

【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】令和1年6月20日(2019.6.20)

【公開番号】特開2019-55968(P2019-55968A)

【公開日】平成31年4月11日(2019.4.11)

【年通号数】公開・登録公報2019-014

【出願番号】特願2018-214091(P2018-214091)

【国際特許分類】

C 07 H	17/08	(2006.01)
A 61 P	11/00	(2006.01)
A 61 P	29/00	(2006.01)
A 61 P	31/00	(2006.01)
A 61 P	31/04	(2006.01)
A 61 P	33/00	(2006.01)
A 61 K	31/7052	(2006.01)
A 01 N	43/90	(2006.01)
A 01 P	3/00	(2006.01)

【F I】

C 07 H	17/08	C S P B
A 61 P	11/00	
A 61 P	29/00	
A 61 P	31/00	
A 61 P	31/04	
A 61 P	33/00	
A 61 K	31/7052	
A 01 N	43/90	1 0 3
A 01 P	3/00	

【手続補正書】

【提出日】平成31年4月18日(2019.4.18)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

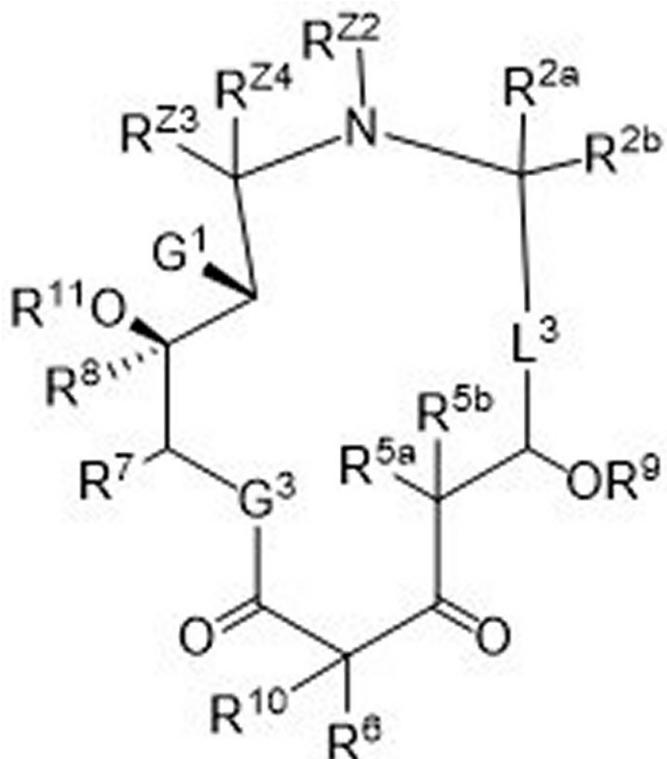
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式

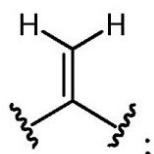
【化1】



式中、

R<sup>2a</sup>、およびR<sup>2b</sup>のそれぞれは独立して水素、ハロゲン、カルボニル、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル(heterocyllyl)、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリールであるか、あるいはR<sup>2a</sup>およびR<sup>2b</sup>が一緒になって、

【化2】



を形成し得、

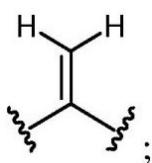
R<sup>2</sup>のそれぞれは独立して水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル(heterocyllyl)、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、ヒドロキシリル、置換ヒドロキシリル、アミノ、置換アミノ、-C(=O)R<sup>2</sup>、-C(=O)OR<sup>2</sup>、-C(=O)N(R<sup>2</sup>)<sub>2</sub>、または窒素保護基であるか、あるいは2つのR<sup>2</sup>基が連結されて任意置換ヘテロシクリル(heterocyllyl)または任意置換ヘテロアリール環を形成し、

R<sup>3</sup>は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル(heterocyllyl)、任意置換アリール、または任意置換ヘテロアリールであり、

R<sup>4</sup>は任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル(heterocyllyl)、任意置換アリール、または任意置換ヘテロアリールであるか、

あるいはR<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>が一緒になって、

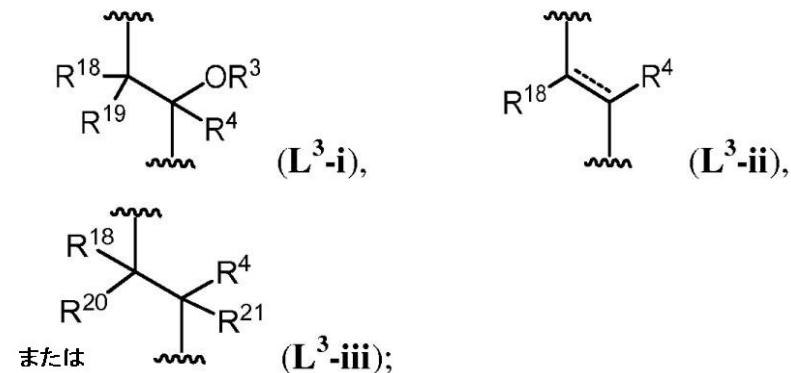
## 【化3】



を形成し得、

$L^3$  は式

## 【化4】



の基であり、

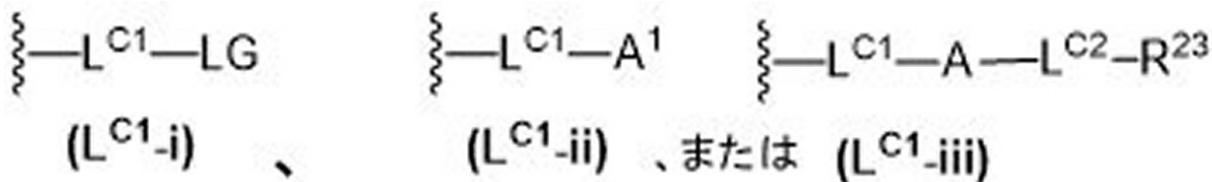
## 【化5】

-----

は単または二重結合を表し、

$R^3$  は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、 $-C(=O)R^{28}$ 、 $-C(=O)OR^{28}$ 、 $-C(=O)N(R^{28})_2$ 、酸素保護基、または式

## 【化6】



の基であり、

$R^4$  は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリールであり、

$R^{18}$  および  $R^{19}$  のそれぞれは独立して水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、または任意置換ヘテロアリールであり、

$R^{20}$  および  $R^{21}$  のそれぞれは独立して水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニ

ル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、ヒドロキシリ、置換ヒドロキシリ、チオール、置換チオール、アミノ、置換アミノ、ハロゲン、カルボニルであるか、または $R^{2\ 0}$ および $R^{2\ 1}$ が連結されて任意置換シクロプロピルもしくはオキシラニル環を形成し、

$R^{5\ a}$ および $R^{5\ b}$ のそれぞれは独立して水素、ハロゲン、シリル、任意置換アルキル、任意置換カルボシクリル、または任意置換ヘテロシクリルであり、

$R^6$ は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換アラルキル、任意置換ヘテロアリール、任意置換ヘテロアラルキル、ヒドロキシリ、置換ヒドロキシリ、チオール、置換チオール、アミノ、置換アミノ、カルボニル、シリル、またはハロゲンであり、

$R^7$ および $R^8$ はそれぞれ独立して水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、または任意置換ヘテロアリールであり、

$R^9$ は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、 $-C(=O)R^{2\ 8}$ 、 $-C(=O)OR^{2\ 8}$ 、 $-C(=O)N(R^{2\ 8})_2$ 、酸素保護基、または炭水化物であり、

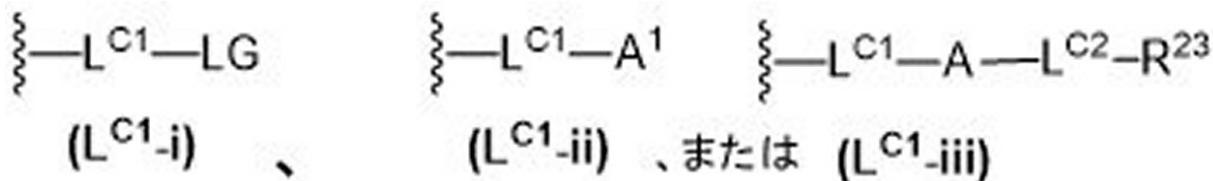
$R^{1\ 0}$ は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、ヒドロキシリ、置換ヒドロキシリ、チオール、置換チオール、アミノ、置換アミノ、カルボニル、シリル、およびハロゲンであり、

$G^3$ は $-O-$ 、 $-S-$ 、または $-N(R^{G\ 1})-$ であり、 $R^{G\ 1}$ は水素、任意置換アルキル、または窒素保護基であり、

$G^1$ は $-OR^{1\ 2}$ または $-NR^{1\ 3}R^{1\ 4}$ であり、

ただし、 $G^1$ が $-OR^{1\ 2}$ であるときには、 $R^{1\ 1}$ および $R^{1\ 2}$ は式 $-C(=O)-$ の基として連結されて環式カーボネートを提供するか、あるいは $R^{1\ 1}$ および $R^{1\ 2}$ は連結されず、 $R^{1\ 1}$ は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、または酸素保護基であり、 $R^{1\ 2}$ は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、酸素保護基、または式

【化7】

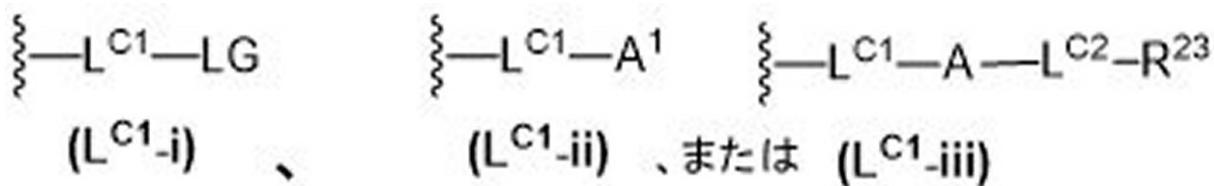


の基であり、

ただし、 $G^1$ が $-NR^{1\ 3}R^{1\ 4}$ であるときには、 $R^{1\ 1}$ および $R^{1\ 3}$ は式 $-C(=O)-$ の基として連結されて環式カルバメートを提供するか、あるいは $R^{1\ 1}$ および $R^{1\ 3}$ は連結されず、 $R^{1\ 1}$ は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、または酸素保護基であり、 $R^{1\ 3}$ は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、または窒素保護基であり、

$R^{1\ 4}$ は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、窒素保護基、 $-C(=O)R^{2\ 8}$ もしくは $-C(=O)OR^{2\ 8}$ 、または式

## 【化8】



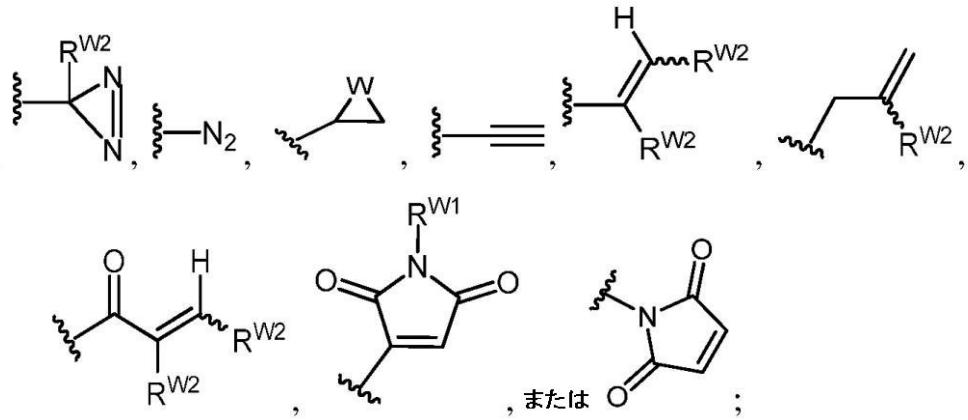
の基であり、

あるいは  $\text{R}^{1\sim 3}$  および  $\text{R}^{1\sim 4}$  が連結されて任意置換ヘテロシクリルまたは任意置換ヘテロアリールを形成し、

$\text{L}^{\text{C1}}$  および  $\text{L}^{\text{C2}}$  のそれぞれは独立して結合であるか、または任意置換アルキレン、任意置換アルケニレン、任意置換アルキニレン、任意置換ヘテロアルキレン、任意置換ヘテロアルケニレン、任意置換ヘテロアルキニレン、およびその組み合わせからなる群から選択される連結基であり、

$\text{A}^1$  のそれぞれは独立して脱離基 ( $\text{L}\text{G}$ )、-SH、-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH-NH<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、-O-NH<sub>2</sub>、-C(=O)R<sup>X1</sup>、

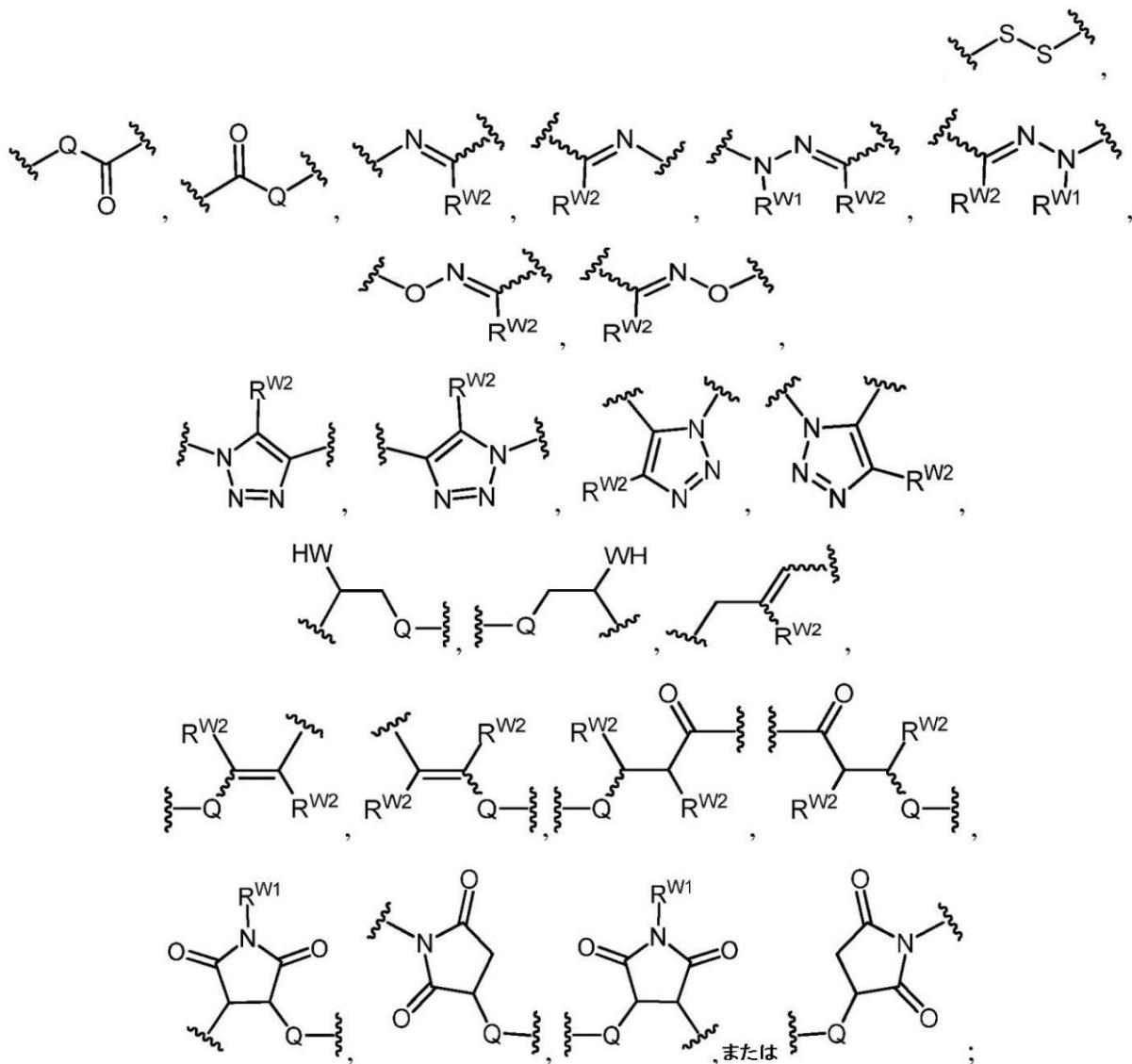
## 【化9】



であり、

$\text{A}$  は -NH-、-NH-NH-、-NH-O-、-O-NH-、-S-、-O-、

【化10】



任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル(heterocyclyl)、任意置換アリール、または任意置換ヘテロアリールであり、

Qは-NH-、-NH-NH-、-O-NH-、-NH-O-、-S-、または-O-であり、

WはO、S、またはNR<sup>W1</sup>であり、

R<sup>W1</sup>は水素、置換もしくは無置換アルキル、置換もしくは無置換アルケニル、置換もしくは無置換アルキニル、置換もしくは無置換カルボシクリル、置換もしくは無置換ヘテロシクリル、置換もしくは無置換アリール、置換もしくは無置換ヘテロアリール、または窒素保護基であり、

R<sup>W2</sup>は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリールであるか、または2つのR<sup>W2</sup>基が連結されて任意置換環式部分を形成し、

R<sup>X1</sup>は水素、ハロゲン、または-OR<sup>X2</sup>であり、R<sup>X2</sup>は水素、任意置換アルキル、任意置換アルキニル、任意置換アルケニル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、または酸素保護基であり、

$R^{2\sim 3}$  は任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、または任意置換ヘテロアリールであり、

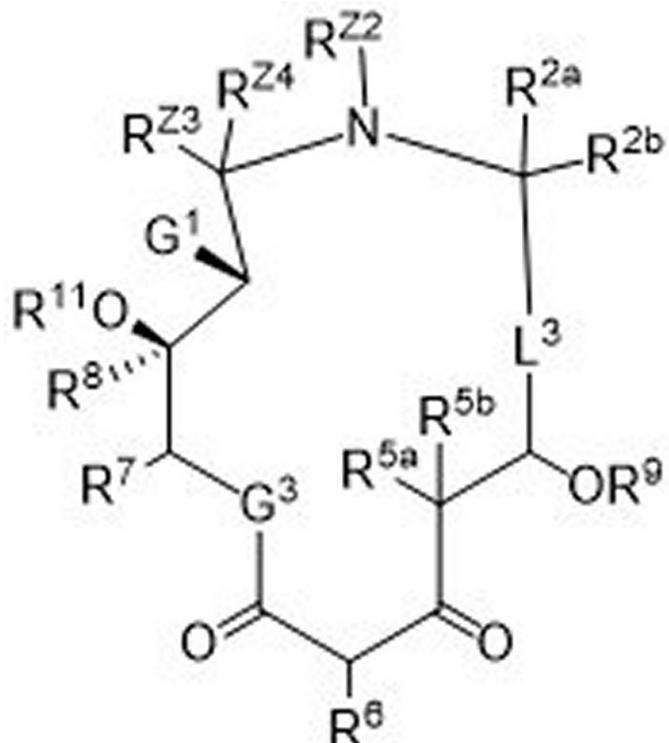
$R^{2\sim 8}$  のそれぞれは独立して水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル(heteroclyl)、任意置換アリール、または任意置換ヘテロアリールであるか、あるいは2つの $R^{2\sim 8}$  基が連結されて任意置換ヘテロシクリル(heteroclyl)または任意置換ヘテロアリール環を形成する。

の化合物またはその塩。

【請求項2】

化合物が式

【化11】

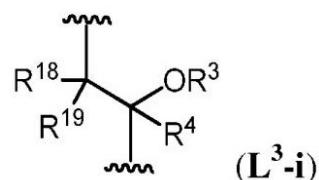


またはその塩である、請求項1に記載の化合物、またはその塩。

【請求項3】

$L^3$  が式

【化12】

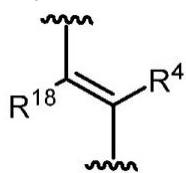


の基である、請求項1または2に記載の化合物、またはその塩。

【請求項4】

$L^3$  が式

【化13】

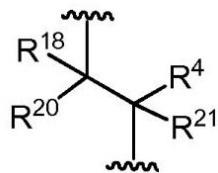


の基である、請求項1または2に記載の化合物、またはその塩。

【請求項5】

 $L^3$ が式

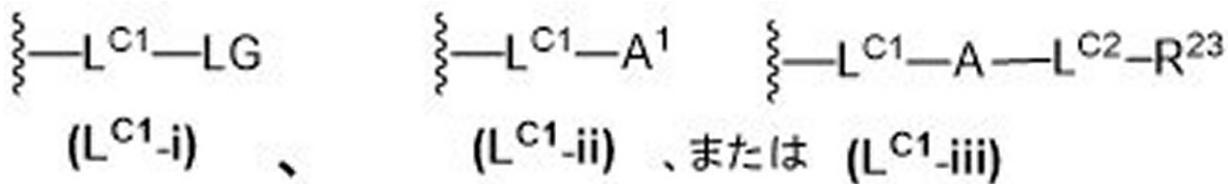
【化14】

の基であり、 $R^{2\sim 1}$ が水素である、請求項1または2に記載の化合物、またはその塩。

【請求項6】

 $R^3$ が式

【化15】

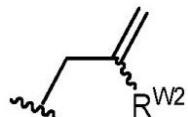


の基である、請求項1に記載の化合物、またはその塩。

【請求項7】

 $A^1$ が、

【化16】

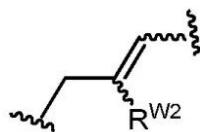


である、請求項6に記載の化合物、またはその塩。

【請求項8】

 $A$ が、

【化17】

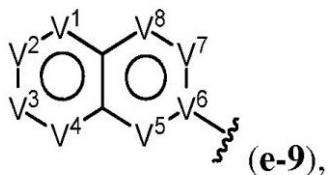
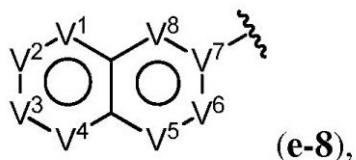
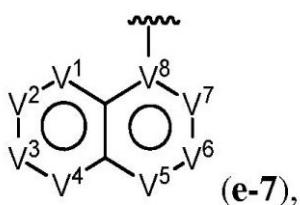
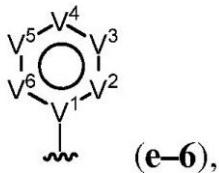
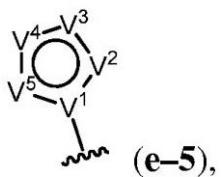
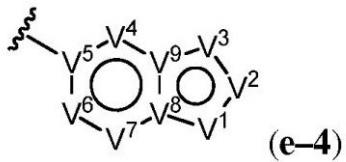
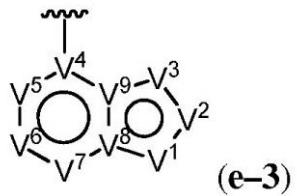
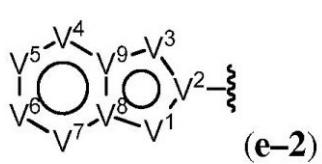
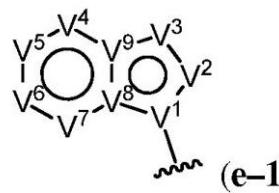


である、請求項6に記載の化合物、またはその塩。

【請求項9】

 $R^{2\sim 3}$ が

## 【化18】



であり、

$V^1$ 、 $V^2$ 、 $V^3$ 、 $V^4$ 、 $V^5$ 、 $V^6$ 、 $V^7$ 、 $V^8$ 、および $V^9$ のそれぞれは、原子価が許す限り独立してO、S、N、 $NR^{2,3}N$ 、C、または $CR^{2,3}C$ であり得、

$R^{2,3}N$ は独立して水素、任意置換アルキル、任意置換アリール、または窒素保護基であり、

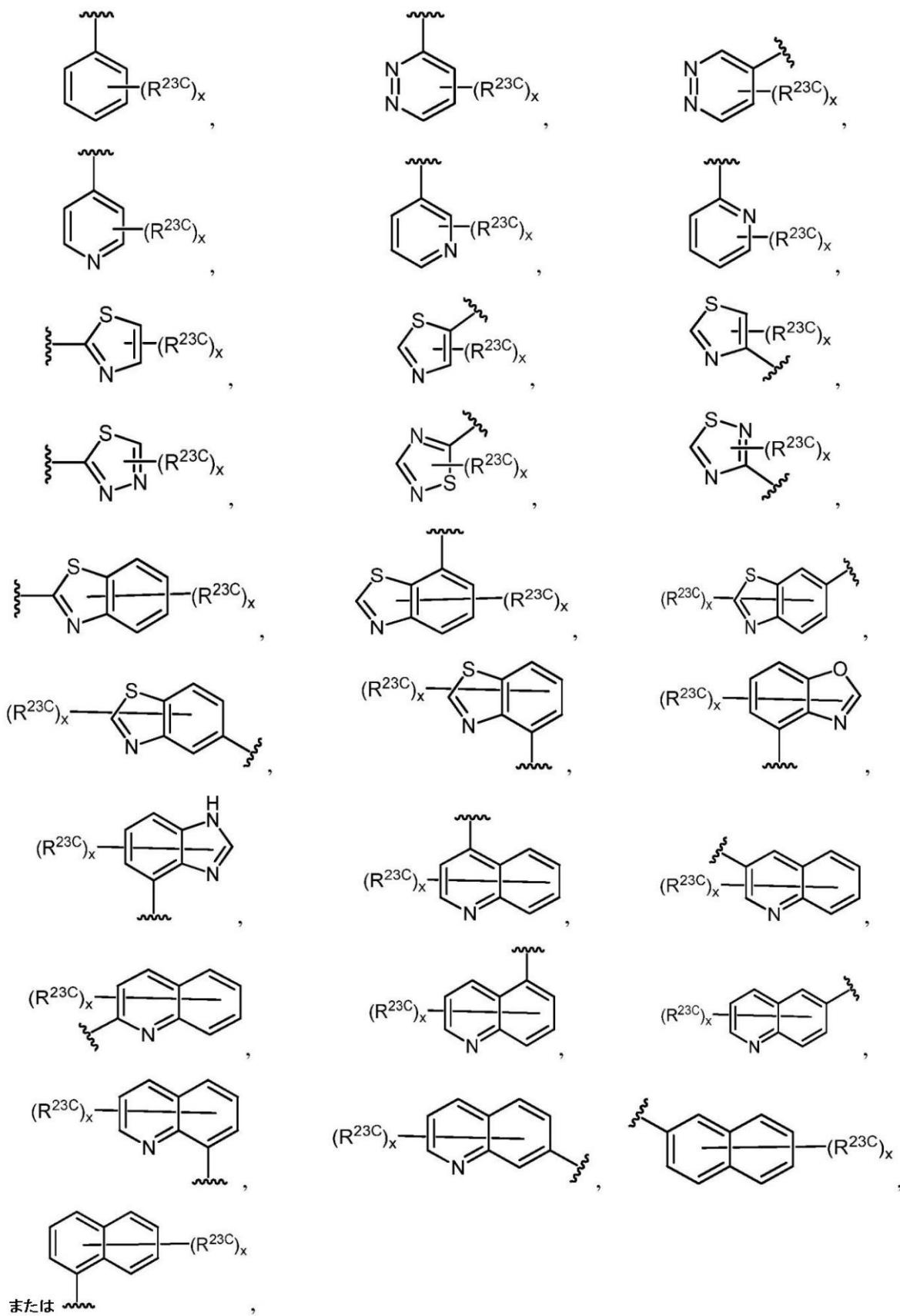
$CR^{2,3}C$ は水素、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、および任意置換ヘテロアリール、ヒドロキシリル、置換ヒドロキシリル、アミノ、置換アミノ、チオール、置換チオール、またはカルボニルである、

請求項6に記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項10】

$R^{2,3}$ が式

【化19】



であり、 $x$ が0、1、または2である、請求項9に記載の化合物、またはその塩。

【請求項11】

$R^4$ が水素、任意置換 $C_{1\sim 6}$ アルキル、または任意置換 $C_{2\sim 6}$ アルケニルである、

請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 1 2】

$R^4$  が  $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_2C(H)=O$ 、 $-CH_2CH_2N(R^{2-2})_2$ 、または  $-CH_2CH_2NH R^{2-2}$  であり、 $R^{2-2}$  のそれぞれが独立して水素または任意置換アルキルである、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 1 3】

$R^4$  が任意置換アリルまたは無置換アリルである、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 1 4】

$R^4$  が水素、任意置換  $C_{1-6}$  アルキル、または任意置換  $C_{2-6}$  アルケニルであり、 $R^{2-1}$  が水素である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 1 5】

$R^4$  は  $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_2OH$ 、 $-CH_2C(H)=O$ 、 $-CH_2CH_2N(R^{2-2})_2$ 、または  $-CH_2CH_2NH R^{2-2}$  であり、

$R^{2-2}$  のそれぞれは独立して水素または任意置換アルキルであり、 $R^{2-1}$  は水素である

、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 1 6】

$R^4$  は任意置換アリルまたは無置換アリルであり、 $R^{2-1}$  は水素である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 1 7】

$R^{5a}$  および  $R^{5b}$  のそれぞれが独立して水素、任意置換アルキル、またはハロゲンである、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 1 8】

$R^{5a}$  および  $R^{5b}$  が両方とも水素である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 9】

$R^{5a}$  が  $-CH_3$  であり、 $R^{5b}$  が水素である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 2 0】

$R^6$  が任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アラルキル、または任意置換ヘテロアラルキルである、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 2 1】

$R^6$  は任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アラルキル、または任意置換ヘテロアラルキルであり、 $R^{1-0}$  はフッ素である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 2 2】

$R^6$  が任意置換ピラゾリルアルキル、イミダゾリルアルキル、チアゾリルアルキル、オキサゾリルアルキル、ピリジニルアルキル、ピリミジニルアルキル、またはピラジニルアルキルである、請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 2 3】

$R^6$  が任意置換ピラゾリルアルキル、イミダゾリルアルキル、チアゾリルアルキル、オキサゾリルアルキル、ピリジニルアルキル、ピリミジニルアルキル、またはピラジニルアルキルであり、 $R^{1-0}$  がフッ素である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 2 4】

$R^6$  が任意置換アリル、任意置換アリル、または任意置換ベンジルである、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項 25】

$R^6$  が任意置換アリル、任意置換アリル、または任意置換ベンジルであり、 $R^{1-10}$  がフッ素である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 26】

$R^6$  が  $-CH_2CN$  または  $-CH_2C(=O)OR^{3-2}$  であり、 $R^{3-2}$  が水素または任意置換アルキルである、請求項1～10のいずれか1項に記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項 27】

R<sup>7</sup> が任意置換アルキルである、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 28】

R<sup>7</sup> が -CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 29】

R<sup>8</sup>が任意置換アルキルである、請求項1～10のいずれか1項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 30】

R<sup>8</sup> が - C H<sub>3</sub> である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩

### 【請求項 31】

P<sub>1</sub><sup>1</sup> および P<sub>1</sub><sup>2</sup> が水素である。請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、また

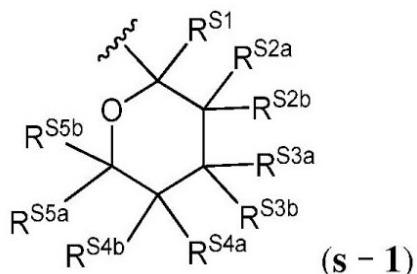
### 【請求項 31】

R<sup>1~8</sup> および R<sup>1~9</sup> が水素である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

### 【請求項 3 2】

R<sup>9</sup> が式

【化 2 0】



の基であり、

$R^S_1$ 、 $R^S_2a$ 、 $R^S_2b$ 、 $R^S_3a$ 、 $R^S_3b$ 、 $R^S_4a$ 、 $R^S_4b$ 、 $R^S_5a$ 、  
および $R^S_5b$ のそれぞれが独立して水素、任意置換アルキル、-OR<sup>S0</sup>、-N(R<sup>S<sub>N</sub></sup>)<sub>2</sub>であるか、または $R^S_2a$ または $R^S_2b$ が $R^S_3a$ または $R^S_3b$ と一緒になつて任意置換縮合ヘテロ環式環を形成し得、

$R^{\text{S}O}$  のそれぞれが独立して水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換ヘテロシクリル、または酸素保護基であり、

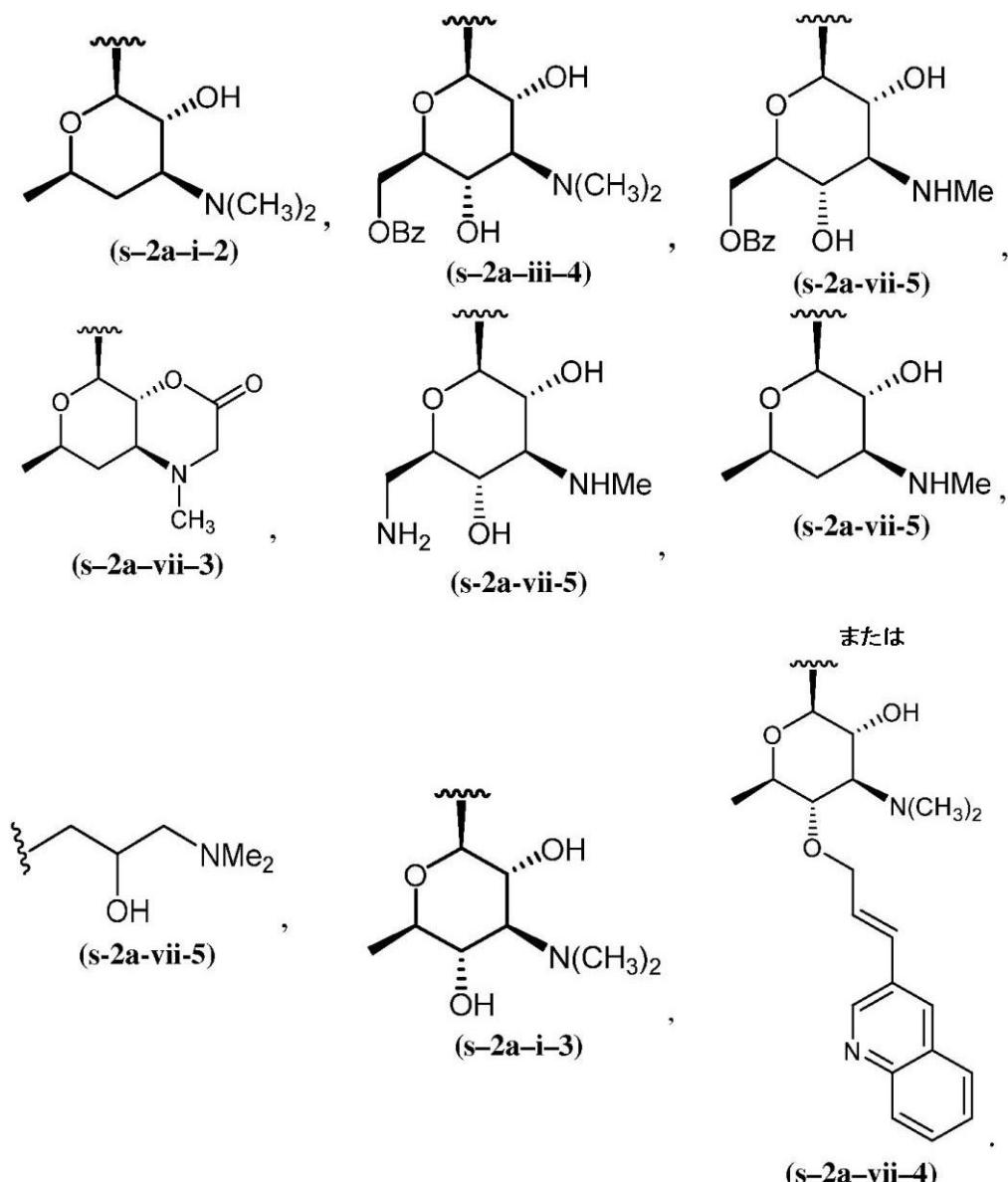
$R^S N$  のそれぞれが独立して水素、任意置換アルキル、または窒素保護基であるか、あるいは任意に 2 つの  $R^S N$  が介在原子と一緒にになってヘテロ環式環を形成する、

請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

### 【請求項 3 3】

R 9 が式

## 【化21】



の基である、請求項1～10のいずれか1項に記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項34】

R<sup>1～4</sup>が水素である、請求項1～10のいずれか1項に記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項35】

R<sup>2～3</sup>が任意置換C<sub>1～6</sub>アルキル、任意置換ハロアルキル、任意置換アラルキル、任意置換C<sub>2～6</sub>アルケニル、または任意置換C<sub>3～6</sub>カルボシクリルである、請求項1～10のいずれか1項に記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項36】

R<sup>2～3</sup>が-C<sub>1</sub>H<sub>3</sub>、-CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH、-CH<sub>2</sub>C(H)=O、-CH<sub>2</sub>C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>N(R<sup>2～2</sup>)<sub>2</sub>、または-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NHR<sup>2～2</sup>である、請求項1～10のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項37】

R<sup>2～3</sup>が任意置換ビニルまたは任意置換アリルである、請求項1～10のいずれか1項に記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項38】

R<sup>Z</sup><sup>3</sup> が無置換ビニルまたは無置換アリルである、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 39】

R<sup>Z</sup><sup>3</sup> が任意置換ベンジルまたは無置換ベンジルである、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 40】

R<sup>Z</sup><sup>3</sup> が一置換ベンジルである、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 41】

R<sup>Z</sup><sup>3</sup> が、ハロゲンの 1 つによって置換されたベンジルである、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

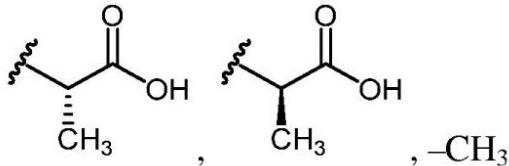
【請求項 42】

R<sup>Z</sup><sup>3</sup> が任意置換シクロプロピルまたは無置換シクロプロピルである、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 43】

R<sup>Z</sup><sup>3</sup> が - C H<sub>2</sub> C H<sub>2</sub> N ( R<sup>2</sup> R<sup>2</sup> )<sub>2</sub> または - C H<sub>2</sub> C H<sub>2</sub> N H R<sup>2</sup> R<sup>2</sup> であり、R<sup>2</sup> のそれぞれが独立して水素、- C H<sub>2</sub> C ( = O ) O H、

【化 22】



である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 44】

R<sup>2</sup><sup>a</sup> が任意置換 C<sub>1</sub> ~ <sub>6</sub> アルキル、任意置換ハロアルキル、またはハロゲンである、請求項 10 に記載の化合物、またはその塩。

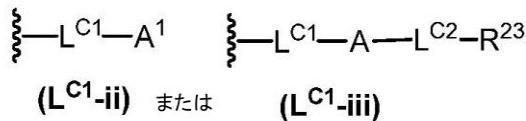
【請求項 45】

R<sup>2</sup><sup>a</sup> が - C H<sub>3</sub>、- C F<sub>3</sub>、または - F である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 46】

R<sup>1</sup><sup>4</sup> が式

【化 23】



の基である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩。

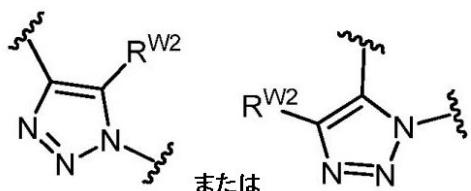
【請求項 47】

A<sup>1</sup> が - N<sub>3</sub> である、請求項 46 に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 48】

A が、

## 【化24】

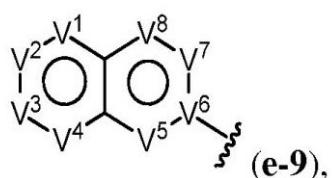
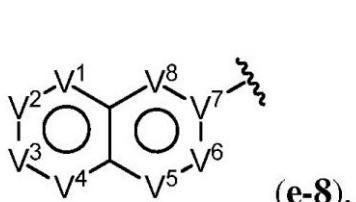
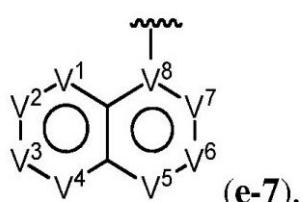
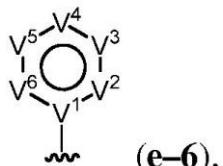
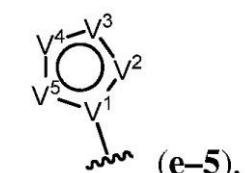
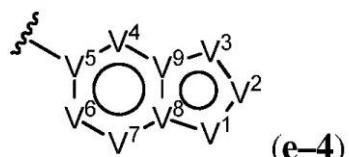
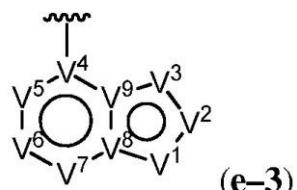
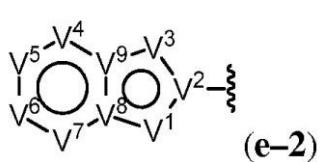
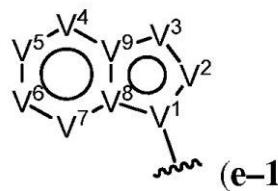


である、請求項4\_6に記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項4\_9】

R<sup>2</sup><sup>3</sup>が式

## 【化25】



であり、

V<sup>1</sup>、V<sup>2</sup>、V<sup>3</sup>、V<sup>4</sup>、V<sup>5</sup>、V<sup>6</sup>、V<sup>7</sup>、V<sup>8</sup>、およびV<sup>9</sup>のそれぞれは、原子価が許す限り独立してO、S、N、NR<sup>2</sup><sup>3</sup>N、C、またはCR<sup>2</sup><sup>3</sup>Cであり得、

R<sup>2</sup><sup>3</sup>Nは独立して水素、任意置換アルキル、任意置換アリール、または窒素保護基であり、

CR<sup>2</sup><sup>3</sup>Cは水素、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、-N<sub>3</sub>、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、

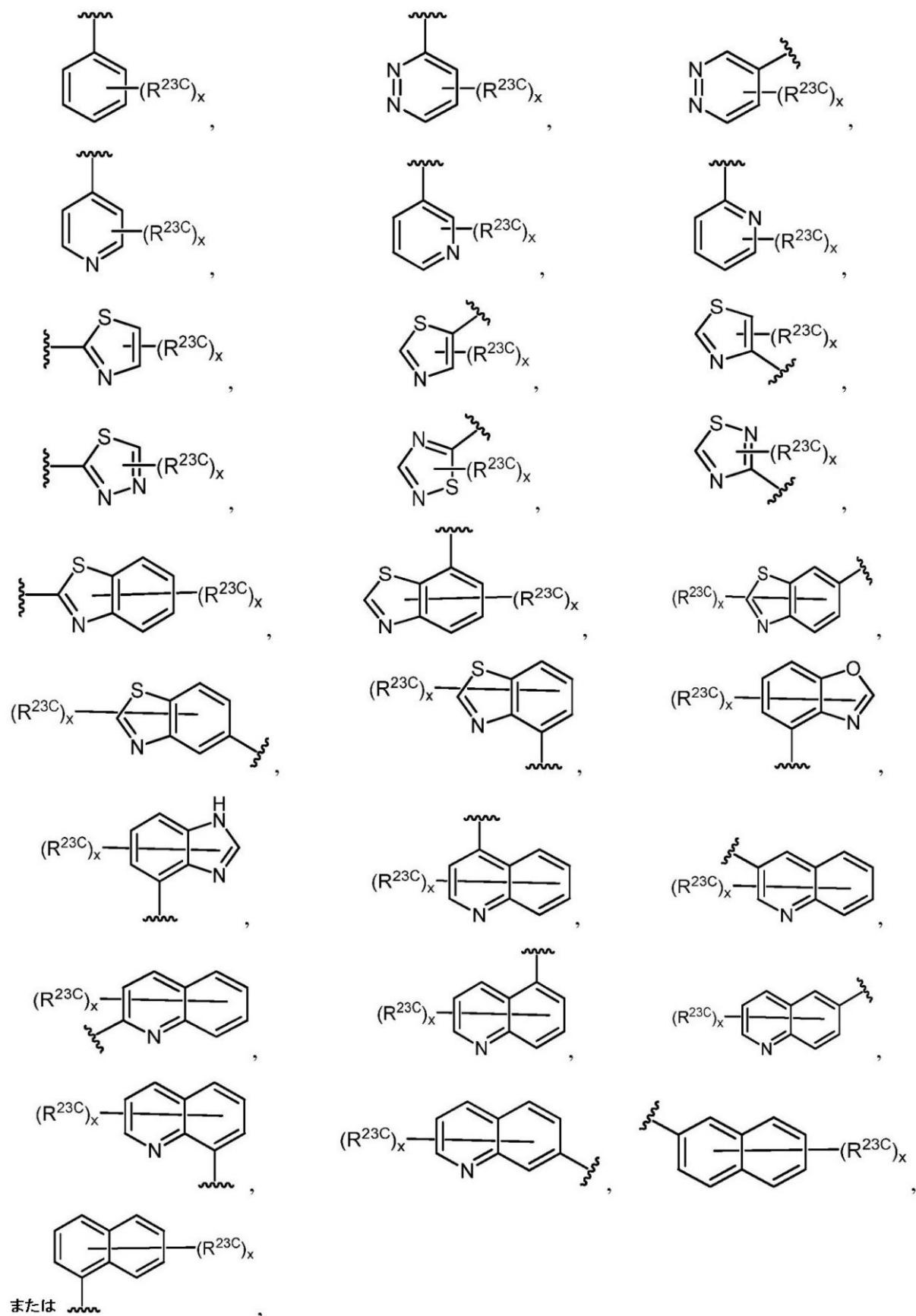
任意置換アリール、および任意置換ヘテロアリール、ヒドロキシリル、置換ヒドロキシリル、アミノ、置換アミノ、チオール、置換チオール、またはカルボニルである、

請求項4\_6に記載の化合物、またはその塩。

【請求項 5\_0】

$R^{2_3}$ が、式

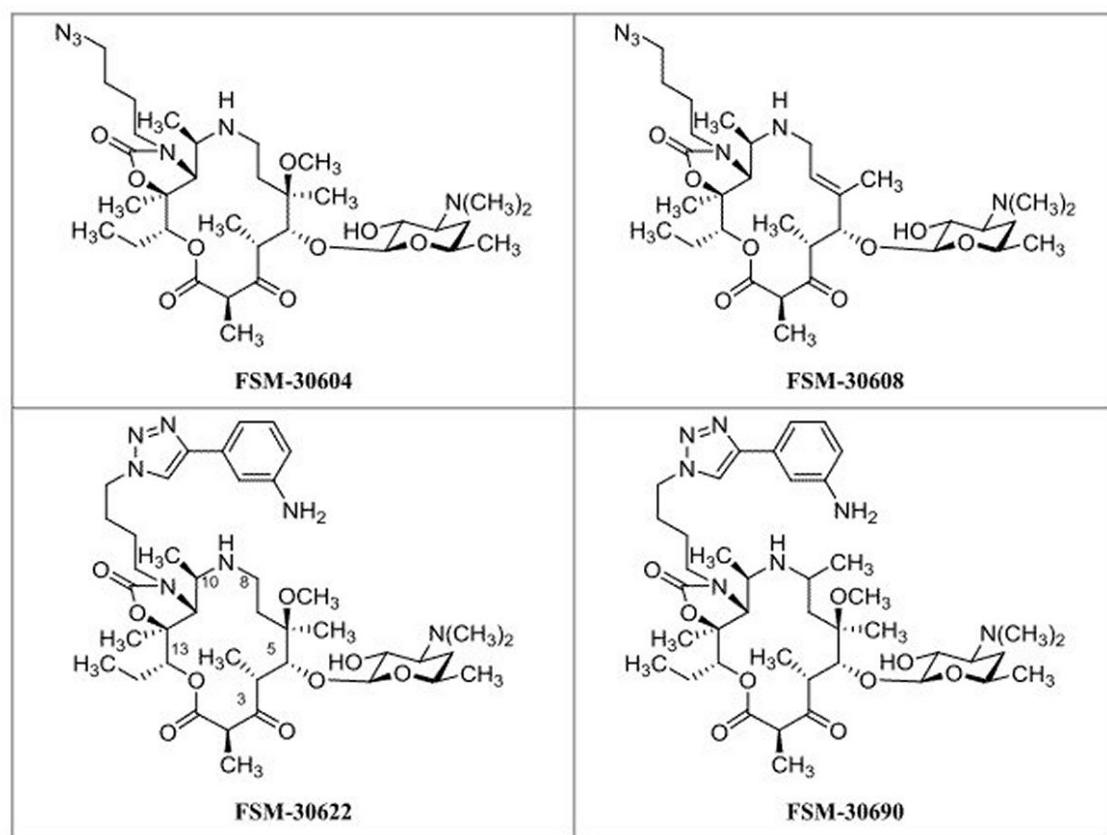
## 【化26】



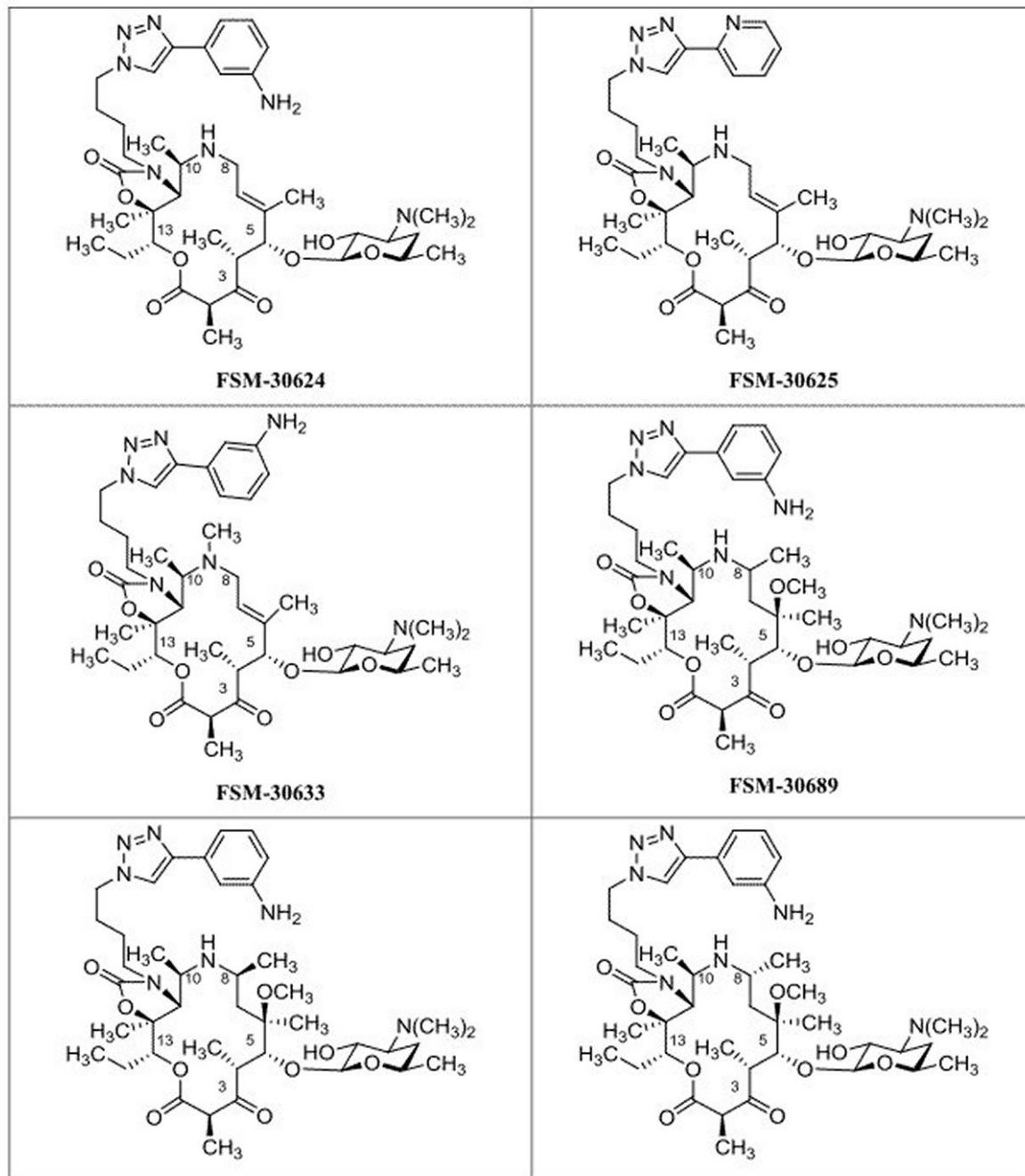
であり、 $n$ が0、1、または2である、請求項49に記載の化合物、またはその塩。

## 【請求項51】

化合物が、  
【化27】



## 【化28】



## 【請求項52】

請求項1～51のいずれか1項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩と医薬的に許容される添加剤とを含む医薬組成物。

## 【請求項53】

その必要がある対象において感染性疾患を処置するための請求項1～52のいずれか1項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩を含む医薬組成物。

## 【請求項54】

感染性疾患が細菌感染である、請求項53に記載の医薬組成物。

## 【請求項55】

細菌感染がグラム陽性細菌による感染である、請求項54に記載の医薬組成物。

## 【請求項56】

細菌感染がグラム陰性細菌による感染である、請求項54に記載の医薬組成物。

## 【請求項57】

細菌感染がStaphylococcus感染、Bacillus感染、Strepococcus感染、Escherichia感染、またはHaemophilus感染である、請求項5 4に記載の医薬組成物。

【請求項 5 8】

感染性疾患が寄生虫感染である、請求項5 4に記載の医薬組成物。

【請求項 5 9】

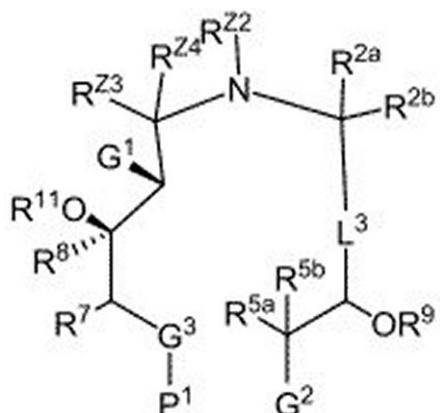
その必要がある対象において感染性状態を処置するための請求項1 ~ 5 2のいずれか1項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩を含む、医薬組成物。

【請求項 6 0】

炎症状態が慢性肺炎症候群である、請求項5 9に記載の医薬組成物。

【請求項 6 1】

【化 2 9】

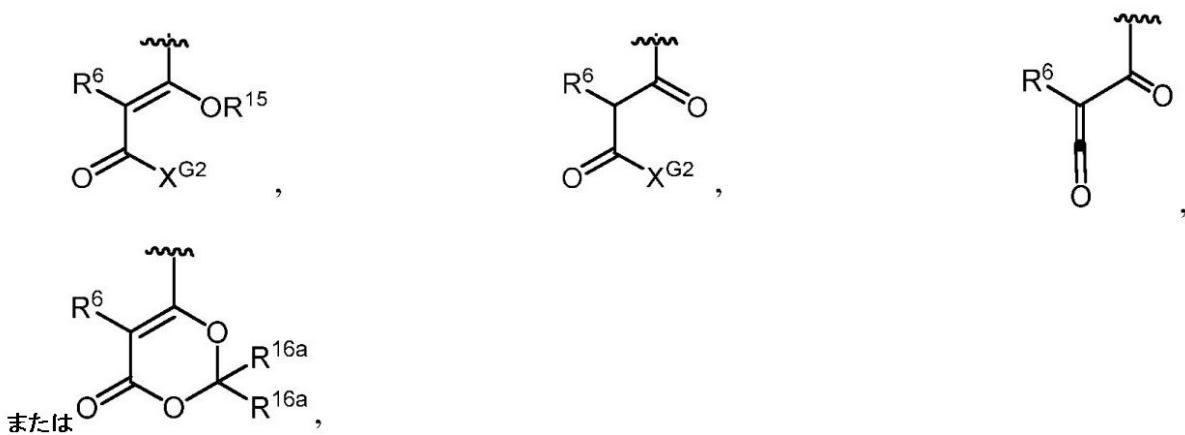


R<sup>Z 3</sup>、R<sup>Z 4</sup>、R<sup>Z 2</sup>、R<sup>2 a</sup>、R<sup>2 b</sup>、G<sup>1</sup>、G<sup>3</sup>、R<sup>1 1</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>5 a</sup>、R<sup>5 b</sup>、R<sup>9</sup>、およびL<sup>3</sup>は請求項1において定義された通りであり、

P<sup>1</sup>は水素、シリル、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、または酸素、窒素、もしくはチオール保護基であり、

G<sup>2</sup>は式

【化 3 0】



の基であり、

X<sup>G 2</sup>のそれぞれは-OR<sup>1 5</sup>、-SR<sup>1 5</sup>、または-N(uR<sup>1 5</sup>)<sub>2</sub>であり、

R<sup>1 5</sup>のそれぞれは独立してシリル、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置

換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリールであるか、または2つのR<sup>1-5</sup>基が一緒になって任意置換ヘテロアリールもしくはヘテロ環式環を形成し得、

R<sup>1-6a</sup>のそれぞれは独立して水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、または任意置換ヘテロアリールである、

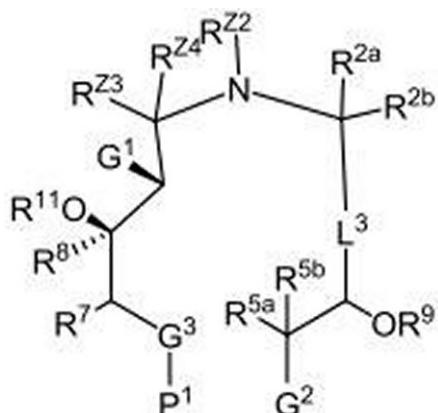
式(C-1)の化合物またはその塩。

【請求項62】

$\frac{R^{Z3}}{R^{5a}}$ 、 $\frac{R^{Z4}}{R^{5b}}$ 、 $R^{Z2}$ 、 $R^2a$ 、 $R^2b$ 、 $G^1$ 、 $G^3$ 、 $R^{1-1}$ 、 $R^8$ 、 $R^7$ 、 $R^6$ 、 $R^9$ 、およびL<sup>3</sup>は請求項1において定義された通りであり、

方法が、

【化31】



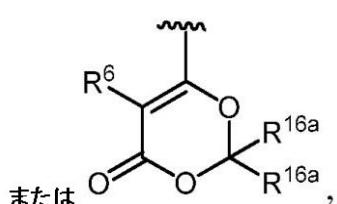
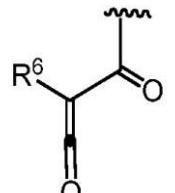
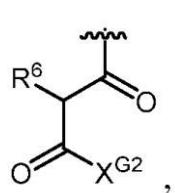
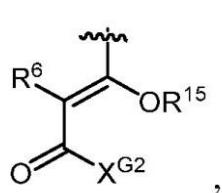
の化合物、

またはその塩を環化することを含み、

P<sup>1</sup>は水素、シリル、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、または酸素、窒素、もしくはチオール保護基であり、

G<sup>2</sup>は式

【化32】



の基であり、

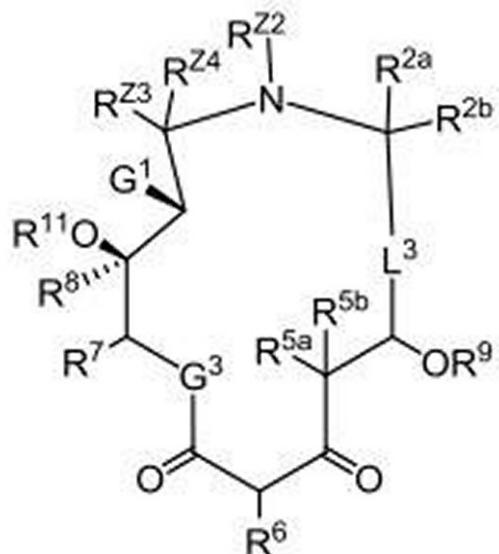
XG<sup>2</sup>のそれぞれが-OR<sup>1-5</sup>、-SR<sup>1-5</sup>、または-N(R<sup>1-5</sup>)<sub>2</sub>であり、

R<sup>1-5</sup>のそれぞれが独立してシリル、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、

任意置換ヘテロアリールであるか、または2つのR<sup>1~5</sup>基が一緒になって任意置換ヘテロアリールもしくはヘテロ環式環を形成し得、

R<sup>1~6a</sup>のそれぞれが独立して水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、または任意置換ヘテロアリールである、

式  
【化33】



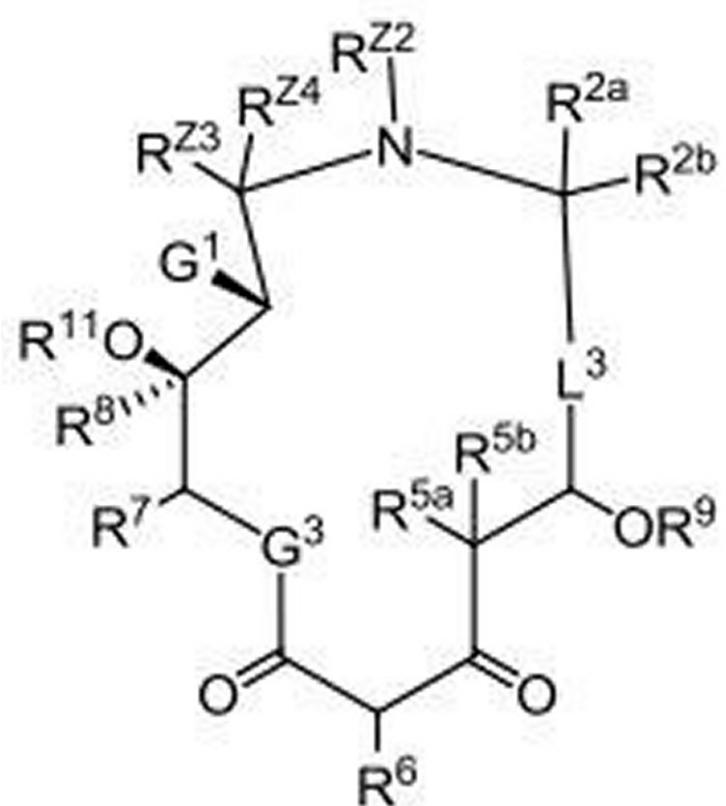
の化合物、

またはその塩を調製する方法。

【請求項63】

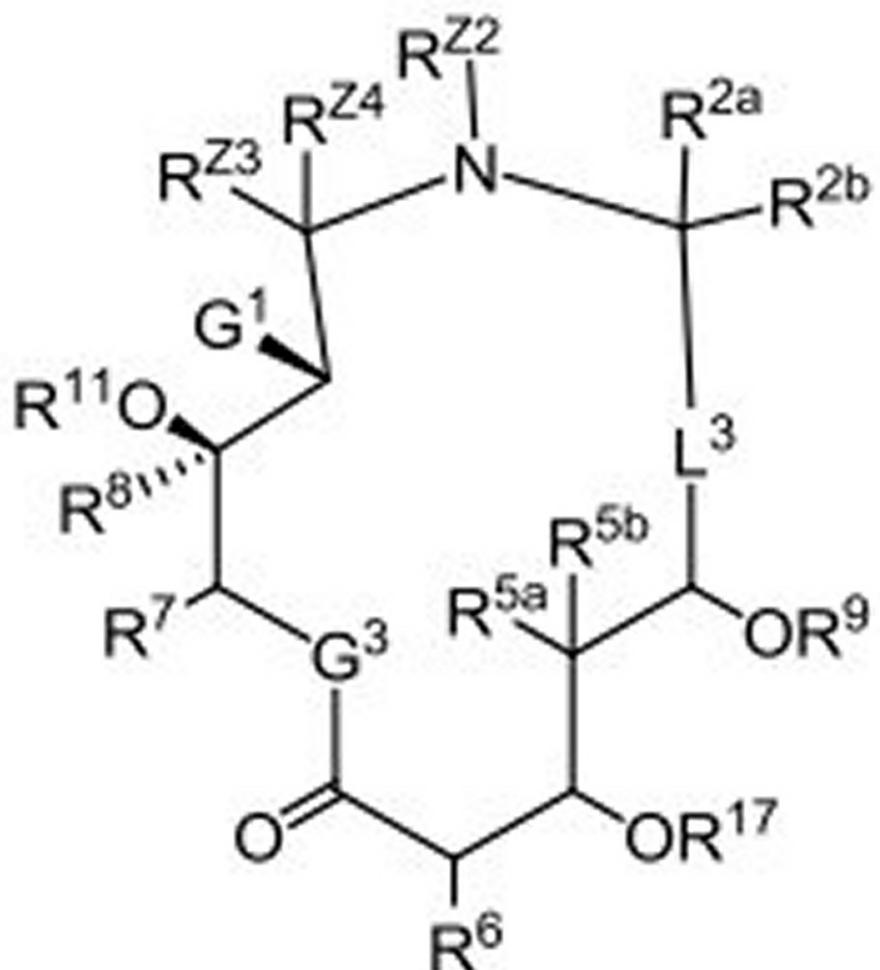
式

【化 3 4】



の化合物またはその塩を還元および任意に保護して、式

【化35】



の化合物またはその塩を提供することをさらに含み、

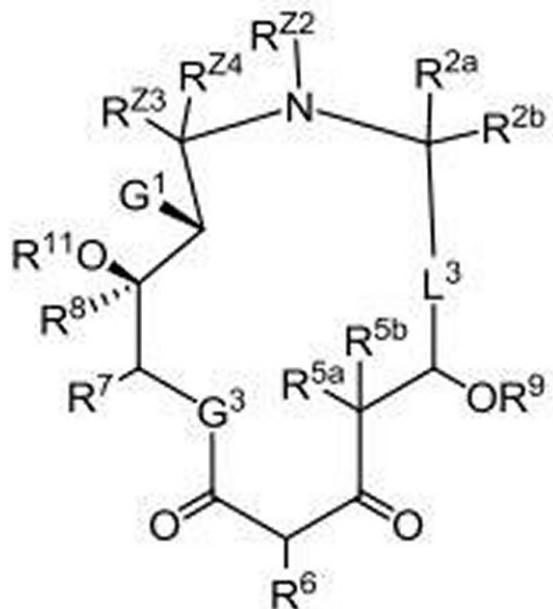
R<sup>1~7</sup>は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、-C(=O)R<sup>Z8</sup>、-C(=O)OR<sup>Z8</sup>、-C(=O)N(R<sup>Z8</sup>)<sub>2</sub>、酸素保護基、または炭水化物である、

請求項6~2に記載の方法。

【請求項6~4】

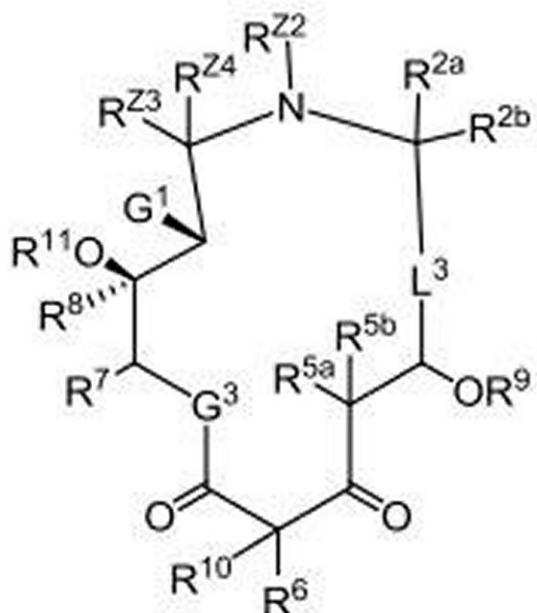
式

【化36】



の化合物またはその塩を、塩基およびアルキル化剤 R<sup>1</sup>⁰ - LG、またはハロゲン化剤を用いて処理して、式

【化37】



またはその塩を提供することをさらに含み、

式中、R<sup>1</sup>⁰ がハロゲン、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、または任意置換ヘテロシクリルである、

請求項 6\_2 に記載の方法。

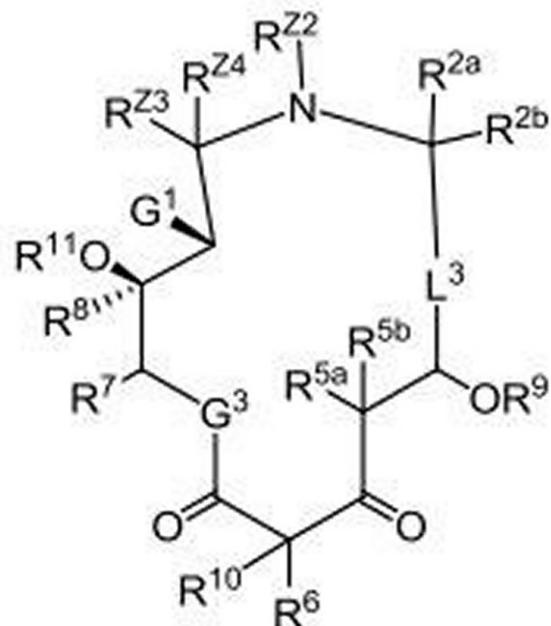
【請求項 6\_5】

G<sup>2</sup> が - OR<sup>1</sup>⁵ である、請求項 6\_2 に記載の方法。

【請求項 6\_6】

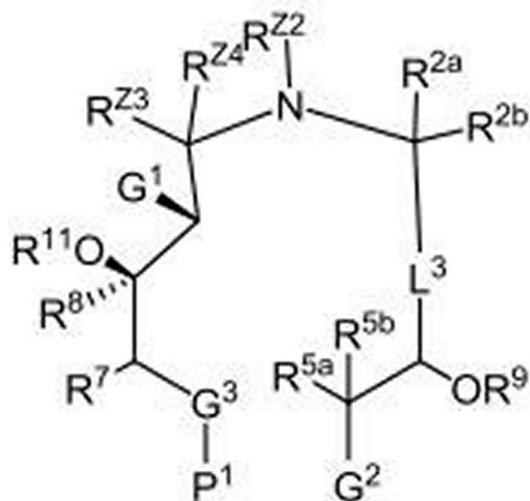
式

## 【化38】



式中、 $R^{Z3}$ 、 $R^{Z4}$ 、 $R^{Z2}$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{2b}$ 、 $G^1$ 、 $G^3$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{10}$ 、 $R^8$ 、 $R^7$ 、 $R^6$ 、 $R^{5a}$ 、 $R^{5b}$ 、 $R^9$ 、および $L^3$ は請求項1において定義された通りである。またはその塩を調製する方法であって、方法が、式

## 【化39】

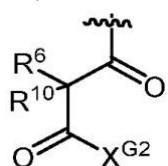


の化合物またはその塩を環化することを含み、

$P^1$ は水素、シリル、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリール、または酸素、窒素、もしくはチオール保護基であり、

$G^2$ は式

## 【化40】

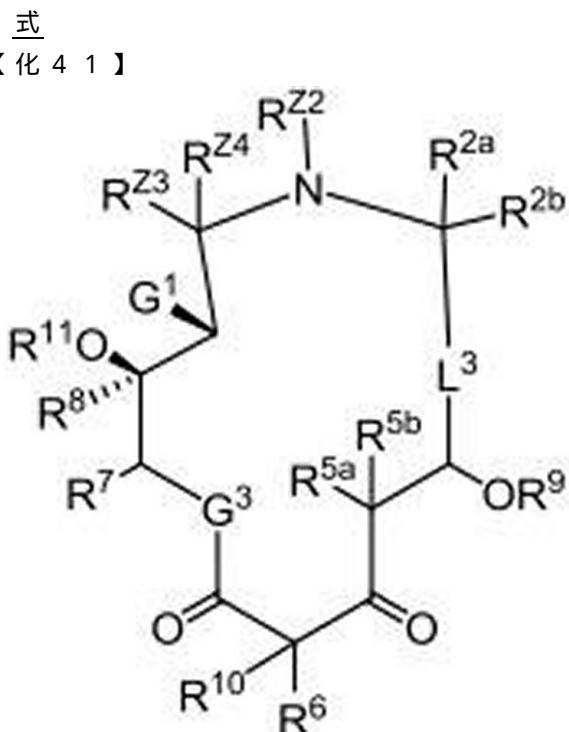


の基であり、

$G^2$  のそれぞれは -OR<sup>1~5</sup>、-SR<sup>1~5</sup>、または -N(R<sup>1~5</sup>)<sub>2</sub> であり、  
R<sup>1~5</sup> のそれぞれは独立してシリル、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリールであるか、または 2 つの R<sup>1~5</sup> 基が一緒になって任意置換ヘテロアリールもしくはヘテロ環式環を形成し得る、

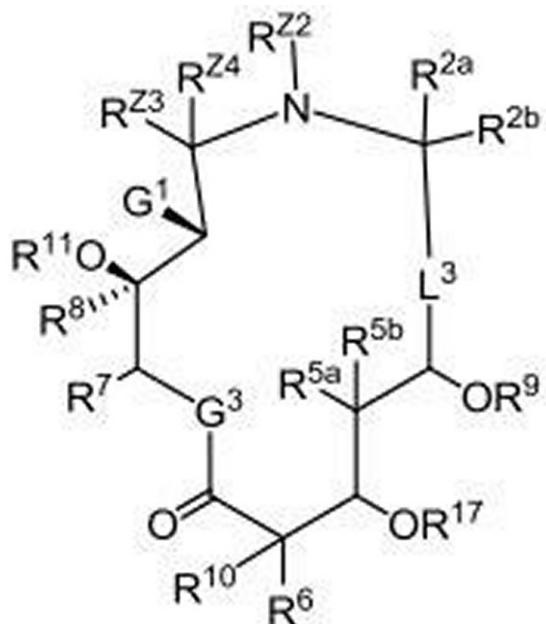
前記方法。

## 【請求項67】



の化合物またはその塩を還元および任意に保護して、式

【化42】



またはその塩を提供することをさらに含み、

R<sup>1~7</sup>は水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロシクリル、任意置換アリール、任意置換ヘテロアリー  
ル、-C(=O)R<sup>Z</sup><sup>8</sup>、-C(=O)OR<sup>Z</sup><sup>8</sup>、-C(=O)N(R<sup>Z</sup><sup>8</sup>)<sub>2</sub>、酸素保  
護基、または炭水化物である、

請求項66に記載の方法。

【請求項68】

G<sup>2</sup>が-OR<sup>1~5</sup>である、請求項66に記載の方法。