

【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27年5月28日(2015.5.28)

【公表番号】特表2014-510788(P2014-510788A)

【公表日】平成26年5月1日(2014.5.1)

【年通号数】公開・登録公報2014-022

【出願番号】特願2014-505231(P2014-505231)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 L 31/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 487/04 1 4 0

C 0 7 D 487/04 C S P

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 31/04

A 6 1 L 31/00 B

【手続補正書】

【提出日】平成27年4月7日(2015.4.7)

【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

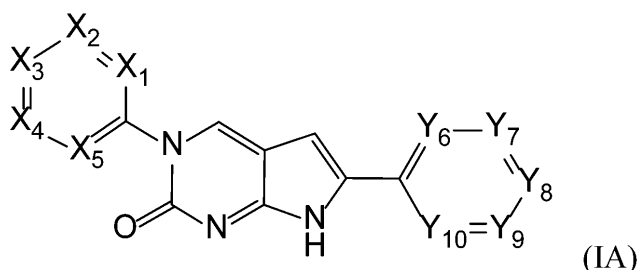
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式を有する化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ:



式中、

X₁はCR¹またはNであり；X₂はCR²またはNであり；X₃はCR³またはNであり；X₄はCR⁴またはNであり；X₅はCR⁵またはNであるが；但し、X₁、X₂、X₃、X₄およびX₅がすべてNであることはなく；

Y₆はCR⁶またはNであり；Y₇はCR⁷またはNであり；Y₈はCR⁸またはNであり；Y₉はCR⁹またはNであり；Y₁₀はCR¹⁰またはNであるが；但し、Y₆、Y₇、Y₈、Y₉およびY₁₀がすべてNであることはなく；

ここで、R¹、R²、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸およびR¹⁰は、それぞれ独立して(a) 水素、(b) F、(c) Cl、(d) Br、(e) I、(f) -CF₃、(g) -CF₂H、(h) -CFH₂、(i) -OCF₃、(j) -OCF₂H、(k) -OCFH₂、(l) -OCH₃、(m) -CN、(n) -N₃、(o) -NO₂、(p) -NR¹¹R¹¹、(q) -NR¹¹C(O)R¹¹、(r) -C(O)NR¹¹R¹¹、(s) -OR¹¹、(t) -COH、(u) -CO(C₁~C₈アルキル)、(v) -COR¹¹、(w) -NR¹¹(CNR¹¹)NR¹¹R¹¹、(x) -S(O)_pR¹¹、(y) -NR¹¹S(O)_pR¹¹、(z) -SR¹¹、(aa) -SCF₃

、(bb) $-\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{H}-\text{NH}-\text{CHR}^{11}\text{R}^{11}$ 、(cc) $-\text{COOR}^{11}$ 、(dd) $-(\text{OCH}_2\text{CH}_2)_t\text{R}^{11}$ 、(ee) $-(\text{OCH}_2\text{CH}_2)_t\text{OR}^{11}$ 、(ff) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキル、(gg) $-\text{C}_2 \sim \text{C}_8$ アルケニル、(hh) $-\text{C}_2 \sim \text{C}_8$ アルキニル、(ii) $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル})-(\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3} \sim 14\text{員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環})$ 、(jj) $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル})-(3 \sim 14\text{員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環})$ 、(kk) $-\text{ハロアルキル}$ 、(ll) $-\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3} \sim 14\text{員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環}$ 、(mm) $-\text{3} \sim 14\text{員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環}$ 、ならびに(nn) $-\text{CHR}^{11}-\text{NH}-(\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3} \sim 14\text{員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環})$ より選択され；

ここで(ff)～(nn)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

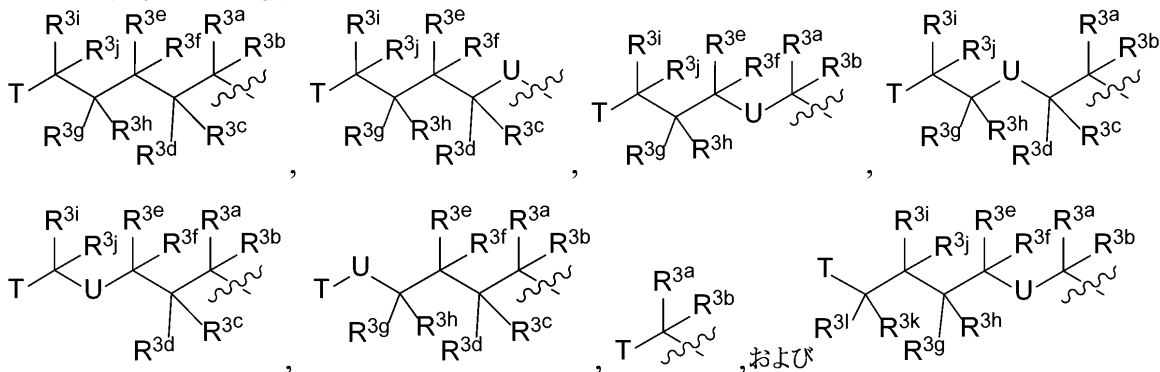
あるいは、 R^6 、 R^7 および R^8 より選択される2個の置換基は、それらが結合している炭素原子と一緒に、(a) $-\text{3} \sim 7\text{員飽和もしくは不飽和炭素環}$ 、または(b) $-\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3} \sim 7\text{員飽和もしくは不飽和複素環}$ を形成し；ここで(a)～(b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

各 R^{11} は、独立して(a) 水素、(b) ハロゲン、(c) $-\text{OH}$ 、(d) $-\text{SH}$ 、(e) $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル})\text{OH}$ 、(f) $-\text{OCF}_3$ 、(g) $-\text{OCF}_2\text{H}$ 、(h) $-\text{OCFH}_2$ 、(i) $-\text{OCH}_3$ 、(j) $-\text{OR}^{12}$ 、(k) $-\text{COR}^{12}$ 、(l) $-\text{CN}$ 、(m) $-\text{NO}_2$ 、(n) $-\text{CONH}_2$ 、(o) $-\text{CONR}^{12}\text{R}^{12}$ 、(p) $-\text{COCH}_3$ 、(q) $-\text{S}(\text{O})_p\text{CH}_3$ 、(r) $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^{12}\text{R}^{12}$ 、(s) $-\text{SR}^{12}$ 、(t) $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、(u) $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ 、(v) $-\text{N}_3$ 、(w) $-\text{NH}_2$ 、(x) $-\text{NR}^{12}\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$ 、(y) $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル})$ 、(z) $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル})_2$ 、(aa) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル}$ 、(bb) $-\text{C}_2 \sim \text{C}_8 \text{アルケニル}$ 、(cc) $-\text{C}_2 \sim \text{C}_8 \text{アルキニル}$ 、(dd) $-\text{ハロアルキル}$ 、(ee) $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル})-(\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3} \sim 14\text{員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環})$ 、(ff) $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル})-(3 \sim 14\text{員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環})$ 、(gg) $-\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3} \sim 14\text{員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環}$ 、(hh) $-\text{3} \sim 14\text{員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環}$ 、ならびに(ii) $-(\text{C}=\text{NH})\text{NR}^{12}\text{R}^{12}$ より選択され；

ここで(y)～(hh)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、2個の R^{11} 置換基は一緒に、(a) $-\text{3} \sim 7\text{員飽和もしくは不飽和炭素環}$ 、または(b) $-\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3} \sim 7\text{員飽和もしくは不飽和複素環}$ を形成し、ここで(a)～(b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

R^3 は以下より選択され：



式中、 R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 、 R^{3d} 、 R^{3e} 、 R^{3f} 、 R^{3g} 、 R^{3h} 、 R^{3i} 、 R^{3j} 、 R^{3k} および R^{3l} は、それぞれ独立して(a) 水素、(b) ハロゲン、(c) $-\text{CN}$ 、(d) $-\text{N}_3$ 、(e) $-\text{NO}_2$ 、(f) $-\text{OCF}_3$ 、(g) $-\text{OCF}_2\text{H}$ 、(h) $-\text{OCFH}_2$ 、(i) $-\text{OCH}_3$ 、(j) $-\text{OR}^{11}$ 、(k) $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{11}$ 、(l) $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{11}$ 、(m) $-\text{NH}_2$ 、(n) $-\text{NR}^{11}\text{R}^{11}$ 、(o) $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{R}^{11}$ 、(p) $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^{11}$ 、(q) $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、(r) $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{11}$ 、(s) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル}$ 、(t) $-\text{C}_2 \sim \text{C}_8 \text{アルケニル}$ 、(u) $-\text{C}_2 \sim \text{C}_8 \text{アルキニル}$ 、(v) $-\text{ハロアルキル}$ 、(w) $-\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子}$

を含有する3～14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環、ならびに(x) -3～14員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環より選択され；

ここで(s)～(x)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、 R^{3a} および R^{3b} 、 R^{3c} および R^{3d} 、 R^{3e} および R^{3f} 、 R^{3g} および R^{3h} 、 R^{3i} および R^{3j} 、ならびに R^{3k} および R^{3l} より選択される1対もしくは複数対の置換基は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、(a) -3～7員飽和もしくは不飽和炭素環、(b) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3～7員飽和もしくは不飽和複素環、(c) エキソ炭素-炭素二重結合、(d) カルボニル基、または(e) チオカルボニル基を形成し；

ここで(a)～(b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、異なる炭素原子上の R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 、 R^{3d} 、 R^{3e} 、 R^{3f} 、 R^{3g} 、 R^{3h} 、 R^{3i} 、 R^{3j} 、 R^{3k} および R^{3l} より選択される2個の置換基は、それらが結合している介在原子と一緒にあって、(a) -3～7員飽和もしくは不飽和炭素環、または(b) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3～7員飽和もしくは不飽和複素環を形成し；

ここで(a)～(b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、2個の隣接する炭素原子上の R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 、 R^{3d} 、 R^{3e} 、 R^{3f} 、 R^{3g} 、 R^{3h} 、 R^{3i} 、 R^{3j} 、 R^{3k} および R^{3l} より選択される2個の置換基は、隣接する該炭素原子間の結合と一緒にあって、置換もしくは非置換炭素-炭素二重結合を形成し、あるいは、2個の隣接する炭素原子上の R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 、 R^{3d} 、 R^{3e} 、 R^{3f} 、 R^{3g} 、 R^{3h} 、 R^{3i} 、 R^{3j} 、 R^{3k} および R^{3l} より選択される4個の置換基は、隣接する該炭素原子間の結合と一緒にあって、炭素-炭素三重結合を形成し；

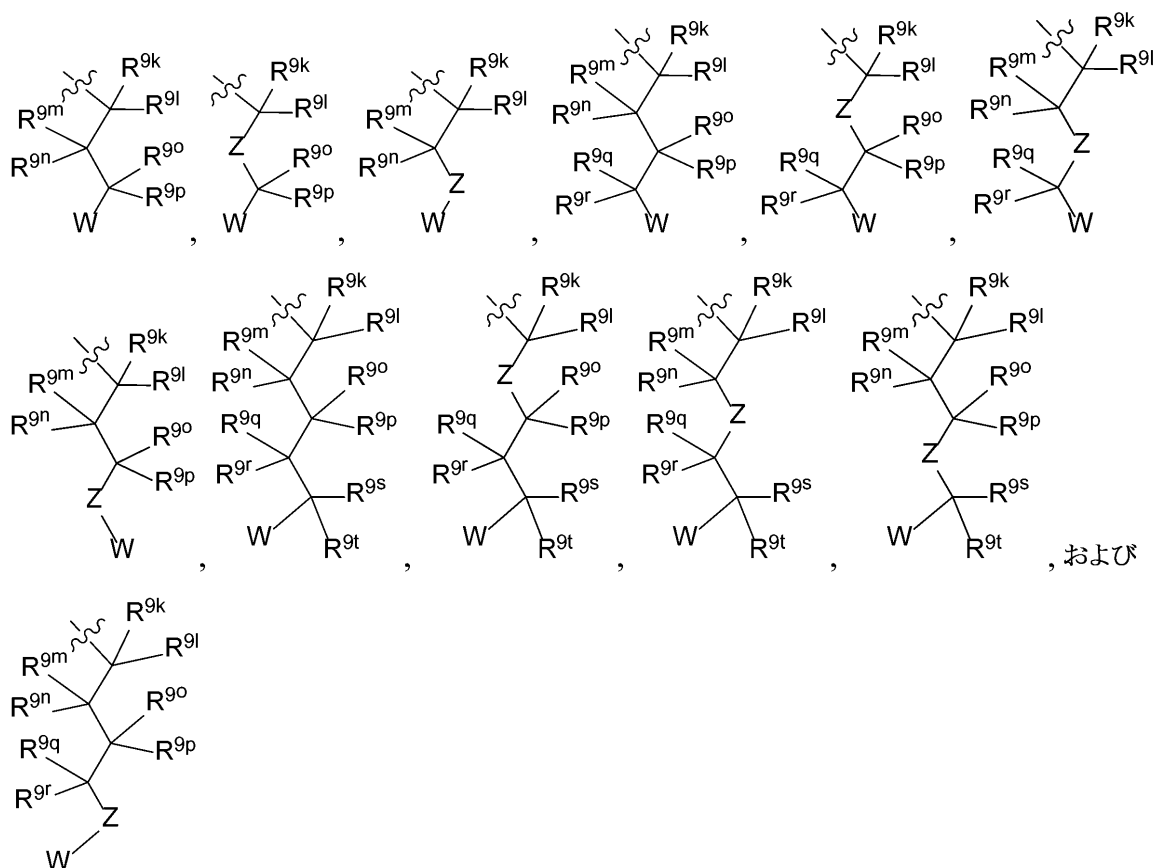
Uは、 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-NR^{11}-$ 、 $-(C=O)-$ 、 $-NR^{11}(C=O)-$ 、 $-(C=O)NR^{11}-$ 、 $-S(O)_pNR^{11}-$ 、 $-NR^{11}S(O)_p-$ 、 $-NR^{11}S(O)_pNR^{11}-$ および $-NR^{11}C(O)NR^{11}-$ より選択され；

Tは、 $-NR^{11}R^{11}$ 、 $-NR^{11}(C=O)OR^{11}$ 、 $-NR^{11}(C=NR^{11})NR^{11}R^{11}$ および OR^{11} より選択され；

あるいは、1個の R^{11} 、ならびに R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 、 R^{3d} 、 R^{3e} 、 R^{3f} 、 R^{3g} 、 R^{3h} 、 R^{3i} 、 R^{3j} 、 R^{3k} および R^{3l} より選択される1個の置換基は、それらが結合している介在原子と一緒にあって、(a) -3～7員飽和もしくは不飽和炭素環、または(b) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3～7員飽和もしくは不飽和複素環を形成し；

ここで(a)～(b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

R^9 は以下より選択され：



式中、 R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} は、それぞれ独立して (a) 水素、(b) ハロゲン、(c) $-\text{CN}$ 、(d) $-\text{N}_3$ 、(e) $-\text{NO}_2$ 、(f) $-\text{OCF}_3$ 、(g) $-\text{OCH}_3$ 、(h) $-\text{O}$ CF_2H 、(i) $-\text{OCFH}_2$ 、(j) $-\text{OR}^{11}$ 、(k) $-\text{NH}_2$ 、(l) $-\text{NR}^{11}\text{R}^{11}$ 、(m) $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{11}$ 、(n) $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{11}$ 、(o) $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{11}$ 、(p) $-\text{NR}^{11}\text{C}(\text{O})\text{R}^{11}$ 、(q) $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^{11}$ 、(r) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキル、(s) $-\text{C}_2 \sim \text{C}_8$ アルケニル、(t) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキニル、(u) ハロアルキル、(v) 窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3～14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環、ならびに(w) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキル、(v) 窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3～14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環より選択され；

ここで(r)～(w)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、 R^{9k} および R^{9l} 、 R^{9m} および R^{9n} 、 R^{9o} および R^{9p} 、 R^{9q} および R^{9r} 、ならびに R^{9s} および R^{9t} より選択される1対もしくは複数対の置換基は、それらが結合している炭素原子と一緒に、(a) 3～7員飽和もしくは不飽和炭素環、(b) 窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3～7員飽和もしくは不飽和複素環、(c) エキソ炭素-炭素二重結合、(d) カルボニル基、または(e) チオカルボニル基を形成し；

ここで(a)～(c)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、異なる炭素原子上の R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択される2個の置換基は、それらが結合している介在原子と一緒に、(a) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキル、(b) $-\text{C}_2 \sim \text{C}_8$ アルケニル、または(c) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキニル、(d) 窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3～7員飽和もしくは不飽和複素環を形成し；

ここで(a)～(b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、2個の隣接する炭素原子上の R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択される2個の置換基は、隣接する該炭素原子間の結合と一緒に、置換もしくは非置換炭素-炭素二重結合を形成し、あるいは、2個の隣接する炭素原子上の R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択される4個の置換基は、隣接する該炭素原子間の結合と一緒に、炭素-炭素三重結合を形成し；

Zは、 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-NR^{11}-$ 、 $-(C=O)-$ 、 $-NR^{11}(C=O)-$ 、 $-(C=O)NR^{11}-$ 、 $-S(O)_pNR^{11}-$ 、 $-NR^{11}S(O)_p-$ 、 $-NR^{11}S(O)_pNR^{11}-$ および $-NR^{11}C(O)NR^{11}-$ より選択され；

Wは、 $-NR^{11}R^{11}$ 、 $-NR^{11}(CO)OR^{11}$ 、 $-NR^{11}(C=NR^{11})NR^{11}R^{11}$ および $-OR^{11}$ より選択され；

あるいは、1個の R^{11} 、ならびに R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択される1個の置換基は、それらが結合している介在原子と一緒にあって、(a) - 3~7員飽和もしくは不飽和炭素環、または(b) - 窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~7員飽和もしくは不飽和複素環を形成し；

ここで(a)~(b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

R^{12} は、独立して(a) 水素、(b) ハロゲン、(c) $-OH$ 、(d) $-SH$ 、(e) $-(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})OH$ 、(f) $-OCF_3$ 、(g) $-OCH_3$ 、(h) $-OCF_2H$ 、(i) $-OCFH_2$ 、(j) $-O(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、(k) $-CN$ 、(l) $-NO_2$ 、(m) $-CONH_2$ 、(n) $C(O)NH(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、(o) $C(O)N(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})_2$ 、(p) $-COH$ 、(q) $-COCH_3$ 、(r) $-S(O)_pCH_3$ 、(s) $-S(O)_pN(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})_2$ 、(t) $-S(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、(u) $-C(O)OH$ 、(v) $-C(O)O(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、(w) $-N_3$ 、(x) $-NHC(O)(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、(y) $-N(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})C(O)(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、(z) $-NH_2$ 、(aa) $-NH(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、(bb) $-N(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})_2$ 、(cc) $-C_1 \sim C_8 \text{ アルキル}$ 、(dd) $-C_2 \sim C_8 \text{ アルケニル}$ 、(ee) $-C_2 \sim C_8 \text{ アルキニル}$ 、(ff) $-ハロアルキル$ 、(gg) $-(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})-(\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環})$ 、(hh) $-(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})-(3 \sim 14 \text{ 員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環})$ 、(ii) $-\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環}$ 、(jj) $-3 \sim 14 \text{ 員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環}$ 、(kk) $-(C=NH)NH_2$ 、(ll) $-C(=NH)NH_2$ 、(mm) $-C(O)R^{13}$ 、(nn) $=O$ 、ならびに(oo) $=NR^{13}$ より選択され；

ここで(aa)~(jj)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{13} で置換されていてもよく；

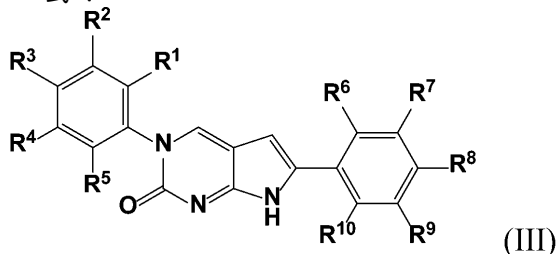
R^{13} は独立して(a) 水素、(b) ハロゲン、(c) $-C_1 \sim C_8 \text{ アルキル}$ 、(d) $-C_2 \sim C_8 \text{ アルケニル}$ 、(e) $-C_2 \sim C_8 \text{ アルキニル}$ 、(f) $-ハロアルキル$ 、(g) $-OH$ 、(h) $-OC_1 \sim C_8 \text{ アルキル}$ 、(i) $-OC_2 \sim C_8 \text{ アルケニル}$ 、(j) $-OC_2 \sim C_8 \text{ アルキニル}$ 、(k) $-OCF_3$ 、(l) $-OCH_3$ 、(m) $-OCF_2H$ 、(n) $-OCFH_2$ 、(o) $-NH_2$ 、(p) $-CN$ 、(q) $-N_3$ 、(r) $-S(O)_pC_1 \sim C_8 \text{ アルキル}$ 、(s) $-\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環}$ 、ならびに(t) $-3 \sim 14 \text{ 員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環}$ より選択され；

pは0、1または2であり；かつ

tは0、1または2である。

【請求項2】

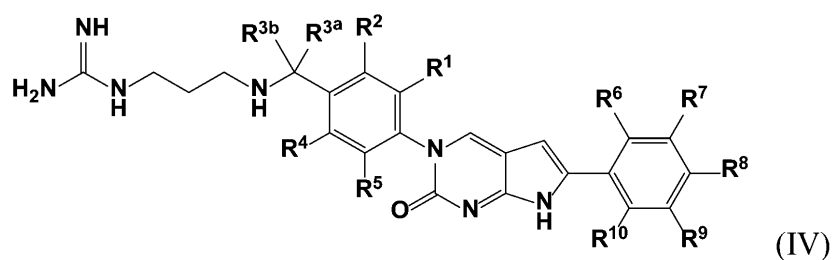
式：



を有する、請求項1記載の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

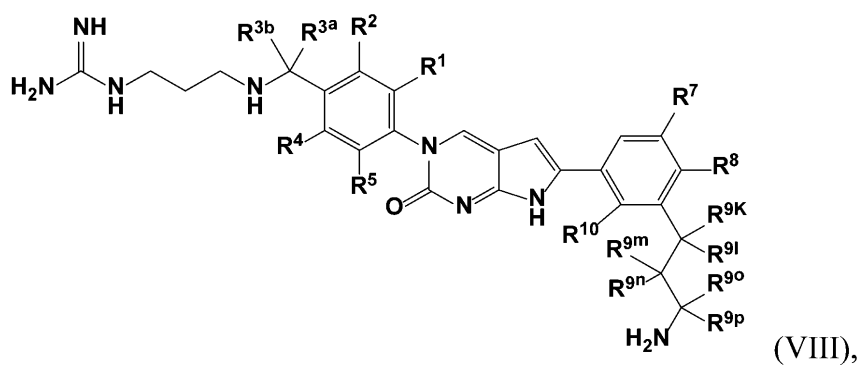
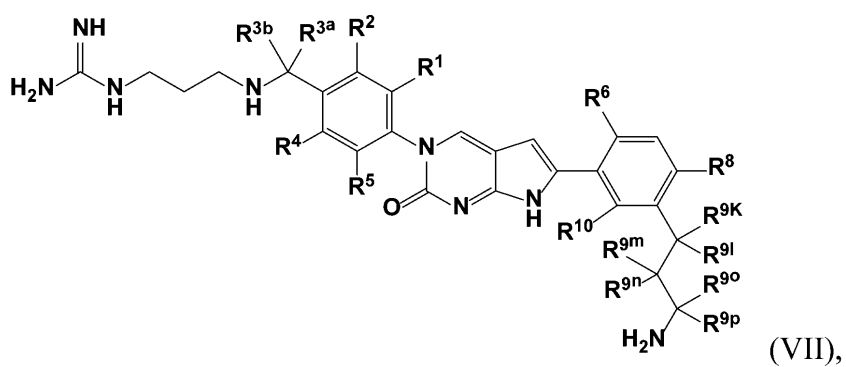
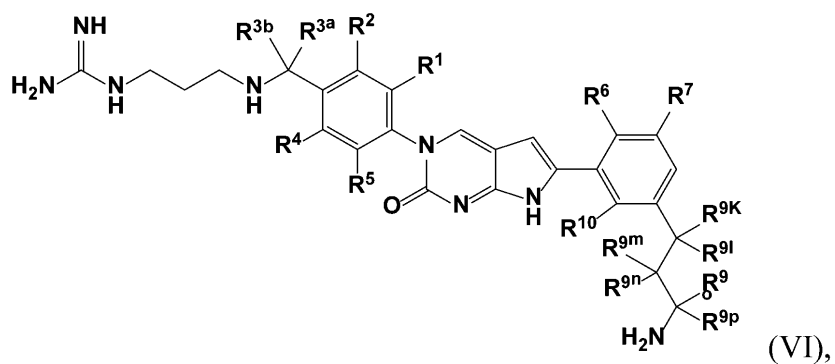
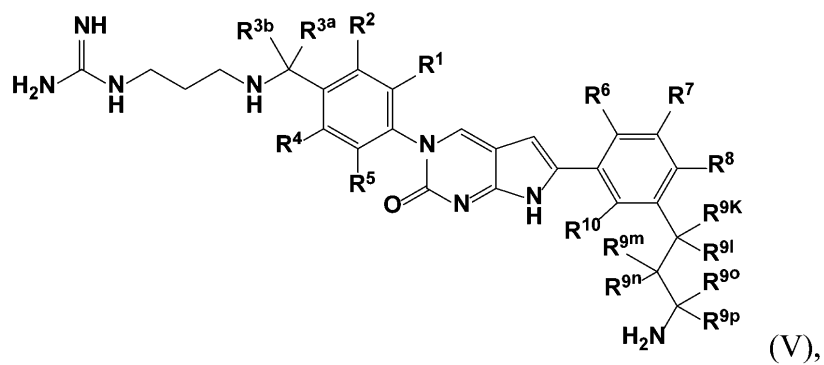
【請求項3】

式：



を有する、請求項2記載の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

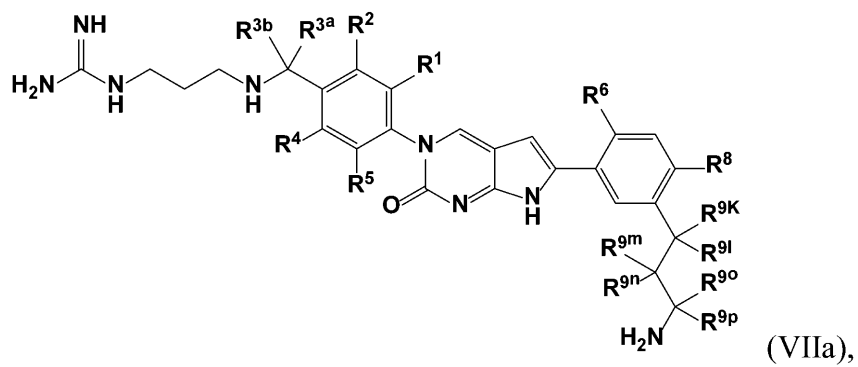
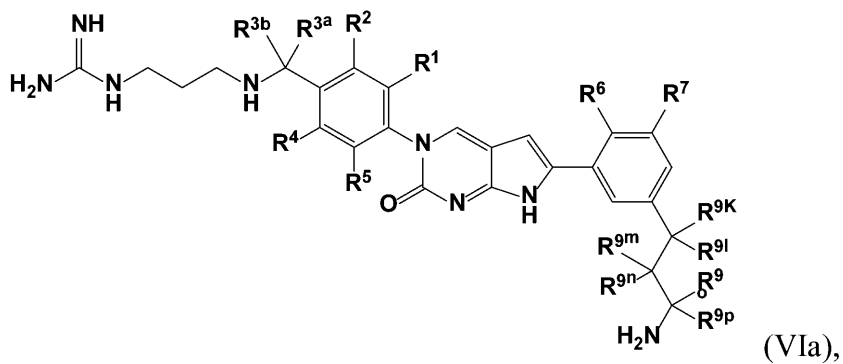
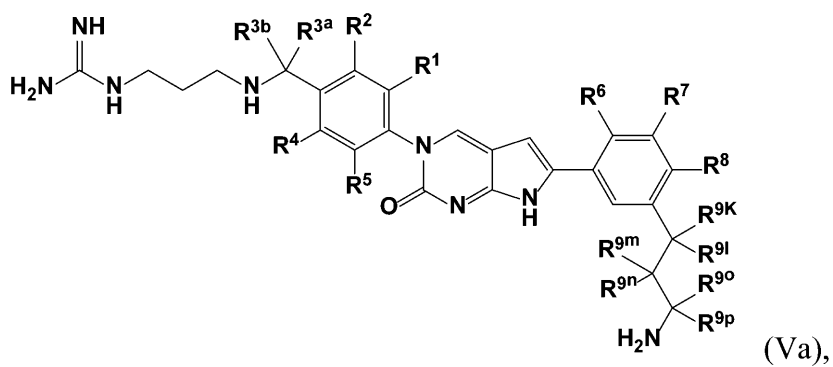
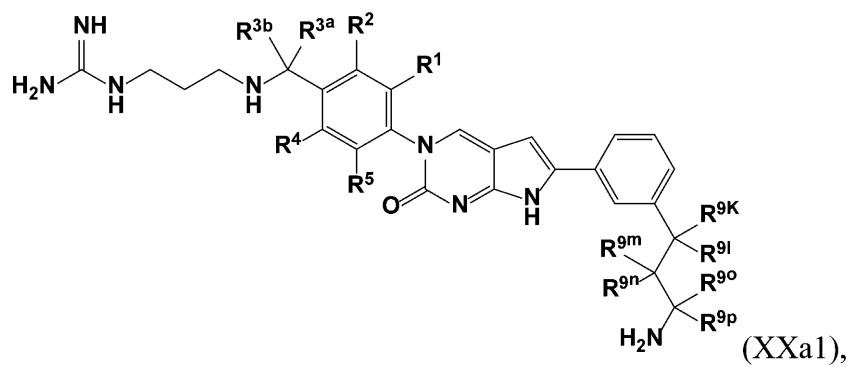
【請求項4】



Chemical structure (IX) is a complex molecule featuring a guanidine group (H₂N-C(=NH)-NH-) linked to a benzimidazole core. The benzimidazole core is substituted with a phenyl ring (R⁶) and a quaternary carbon atom (R^{9m}, R⁹ⁿ, R^{9o}, R^{9p}). The benzimidazole core is also substituted with a quaternary carbon atom (R^{3a}, R^{3b}, R^{3c}, R^{3d}) and a quaternary carbon atom (R¹, R², R³, R⁴). The structure is labeled (IX).

Chemical structure (XI) is a complex molecule featuring a guanidine group (H₂N-C(=NH)-NH-) connected to a substituted benzene ring. The benzene ring is substituted with R¹, R², R^{3a}, R^{3b}, R⁴, and R⁵. The benzene ring is further connected to a pyrazole ring, which is substituted with R⁶ and R⁷. The pyrazole ring is connected to a substituted benzene ring, which is further substituted with R⁸, R^{9a}, R^{9b}, R^{9c}, R^{9d}, R^{9e}, R^{9f}, R^{9g}, R^{9h}, R⁹ⁱ, R^{9j}, R^{9k}, R^{9l}, R^{9m}, R⁹ⁿ, R^{9o}, R^{9p}, and R¹⁰. The molecule is labeled (XI).

(XXa),



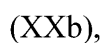
(VIIIa),

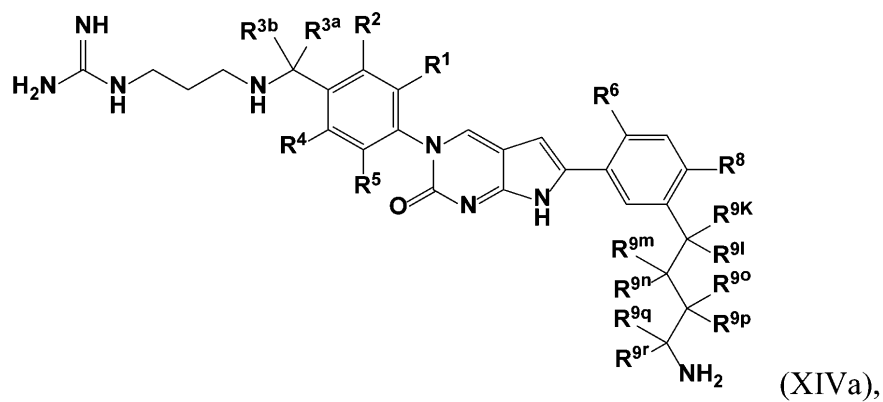
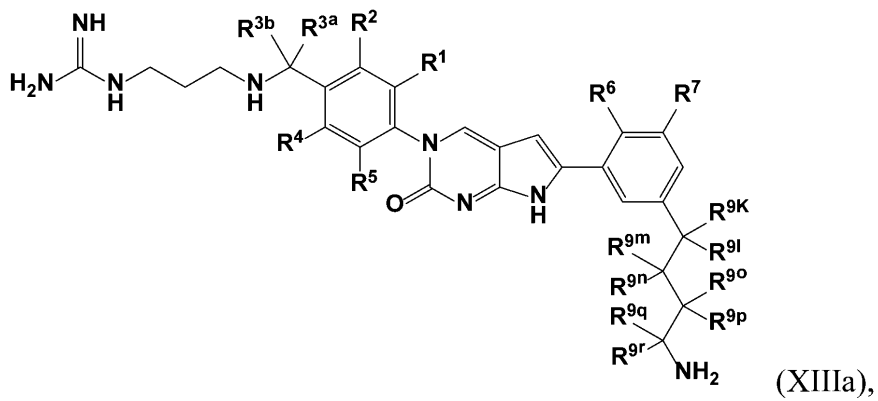
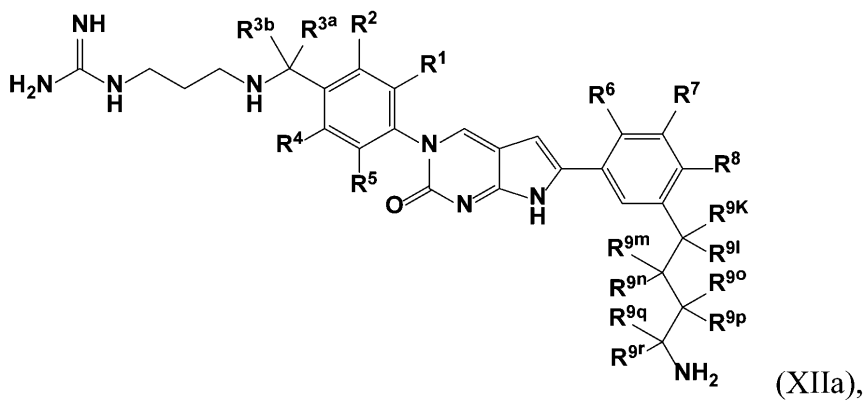
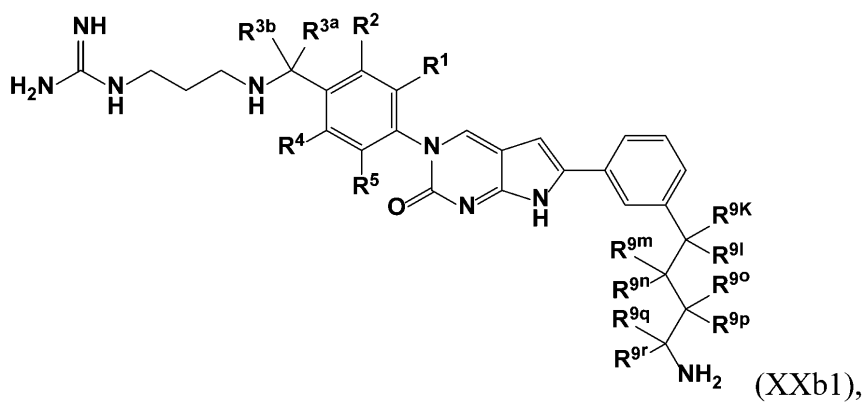
(IXa),

(Xa),

(XIa),











(A5),

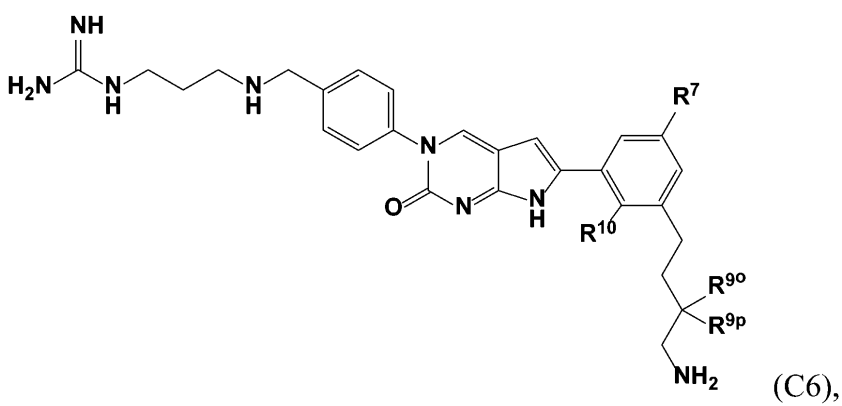
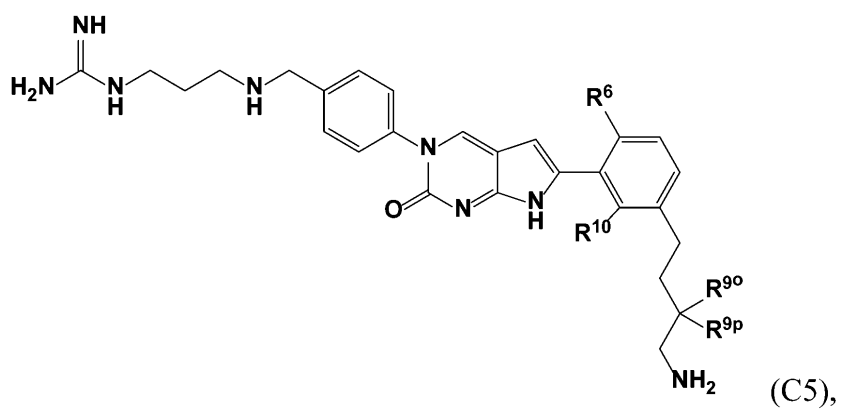
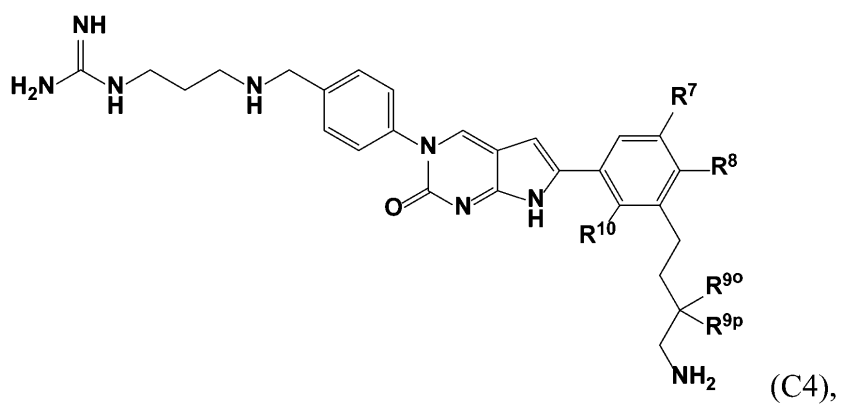
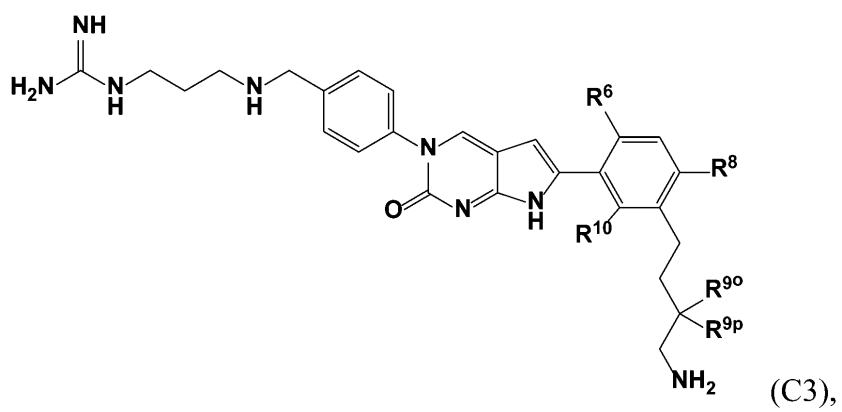
(A6),

N=C(N)NCCCNCCc1ccc(cc1)-n2cnc3c(c2)c[nH]3-c4ccc(cc4C(R9K)(R9I)CCCN)R10R8 (A7),

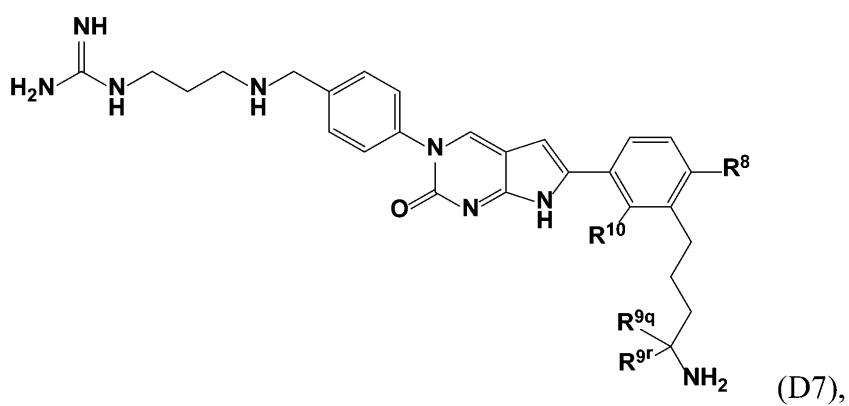
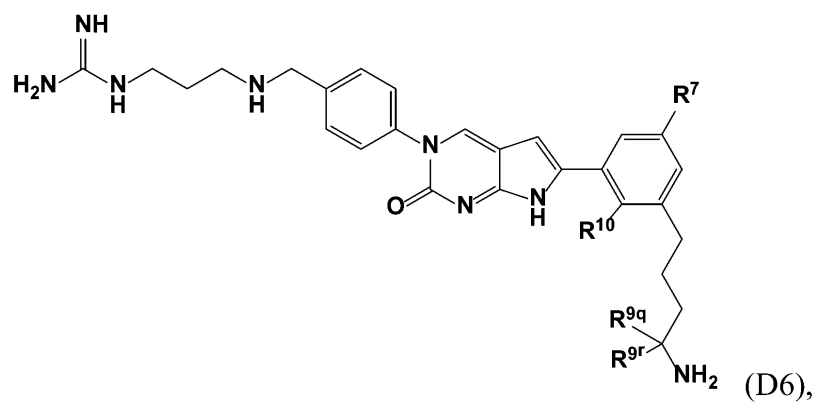
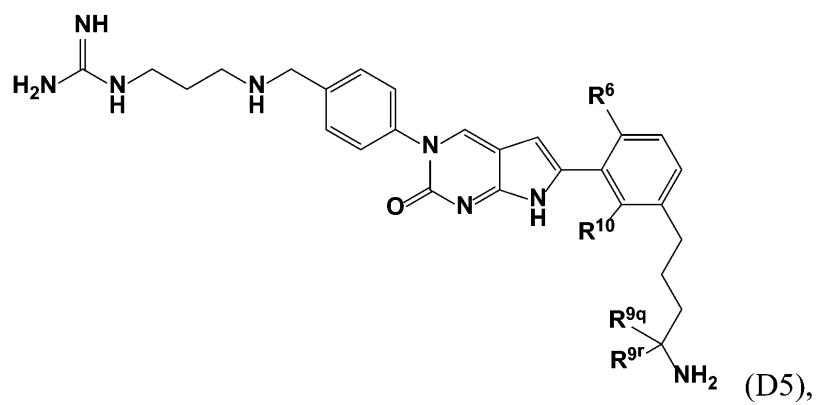
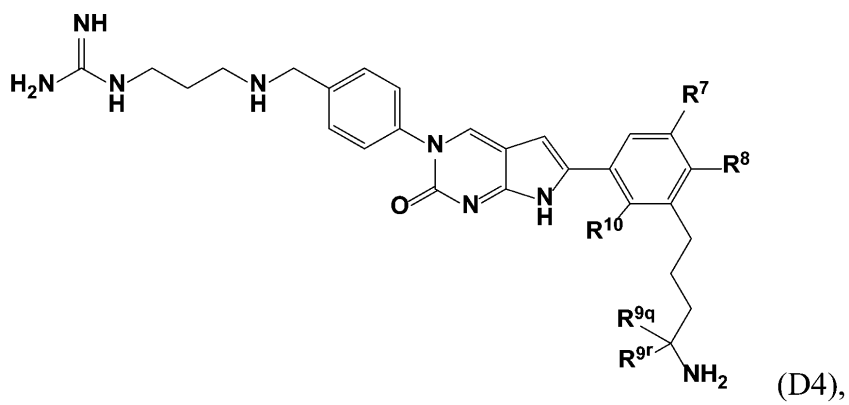
(B1),





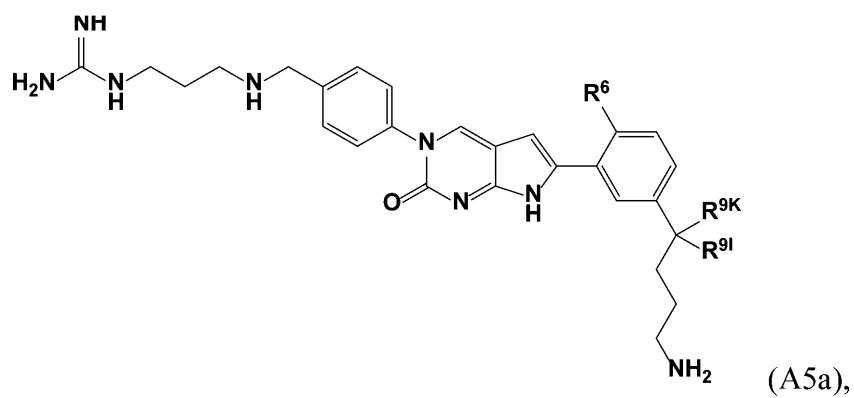
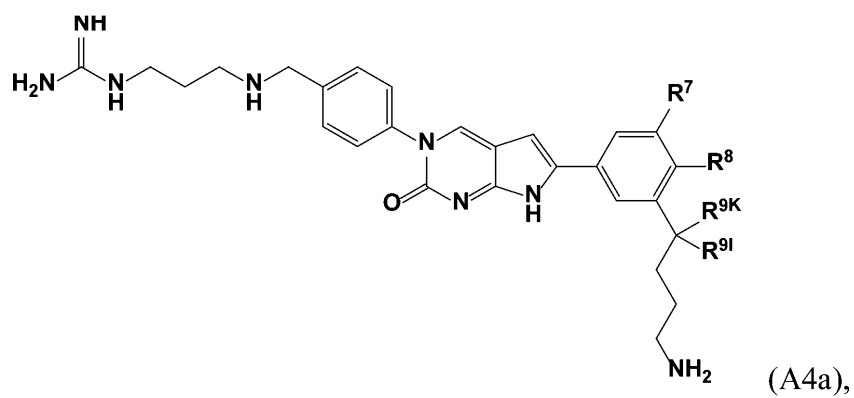
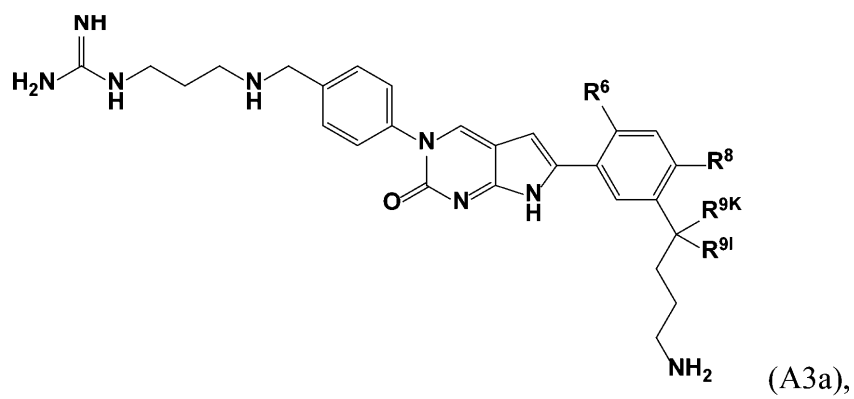
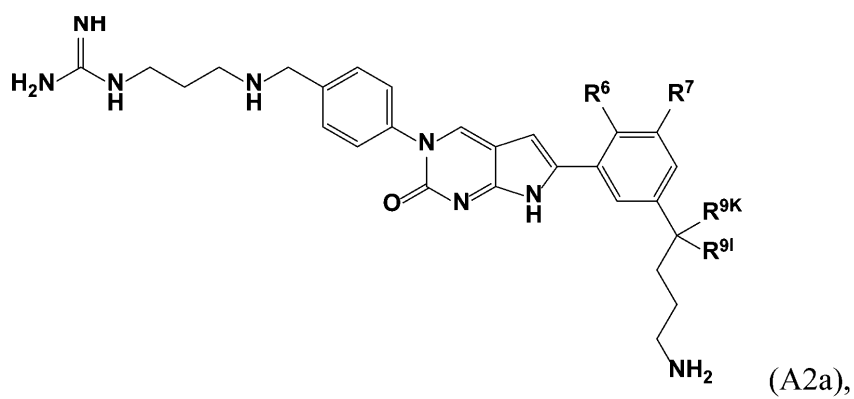


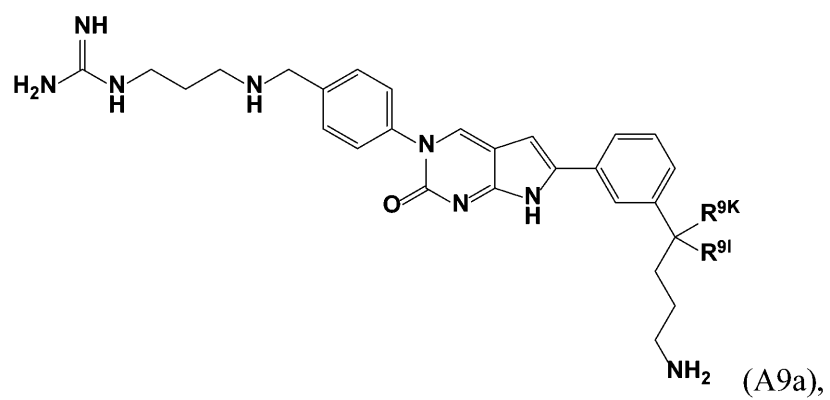
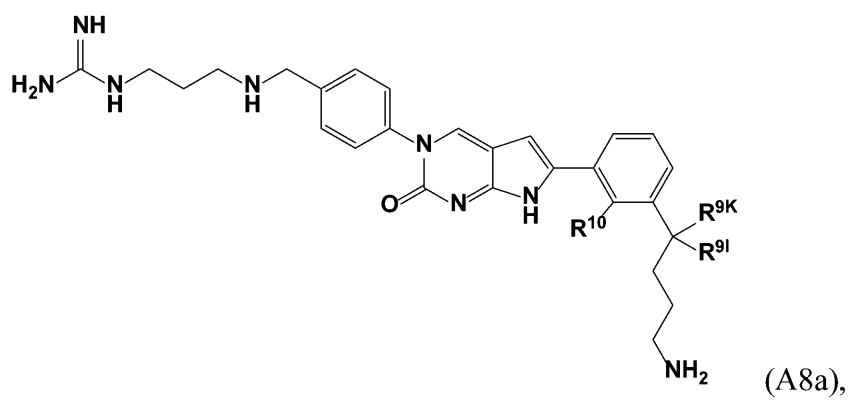
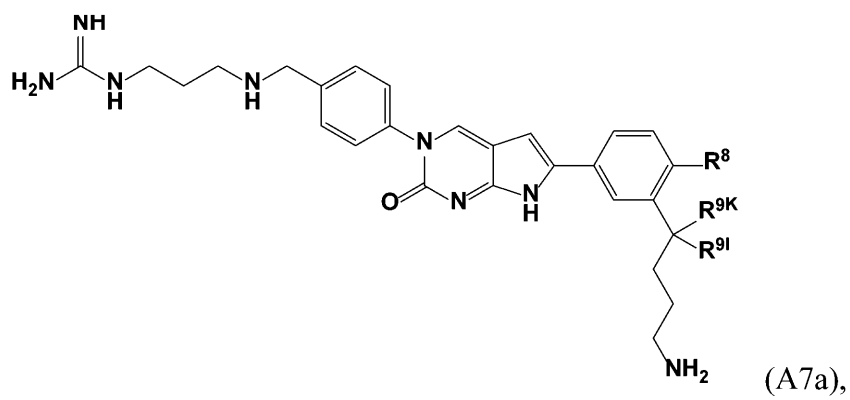
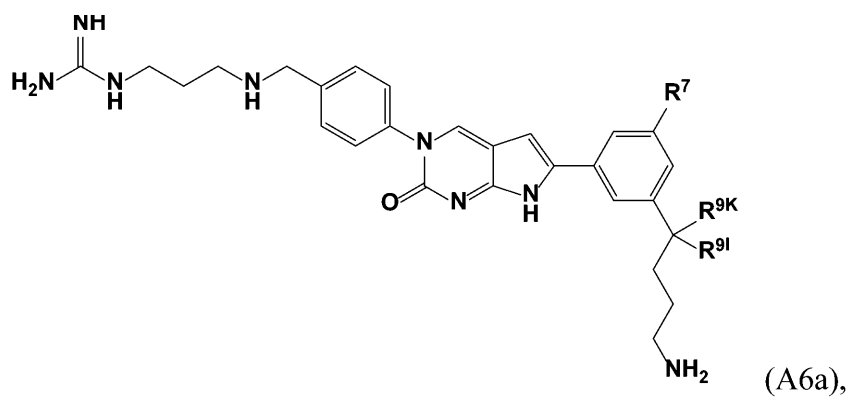


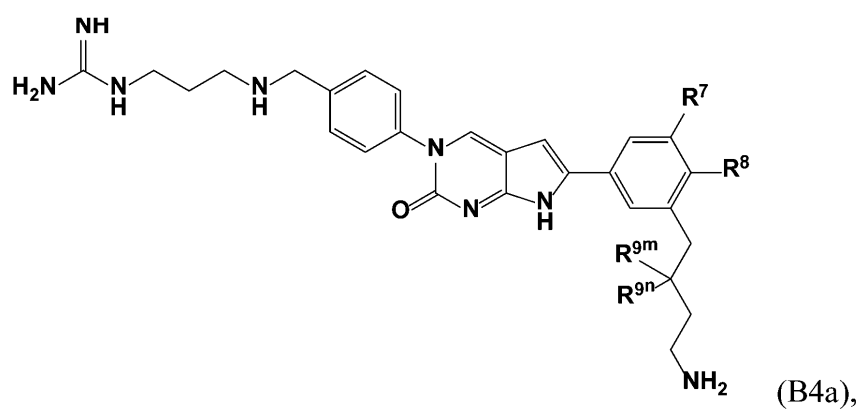
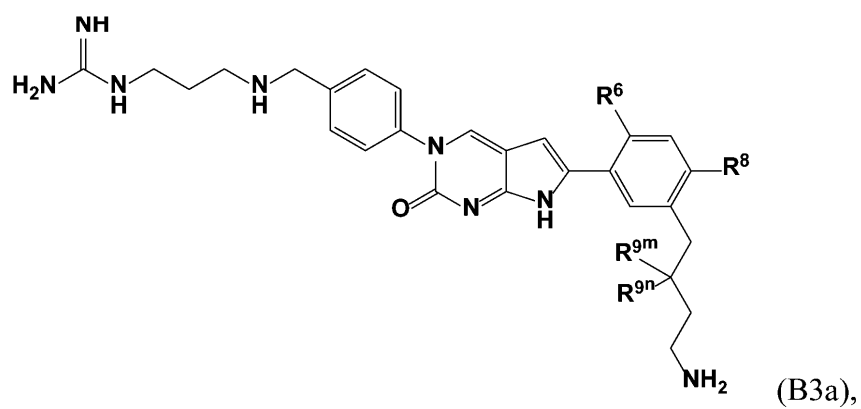
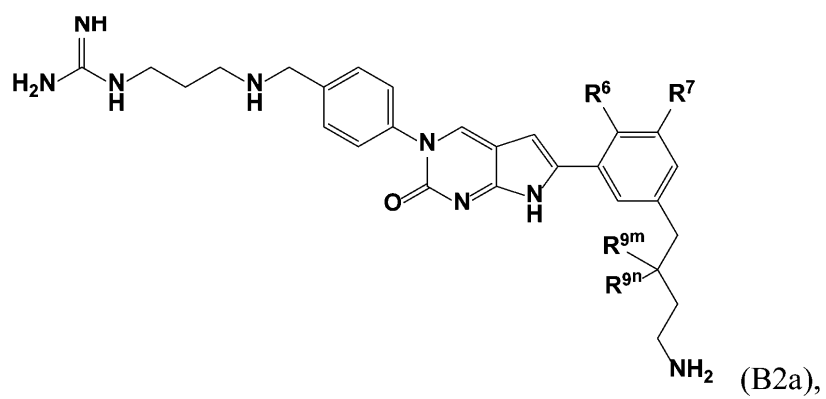
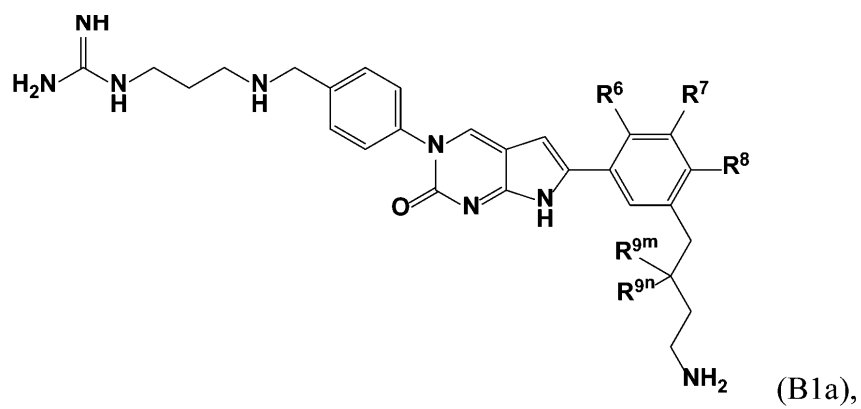


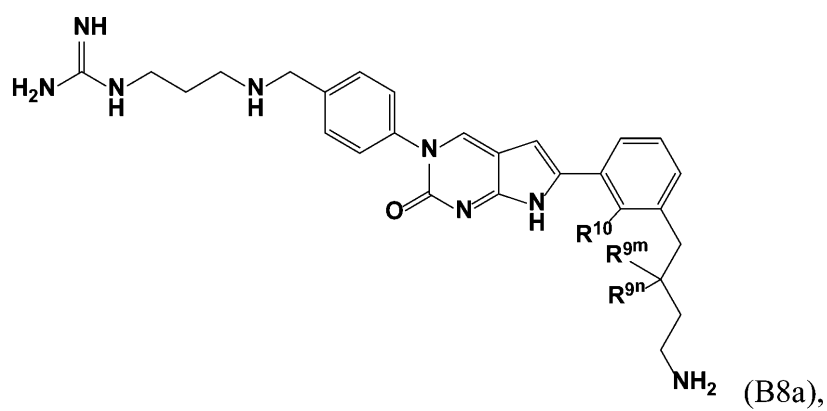
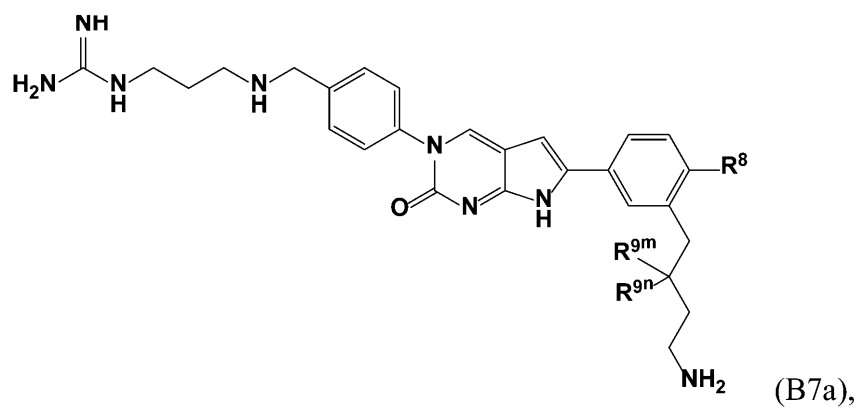
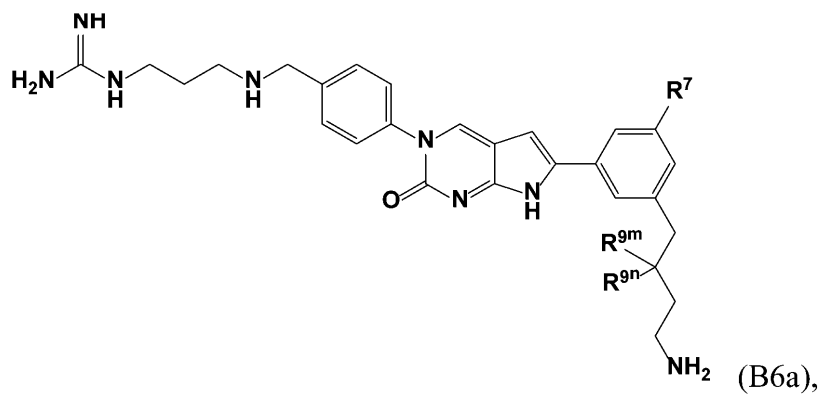
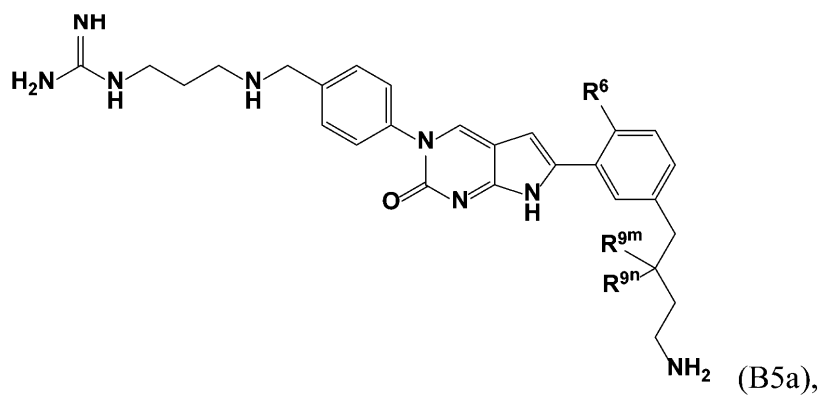


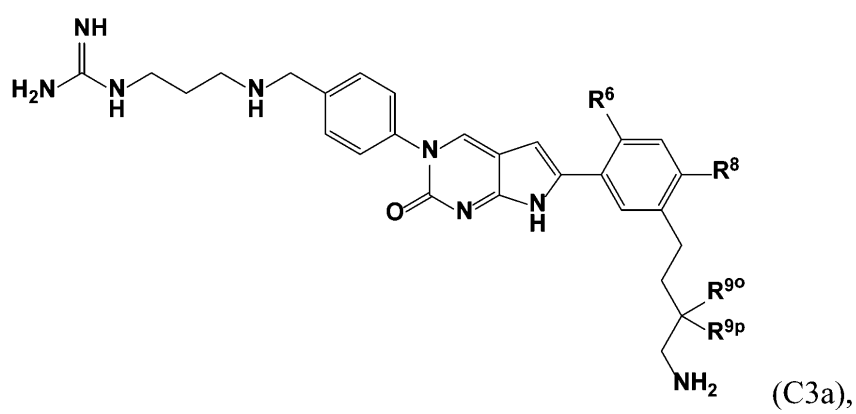
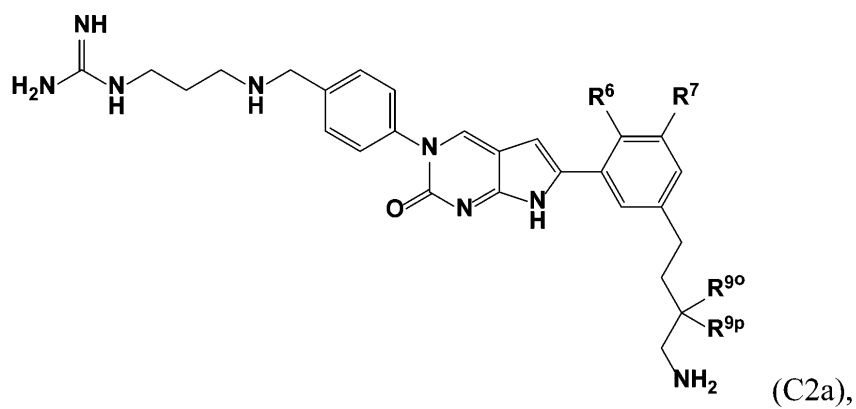
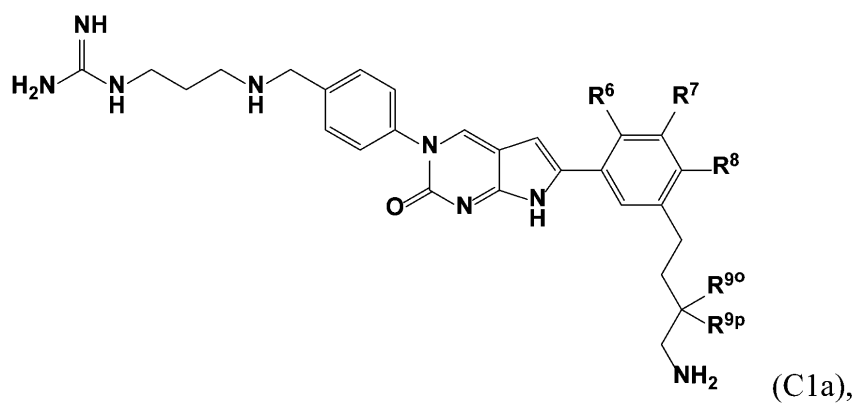
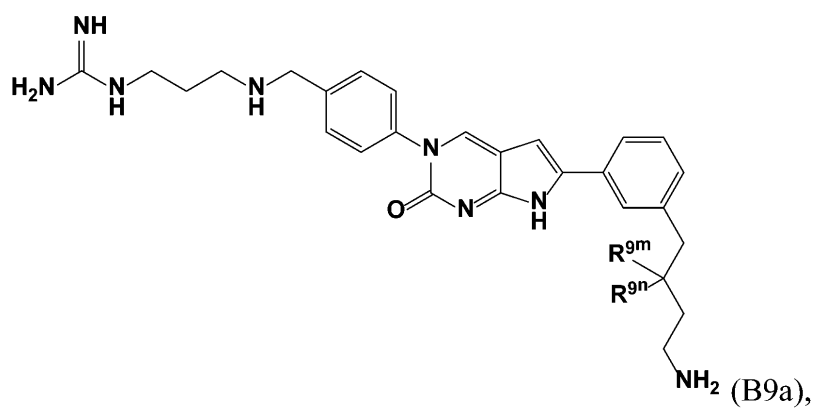






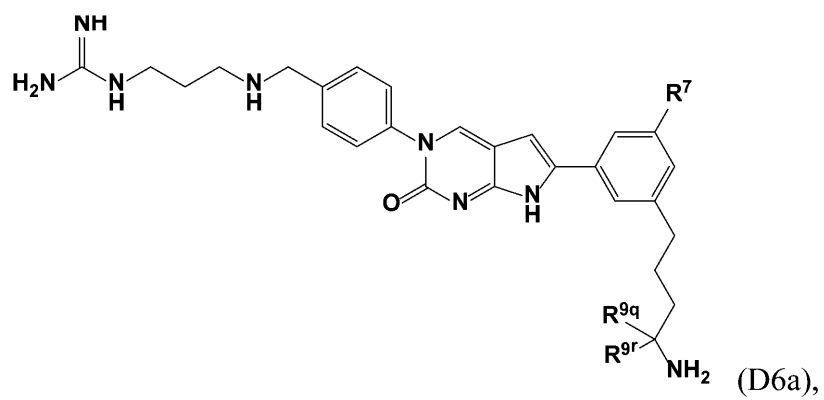
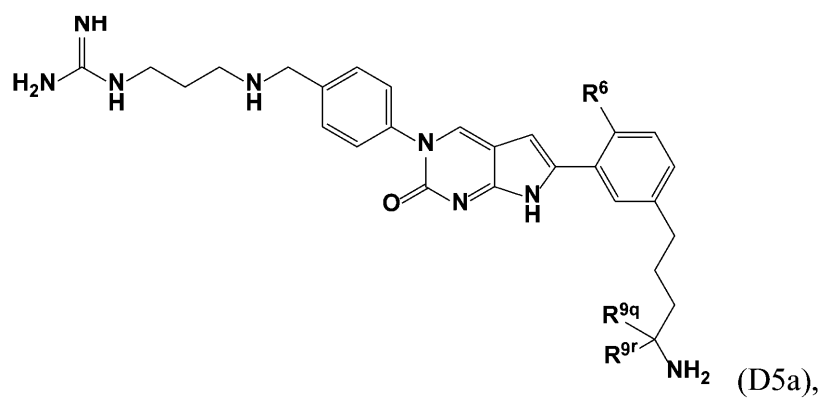
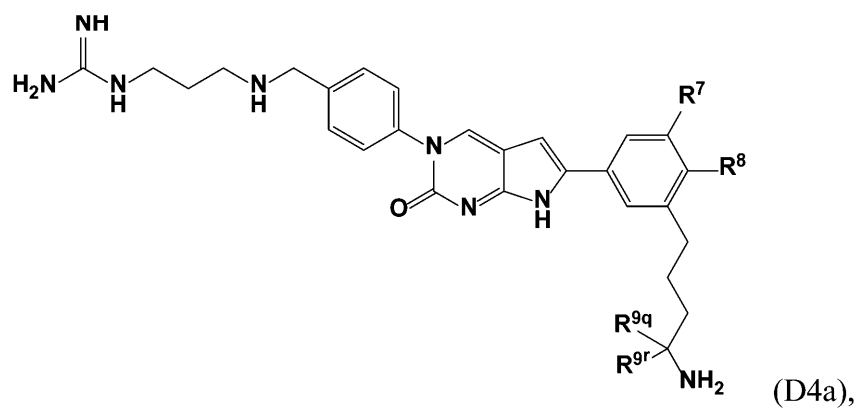
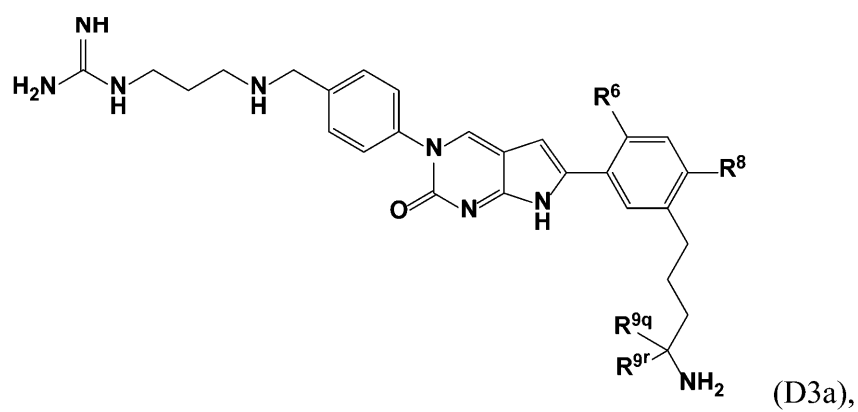


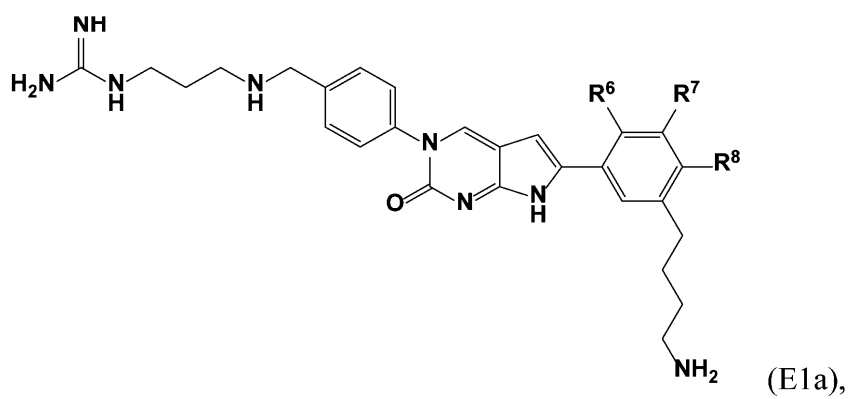
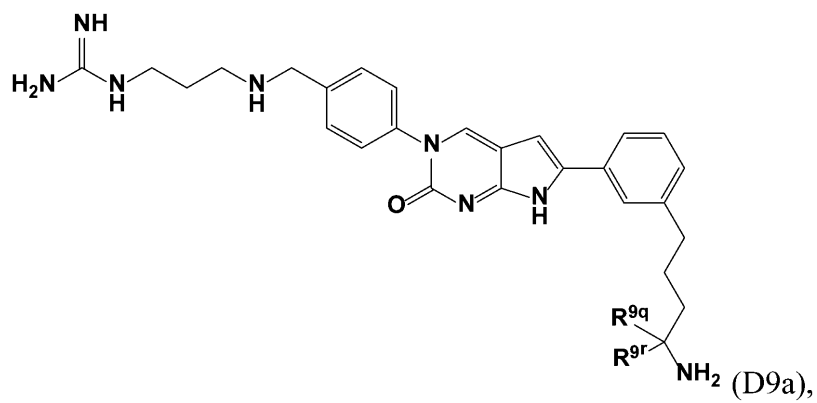
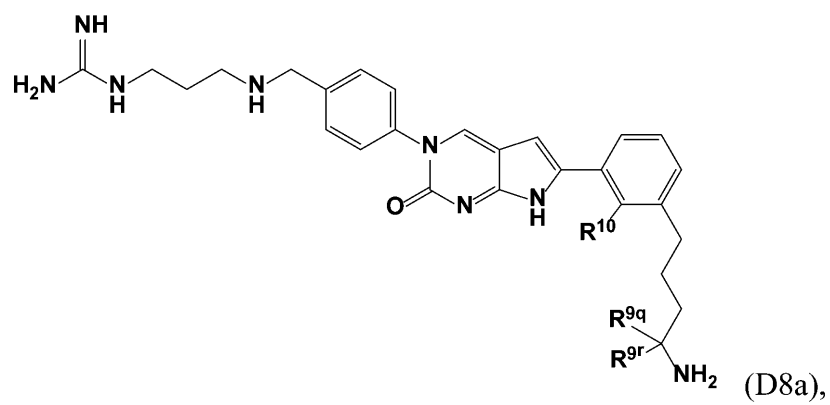
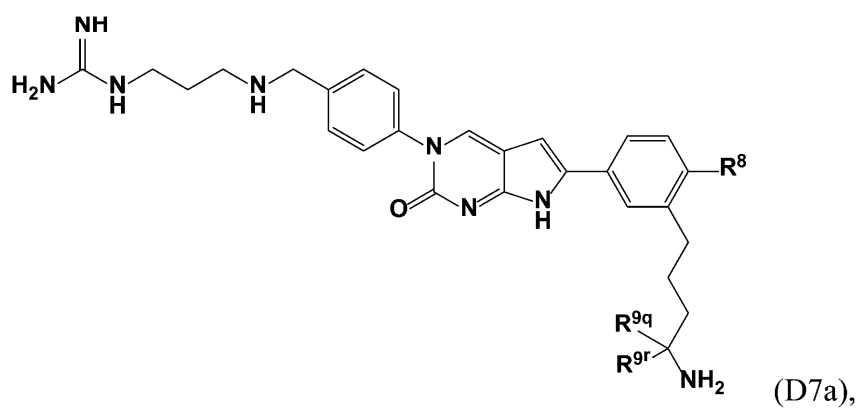




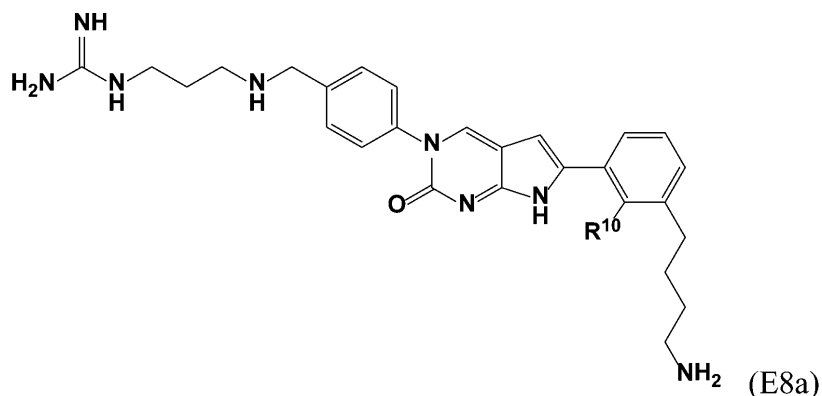
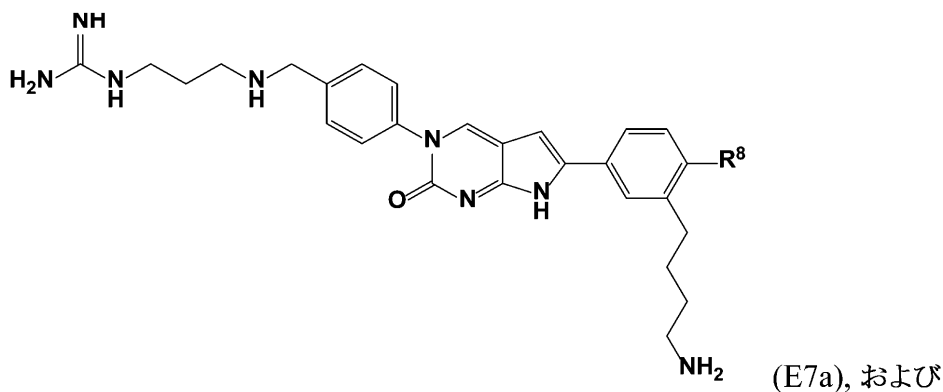
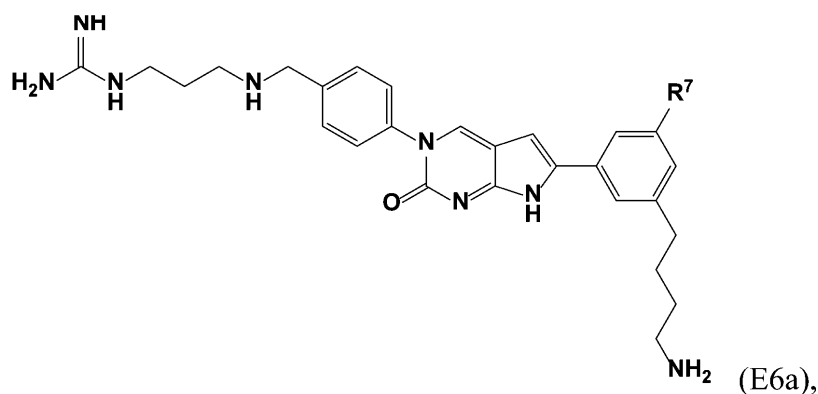












より選択される式を有する、請求項3記載の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

【請求項5】

(i) R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} が、それぞれ独立して(a) 水素、(b) ハロゲン、(c) $-\text{CF}_3$ 、(d) $-\text{CF}_2\text{H}$ 、(e) $-\text{CFH}_2$ 、(f) $-\text{OCF}_3$ 、(g) $-\text{OCH}_3$ 、(h) $-\text{OCF}_2\text{H}$ 、(i) $-\text{OCFH}_2$ 、(j) $-\text{OR}^{11}$ 、(k) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキル、(l) ハロアルキル、(m) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3～14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環、ならびに(n) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキル、(o) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキル、(p) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキル、(q) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキル、(r) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキル、(s) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキル、(t) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキルより選択され；

あるいは、 R^{9k} および R^{9l} 、 R^{9m} および R^{9n} 、 R^{9o} および R^{9p} 、 R^{9q} および R^{9r} 、ならびに R^{9s} および R^{9t} より選択される1対もしくは複数対の置換基が、それらが結合している炭素原子と一緒に、(a) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキル、または(b) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3～7員飽和もしくは不飽和複素環を形成し；または

(a) R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} が、それぞれ独立して(a) 水素；(b) ハロゲン；(c) $-\text{CF}_3$ ；(d) $-\text{CF}_2\text{H}$ ；(e) $-\text{CFH}_2$ ；(f) $-\text{OCF}_3$ ；(g) $-\text{OCH}_3$ ；(h) $-\text{OCF}_2\text{H}$ ；(i) $-\text{OCFH}_2$ ；(j) $-\text{OH}$ ；(k) $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{アルキル})$ ；(l) メチル、エチル、イソプロピルおよびt-ブチルより選択される $-\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル；(m) オキセタニル、アゼパニル、ピリジル、ジヒドロピリジル、フラニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピリ

ジル、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニルおよびピペリデニルより選択される-3~7員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環；ならびに (n) シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、フェニル、シクロヘキセニルおよびシクロヘキサジエニルより選択される-3~7員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環より選択されるか；

あるいは、 R^{9k} および R^{9l} 、 R^{9m} および R^{9n} 、 R^{9o} および R^{9p} 、 R^{9q} および R^{9r} 、ならびに R^{9s} および R^{9t} より選択される1対もしくは複数対の置換基が、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、シクロプロピル、シクロブチルまたはオキセタニルを形成し；もしくは

(b) R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} が、それぞれ独立して (a) 水素、(b) ハロゲン、(d) $-CF_3$ 、(e) $-CF_2H$ 、(f) $-CFH_2$ 、(g) $-OCF_3$ 、(h) $-OCH_3$ 、(i) $-OCF_2H$ 、(j) $-OCFH_2$ 、(k) $-OH$ 、(l) $-OCH_3$ 、(l) メチル、(m) エチル、(n) イソプロピルおよび(o) t-ブチルより選択され；

(ii) R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択される少なくとも1個の置換基が水素ではないか、または R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択される少なくとも2個の置換基が水素ではなく、

(iii) R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が、それぞれ独立して水素およびFより選択されるか、または R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 がそれぞれ水素であり、

(iv) R^{3a} および R^{3b} が、それぞれ独立して (a) 水素、(b) F、(c) Cl、(d) $-CH_3$ 、(e) $-CF_3$ 、(f) $-CF_2H$ 、(g) $-CFH_2$ 、(h) $-OCF_3$ 、(i) $-OCF_2H$ 、(j) $-OCFH_2$ 、(k) $-OCH_3$ および(l) $-OH$ より選択され、

(v) R^{10} が水素、FおよびClより選択され、かつ

(vi) R^6 、 R^7 および R^8 が、それぞれ独立して (a) F、(b) Cl、(c) $-CF_3$ 、(d) $-CF_2H$ 、(e) $-CFH_2$ 、(f) $-OCF_3$ 、(g) $-OCF_2H$ 、(h) $-OCFH_2$ 、(i) $-OCH_3$ 、(j) $-CN$ 、(k) $-OR^{11}$ 、(l) $-S(O)_pR^{11}$ 、(m) $-SCF_3$ 、(n) $-C_1 \sim C_8$ アルキル、(o) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環、(p) -3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環、(q) $-CHCHCN$ 、ならびに (r) $-CHCH-C(O)NH-t$ -ブチルより選択される、または

(a) R^6 、 R^7 および R^8 が、それぞれ独立して (a) F、(b) Cl、(c) $-CF_3$ 、(d) $-CF_2H$ 、(e) $-CFH_2$ 、(f) $-OCF_3$ 、(g) $-OCF_2H$ 、(h) $-OCFH_2$ 、(i) $-OCH_3$ 、(j) $-CN$ 、(k) $-OR^{11}$ 、(l) $-S(O)_pR^{11}$ 、(m) $-SCF_3$ 、(n) $-C_1 \sim C_8$ アルキル、(o) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環、ならびに (p) -3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環より選択される、もしくは

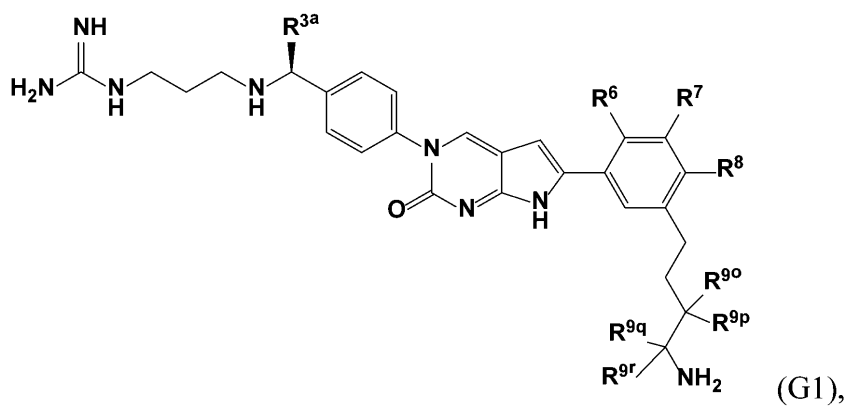
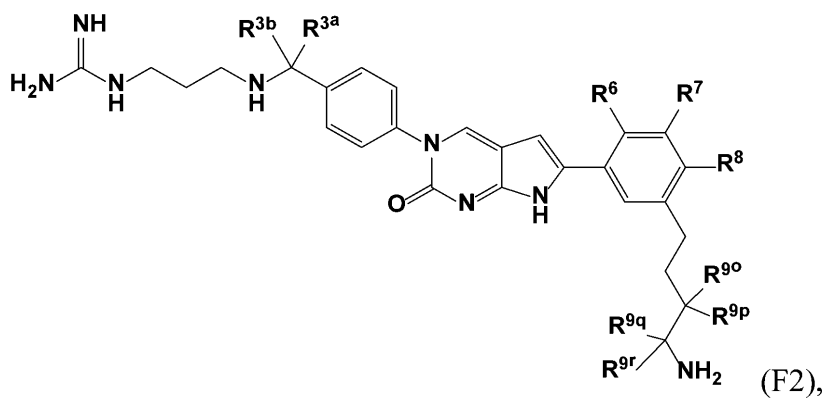
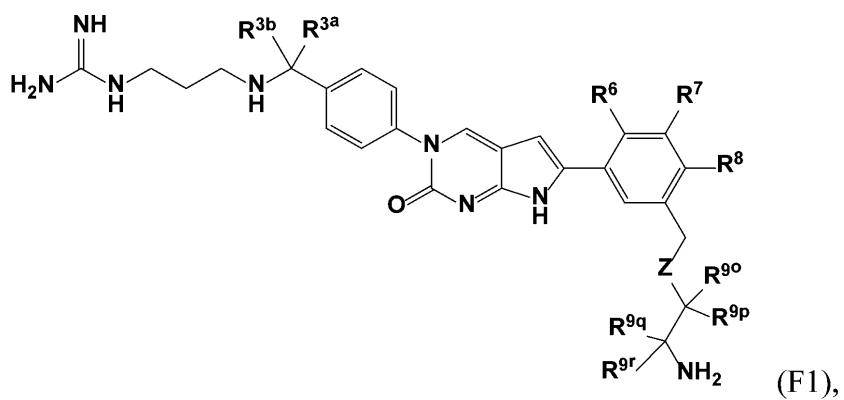
(b) R^6 、 R^7 および R^8 が、それぞれ独立して (a) F；(b) Cl；(c) $-CF_3$ ；(d) $-CF_2H$ ；(e) $-CFH_2$ ；(f) $-OCF_3$ ；(g) $-OCF_2H$ ；(h) $-OCFH_2$ ；(i) $-OCH_3$ ；(j) $-O(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ ；(k) $-S(O)CH_3$ ；(l) $-S(O)CF_3$ ；(m) $-S(O)_2CH_3$ ；(n) $-S(O)_2CF_3$ ；(o) $-SCF_3$ ；(p) メチル、エチル、イソプロピルおよびt-ブチルより選択される $-C_1 \sim C_4$ アルキル；(q) オキセタニル、アゼパニル、ピリジル、ジヒドロピリジル、フラニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピリジル、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニルおよびピペリデニル(piperidenyl)より選択される-3~7員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環；ならびに (r) シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、フェニル、シクロヘキセニルおよびシクロヘキサジエニルより選択される-3~7員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環より選択される、もしくは

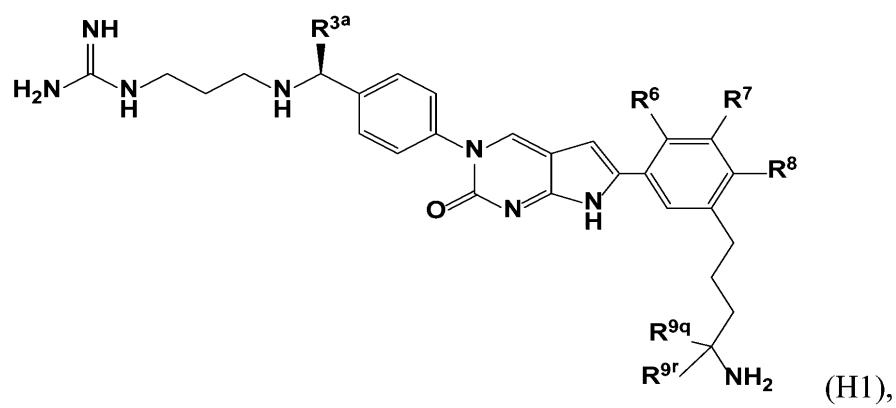
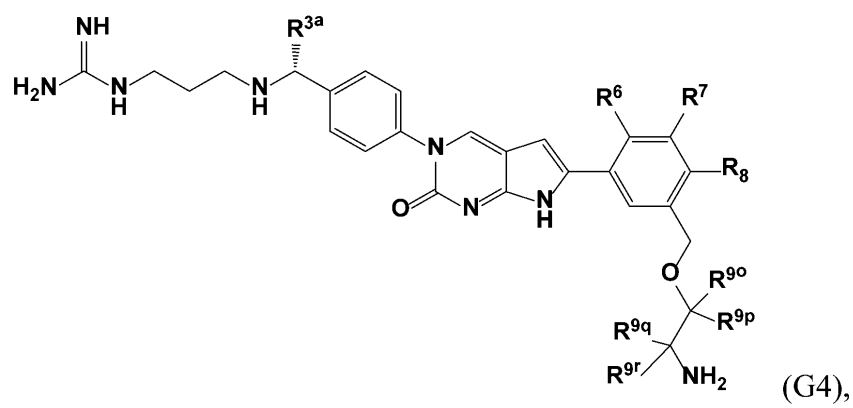
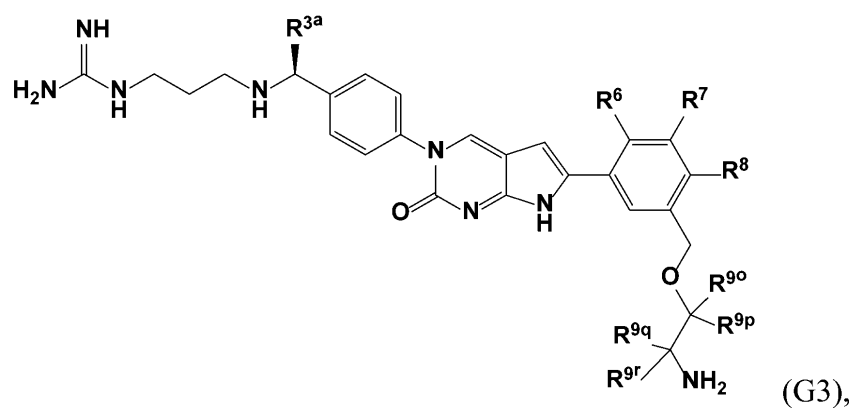
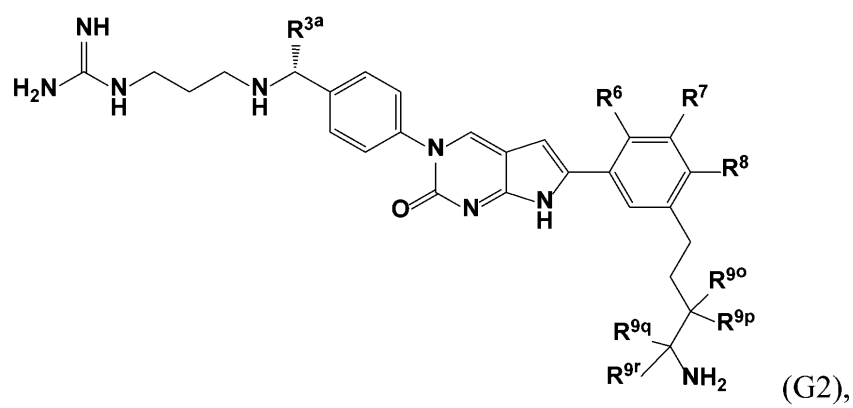
(c) R^6 、 R^7 および R^8 が、それぞれ独立して (a) F、(b) Cl、(c) $-CF_3$ 、(d) $-OCF_3$ 、(e) $-OCH_3$ 、(f) メチル、(g) エチル、(h) イソプロピル、(i) t-ブチル、(j) アゼパニル、(k) シクロプロピル、(l) シクロブチル、(m) シクロヘキシル、(n) フェニル、(o) ピリジル、(p) アゼチジニル、(q) ピロリジニル、(r) ピペリジニルおよび(s) ピペリデニルより選択される、

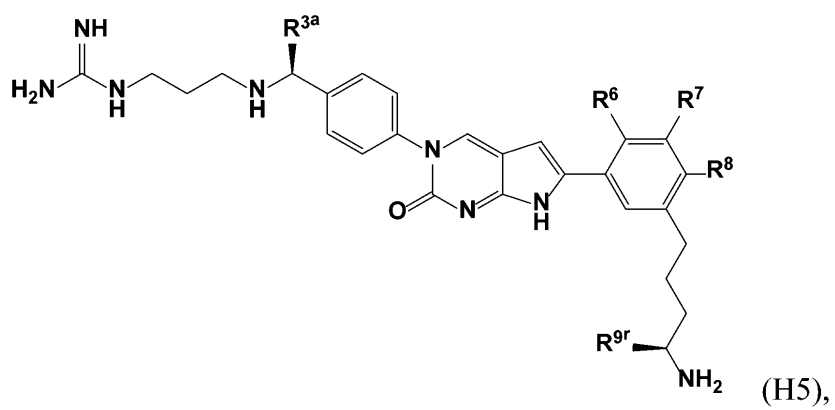
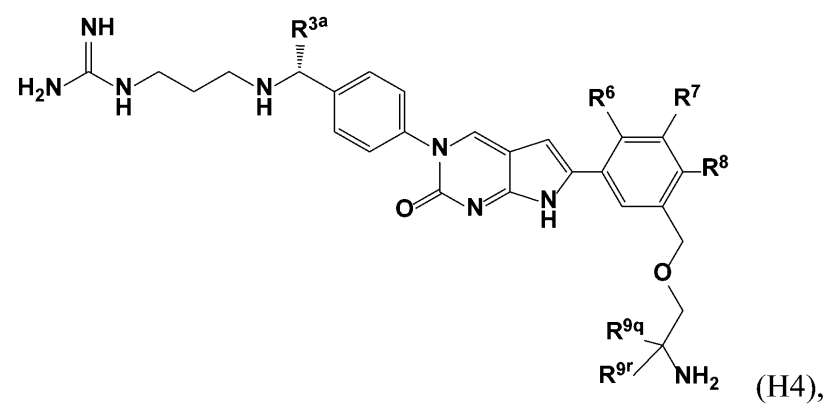
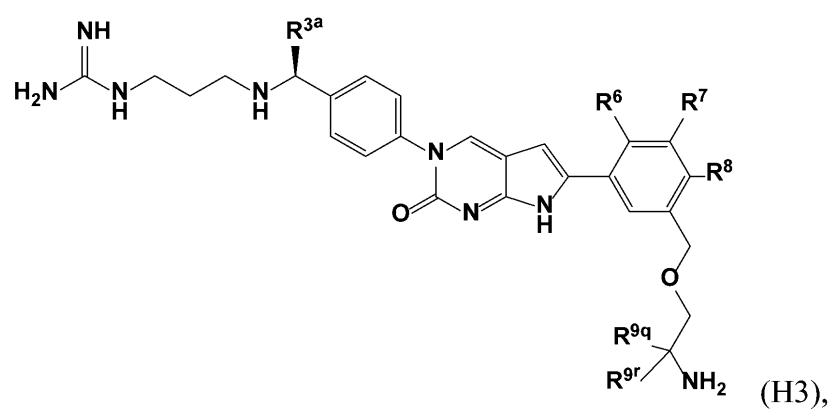
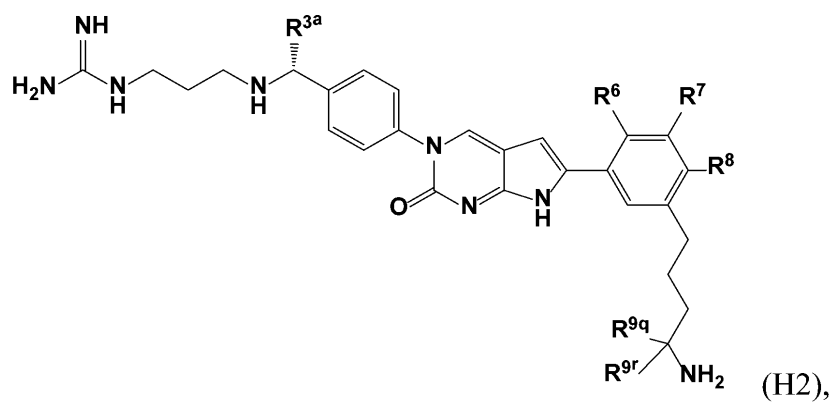
請求項1~4のいずれか一項記載の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは

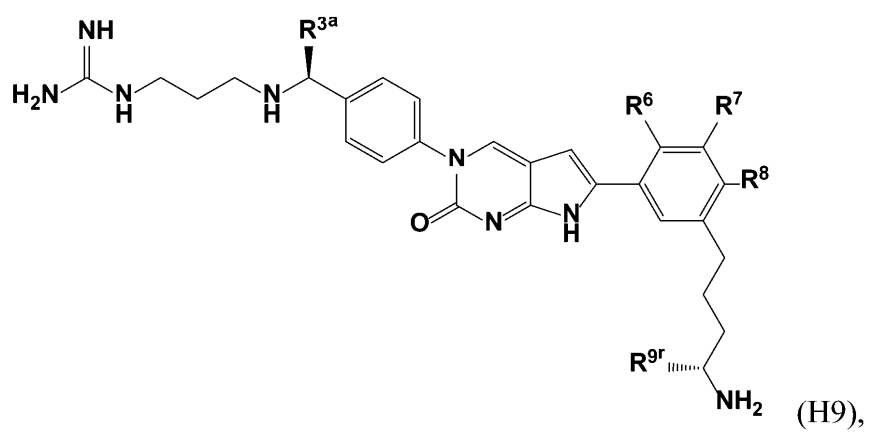
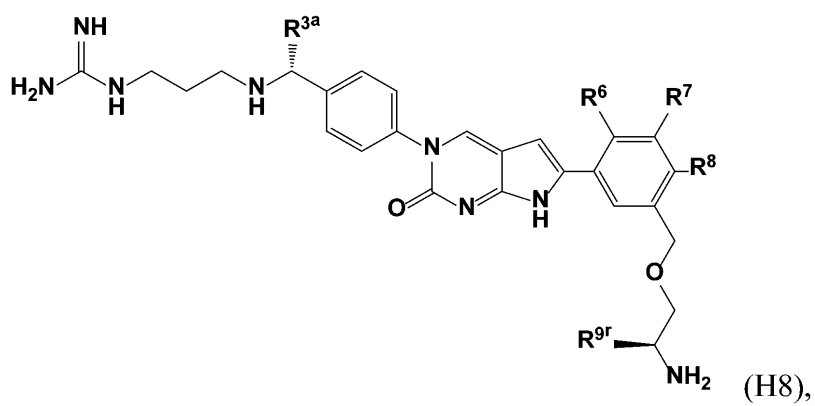
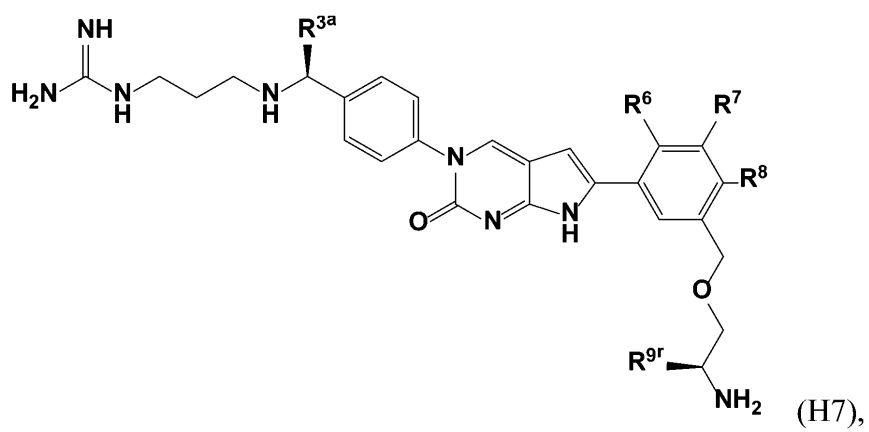
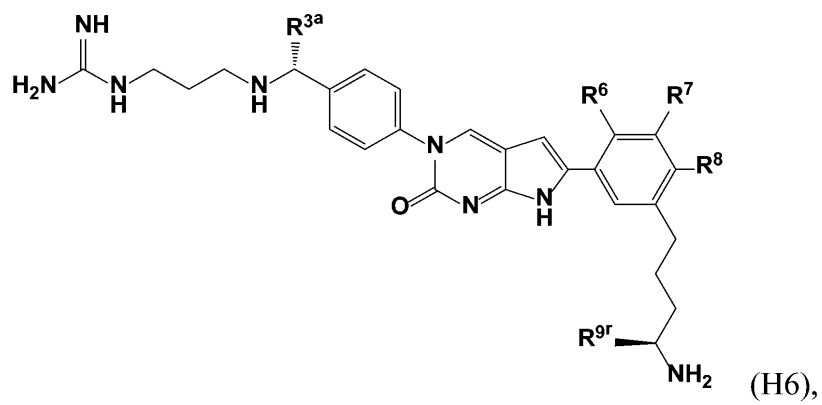
は互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

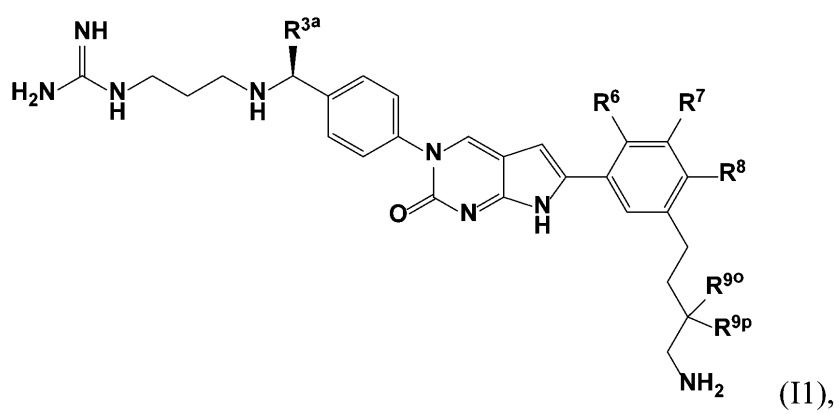
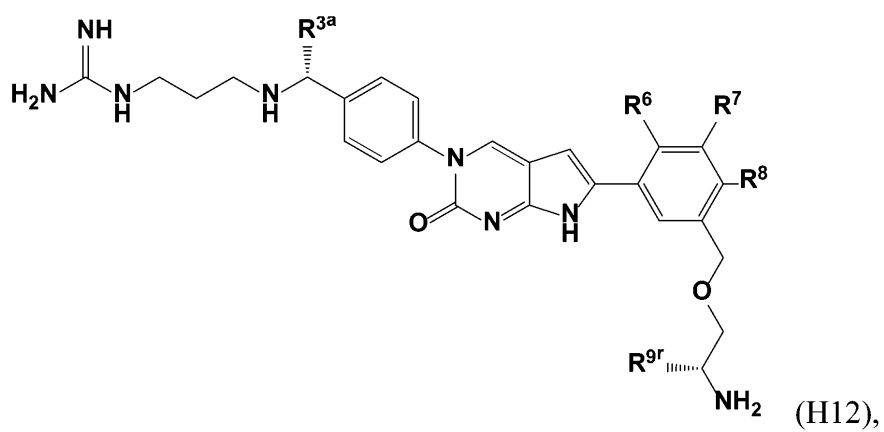
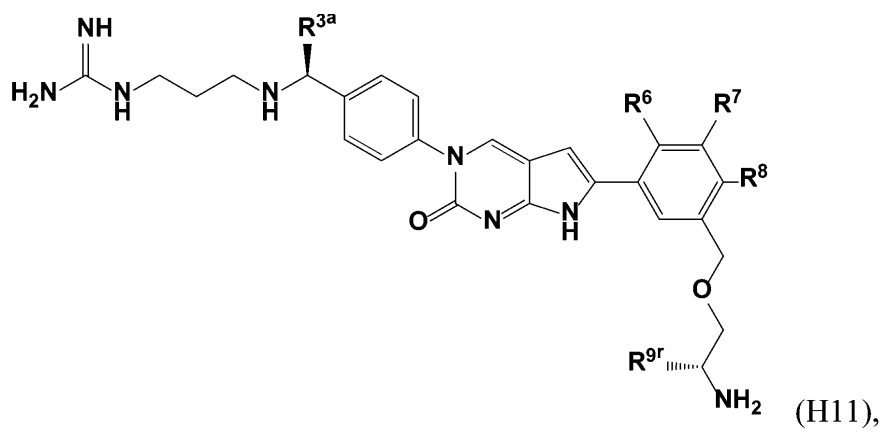
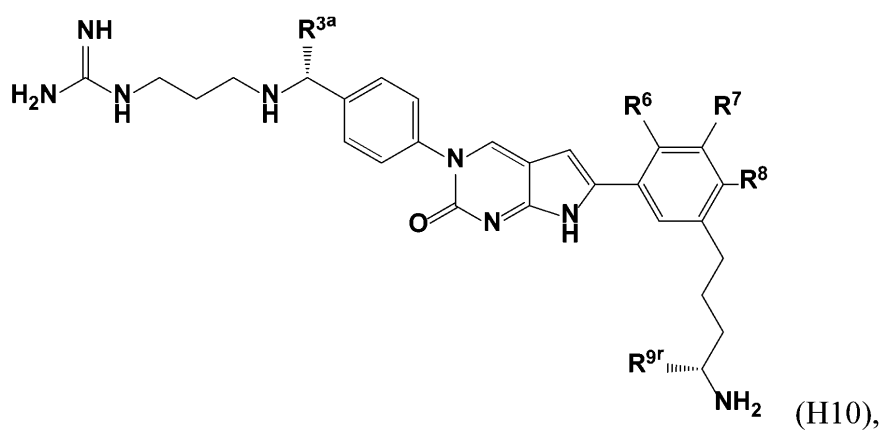
【請求項 6】

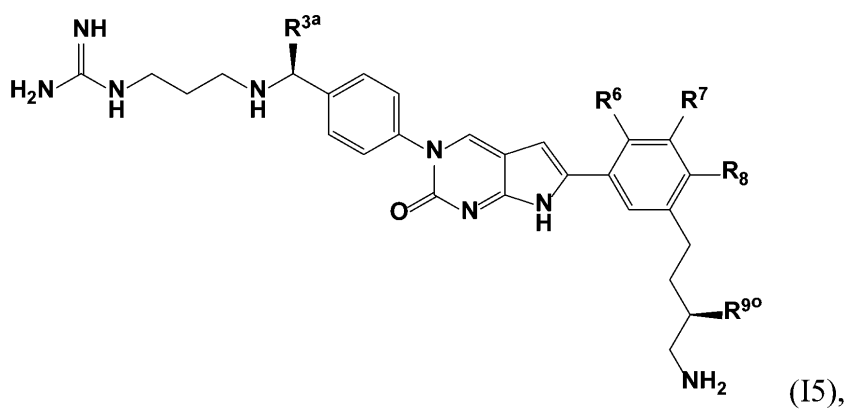
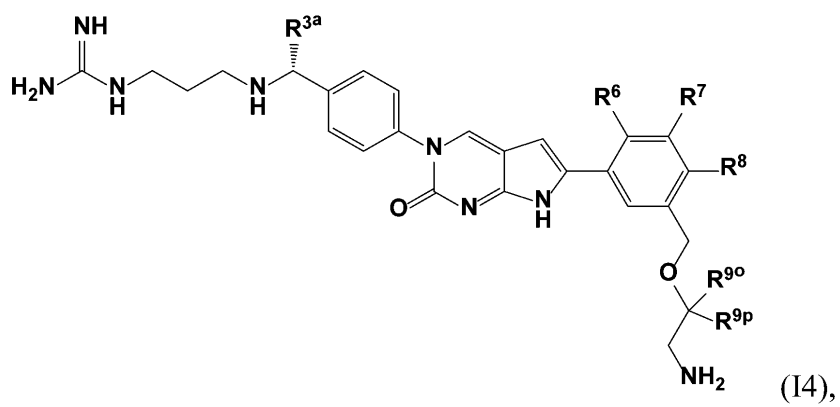
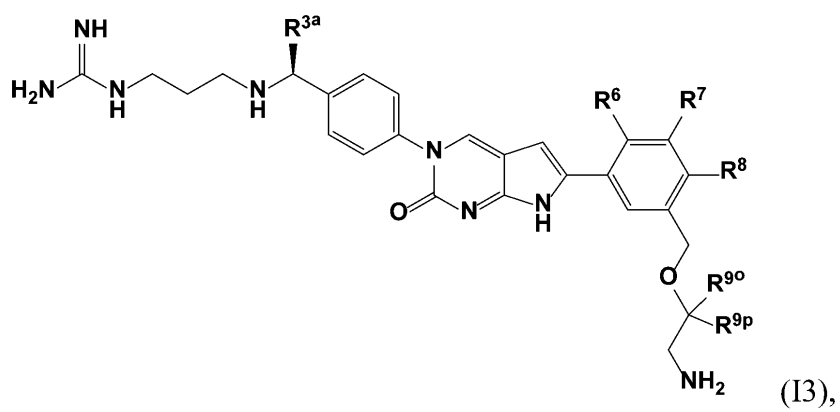
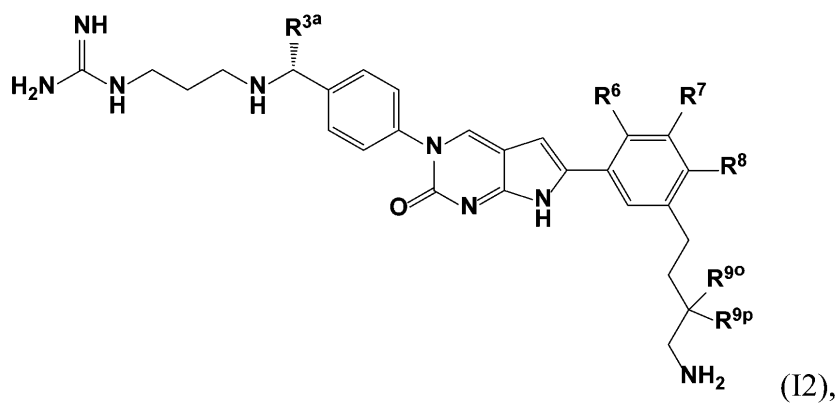


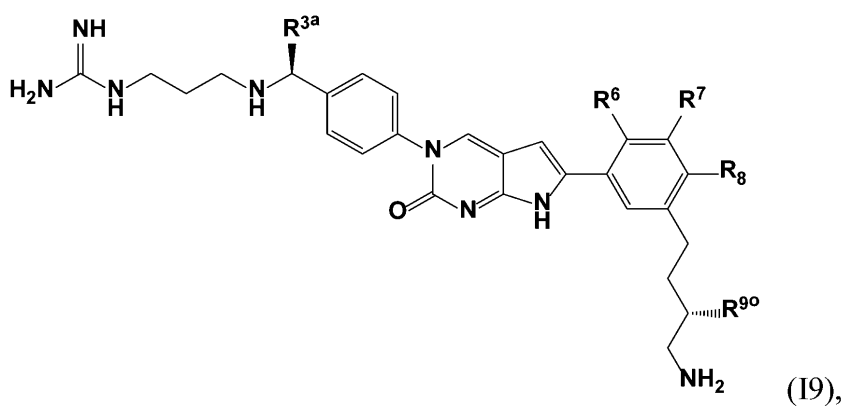
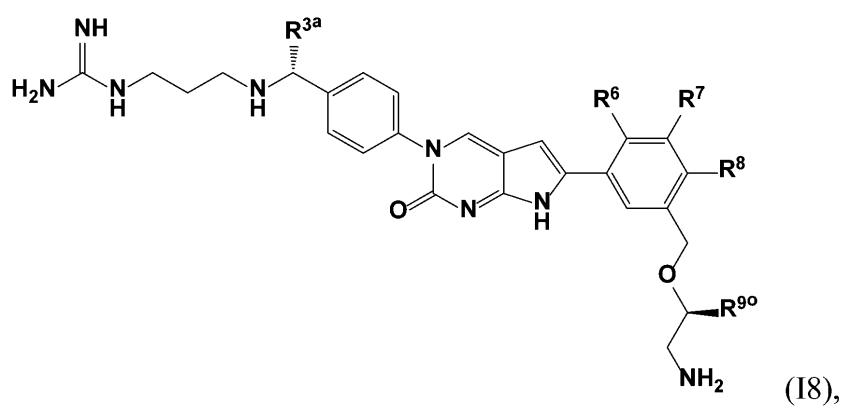
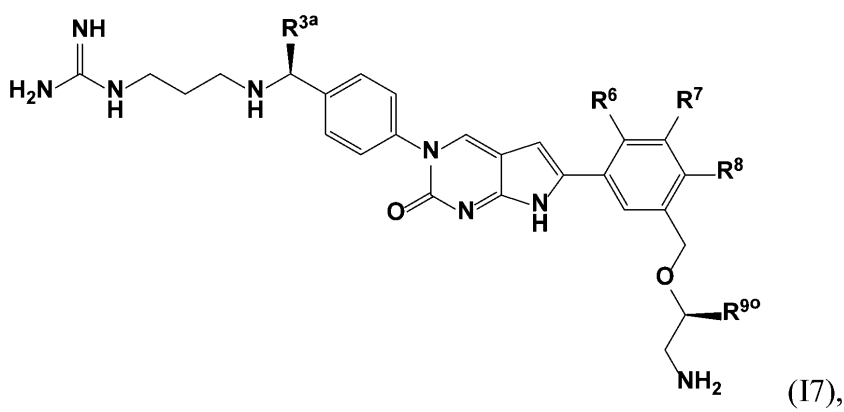
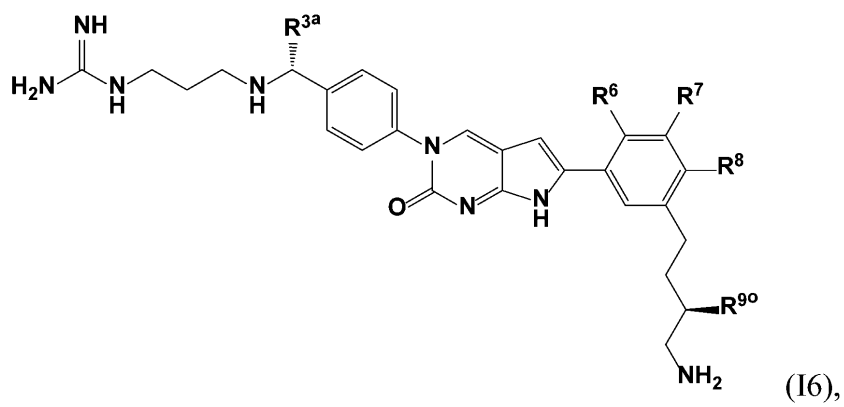


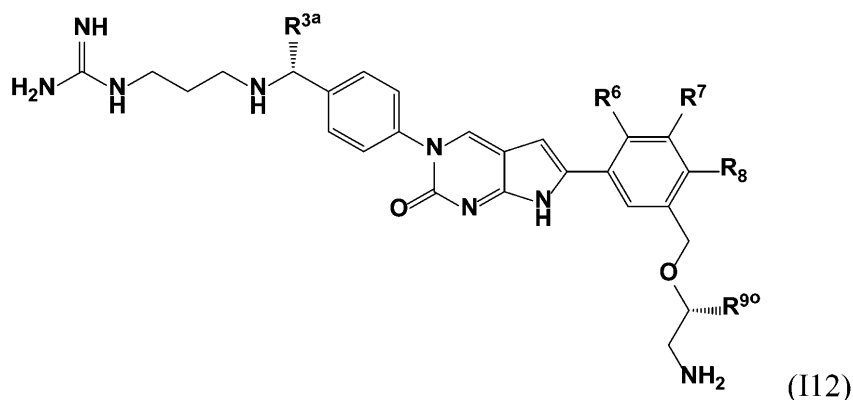
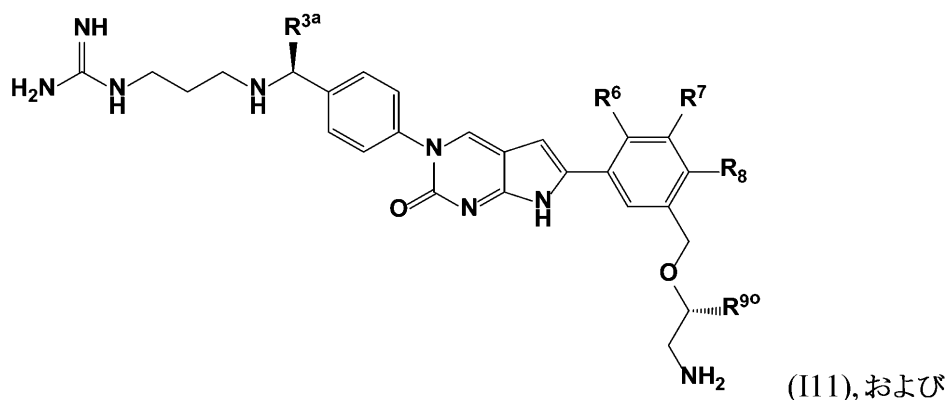
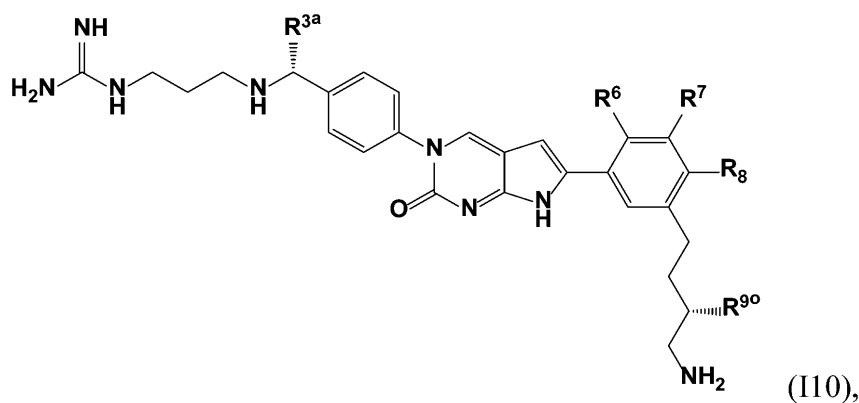












より選択される式を有する、請求項1~4のいずれか一項記載の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

【請求項7】

(i) 前記化合物が式 (F1) または (F2) である場合、Zが、 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-NR^{11}-$ 、 $-(C=O)-$ 、 $-NR^{11}(C=O)-$ 、 $-(C=O)NR^{11}-$ 、 $-S(O)_pNR^{11}-$ 、 $-NR^{11}S(O)_p-$ および $-NR^{11}S(O)_pNR^{11}-$ より選択され；

R^{3a} が、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルより選択され；

R^{3b} が、水素、ハロゲン、 $-OCF_3$ 、 $-OCF_2H$ 、 $-OCFH_2$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキルおよびハロアルキルより選択され；

R^6 、 R^7 および R^8 が、それぞれ独立して(a) 水素、(b) F、(c) Cl、(d) Br、(e) I、(f) $-CF_3$ 、(g) $-CF_2H$ 、(h) $-CFH_2$ 、(i) $-OCF_3$ 、(j) $-OCF_2H$ 、(k) $-OCFH_2$ 、(l) $-OCH_3$ 、(m) $-CN$ 、(n) $-N_3$ 、(o) $-NO_2$ 、(p) $-NR^{11}R^{11}$ 、(q) $-NR^{11}(CO)R^{11}$ 、(r) $-(CO)NR^{11}R^{11}$ 、(s) $-OR^{11}$ 、(t) $-COH$ 、(u) $-CO(C_1 \sim C_8 \text{アルキル})$ 、(v) $-COR^{11}$ 、(w) $-NR^{11}(CNR^{11})NR^{11}R^{11}$ 、(x) $-S(O)_pR^{11}$ 、(y) $-NR^{11}S(O)_pR^{11}$ 、(z) $-SR^{11}$ 、(aa) $-SCF_3$ 、(bb) $-C(CF_3)H-NH-CHR^{11}R^{11}$ 、(cc) $-COOR^{11}$ 、(dd) $-(OCH_2CH_2)_tR^{11}$ 、(ee) $-(OCH_2CH_2)_tOR^{11}$ 、(ff) $-C_1 \sim C_8 \text{アルキル}$ 、(g) $-C_2 \sim C_8 \text{アルケニル}$ および(hh) $-C_2 \sim C_8 \text{アルキニル}$ より選択され；

R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} および R^{9r} が、それぞれ独立して(a) 水素、(b) ハロゲン、(c) $-OCF_3$ 、(

d) $-\text{OCH}_3$ 、(e) $-\text{OCF}_2\text{H}$ 、(f) $-\text{OCFH}_2$ 、(g) $-\text{OR}^{11}$ 、(h) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキルおよび(i) ハロアルキルより選択され；

R^{11} が、水素、 $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルケニル、 $-\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ アルキニルおよびハロアルキルより選択され；

p が0、1または2であり；かつ

t が0、1または2であり；

(ii) 前記化合物が式 (F1) である場合、 Z が0であり；

R^{90} 、 R^{9p} 、 R^{9q} および R^{9r} が、それぞれ独立して $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルおよび水素より選択され；

R^6 および R^8 が、それぞれ独立して水素、F、Cl、Br、I、 $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CHF}_2$ および $-\text{CF}_3$ より選択され；

R^7 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OC}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{S}(\text{O})_p-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCH}_2\text{F}$ 、 $-\text{OCHF}_2$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p-\text{CH}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p-\text{CH}_2\text{F}$ および $-\text{S}(\text{O})_p-\text{CF}_3$ より選択され；

R^{3a} が、ハロゲンおよび $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルより選択され；

R^{3b} が、水素、ハロゲン、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルおよびハロアルキルより選択され；かつ

p が0、1または2であり；

(iii) 前記化合物が式 (F2) である場合、 R^{90} 、 R^{9p} 、 R^{9q} および R^{9r} が、それぞれ独立して $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルおよび水素より選択され；

R^6 および R^8 が、それぞれ独立して水素、F、Cl、Br、I、 $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CHF}_2$ および $-\text{CF}_3$ より選択され；

R^7 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OC}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{S}(\text{O})_p-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCH}_2\text{F}$ 、 $-\text{OCHF}_2$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p-\text{CH}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p-\text{CH}_2\text{F}$ および $-\text{S}(\text{O})_p-\text{CF}_3$ より選択され；

R^{3a} が、ハロゲンおよび $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルより選択され；

R^{3b} が、水素、ハロゲン、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{H}$ 、 $-\text{CFH}_2$ 、 $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルおよびハロアルキルより選択され；かつ

p が0、1または2であり；

(iv) 前記化合物が式 (G1)、(G2)、(G3)、または (G4) である場合、 R^{90} 、 R^{9p} 、 R^{9q} および R^{9r} が、それぞれ独立して $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルおよび水素より選択され；

R^6 および R^8 が、それぞれ独立して水素、F、Cl、Br、I、 $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CHF}_2$ および $-\text{CF}_3$ より選択され；

R^7 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OC}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{S}(\text{O})_p-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCH}_2\text{F}$ 、 $-\text{OCHF}_2$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p-\text{CH}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p-\text{CH}_2\text{F}$ および $-\text{S}(\text{O})_p-\text{CF}_3$ より選択され；

R^{3a} が、ハロゲンおよび $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルより選択され；かつ

p が0、1または2であり；

(v) 前記化合物が式 (G1)、(G2)、(G3)、または (G4) である場合、 R^{90} 、 R^{9p} 、 R^{9q} および R^{9r} が、それぞれ独立して $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルおよび水素より選択され；

R^6 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CHF}_2$ および $-\text{CF}_3$ より選択され；

R^7 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OC}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{S}(\text{O})_p-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCH}_2\text{F}$ 、 $-\text{OCHF}_2$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p-\text{CH}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p-\text{CH}_2\text{F}$ および $-\text{S}(\text{O})_p-\text{CF}_3$ より選択され；

R^8 が水素であり；

R^{3a} が、ハロゲンおよび $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルより選択され；かつ

p が0、1または2であり；

(vi) 前記化合物が式 (H1)、(H2)、(H3)、または (H4) である場合、 R^{9q} および R^{9r} が、それぞれ独立して $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルおよび水素より選択され；

R⁶およびR⁸が、それぞれ独立して水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂および-CF₃より選択され；

R⁷が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂、-CF₃、-OC₁~C₆アルキル、-S(O)_p-C₁~C₆アルキル、-OCH₂F、-OCHF₂、-OCF₃、-S(O)_p-CH₃、-S(O)_p-CH₂Fおよび-S(O)_p-CF₃より選択され；

R^{3a}が、ハロゲンおよび-C₁~C₆アルキルより選択され；かつ

pが0、1または2であり；

(vii) 前記化合物が式 (H1)、(H2)、(H3)、または (H4) である場合、R^{9a}およびR^{9r}が、それぞれ独立して-C₁~C₆アルキルおよび水素より選択され；

R⁶が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂および-CF₃より選択され；

R⁷が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂、-CF₃、-OC₁~C₆アルキル、-S(O)_p-C₁~C₆アルキル、-OCH₂F、-OCHF₂、-OCF₃、-S(O)_p-CH₃、-S(O)_p-CH₂Fおよび-S(O)_p-CF₃より選択され；

R⁸が水素であり；

R^{3a}が、ハロゲンおよび-C₁~C₆アルキルより選択され；かつ

pが0、1または2であり；

(viii) 前記化合物が式 (H5)、(H6)、(H7)、(H8)、(H9)、(H10)、(H11)、または (H12) である場合、R^{9r}が-C₁~C₆アルキルであり；

R⁶が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂および-CF₃より選択され；

R⁷が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂、-CF₃、-OC₁~C₆アルキル、-S(O)_p-C₁~C₆アルキル、-OCH₂F、-OCHF₂、-OCF₃、-S(O)_p-CH₃、-S(O)_p-CH₂Fおよび-S(O)_p-CF₃より選択され；

R⁸が水素であり；

R^{3a}が、ハロゲンおよび-C₁~C₆アルキルより選択され；かつ

pが0、1または2であり；

(ix) 前記化合物が式 (H5)、(H6)、(H7)、(H8)、(H9)、(H10)、(H11)、または (H12) である場合、R^{9r}が-CH₃であり；

R⁶が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂および-CF₃より選択され；

R⁷が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、CHF₂、-CF₃、-OC₁~C₆アルキル、-S(O)_p-C₁~C₆アルキル、-OCH₂F、-OCHF₂、-OCF₃、-S(O)_p-CH₃、-S(O)_p-CH₂Fおよび-S(O)_p-CF₃より選択され；

R⁸が水素であり；

R^{3a}が-CH₃であり；かつ

pが0、1または2であり；

(x) 前記化合物が式 (I1)、(I2)、(I3)、または (I4) である場合、R^{9o}およびR^{9p}が、それぞれ独立して-C₁~C₆アルキルおよび水素より選択され；

R⁶およびR⁸が、それぞれ独立して水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂および-CF₃より選択され；

R⁷が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂、-CF₃、-OC₁~C₆アルキル、-S(O)_p-C₁~C₆アルキル、-OCH₂F、-OCHF₂、-OCF₃、-S(O)_p-CH₃、-S(O)_p-CH₂Fおよび-S(O)_p-CF₃より選択され；

R^{3a}が、ハロゲンおよび-C₁~C₆アルキルより選択され；かつ

pが0、1または2であり；

(xi) 前記化合物が式 (I1)、(I2)、(I3)、または (I4) である場合、R^{9o}およびR^{9p}が、それぞれ独立してC₁~C₆アルキルおよび水素より選択され；

R⁶が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂および-CF₃より選択され；

R^7 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OC_1 \sim C_6$ アルキル、 $-S(O)_p-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-OCH_2F$ 、 $OCHF_2$ 、 $-OCF_3$ 、 $S(O)_p-CH_3$ 、 $-S(O)_p-CH_2F$ および $-S(O)_p-CF_3$ より選択され；

R^8 が水素であり；

R^{3a} が、ハロゲンおよび $-C_1 \sim C_6$ アルキルより選択され；かつ

p が 0、1 または 2 であり；

(xii) 前記化合物が式 (I5)、(I6)、(I7)、(I8)、(I9)、(I10)、(I11)、または (I12) である場合、 R^{90} が $-C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

R^6 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CH_2F$ 、 CHF_2 および $-CF_3$ より選択され；

R^7 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OC_1 \sim C_6$ アルキル、 $-S(O)_p-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-OCH_2F$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCF_3$ 、 $-S(O)_p-CH_3$ 、 $-S(O)_p-CH_2F$ および $-S(O)_p-CF_3$ より選択され；

R^8 が水素であり；

R^{3a} が、ハロゲンおよび $-C_1 \sim C_6$ アルキルより選択され；かつ

p が 0、1 または 2 であり；あるいは

(xiii) 前記化合物が式 (I5)、(I6)、(I7)、(I8)、(I9)、(I10)、(I11)、または (I12) である場合、 R^{90} が $-CH_3$ であり；

R^6 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ および $-CF_3$ より選択され；

R^7 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OC_1 \sim C_6$ アルキル、 $-S(O)_p-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-OCH_2F$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCF_3$ 、 $-S(O)_p-CH_3$ 、 $-S(O)_p-CH_2F$ および $-S(O)_p-CF_3$ より選択され；

R^8 が水素であり；

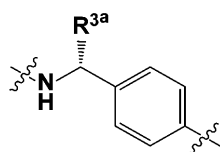
R^{3a} が $-CH_3$ であり；かつ

p が 0、1 または 2 である、

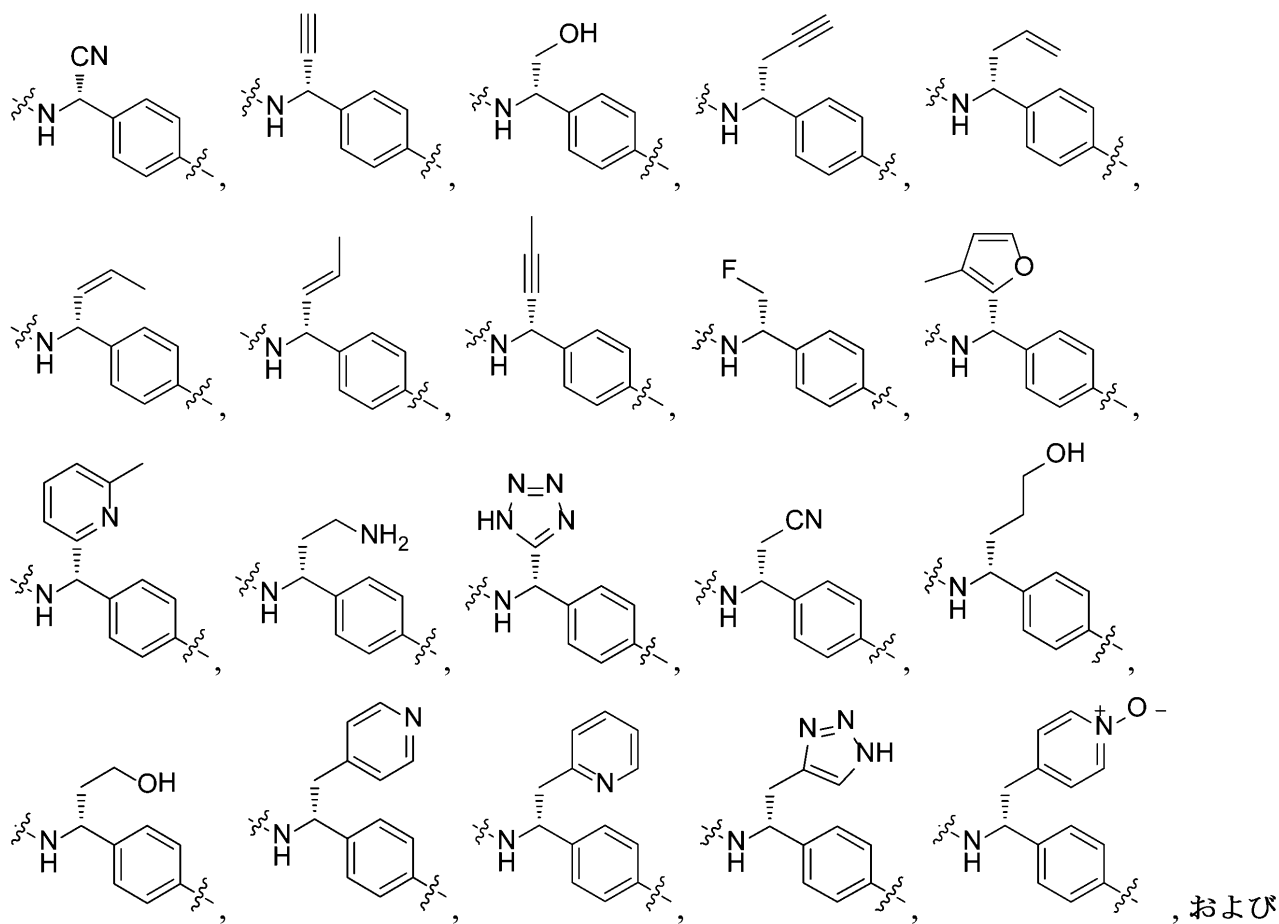
請求項6記載の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

【請求項8】

(i) 部分

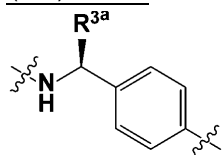


が

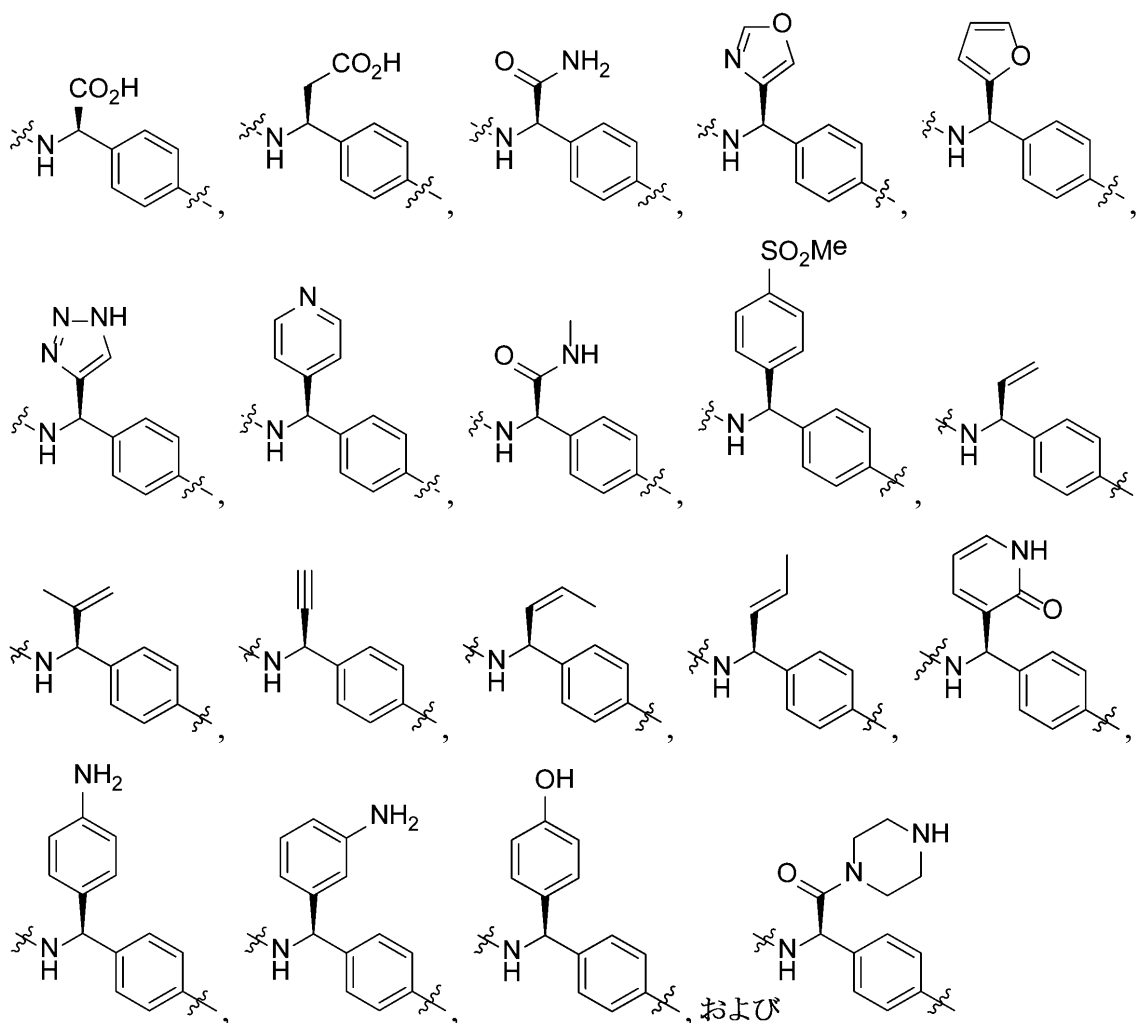


より選択され；かつ

(ii) 部分



が



より選択される、請求項6または7記載の化合物。

【請求項 9】

表1、表2、表2aおよび表2aaの化合物のいずれかである化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

【請求項 10】

リボソームまたは細菌リボソームに結合する、請求項1～9のいずれか一項記載の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

【請求項 11】

請求項1～10のいずれか一項記載の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグと、薬学的に許容される担体とを含む、薬学的組成物。

【請求項 12】

ヒトまたは動物における微生物感染症を治療するか、予防するか、または低減させるための医薬の製造における、請求項1～10のいずれか一項記載の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグの使用。

【請求項 13】

前記微生物感染症が、皮膚感染症、グラム陽性感染症、グラム陰性感染症、院内肺炎、市中肺炎、ウイルス感染後肺炎、院内肺炎/人工呼吸器関連肺炎、慢性気道感染症(CRTI)などの気道感染症、急性骨盤内感染症、急性細菌性皮膚・皮膚組織感染症(ABSSSI)および非複雑性皮膚・皮膚組織

感染症(uSSSI)を含む皮膚感染症、複雑性腹腔内感染症、尿路感染症、菌血症、敗血症、心内膜炎、房室シャント感染症、血管アクセス感染症、髄膜炎、外科的予防、腹膜感染症、骨感染症、関節感染症、メチシリン耐性黄色ブドウ球菌(*Staphylococcus aureus*)感染症、バンコマイシン耐性腸球菌(*Enterococci*)感染症、リネゾリド耐性生物感染症、炭疽菌(*Bacillus anthracis*)感染症、野兔病菌(*Francisella tularensis*)感染症、ペスト菌(*Yersinia pestis*)感染症、ならびに結核からなる群より選択され；

(i) 該微生物感染症がグラム陽性感染症であり；

(ii) 該微生物感染症がグラム陰性感染症であり；

(iii) 該微生物感染症が、アシネトバクター属(*Acinetobacter* spp.) (アシネトバクター・バウマンニ(*Acinetobacter baumannii*))、バクテロイデス・ディスタソニス(*Bacteroides distasonis*)、バクテロイデス・フラジリス(*Bacteroides fragilis*)、バクテロイデス・オパタス(*Bacteroides ovatus*)、バクテロイデス・テタイオタオミクロン(*Bacteroides thetaiotaomicron*)、バクテロイデス・ユニフォルミス(*Bacteroides uniformis*)、バクテロイデス・ブルガタス(*Bacteroides vulgatus*)、シトロバクター・フロインディイ(*Citrobacter freundii*)、シトロバクター・コセリ(*Citrobacter koseri*)、クロストリジウム・クロストリディオフォルメ(*Clostridium clostridioforme*)、クロストリジウム・パーフリンジェンス(*Clostridium perfringens*)、エンテロバクター・エロゲネス(*Enterobacter aerogenes*)、エンテロバクター・クロアカ(*Enterobacter cloacae*)、フェカリス菌(*Enterococcus faecalis*)、腸球菌属、大腸菌(*Escherichia coli*)、ユーバクテリウム・レントム(*Eubacterium lentum*)、フソバクテリウム属(*Fusobacterium* spp.)、インフルエンザ菌(*Haemophilus influenzae*)、パラインフルエンザ菌(*Haemophilus parainfluenzae*)、肺炎桿菌(*Klebsiella pneumoniae*)、クレブシエラ・オキシトカ(*Klebsiella oxytoca*)、レジオネラ・ニューモフィラ(*Legionella pneumophila*)、モラクセラ・カタラーリス(*Moraxella catarrhalis*)、モルガネラ・モーガニイ(*Morganella morganii*)、マイコプラズマ属(*Mycoplasma* spp.)、ペプトストレプトコッカス属(*Peptostreptococcus* spp.)、ポルフィロモナス・アサッカロリティカ(*Porphyromonas asaccharolytica*)、プレボテラ・ビビア(*Prevotella bivia*)、プロテウス・ミラビリス(*Proteus mirabilis*)、プロテウス・ブルガリス(*Proteus vulgaris*)、プロビデンシア・レットゲリ(*Providencia rettgeri*)、プロビデンシア・スチュアルティイ(*Providencia stuartii*)、緑膿菌(*Pseudomonas aeruginosa*)、霊菌(*Serratia marcescens*)、ストレプトコッカス・アンギノサス(*Streptococcus anginosus*)、黄色ブドウ球菌、表皮ブドウ球菌(*Staphylococcus epidermidis*)、ステノトロホモナス・マルトフィリア(*Stenotrophomonas maltophilia*)、ストレプトコッカス・アガラクチア(*Streptococcus agalactiae*)、ストレプトコッカス・コンステラータス(*Streptococcus constellatus*)、肺炎連鎖球菌(*Streptococcus pneumoniae*)、および化膿性連鎖球菌(*Streptococcus pyogenes*)より選択される1種または複数種の微生物により引き起こされるかまたはそれを包含し；

(iv) 該微生物感染症が、黄色ブドウ球菌、肺炎連鎖球菌、腸球菌属、ストレプトコッカス・アガラクチア、化膿性連鎖球菌および表皮ブドウ球菌より選択される1種または複数種の好気性および通性のグラム陽性微生物により引き起こされるかまたはそれを包含し；

(v) 該微生物感染症が、大腸菌、インフルエンザ菌、肺炎桿菌、シトロバクター・フロインディイ、エンテロバクター・エロゲネス、エンテロバクター・クロアカ、モルガネラ・モーガニイ、霊菌、緑膿菌、アシネトバクター・バウマンニ、モラクセラ・カタラーリス、プロテウス・ミラビリス、シトロバクター・コセリ、パラインフルエンザ菌、クレブシエラ・オキシトカ、プロテウス・ブルガリス、プロビデンシア・レットゲリおよびプロビデンシア・スチュアルティイより選択される1種または複数種の好気性および通性のグラム陰性微生物により引き起こされるかまたはそれを包含し；

(vi) 該微生物感染症が、1種または複数種の嫌気性微生物：バクテロイデス・フラジリス、バクテロイデス・ディスタソニス、バクテロイデス・オパタス、バクテロイデス・テタイオタオミクロン、バクテロイデス・ユニフォルミス、クロストリジウム・クロストリ

ディオフォルメ、ユーバクテリウム・レントム、ペプトストレプトコッカス属、ボルフィロモナス・アサッカロリティカ、プレボテラ・ビビア、バクテロイデス・ブルガタス、クロストリジウム・パーフリンジエンスおよびフソバクテリウム属により引き起こされるかまたはそれを包含し；

(vii) 微生物腸球菌属が、バンコマイシン感受性分離株およびバンコマイシン耐性分離株より選択され；

(viii) 微生物大腸菌が、基質特異性拡張型 -ラクタマーゼ(ESBL)産生分離株および肺炎桿菌カルバペネマーゼ(KPC)産生分離株より選択され；

(ix) 微生物インフルエンザ菌が -ラクタマーゼ陽性分離株であり；

(x) 微生物肺炎桿菌が、基質特異性拡張型 -ラクタマーゼ(ESBL)産生分離株および肺炎桿菌カルバペネマーゼ(KPC)産生分離株より選択され；

(xi) 微生物クレブシエラ・オキシトカが、基質特異性拡張型 -ラクタマーゼ(ESBL)産生分離株および肺炎桿菌カルバペネマーゼ(KPC)産生分離株より選択され；

(xii) 微生物黄色ブドウ球菌が、メチシリン感受性分離株およびメチシリン耐性分離株より選択され；

(xiii) 微生物表皮ブドウ球菌が、メチシリン感受性分離株およびメチシリン耐性分離株より選択され；あるいは

(xiv) 微生物肺炎連鎖球菌が、ペニシリン感受性分離株およびペニシリン耐性分離株より選択される、

請求項12記載の使用。

【請求項14】

化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグの量が、0.1mg ~ 1500mgを構成するか、あるいは約25mg、または約50mg、または約75mg、または約100mg、または約125mg、または約150mg、または約175mg、または約200mg、または約225mg、または約250mg、または約275mg、または約300mg、または約325、または約350mg、または約375mg、または約400mg、または約425mg、または約450mg、または約475mg、または約500mg、または約525mg、または約550mg、または約575mg、または約600mg、または約625mg、または約650mg、または約675mg、または約700mg、または約725mg、または約750mg、または約775mg、または約800mg、または約825mg、または約850mg、または約875mg、または約900mg、または約925mg、または約950mg、または約975mg、または約1000mg、または約1025mg、または約1050mg、または約1075mg、または約1100mg、または約1125mg、または約1150mg、または約1175mg、または約1200mg、または約1225mg、または約1250mg、または約1275mg、または約1300mg、または約1325mg、または約1350mg、または約1375mg、または約1400mg、または約1425mg、または約1450mg、または約1475mg、または約1500mgを構成する、請求項13記載の使用。

【請求項15】

請求項1~10のいずれか一項記載の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグを含む、医療デバイス。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0015

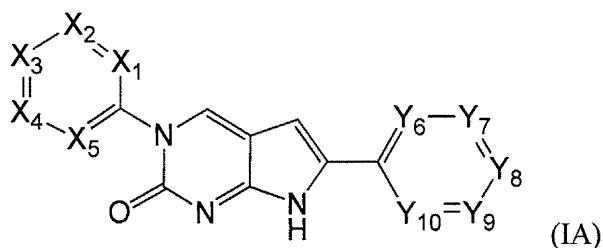
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0015】

[本発明1001]

下記式を有する化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ：



式中、

X_1 は CR^1 またはNであり； X_2 は CR^2 またはNであり； X_3 は CR^3 またはNであり； X_4 は CR^4 またはNであり； X_5 は CR^5 またはNであるが；但し、 X_1 、 X_2 、 X_3 、 X_4 および X_5 がすべてNであることはなく；

Y_6 は CR^6 またはNであり； Y_7 は CR^7 またはNであり； Y_8 は CR^8 またはNであり； Y_9 は CR^9 またはNであり； Y_{10} は CR^{10} またはNであるが；但し、 Y_6 、 Y_7 、 Y_8 、 Y_9 および Y_{10} がすべてNであることはなく；

ここで、 R^1 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 および R^{10} は、それぞれ独立して(a) 水素、(b) F、(c) Cl、(d) Br、(e) I、(f) $-CF_3$ 、(g) $-CF_2H$ 、(h) $-CFH_2$ 、(i) $-OCF_3$ 、(j) $-OCF_2H$ 、(k) $-OCFH_2$ 、(l) $-OCH_3$ 、(m) $-CN$ 、(n) $-N_3$ 、(o) $-NO_2$ 、(p) $-NR^{11}R^{11}$ 、(q) $-NR^{11}C(O)R^{11}$ 、(r) $-C(O)NR^{11}R^{11}$ 、(s) $-OR^{11}$ 、(t) $-COH$ 、(u) $-CO(C_1 \sim C_8 \text{アルキル})$ 、(v) $-COR^{11}$ 、(w) $-NR^{11}(CNR^{11})NR^{11}R^{11}$ 、(x) $-S(O)_pR^{11}$ 、(y) $-NR^{11}S(O)_pR^{11}$ 、(z) $-SR^{11}$ 、(aa) $-SCF_3$ 、(bb) $-C(CF_3)H-NH-CHR^{11}R^{11}$ 、(cc) $-COOR^{11}$ 、(dd) $-(OCH_2CH_2)_tR^{11}$ 、(ee) $-(OCH_2CH_2)_tOR^{11}$ 、(ff) $-C_1 \sim C_8 \text{アルキル}$ 、(gg) $-C_2 \sim C_8 \text{アルケニル}$ 、(hh) $-C_2 \sim C_8 \text{アルキニル}$ 、(ii) $-(C_1 \sim C_8 \text{アルキル})-(\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3} \sim 14 \text{員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環})$ 、(jj) $-(C_1 \sim C_8 \text{アルキル})-(3 \sim 14 \text{員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環})$ 、(kk) $-ハロアルキル$ 、(ll) $-窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3 \sim 14 \text{員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環}$ 、(mm) $-3 \sim 14 \text{員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環}$ 、ならびに(nn) $-CHR^{11}-NH-(\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3} \sim 14 \text{員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環})$ より選択され；

ここで(ff)～(nn)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、 R^6 、 R^7 および R^8 より選択される2個の置換基は、それらが結合している炭素原子と一緒に、(a) $-3 \sim 7 \text{員飽和もしくは不飽和炭素環}$ 、または(b) $-窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3 \sim 7 \text{員飽和もしくは不飽和複素環}$ を形成し；ここで(a)～(b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

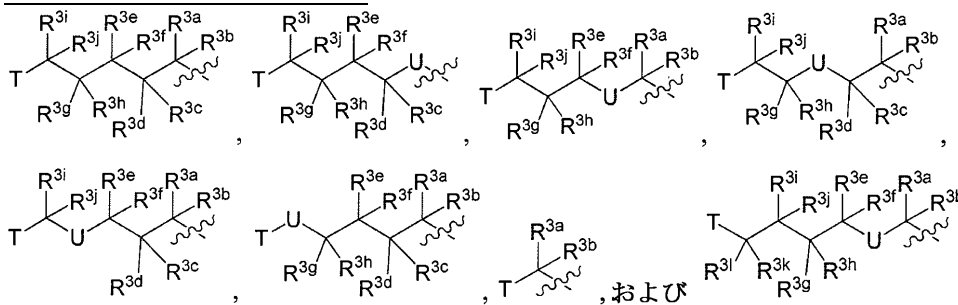
各 R^{11} は、独立して(a) 水素、(b) ハロゲン、(c) $-OH$ 、(d) $-SH$ 、(e) $-(C_1 \sim C_8 \text{アルキル})OH$ 、(f) $-OCF_3$ 、(g) $-OCF_2H$ 、(h) $-OCFH_2$ 、(i) $-OCH_3$ 、(j) $-OR^{12}$ 、(k) $-COR^{12}$ 、(l) $-CN$ 、(m) $-NO_2$ 、(n) $-CONH_2$ 、(o) $-CONR^{12}R^{12}$ 、(p) $-COCH_3$ 、(q) $-S(O)_pCH_3$ 、(r) $-S(O)_pNR^{12}R^{12}$ 、(s) $-SR^{12}$ 、(t) $-C(O)OH$ 、(u) $-C(O)OR^{12}$ 、(v) $-N_3$ 、(w) $-NH_2$ 、(x) $-NR^{12}C(O)R^{12}$ 、(y) $-NH(C_1 \sim C_8 \text{アルキル})$ 、(z) $-N(C_1 \sim C_8 \text{アルキル})_2$ 、(aa) $-C_1 \sim C_8 \text{アルキル}$ 、(bb) $-C_2 \sim C_8 \text{アルケニル}$ 、(cc) $-C_2 \sim C_8 \text{アルキニル}$ 、(dd) $-ハロアルキル$ 、(ee) $-(C_1 \sim C_8 \text{アルキル})-(\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3} \sim 14 \text{員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環})$ 、(ff) $-(C_1 \sim C_8 \text{アルキル})-(3 \sim 14 \text{員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環})$ 、(gg) $-窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3 \sim 14 \text{員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環}$ 、(hh) $-3 \sim 14 \text{員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環}$ 、ならびに(ii) $-(C=NH)NR^{12}R^{12}$ より選択され；

ここで(y)～(hh)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、2個の R^{11} 置換基は一緒に、(a) $-3 \sim 7 \text{員飽和もしくは不飽和炭素環}$ 、または(b) $-窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ$

原子を含有する3~7員飽和もしくは不飽和複素環を形成し、ここで(a)~(b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

R^3 は以下より選択され：



式中、 R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 、 R^{3d} 、 R^{3e} 、 R^{3f} 、 R^{3g} 、 R^{3h} 、 R^{3i} 、 R^{3j} 、 R^{3k} および R^{3l} は、それぞれ独立して(a) 水素、(b) ハロゲン、(c) $-CN$ 、(d) $-N_3$ 、(e) $-NO_2$ 、(f) $-OCF_3$ 、(g) $-OCF_2H$ 、(h) $-OCFH_2$ 、(i) $-OCH_3$ 、(j) $-OR^{11}$ 、(k) $-C(O)R^{11}$ 、(l) $-C(O)NR^{11}R^{11}$ 、(m) $-NH_2$ 、(n) $-NR^{11}R^{11}$ 、(o) $-NR^{11}C(O)R^{11}$ 、(p) $-S(O)_pR^{11}$ 、(q) $-C(O)OH$ 、(r) $-C(O)OR^{11}$ 、(s) $-C_1 \sim C_8$ アルキル、(t) $-C_2 \sim C_8$ アルケニル、(u) $-C_2 \sim C_8$ アルキニル、(v) ハロアルキル、(w) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環、ならびに(x) -3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環より選択され；

ここで(s)~(x)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、 R^{3a} および R^{3b} 、 R^{3c} および R^{3d} 、 R^{3e} および R^{3f} 、 R^{3g} および R^{3h} 、 R^{3i} および R^{3j} 、ならびに R^{3k} および R^{3l} より選択される1対もしくは複数対の置換基は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、(a) -3~7員飽和もしくは不飽和炭素環、(b) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~7員飽和もしくは不飽和複素環、(c) エキソ炭素-炭素二重結合、(d) カルボニル基、または(e) チオカルボニル基を形成し；

ここで(a)~(b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、異なる炭素原子上の R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 、 R^{3d} 、 R^{3e} 、 R^{3f} 、 R^{3g} 、 R^{3h} 、 R^{3i} 、 R^{3j} 、 R^{3k} および R^{3l} より選択される2個の置換基は、それらが結合している介在原子と一緒にあって、(a) -3~7員飽和もしくは不飽和炭素環、または(b) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~7員飽和もしくは不飽和複素環を形成し；

ここで(a)~(b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、2個の隣接する炭素原子上の R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 、 R^{3d} 、 R^{3e} 、 R^{3f} 、 R^{3g} 、 R^{3h} 、 R^{3i} 、 R^{3j} 、 R^{3k} および R^{3l} より選択される2個の置換基は、隣接する該炭素原子間の結合と一緒にあって、置換もしくは非置換炭素-炭素二重結合を形成し、あるいは、2個の隣接する炭素原子上の R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 、 R^{3d} 、 R^{3e} 、 R^{3f} 、 R^{3g} 、 R^{3h} 、 R^{3i} 、 R^{3j} 、 R^{3k} および R^{3l} より選択される4個の置換基は、隣接する該炭素原子間の結合と一緒にあって、炭素-炭素三重結合を形成し；

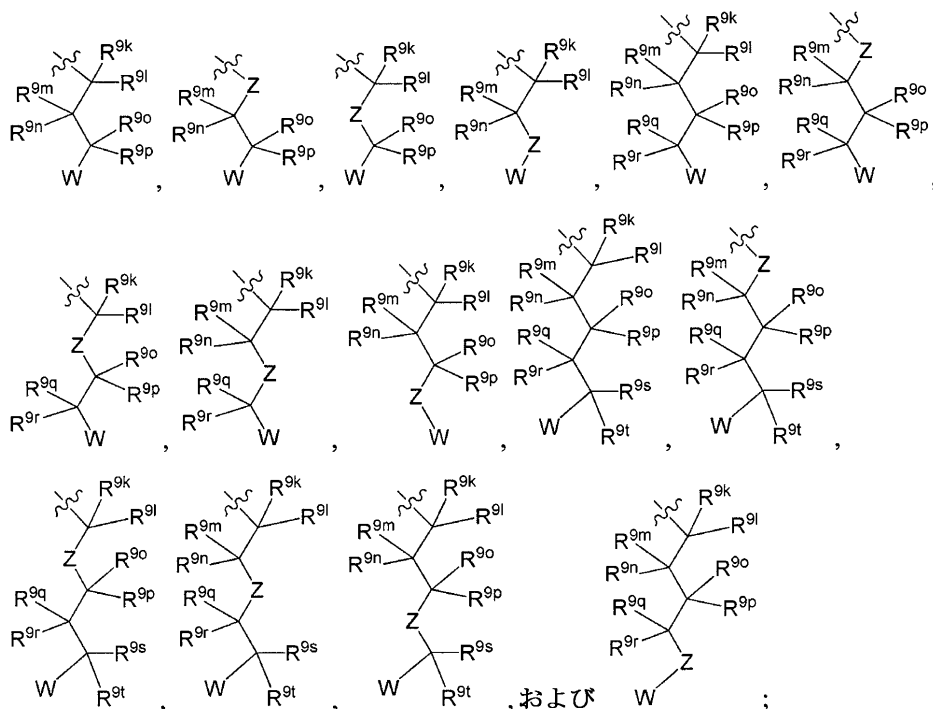
Uは、 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-NR^{11}-$ 、 $-(C=O)-$ 、 $-NR^{11}(C=O)-$ 、 $-(C=O)NR^{11}-$ 、 $-S(O)_pNR^{11}-$ 、 $-NR^{11}S(O)_p-$ 、 $-NR^{11}S(O)_pNR^{11}-$ および $-NR^{11}C(O)NR^{11}-$ より選択され；

Tは、 $-NR^{11}R^{11}$ 、 $-NR^{11}(C=O)OR^{11}$ 、 $-NR^{11}(C=NR^{11})NR^{11}R^{11}$ および OR^{11} より選択され；

あるいは、1個の R^{11} 、ならびに R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 、 R^{3d} 、 R^{3e} 、 R^{3f} 、 R^{3g} 、 R^{3h} 、 R^{3i} 、 R^{3j} 、 R^{3k} および R^{3l} より選択される1個の置換基は、それらが結合している介在原子と一緒にあって、(a) -3~7員飽和もしくは不飽和炭素環、または(b) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~7員飽和もしくは不飽和複素環を形成し；

ここで(a)~(b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

R^9 は以下より選択され：



式中、 R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} は、それぞれ独立して (a) 水素、(b) ハロゲン、(c) $-CN$ 、(d) $-N_3$ 、(e) $-NO_2$ 、(f) $-OCF_3$ 、(g) $-OCH_3$ 、(h) $-OCF_2H$ 、(i) $-OCFH_2$ 、(j) $-OR^{11}$ 、(k) $-NH_2$ 、(l) $-NR^{11}R^{11}$ 、(m) $-C(O)R^{11}$ 、(n) $-C(O)OR^{11}$ 、(o) $-C(O)NR^{11}R^{11}$ 、(p) $-NR^{11}C(O)R^{11}$ 、(q) $-S(O)_pR^{11}$ 、(r) $-C_1 \sim C_8$ アルキル、(s) $-C_2 \sim C_8$ アルケニル、(t) $-C_1 \sim C_8$ アルキニル、(u) ハロアルキル、(v) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環、ならびに(w) $-3 \sim 14$ 員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環より選択され；

ここで(r)~(w)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、 R^{9k} および R^{9l} 、 R^{9m} および R^{9n} 、 R^{9o} および R^{9p} 、 R^{9q} および R^{9r} 、ならびに R^{9s} および R^{9t} より選択される1対もしくは複数対の置換基は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、(a) 3~7員飽和もしくは不飽和炭素環、(b) 窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~7員飽和もしくは不飽和複素環、(c) エキソ炭素-炭素二重結合、(d) カルボニル基、または(e) チオカルボニル基を形成し；

ここで(a)~(c)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、異なる炭素原子上の R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択される2個の置換基は、それらが結合している介在原子と一緒にあって、(a) $-3 \sim 7$ 員飽和もしくは不飽和炭素環、または(b) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~7員飽和もしくは不飽和複素環を形成し；

ここで(a)~(b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、2個の隣接する炭素原子上の R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択される2個の置換基は、隣接する該炭素原子間の結合と一緒にあって、置換もしくは非置換炭素-炭素二重結合を形成し、あるいは、2個の隣接する炭素原子上の R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択される4個の置換基は、隣接する該炭素原子間の結合と一緒にあって、炭素-炭素三重結合を形成し；

Z は、 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-NR^{11}-$ 、 $-(C=O)-$ 、 $-NR^{11}(C=O)-$ 、 $-(C=O)NR^{11}-$ 、 $-S(O)_pNR^{11}-$ 、 $-NR^{11}S(O)_p-$ 、 $-NR^{11}S(O)_pNR^{11}-$ および $-NR^{11}C(O)NR^{11}-$ より選択され；

W は、 $-NR^{11}R^{11}$ 、 $-NR^{11}(CO)OR^{11}$ 、 $-NR^{11}(C=NR^{11})NR^{11}R^{11}$ および $-OR^{11}$ より選択され；

あるいは、1個の R^{11} 、ならびに R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択され；

^{9t}より選択される1個の置換基は、それらが結合している介在原子と一緒にあって、(a) - 3~7員飽和もしくは不飽和炭素環、または(b) - 窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~7員飽和もしくは不飽和複素環を形成し；

ここで(a)~(b)はそれぞれ1個もしくは複数個のR¹²で置換されていてもよく；

R¹²は、独立して(a) 水素、(b) ハロゲン、(c) -OH、(d) -SH、(e) -(C₁~C₈アルキル)OH、(f) -OCF₃、(g) -OCH₃、(h) -OCF₂H、(i) -OCFH₂、(j) -O(C₁~C₈アルキル)、(k) -CN、(l) -NO₂、(m) -CONH₂、(n) C(O)NH(C₁~C₈アルキル)、(o) C(O)N(C₁~C₈アルキル)₂、(p) -COH、(q) -COCH₃、(r) -S(O)_pCH₃、(s) -S(O)_pN(C₁~C₈アルキル)₂、(t) -S(C₁~C₈アルキル)、(u) -C(O)OH、(v) -C(O)O(C₁~C₈アルキル)、(w) -N₃、(x) -NHC(O)(C₁~C₈アルキル)、(y) -N(C₁~C₈アルキル)C(O)(C₁~C₈アルキル)、(z) -NH₂、(aa) -NH(C₁~C₈アルキル)、(bb) -N(C₁~C₈アルキル)₂、(cc) -C₁~C₈アルキル、(dd) -C₂~C₈アルケニル、(ee) -C₂~C₈アルキニル、(ff) -ハロアルキル、(gg) -(C₁~C₈アルキル)-(窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環)、(hh) -(C₁~C₈アルキル)-(3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環)、(ii) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環、(jj) -3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環、(kk) -(C=NH)NH₂、(ll) -C(=NH)NH₂、(mm) -C(O)R¹³、(nn) =O、ならびに(oo) =NR¹³より選択され；

ここで(aa)~(jj)はそれぞれ1個もしくは複数個のR¹³で置換されていてもよく；

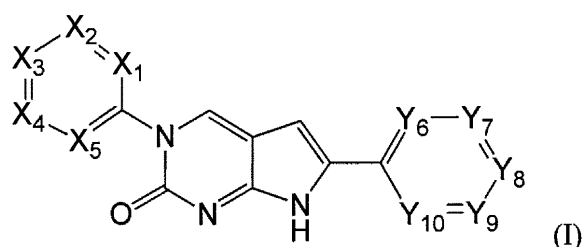
R¹³は独立して(a) 水素、(b) ハロゲン、(c) -C₁~C₈アルキル、(d) -C₂~C₈アルケニル、(e) -C₂~C₈アルキニル、(f) -ハロアルキル、(g) -OH、(h) -OC₁~C₈アルキル、(i) -OC₂~C₈アルケニル、(j) -OC₂~C₈アルキニル、(k) -OCF₃、(l) -OCH₃、(m) -OCF₂H、(n) -OCFH₂、(o) -NH₂、(p) -CN、(q) -N₃、(r) -S(O)_pC₁~C₈アルキル、(s) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環、ならびに(t) -3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環より選択され；

pは0、1または2であり；かつ

tは0、1または2である。

[本発明1002]

下記式を有する、本発明1001の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ：



式中、

X₁はCR¹またはNであり；X₂はCR²またはNであり；X₃はCR³またはNであり；X₄はCR⁴またはNであり；X₅はCR⁵またはNであるが；但し、X₁、X₂、X₃、X₄およびX₅がすべてNであることはなく；

Y₆はCR⁶またはNであり；Y₇はCR⁷またはNであり；Y₈はCR⁸またはNであり；Y₉はCR⁹またはNであり；Y₁₀はCR¹⁰またはNであるが；但し、Y₆、Y₇、Y₈、Y₉およびY₁₀がすべてNであることはなく；

ここで、R¹、R²、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸およびR¹⁰は、それぞれ独立して(a) 水素、(b) F、(c) Cl、(d) Br、(e) I、(f) -CF₃、(g) -CF₂H、(h) -CFH₂、(i) -OCF₃、(j) -OCF₂H、(k) -OCFH₂、(l) -OCH₃、(m) -CN、(n) -N₃、(o) -NO₂、(p) -NR¹¹R¹¹、(q) -NR¹¹(CO)R¹

1 、(r) $-(\text{CO})\text{NR}^{11}\text{R}^{11}$ 、(s) $-\text{OR}^{11}$ 、(t) $-\text{COH}$ 、(u) $-\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル})$ 、(v) $-\text{COR}^{11}$ 、(w) $-\text{NR}^{11}(\text{CNR}^{11})\text{NR}^{11}\text{R}^{11}$ 、(x) $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^{11}$ 、(y) $-\text{NR}^{11}\text{S}(\text{O})_p\text{R}^{11}$ 、(z) $-\text{SR}^{11}$ 、(aa) $-\text{SCF}_3$ 、(bb) $-\text{C}(\text{CF}_3)_3\text{H}-\text{NH}-\text{CHR}^{11}\text{R}^{11}$ 、(cc) $-\text{COOR}^{11}$ 、(dd) $-(\text{OCH}_2\text{CH}_2)_t\text{R}^{11}$ 、(ee) $-(\text{OCH}_2\text{CH}_2)_t\text{OR}^{11}$ 、(ff) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル}$ 、(gg) $-\text{C}_2 \sim \text{C}_8 \text{アルケニル}$ 、(hh) $-\text{C}_2 \sim \text{C}_8 \text{アルキニル}$ 、(ii) $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル})-(\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環})$ 、(jj) $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル})-(3 \sim 14 \text{員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環})$ 、(kk) $-\text{ハロアルキル}$ 、(ll) $-\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環}$ 、(mm) $-3 \sim 14 \text{員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環}$ 、ならびに(nn) $-\text{CHR}^{11}-\text{NH}-(\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環})$ より選択され；

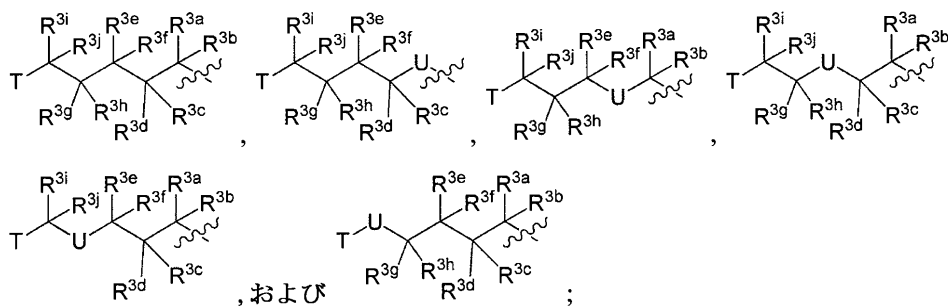
ここで(ff) ~ (nn)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

各 R^{11} は、独立して(a) 水素、(b) ハロゲン、(c) $-\text{CF}_3$ 、(d) $-\text{CF}_2\text{H}$ 、(e) $-\text{CFH}_2$ 、(f) $-\text{OH}$ 、(g) $-\text{SH}$ 、(h) $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル})\text{OH}$ 、(i) $-\text{OCF}_3$ 、(j) $-\text{OCF}_2\text{H}$ 、(k) $-\text{OCFH}_2$ 、(l) $-\text{OCH}_3$ 、(m) $-\text{OR}^{12}$ 、(n) $-\text{COR}^{12}$ 、(o) $-\text{CN}$ 、(p) $-\text{NO}_2$ 、(q) $-\text{CONH}_2$ 、(r) $-\text{CONR}^{12}\text{R}^{12}$ 、(s) $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ 、(t) $-\text{S}(\text{O})_p\text{CH}_3$ 、(u) $-\text{S}(\text{O})_p\text{NR}^{12}\text{R}^{12}$ 、(v) $-\text{SR}^{12}$ 、(w) $-\text{C}(\text{O})\text{OH}$ 、(x) $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ 、(y) $-\text{N}_3$ 、(z) $-\text{NH}_2$ 、(aa) $-\text{NR}^{12}\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$ 、(bb) $-\text{NH}(\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル})$ 、(cc) $-\text{N}(\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル})_2$ 、(dd) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル}$ 、(ee) $-\text{C}_2 \sim \text{C}_8 \text{アルケニル}$ 、(ff) $-\text{C}_2 \sim \text{C}_8 \text{アルキニル}$ 、(gg) $-\text{ハロアルキル}$ 、(hh) $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル})-(\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環})$ 、(ii) $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル})-(3 \sim 14 \text{員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環})$ 、(jj) $-\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環}$ 、(kk) $-3 \sim 14 \text{員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環}$ 、ならびに(ll) $-(\text{C}=\text{NH})\text{NR}^{12}\text{R}^{12}$ より選択され；

ここで(bb) ~ (kk)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、2個の R^{11} 置換基は一緒になって、(a) $3 \sim 7 \text{員飽和もしくは不飽和炭素環}$ 、または(b) $\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~7員飽和もしくは不飽和複素環を形成し}$ 、ここで(a) ~ (b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

R^3 は以下より選択され：



式中、 R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 、 R^{3d} 、 R^{3e} 、 R^{3f} 、 R^{3g} 、 R^{3h} 、 R^{3i} および R^{3j} は、それぞれ独立して(a) 水素、(b) ハロゲン、(c) $-\text{CH}_3$ 、(d) $-\text{CF}_3$ 、(e) $-\text{CF}_2\text{H}$ 、(f) $-\text{CFH}_2$ 、(g) $-\text{OCF}_3$ 、(h) $-\text{OCF}_2\text{H}$ 、(i) $-\text{OCFH}_2$ 、(j) $-\text{OCH}_3$ 、(k) $-\text{OR}^{11}$ 、(l) $-\text{C}_1 \sim \text{C}_8 \text{アルキル}$ 、(m) ハロアルキル 、(n) $-\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環}$ 、ならびに(o) $-3 \sim 14 \text{員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環}$ より選択され；

ここで(l) ~ (o)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、 R^{3a} および R^{3b} 、 R^{3c} および R^{3d} 、 R^{3e} および R^{3f} 、 R^{3g} および R^{3h} 、ならびに R^{3i} および R^{3j} より選択される1対もしくは複数対の置換基は、それらが結合している炭素原子と一緒に、(a) $-3 \sim 7 \text{員飽和もしくは不飽和炭素環}$ 、(b) $-\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~7員飽和もしくは}$

不飽和複素環、(c) エキソ炭素-炭素二重結合、(d) カルボニル基、または(e) チオカルボニル基を形成し；

ここで(a)～(b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、異なる炭素原子上の R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 、 R^{3d} 、 R^{3e} 、 R^{3f} 、 R^{3g} 、 R^{3h} 、 R^{3i} および R^{3j} より選択される2個の置換基は、それらが結合している介在原子と一緒にあって、(a) - 3～7員飽和もしくは不飽和炭素環、または(b) - 窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3～7員飽和もしくは不飽和複素環を形成し；

ここで(a)～(b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、2個の隣接する炭素原子上の R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 、 R^{3d} 、 R^{3e} 、 R^{3f} 、 R^{3g} 、 R^{3h} 、 R^{3i} および R^{3j} より選択される2個の置換基は、隣接する該炭素原子間の結合と一緒にあって、置換もしくは非置換炭素-炭素二重結合を形成し、あるいは、2個の隣接する炭素原子上の R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 、 R^{3d} 、 R^{3e} 、 R^{3f} 、 R^{3g} 、 R^{3h} 、 R^{3i} および R^{3j} より選択される4個の置換基は、隣接する該炭素原子間の結合と一緒にあって、炭素-炭素三重結合を形成し；

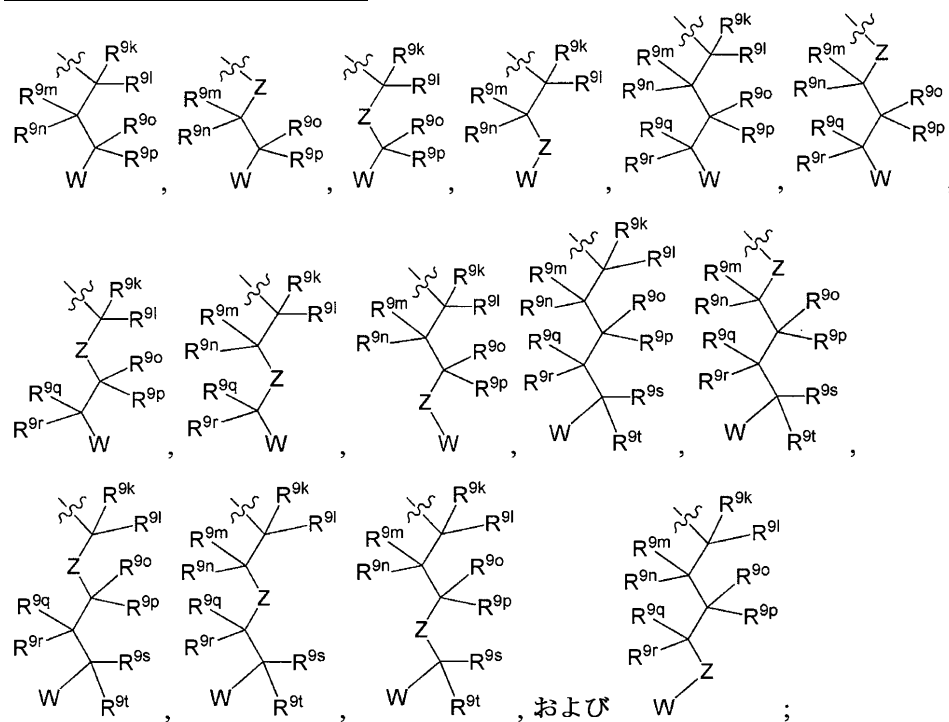
Uは、-O-、-S(O)_p-、-NR¹¹-、-(C=O)-、-NR¹¹(C=O)-、-(C=O)NR¹¹-、-S(O)_pNR¹¹-、-NR¹¹S(O)_p-および-NR¹¹S(O)_pNR¹¹-より選択され；

Tは、-NR¹¹R¹¹、-NR¹¹(C=O)OR¹¹、-NR¹¹(C=NR¹¹)NR¹¹R¹¹およびOR¹¹より選択され；

あるいは、1個の R^{11} 、ならびに R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 、 R^{3d} 、 R^{3e} 、 R^{3f} 、 R^{3g} 、 R^{3h} 、 R^{3i} および R^{3j} より選択される1個の置換基は、それらが結合している介在原子と一緒にあって、(a) - 3～7員飽和もしくは不飽和炭素環、または(b) - 窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3～7員飽和もしくは不飽和複素環を形成し；

ここで(a)～(b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

R^9 は以下より選択され：



式中、 R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} は、それぞれ独立して(a) 水素、(b) ハロゲン、(c) -CH₃、(d) -CF₃、(e) -CF₂H、(f) -CFH₂、(g) -OCF₃、(h) -OCH₃、(i) -OCF₂H、(j) -OCFH₂、(k) -OR¹¹、(l) -C₁～C₈アルキル、(m) ハロアルキル、(n) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3～14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環、ならびに(o) -3～14員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環より選択され；

ここで(l)～(o)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、 R^{9k} および R^{9l} 、 R^{9m} および R^{9n} 、 R^{9o} および R^{9p} 、 R^{9q} および R^{9r} 、ならびに R^{9s} および R^{9t} より選択される1対もしくは複数対の置換基は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、(a) -3~7員飽和もしくは不飽和炭素環、(b) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~7員飽和もしくは不飽和複素環、(c) エキソ炭素-炭素二重結合、(d) カルボニル基、および(e) チオカルボニル基を形成し；

ここで(a)~(c)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、異なる炭素原子上の R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択される2個の置換基は、それらが結合している介在原子と一緒にあって、(a) -3~7員飽和もしくは不飽和炭素環、または(b) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~7員飽和もしくは不飽和複素環を形成し；

ここで(a)~(b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

あるいは、2個の隣接する炭素原子上の R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択される2個の置換基は、隣接する該炭素原子間の結合と一緒にあって、置換もしくは非置換炭素-炭素二重結合を形成し、あるいは、2個の隣接する炭素原子上の R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択される4個の置換基は、隣接する該炭素原子間の結合と一緒にあって、炭素-炭素三重結合を形成し；

Zは、 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-NR^{11}-$ 、 $-(C=O)-$ 、 $-NR^{11}(C=O)-$ 、 $-(C=O)NR^{11}-$ 、 $-S(O)_pNR^{11}-$ 、 $-NR^{11}S(O)_p-$ および $-NR^{11}S(O)_pNR^{11}-$ より選択され；

Wは、 $-NR^{11}R^{11}$ 、 $-NR^{11}(CO)OR^{11}$ 、 $-NR^{11}(C=NR^{11})NR^{11}R^{11}$ および $-OR^{11}$ より選択され；

あるいは、1個の R^{11} 、ならびに R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択される1個の置換基は、それらが結合している介在原子と一緒にあって、(a) -3~7員飽和もしくは不飽和炭素環、または(b) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~7員飽和もしくは不飽和複素環を形成し；

ここで(a)~(b)はそれぞれ1個もしくは複数個の R^{12} で置換されていてもよく；

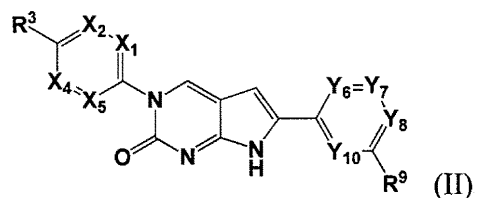
R^{12} は、独立して(a) 水素、(b) ハロゲン、(c) $-CF_3$ 、(d) $-CF_2H$ 、(e) $-CFH_2$ 、(f) $-OH$ 、(g) $-SH$ 、(h) $-(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})OH$ 、(i) $-OCF_3$ 、(j) $-OCH_3$ 、(k) $-OCF_2H$ 、(l) $-OCFH_2$ 、(m) $-O(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、(n) $-CN$ 、(o) $-NO_2$ 、(p) $-CONH_2$ 、(q) $-C(O)H$ 、(r) $-C(O)CH_3$ 、(s) $-S(O)_pCH_3$ 、(t) $-S(O)_pN(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})_2$ 、(u) $-S(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、(v) $-C(O)OH$ 、(w) $-C(O)O(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、(x) $-N_3$ 、(y) $-NHC(O)(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、(z) $-N(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})C(O)(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、(aa) $-NH_2$ 、(bb) $-NH(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、(cc) $-N(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})_2$ 、(dd) $-C_1 \sim C_8 \text{ アルキル}$ 、(ee) $-C_2 \sim C_8 \text{ アルケニル}$ 、(ff) $-C_2 \sim C_8 \text{ アルキニル}$ 、(gg) $-ハロアルキル$ 、(hh) $-(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})-(\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環})$ 、(ii) $-(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})-(3 \sim 14 \text{ 員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環})$ 、(jj) $-\text{窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3~14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環}$ 、(kk) $-3 \sim 14 \text{ 員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環}$ 、(ll) $-(C=NH)NH_2$ 、(mm) $-C(O)NH(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})$ 、(nn) $-C(O)N(C_1 \sim C_8 \text{ アルキル})_2$ 、ならびに(oo) $-C(=NH)NH_2$ より選択され；

pは0、1または2であり；かつ

tは0、1または2である。

[本発明1003]

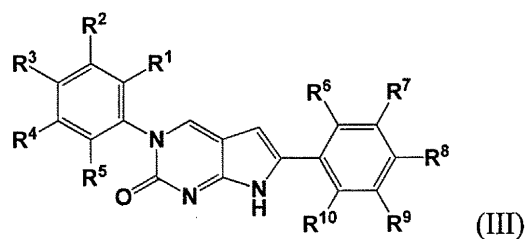
式：



を有する、本発明1002の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1004]

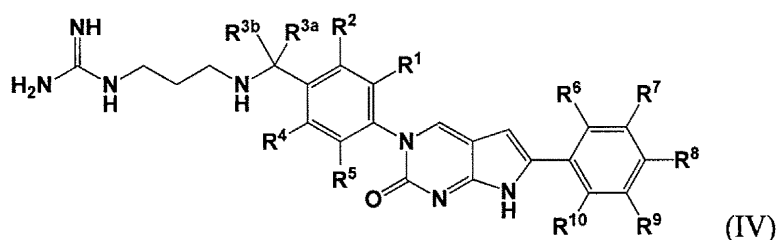
式：



を有する、本発明1003の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

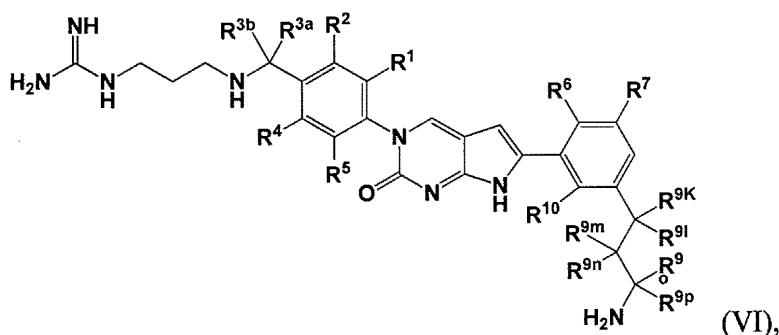
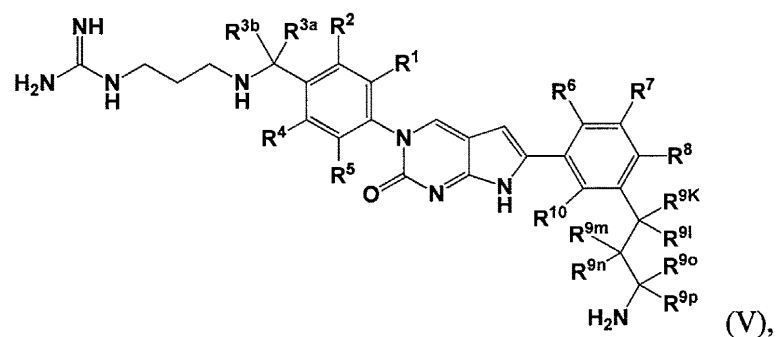
[本発明1005]

式：

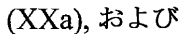


を有する、本発明1004の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1006]

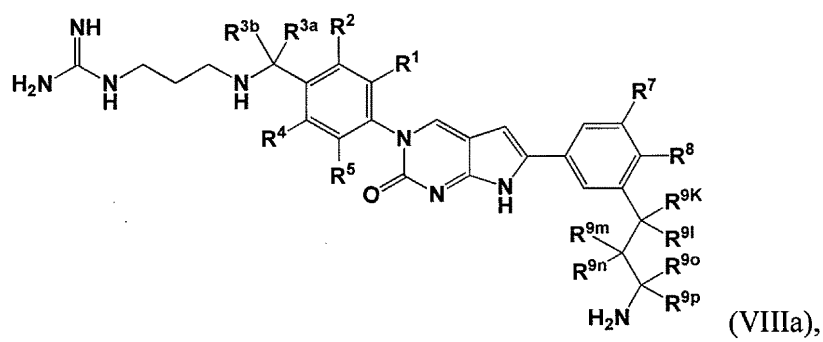
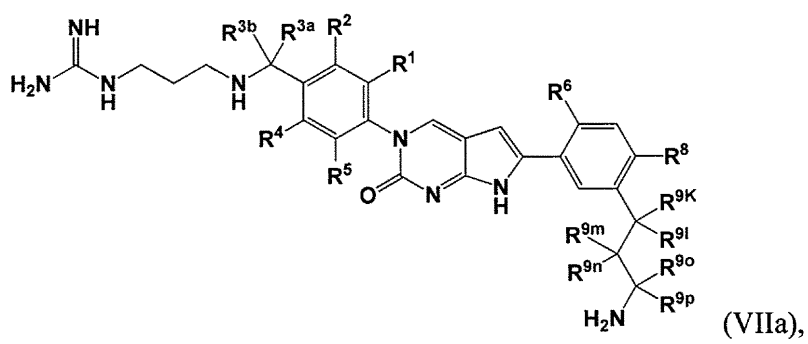
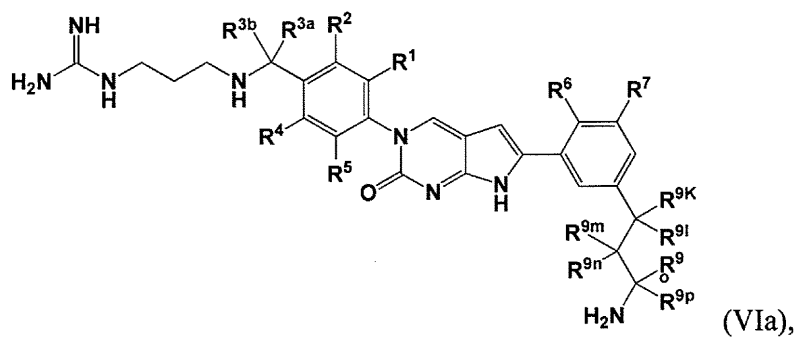


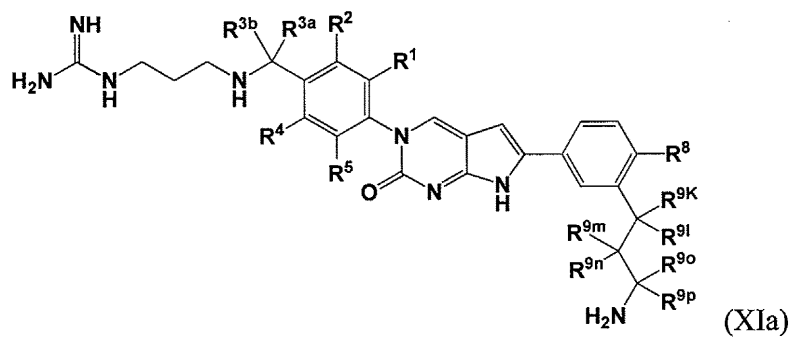
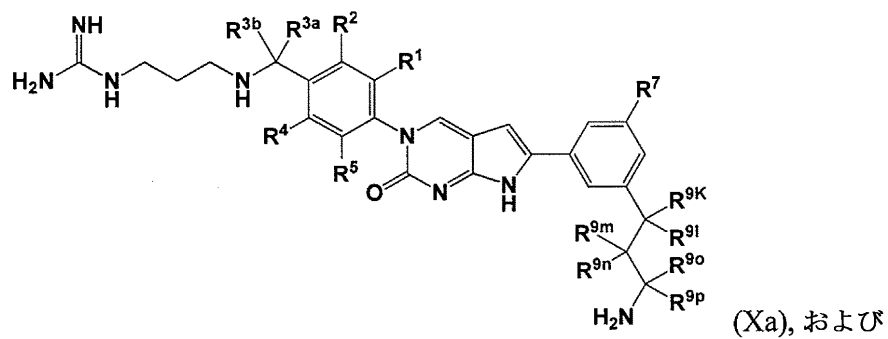
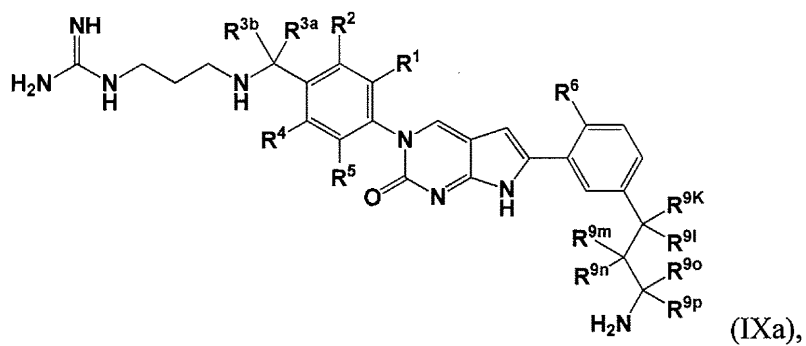




[本 発 明 1007]



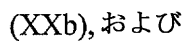


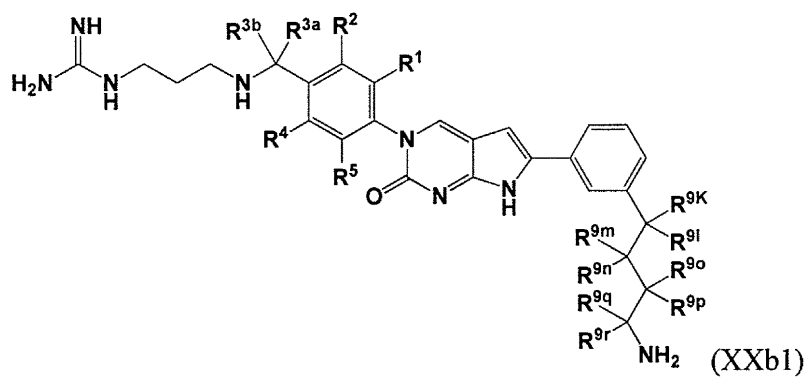


より選択される式を有する、本発明1006の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1008]

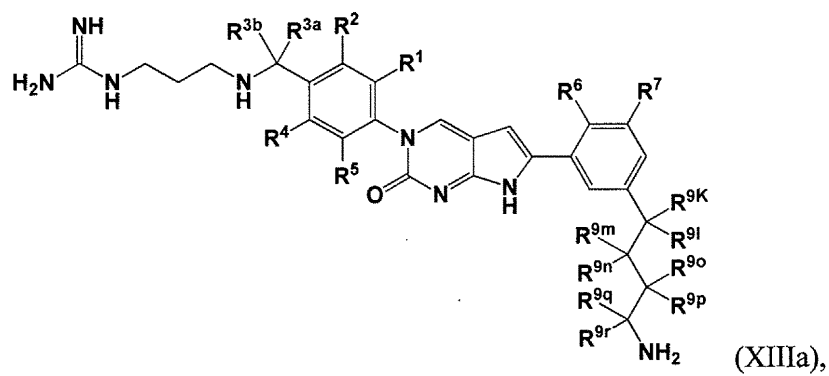
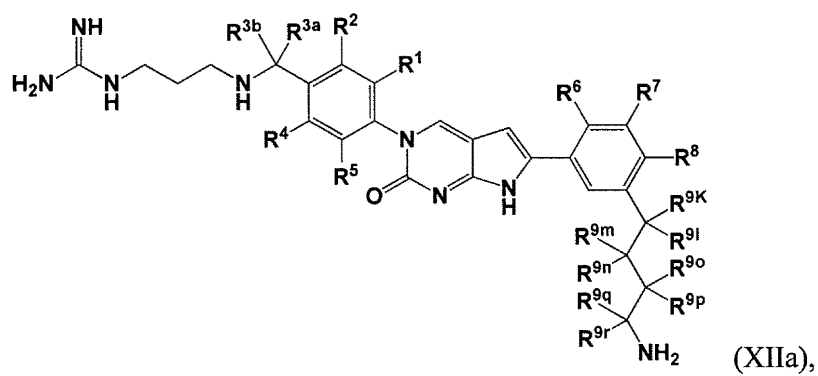






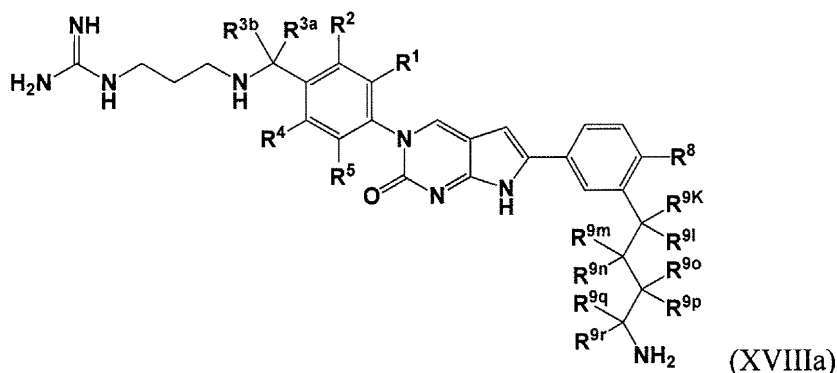
より選択される式を有する、本発明1005の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1009]





および



より選択される式を有する、本発明1008の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1010]

R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択される少なくとも1個の置換基が水素ではない、本発明1001～1009のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1011]

R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択される少なくとも2個の置換基が水素ではない、本発明1001～1009のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1012]

R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 が、それぞれ独立して水素およびFより選択される、本発明1001～1011のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1013]

R^1 、 R^2 、 R^4 および R^5 がそれぞれ水素である、本発明1012の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

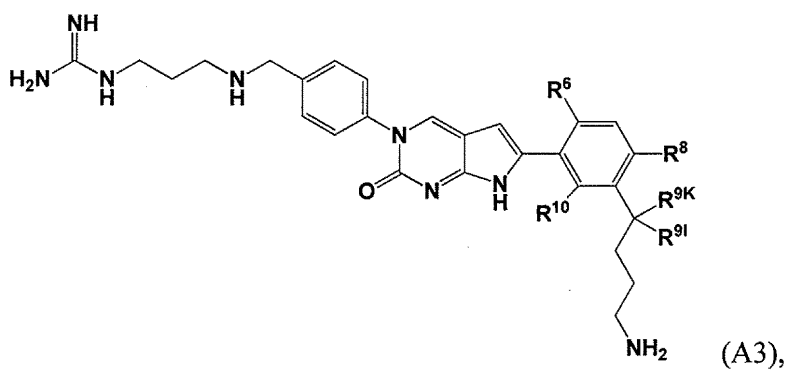
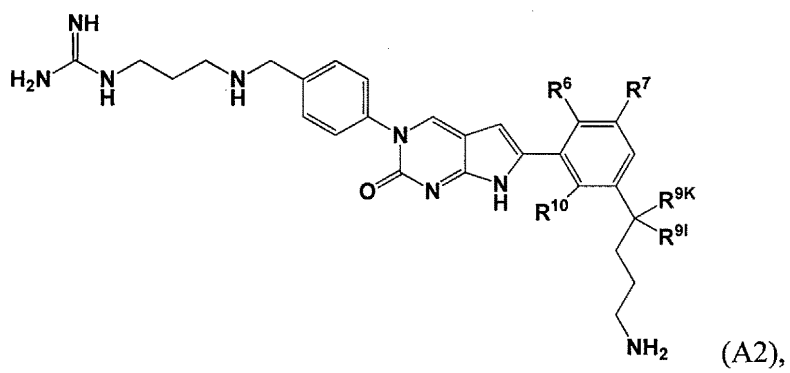
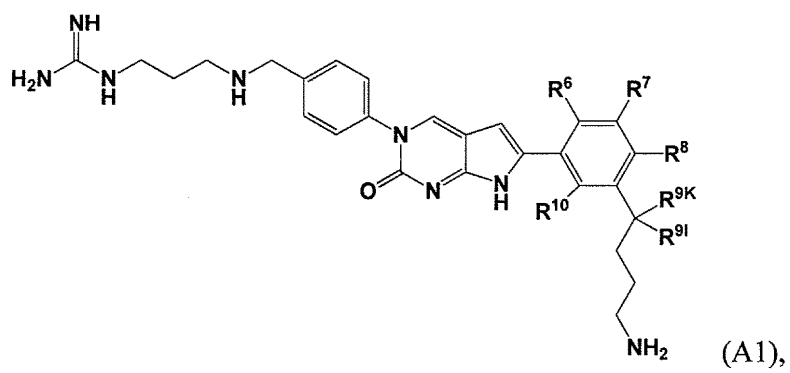
[本発明1014]

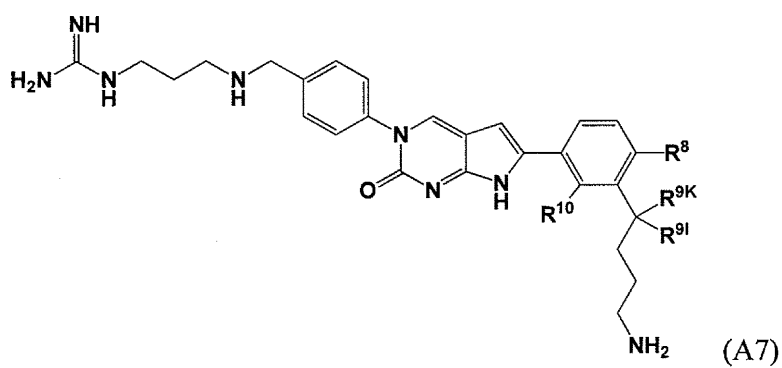
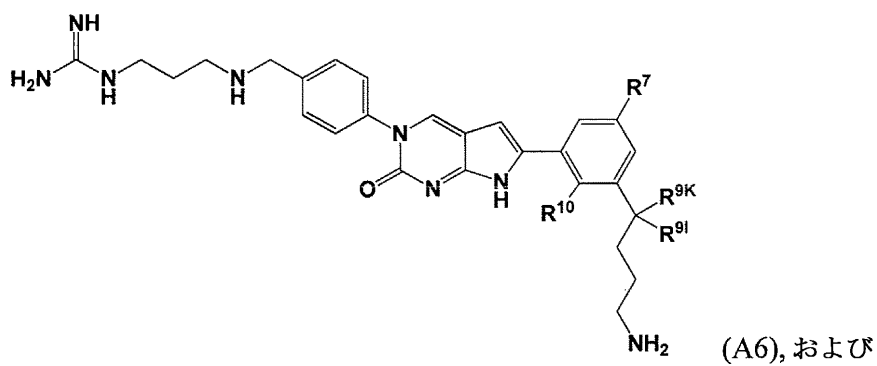
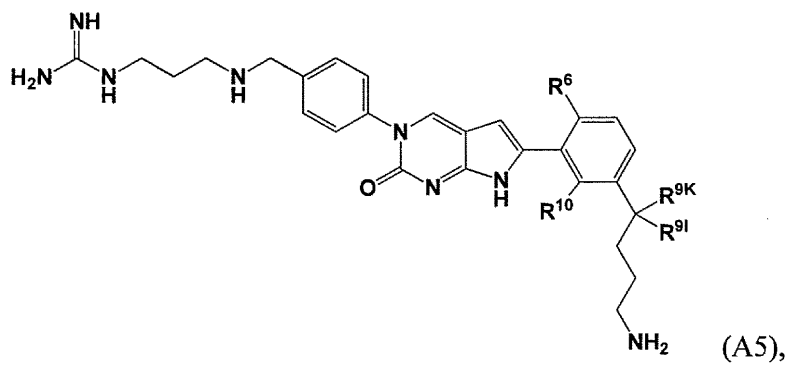
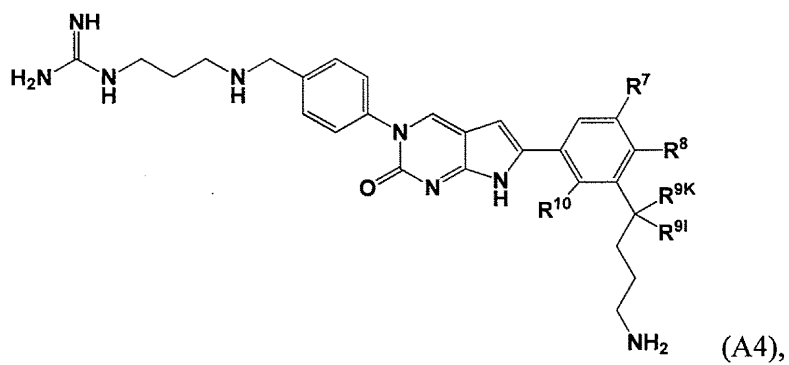
R^{3a} および R^{3b} が、それぞれ独立して(a) 水素、(b) F、(c) Cl、(d) $-CH_3$ 、(e) $-CF_3$ 、(f) $-CF_2H$ 、(g) $-CFH_2$ 、(h) $-OCF_3$ 、(i) $-OCF_2H$ 、(j) $-OCFH_2$ 、(k) $-OCH_3$ および(l) $-OH$ より選択される、本発明1001～1013のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1015]

R^{3a} および R^{3b} がそれぞれ水素である、本発明1014の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1016]

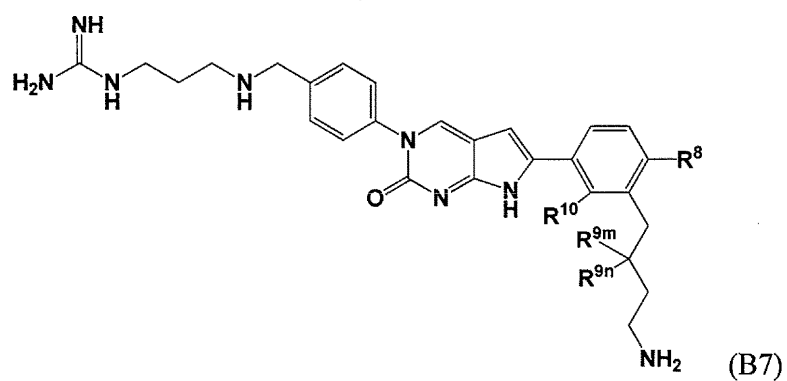
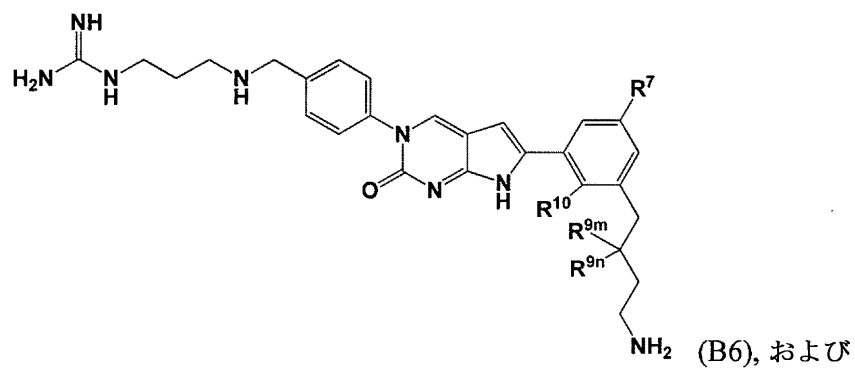




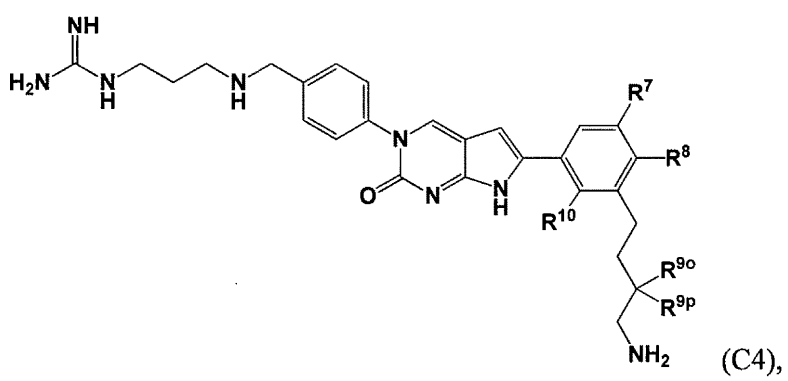
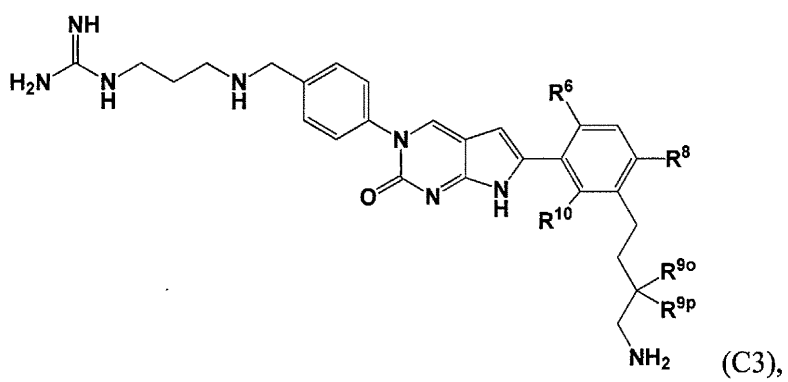
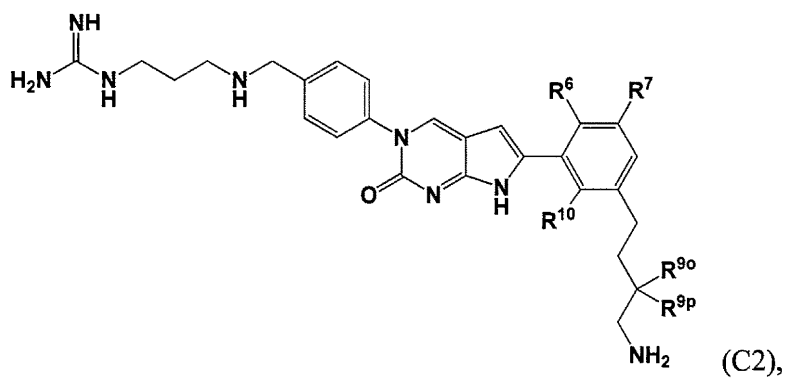
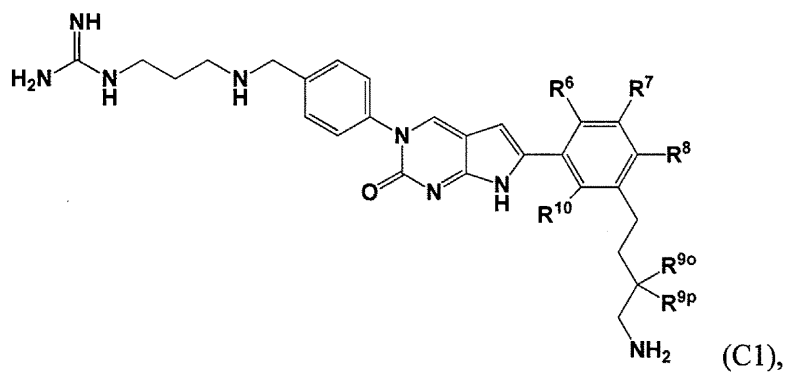
より選択される式を有する、本発明1008の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

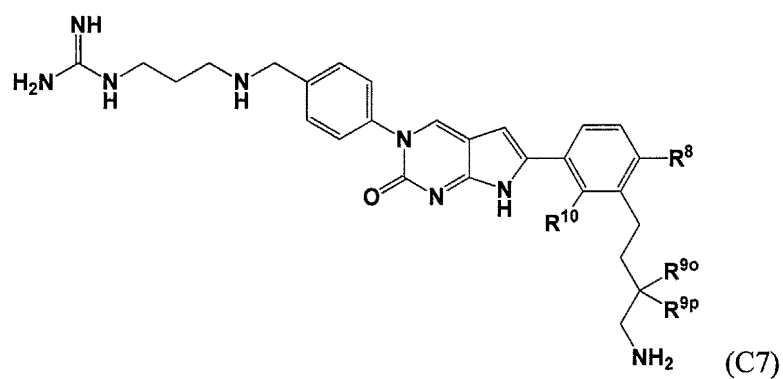
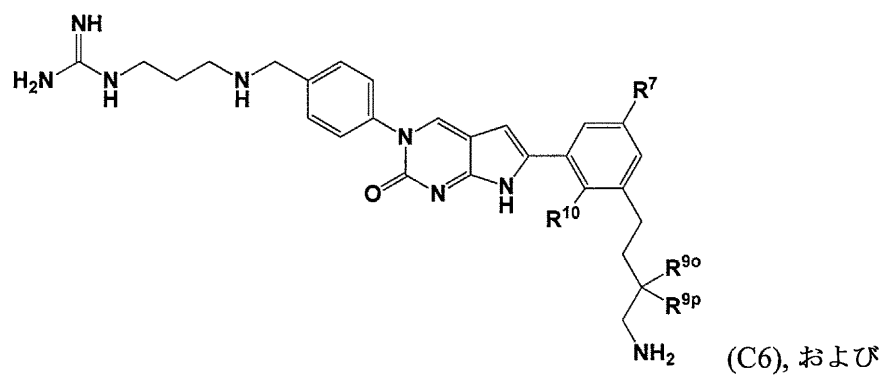
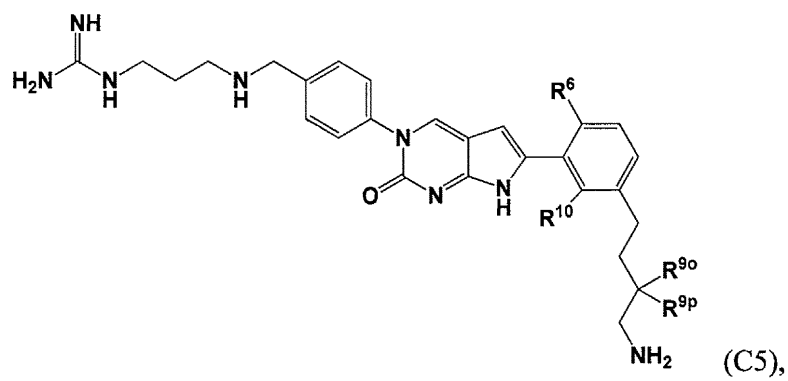
[本発明1017]





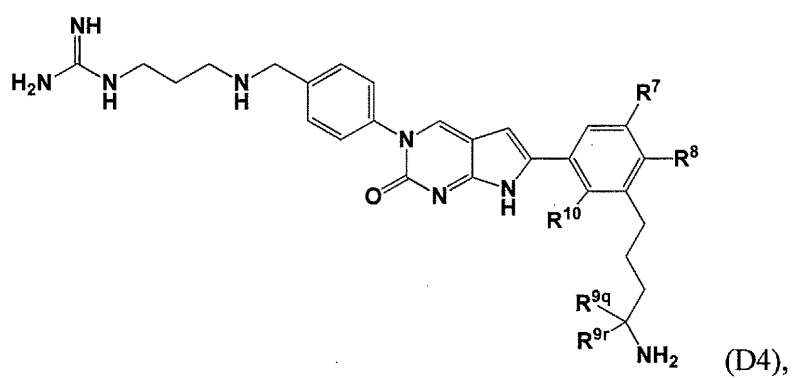
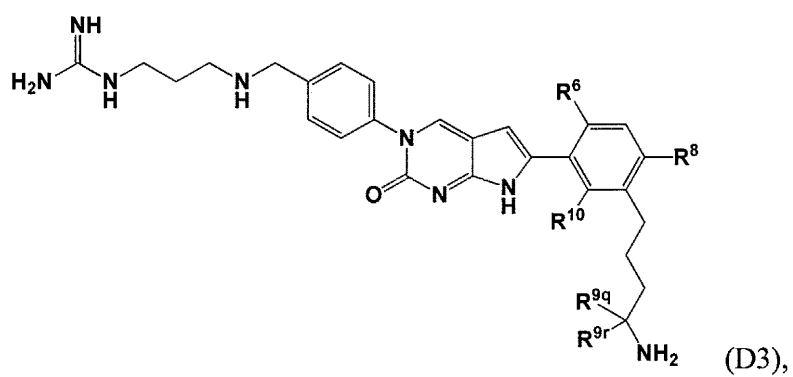
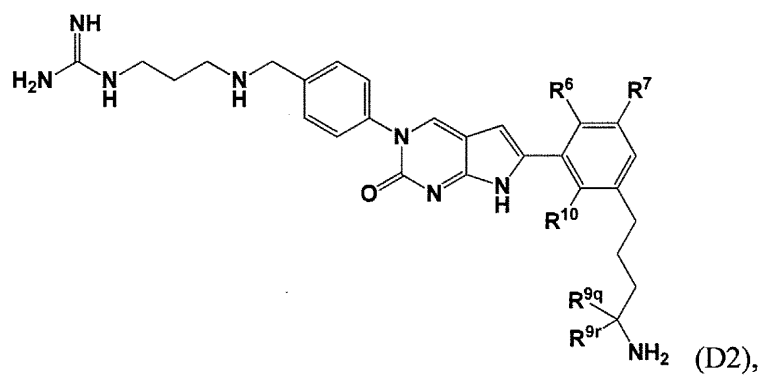
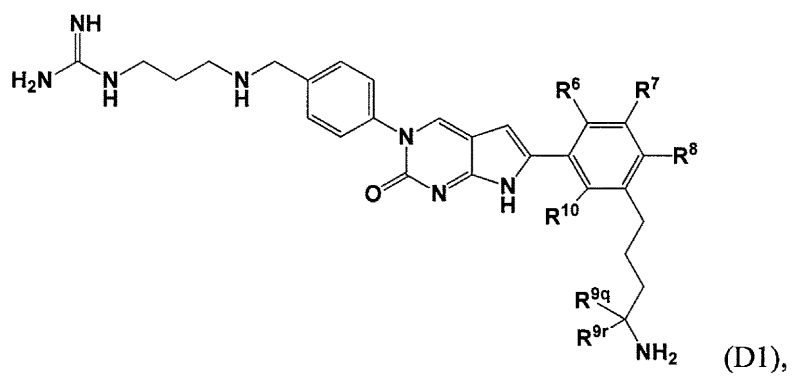
[本 発 明 1018]

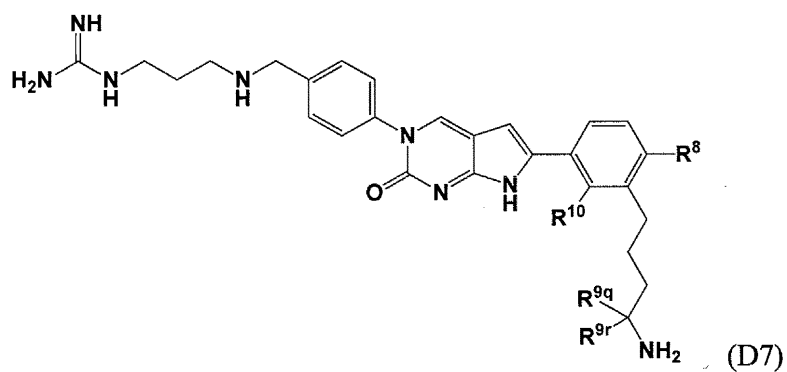
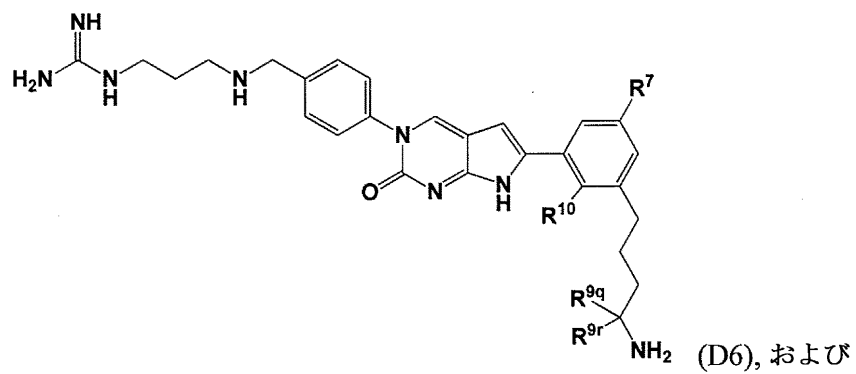




より選択される式を有する、本発明1008の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

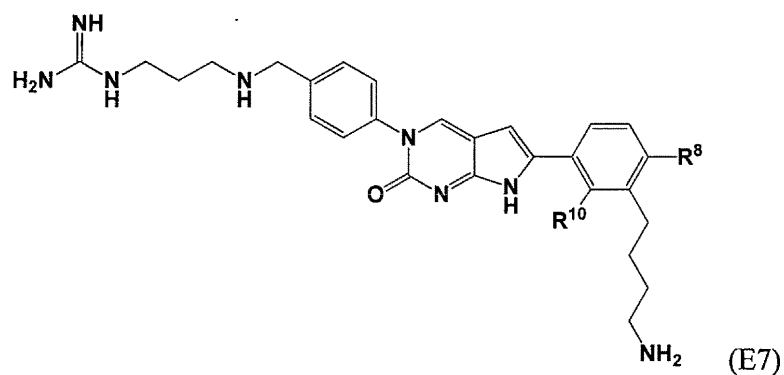
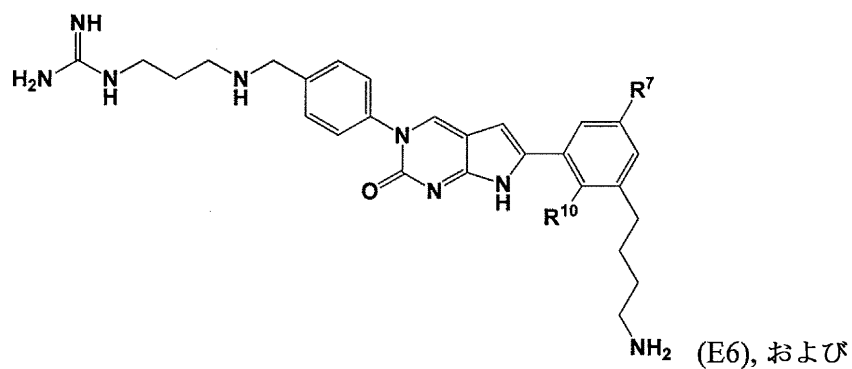
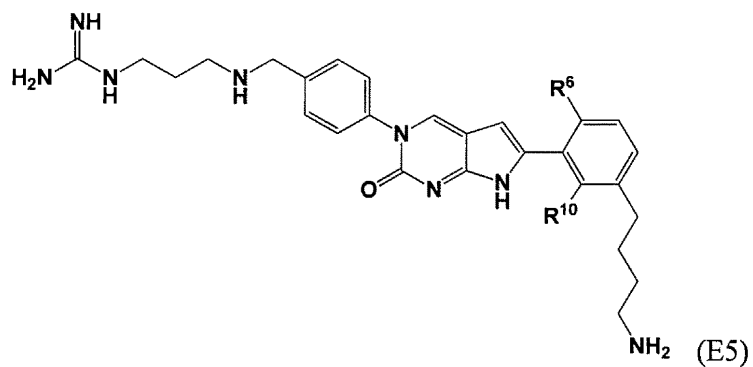
[本発明1019]





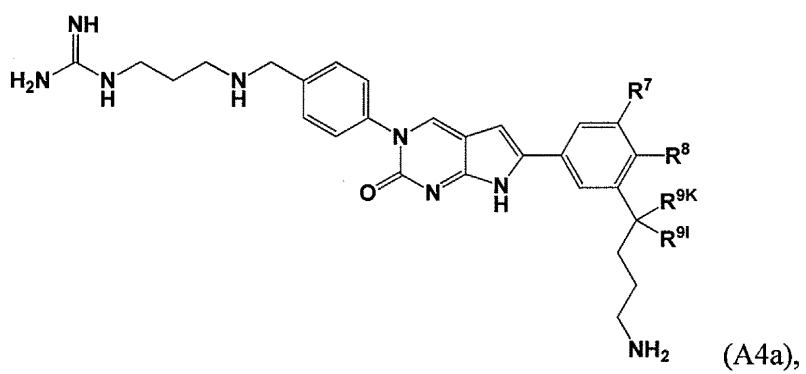
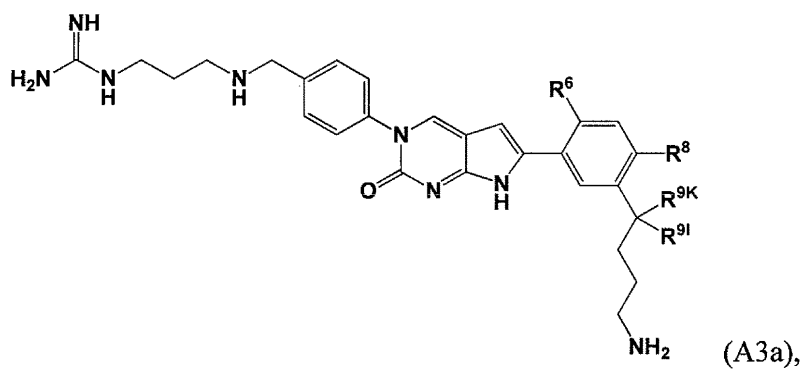
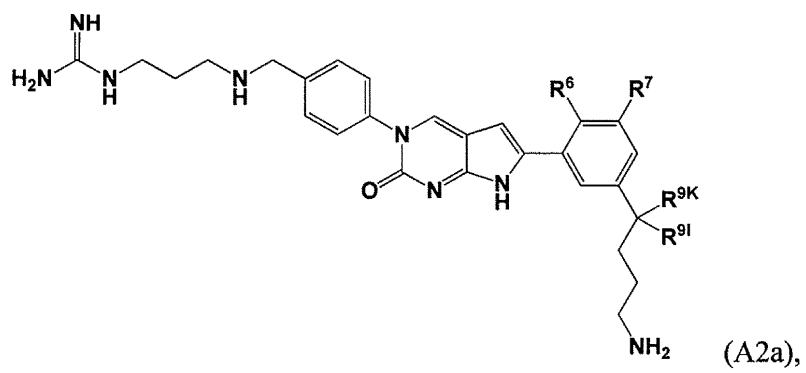
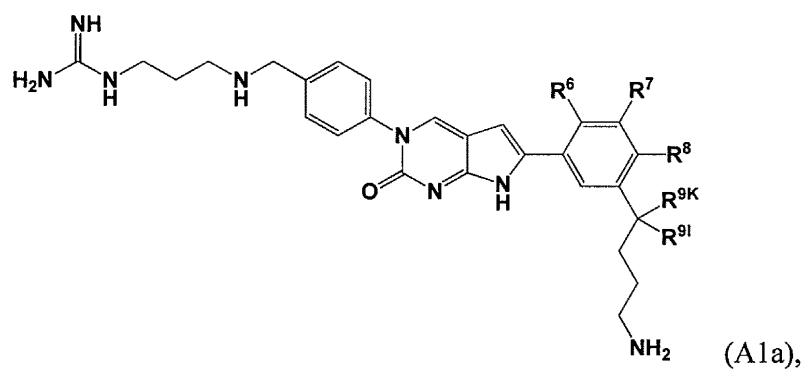
[本 発 明 1020]

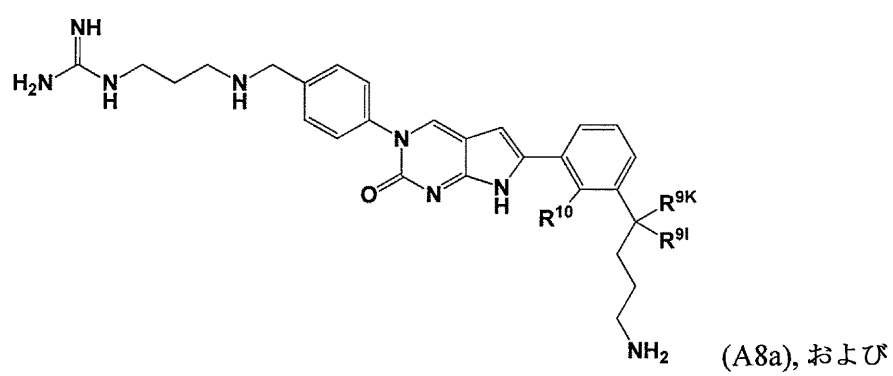
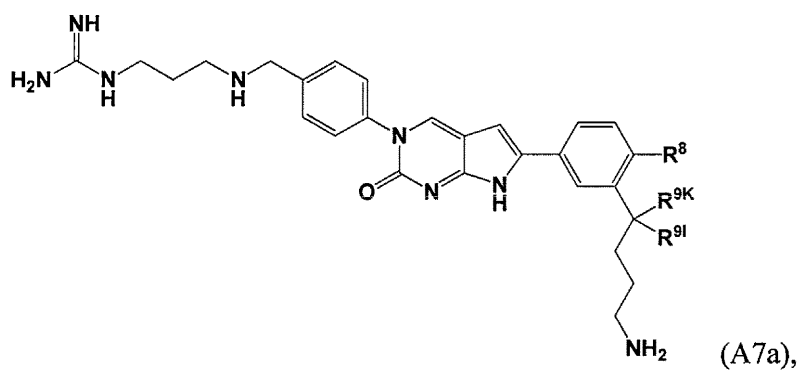
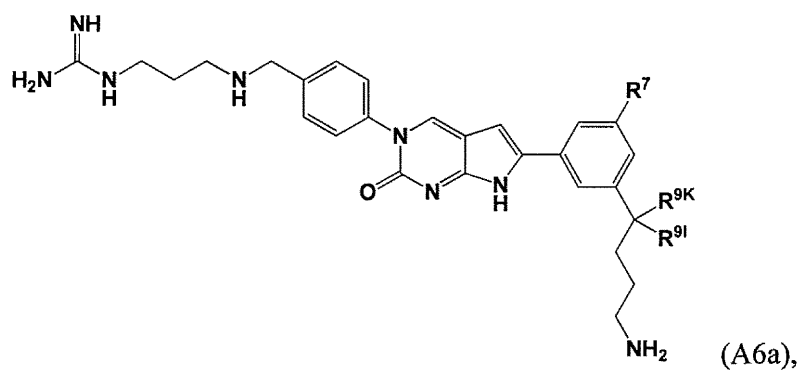
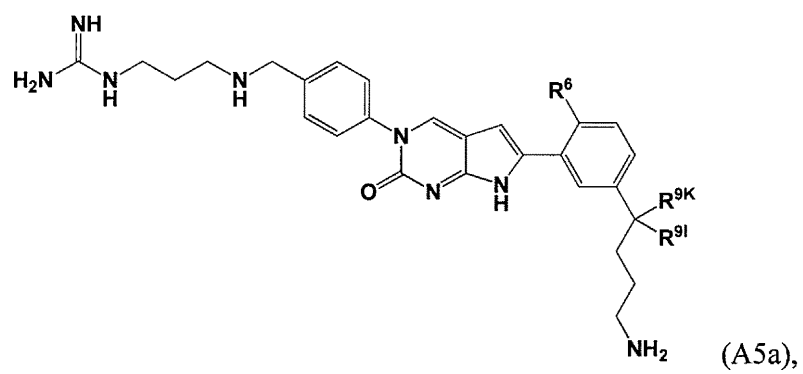


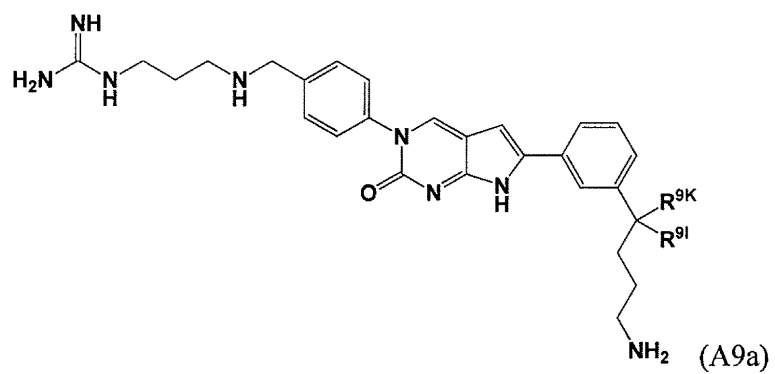


より選択される式を有する、本発明1008の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1021]

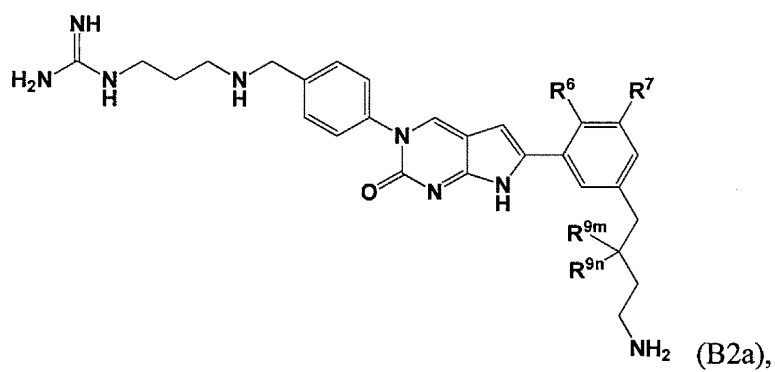
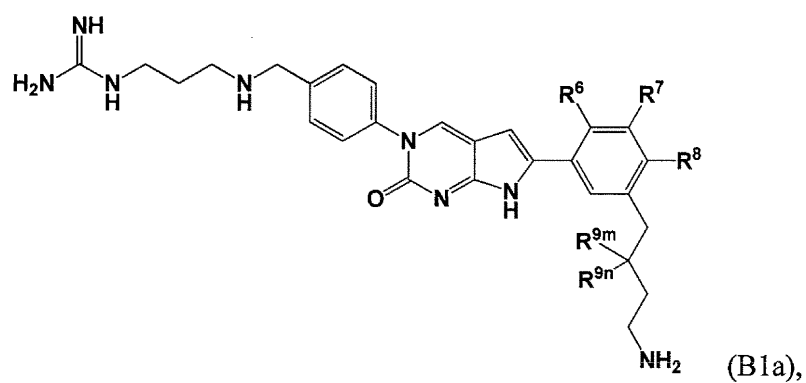


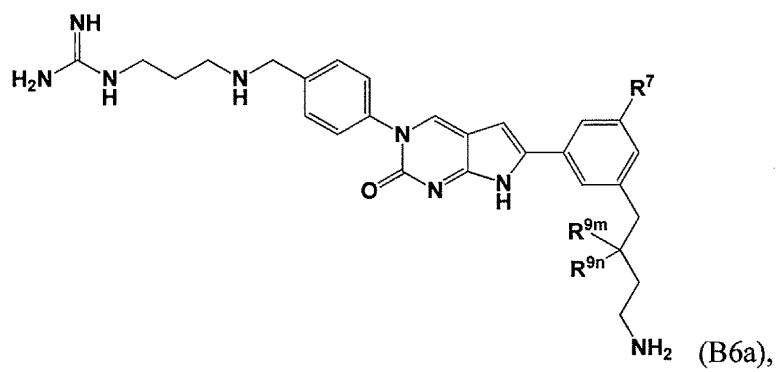
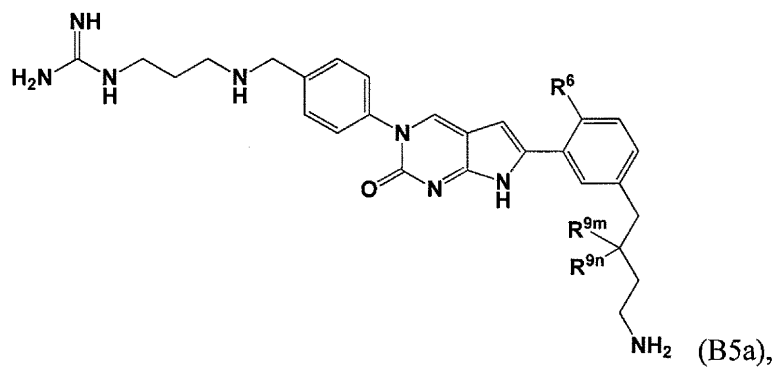
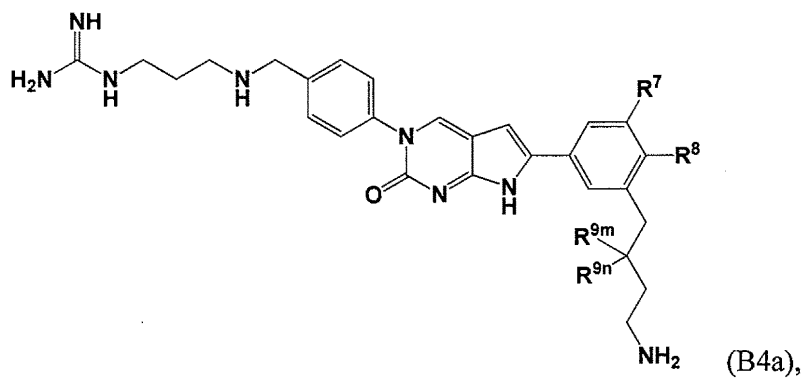
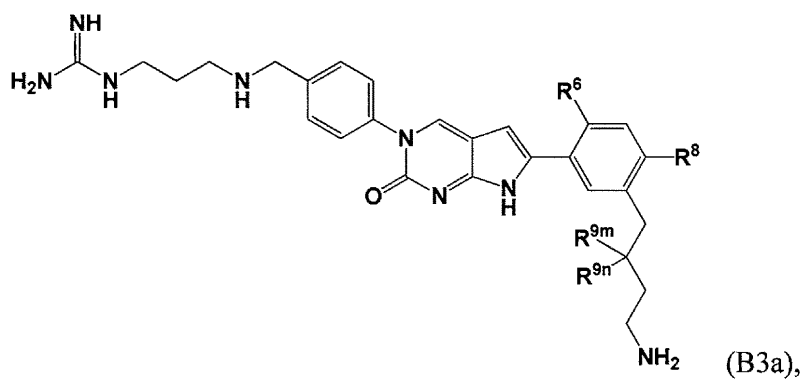


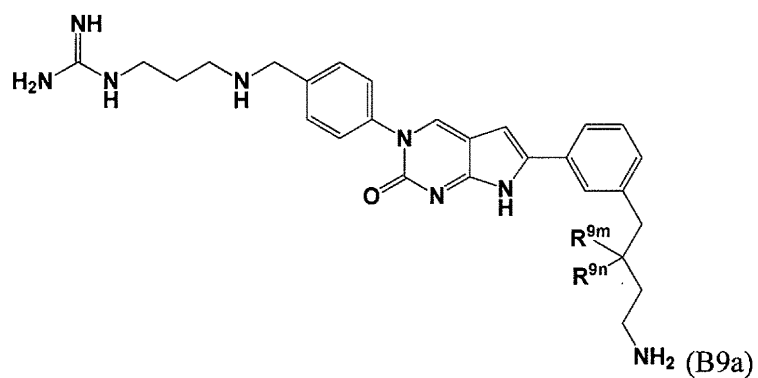
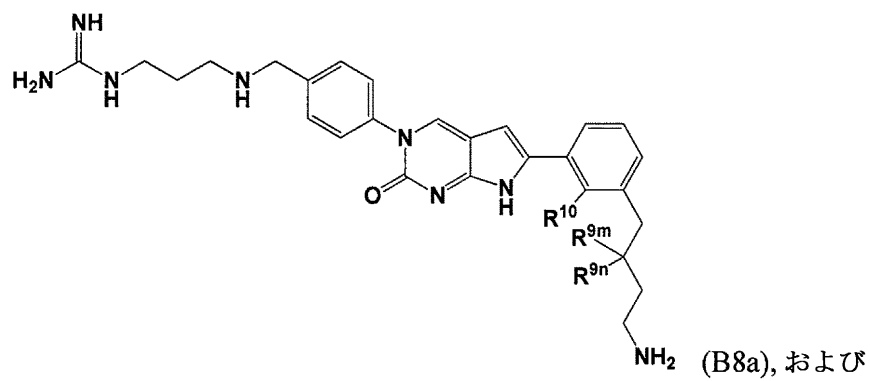
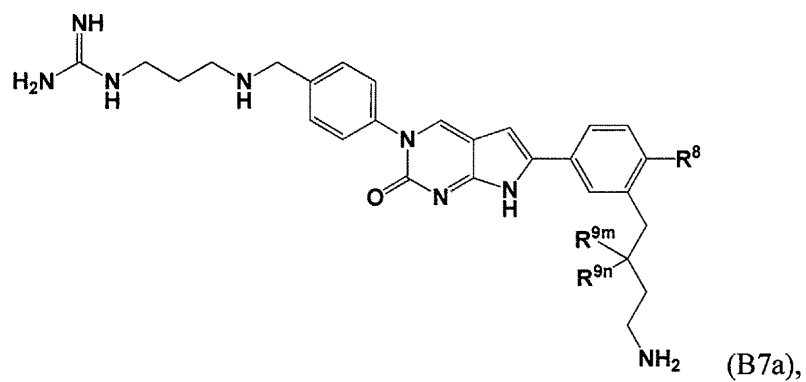


より選択される式を有する、本発明1016の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1022]



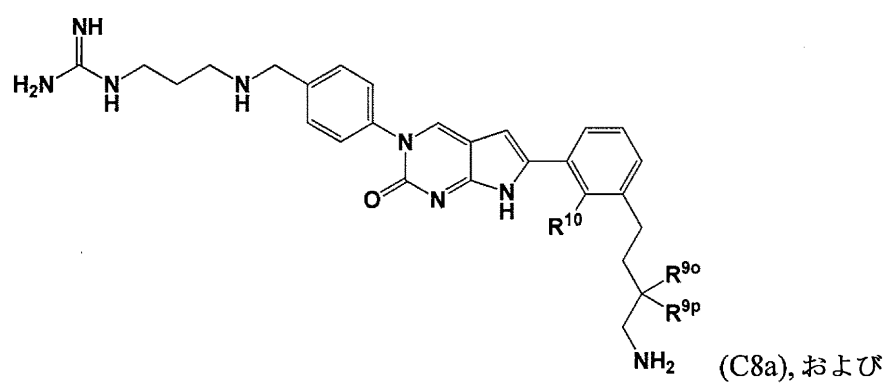
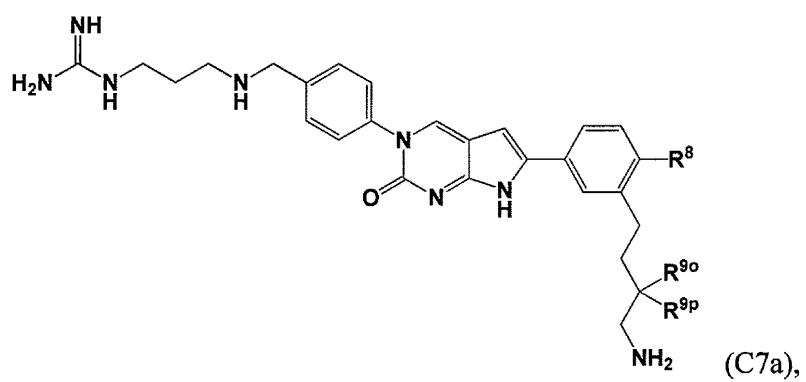
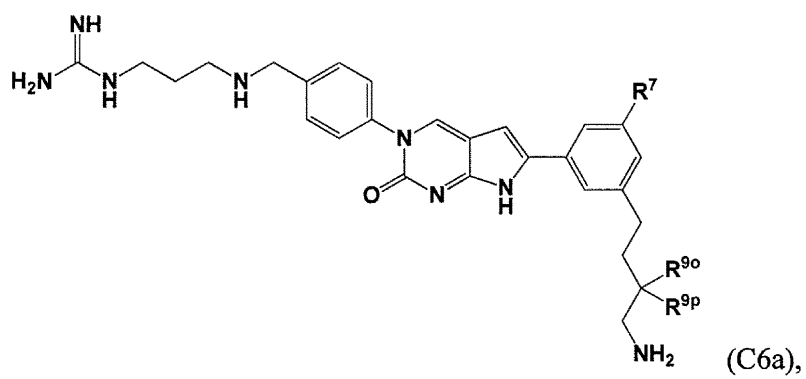
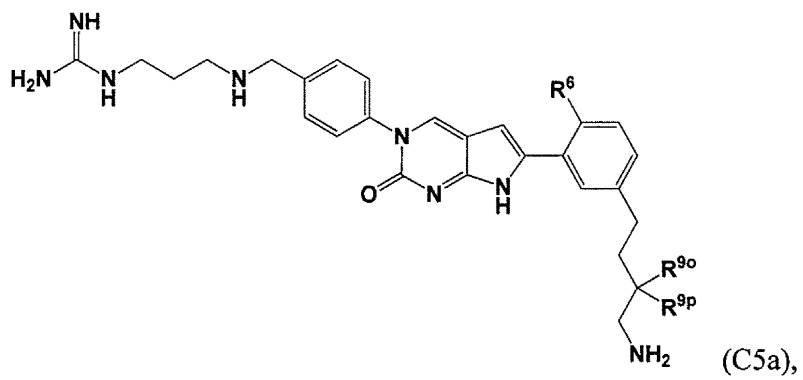


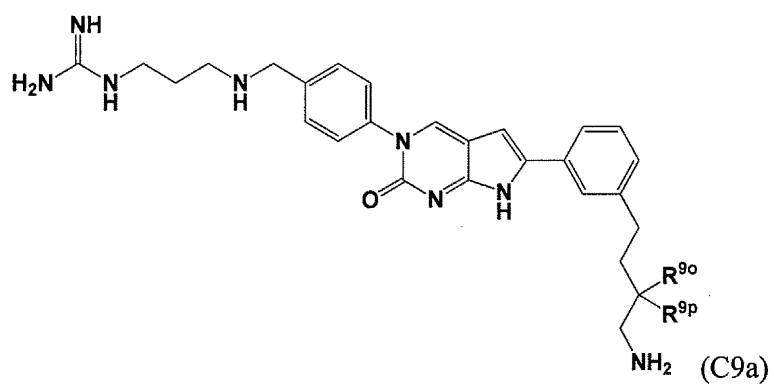


より選択される式を有する、本発明1017の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1023]

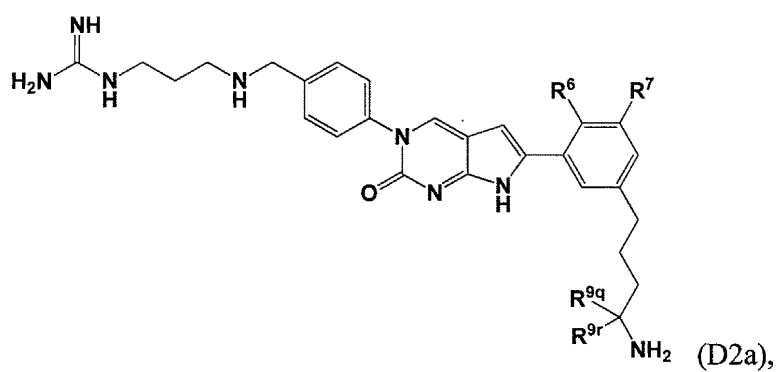
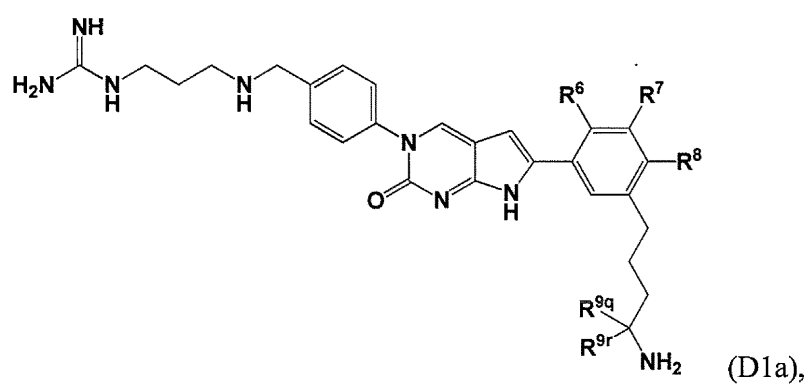




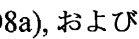


より選択される式を有する、本発明1018の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

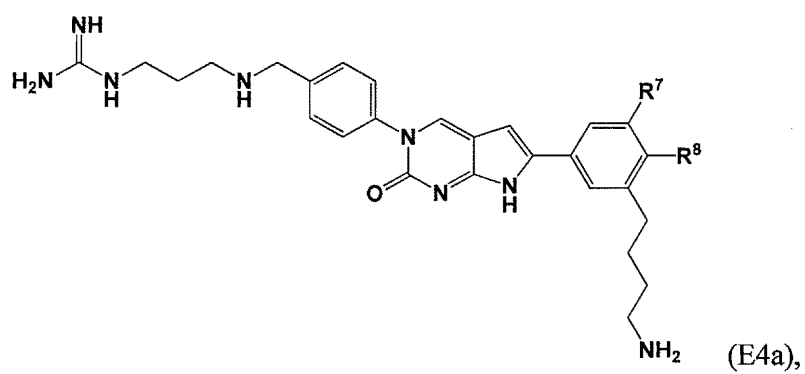
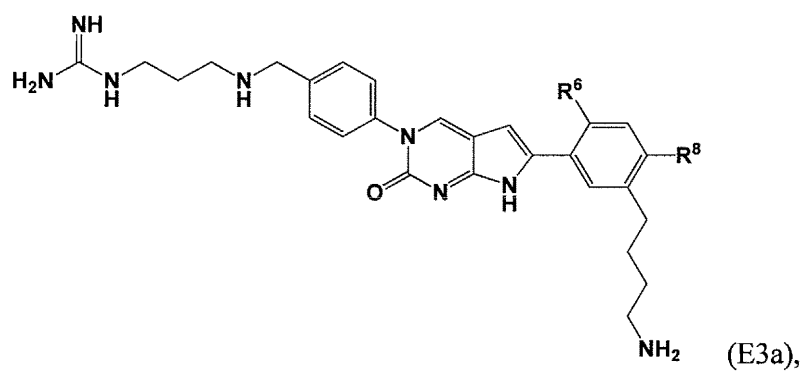
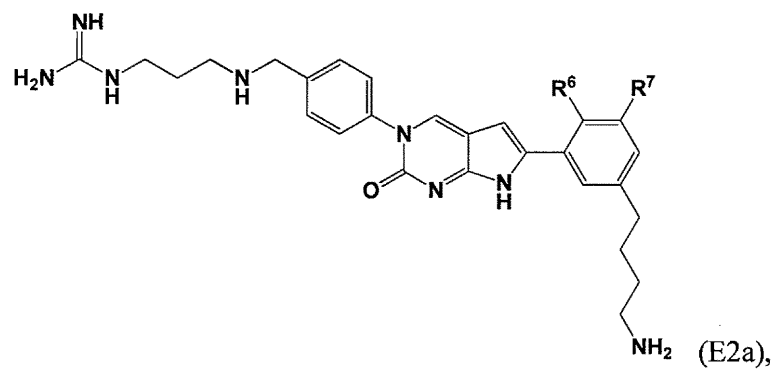
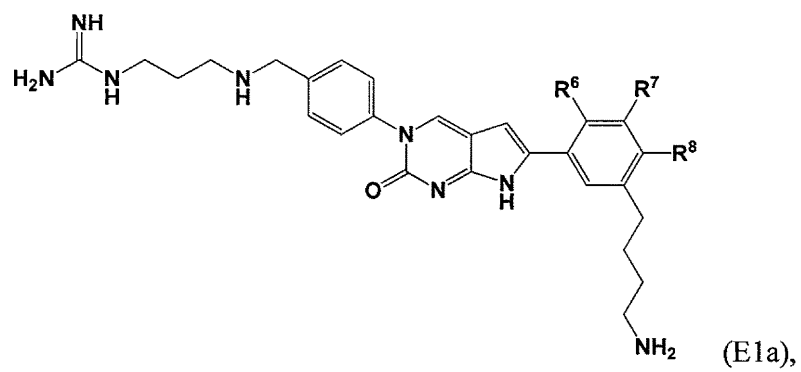
[本発明1024]

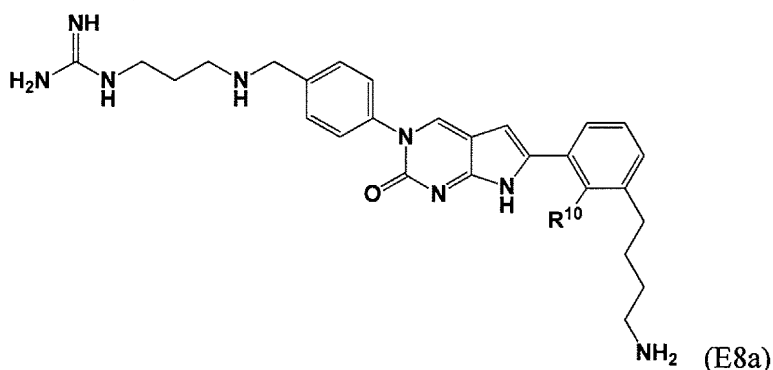
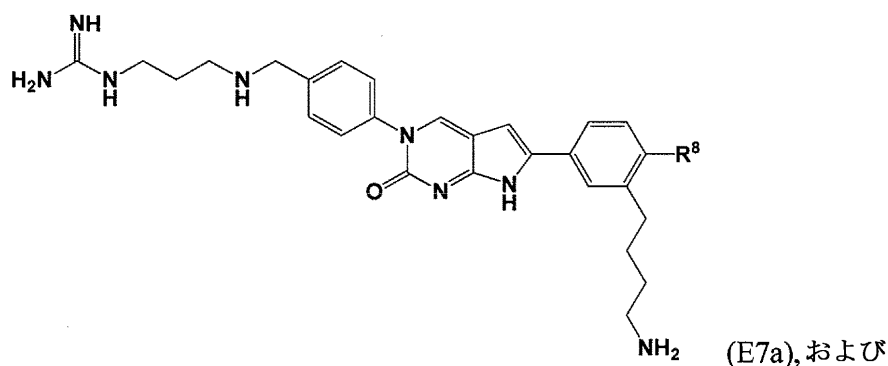
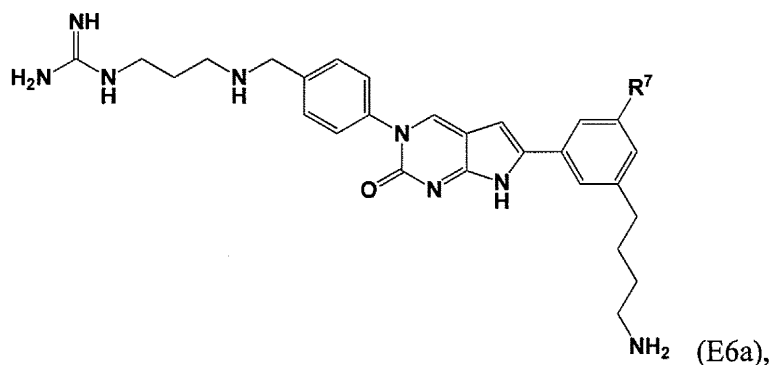
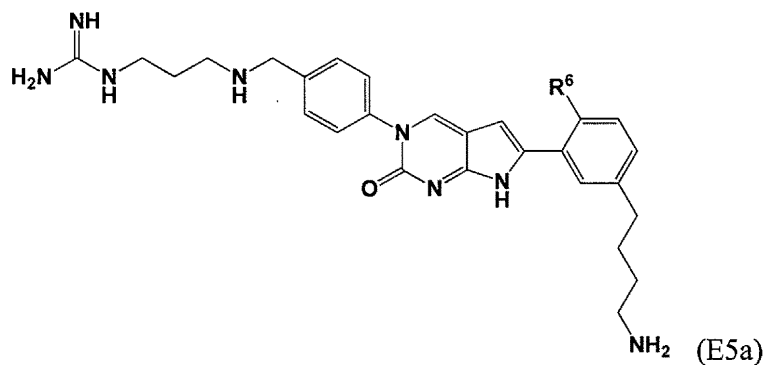






[本 発 明 1025]





より選択される式を有する、本発明1020の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1026]

R^{10} が水素、FおよびClより選択される、本発明1001～1025のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1027]

R^6 、 R^7 および R^8 が、それぞれ独立して(a) F、(b) Cl、(c) $-CF_3$ 、(d) $-CF_2H$ 、(e) $-CFH_2$ 、(f) $-OCF_3$ 、(g) $-OCF_2H$ 、(h) $-OCFH_2$ 、(i) $-OCH_3$ 、(j) $-CN$ 、(k) $-OR^{11}$ 、(l) $-S(O)_pR^{11}$ 、(m) $-SCF_3$ 、(n) $-C_1 \sim C_8$ アルキル、(o) 窒素、酸素および硫黄からなる群より選択

される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3～14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環、(p) -3～14員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環、(q) -CHCHCN、ならびに(r) -CHCH-C(O)NH-t-ブチルより選択される、本発明1001～1026のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1028]

R^6 、 R^7 および R^8 が、それぞれ独立して(a) F、(b) Cl、(c) -CF₃、(d) -CF₂H、(e) -CFH₂、(f) -OCF₃、(g) -OCF₂H、(h) -OCFH₂、(i) -OCH₃、(j) -CN、(k) -OR¹¹、(l) -S(O)_pR¹¹、(m) -SCF₃、(n) -C₁～C₈アルキル、(o) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3～14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環、ならびに(p) -3～14員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環より選択される、本発明1027の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1029]

R^6 、 R^7 および R^8 が、それぞれ独立して(a) F；(b) Cl；(c) -CF₃；(d) -CF₂H；(e) -CFH₂；(f) -OCF₃；(g) -OCF₂H；(h) -OCFH₂；(i) -OCH₃；(j) -O(C₁～C₄アルキル)；(k) -S(O)CH₃；(l) -S(O)CF₃；(m) -S(O)₂CH₃；(n) -S(O)₂CF₃；(o) -SCF₃；

(p) メチル、エチル、イソプロピルおよびt-ブチルより選択される-C₁～C₄アルキル；
(q) オキセタニル、アゼパニル、ピリジル、ジヒドロピリジル、フラニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピリジル、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニルおよびピペリデニル(piperidenyl)より選択される-3～7員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環；
ならびに

(r) シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、フェニル、シクロヘキセニルおよびシクロヘキサジエニルより選択される-3～7員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環
より選択される、本発明1028の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1030]

R^6 、 R^7 および R^8 が、それぞれ独立して(a) F、(b) Cl、(c) -CF₃、(d) -OCF₃、(e) -OCH₃、(f) メチル、(g) エチル、(h) イソプロピル、(i) t-ブチル、(j) アゼパニル、(k) シクロプロピル、(l) シクロブチル、(m) シクロヘキシル、(n) フェニル、(o) ピリジル、(p) アゼチジニル、(q) ピロリジニル、(r) ピペリジニルおよび(s) ピペリデニルより選択される、本発明1029の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1031]

R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} が、それぞれ独立して(a) 水素、(b) ハロゲン、(c) -CF₃、(d) -CF₂H、(e) -CFH₂、(f) -OCF₃、(g) -OCH₃、(h) -OCF₂H、(i) -OCFH₂、(j) -OR¹¹、(k) -C₁～C₈アルキル、(l) ハロアルキル、(m) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3～14員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環、ならびに(n) -3～14員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環より選択され；

あるいは、 R^{9k} および R^{9l} 、 R^{9m} および R^{9n} 、 R^{9o} および R^{9p} 、 R^{9q} および R^{9r} 、ならびに R^{9s} および R^{9t} より選択される1対もしくは複数対の置換基が、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、(a) -3～7員飽和もしくは不飽和炭素環、または(b) -窒素、酸素および硫黄からなる群より選択される1個もしくは複数個のヘテロ原子を含有する3～7員飽和もしくは不飽和複素環を形成し；かつ

R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択される少なくとも1個の置換基が水素ではない、

本発明1001～1019、1021～1024および1026～1030のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロ

ロドラッグ。

[本発明1032]

R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} が、それぞれ独立して(a) 水素；(b) ハロゲン；(c) $-\text{CF}_3$ ；(d) $-\text{CF}_2\text{H}$ ；(e) $-\text{CFH}_2$ ；(f) $-\text{OCF}_3$ ；(g) $-\text{OCH}_3$ ；(h) $-\text{OCF}_2\text{H}$ ；(i) $-\text{OCFH}_2$ ；(j) $-\text{OH}$ ；(k) $-\text{O}(\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{アルキル})$ ；

(l) メチル、エチル、イソプロピルおよびt-ブチルより選択される $-\text{C}_1 \sim \text{C}_4 \text{アルキル}$ ；

(m) オキセタニル、アゼパニル、ピリジル、ジヒドロピリジル、フラニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピリジル、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニルおよびピペリデニルより選択される-3~7員飽和、不飽和もしくは芳香族複素環；ならびに

(n) シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、フェニル、シクロヘキセニルおよびシクロヘキサジエニルより選択される-3~7員飽和、不飽和もしくは芳香族炭素環

より選択されるか；

あるいは、 R^{9k} および R^{9l} 、 R^{9m} および R^{9n} 、 R^{9o} および R^{9p} 、 R^{9q} および R^{9r} 、ならびに R^{9s} および R^{9t} より選択される1対もしくは複数対の置換基が、それらが結合している炭素原子と一緒に、シクロプロピル、シクロブチルまたはオキセタニルを形成し；かつ

R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択される少なくとも1個の置換基が水素ではない、

本発明1031の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1033]

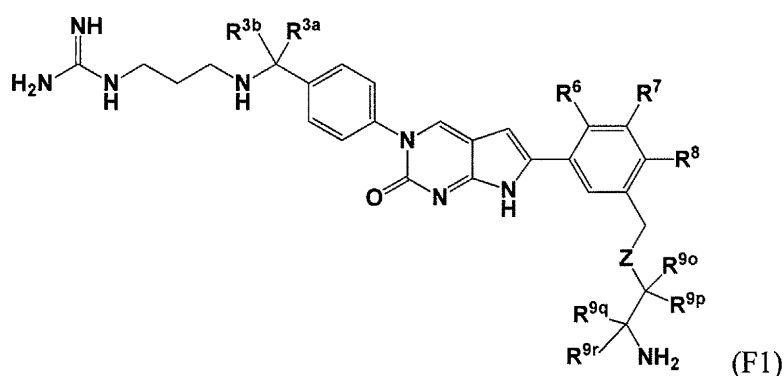
R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} が、それぞれ独立して(a) 水素、(b) ハロゲン、(d) $-\text{CF}_3$ 、(e) $-\text{CF}_2\text{H}$ 、(f) $-\text{CFH}_2$ 、(g) $-\text{OCF}_3$ 、(h) $-\text{OCH}_3$ 、(i) $-\text{OCF}_2\text{H}$ 、(j) $-\text{OCFH}_2$ 、(k) $-\text{OH}$ 、(l) $-\text{OCH}_3$ 、(l) メチル、(m) エチル、(n) イソプロピルおよび(o) t-ブチルより選択され；かつ

R^{9k} 、 R^{9l} 、 R^{9m} 、 R^{9n} 、 R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} 、 R^{9r} 、 R^{9s} および R^{9t} より選択される少なくとも1個の置換基が水素ではない、

本発明1032の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1034]

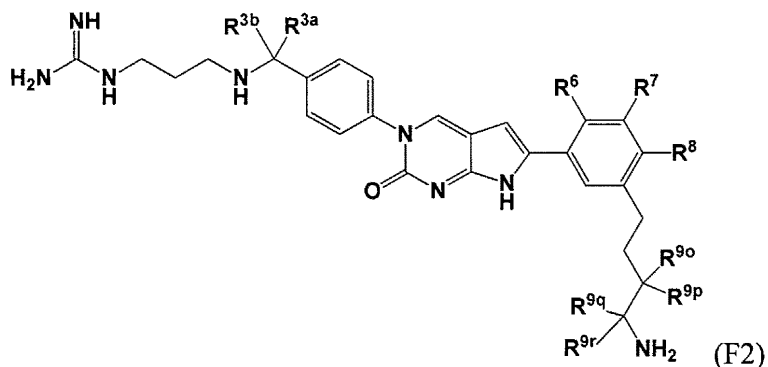
式：



を有する、本発明1001~1005のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1035]

式：



を有する、本発明1001～1005のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1036]

Zが、 $-O-$ 、 $-S(O)_p-$ 、 $-NR^{11}-$ 、 $-(C=O)-$ 、 $-NR^{11}(C=O)-$ 、 $-(C=O)NR^{11}-$ 、 $-S(O)_pNR^{11}-$ 、 $-NR^{11}S(O)_p$ および $-NR^{11}S(O)_pNR^{11}-$ より選択され；

R^{3a} が、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_6$ アルキルより選択され；

R^{3b} が、水素、ハロゲン、 $-OCF_3$ 、 $-OCF_2H$ 、 $-OCFH_2$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキルおよびハロアルキルより選択され；

R^6 、 R^7 および R^8 が、それぞれ独立して(a) 水素、(b) F、(c) Cl、(d) Br、(e) I、(f) $-CF_3$ 、(g) $-CF_2H$ 、(h) $-CFH_2$ 、(i) $-OCF_3$ 、(j) $-OCF_2H$ 、(k) $-OCFH_2$ 、(l) $-OCH_3$ 、(m) $-CN$ 、(n) $-N_3$ 、(o) $-NO_2$ 、(p) $-NR^{11}R^{11}$ 、(q) $-NR^{11}(CO)R^{11}$ 、(r) $-(CO)NR^{11}R^{11}$ 、(s) $-OR^{11}$ 、(t) $-COH$ 、(u) $-CO(C_1 \sim C_8 \text{アルキル})$ 、(v) $-COR^{11}$ 、(w) $-NR^{11}(CNR^{11})NR^{11}R^{11}$ 、(x) $-S(O)_pR^{11}$ 、(y) $-NR^{11}S(O)_pR^{11}$ 、(z) $-SR^{11}$ 、(aa) $-SCF_3$ 、(bb) $-C(CF_3)H-NH-CHR^{11}R^{11}$ 、(cc) $-COOR^{11}$ 、(dd) $-(OCH_2CH_2)_tR^{11}$ 、(ee) $-(OCH_2CH_2)_tOR^{11}$ 、(ff) $-C_1 \sim C_8 \text{アルキル}$ 、(g) $-C_2 \sim C_8 \text{アルケニル}$ および(hh) $-C_2 \sim C_8 \text{アルキニル}$ より選択され；

R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} および R^{9r} が、それぞれ独立して(a) 水素、(b) ハロゲン、(c) $-OCF_3$ 、(d) $-OCH_3$ 、(e) $-OCF_2H$ 、(f) $-OCFH_2$ 、(g) $-OR^{11}$ 、(h) $-C_1 \sim C_8 \text{アルキル}$ および(i) ハロアルキルより選択され；

R^{11} が、水素、 $-C_1 \sim C_6 \text{アルキル}$ 、 $-C_2 \sim C_6 \text{アルケニル}$ 、 $-C_2 \sim C_6 \text{アルキニル}$ およびハロアルキルより選択され；

pが0、1または2であり；かつ

tが0、1または2である、

本発明1034～1035のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1037]

ZがOであり；

R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} および R^{9r} が、それぞれ独立して $C_1 \sim C_6 \text{アルキル}$ および水素より選択され；

R^6 および R^8 が、それぞれ独立して水素、F、Cl、Br、I、 $-C_1 \sim C_6 \text{アルキル}$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ および $-CF_3$ より選択され；

R^7 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-C_1 \sim C_6 \text{アルキル}$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OC_1 \sim C_6 \text{アルキル}$ 、 $-S(O)_p-C_1 \sim C_6 \text{アルキル}$ 、 $-OCH_2F$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCF_3$ 、 $-S(O)_p-CH_3$ 、 $-S(O)_p-CH_2F$ および $-S(O)_p-CF_3$ より選択され；かつ

R^{3a} が、ハロゲンおよび $-C_1 \sim C_6 \text{アルキル}$ より選択され；

R^{3b} が、水素、ハロゲン、 $-CF_3$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C_1 \sim C_6 \text{アルキル}$ およびハロアルキルより選択され；かつ

pが0、1または2である、

本発明1034の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本 発 明 1038]

R^{9o} 、 R^{9p} 、 R^{9q} および R^{9r} が、それぞれ独立して $-C_1 \sim C_6$ アルキルおよび水素より選択され；

R^6 および R^8 が、それぞれ独立して水素、F、Cl、Br、I、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ および $-CF_3$ より選択され；

R^7 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OC_1 \sim C_6$ アルキル、 $-S(O)_p-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-OCH_2F$ 、 $O-CHF_2$ 、 $-OCF_3$ 、 $-S(O)_p-CH_3$ 、 $-S(O)_p-CH_2F$ および $-S(O)_p-CF_3$ より選択され；かつ

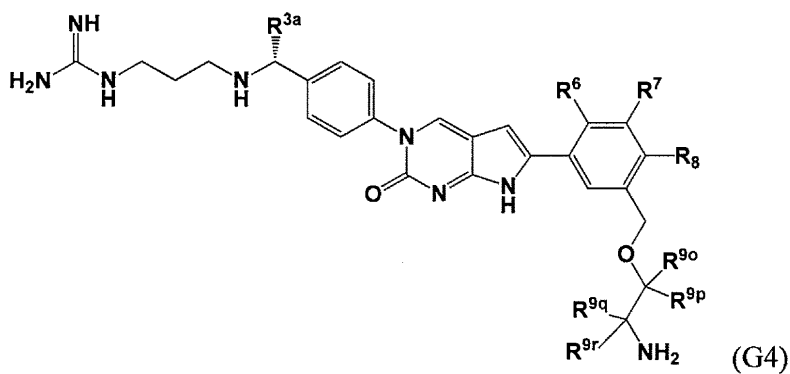
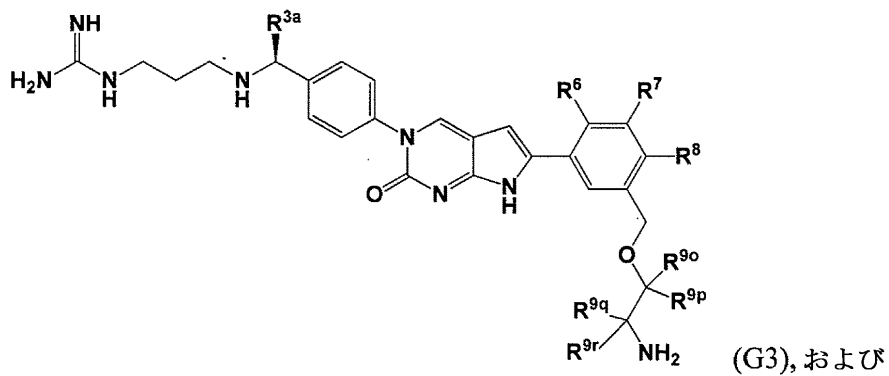
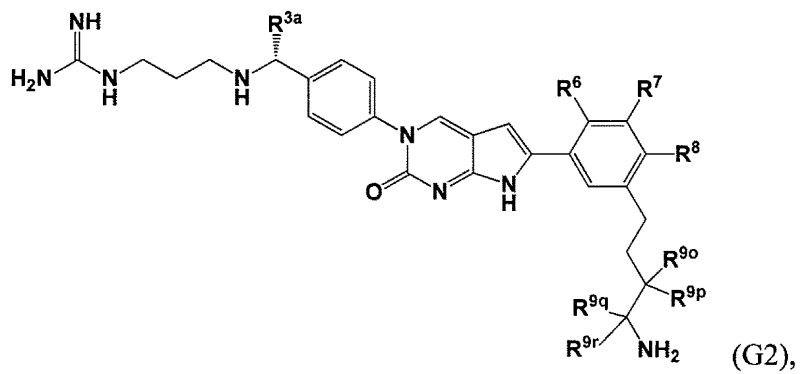
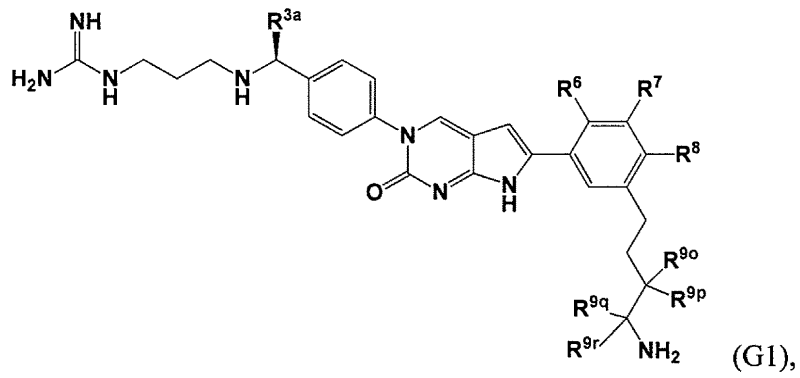
R^{3a} が、ハロゲンおよび $-C_1 \sim C_6$ アルキルより選択され；

R^{3b} が、水素、ハロゲン、 $-CF_3$ 、 $-CF_2H$ 、 $-CFH_2$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキルおよびハロアルキルより選択され；かつ

pが0、1または2である、

本発明1035の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本 発 明 1039]



より選択される式を有する、本発明1001～1005のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1040]

R^{9o}、R^{9p}、R^{9q}およびR^{9r}が、それぞれ独立して-C₁～C₆アルキルおよび水素より選択され；

R⁶およびR⁸が、それぞれ独立して水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂および-CF₃より選択され；

R⁷が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂、-CF₃、-OC₁~C₆アルキル、-S(O)_p-C₁~C₆アルキル、-OCH₂F、-OCHF₂、-OCF₃、-S(O)_p-CH₃、-S(O)_p-CH₂Fおよび-S(O)_p-CF₃より選択され；かつ

R^{3a}が、ハロゲンおよびC₁~C₆アルキルより選択され；かつ

pが0、1または2である、

本発明1039の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1041]

R^{9o}、R^{9p}、R^{9q}およびR^{9r}が、それぞれ独立してC₁~C₆アルキルおよび水素より選択され；

R⁶が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂および-CF₃より選択され；

R⁷が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂、-CF₃、-OC₁~C₆アルキル、-S(O)_p-C₁~C₆アルキル、-OCH₂F、-OCHF₂、-OCF₃、-S(O)_p-CH₃、-S(O)_p-CH₂Fおよび-S(O)_p-CF₃より選択され；

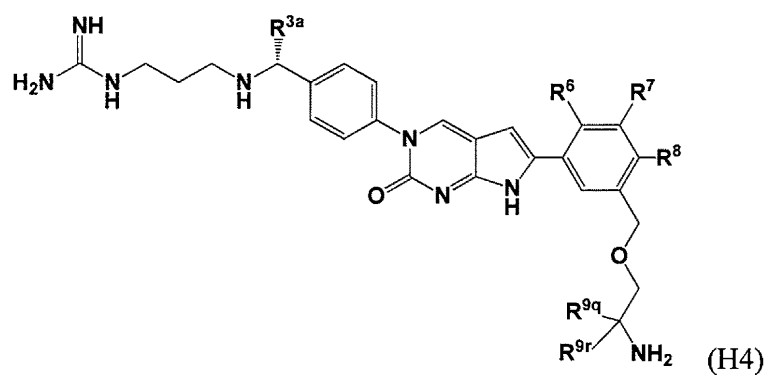
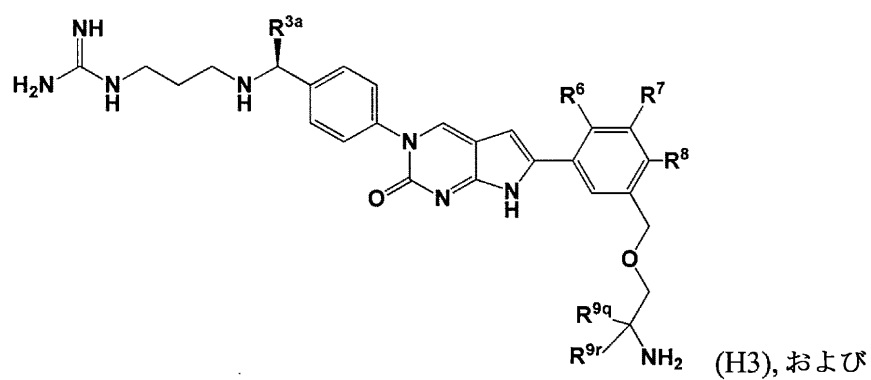
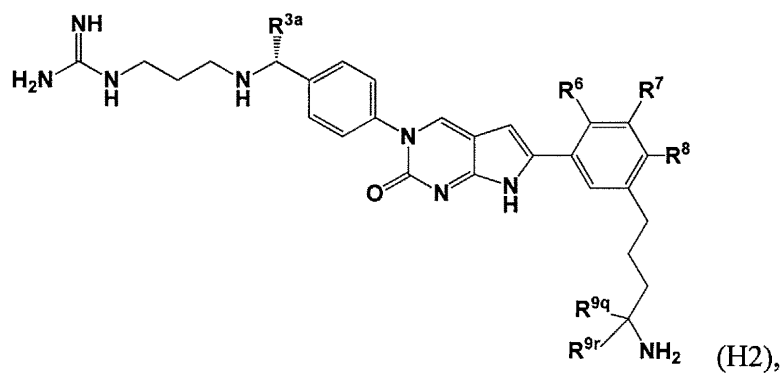
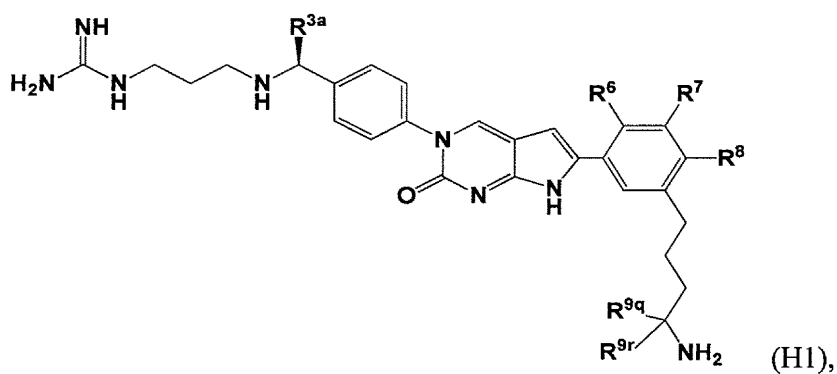
R⁸が水素であり；

R^{3a}が、ハロゲンおよび-C₁~C₆アルキルより選択され；かつ

pが0、1または2である、

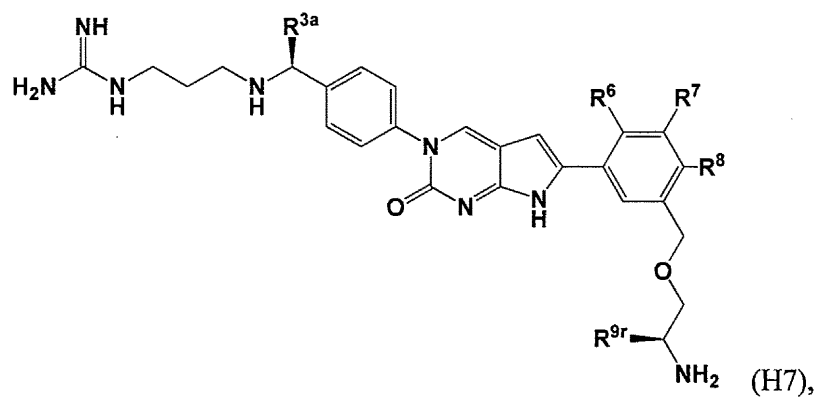
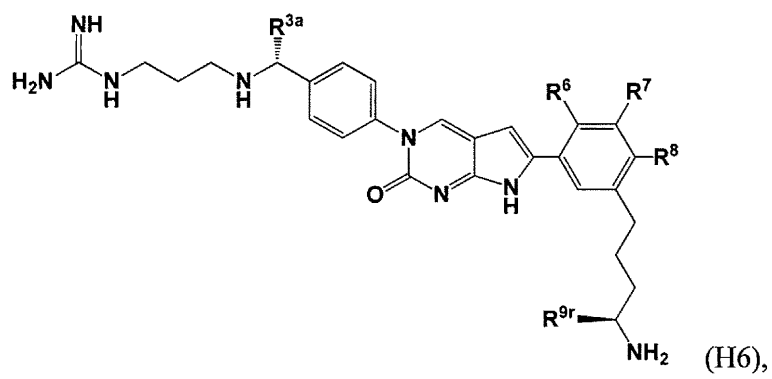
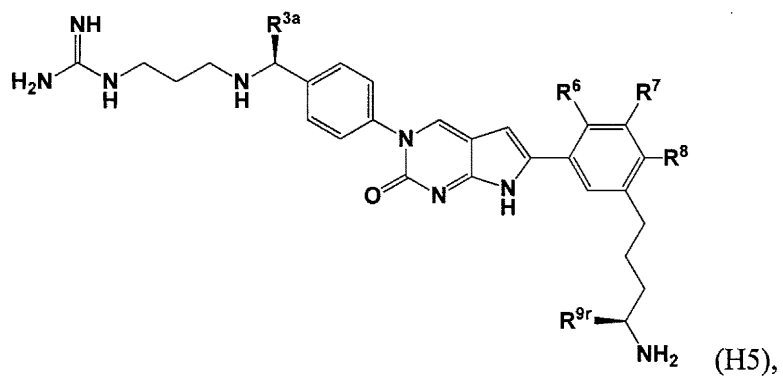
本発明1039~1040のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

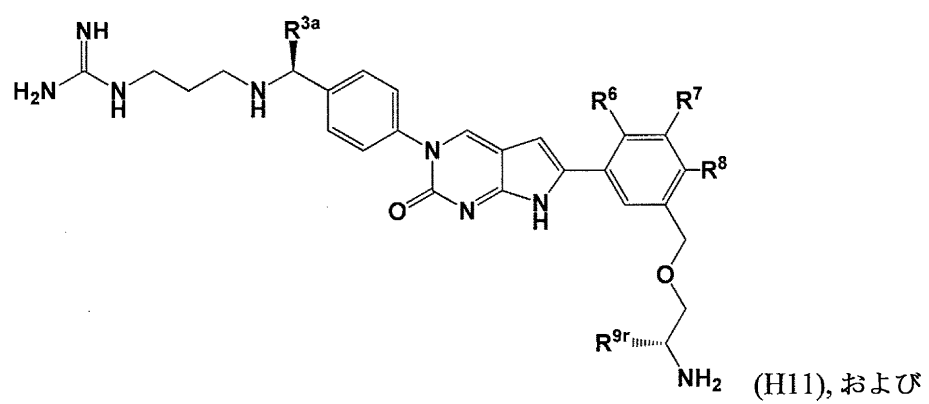
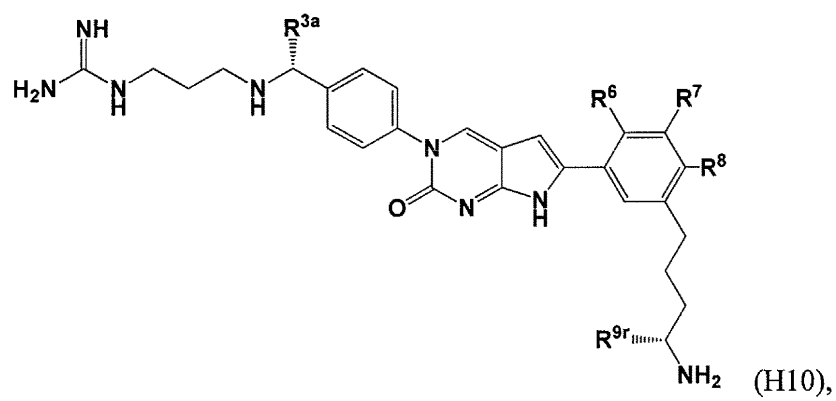
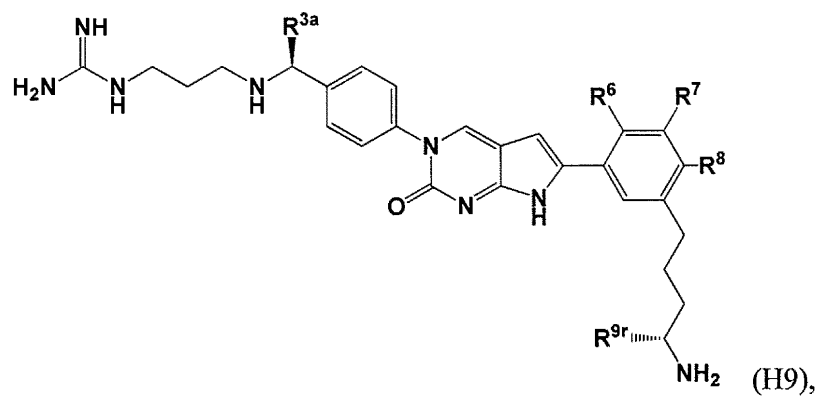
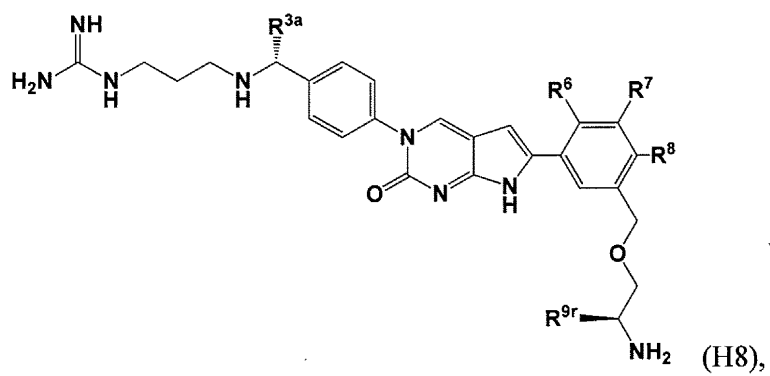
[本発明1042]

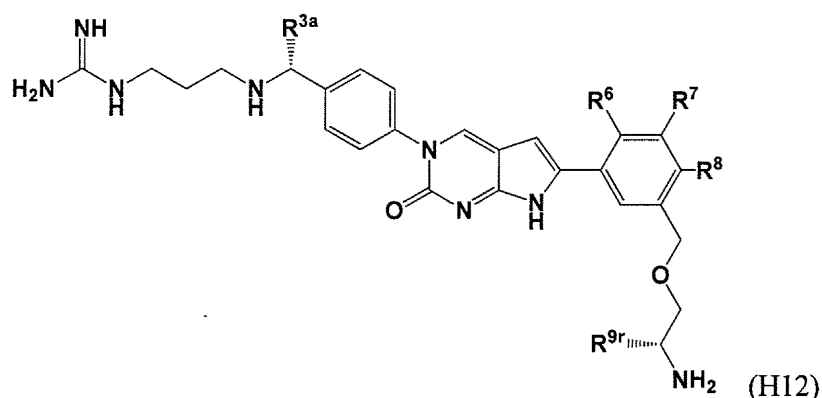


より選択される式を有する、本発明1001～1005のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1043]







より選択される式を有する、本発明1001～1005のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1044]

R^{9a} および R^{9r} が、それぞれ独立して $C_1 \sim C_6$ アルキルおよび水素より選択され；

R^6 および R^8 が、それぞれ独立して水素、F、Cl、Br、I、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ および $-CF_3$ より選択され；

R^7 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OC_1 \sim C_6$ アルキル、 $-S(O)_p-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-OCH_2F$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCF_3$ 、 $-S(O)_p-CH_3$ 、 $-S(O)_p-CH_2F$ および $-S(O)_p-CF_3$ より選択され；かつ

R^{3a} が、ハロゲンおよび $-C_1 \sim C_6$ アルキルより選択され；かつ

pが0、1または2である、

本発明1042の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1045]

R^{9a} および R^{9r} が、それぞれ独立して $-C_1 \sim C_6$ アルキルおよび水素より選択され；

R^6 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ および $-CF_3$ より選択され；

R^7 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OC_1 \sim C_6$ アルキル、 $-S(O)_p-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-OCH_2F$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCF_3$ 、 $-S(O)_p-CH_3$ 、 $-S(O)_p-CH_2F$ および $-S(O)_p-CF_3$ より選択され；

R^8 が水素であり；

R^{3a} が、ハロゲンおよび $-C_1 \sim C_6$ アルキルより選択され；かつ

pが0、1または2である、

本発明1042の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1046]

R^{9r} が $-C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

R^6 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ および $-CF_3$ より選択され；

R^7 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-OC_1 \sim C_6$ アルキル、 $-S(O)_p-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-OCH_2F$ 、 $-OCHF_2$ 、 $-OCF_3$ 、 $-S(O)_p-CH_3$ 、 $-S(O)_p-CH_2F$ および $-S(O)_p-CF_3$ より選択され；

R^8 が水素であり；

R^{3a} が、ハロゲンおよび $-C_1 \sim C_6$ アルキルより選択され；かつ

pが0、1または2である、

本発明1043の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1047]

R^{9r} が $-\text{CH}_3$ であり ;

R^6 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CHF}_2$ および $-\text{CF}_3$ より選択され

;

R^7 が、水素、F、Cl、Br、I、 $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OC}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{S}(\text{O})_p-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{OCH}_2\text{F}$ 、 $-\text{OCHF}_2$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p-\text{CH}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_p-\text{CH}_2\text{F}$ および $-\text{S}(\text{O})_p-\text{CF}_3$ より選択され ;

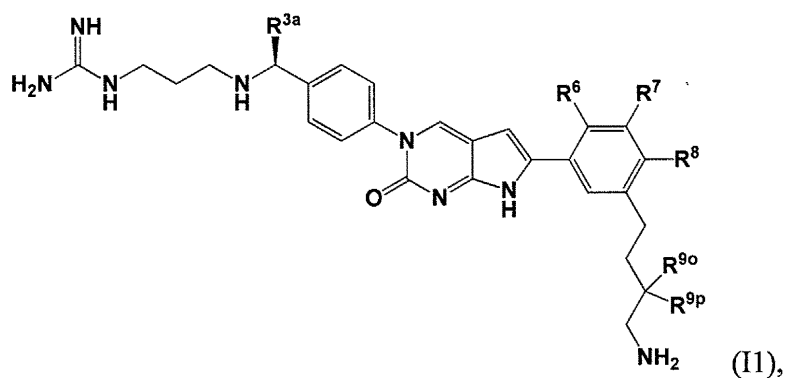
R^8 が水素であり ;

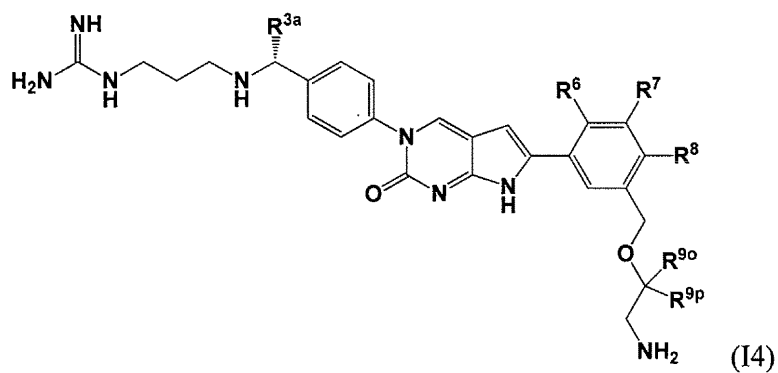
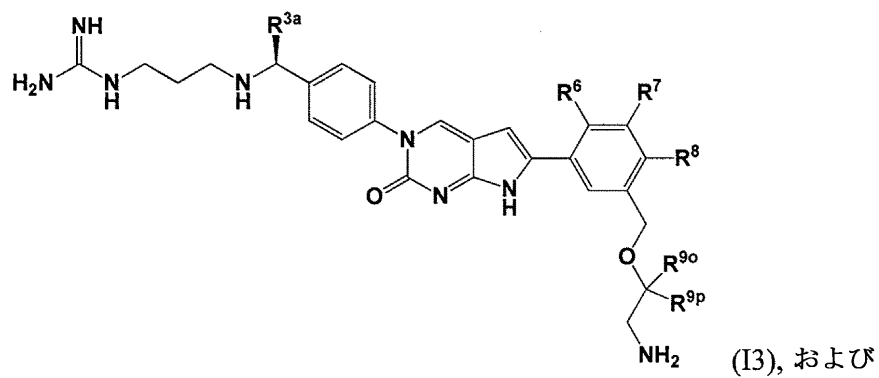
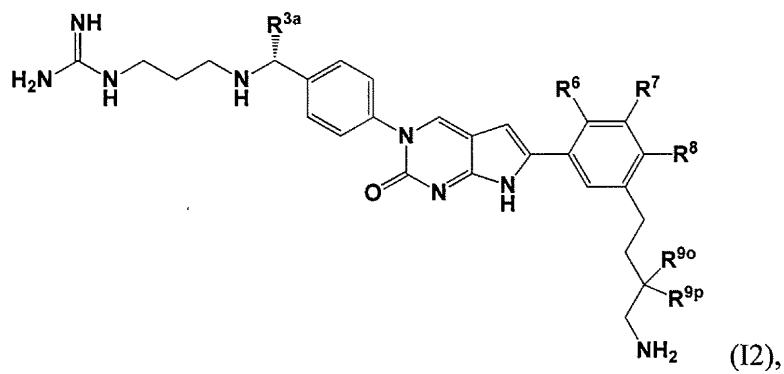
R^{3a} が $-\text{CH}_3$ であり ; かつ

p が 0、1 または 2 である、

本発明1043の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

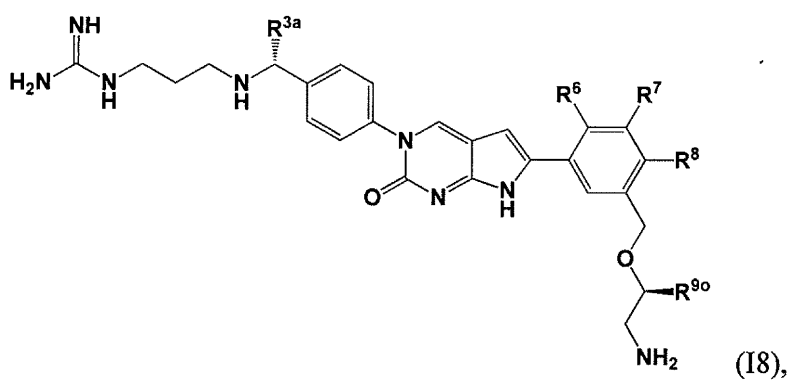
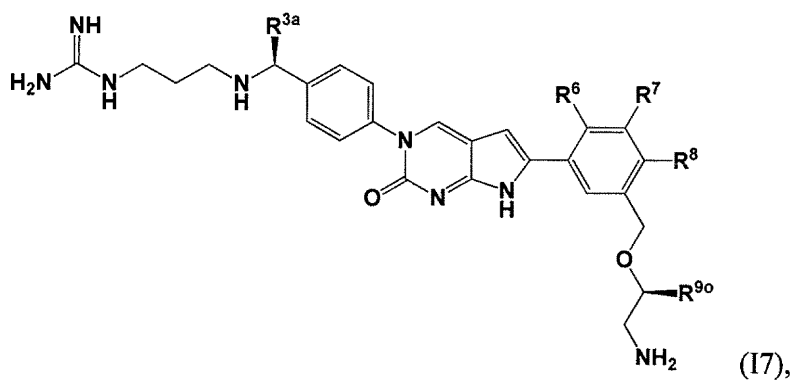
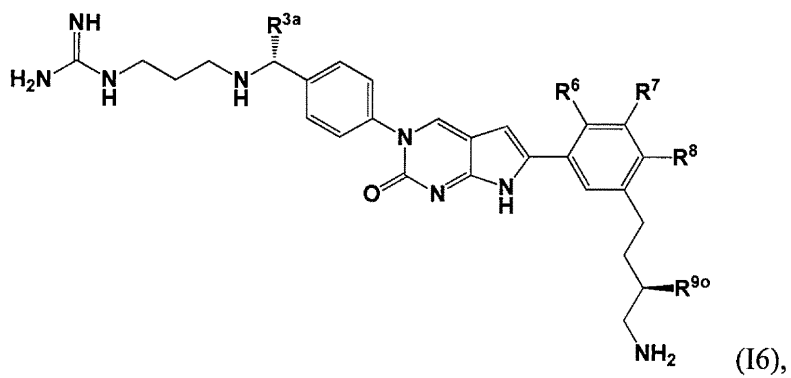
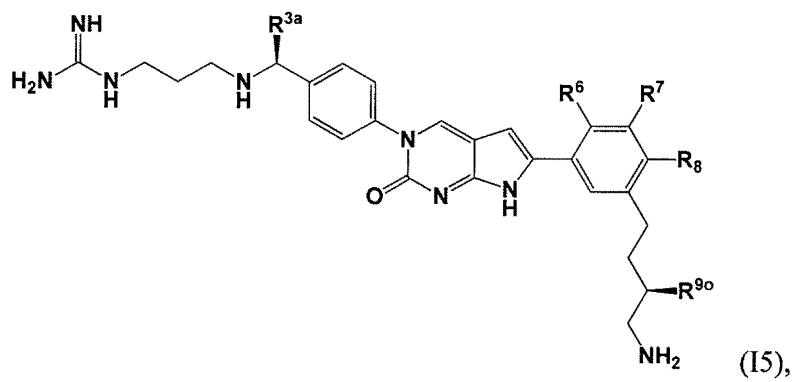
[本発明1048]

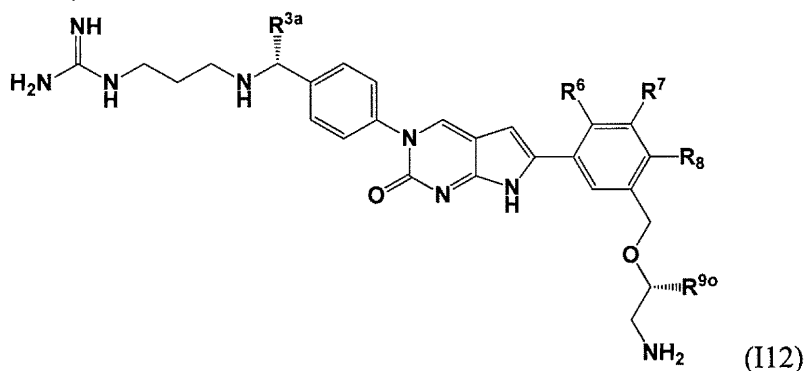
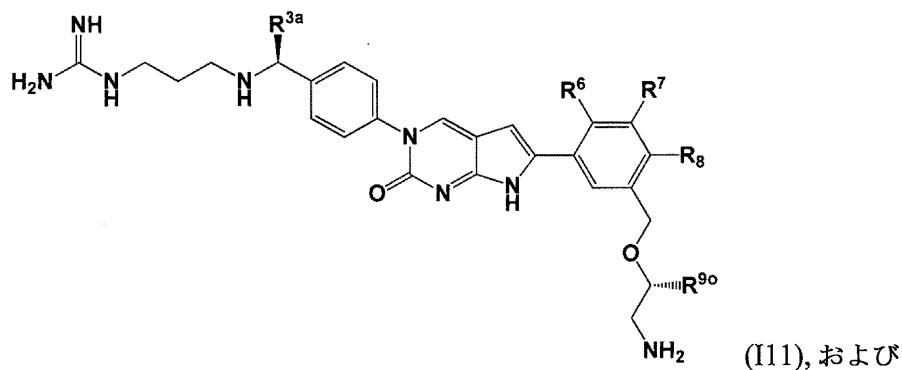
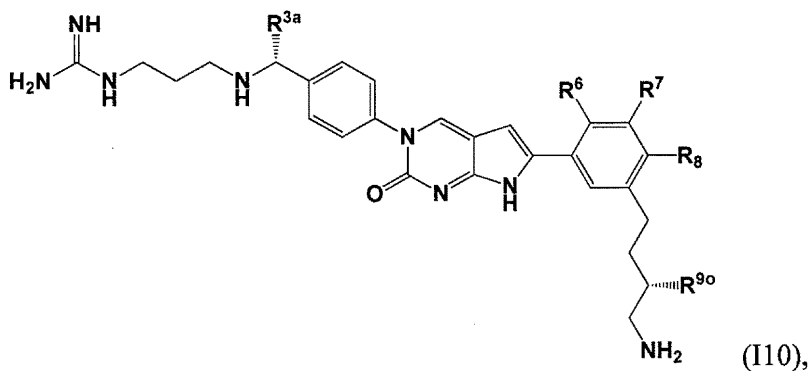
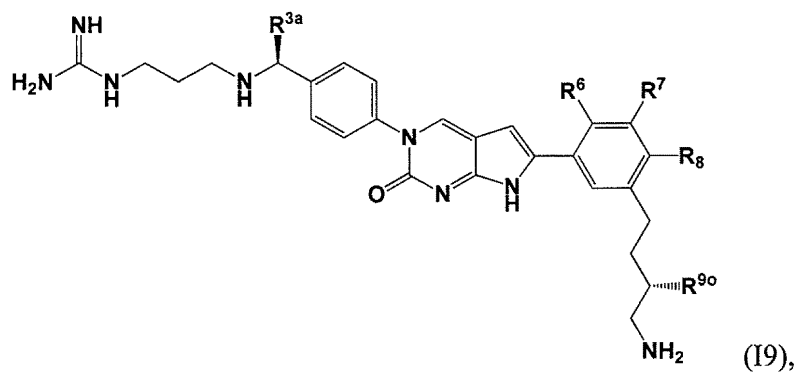




より選択される式を有する、本発明1001～1005のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1049]





より選択される式を有する、本発明1001～1005のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1050]

R^{9o}およびR^{9p}が、それぞれ独立して-C₁～C₆アルキルおよび水素より選択され；

R⁶およびR⁸が、それぞれ独立して水素、F、Cl、Br、I、-C₁～C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂および-CF₃より選択され；

R⁷が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁～C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂、-CF₃、-OC₁～C₆アルキル、-S(O)_p-C₁～C₆アルキル、-OCH₂F、-OCHF₂、-OCF₃、-S(O)_p-CH₃、-S(O)_p-CH₂Fおよび-

S(O)_p-CF₃より選択され；かつ

R^{3a}が、ハロゲンおよび-C₁~C₆アルキルより選択され；かつ

pが0、1または2である、

本発明1048の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1051]

R^{9o}およびR^{9p}が、それぞれ独立してC₁~C₆アルキルおよび水素より選択され；

R⁶が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂および-CF₃より選択され；

R⁷が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂、-CF₃、-OC₁~C₆アルキル、-S(O)_p-C₁~C₆アルキル、-OCH₂F、OCHF₂、-OCF₃、S(O)_p-CH₃、-S(O)_p-CH₂Fおよび-S(O)_p-CF₃より選択され；

R⁸が水素であり；

R^{3a}が、ハロゲンおよび-C₁~C₆アルキルより選択され；かつ

pが0、1または2である、

本発明1048の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1052]

R^{9o}が-C₁~C₆アルキルであり；

R⁶が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、CHF₂および-CF₃より選択され；

R⁷が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂、-CF₃、-OC₁~C₆アルキル、-S(O)_p-C₁~C₆アルキル、-OCH₂F、-OCHF₂、-OCF₃、-S(O)_p-CH₃、-S(O)_p-CH₂Fおよび-S(O)_p-CF₃より選択され；

R⁸が水素であり；

R^{3a}が、ハロゲンおよび-C₁~C₆アルキルより選択され；かつ

pが0、1または2である、

本発明1049の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1053]

R^{9o}が-CH₃であり；

R⁶が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂および-CF₃より選択され；

R⁷が、水素、F、Cl、Br、I、-C₁~C₆アルキル、-CH₂F、-CHF₂、-CF₃、-OC₁~C₆アルキル、-S(O)_p-C₁~C₆アルキル、-OCH₂F、-OCHF₂、-OCF₃、-S(O)_p-CH₃、-S(O)_p-CH₂Fおよび-S(O)_p-CF₃より選択され；

R⁸が水素であり；

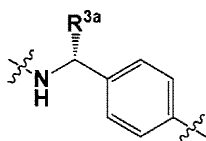
R^{3a}が-CH₃であり；かつ

pが0、1または2である、

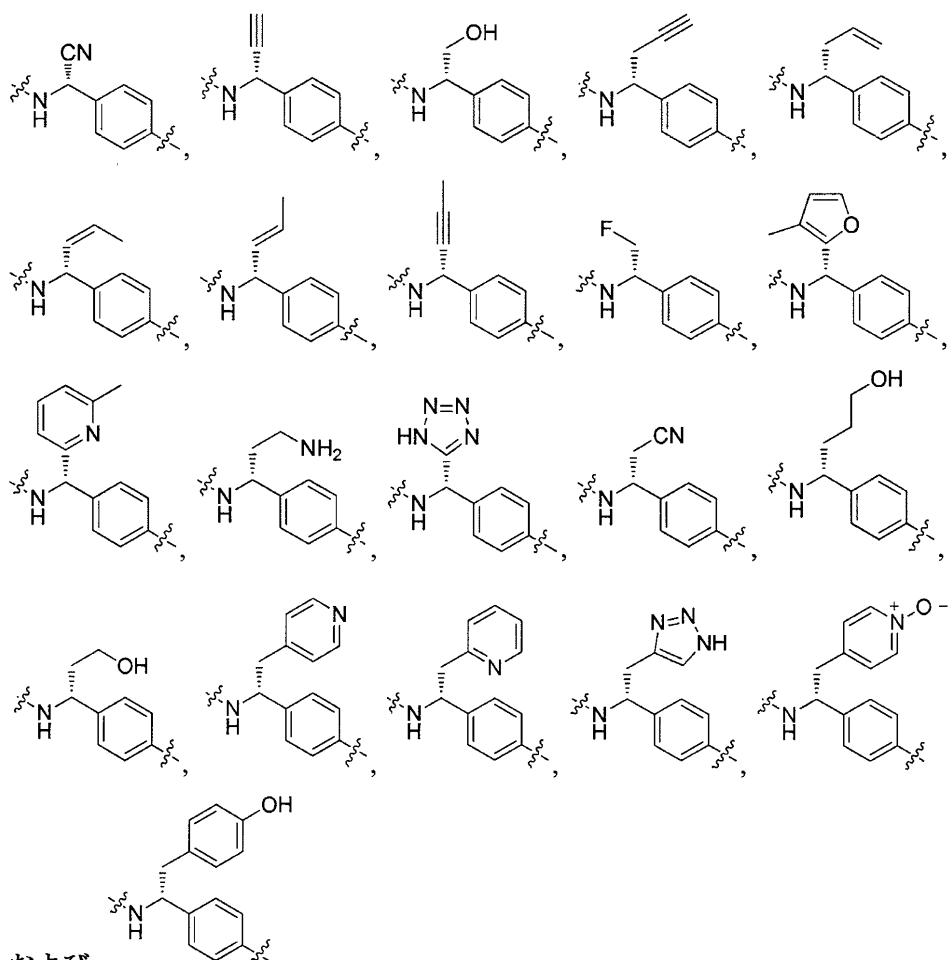
本発明1049の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1054]

部分



が

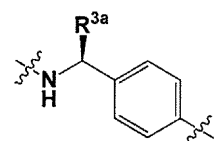


および

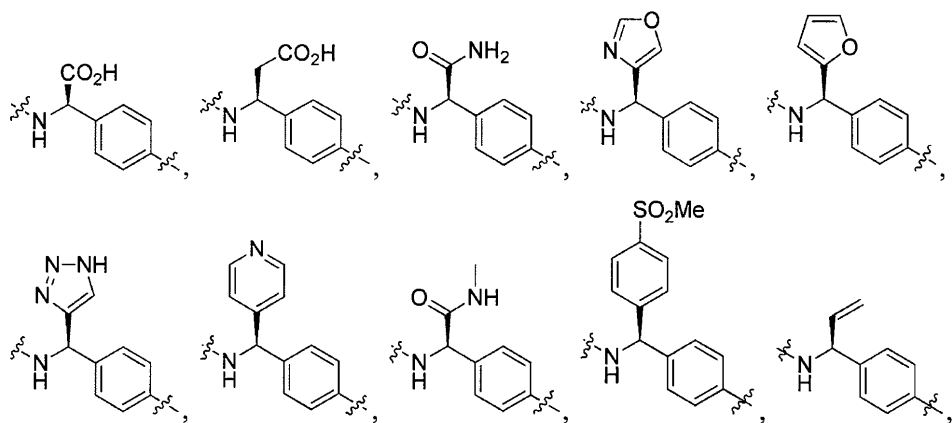
より選択される、本発明1034(R^{3b} はH)、1035(R^{3b} はH)、1039、1042、1043、1048および1049のいずれかの化合物。

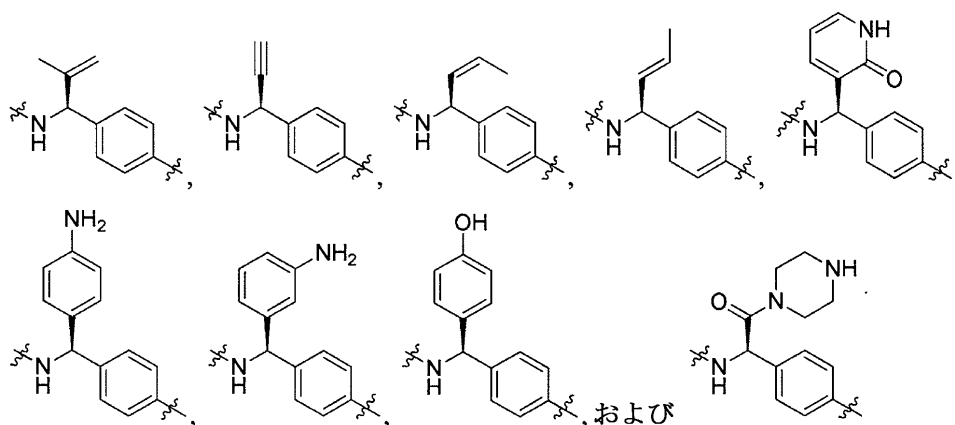
[本発明1055]

部分



が





より選択される、本発明1034(R^{3b} はH)、1035(R^{3b} はH)、1039、1042、1043、1048および1049のいずれかの化合物。

[本発明1056]

表1、表2、表2aおよび表2aaの化合物のいずれかである化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1057]

リボソームに結合する、本発明1001～1056のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1058]

リボソームが細菌リボソームである、本発明1057の化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1059]

本発明1001～1056のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグと、薬学的に許容される担体とを含む、薬学的組成物。

[本発明1060]

ヒトまたは動物における疾患状態を治療するか、予防するか、またはその危険性を低減させる方法であって、それを必要とする該ヒトまたは動物に、有効量の本発明1001～1056のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグを投与する段階を含む、方法。

[本発明1061]

ヒトまたは動物における微生物感染症を治療するか、予防するか、または低減させる方法であって、該ヒトまたは動物に、有効量の本発明1001～1056のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグを投与する段階を含む、方法。

[本発明1062]

ヒトまたは動物における微生物感染症を治療するか、予防するか、または低減させるための医薬の製造における、本発明1001～1056のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグの使用。

[本発明1063]

ヒトまたは動物における微生物感染症の治療、予防または低減において使用するための、本発明1001～1056のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグ。

[本発明1064]

ヒトまたは動物における微生物感染症を治療するか、予防するか、またはその危険性を低減させる方法であって、該方法が、該ヒトまたは動物に、有効量の本発明1001～1056のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグを投与する段階を含み、該微生物感染症が以下からなる群より選択される、方法：

皮膚感染症、グラム陽性感染症、グラム陰性感染症、院内肺炎、市中肺炎、ウイルス感染後肺炎、院内肺炎/人工呼吸器関連肺炎、慢性気道感染症(CRTI)などの気道感染症、急性骨盤内感染症、急性細菌性皮膚・皮膚組織感染症(ABSSSI)および非複雑性皮膚・皮膚組織感染症(uSSSI)を含む皮膚感染症、複雑性腹腔内感染症、尿路感染症、菌血症、敗血症、心内膜炎、房室シャント感染症、血管アクセス感染症、髄膜炎、外科的予防、腹膜感染症、骨感染症、関節感染症、メチシリン耐性黄色ブドウ球菌(*Staphylococcus aureus*)感染症、バンコマイシン耐性腸球菌(*Enterococci*)感染症、リネゾリド耐性生物感染症、炭疽菌(*Bacillus anthracis*)感染症、野兔病菌(*Francisella tularensis*)感染症、ペスト菌(*Yersinia pestis*)感染症、ならびに結核。

[本発明1065]

微生物感染症がグラム陽性感染症である、本発明1064の方法。

[本発明1066]

微生物感染症がグラム陰性感染症である、本発明1064の方法。

[本発明1067]

ヒトまたは動物における微生物感染症を治療するか、予防するか、またはその危険性を低減させる方法であって、該方法が、該ヒトまたは動物に、有効量の本発明1001～1056のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグを投与する段階を含み、該感染症が以下より選択される1種もしくは複数種の微生物により引き起こされるかまたはそれを包含する、方法：

アシネトバクター属(*Acinetobacter* spp.) (アシネトバクター・バウマンニ(*Acinetobacter baumannii*))、バクテロイデス・ディスタソニス(*Bacteroides distasonis*)、バクテロイデス・フラジリス(*Bacteroides fragilis*)、バクテロイデス・オバタス(*Bacteroides ovatus*)、バクテロイデス・テタイオタオミクロン(*Bacteroides thetaiotaomicron*)、バクテロイデス・ユニフォルミス(*Bacteroides uniformis*)、バクテロイデス・ブルガタス(*Bacteroides vulgatus*)、シトロバクター・フロインディイ(*Citrobacter freundii*)、シトロバクター・コセリ(*Citrobacter koseri*)、クロストリジウム・クロストリディオフォルメ(*Clostridium clostridioforme*)、クロストリジウム・パーフリンジエンス(*Clostridium perfringens*)、エンテロバクター・エロゲネス(*Enterobacter aerogenes*)、エンテロバクター・クロアカ(*Enterobacter cloacae*)、フェカリス菌(*Enterococcus faecalis*)、腸球菌属、大腸菌(*Escherichia coli*)、ユーバクテリウム・レンタム(*Eubacterium lentum*)、フソバクテリウム属(*Fusobacterium* spp.)、インフルエンザ菌(*Haemophilus influenzae*)、パラインフルエンザ菌(*Haemophilus parainfluenzae*)、肺炎桿菌(*Klebsiella pneumoniae*)、クレブシエラ・オキシトカ(*Klebsiella oxytoca*)、レジオネラ・ニューモフィラ(*Legionella pneumophila*)、モラクセラ・カタラーリス(*Moraxella catarrhalis*)、モルガネラ・モーガニイ(*Morganella morganii*)、マイコプラズマ属(*Mycoplasma* spp.)、ペプトストレプトコッカス属(*Peptostreptococcus* spp.)、ポルフィロモナス・アサッカロリテキア(*Porphyromonas asaccharolytica*)、プレボテラ・ビビア(*Prevotella bivia*)、プロテウス・ミラビリス(*Proteus mirabilis*)、プロテウス・ブルガリス(*Proteus vulgaris*)、プロビデンシア・レットゲリ(*Providencia rettgeri*)、プロビデンシア・スチュアルティイ(*Providencia stuartii*)、緑膿菌(*Pseudomonas aeruginosa*)、霊菌(*Serratia marcescens*)、ストレプトコッカス・アンギノサス(*Streptococcus anginosus*)、黄色ブドウ球菌、表皮ブドウ球菌(*Staphylococcus epidermidis*)、ステノトロホモナス・マルトフィリア(*Stenotrophomonas maltophilia*)、ストレプトコッカス・アガラクチア(*Streptococcus agalactiae*)、ストレプトコッカス・コンステラータス(*Streptococcus constellatus*)、肺

炎連鎖球菌(*Streptococcus pneumoniae*)、化膿性連鎖球菌(*Streptococcus pyogenes*)および化膿性連鎖球菌。

[本発明1068]

前記感染症が、黄色ブドウ球菌、肺炎連鎖球菌、腸球菌属、ストレプトコッカス・アガラクタ、化膿性連鎖球菌および表皮ブドウ球菌より選択される1種または複数種の好気性および通性のグラム陽性微生物により引き起こされるかまたはそれを包含する、本発明1067の方法。

[本発明1069]

前記感染症が、大腸菌、インフルエンザ菌、肺炎桿菌、シトロバクター・フロインディイ、エンテロバクター・エロゲネス、エンテロバクター・クロアカ、モルガネラ・モーガニイ、霊菌、緑膿菌、アシネトバクター・バウマンニ、モラクセラ・カタラーリス、プロテウス・ミラビリス、シトロバクター・コセリ、パラインフルエンザ菌、クレブシエラ・オキシトカ、プロテウス・ブルガリス、プロビデンシア・レットゲリおよびプロビデンシア・スチュアルティイより選択される1種または複数種の好気性および通性のグラム陰性微生物により引き起こされるかまたはそれを包含する、本発明1067の方法。

[本発明1070]

前記感染症が、1種または複数種の嫌気性微生物：バクテロイデス・フラジリス、バクテロイデス・ディスタソニス、バクテロイデス・オパタス、バクテロイデス・テタイオタオミクロン、バクテロイデス・ユニフォルミス、クロストリジウム・クロストリディオフォルメ、ユーバクテリウム・レントム、ペプトストレプトコッカス属、ボルフィロモナス・アサッカロリティカ、プレボテラ・ビビア、バクテロイデス・ブルガタス、クロストリジウム・パープリンジェンスおよびフソバクテリウム属により引き起こされるかまたはそれを包含する、本発明1067の方法。

[本発明1071]

微生物腸球菌属が、バンコマイシン感受性分離株およびバンコマイシン耐性分離株より選択される、本発明1067および1068のいずれかの方法。

[本発明1072]

微生物大腸菌が、基質特異性拡張型 -ラクタマーゼ(ESBL)産生分離株および肺炎桿菌カルバペネマーゼ(KPC)産生分離株より選択される、本発明1067および1069のいずれかの方法。

[本発明1073]

微生物インフルエンザ菌が -ラクタマーゼ陽性分離株である、本発明1067および1069のいずれかの方法。

[本発明1074]

微生物肺炎桿菌が、基質特異性拡張型 -ラクタマーゼ(ESBL)産生分離株および肺炎桿菌カルバペネマーゼ(KPC)産生分離株より選択される、本発明1067および1069のいずれかの方法。

[本発明1075]

微生物クレブシエラ・オキシトカが、基質特異性拡張型 -ラクタマーゼ(ESBL)産生分離株および肺炎桿菌カルバペネマーゼ(KPC)産生分離株より選択される、本発明1067および1069のいずれかの方法。

[本発明1076]

微生物黄色ブドウ球菌が、メチシリン感受性分離株およびメチシリン耐性分離株より選択される、本発明1067および1068のいずれかの方法。

[本発明1077]

微生物表皮ブドウ球菌が、メチシリン感受性分離株およびメチシリン耐性分離株より選択される、本発明1067および1068のいずれかの方法。

[本発明1078]

微生物肺炎連鎖球菌が、ペニシリン感受性分離株およびペニシリン耐性分離株より選択される、本発明1067および1068のいずれかの方法。

[本発明1079]

化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグの量が、0.1mg～1500mgを構成する、本発明1060～1078のいずれかの方法、使用または化合物。

[本発明1080]

化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグの量が、約25mg、または約50mg、または約75mg、または約100mg、または約125mg、または約150mg、または約175mg、または約200mg、または約225mg、または約250mg、または約275mg、または約300mg、または約325、または約350mg、または約375mg、または約400mg、または約425mg、または約450mg、または約475mg、または約500mg、または約525mg、または約550mg、または約575mg、または約600mg、または約625mg、または約650mg、または約675mg、または約700mg、または約725mg、または約750mg、または約775mg、または約800mg、または約825mg、または約850mg、または約875mg、または約900mg、または約925mg、または約950mg、または約975mg、または約1000mg、または約1025mg、または約1050mg、または約1075mg、または約1100mg、または約1125mg、または約1150mg、または約1175mg、または約1200mg、または約1225mg、または約1250mg、または約1275mg、または約1300mg、または約1325mg、または約1350mg、または約1375mg、または約1400mg、または約1425mg、または約1450mg、または約1475mg、または約1500mgを構成する、本発明1079の方法、使用または化合物。

[本発明1081]

化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグが、経耳、経眼、経鼻、経口、非経口、局所または静脈内投与される、本発明1060～1080のいずれかの方法、使用または化合物。

[本発明1082]

本発明1001～1056のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグを合成する方法。

[本発明1083]

本発明1001～1056のいずれかの化合物もしくはその互変異性体、または該化合物もしくは互変異性体の薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグを含む、医療デバイス。

[本発明1084]

ステントである、本発明1083の医療デバイス。

本発明の前述のおよび他の局面および態様は、以下の詳細な説明および特許請求の範囲を参照することでより完全に理解することができる。