sup>)<sub>2</sub>、C(=O)OR<sup>C</sup>、OC(=O)OR<sup>C</sup>、ニトロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)チオアルコキシ、N(R<sup>C</sup>)<sub>2</sub>、5から7員のヘテロシクリルまたは5から7員のヘテロアリール、あるいは(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリールであり、R<sup>C</sup>は独立して、それぞれの出現時に、Hまたは(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルであり、R<sup>2-5a</sup>は、H、-OH、-OCH<sub>3</sub>、NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、または隨意に置換されたアルキルであり、R<sup>2-5b</sup>はそれぞれ独立してH、または隨意に置換されたアルキルであり、R<sup>2-5c</sup>はHまたは隨意に置換されたアルキルであり、R<sup>2-5d</sup>は-OH、-OCH<sub>3</sub>、またはNH<sub>2</sub>であり、R<sup>2-6</sup>はそれぞれ独立してH、ハロ、または(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルであり、R<sup>2-7</sup>はそれぞれ独立して-OH、ハロ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルであり、あるいは、R<sup>2-6</sup>とR<sup>2-7</sup>は結合してシクロアルキル環を形成し、R<sup>2-8</sup>はH、-CH<sub>2</sub>OH、-CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-C(O)CH<sub>3</sub>、または(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルであり、R<sup>2-9</sup>はそれぞれ独立して-OH、ハロ、または(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルであり、R<sup>3-0</sup>はヘテロシクリル、ヘテロアリール、またはアリールであり、n<sub>9</sub>は1、2、または3であり、n<sub>10</sub>は0、1、2、3、または4であり、R<sup>5</sup>は、鎖内または鎖の末端に、隨意に置換されたアリール、隨意に置換されたヘテロアリール、あるいは隨意に置換された

## 【化16】



を隨意に含む、約1-22の炭素原子の直鎖または分枝鎖のアルキル鎖であり、Zは単結合、O、S、NH、CH<sub>2</sub>、またはC-Cであり、あるいは、R<sup>5</sup>は、鎖内に少なくとも1つの-O-または-N(R<sup>4</sup>)-を含む、約1-22の炭素原子の直鎖または分枝鎖のアルキル鎖であり、

各々のR<sup>2</sup>とR<sup>3</sup>はそれぞれ独立して、ヒドロキシ、ニトロ、ハロ、シアノ、グリコシリオキシ、アミノ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、OR<sup>40</sup>、または、式(I V)の化合物を提供するための生理学的な条件下で切断可能な基であり、R<sup>2</sup>またはR<sup>3</sup>はそれぞれヒドロキシであり、任意の炭素原子はJで隨意に置換され、

R<sup>40</sup>はそれぞれ独立して-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルまたは-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル-NR<sup>41</sup>R<sup>42</sup>であり、

R<sup>41</sup>とR<sup>42</sup>はそれぞれ水素、-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ヘテロアルキル、-C(O)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、-C(O)N(R<sup>43</sup>)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>N(R<sup>43</sup>)<sub>2</sub>であり、あるいは、R<sup>41</sup>とR<sup>42</sup>とそれらが結合する窒素原子は、ヘテロシクロアルキル環を形成し、

R<sup>43</sup>はそれぞれ独立して水素または-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルであり、

あるいは、2つのR<sup>43</sup>とそれらが結合する窒素原子は、ヘテロシクロアルキル環を形成し、

n<sub>1</sub>とn<sub>2</sub>は独立して0または1であり、

n<sub>3</sub>とn<sub>8</sub>は独立して0、1、または2であり、

それぞれのmは独立して0または1であり、

R<sup>1</sup>は水素または1~3のJで隨意に置換された(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルであり、あるいは、R<sup>1</sup>はE<sup>1</sup>と一緒に環を形成し、

R<sup>4</sup>、R<sup>4'</sup>、およびR<sup>4''</sup>はそれぞれの出現時に、独立して、水素、または、1~3のJで隨意に置換された(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルであり、

R<sup>6</sup>は、水素、または1~3のJで隨意に置換された(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルであり、あるいは、R<sup>6</sup>はR<sup>A4</sup>と一緒に環を形成し、

R<sup>A1</sup>、R<sup>A1'</sup>、R<sup>A2</sup>、R<sup>A3</sup>、R<sup>A3'</sup>、R<sup>A4</sup>、R<sup>A4'</sup>、R<sup>A7</sup>、R<sup>A7'</sup>、R<sup>A8</sup>、R<sup>A8'</sup>、R<sup>A9</sup>、R<sup>A9'</sup>、R<sup>A10</sup>、およびR<sup>A10'</sup>は、それぞれの出現時に、独立して、水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)シクロアルキル、5から7員のヘテロアリール、5から7員のヘテロシクリル、または(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリールであり、任意のアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、またはヘテロアリールは、1~3のJで隨意に置換され、

R<sup>A6</sup>はH、アミノ、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)シクロアルキル、5から7員のヘテロアリール、5から7員のヘテロシクリル、または(C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)アリールであり、ここで、任意のアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクリル、アリール、またはヘテロアリールは1~3のJで隨意に置換され、

Jはそれぞれ独立してハロゲン、R'、OR'、CN、CF<sub>3</sub>、OCF<sub>3</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pN(R')<sub>2</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pSR'、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pS(O)<sub>2</sub>R'、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pS(O)<sub>2</sub>N(R')<sub>2</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pSO<sub>3</sub>R'、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pC(O)R'、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pC(O)OR'、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pC(O)N(R')<sub>2</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pOC(O)N(R')<sub>2</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pNH-C(O)R'、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pN(R')SO<sub>2</sub>R'、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pN(R')C(O)OR'、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pN(R')C(O)R'、(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pN(R')C(O)N(R')<sub>2</sub>、または(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>-pC(=NH)N(R')<sub>2</sub>であり、ここでpは4であり、それぞれのR'は、それぞれの出現時に、独立して、水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-アルキル、

$(C_2 - C_7)$  - アルケニル、 $(C_2 - C_7)$  - アルキニル、 $(C_3 - C_{10})$  - シクロアルキル、 $(C_3 - C_{10})$  - シクロアルケニル、アリール、またはヘテロアリールであり、ここで、任意のアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール、またはヘテロアリールは、F、Cl、Br、I、-CN、-NO<sub>2</sub>、-OH、-CF<sub>3</sub>、-OCF<sub>3</sub>、-OCH<sub>3</sub>、-NH<sub>2</sub>、-N((C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル)、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>シクロアルキル、またはC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ヘテロアルキルから選択された置換基で随意に置換される、化合物。

【請求項17】

請求項1の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物、および薬学的に許容可能な賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項18】

哺乳動物の細菌感染症の処置で使用される薬物の製造における、請求項1の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物の使用。

【請求項19】

細菌感染症は、*Pseudomonas aeruginosa*, *Pseudomonas fluorescens*, *Pseudomonas acidovorans*, *Pseudomonas alcaligenes*, *Pseudomonas putida*, *Stenotrophomonas maltophilia*, *Burkholderia cepacia*, *Aeromonas hydrophilia*, *Escherichia coli*, *Citrobacter freundii*, *Salmonella typhimurium*, *Salmonella typhi*, *Salmonella paratyphi*, *Salmonella enteritidis*, *Shigella dysenteriae*, *Shigella flexneri*, *Shigella sonnei*, *Enterobacter cloacae*, *Enterobacter aerogenes*, *Klebsiella pneumoniae*, *Klebsiella oxytoca*, *Serratia marcescens*, *Francisella tularensis*, *Morganella morgani*, *Proteus mirabilis*, *Proteus vulgaris*, *Providencia alcalifaciens*, *Providencia rettgeri*, *Providencia stuartii*, *Acinetobacter baumannii*, *Acinetobacter calcoaceticus*, *Acinetobacter haemolyticus*, *Yersinia enterocolitica*, *Yersinia pestis*, *Yersinia pseudotuberculosis*, *Yersinia intermedia*, *Bordetella pertussis*, *Bordetella parapertussis*, *Bordetella bronchiseptica*, *Haemophilus influenzae*, *Haemophilus parainfluenzae*, *Haemophilus haemolyticus*, *Haemophilus parahaemolyticus*, *Haemophilus ducreyi*, *Pasteurella multocida*, *Pasteurella haemolytica*, *Branhamella catarrhalis*, *Helicobacter pylori*, *Campylobacter fetus*, *Campylobacter jejuni*, *Campylobacter coli*, *Borrelia burgdorferi*, *Vibrio cholerae*, *Vibrio parahaemolyticus*, *Legionella pneumophila*, *Listeria monocytogenes*, *Neisseria gonorrhoeae*, *Neisseria meningitidis*, *Kingella*, *Moraxella*, *Gardnerella vaginalis*, *Bacteroides fragilis*, *Bacteroides distasonis*, *Bactero*

ides 3452A homology group, Bacteroides vulgaris, Bacteroides ovalis, Bacteroides thetaiotomicron, Bacteroides uniformis, Bacteroides eggertthii, Bacteroides splanchnicus, Clostridium difficile, Mycobacterium tuberculosis, Mycobacterium avium, Mycobacterium intracellulare, Mycobacterium leprae, Corynebacterium diphtheriae, Corynebacterium ulcerans, Streptococcus pneumoniae, Streptococcus agalactiae, Streptococcus pyogenes, Enterococcus faecalis, Enterococcus faecium, Staphylococcus aureus, Staphylococcus epidermidis, Staphylococcus saprophyticus, Staphylococcus intermedius, Staphylococcus hyicus subsp. hyicus, Staphylococcus haemolyticus, Staphylococcus hominis, またはStaphylococcus saccharolyticusを含む感染である、請求項18に記載の使用。

【請求項20】

細菌感染症はグラム陰性細菌を含む感染である、請求項18に記載の使用。

【請求項21】

投与は局所投与を含む、請求項18に記載の使用。