

【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 0 7 K 7/00 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/43 (2006.01)

A 6 1 K 31/397 (2006.01)

A 6 1 K 31/545 (2006.01)

A 6 1 K 31/407 (2006.01)

A 6 1 K 31/165 (2006.01)

A 6 1 K 31/351 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/335 (2006.01)

C 0 7 K 5/10 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 K 7/00

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 31/43

A 6 1 K 31/397

A 6 1 K 31/545

A 6 1 K 31/407

A 6 1 K 31/165

A 6 1 K 31/351

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/335

C 0 7 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

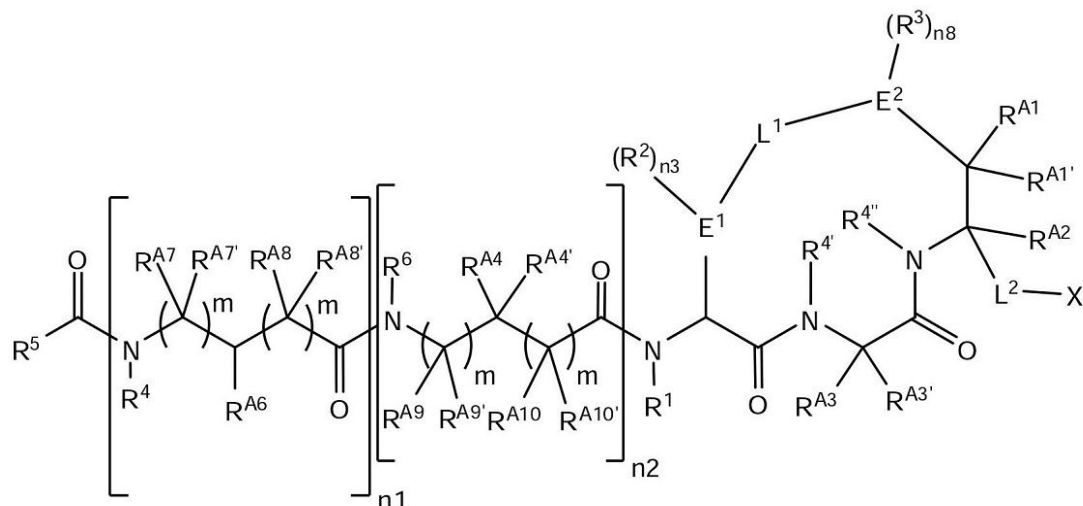
【補正の内容】

【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、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_2 - C_7)$ アルケニル、 $(C_2 - C_7)$ アルキニル、 $(C_3 - C_7)$ 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、

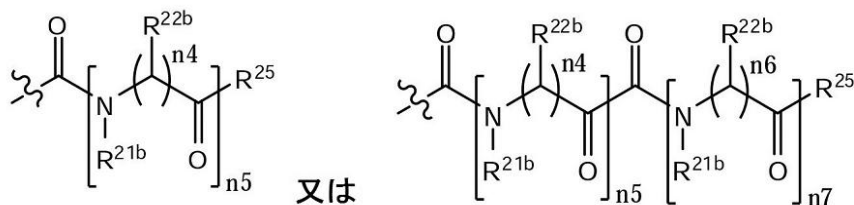
E^2 は、 $(C_2 - C_7)$ アルケニル、 $(C_2 - C_7)$ アルキニル、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、またはアリールであり、

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 $-CH_2OH$ 、 $-CH(OH)CH_3$ 、 $-N(R^4)CH(R^{24})CN$ 、 $-NHCH(R^{24})C(O)CH_3$ 、 $-NHN(R^{24})C(O)CH_3$ 、 $-NHCH(R^{24})CH=CHS(O)_2CH_3$ 、 $-NHCH(R^{24})CH=CHS(O)_2NH_2$ 、

【化 2】



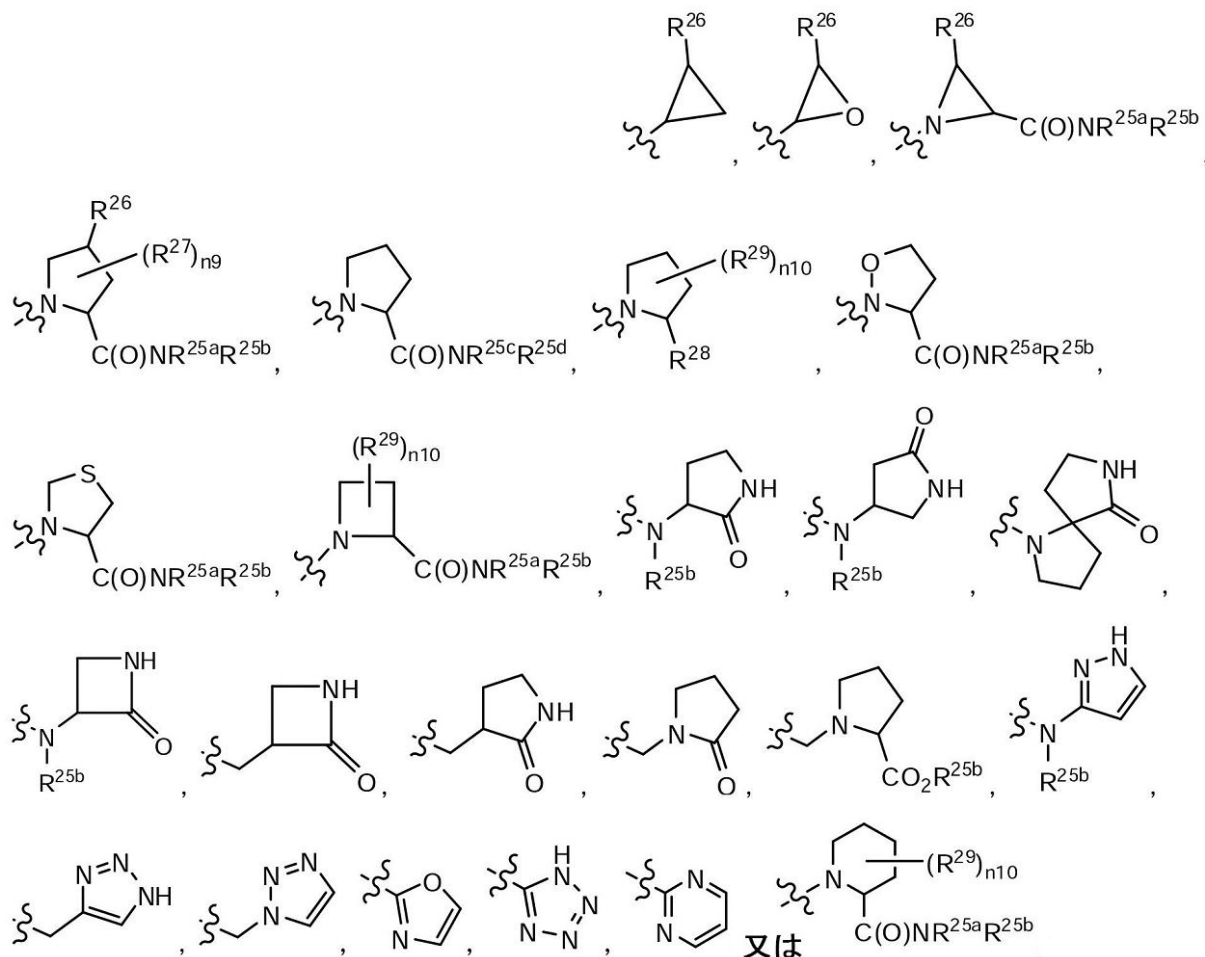
又は

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^{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 で随意に置換され、 R^{24} は H または $(C_1 - C_6)$ アルキルであり、 R^{25} は、 $-CH_3$ 、 $-CH_2Cl$ 、 $-CH_2OR^{25b}$ 、 $-CH_2R^{30}$ 、 $-C$

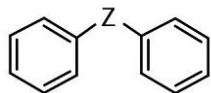
$(R^{26})_2C(O)NH_2$ 、 $-CH_2SO_2N(R^{25b})_2$ 、 $-CH_2N(R^{25b})SO_2(C_1-C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-CH_2PO_3H$ 、 $-CH_2P(O)(OH)OCH_3$ 、 $-CH_2OC(O)CH_3$ 、 $-CH_2OC(O)R^{30}$ 、 $-CH_2CO_2R^{25b}$ 、 $-CF_2CO_2R^{25b}$ 、 $-CH_2CH_2CO_2R^{25b}$ 、 $-CH_2CH_2C(O)N(R^{25b})_2$ 、 $-CH_2CH_2C(O)N(H)CH(R^{26})CO_2R^{25b}$ 、 $-CH_2N(H)CH(R^{26})C(O)N(H)R^{25b}$ 、 $-CH_2CH_2R^{30}$ 、 $-N(H)CH_2(R^{30})$ 、 $-CH=CHR^{30}$ 、 $-CH=CHSO_2R^{25b}$ 、

【化3】



であり、 R^{25a} はH、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 NH_2 、 $SO_2(C_1-C_6)$ アルキル、または随意に置換されたアルキルであり、 R^{25b} はそれぞれ独立してH、または随意に置換されたアルキルであり、 R^{25c} はHまたは随意に置換されたアルキルであり、 R^{25d} は $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、または NH_2 であり、 R^{26} 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^{27} 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^{26} と R^{27} は結合してシクロアルキル環を形成し、 R^{28} 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^{29} 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^{30} 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_9 は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、随意に置換されたアリール、随意に置換されたヘテロアリール、または随意に置換された

【化 4】



を含み、ここで、Zは単結合、O、S、NH、CH₂、またはC—Cであり、あるいは、R⁵は、鎖内に少なくとも1つの—O—または—N(R⁴)—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R²とR³はそれぞれ独立して、ヒドロキシ、ニトロ、ハロ、シアノ、グリコシルオキシ、アミノ、(C₁—C₄)アルキル、OR^{4 0}、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、R²またはR³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^{4 0}はそれぞれ独立して—(C₁—C₆)アルキルまたは—(C₁—C₆)アルキル—NR^{4 1}R^{4 2}であり、

R^{4 1}とR^{4 2}はそれぞれ水素、—(C₁—C₆)アルキル、—(C₁—C₆)ヘテロアルキル、—C(O)(C₁—C₆)アルキル、—C(O)N(R^{4 3})₂、—SO₂N(R^{4 3})₂であり、あるいは、R^{4 1}とR^{4 2}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^{4 3}はそれぞれ独立して水素または—(C₁—C₆)アルキルであり、あるいは、2つのR^{4 3}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、

n₁とn₂は独立して0または1であり、

n₃とn₈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、

R¹は水素または1～3のJで随意に置換された(C₁—C₆)アルキルであり、

あるいは、R¹はE¹と一緒に環を形成し、

R⁴、R^{4'}、およびR^{4''}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(C₁—C₆)アルキルであり、

R⁶は、水素、または1～3のJで随意に置換された(C₁—C₆)アルキルであり、あるいは、R⁶はR^{A 4}と一緒に環を形成し、

R^{A 1}、R^{A 1'}、R^{A 2}、R^{A 3}、R^{A 3'}、R^{A 4}、R^{A 4'}、R^{A 7}、R^{A 7'}、R^{A 8}、R^{A 8'}、R^{A 9}、R^{A 9'}、R^{A 10}、およびR^{A 10'}は、それぞれの出現時に、独立して、水素、(C₁—C₆)アルキル、(C₃—C₇)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(C₆—C₁₀)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^{A 6}はH、アミノ、(C₁—C₆)アルキル、(C₃—C₇)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(C₆—C₁₀)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、CF₃、OCF₃、(CH₂)₀—_pN(R['])₂、(CH₂)₀—_pSR[']、(CH₂)₀—_pS(O)₂R[']、(CH₂)₀—_pS(O)₂N(R['])₂、(CH₂)₀—_pSO₃R[']、(CH₂)₀—_pC(O)R[']、(CH₂)₀—_pC(O)OR[']、(CH₂)₀—_pC(O)N(R['])₂、(CH₂)₀—_pOC(O)N(R['])₂、(CH₂)₀—_pNH—C(O)R[']、(CH₂)₀—_pN(R['])SO₂R[']、(CH₂)₀—_pN(R['])C(O)OR[']、(CH₂)₀—_pN(R['])C(O)N(R['])₂、または(CH₂)₀—_pC(=NH)N(R['])₂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、(C₁—C₆)—アルキル、(C₂—C₇)—アルケニル、(C₂—C₇)—アルキニル、(C₃—C₁₀)—シクロアルキル、(C₃—C₁₀)—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、-NO₂、-OH、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、-NH₂、-N((C₁-C₄)アルキル)₂、-NH(C₁-C₄)アルキル、C₁-C₆アルキル、C₃-C₈シクロアルキル、またはC₁-C₆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^{A1} 、 $R^{A1'}$ 、 $R^{A4'}$ 、および $R^{A4''}$ はHである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

L^2 は単結合であり、 R^1 はCH₃である、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

n_1 は1であり、 n_2 は1である、請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

R^{A2} 、 R^{A3} 、 $R^{A3'}$ 、 R^{A4} 、 $R^{A4'}$ 、 R^{A7} 、 $R^{A7'}$ 、 R^{A8} 、 $R^{A8'}$ 、 R^{A9} 、 $R^{A9'}$ 、 R^{A10} 、および、 $R^{A10'}$ 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(C₁-C₆)アルキルである、請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

R^{A6} は1～3のJで随意に置換された(C₁-C₆)アルキルである、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

n_1 は0であり、 n_2 は1である、請求項3に記載の化合物。

【請求項8】

R^{A2} 、 R^{A3} 、 $R^{A3'}$ 、 R^{A4} 、 $R^{A4'}$ 、 R^{A9} 、 $R^{A9'}$ 、 R^{A10} 、および $R^{A10'}$ 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(C₁-C₆)アルキルである、請求項7に記載の化合物。

【請求項9】

R^4 は水素である、請求項8に記載の化合物。

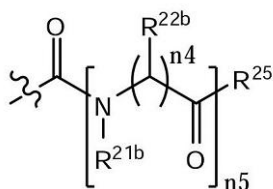
【請求項10】

n_1 は0であり、 n_2 は0である、請求項3に記載の化合物。

【請求項11】

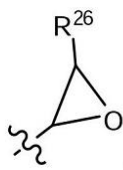
Xは、

【化5】



であり、 R^{25} は、

【化6】

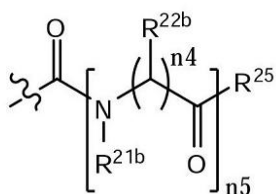


であり、 R^{26} は水素または-CH₃である、請求項10に記載の化合物。

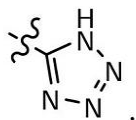
【請求項12】

Xは、

【化 7】

であり、 R^{25} は、

【化 8】

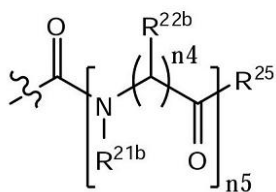


である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 13】

 X は、

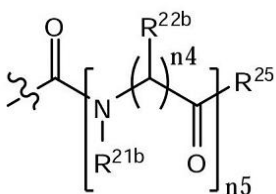
【化 9】

であり、 R^{25} は $-CH_3$ である、請求項 10 に記載の化合物。

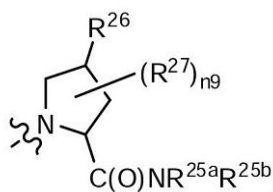
【請求項 14】

 X は、

【化 10】

であり、 R^{25} は、

【化 11】

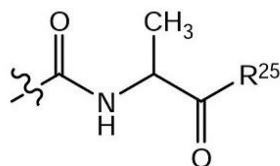


である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 15】

 X は、

【化 1 2】

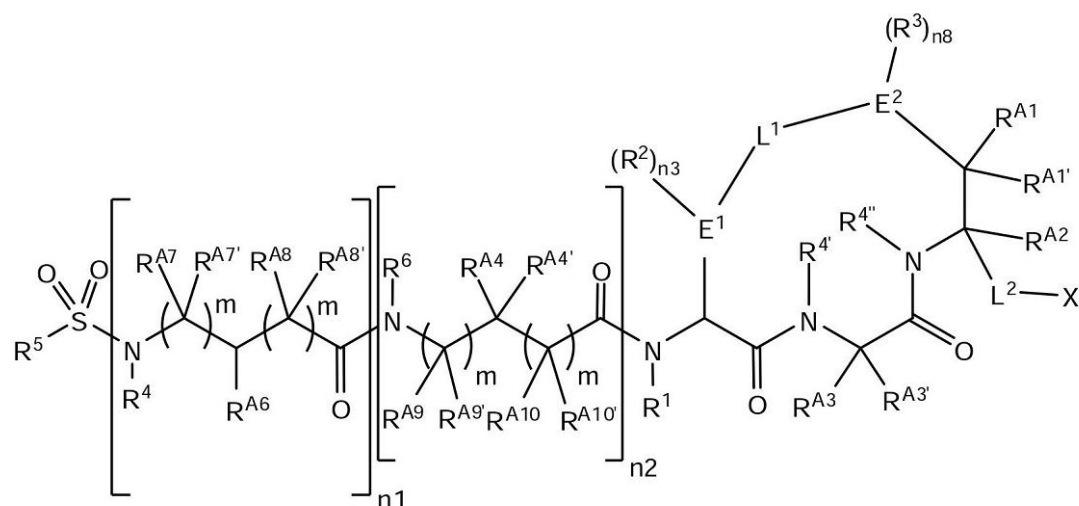


である、請求項 1 3 に記載の化合物。

【請求項 1 6】

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 1 3】



式 (IV)

式中：

E^1 は、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_2 - C_7)$ アルケニル、 $(C_2 - C_7)$ アルキニル、 $(C_3 - C_7)$ 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、

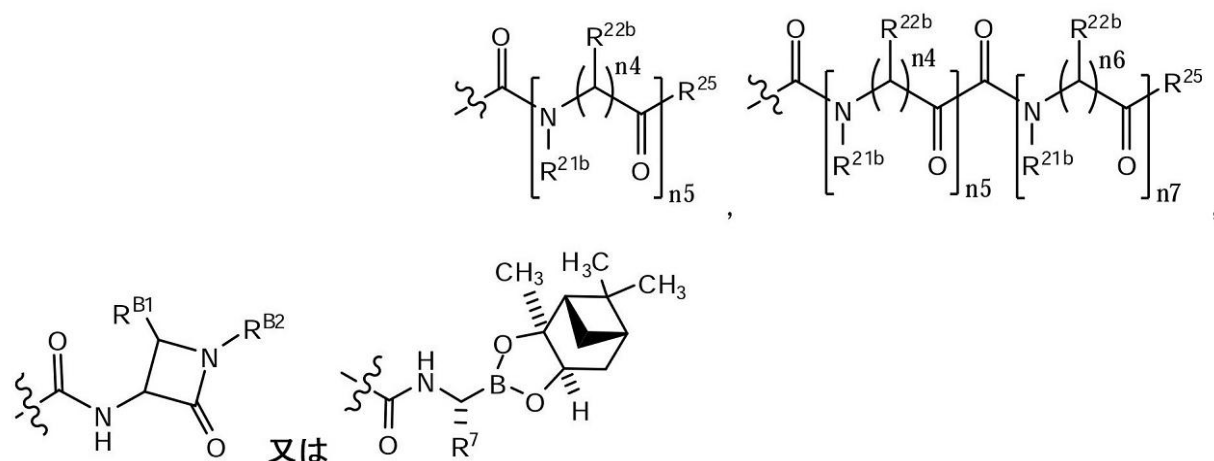
E^2 は、 $(C_2 - C_7)$ アルケニル、 $(C_2 - C_7)$ アルキニル、 $(C_3 - C_7)$ シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、またはアリールであり、

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、

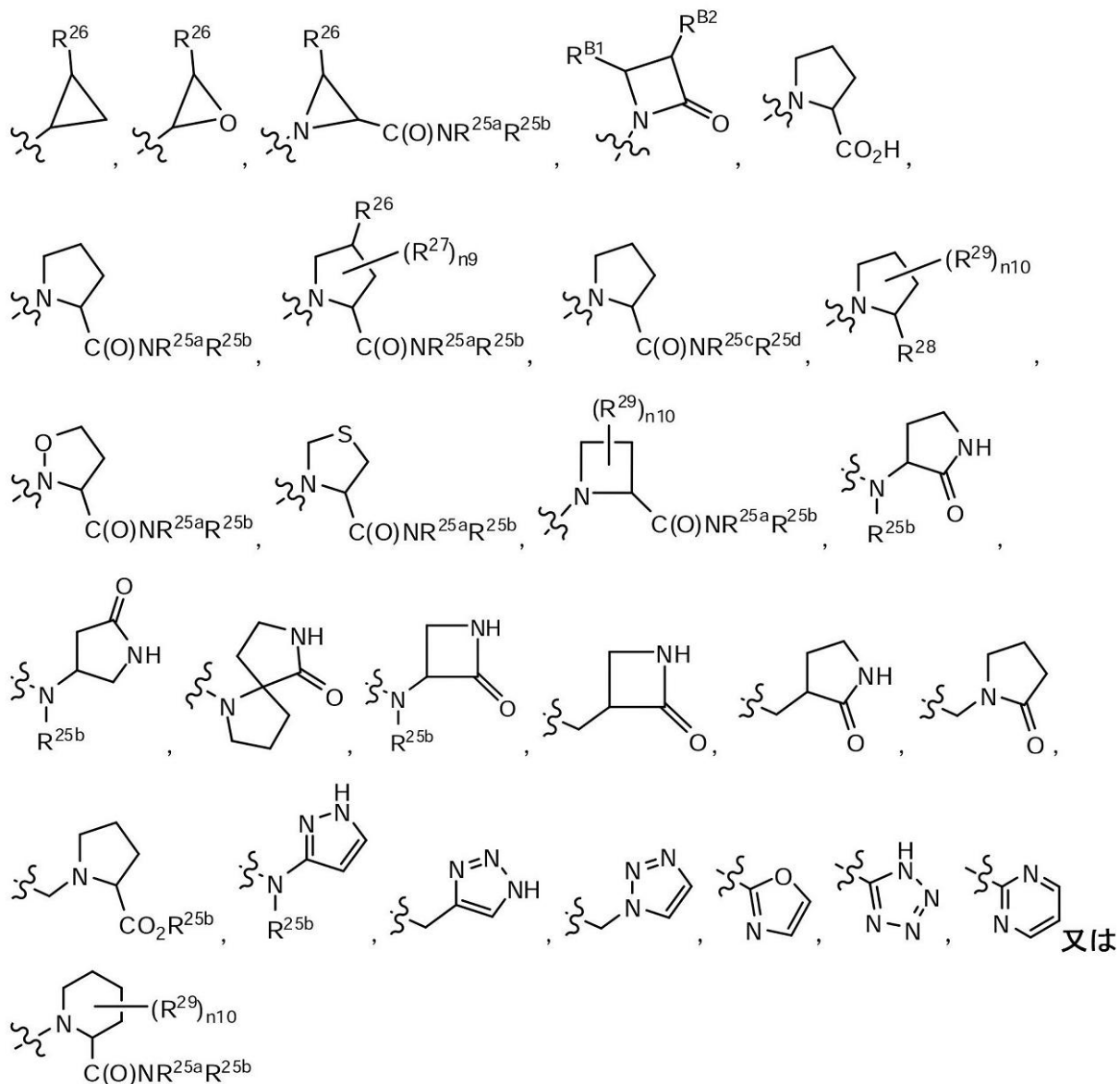
X は、 $-CO_2H$ 、 $-CH_2CO_2H$ 、 $-C(=O)NHCH_2C(=O)H$ 、 $-CH_2C(=O)H$ 、 $-C(=O)N(H)CH(R^7)B(OR^{B3})(OR^{B4})$ 、 $-CH_2OH$ 、 $-CH(OH)CH_3$ 、 $-N(R^4)CH(R^{24})CN$ 、 $-NHCH(R^{24})C(O)CH_3$ 、 $-NHN(R^{24})C(O)CH_3$ 、 $-NHCH(R^{24})CH=CHS(O)_2CH_3$ 、 $-NHCH(R^{24})CH=CHS(O)_2NH_2$ 、

【化 1 4】



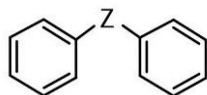
であり、ここで、 n_4 、 n_5 、および n_6 はそれぞれ独立して、1、2、または3であり、 n_7 は、0、1、または2であり、 R^7 はH、メチル、エチル、または $-\text{CH}_2\text{OH}$ であり、あるいは、 R^7 と R^{B3} はホウ素原子と一緒に、5または6員のホウ素含有環を形成し、 R^{B3} と R^{B4} はそれぞれ独立して、H、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ であり、あるいは、 R^{B3} と R^{B4} はホウ素原子と一緒に、随意に置換された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、 $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル、 $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ 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 $(\text{C}_6 - \text{C}_{10})$ 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^{24} はHまたは $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキルであり、 R^{25} は、H、OH、 OR^c 、 NR^{25a} 、 R^{25b} 、 $-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $-\text{CH}_2\text{OR}^{25b}$ 、 $-\text{CH}_2\text{R}^{30}$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{26})_2\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{25b})_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^{25b})\text{SO}_2(\text{C}_1 - \text{C}_6 \text{ アルキル})$ 、 $-\text{CH}_2\text{PO}_3\text{H}$ 、 $-\text{CH}_2\text{P}(\text{O})(\text{OH})\text{OCH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{OC}(\text{O})\text{R}^{30}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^{25b}$ 、 $-\text{CF}_2\text{CO}_2\text{R}^{25b}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^{25b}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{25b})_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})\text{CH}(\text{R}^{26})\text{CO}_2\text{R}^{25b}$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{H})\text{CH}(\text{R}^{26})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})\text{R}^{25b}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{R}^{30}$ 、 $-\text{N}(\text{H})\text{CH}_2(\text{R}^{30})$ 、 $-\text{CH}=\text{CHR}^{30}$ 、 $-\text{CH}=\text{CHSO}_2\text{R}^{25b}$ 、

【化 15】



であり、 R^{B1} と R^{B2} が各々独立して、 H 、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 OR^C 、 $C(=O)N(R^C)_2$ 、 $OC(=O)N(R^C)_2$ 、 $C(=O)OR^C$ 、 $OC(=O)OR^C$ 、ニトロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ チオアルコキシ、 $N(R^C)_2$ 、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 $(C_6 - C_{10})$ アリールであり、 R^C は独立して、それぞれの出現時に、 H または $(C_1 - C_6)$ アルキルであり、 R^{25a} は、 H 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 NH_2 、 $SO_2(C_1 - C_6)$ アルキル、または随意に置換されたアルキルであり、 R^{25b} はそれぞれ独立して H 、または随意に置換されたアルキルであり、 R^{25c} は H または随意に置換されたアルキルであり、 R^{25d} は $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、または NH_2 であり、 R^{26} 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^{27} 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^{26} と R^{27} は結合してシクロアルキル環を形成し、 R^{28} 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^{29} 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^{30} 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_9 は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、鎖内または鎖の末端に、随意に置換されたアリール、随意に置換されたヘテロアリール、あるいは随意に置換された

【化 16】



を随意に含む、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、CH₂、または C - C であり、あるいは、R⁵ は、鎖内に少なくとも 1 つの - O - または - N (R⁴) - 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 R² と R³ はそれぞれ独立して、ヒドロキシ、ニトロ、ハロ、シアノ、グリコシルオキシ、アミノ、(C₁ - C₄) アルキル、OR^{4 0}、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、R² または R³ 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^{4 0} はそれぞれ独立して - (C₁ - C₆) アルキルまたは - (C₁ - C₆) アルキル - NR^{4 1} R^{4 2} であり、

R^{4 1} と R^{4 2} はそれぞれ水素、- (C₁ - C₆) アルキル、- (C₁ - C₆) ヘテロアルキル、- C (O) (C₁ - C₆) アルキル、- C (O) N (R^{4 3})₂、- SO₂ N (R^{4 3})₂ であり、あるいは、R^{4 1} と R^{4 2} 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^{4 3} はそれぞれ独立して水素または - (C₁ - C₆) アルキルであり、

あるいは、2 つの R^{4 3} 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、

n₁ と n₂ は独立して 0 または 1 であり、

n₃ と n₈ 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、

R¹ は水素または 1 ~ 3 の J で随意に置換された (C₁ - C₆) アルキルであり、あるいは、R¹ は E¹ と一緒に環を形成し、

R⁴、R^{4'}、および R^{4''} 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 (C₁ - C₆) アルキルであり、

R⁶ は、水素、または 1 ~ 3 の J で随意に置換された (C₁ - C₆) アルキルであり、あるいは、R⁶ は R^{A 4} と一緒に環を形成し、

R^{A 1}、R^{A 1'}、R^{A 2}、R^{A 3}、R^{A 3'}、R^{A 4}、R^{A 4'}、R^{A 7}、R^{A 7'}、R^{A 8}、R^{A 8'}、R^{A 9}、R^{A 9'}、R^{A 10}、および R^{A 10'} は、それぞれの出現時に、独立して、水素、(C₁ - C₆) アルキル、(C₃ - C₇) 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 (C₆ - C₁₀) 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^{A 6} は H、アミノ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₃ - C₇) 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 (C₆ - C₁₀) 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、CF₃、OCF₃、(CH₂)₀ - p N (R')₂、(CH₂)₀ - p SR'、(CH₂)₀ - p S (O)₂ R'、(CH₂)₀ - p S (O)₂ N (R')₂、(CH₂)₀ - p SO₃ R'、(CH₂)₀ - p C (O) R'、(CH₂)₀ - p C (O) OR'、(CH₂)₀ - p C (O) N (R')₂、(CH₂)₀ - p OC (O) N (R')₂、(CH₂)₀ - p NH - C (O) R'、(CH₂)₀ - p N (R') SO₂ R'、(CH₂)₀ - p N (R') C (O) OR'、(CH₂)₀ - p N (R') C (O) R'、(CH₂)₀ - p N (R') C (O) N (R')₂、または (CH₂)₀ - p C (= NH) N (R')₂ 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、(C₁ - C₆) - 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、-NO₂、-OH、-CF₃、-OCF₃、-OCH₃、-NH₂、-N($C_1 - C_4$)アルキル)₂、-NH($C_1 - C_4$)アルキル、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_8$ シクロアルキル、または $C_1 - C_6$ 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 morganii*, *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*, *Bacteroides*

i d e s 3 4 5 2 A h o m o l o g y g r o u p , B a c t e r o i d e s v
u l g a t u s , B a c t e r o i d e s o v a l u s , B a c t e r o i d e s
t h e t a i o t a o m i c r o n , B a c t e r o i d e s u n i f o r m i s
, B a c t e r o i d e s e g g e r t h i i , B a c t e r o i d e s s p l
a n c h n i c u s , C l o s t r i d i u m d i f f i c i l e , M y c o b a c
t e r i u m t u b e r c u l o s i s , M y c o b a c t e r i u m a v i u m
, M y c o b a c t e r i u m i n t r a c e l l u l a r e , M y c o b a c t
e r i u m l e p r a e , C o r y n e b a c t e r i u m d i p h t h e r i a
e , C o r y n e b a c t e r i u m u l c e r a n s , S t r e p t o c o c c
u s p n e u m o n i a e , S t r e p t o c o c c u s a g a l a c t i a e ,
S t r e p t o c o c c u s p y o g e n e s , E n t e r o c o c c u s f a
e c a l i s , E n t e r o c o c c u s f a e c i u m , S t a p h y l o c o
c c u s a u r e u s , S t a p h y l o c o c c u s e p i d e r m i d i s ,
S t a p h y l o c o c c u s s a p r o p h y t i c u s , S t a p h y l o c
o c c u s i n t e r m e d i u s , S t a p h y l o c o c c u s h y i c u s
s u b s p . h y i c u s , S t a p h y l o c o c c u s h a e m o l y t i
c u s , S t a p h y l o c o c c u s h o m i n i s , ま た は S t a p h y l o
c o c c u s s a c c h a r o l y t i c u s を 含 む 感 染 で あ る 、 請 求 項 1 8 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。