

【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 2 年 8 月 6 日 (2020.8.6)

【公表番号】特表 2019-527196 (P2019-527196A)

【公表日】令和 1 年 9 月 26 日 (2019.9.26)

【年通号数】公開・登録公報 2019-039

【出願番号】特願 2018-565257 (P2018-565257)

【国際特許分類】

C 0 7 F 5/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/69 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/06 (2006.01)

A 6 1 P 31/08 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 F 5/02 C S P C

A 6 1 K 31/69

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 31/06

A 6 1 P 31/08

A 6 1 K 45/00

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 6 月 26 日 (2020.6.26)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

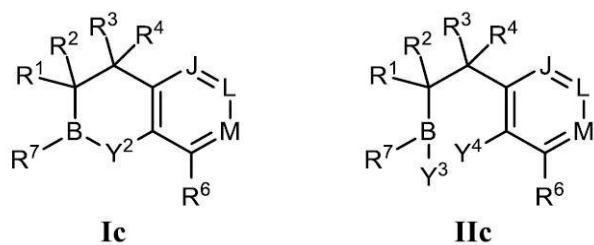
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I c もしくは I I c の構造を有する化合物、またはその薬学的に許容される塩

【化 2 0 1】



[ 式中、R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は、それらが結合する原子と一緒にあって、1 つまたは複数の R<sup>5</sup> によりそれぞれ必要に応じて置換されている、C<sub>3</sub> ~ 7 シクロアルキル、および 3 ~ 10 員のヘテロシクリルからなる群から選択される縮合環または環系を形成し、R<sup>1</sup>、および R<sup>4</sup> のそれぞれは、独立に、H、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 ハロアルキル、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 アルコキシ、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている (C<sub>1</sub> ~ 6 アルコキシ) C<sub>1</sub>

～<sub>6</sub> アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>2</sub>～<sub>10</sub> アルケニル、必要に応じて置換されている C<sub>2</sub>～<sub>10</sub> アルキニル、必要に応じて置換されている C<sub>3</sub>～<sub>7</sub> カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3～10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている C<sub>6</sub>～<sub>10</sub> アリール、必要に応じて置換されている 5～10 員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている (C<sub>3</sub>～<sub>7</sub> カルボシクリル) C<sub>1</sub>～<sub>6</sub> アルキル、必要に応じて置換されている (3～10 員のヘテロシクリル) C<sub>1</sub>～<sub>6</sub> アルキル、必要に応じて置換されている (C<sub>6</sub>～<sub>10</sub> アリール) C<sub>1</sub>～<sub>6</sub> アルキル、(C<sub>6</sub>～<sub>10</sub> アリール) C<sub>1</sub>～<sub>6</sub> アルコキシ、必要に応じて置換されている (5～10 員のヘテロアリール) C<sub>1</sub>～<sub>6</sub> アルキル、アシル、C - カルボキシ、O - カルボキシ、C - アミド、N - アミド、S - スルホンアミド、N - スルホンアミド、-SR<sup>c</sup>、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>～<sub>3</sub> SR<sup>c</sup>、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>～<sub>3</sub> R<sup>d</sup>、-NR<sup>f</sup>C(O)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-C(=NR<sup>e</sup>)R<sup>c</sup>、-C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>CR<sup>c</sup>(=NR<sup>e</sup>)、-NR<sup>f</sup>C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-S(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>～<sub>3</sub> R<sup>c</sup>、および -NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>OR<sup>d</sup> からなる群から選択されるか、あるいは

R<sup>5</sup> は、-Y<sup>5</sup>-(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>-G であり、

t は、0 または 1 の整数であり、

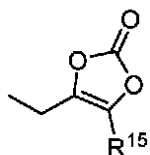
G は、H、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub>～<sub>6</sub> アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub>～<sub>6</sub> ハロアルキル、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub>～<sub>6</sub> アルコキシ、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub>～<sub>6</sub> ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている (C<sub>1</sub>～<sub>6</sub> アルコキシ) C<sub>1</sub>～<sub>6</sub> アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>2</sub>～<sub>10</sub> アルケニル、必要に応じて置換されている C<sub>2</sub>～<sub>10</sub> アルキニル、必要に応じて置換されている C<sub>3</sub>～<sub>7</sub> カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3～10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている C<sub>6</sub>～<sub>10</sub> アリール、必要に応じて置換されている 5～10 員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている (C<sub>3</sub>～<sub>7</sub> カルボシクリル) C<sub>1</sub>～<sub>6</sub> アルキル、必要に応じて置換されている (3～10 員のヘテロシクリル) C<sub>1</sub>～<sub>6</sub> アルキル、必要に応じて置換されている (C<sub>6</sub>～<sub>10</sub> アリール) C<sub>1</sub>～<sub>6</sub> アルキル、(C<sub>6</sub>～<sub>10</sub> アリール) C<sub>1</sub>～<sub>6</sub> アルコキシ、必要に応じて置換されている (5～10 員のヘテロアリール) C<sub>1</sub>～<sub>6</sub> アルキル、アシル、C - カルボキシ、O - カルボキシ、C - アミド、N - アミド、S - スルホンアミド、N - スルホンアミド、-SR<sup>c</sup>、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub>～<sub>3</sub> SR<sup>c</sup>、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>～<sub>3</sub> R<sup>d</sup>、-NR<sup>f</sup>C(O)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-C(=NR<sup>e</sup>)R<sup>c</sup>、-C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>CR<sup>c</sup>(=NR<sup>e</sup>)、-NR<sup>f</sup>C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-S(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>～<sub>3</sub> R<sup>c</sup>、および -NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>OR<sup>d</sup> からなる群から選択され、

各 J、L、M は、独立に、CR<sup>1 2</sup> または N (窒素) であり、

R<sup>6</sup> は、-C(O)OR、およびカルボン酸イソスターからなる群から選択され、

R は、H、C<sub>1</sub>～<sub>9</sub> アルキル、-CR<sup>1 0</sup>R<sup>1 1</sup>OC(O)C<sub>1</sub>～<sub>9</sub> アルキル、-CR<sup>1 0</sup>R<sup>1 1</sup>OC(O)C<sub>3</sub>～<sub>7</sub> カルボシクリル、-CR<sup>1 0</sup>R<sup>1 1</sup>OC(O)(3～7 員のヘテロシクリル)、-CR<sup>1 0</sup>R<sup>1 1</sup>OC(O)C<sub>2</sub>～<sub>8</sub> アルコキシアルキル、-CR<sup>1 0</sup>R<sup>1 1</sup>OC(O)OC<sub>1</sub>～<sub>9</sub> アルキル、-CR<sup>1 0</sup>R<sup>1 1</sup>OC(O)OC<sub>3</sub>～<sub>7</sub> カルボシクリル、-CR<sup>1 0</sup>R<sup>1 1</sup>OC(O)O(3～7 員のヘテロシクリル)、-CR<sup>1 0</sup>R<sup>1 1</sup>OC(O)OC<sub>2</sub>～<sub>8</sub> アルコキシアルキル、-CR<sup>1 0</sup>R<sup>1 1</sup>OC(O)C<sub>6</sub>～<sub>10</sub> アリール、-CR<sup>1 0</sup>R<sup>1 1</sup>OC(O)OC<sub>6</sub>～<sub>10</sub> アリール、-CR<sup>1 0</sup>R<sup>1 1</sup>C(O)NR<sup>1 3</sup>R<sup>1 4</sup>、-CR<sup>1 0</sup>R<sup>1 1</sup>OC(O)O(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>～<sub>3</sub>C(O)NR<sup>1 3</sup>R<sup>1 4</sup>、-CR<sup>1 0</sup>R<sup>1 1</sup>OC(O)O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>～<sub>3</sub>OC(O)C<sub>1</sub>～<sub>4</sub> アルキル、-CR<sup>1 0</sup>R<sup>1 1</sup>OC(O)O(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>～<sub>3</sub>C(O)OC<sub>1</sub>～<sub>4</sub> アルキル、-CR<sup>1 0</sup>R<sup>1 1</sup>OC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub>～<sub>3</sub>OC(O)C<sub>1</sub>～<sub>4</sub> アルキル、および

## 【化 1 3 0】



からなる群から選択され、

R<sup>7</sup> は、-OH、および必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 アルコキシからなる群から選択され、

各 R<sup>10</sup> および R<sup>11</sup> は、独立に、H、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>3</sub> ~ 7 カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている C<sub>6</sub> ~ 10 アリール、および必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択され、

R<sup>12</sup> は、水素、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 ハロアルキル、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 アルコキシ、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている (C<sub>1</sub> ~ 6 アルコキシ) C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>2</sub> ~ 10 アルケニル、必要に応じて置換されている C<sub>2</sub> ~ 10 アルキニル、必要に応じて置換されている C<sub>3</sub> ~ 7 カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている C<sub>6</sub> ~ 10 アリール、必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている (C<sub>3</sub> ~ 7 カルボシクリル) C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、必要に応じて置換されている (3 ~ 10 員のヘテロシクリル) C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、必要に応じて置換されている (C<sub>6</sub> ~ 10 アリール) C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、(C<sub>6</sub> ~ 10 アリール) C<sub>1</sub> ~ 6 アルコキシ、必要に応じて置換されている (5 ~ 10 員のヘテロアリール) C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、アシル、C-カルボキシ、O-カルボキシ、C-アミド、N-アミド、S-スルホンアミド、N-スルホンアミド、スルフヒドリル、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub> ~ 3 SR<sup>c</sup>、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub> ~ 3 R<sup>d</sup>、-NR<sup>f</sup>C(O)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-C(=NR<sup>e</sup>)R<sup>c</sup>、-C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>CR<sup>c</sup>(=NR<sup>e</sup>)、-NR<sup>f</sup>C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-S(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub> ~ 3 R<sup>c</sup>、-NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>OR<sup>d</sup>、および -(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-Y<sup>6</sup>-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>K からなる群から選択され、

各 R<sup>13</sup> および R<sup>14</sup> は、独立に、H、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>3</sub> ~ 7 カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている C<sub>6</sub> ~ 10 アリール、および必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択され、

R<sup>15</sup> は、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 アルキルであり、

Y<sup>2</sup> は、-O-、または-S-であり、

Y<sup>3</sup> は、-OH、または-SHであり、

Y<sup>4</sup> は、-OH、および必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 アルコキシからなる群から選択され、

Y<sup>5</sup> は存在せず、

Y<sup>6</sup> は、-S-、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、-O-、-CR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>-、および-NR<sup>f</sup>-からなる群から選択され、

K は、C-アミド；N-アミド；S-スルホンアミド；N-スルホンアミド；-NR<sup>f</sup>C(O)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>；-NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>；-C(=NR<sup>e</sup>)R<sup>c</sup>；-C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>；-NR<sup>f</sup>CR<sup>c</sup>(=NR<sup>e</sup>)；-NR<sup>f</sup>C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>；C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ、アミノ、ハロゲン、C-アミドおよびN-アミドからなる群から選択される 0 ~ 2 個の置換基により必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル；C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ、アミノ、ハロゲン、C-アミドおよびN-アミドから

なる群から選択される 0 ~ 2 個の置換基により必要に応じて置換されている C<sub>6</sub> ~ 10 アリール；C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ、アミノ、ハロゲン、C - アミドおよび N - アミドからなる群から選択される 0 ~ 2 個の置換基により必要に応じて置換されている C<sub>3</sub> ~ 7 カルボシクリル；C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ、アミノ、ハロゲン、C - アミドおよび N - アミドからなる群から選択される 0 ~ 2 個の置換基により必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリール；ならびに C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ、アミノ、ハロゲン、C - アミドおよび N - アミドからなる群から選択される 0 ~ 2 個の置換基により必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリルからなる群から選択され、

各 R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>f</sup>、および R<sup>g</sup> は、独立に、H、ハロゲン、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>3</sub> ~ 7 カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている C<sub>6</sub> ~ 10 アリール、および必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択され、

各 p および q は、独立に、0 または 1 である ]。

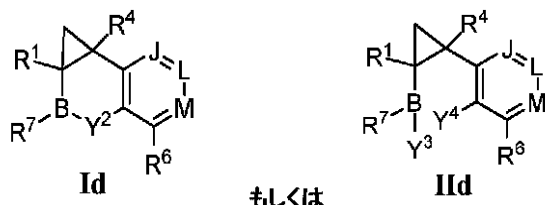
【請求項 2】

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> が、それらが結合する原子と一緒に、1 つまたは複数の R<sup>5</sup> により必要に応じて置換されている C<sub>3</sub> ~ 7 シクロアルキルを形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

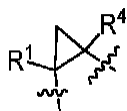
式 I d もしくは I I d の構造を有する、請求項 2 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

【化 1 3 7】



[ 式中、シクロプロピル部分

【化 1 3 8】

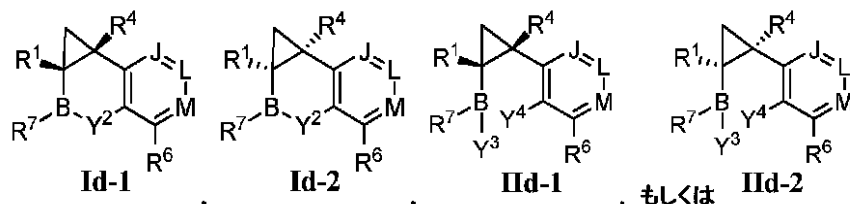


は、1 つまたは複数の R<sup>5</sup> により必要に応じて置換されている ]。

【請求項 4】

式 I d - 1、I d - 2、I I d - 1 もしくは I I d - 2 の構造を有する、請求項 3 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

【化 1 3 9】



。

## 【請求項 5】

各 J、L および M が、 $CR^{12}$  である、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の化合物

。

## 【請求項 6】

各  $R^{12}$  が、独立に、水素、ハロゲン、 $C_{1-6}$  アルコキシ、または  $C_{1-6}$  ハロアルコキシである、請求項 5 に記載の化合物。

## 【請求項 7】

J、L および M の少なくとも 1 つが、N である、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 8】

M が、N である、請求項 7 に記載の化合物。

## 【請求項 9】

$R^1$  が、水素または  $C_{1-6}$  ヒドロキシアルキルである、請求項 1 から 8 のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 10】

$R^4$  が、水素である、請求項 1 から 9 のいずれか一項に記載の化合物。

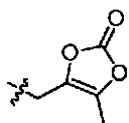
## 【請求項 11】

$R^6$  が、 $-C(O)OR$  である、請求項 1 から 10 のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 12】

R が、H、 $C_{1-9}$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_{1-9}$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{1-9}$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_{6-10}$  アリール、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{6-10}$  アリール、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_{3-7}$  カルボシクリル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{3-7}$  カルボシクリル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)(3\sim7$  員のヘテロシクリル)、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)O(3\sim7$  員のヘテロシクリル)、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_{2-8}$  アルコキシアルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{2-8}$  アルコキシアルキル、または

## 【化 131】



である、請求項 11 に記載の化合物。

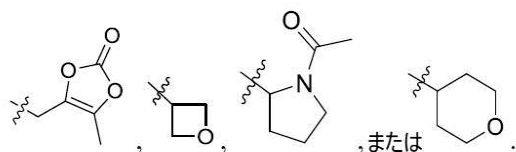
## 【請求項 13】

R が、H である、請求項 12 に記載の化合物。

## 【請求項 14】

R の前記 3～7 員のヘテロシクリルが、

## 【化 202】



である、請求項 12 に記載の化合物。

## 【請求項 15】

R が、 $-CR^{10}R^{11}C(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)O(C(H_2))_{1-3}C(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)O(CH_2)_{2-3}OC(O)C_{1-4}$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)(CH_2)_{1-3}OC(O)$

$C_{1 \sim 4}$  アルキル、または  $-CR^{10}R^{11}OC(O)O(CH_2)_{1 \sim 3}C(O)OC_{1 \sim 4}$  アルキルである、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 16】

$R^{10}$  および  $R^{11}$  の少なくとも 1 つが、H である、請求項 12 または 15 に記載の化合物。

【請求項 17】

$R^{10}$  および  $R^{11}$  の両方が、H である、請求項 12 または 15 に記載の化合物。

【請求項 18】

$R^7$  が、 $-OH$  である、請求項 1 から 17 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 19】

$Y^2$  が、 $-O-$  である、請求項 1 から 18 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 20】

$Y^3$  が、 $-OH$  である、請求項 1 から 18 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 21】

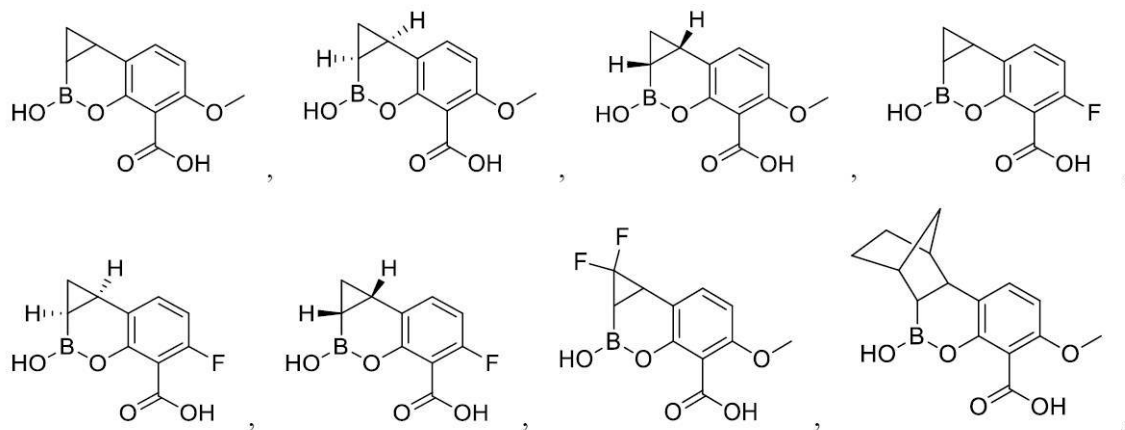
$Y^4$  が、 $-OH$  である、請求項 1 から 18 および 20 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 22】

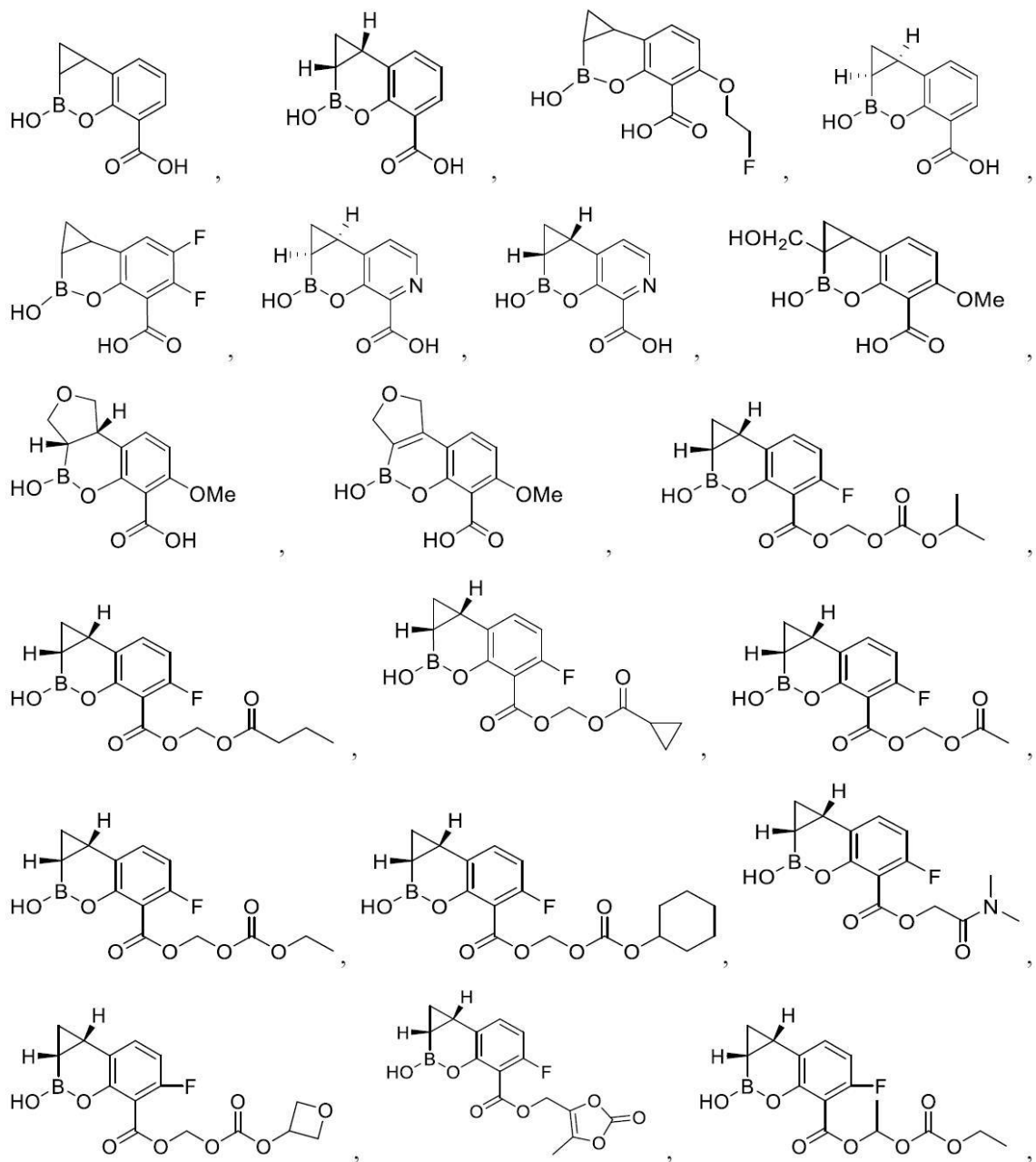
$t$  が、0 であり、 $R^5$  が、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1 \sim 6}$  アルコキシ、アシル、 $C$ -カルボキシ、 $C$ -アミド、 $N$ -アミド、 $N$ -スルホンアミド、 $-SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{0 \sim 3}SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{1 \sim 3}R^d$ 、 $-NR^fC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^fS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-C(=NR^e)R^c$ 、 $-C(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-NR^fCR^c(=NR^e)$ 、 $-NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-S(O)(CH_2)_{1 \sim 3}R^c$ 、および  $-NR^fS(O)_2NR^fOR^d$  からなる群から選択される、請求項 1 から 21 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 23】

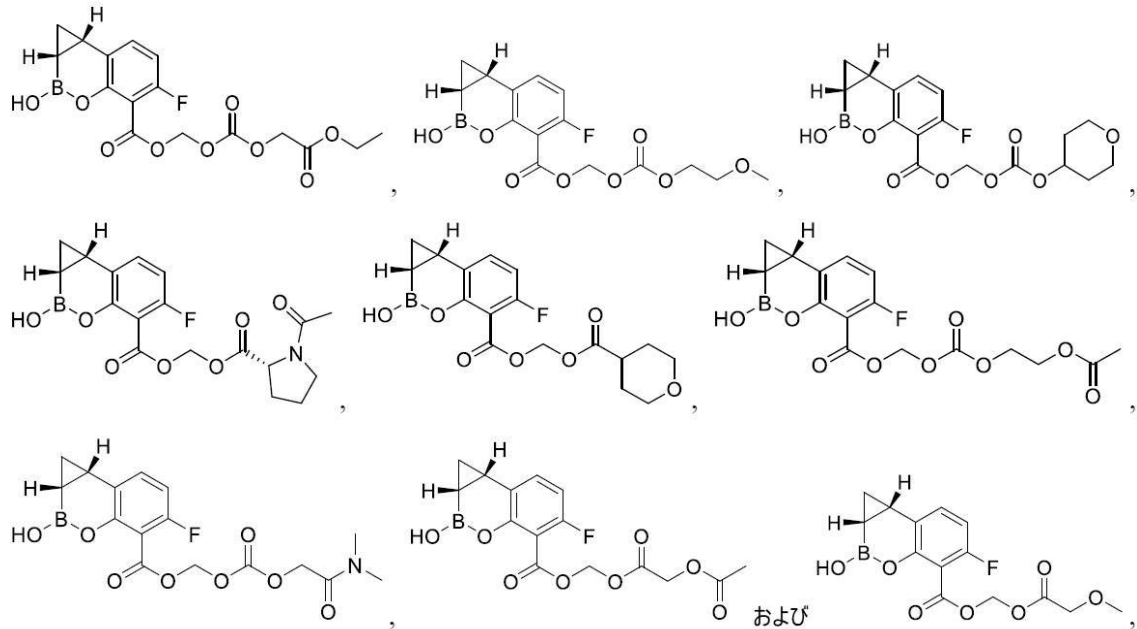
【化 203】



【化 2 0 4】



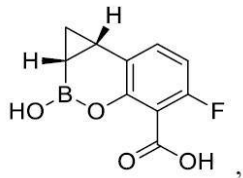
## 【化 2 0 5】



からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物、およびその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 2 4】

## 【化 2 0 6】



の構造を有する化合物、またはその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 2 5】

前記薬学的に許容される塩が、アルカリ金属塩、ナトリウム塩またはアンモニウム塩である、請求項 1 から 2 4 のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項 2 6】

治療有効量の請求項 1 から 2 5 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、および薬学的に許容される賦形剤を含む、医薬組成物。

## 【請求項 2 7】

\_\_\_\_ - ラクタム抗菌剤をさらに含む、請求項 2 6 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 8】

前記 \_\_\_\_ - ラクタム抗菌剤が、メロペネム、またはその薬学的に許容される塩である、請求項 2 7 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 9】

前記 \_\_\_\_ - ラクタム抗菌剤が、セフチブテン、またはその薬学的に許容される塩である、請求項 2 7 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 0】

\_\_\_\_ - ラクタム抗菌剤耐性 *Enterobacteriaceae* によって引き起こされる細菌感染の処置において使用するための、請求項 1 から 2 5 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩を含む、組成物。

## 【請求項 3 1】

前記組成物が、\_\_\_\_ - ラクタム抗菌剤と組み合わせて使用される、請求項 3 0 に記載の組



成物。

【請求項 3 2】

前記 - ラクタム抗菌剤が、メロペネム、またはセフチブテンまたはその薬学的に許容される塩である、請求項 3 0 または 3 1 に記載の組成物。

【請求項 3 3】

前記 - ラクタム抗菌剤が、前記組成物とは個別に投与するためである、請求項 3 1 または 3 2 に記載の組成物。

【請求項 3 4】

前記 - ラクタム抗菌剤および前記化合物、またはそれらの薬学的に許容される塩が、単一剤形である、請求項 3 1 または 3 2 に記載の組成物。

【請求項 3 5】

請求項 1 から 2 5 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、および - ラクタム抗菌剤耐性 Enterobacteriaceae によって引き起こされる細菌感染の処置において使用するための - ラクタム抗菌剤を含む、医薬組成物。

【請求項 3 6】

前記 - ラクタム抗菌剤が、メロペネム、またはその薬学的に許容される塩である、請求項 3 5 に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 3 7】

前記 - ラクタム抗菌剤が、セフチブテン、またはその薬学的に許容される塩である、請求項 3 5 に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 3 8】

前記 - ラクタム抗菌剤が、前記化合物、またはその薬学的に許容される塩とは個別に投与される、請求項 3 5 から 3 7 のいずれか一項に記載の使用のための医薬組成物。

【請求項 3 9】

前記 - ラクタム抗菌剤および前記化合物、またはそれらの薬学的に許容される塩が、単一剤形である、請求項 3 5 から 3 7 のいずれか一項に記載の使用のための医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 1 6

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 1 6】

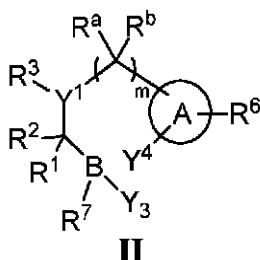
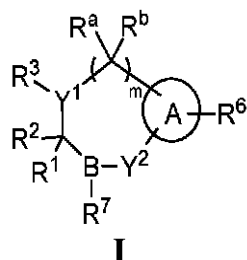
本明細書に記載される一部の追加の実施形態は、本明細書に記載される式 I、I I、I I I、I V、V または V I の構造を有する化合物、またはその薬学的に許容される塩を、それを必要とする被験体に投与するステップを含む、細菌感染を処置する方法に関する。一部の実施形態では、この方法は、被験体に追加の医薬を投与するステップをさらに含み、例えば、追加の医薬は、抗菌剤、抗真菌剤、抗ウイルス剤、抗炎症剤、または抗アレルギー剤から選択することができる。

本発明は、例えば、以下の項目を提供する。

(項目 1)

式 I もしくは I I の構造を有する化合物、またはその薬学的に許容される塩

## 【化 1 2 9】



[ 式中、

$Y^1$  は、N または  $CR^4$  であり、

$m$  は、0 または 1 の整数であり、

( a )

$R^2$  および  $R^3$  は、それらが結合する原子と一緒に、1 つまたは複数の  $R^5$  によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_{3-7}$  カルボシクリル、3 ~ 10 員のヘテロシクリル、 $C_{6-10}$  アリールおよび 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択される縮合環または環系を形成し、

$R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^a$ 、および  $R^b$  のそれぞれは、独立に、H、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている ( $C_{1-6}$  アルコキシ)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている ( $C_{3-7}$  カルボシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている (3 ~ 10 員のヘテロシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている ( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキル、( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている (5 ~ 10 員のヘテロアリール)  $C_{1-6}$  アルキル、アシル、C - カルボキシ、O - カルボキシ、C - アミド、N - アミド、S - スルホンアミド、N - スルホンアミド、 $-SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{0-3}SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{1-3}R^d$ 、 $-NR^fC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^fS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-C(=NR^e)R^c$ 、 $-C(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-NR^fCR^c(=NR^e)$ 、 $-NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-S(O)(CH_2)_{1-3}R^c$ 、および  $-NR^fS(O)_2NR^fOR^d$  からなる群から選択されるか、あるいは

( b )

$R^3$  および  $R^4$  は、それらが結合する原子と一緒に、1 つまたは複数の  $R^5$  によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_{3-7}$  カルボシクリルおよび 3 ~ 10 員のヘテロシクリルからなる群から選択されるスピロ環式環または環系を形成し、

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^a$ 、および  $R^b$  のそれぞれは、独立に、H、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている ( $C_{1-6}$  アルコキシ)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている ( $C_{3-7}$  カルボシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている (3 ~ 10 員のヘテロシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている

て置換されている ( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキル、( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている ( $5-10$  員のヘテロアリール)  $C_{1-6}$  アルキル、アシル、 $C$ -カルボキシ、 $O$ -カルボキシ、 $C$ -アミド、 $N$ -アミド、 $S$ -スルホンアミド、 $N$ -スルホンアミド、 $-SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{0-3}SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{1-3}R^d$ 、 $-NR^fC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^fS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-C(=NR^e)R^c$ 、 $-C(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-NR^fCR^c(=NR^e)$ 、 $-NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-S(O)(CH_2)_{1-3}R^c$ 、および  $-NR^fS(O)_2NR^fOR^d$  からなる群から選択されるか、あるいは  
(c)

$R^1$  および  $R^2$  は、それらが結合する原子と一緒に、1つまたは複数の  $R^5$  によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_{3-7}$  カルボシクリルおよび  $3-10$  員のヘテロシクリルからなる群から選択されるスピロ環式環または環系を形成し、  
 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^a$ 、および  $R^b$  のそれぞれは、独立に、 $H$ 、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている ( $C_{1-6}$  アルコキシ)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている  $3-10$  員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、必要に応じて置換されている  $5-10$  員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている ( $C_{3-7}$  カルボシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている ( $3-10$  員のヘテロシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている ( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキル、( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている ( $5-10$  員のヘテロアリール)  $C_{1-6}$  アルキル、アシル、 $C$ -カルボキシ、 $O$ -カルボキシ、 $C$ -アミド、 $N$ -アミド、 $S$ -スルホンアミド、 $N$ -スルホンアミド、 $-SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{0-3}SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{1-3}R^d$ 、 $-NR^fC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^fS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-C(=NR^e)R^c$ 、 $-C(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-NR^fCR^c(=NR^e)$ 、 $-NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-S(O)(CH_2)_{1-3}R^c$ 、および  $-NR^fS(O)_2NR^fOR^d$  からなる群から選択されるか、あるいは  
(d)

$R^a$  および  $R^b$  は、それらが結合する原子と一緒に、1つまたは複数の  $R^5$  によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_{3-7}$  カルボシクリルおよび  $3-10$  員のヘテロシクリルからなる群から選択されるスピロ環式環または環系を形成し、  
 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および  $R^4$  のそれぞれは、独立に、 $H$ 、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている ( $C_{1-6}$  アルコキシ)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている  $3-10$  員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、必要に応じて置換されている  $5-10$  員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている ( $C_{3-7}$  カルボシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている ( $3-10$  員のヘテロシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている ( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキル、( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている ( $5-10$  員のヘテロアリール)  $C_{1-6}$  アルキル、アシル、 $C$ -カルボキシ、 $O$ -カルボキシ、 $C$ -アミド、 $N$ -アミド、 $S$ -スルホンアミド、 $N$ -スルホンアミド、 $-SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{0-3}SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{1-3}R^d$ 、 $-NR^fC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^fS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-C(=NR^e)R^c$ 、 $-C(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-NR^fCR^c(=NR^e)$

$R^e$ )、 $-NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-S(O)(CH_2)_{1-3}R^c$ 、および  
 $-NR^fS(O)_2NR^fOR^d$  からなる群から選択されるか、あるいは

(e)

$R^a$  および  $R^4$  は、それらが結合する原子と一緒にあって、1つまたは複数の  $R^5$  によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_{3-7}$  カルボシクリル、3～10員のヘテロシクリル、 $C_{6-10}$  アリールおよび5～10員のヘテロアリールからなる群から選択される縮合環または環系を形成し、

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および  $R^b$  のそれぞれは、独立に、H、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている ( $C_{1-6}$  アルコキシ)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている3～10員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、必要に応じて置換されている5～10員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている ( $C_{3-7}$  カルボシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている (3～10員のヘテロシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている ( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキル、( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている (5～10員のヘテロアリール)  $C_{1-6}$  アルキル、アシル、C-カルボキシ、O-カルボキシ、C-アミド、N-アミド、S-スルホンアミド、N-スルホンアミド、 $-SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{0-3}SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{1-3}R^d$ 、 $-NR^fC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^fS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-C(=NR^e)R^c$ 、 $-C(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-NR^fCR^c(=NR^e)$ 、 $-NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-S(O)(CH_2)_{1-3}R^c$ 、および  $-NR^fS(O)_2NR^fOR^d$  からなる群から選択され、

$R^5$  は、 $-Y^5-(CH_2)_t-G$  であり、

t は、0 または 1 の整数であり、

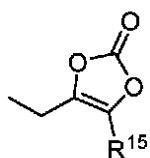
G は、H、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている ( $C_{1-6}$  アルコキシ)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている3～10員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、必要に応じて置換されている5～10員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている ( $C_{3-7}$  カルボシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている (3～10員のヘテロシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている ( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキル、( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている (5～10員のヘテロアリール)  $C_{1-6}$  アルキル、アシル、C-カルボキシ、O-カルボキシ、C-アミド、N-アミド、S-スルホンアミド、N-スルホンアミド、 $-SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{0-3}SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{1-3}R^d$ 、 $-NR^fC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^fS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-C(=NR^e)R^c$ 、 $-C(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-NR^fCR^c(=NR^e)$ 、 $-NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-S(O)(CH_2)_{1-3}R^c$ 、および  $-NR^fS(O)_2NR^fOR^d$  からなる群から選択され、

A は、1つまたは複数の  $R^{1,2}$  によってそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_{3-7}$  カルボシクリル、3～10員のヘテロシクリル、 $C_{6-10}$  アリールおよび5～10員のヘテロアリールからなる群から選択され、 $R^6$  は、H、ハロゲン、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、OH、 $-C(O)OR$ 、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルコキシ、アミノ、 $-N(OR^8)R^9$ 、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキ

ルチオール、C - アミド、S - スルホンアミド、CN、スルフィニル、スルホニル、およびカルボン酸イソスターからなる群から選択され、

R は、H、 $C_{1-9}$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_{1-9}$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_{3-7}$  カルボシクリル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)(3\sim7$  員のヘテロシクリル)、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_{2-8}$  アルコキシアルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{1-9}$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{3-7}$  カルボシクリル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)O(3\sim7$  員のヘテロシクリル)、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{2-8}$  アルコキシアルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_{6-10}$  アリール、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{6-10}$  アリール、 $-CR^{10}R^{11}C(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)O(CH_2)_{1-3}C(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)O(CH_2)_{2-3}OC(O)C_{1-4}$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)O(CH_2)_{1-3}C(O)OC_{1-4}$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)(CH_2)_{1-3}OC(O)C_{1-4}$  アルキル、および

【化130】



からなる群から選択され、

$R^7$  は、 $-OH$ 、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルコキシ、アミノ、および  $-N(OR^8)R^9$  からなる群から選択され、

各  $R^8$  および  $R^9$  は、独立に、H、ハロゲン、必要に応じて置換されている  $C_{1-4}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている  $3\sim10$  員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、および必要に応じて置換されている  $5\sim10$  員のヘテロアリールからなる群から選択され、

各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立に、H、必要に応じて置換されている  $C_{1-4}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている  $3\sim10$  員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、および必要に応じて置換されている  $5\sim10$  員のヘテロアリールからなる群から選択され、

$R^{12}$  は、水素、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている  $(C_{1-6}$  アルコキシ)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている  $3\sim10$  員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、必要に応じて置換されている  $5\sim10$  員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている  $(C_{3-7}$  カルボシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $(3\sim10$  員のヘテロシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $(C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキル、 $(C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $(5\sim10$  員のヘテロアリール)  $C_{1-6}$  アルキル、アシル、C - カルボキシ、O - カルボキシ、C - アミド、N - アミド、S - スルホンアミド、N - スルホンアミド、スルフィドリル、 $-C(O)(CH_2)_{0-3}SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{1-3}R^d$ 、 $-NR^fC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^fS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-C(=NR^e)R^c$ 、 $-C(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-NR^fCR^c(=NR^e)$ 、 $-NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-S(O)(CH_2)_{1-3}R^c$ 、 $-NR^fS(O)_2NR^fOR^d$ 、および  $-(CH_2)_p-Y^6-(CH_2)_q-K$  からなる群から選択され、

各  $R^{13}$  および  $R^{14}$  は、独立に、H、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、

必要に応じて置換されている  $C_3 \sim 7$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている  $3 \sim 10$  員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_6 \sim 10$  アリール、および必要に応じて置換されている  $5 \sim 10$  員のヘテロアリールからなる群から選択され、

$R^{15}$  は、必要に応じて置換されている  $C_1 \sim 6$  アルキルであり、

$Y^2$  は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、および  $-NR^9-$  からなる群から選択され、

$Y^3$  は、 $-OH$ 、 $-SH$ 、および  $-NHR^9$  からなる群から選択され、

$Y^4$  は、 $-OH$ 、必要に応じて置換されている  $C_1 \sim 6$  アルコキシ、アミノ、および  $-N(OR^8)R^9$  からなる群から選択され、

$Y^5$  は、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-O-$ 、 $-CR^fR^g-$ 、および  $-NR^g-$  からなる群から選択されるか、または  $Y^5$  は存在せず、

$Y^6$  は、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-O-$ 、 $-CR^fR^g-$ 、および  $-NR^f-$  からなる群から選択され、

$K$  は、 $C$ -アミド； $N$ -アミド； $S$ -スルホンアミド； $N$ -スルホンアミド； $-NR^fC(O)NR^fR^g$ ； $-NR^fS(O)_2NR^fR^g$ ； $-C(=NR^e)R^c$ ； $-C(=NR^e)NR^fR^g$ ； $-NR^fCR^c(=NR^e)$ ； $-NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ ；

$C_1 \sim 4$  アルコキシ、アミノ、ハロゲン、 $C$ -アミドおよび  $N$ -アミドからなる群から選択される  $0 \sim 2$  個の置換基により必要に応じて置換されている  $C_1 \sim 4$  アルキル； $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、アミノ、ハロゲン、 $C$ -アミドおよび  $N$ -アミドから

なる群から選択される  $0 \sim 2$  個の置換基により必要に応じて置換されている  $C_6 \sim 10$  アリール； $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、アミノ、ハロゲン、 $C$ -アミドおよび

$N$ -アミドからなる群から選択される  $0 \sim 2$  個の置換基により必要に応じて置換されている  $C_3 \sim 7$  カルボシクリル； $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、アミノ、ハロゲン、

$C$ -アミドおよび  $N$ -アミドからなる群から選択される  $0 \sim 2$  個の置換基により必要に

応じて置換されている  $5 \sim 10$  員のヘテロアリール；ならびに  $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、アミノ、ハロゲン、 $C$ -アミドおよび  $N$ -アミドからなる群から選択され

る  $0 \sim 2$  個の置換基により必要に応じて置換されている  $3 \sim 10$  員のヘテロシクリルからなる群から選択され、

各  $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^f$ 、および  $R^g$  は、独立に、 $H$ 、ハロゲン、必要に応じて置換されている  $C_1 \sim 4$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_3 \sim 7$  カルボシクリル、必要に

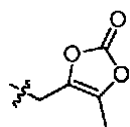
応じて置換されている  $3 \sim 10$  員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_6 \sim 10$  アリール、および必要に応じて置換されている  $5 \sim 10$  員のヘテロアリールからなる群から選択され、

各  $p$  および  $q$  は、独立に、 $0$  または  $1$  である ]。

(項目 2)

$R$  が、 $H$ 、 $C_1 \sim 9$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_1 \sim 9$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_1 \sim 9$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_6 \sim 10$  アリール、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_6 \sim 10$  アリールおよび

【化 131】



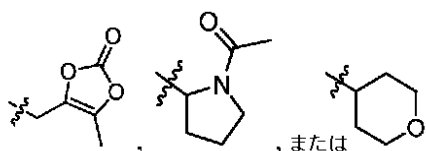
から選択される、項目 1 に記載の化合物。

(項目 3)

$R$  が、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_1 \sim 9$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_3 \sim 7$  カルボシクリル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)(3 \sim 7$  員のヘテロシクリル)、または  $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_2 \sim 8$  アルコキシアルキルである、項目 1 に記載の化合物。

(項目 4)

R の前記 3 ~ 7 員のヘテロシクリルが、  
【化 1 3 2】



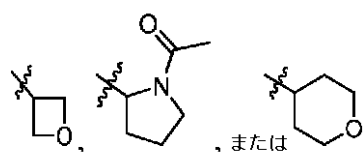
である、項目 3 に記載の化合物。

(項目 5)

R が、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{1\sim 9}$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{3\sim 7}$  カルボシクリル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)O(3\sim 7$  員のヘテロシクリル)、または  $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{2\sim 8}$  アルコキシアルキルである、項目 1 に記載の化合物。

(項目 6)

R の前記 3 ~ 7 員のヘテロシクリルが、  
【化 1 3 3】



である、項目 5 に記載の化合物。

(項目 7)

R が、 $-CR^{10}R^{11}C(O)NR^{13}R^{14}$  である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 8)

R が、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)O(CH_2)_{1\sim 3}C(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)O(CH_2)_{2\sim 3}OC(O)C_{1\sim 4}$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)(CH_2)_{1\sim 3}OC(O)C_{1\sim 4}$  アルキル、または  $-CR^{10}R^{11}OC(O)O(CH_2)_{1\sim 3}C(O)OC_{1\sim 4}$  アルキルである、項目 1 に記載の化合物。

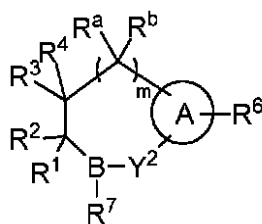
(項目 9)

各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  が、独立に、水素または  $C_{1\sim 6}$  アルキルである、項目 3 から 8 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 10)

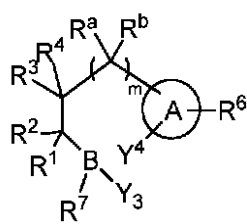
式 I a もしくは II a の構造を有する、項目 1 から 9 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

【化 1 3 4】



**Ia**

もしくは



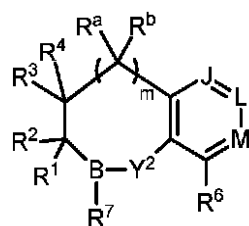
**IIa**

°

(項目 11)

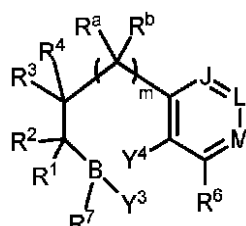
式 I b もしくは I I b の構造を有する、項目 1 0 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

【化 1 3 5】



Ib

もしくは



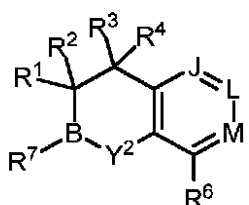
IIb

[ 式中、各 J、L、M は、独立に、C R<sup>1 2</sup> または N (窒素) である ]。

(項目 1 2)

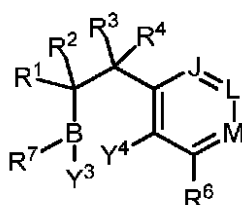
式 I c もしくは I I c の構造を有する、項目 1 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

【化 1 3 6】



Ic

もしくは



IIc

。

(項目 1 3)

各 J、L および M が、C R<sup>1 2</sup> である、項目 1 1 または 1 2 のいずれかに記載の化合物

。

(項目 1 4)

R<sup>1 2</sup> が、水素、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ 6 アルコキシ、または C<sub>1</sub> ~ 6 ハロアルコキシである、項目 1 3 に記載の化合物。

(項目 1 5)

J、L および M の少なくとも 1 つが、N である、項目 1 1 または 1 2 に記載の化合物。

(項目 1 6)

M が、N である、項目 1 5 に記載の化合物。

(項目 1 7)

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> が、それらが結合する原子と一緒に、1 つまたは複数の R<sup>5</sup> によりそれぞれ必要に応じて置換されている、C<sub>3</sub> ~ 7 カルボシクリル、3 ~ 10 員のヘテロシクリル、C<sub>6</sub> ~ 10 アリールおよび 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択される環または環系を形成する、項目 1 から 1 6 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 1 8)

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> が、それらが結合する原子と一緒に、1 つまたは複数の R<sup>5</sup> により必要に応じて置換されている C<sub>3</sub> ~ 7 カルボシクリルを形成する、項目 1 7 に記載の化合物。

(項目 1 9)

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> が、それらが結合する原子と一緒に、1 つまたは複数の R<sup>5</sup> によりそれぞれ必要に応じて置換されている、シクロプロピル、ビシクロ[2.2.1]ヘプチル、ビシクロ[2.2.1]ヘプテニル、テトラヒドロフラニルまたはジヒドロフラニ

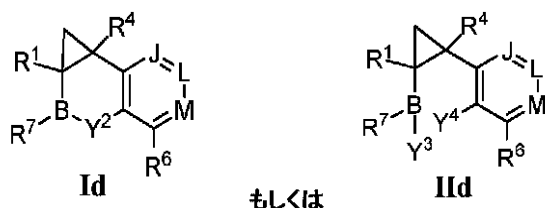


ルを形成する、項目 18 に記載の化合物。

(項目 20)

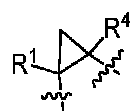
式 I d もしくは I I d の構造を有する、項目 18 もしくは 19 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

【化 137】



[ 式中、シクロプロピル部分

【化 138】

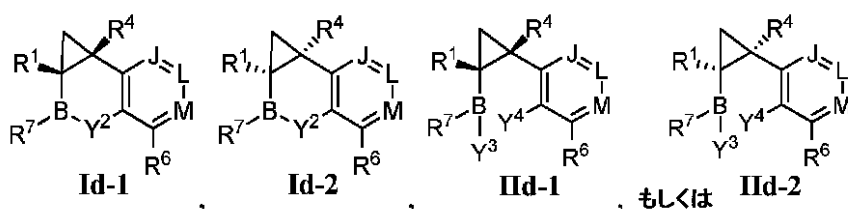


は、1 つまたは複数の R<sup>5</sup> により必要に応じて置換されている ]。

(項目 21)

式 I d - 1、I d - 2、I I d - 1 もしくは I I d - 2 の構造を有する、項目 20 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

【化 139】



。

(項目 22)

R<sup>1</sup> が、水素または C<sub>1</sub> - 6 ヒドロキシアルキルである、項目 1 から 21 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 23)

R<sup>4</sup> が、水素である、項目 1 から 22 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 24)

R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> が、それらが結合する原子と一緒にあって、1 つまたは複数の R<sup>5</sup> によりそれぞれ必要に応じて置換されている、C<sub>3</sub> - 7 カルボシクリルおよび 3 - 10 員のヘテロシクリルからなる群から選択される環または環系を形成する、項目 1 から 16 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 25)

R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> が、それらが結合する原子と一緒にあって、1 つまたは複数の R<sup>5</sup> により必要に応じて置換されている C<sub>3</sub> - 7 カルボシクリルを形成する、項目 24 に記載の化合物。

(項目 26)

R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> が、それらが結合する原子と一緒にあって、1 つまたは複数の R<sup>5</sup> により必要に応じて置換されているシクロプロピルを形成する、項目 25 に記載の化合物。

(項目 2 7)

R<sup>1</sup> が、水素である、項目 2 4 から 2 6 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 2 8)

R<sup>2</sup> が、水素である、項目 2 4 から 2 7 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 2 9)

R<sup>6</sup> が、-C(O)OR である、項目 1 から 2 8 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 3 0)

R が、H である、項目 2 9 に記載の化合物。

(項目 3 1)

R<sup>7</sup> が、-OH である、項目 1 から 3 0 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 3 2)

Y<sup>2</sup> が、-O- である、項目 1 から 3 1 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 3 3)

Y<sup>3</sup> が、-OH である、項目 1 から 3 2 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 3 4)

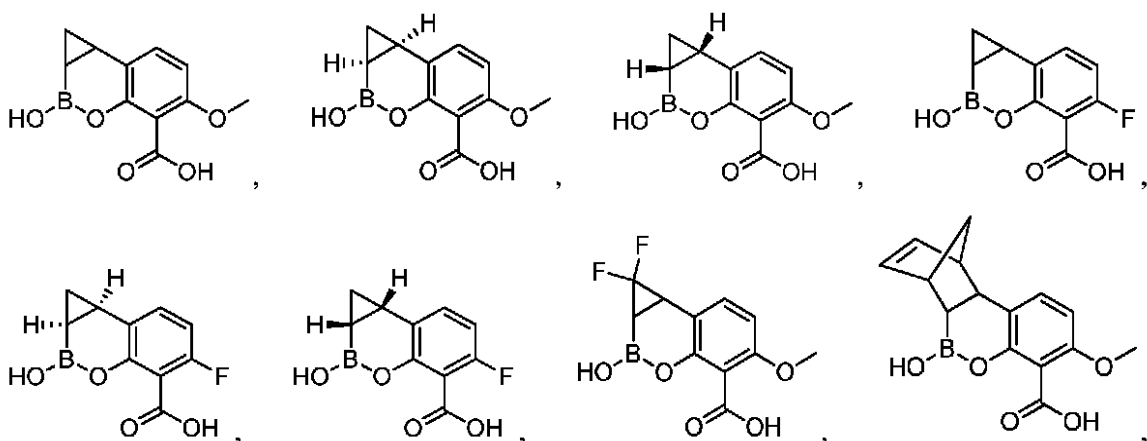
Y<sup>4</sup> が、-OH である、項目 1 から 3 3 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 3 5)

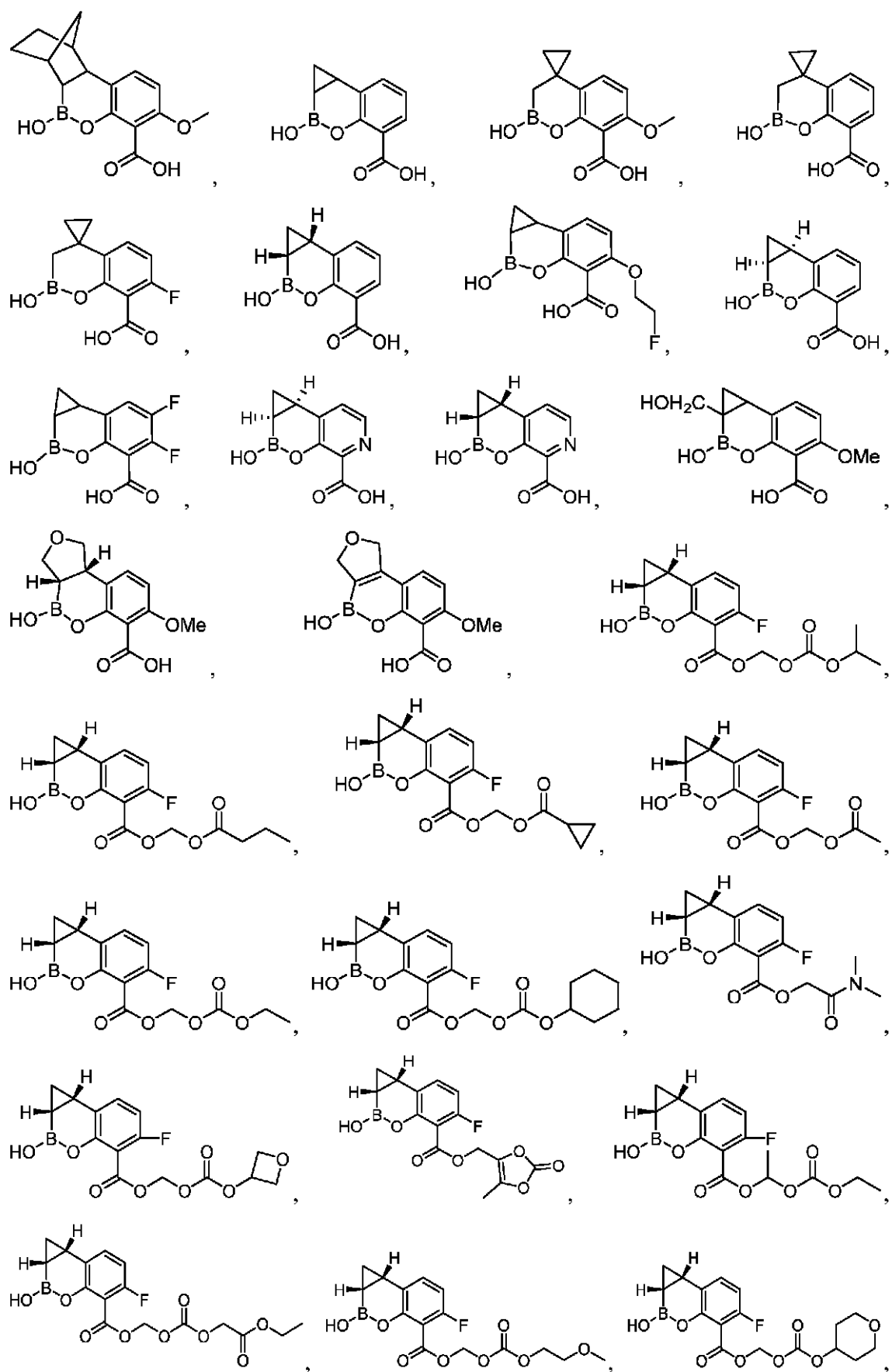
Y<sup>5</sup> が、存在せず、t が、0 であり、R<sup>5</sup> が、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 アルコキシ、アシル、C - カルボキシ、C - アミド、N - アミド、N - スルホンアミド、-SR<sup>c</sup>、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub> ~ 3 SR<sup>c</sup>、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub> ~ 3 R<sup>d</sup>、-NR<sup>f</sup>C(O)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-C(=NR<sup>e</sup>)R<sup>c</sup>、-C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>CR<sup>c</sup>(=NR<sup>e</sup>)、-NR<sup>f</sup>C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-S(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub> ~ 3 R<sup>c</sup>、および -NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>OR<sup>d</sup> からなる群から選択される、項目 1 から 3 4 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 3 6)

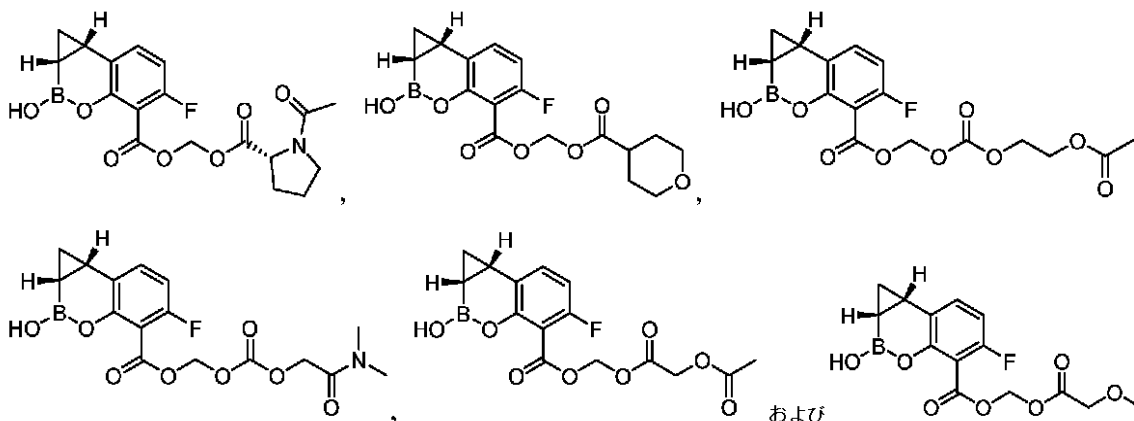
【化 1 4 0】



【化 1 4 1】



【化 1 4 2】

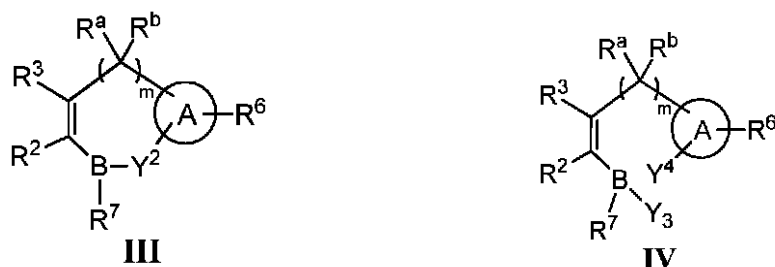


からなる群から選択される、項目 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

( 項 目 3 7 )

式 I I I もしくは I V の構造を有する化合物、またはその薬学的に許容される塩

【化 1 4 3】



[ 式中、

( a )

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> のそれぞれは、独立に、H、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 ハロアルキル、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 アルコキシ、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている (C<sub>1</sub> ~ 6 アルコキシ) C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>2</sub> ~ 10 アルケニル、必要に応じて置換されている C<sub>2</sub> ~ 10 アルキニル、必要に応じて置換されている C<sub>3</sub> ~ 7 カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている C<sub>6</sub> ~ 10 アリール、必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている (C<sub>3</sub> ~ 7 カルボシクリル) C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、必要に応じて置換されている (3 ~ 10 員のヘテロシクリル) C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、必要に応じて置換されている (C<sub>6</sub> ~ 10 アリール) C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、(C<sub>6</sub> ~ 10 アリール) C<sub>1</sub> ~ 6 アルコキシ、必要に応じて置換されている (5 ~ 10 員のヘテロアリール) C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、アシル、C - カルボキシ、O - カルボキシ、C - アミド、N - アミド、S - スルホンアミド、N - スルホンアミド、-SR<sup>c</sup>、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>0</sub> ~ 3 SR<sup>c</sup>、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub> ~ 3 R<sup>d</sup>、-NR<sup>f</sup>C(O)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-C(=NR<sup>e</sup>)R<sup>c</sup>、-C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>CR<sup>c</sup>(=NR<sup>e</sup>)、-NR<sup>f</sup>C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-S(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1</sub> ~ 3 R<sup>c</sup>、および -NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>OR<sup>d</sup> からなる群から選択されるか、あるいは、R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> は、それらが結合する原子と一緒に、1 つまたは複数の R<sup>5</sup> によりそれぞれ必要に応じて置換されている、C<sub>3</sub> ~ 7 カルボシクリル、3 ~ 10 員のヘテロシクリル、C<sub>6</sub> ~ 10 アリール および 5 ~ 10 員のヘテロアリール からなる群から選択される縮合環または環系を形成し

、 $m$ は、0または1の整数であり、

各  $R^a$  および  $R^b$  は、独立に、H、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている  $(C_{1-6}$  アルコキシ)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている  $(C_{3-7}$  カルボシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $(3 \sim 10$  員のヘテロシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $(C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキル、 $(C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $(5 \sim 10$  員のヘテロアリール)  $C_{1-6}$  アルキル、アシル、C - カルボキシ、O - カルボキシ、C - アミド、N - アミド、S - スルホンアミド、N - スルホンアミド、 $-SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{0-3}SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{1-3}R^d$ 、 $-NR^fC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^fS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-C(=NR^e)R^c$ 、 $-C(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-NR^fCR^c(=NR^e)$ 、 $-NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-S(O)(CH_2)_{1-3}R^c$ 、および  $-NR^fS(O)_2NR^fOR^d$  からなる群から選択されるか、あるいは、 $R^a$  および  $R^b$  は、それらが結合する原子と一緒に、1つまたは複数の  $R^5$  によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_{3-7}$  カルボシクリルおよび 3 ~ 10 員のヘテロシクリルからなる群から選択される環または環系を形成するか、あるいは

(b)

$m$ は、1であり、

$R^a$  および  $R^3$  は、それらが結合する原子と一緒に、1つまたは複数の  $R^5$  によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_{3-7}$  カルボシクリルおよび 3 ~ 10 員のヘテロシクリルからなる群から選択される環または環系を形成し、

各  $R^2$  および  $R^b$  は、独立に、H、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている  $(C_{1-6}$  アルコキシ)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている  $(C_{3-7}$  カルボシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $(3 \sim 10$  員のヘテロシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $(C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキル、 $(C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $(5 \sim 10$  員のヘテロアリール)  $C_{1-6}$  アルキル、アシル、C - カルボキシ、O - カルボキシ、C - アミド、N - アミド、S - スルホンアミド、N - スルホンアミド、 $-SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{0-3}SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{1-3}R^d$ 、 $-NR^fC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^fS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-C(=NR^e)R^c$ 、 $-C(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-NR^fCR^c(=NR^e)$ 、 $-NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-S(O)(CH_2)_{1-3}R^c$ 、および  $-NR^fS(O)_2NR^fOR^d$  からなる群から選択され、

$R^5$  は、 $-Y^5 - (CH_2)_t - G$  であり、

$t$  は、0または1の整数であり、

$G$  は、H、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルコキシ、必要

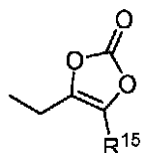
に応じて置換されている ( $C_{1-6}$  アルコキシ)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている ( $C_{3-7}$  カルボシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている (3 ~ 10 員のヘテロシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている ( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキル、( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている (5 ~ 10 員のヘテロアリール)  $C_{1-6}$  アルキル、アシル、C - カルボキシ、O - カルボキシ、C - アミド、N - アミド、S - スルホンアミド、N - スルホンアミド、-  $SR^c$ 、-  $C(O)(CH_2)_{0-3}SR^c$ 、-  $C(O)(CH_2)_{1-3}R^d$ 、-  $NR^fC(O)NR^fR^g$ 、-  $NR^fS(O)_2NR^fR^g$ 、-  $C(=NR^e)R^c$ 、-  $C(=NR^e)NR^fR^g$ 、-  $NR^fCR^c(=NR^e)$ 、-  $NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ 、-  $S(O)(CH_2)_{1-3}R^c$ 、および -  $NR^fS(O)_2NR^fOR^d$  からなる群から選択され、

A は、1 つまたは複数の  $R^{12}$  によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_{3-7}$  カルボシクリル、3 ~ 10 員のヘテロシクリル、 $C_{6-10}$  アリールおよび 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択される環系であり、

$R^6$  は、H、ハロゲン、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、OH、-  $C(O)OR$ 、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルコキシ、アミノ、-  $N(OR^8)R^9$ 、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキルチオール、C - アミド、S - スルホンアミド、CN、スルフィニル、スルホニル、およびカルボン酸イソスターからなる群から選択され、

R は、H、 $C_{1-9}$  アルキル、-  $CR^{10}R^{11}OC(O)C_{1-9}$  アルキル、-  $CR^{10}R^{11}OC(O)C_{3-7}$  カルボシクリル、-  $CR^{10}R^{11}OC(O)(3 \sim 7 \text{ 員のヘテロシクリル})$ 、-  $CR^{10}R^{11}OC(O)C_{2-8}$  アルコキシアルキル、-  $CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{1-9}$  アルキル、-  $CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{3-7}$  カルボシクリル、-  $CR^{10}R^{11}OC(O)O(3 \sim 7 \text{ 員のヘテロシクリル})$ 、-  $CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{2-8}$  アルコキシアルキル、-  $CR^{10}R^{11}OC(O)C_{6-10}$  アリール、-  $CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{6-10}$  アリール、-  $CR^{10}R^{11}C(O)NR^{13}R^{14}$ 、-  $CR^{10}R^{11}OC(O)O(CH_2)_{1-3}C(O)NR^{13}R^{14}$ 、-  $CR^{10}R^{11}OC(O)O(CH_2)_{2-3}OC(O)C_{1-4}$  アルキル、-  $CR^{10}R^{11}OC(O)O(CH_2)_{1-3}C(O)OC_{1-4}$  アルキル、-  $CR^{10}R^{11}OC(O)(CH_2)_{1-3}OC(O)C_{1-4}$  アルキル、および

【化 144】



からなる群から選択され、

$R^7$  は、- OH、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルコキシ、アミノ、および -  $N(OR^8)R^9$  からなる群から選択され、

各  $R^8$  および  $R^9$  は、独立に、H、ハロゲン、必要に応じて置換されている  $C_{1-4}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、および必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択され、

各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立に、H、必要に応じて置換されている  $C_{1-4}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~

10員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている $C_{6-10}$ アリアル、および必要に応じて置換されている5～10員のヘテロアリアルからなる群から選択され、  
 $R^{12}$ は、水素、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている $C_{1-6}$ アルキル、必要に応じて置換されている $C_{1-6}$ ハロアルキル、必要に応じて置換されている $C_{1-6}$ アルコキシ、必要に応じて置換されている $C_{1-6}$ ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている $C_{1-6}$ アルキルチオール、必要に応じて置換されている( $C_{1-6}$ アルコキシ) $C_{1-6}$ アルキル、必要に応じて置換されている $C_{2-10}$ アルケニル、必要に応じて置換されている $C_{2-10}$ アルキニル、必要に応じて置換されている $C_{3-7}$ カルボシクリル、必要に応じて置換されている3～10員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている $C_{6-10}$ アリアル、必要に応じて置換されている5～10員のヘテロアリアル、必要に応じて置換されている( $C_{3-7}$ カルボシクリル) $C_{1-6}$ アルキル、必要に応じて置換されている(3～10員のヘテロシクリル) $C_{1-6}$ アルキル、必要に応じて置換されている( $C_{6-10}$ アリアル) $C_{1-6}$ アルキル、( $C_{6-10}$ アリアル) $C_{1-6}$ アルコキシ、必要に応じて置換されている(5～10員のヘテロアリアル) $C_{1-6}$ アルキル、アシル、C-カルボキシ、O-カルボキシ、C-アミド、N-アミド、S-スルホンアミド、N-スルホンアミド、スルフヒドリル、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>0-3</sub>SR<sup>c</sup>、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1-3</sub>R<sup>d</sup>、-NR<sup>f</sup>C(O)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-C(=NR<sup>e</sup>)R<sup>c</sup>、-C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>CR<sup>c</sup>(=NR<sup>e</sup>)、-NR<sup>f</sup>C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-S(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1-3</sub>R<sup>c</sup>、-NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>OR<sup>d</sup>、および-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-Y<sup>6</sup>-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>Kからなる群から選択され、  
 各 $R^{13}$ および $R^{14}$ は、独立に、H、必要に応じて置換されている $C_{1-6}$ アルキル、必要に応じて置換されている $C_{3-7}$ カルボシクリル、必要に応じて置換されている3～10員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている $C_{6-10}$ アリアル、および必要に応じて置換されている5～10員のヘテロアリアルからなる群から選択され、  
 $R^{15}$ は、必要に応じて置換されている $C_{1-6}$ アルキルであり、  
 $Y^2$ は、-O-、-S-、および-NR<sup>9</sup>-からなる群から選択され、  
 $Y^3$ は、-OH、-SH、および-NHR<sup>9</sup>からなる群から選択され、  
 $Y^4$ は、-OH、必要に応じて置換されている $C_{1-6}$ アルコキシ、アミノ、および-N(OR<sup>8</sup>)R<sup>9</sup>からなる群から選択され、  
 $Y^5$ は、-S-、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、-O-、-CR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>-、および-NR<sup>g</sup>-からなる群から選択されるか、または $Y^5$ は、存在せず、  
 $Y^6$ は、-S-、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、-O-、-CR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>-、および-NR<sup>f</sup>-からなる群から選択され、  
 Kは、C-アミド；N-アミド；S-スルホンアミド；N-スルホンアミド；-NR<sup>f</sup>C(O)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>；-NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>；-C(=NR<sup>e</sup>)R<sup>c</sup>；-C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>；-NR<sup>f</sup>CR<sup>c</sup>(=NR<sup>e</sup>)；-NR<sup>f</sup>C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>； $C_{1-4}$ アルコキシ、アミノ、ハロゲン、C-アミドおよびN-アミドからなる群から選択される0～2個の置換基により必要に応じて置換されている $C_{1-4}$ アルキル； $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、アミノ、ハロゲン、C-アミドおよびN-アミドからなる群から選択される0～2個の置換基により必要に応じて置換されている $C_{6-10}$ アリアル； $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、アミノ、ハロゲン、C-アミドおよびN-アミドからなる群から選択される0～2個の置換基により必要に応じて置換されている $C_{3-7}$ カルボシクリル； $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、アミノ、ハロゲン、C-アミドおよびN-アミドからなる群から選択される0～2個の置換基により必要に応じて置換されている5～10員のヘテロアリアル；ならびに $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、アミノ、ハロゲン、C-アミドおよびN-アミドからなる群から選択される0～2個の置換基により必要に応じて置換されている3～10員のヘテロシクリルからなる群から選択され、  
 各R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>f</sup>、およびR<sup>g</sup>は、独立に、H、ハロゲン、必要に応じて置換さ

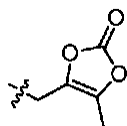
れている  $C_1 \sim 4$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_3 \sim 7$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_6 \sim 10$  アリール、および必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択され、

各 p および q は、独立に、0 または 1 である ]。

(項目 38)

R が、H、 $C_1 \sim 9$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_1 \sim 9$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_1 \sim 9$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_6 \sim 10$  アリール、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_6 \sim 10$  アリールおよび

【化 145】

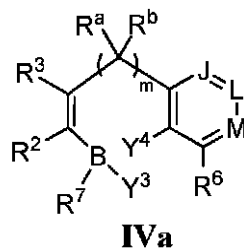
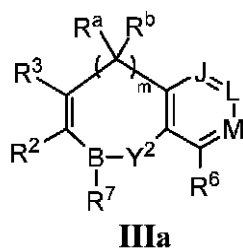


から選択される、項目 37 に記載の化合物。

(項目 39)

式 III a もしくは IV a の構造を有する、項目 37 または 38 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

【化 146】

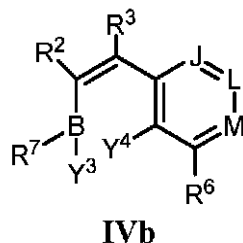
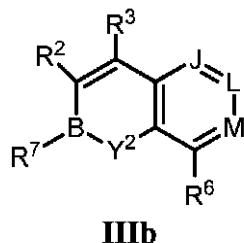


[ 式中、各 J、L、M は、独立に、 $CR^{12}$  または N である ]。

(項目 40)

式 III b もしくは IV b の構造を有する、項目 39 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

【化 147】



。

(項目 41)

各 J、L および M が、 $CR^{12}$  である、項目 39 または 40 に記載の化合物。

(項目 42)

$R^2$  が、水素、ハロゲン、または  $C_1 \sim 6$  アルキルである、項目 37 から 41 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 43)

$R^3$  が、水素である、項目 37 から 42 のいずれか一項に記載の化合物。



(項目 4 4 )

$R^6$  が、 $-C(O)OR$  である、項目 3 7 から 4 3 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 4 5 )

$R$  が、 $H$  である、項目 4 4 に記載の化合物。

(項目 4 6 )

$R^7$  が、 $-OH$  である、項目 3 7 から 4 5 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 4 7 )

$Y^2$  が、 $-O-$  である、項目 3 7 から 4 6 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 4 8 )

$Y^3$  が、 $-OH$  である、項目 3 7 から 4 7 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 4 9 )

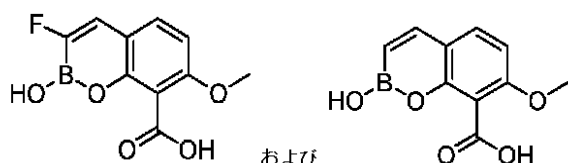
$Y^4$  が、 $-OH$  である、項目 3 7 から 4 8 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 5 0 )

$R^{12}$  が、水素、ハロゲンまたは  $C_1 \sim 6$  アルコキシである、項目 3 7 から 4 9 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 5 1 )

【化 1 4 8】

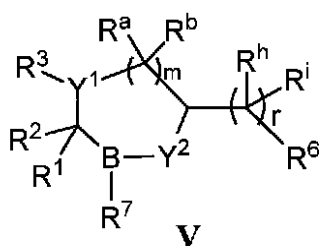


からなる群から選択される、項目 3 7 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

(項目 5 2 )

式 V の構造を有する化合物、またはその薬学的に許容される塩

【化 1 4 9】



[ 式中、

$Y^1$  は、 $N$  または  $CR^4$  であり、

$m$  は、0 または 1 の整数であり、

$r$  は、0 または 1 の整数であり、

( a )

$R^2$  および  $R^3$  は、それらが結合する原子と一緒に、1 つまたは複数の  $R^5$  によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_3 \sim 7$  カルボシクリル、3 ~ 10 員のヘテロシクリル、 $C_6 \sim 10$  アリールおよび 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択される縮合環または環系を形成し、

$R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^a$ 、および  $R^b$  のそれぞれは、独立に、 $H$ 、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_1 \sim 6$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_1 \sim 6$  ハロアルキル、必要に応じて置換されている  $C_1 \sim 6$  アルコキシ、必要に応じて

て置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている ( $C_{1-6}$  アルコキシ)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている ( $C_{3-7}$  カルボシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている (3 ~ 10 員のヘテロシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている ( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキル、( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている (5 ~ 10 員のヘテロアリール)  $C_{1-6}$  アルキル、アシル、C - カルボキシ、O - カルボキシ、C - アミド、N - アミド、S - スルホンアミド、N - スルホンアミド、-SR<sup>c</sup>、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>0-3</sub>SR<sup>c</sup>、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1-3</sub>R<sup>d</sup>、-NR<sup>f</sup>C(O)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-C(=NR<sup>e</sup>)R<sup>c</sup>、-C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>CR<sup>c</sup>(=NR<sup>e</sup>)、-NR<sup>f</sup>C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-S(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1-3</sub>R<sup>c</sup>、および -NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>OR<sup>d</sup> からなる群から選択されるか、あるいは

(b)

R<sup>3</sup> および R<sup>4</sup> は、それらが結合する原子と一緒にあって、1つまたは複数の R<sup>5</sup> によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_{3-7}$  カルボシクリルおよび 3 ~ 10 員のヘテロシクリルからなる群から選択されるスピロ環式環または環系を形成し、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>a</sup>、および R<sup>b</sup> のそれぞれは、独立に、H、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている ( $C_{1-6}$  アルコキシ)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている ( $C_{3-7}$  カルボシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている (3 ~ 10 員のヘテロシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている ( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキル、( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている (5 ~ 10 員のヘテロアリール)  $C_{1-6}$  アルキル、アシル、C - カルボキシ、O - カルボキシ、C - アミド、N - アミド、S - スルホンアミド、N - スルホンアミド、-SR<sup>c</sup>、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>0-3</sub>SR<sup>c</sup>、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1-3</sub>R<sup>d</sup>、-NR<sup>f</sup>C(O)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-C(=NR<sup>e</sup>)R<sup>c</sup>、-C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-NR<sup>f</sup>CR<sup>c</sup>(=NR<sup>e</sup>)、-NR<sup>f</sup>C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、-S(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1-3</sub>R<sup>c</sup>、および -NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>OR<sup>d</sup> からなる群から選択されるか、あるいは

(c)

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、それらが結合する原子と一緒にあって、1つまたは複数の R<sup>5</sup> によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_{3-7}$  カルボシクリルおよび 3 ~ 10 員のヘテロシクリルからなる群から選択されるスピロ環式環または環系を形成し、

R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>a</sup>、および R<sup>b</sup> のそれぞれは、独立に、H、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている ( $C_{1-6}$  アルコキシ)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている ( $C_{3-7}$  カルボシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要

に応じて置換されている (3 ~ 10 員のヘテロシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている ( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキル、( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている (5 ~ 10 員のヘテロアリール)  $C_{1-6}$  アルキル、アシル、C - カルボキシ、O - カルボキシ、C - アミド、N - アミド、S - スルホンアミド、N - スルホンアミド、 $-SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{0-3}SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{1-3}R^d$ 、 $-NR^fC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^fS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-C(=NR^e)R^c$ 、 $-C(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-NR^fCR^c(=NR^e)$ 、 $-NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-S(O)(CH_2)_{1-3}R^c$ 、および  $-NR^fS(O)_2NR^fOR^d$  からなる群から選択されるか、あるいは

(d)

$R^a$  および  $R^b$  は、それらが結合する原子と一緒に、1つまたは複数の  $R^5$  によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_{3-7}$  カルボシクリルおよび 3 ~ 10 員のヘテロシクリルからなる群から選択されるスピロ環式環または環系を形成し、

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および  $R^4$  のそれぞれは、独立に、H、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている ( $C_{1-6}$  アルコキシ)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている ( $C_{3-7}$  カルボシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている (3 ~ 10 員のヘテロシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている ( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキル、( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている (5 ~ 10 員のヘテロアリール)  $C_{1-6}$  アルキル、アシル、C - カルボキシ、O - カルボキシ、C - アミド、N - アミド、S - スルホンアミド、N - スルホンアミド、 $-SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{0-3}SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{1-3}R^d$ 、 $-NR^fC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^fS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-C(=NR^e)R^c$ 、 $-C(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-NR^fCR^c(=NR^e)$ 、 $-NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-S(O)(CH_2)_{1-3}R^c$ 、および  $-NR^fS(O)_2NR^fOR^d$  からなる群から選択されるか、あるいは

(e)

$R^a$  および  $R^4$  は、それらが結合する原子と一緒に、1つまたは複数の  $R^5$  によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_{3-7}$  カルボシクリル、3 ~ 10 員のヘテロシクリル、 $C_{6-10}$  アリールおよび 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択される縮合環または環系を形成し、

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および  $R^b$  のそれぞれは、独立に、H、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている ( $C_{1-6}$  アルコキシ)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_{2-10}$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている ( $C_{3-7}$  カルボシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている (3 ~ 10 員のヘテロシクリル)  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている ( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルキル、( $C_{6-10}$  アリール)  $C_{1-6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている (5 ~ 10 員のヘテロアリール)  $C_{1-6}$  アルキル、アシル、C - カルボキシ、O - カルボキシ、C - アミド、N - アミド、S - スルホンアミド、N - スルホンアミド、 $-SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{0-3}SR^c$ 、

- C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1-3</sub>R<sup>d</sup>、- NR<sup>f</sup>C(O)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、- NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、- C(=NR<sup>e</sup>)R<sup>c</sup>、- C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、- NR<sup>f</sup>CR<sup>c</sup>(=NR<sup>e</sup>)、- NR<sup>f</sup>C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、- S(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1-3</sub>R<sup>c</sup>、および  
- NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>OR<sup>d</sup> からなる群から選択され、  
R<sup>5</sup> は、- Y<sup>5</sup> - (CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub> - G であり、

t は、0 または 1 の整数であり、

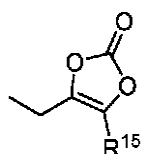
G は、H、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている C<sub>1-6</sub> アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>1-6</sub> ハロアルキル、必要に応じて置換されている C<sub>1-6</sub> アルコキシ、必要に応じて置換されている C<sub>1-6</sub> ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている (C<sub>1-6</sub> アルコキシ) C<sub>1-6</sub> アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>2-10</sub> アルケニル、必要に応じて置換されている C<sub>2-10</sub> アルキニル、必要に応じて置換されている C<sub>3-7</sub> カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3~10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている C<sub>6-10</sub> アリール、必要に応じて置換されている 5~10 員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている (C<sub>3-7</sub> カルボシクリル) C<sub>1-6</sub> アルキル、必要に応じて置換されている (3~10 員のヘテロシクリル) C<sub>1-6</sub> アルキル、必要に応じて置換されている (C<sub>6-10</sub> アリール) C<sub>1-6</sub> アルキル、(C<sub>6-10</sub> アリール) C<sub>1-6</sub> アルコキシ、必要に応じて置換されている (5~10 員のヘテロアリール) C<sub>1-6</sub> アルキル、アシル、C-カルボキシ、O-カルボキシ、C-アミド、N-アミド、S-スルホンアミド、N-スルホンアミド、- SR<sup>c</sup>、- C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>0-3</sub>SR<sup>c</sup>、- C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1-3</sub>R<sup>d</sup>、- NR<sup>f</sup>C(O)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、- NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、- C(=NR<sup>e</sup>)R<sup>c</sup>、- C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、- NR<sup>f</sup>CR<sup>c</sup>(=NR<sup>e</sup>)、- NR<sup>f</sup>C(=NR<sup>e</sup>)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>、- S(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1-3</sub>R<sup>c</sup>、および - NR<sup>f</sup>S(O)<sub>2</sub>NR<sup>f</sup>OR<sup>d</sup> からなる群から選択され、

R<sup>6</sup> は、必要に応じて置換されている - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C(O)OR およびカルボン酸イソスターからなる群から選択され、

n は、0~6 から選択される整数であり、

R は、H、C<sub>1-9</sub> アルキル、- CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)C<sub>1-9</sub> アルキル、- CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)C<sub>3-7</sub> カルボシクリル、- CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)(3~7 員のヘテロシクリル)、- CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)C<sub>2-8</sub> アルコキシアルキル、- CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)OC<sub>1-9</sub> アルキル、- CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)OC<sub>3-7</sub> カルボシクリル、- CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)O(3~7 員のヘテロシクリル)、- CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)OC<sub>2-8</sub> アルコキシアルキル、- CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)C<sub>6-10</sub> アリール、- CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)OC<sub>6-10</sub> アリール、- CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>C(O)NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>、- CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)O(CH<sub>2</sub>)<sub>1-3</sub>C(O)NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>、- CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)O(CH<sub>2</sub>)<sub>2-3</sub>OC(O)C<sub>1-4</sub> アルキル、- CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)O(CH<sub>2</sub>)<sub>1-3</sub>C(O)OC<sub>1-4</sub> アルキル、- CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1-3</sub>OC(O)C<sub>1-4</sub> アルキル、および

【化 150】



からなる群から選択され、

R<sup>7</sup> は、- OH、必要に応じて置換されている C<sub>1-6</sub> アルコキシ、アミノ、および - N(OR<sup>8</sup>)R<sup>9</sup> からなる群から選択され、

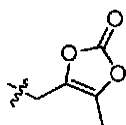
各 R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は、独立に、H、ハロゲン、必要に応じて置換されている C<sub>1-4</sub> アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>3-7</sub> カルボシクリル、必要に応じて置換されてい

る 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、および必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択され、各  $R^{10}$  および  $R^{11}$  は、独立に、H、必要に応じて置換されている  $C_{1-4}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、および必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択され、各  $R^{13}$  および  $R^{14}$  は、独立に、H、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、および必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択され、 $R^{15}$  は、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキルであり、 $Y^2$  は、-O-、-S-、および -NR<sup>9</sup>- からなる群から選択され、 $Y^5$  は、-S-、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、-O-、-CR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>-、および -NR<sup>g</sup>- からなる群から選択されるか、または  $Y^5$  は存在せず、各  $R^c$ 、 $R^d$ 、 $R^e$ 、 $R^f$ 、および  $R^g$  は、独立に、H、ハロゲン、必要に応じて置換されている  $C_{1-4}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、および必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択され、各  $R^h$  および  $R^i$  は、独立に、H、ハロゲン、シアノ、アミノ、C-アミド、N-アミド、必要に応じて置換されている  $C_{1-4}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{3-7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6-10}$  アリール、および必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択されるか、あるいは、 $R^h$  および  $R^i$  は、それらが結合する原子と一緒にあって、1つまたは複数の  $R^5$  によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_{3-7}$  カルボシクリル、3 ~ 10 員のヘテロシクリル、 $C_{6-10}$  アリールおよび 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択されるスピロ環式環または環系を形成する]。

(項目 53)

$R$  が、H、 $C_{1-9}$  アルキル、-CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O) $C_{1-9}$  アルキル、-CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)OC<sub>1-9</sub> アルキル、-CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O) $C_{6-10}$  アリール、-CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)OC<sub>6-10</sub> アリールおよび

【化 151】

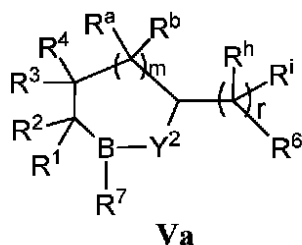


から選択される、項目 52 に記載の化合物。

(項目 54)

式 Va の構造を有する、項目 52 もしくは 53 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩

## 【化 1 5 2】

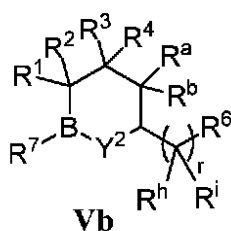


°

## (項目 5 5)

式 V b の構造を有する、項目 5 4 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩

## 【化 1 5 3】



°

## (項目 5 6)

$R^a$  および  $R^b$  の両方が、H である、項目 5 2 から 5 5 のいずれか一項に記載の化合物

°

## (項目 5 7)

$R^2$  および  $R^3$  が、それらが結合する原子と一緒にあって、1 つまたは複数の  $R^5$  によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_3 \sim 7$  カルボシクリル、3 ~ 10 員のヘテロシクリル、 $C_6 \sim 10$  アリールおよび 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択される環または環系を形成する、項目 5 2 から 5 6 のいずれか一項に記載の化合物。

## (項目 5 8)

$R^2$  および  $R^3$  が、それらが結合する原子と一緒にあって、1 つまたは複数の  $R^5$  により必要に応じて置換されている  $C_3 \sim 7$  カルボシクリルを形成する、項目 5 7 に記載の化合物。

## (項目 5 9)

$R^2$  および  $R^3$  が、それらが結合する原子と一緒にあって、1 つまたは複数の  $R^5$  により必要に応じて置換されているシクロプロピルを形成する、項目 5 8 に記載の化合物。

## (項目 6 0)

$r$  が、1 であり、 $R^h$  および  $R^i$  の両方が、H である、項目 5 2 から 5 9 のいずれか一項に記載の化合物。

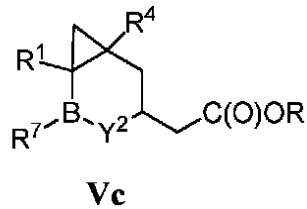
## (項目 6 1)

$R^6$  が、 $-(CH_2)_n C(O)OR$  であり、 $n$  が、0 である、項目 5 2 から 6 0 のいずれか一項に記載の化合物。

## (項目 6 2)

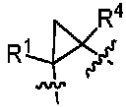
式 V c の構造を有する、項目 6 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩

【化 1 5 4】



[ 式中、前記シクロプロピル部分

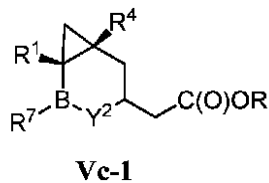
【化 1 5 5】

は、1 つまたは複数の  $R^5$  により必要に応じて置換されている ]。

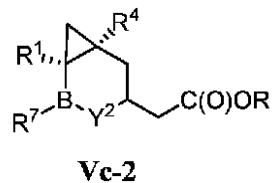
(項目 6 3)

式 Vc - 1 もしくは Vc - 2 の構造を有する、項目 6 2 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

【化 1 5 6】



,



°

(項目 6 4)

 $Y^2$  が、- O - である、項目 5 2 から 6 3 のいずれか一項のいずれか一項に記載の化合物。

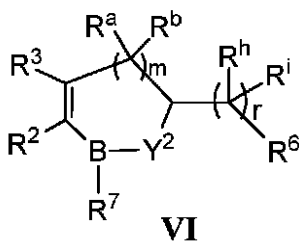
(項目 6 5)

 $R^7$  が、- OH である、項目 5 2 から 6 4 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 6 6)

式 VI の構造を有する化合物、またはその薬学的に許容される塩

【化 1 5 7】



[ 式中、

 $r$  は、0 または 1 の整数であり、

(a)

 $R^2$  および  $R^3$  のそれぞれは、独立に、H、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1-6}$  ハロ

アルキル、必要に応じて置換されている  $C_1 \sim 6$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $C_1 \sim 6$  ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている  $(C_1 \sim 6 \text{ アルコキシ}) C_1 \sim 6$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_2 \sim 10$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_2 \sim 10$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_3 \sim 7$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている  $3 \sim 10$  員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_6 \sim 10$  アリール、必要に応じて置換されている  $5 \sim 10$  員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている  $(C_3 \sim 7 \text{ カルボシクリル}) C_1 \sim 6$  アルキル、必要に応じて置換されている  $(3 \sim 10 \text{ 員のヘテロシクリル}) C_1 \sim 6$  アルキル、必要に応じて置換されている  $(C_6 \sim 10 \text{ アリール}) C_1 \sim 6$  アルキル、 $(C_6 \sim 10 \text{ アリール}) C_1 \sim 6$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $(5 \sim 10 \text{ 員のヘテロアリール}) C_1 \sim 6$  アルキル、アシル、 $C$ -カルボキシ、 $O$ -カルボキシ、 $C$ -アミド、 $N$ -アミド、 $S$ -スルホンアミド、 $N$ -スルホンアミド、 $-SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{0 \sim 3}SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{1 \sim 3}R^d$ 、 $-NR^fC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^fS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-C(=NR^e)R^c$ 、 $-C(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-NR^fCR^c(=NR^e)$ 、 $-NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-S(O)(CH_2)_{1 \sim 3}R^c$ 、および  $-NR^fS(O)_2NR^fOR^d$  からなる群から選択されるか、あるいは、 $R^2$  および  $R^3$  は、それらが結合する原子と一緒にあって、1つまたは複数の  $R^5$  によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_3 \sim 7$  カルボシクリルおよび  $3 \sim 10$  員のヘテロシクリルからなる群から選択される縮合環または環系を形成し、

$m$  は、0 または 1 の整数であり、

各  $R^a$  および  $R^b$  は、独立に、 $H$ 、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_1 \sim 6$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_1 \sim 6$  ハロアルキル、必要に応じて置換されている  $C_1 \sim 6$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $C_1 \sim 6$  ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている  $(C_1 \sim 6 \text{ アルコキシ}) C_1 \sim 6$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_2 \sim 10$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_2 \sim 10$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_3 \sim 7$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている  $3 \sim 10$  員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_6 \sim 10$  アリール、必要に応じて置換されている  $5 \sim 10$  員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている  $(C_3 \sim 7 \text{ カルボシクリル}) C_1 \sim 6$  アルキル、必要に応じて置換されている  $(3 \sim 10 \text{ 員のヘテロシクリル}) C_1 \sim 6$  アルキル、必要に応じて置換されている  $(C_6 \sim 10 \text{ アリール}) C_1 \sim 6$  アルキル、 $(C_6 \sim 10 \text{ アリール}) C_1 \sim 6$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $(5 \sim 10 \text{ 員のヘテロアリール}) C_1 \sim 6$  アルキル、アシル、 $C$ -カルボキシ、 $O$ -カルボキシ、 $C$ -アミド、 $N$ -アミド、 $S$ -スルホンアミド、 $N$ -スルホンアミド、 $-SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{0 \sim 3}SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{1 \sim 3}R^d$ 、 $-NR^fC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^fS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-C(=NR^e)R^c$ 、 $-C(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-NR^fCR^c(=NR^e)$ 、 $-NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-S(O)(CH_2)_{1 \sim 3}R^c$ 、および  $-NR^fS(O)_2NR^fOR^d$  からなる群から選択されるか、あるいは、 $R^a$  および  $R^b$  は、それらが結合する原子と一緒にあって、1つまたは複数の  $R^5$  によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_3 \sim 7$  カルボシクリルおよび  $3 \sim 10$  員のヘテロシクリルからなる群から選択される環または環系を形成するか、あるいは

(b)

$m$  は、1 であり、

$R^a$  および  $R^3$  は、それらが結合する原子と一緒にあって、1つまたは複数の  $R^5$  によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_3 \sim 7$  カルボシクリルおよび  $3 \sim 10$  員のヘテロシクリルからなる群から選択される環または環系を形成し、

各  $R^2$  および  $R^b$  は、独立に、 $H$ 、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_1 \sim 6$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_1 \sim 6$  ハロアルキル、必要に応じて置換されている  $C_1 \sim 6$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $C_1 \sim 6$  ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている  $(C_1 \sim 6 \text{ アルコキシ}) C_1 \sim 6$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_2 \sim 10$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_2 \sim 10$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_3 \sim 7$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている  $3 \sim 10$  員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_6 \sim 10$  アリール、必要に応じて置換されている  $5 \sim 10$  員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている  $(C_3 \sim 7 \text{ カルボシクリル}) C_1 \sim 6$  アルキル、必要に応じて置換されている  $(3 \sim 10 \text{ 員のヘテロシクリル}) C_1 \sim 6$  アルキル、必要に応じて置換されている  $(C_6 \sim 10 \text{ アリール}) C_1 \sim 6$  アルキル、 $(C_6 \sim 10 \text{ アリール}) C_1 \sim 6$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $(5 \sim 10 \text{ 員のヘテロアリール}) C_1 \sim 6$  アルキル、アシル、 $C$ -カルボキシ、 $O$ -カルボキシ、 $C$ -アミド、 $N$ -アミド、 $S$ -スルホンアミド、 $N$ -スルホンアミド、 $-SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{0 \sim 3}SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{1 \sim 3}R^d$ 、 $-NR^fC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^fS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-C(=NR^e)R^c$ 、 $-C(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-NR^fCR^c(=NR^e)$ 、 $-NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-S(O)(CH_2)_{1 \sim 3}R^c$ 、および  $-NR^fS(O)_2NR^fOR^d$  からなる群から選択されるか、あるいは、 $R^2$  および  $R^b$  は、それらが結合する原子と一緒にあって、1つまたは複数の  $R^5$  によりそれぞれ必要に応じて置換されている、 $C_3 \sim 7$  カルボシクリルおよび  $3 \sim 10$  員のヘテロシクリルからなる群から選択される環または環系を形成するか、あるいは



ル、必要に応じて置換されている  $C_{2 \sim 10}$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_{2 \sim 10}$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_{3 \sim 7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6 \sim 10}$  アリール、必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている ( $C_{3 \sim 7}$  カルボシクリル)  $C_{1 \sim 6}$  アルキル、必要に応じて置換されている (3 ~ 10 員のヘテロシクリル)  $C_{1 \sim 6}$  アルキル、必要に応じて置換されている ( $C_{6 \sim 10}$  アリール)  $C_{1 \sim 6}$  アルキル、( $C_{6 \sim 10}$  アリール)  $C_{1 \sim 6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている (5 ~ 10 員のヘテロアリール)  $C_{1 \sim 6}$  アルキル、アシル、C - カルボキシ、O - カルボキシ、C - アミド、N - アミド、S - スルホンアミド、N - スルホンアミド、 $-SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{0 \sim 3}SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{1 \sim 3}R^d$ 、 $-NR^fC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^fS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-C(=NR^e)R^c$ 、 $-C(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-NR^fCR^c(=NR^e)$ 、 $-NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-S(O)(CH_2)_{1 \sim 3}R^c$ 、および  $-NR^fS(O)_2NR^fOR^d$  からなる群から選択され、

$R^5$  は、 $-Y^5 - (CH_2)_t - G$  であり、

$t$  は、0 または 1 の整数であり、

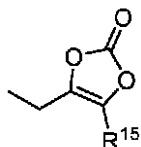
$G$  は、H、アミノ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1 \sim 6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1 \sim 6}$  ハロアルキル、必要に応じて置換されている  $C_{1 \sim 6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている  $C_{1 \sim 6}$  ハロアルコキシ、必要に応じて置換されている ( $C_{1 \sim 6}$  アルコキシ)  $C_{1 \sim 6}$  アルキル、必要に応じて置換されている  $C_{2 \sim 10}$  アルケニル、必要に応じて置換されている  $C_{2 \sim 10}$  アルキニル、必要に応じて置換されている  $C_{3 \sim 7}$  カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている  $C_{6 \sim 10}$  アリール、必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリール、必要に応じて置換されている ( $C_{3 \sim 7}$  カルボシクリル)  $C_{1 \sim 6}$  アルキル、必要に応じて置換されている (3 ~ 10 員のヘテロシクリル)  $C_{1 \sim 6}$  アルキル、必要に応じて置換されている ( $C_{6 \sim 10}$  アリール)  $C_{1 \sim 6}$  アルキル、( $C_{6 \sim 10}$  アリール)  $C_{1 \sim 6}$  アルコキシ、必要に応じて置換されている (5 ~ 10 員のヘテロアリール)  $C_{1 \sim 6}$  アルキル、アシル、C - カルボキシ、O - カルボキシ、C - アミド、N - アミド、S - スルホンアミド、N - スルホンアミド、 $-SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{0 \sim 3}SR^c$ 、 $-C(O)(CH_2)_{1 \sim 3}R^d$ 、 $-NR^fC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^fS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-C(=NR^e)R^c$ 、 $-C(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-NR^fCR^c(=NR^e)$ 、 $-NR^fC(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-S(O)(CH_2)_{1 \sim 3}R^c$ 、および  $-NR^fS(O)_2NR^fOR^d$  からなる群から選択され、

$R^6$  は、必要に応じて置換されている  $-(CH_2)_nC(O)OR$  およびカルボン酸イソスターからなる群から選択され、

$n$  は、0 ~ 6 から選択される整数であり、

$R$  は、H、 $C_{1 \sim 9}$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_{1 \sim 9}$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_{3 \sim 7}$  カルボシクリル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)(3 \sim 7$  員のヘテロシクリル)、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_{2 \sim 8}$  アルコキシアルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{1 \sim 9}$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{3 \sim 7}$  カルボシクリル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)O(3 \sim 7$  員のヘテロシクリル)、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{2 \sim 8}$  アルコキシアルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)C_{6 \sim 10}$  アリール、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)OC_{6 \sim 10}$  アリール、 $-CR^{10}R^{11}C(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)O(CH_2)_{1 \sim 3}C(O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)O(CH_2)_{2 \sim 3}OC(O)C_{1 \sim 4}$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)O(CH_2)_{1 \sim 3}C(O)OC_{1 \sim 4}$  アルキル、 $-CR^{10}R^{11}OC(O)(CH_2)_{1 \sim 3}OC(O)C_{1 \sim 4}$  アルキル、および

## 【化 1 5 8】



からなる群から選択され、

R<sup>7</sup> は、-OH、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 アルコキシ、アミノ、および -N(OR<sup>8</sup>)R<sup>9</sup> からなる群から選択され、

各 R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は、独立に、H、ハロゲン、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>3</sub> ~ 7 カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている C<sub>6</sub> ~ 10 アリール、および必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択され、

各 R<sup>10</sup> および R<sup>11</sup> は、独立に、H、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>3</sub> ~ 7 カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている C<sub>6</sub> ~ 10 アリール、および必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択され、

各 R<sup>13</sup> および R<sup>14</sup> は、独立に、H、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>3</sub> ~ 7 カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている C<sub>6</sub> ~ 10 アリール、および必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択され、

R<sup>15</sup> は、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 6 アルキルであり、

Y<sup>2</sup> は、-O-、-S-、および -NR<sup>9</sup>- からなる群から選択され、

Y<sup>5</sup> は、-S-、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、-O-、-CR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>-、および -NR<sup>g</sup>- からなる群から選択されるか、または Y<sup>5</sup> は、存在せず、

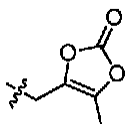
各 R<sup>c</sup>、R<sup>d</sup>、R<sup>e</sup>、R<sup>f</sup>、および R<sup>g</sup> は、独立に、H、ハロゲン、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>3</sub> ~ 7 カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている C<sub>6</sub> ~ 10 アリール、および必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択され、

各 R<sup>h</sup> および R<sup>i</sup> は、独立に、H、ハロゲン、シアノ、アミノ、C-アミド、N-アミド、必要に応じて置換されている C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、必要に応じて置換されている C<sub>3</sub> ~ 7 カルボシクリル、必要に応じて置換されている 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、必要に応じて置換されている C<sub>6</sub> ~ 10 アリール、および必要に応じて置換されている 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択されるか、あるいは R<sup>h</sup> および R<sup>i</sup> は、それらが結合する原子と一緒にあって、1つまたは複数の R<sup>5</sup> によりそれぞれ必要に応じて置換されている、C<sub>3</sub> ~ 7 カルボシクリル、3 ~ 10 員のヘテロシクリル、C<sub>6</sub> ~ 10 アリール、および 5 ~ 10 員のヘテロアリールからなる群から選択されるスピロ環式環または環系を形成する]。

(項目 6 7)

R が、H、C<sub>1</sub> ~ 9 アルキル、-CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)C<sub>1</sub> ~ 9 アルキル、-CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)OC<sub>1</sub> ~ 9 アルキル、-CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)C<sub>6</sub> ~ 10 アリール、-CR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>OC(O)OC<sub>6</sub> ~ 10 アリールおよび

## 【化 1 5 9】

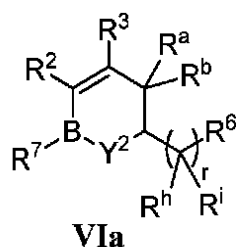


から選択される、項目 6 6 に記載の化合物。

(項目 6 8)

式 V I a の構造を有する、項目 6 6 もしくは 6 7 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩

【化 1 6 0】



。

(項目 6 9)

R<sup>a</sup> および R<sup>b</sup> の両方が、H である、項目 6 6 から 6 8 のいずれか一項に記載の化合物

。

(項目 7 0)

r が、1 であり、R<sup>h</sup> および R<sup>i</sup> の両方が、H である、項目 6 6 から 6 9 のいずれか一項に記載の化合物。

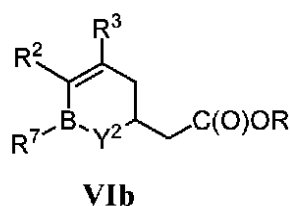
(項目 7 1)

R<sup>6</sup> が、- (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> C(O)OR であり、n が、0 である、項目 6 6 から 7 0 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 7 2)

式 V I b の構造を有する、項目 7 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩

【化 1 6 1】



。

(項目 7 3)

Y<sup>2</sup> が、- O - である、項目 6 6 から 7 2 のいずれか一項のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 7 4)

R<sup>7</sup> が、- OH である、項目 6 6 から 7 3 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 7 5)

前記薬学的に許容される塩が、アルカリ金属塩またはアンモニウム塩である、項目 1 から 7 4 のいずれか一項に記載の化合物。

(項目 7 6)

前記薬学的に許容される塩が、ナトリウム塩である、項目 7 5 に記載の化合物。

(項目 7 7)

治療有効量の項目 1 から 7 6 のいずれか一項に記載の化合物、および薬学的に許容される賦形剤を含む、医薬組成物。

(項目 7 8)

追加の医薬をさらに含む、項目 7 7 に記載の医薬組成物。

(項目 7 9)

前記追加の医薬が、抗菌剤、抗真菌剤、抗ウイルス剤、抗炎症剤、および抗アレルギー剤からなる群から選択される、項目 7 8 に記載の医薬組成物。

(項目 8 0)

前記追加の医薬が、 - ラクタム抗菌剤である、項目 7 9 に記載の医薬組成物。

(項目 8 1)

前記 - ラクタム抗菌剤が、アモキシシリン、アンピシリン（ピバンピシリン、ヘタシリン、パカンピシリン、メタンピシリン、タランピシリン）、エピシリン、カルベニシリン（カリンダシリン）、チカルシリン、テモシリン、アズロシリン、ピペラシリン、メズロシリン、メシリナム（ピブメシリナム）、スルベニシリン、ベンジルベニシリン（G）、クロメトシリン、ベンザチンベンジルベニシリン、プロカインベンジルベニシリン、アジドシリン、ペナメシリン、フェノキシメチルベニシリン（V）、プロピシリン、ベンザチンフェノキシメチルベニシリン、フェネチシリン、クロキサシリン（ジクロキサシリン、フルクロキサシリン）、オキサシリン、メチシリン、ナフシリン、ファロペナム、トモベナム、ラズベナム、セファゾリン、セファセトリル、セファドロキシル、セファレキシン、セファログリシン、セファロニウム、セファロリジン、セファロチン、セファピリン、セファトリジン、セファゼドン、セファザフル、セフラジン、セフロキサジン、セフテゾール、セファクロール、セファマンドール、セフミノクス、セフォニシド、セフォラニド、セフォチアム、セフプロジル、セフペラゾン、セフロキシム、セフゾナム、セフォキシチン、セフォテタン、セフメタゾール、ロラカルベフ、セフィキシム、セフトリアキソン、セフカペン、セフダロキシム、セフジニル、セフジトレン、セフェタメト、セフメノキシム、セフォジジム、セフォペラゾン、セフォタキシム、セフピミゾール、セフピラミド、セフポドキシム、セフスロジン、セフテラム、セフチブテン、セフチオレン、セフチゾキシム、フロモキセフ、ラタモキセフ、セフェピム、セフォゾبران、セフピロム、セフキノム、セフトピブロール、セフタロリン、C X A - 1 0 1、R W J - 5 4 4 2 8、M C - 0 4、5 4 6、M E 1 0 3 6、セフチオフル、セフキノム、セフォベシン、R W J - 4 4 2 8 3 1、R W J - 3 3 3 4 4 1、および R W J - 3 3 3 4 4 2 からなる群から選択される、項目 8 0 に記載の医薬組成物。

(項目 8 2)

前記 - ラクタム抗菌剤が、セフタジジム、ピアベナム、ドリベナム、エルタベナム、イミベナム、メロベナム、テビベナム、テビベナムピボキシル、アパベナム、およびパニベナムからなる群から選択される、項目 8 0 に記載の医薬組成物。

(項目 8 3)

前記 - ラクタム抗菌剤が、アズトレオナム、チゲモナム、B A L 3 0 0 7 2、S Y N 2 4 1 6、およびカルモナムからなる群から選択される、項目 8 0 に記載の医薬組成物。

(項目 8 4)

細菌感染を処置する方法であって、項目 1 から 7 6 のいずれか一項に記載の化合物を、それを必要とする被験体に投与するステップを含む、方法。

(項目 8 5)

前記被験体に、追加の医薬を投与するステップをさらに含む、項目 8 4 に記載の方法。

(項目 8 6)

前記追加の医薬が、抗菌剤、抗真菌剤、抗ウイルス剤、抗炎症剤、または抗アレルギー剤である、項目 8 5 に記載の方法。

(項目 8 7)

前記追加の医薬が、 - ラクタム抗菌剤である、項目 8 6 に記載の方法。

(項目 8 8)

前記 - ラクタム抗菌剤が、アモキシシリン、アンピシリン（ピバンピシリン、ヘタシリン、パカンピシリン、メタンピシリン、タランピシリン）、エピシリン、カルベニシリン（カリンダシリン）、チカルシリン、テモシリン、アズロシリン、ピペラシリン、メズロシリン、メシリナム（ピブメシリナム）、スルベニシリン、ベンジルベニシリン（G）、クロメトシリン、ベンザチンベンジルベニシリン、プロカインベンジルベニシリン、ア

ジドシリン、ペナメシリン、フェノキシメチルペニシリン（V）、プロピシリン、ベンザチンフェノキシメチルペニシリン、フェネチシリン、クロキサシリン（ジクロキサシリン、フルクロキサシリン）、オキサシリン、メチシリン、ナフシリン、ファロペナム、トモペナム、ラズペナム、セファゾリン、セファセトリル、セファドロキシル、セファレキシン、セファログリシン、セファロニウム、セファロリジン、セファロチン、セファピリン、セファトリジン、セファゼドン、セファザフル、セフラジン、セフロキサジン、セフテゾール、セファクロール、セファマンドール、セフミノクス、セフォニシド、セフォラニド、セフォチアム、セフプロジル、セフブペラゾン、セフロキシム、セフゾナム、セフォキシチン、セフォテタン、セフメタゾール、ロラカルベフ、セフィキシム、セフトリアキソン、セフカペン、セフダロキシム、セフジニル、セフジトレン、セフェタメト、セフメノキシム、セフォジジム、セフォペラゾン、セフォタキシム、セフピミゾール、セフピラミド、セフボドキシム、セフスロジン、セフテラム、セフチブテン、セフチオレン、セフチゾキシム、フロモキセフ、ラタモキセフ、セフェピム、セフォゾبران、セフピロム、セフキノム、セフトピブロール、セフタロリン、CXA-101、RWJ-54428、MC-04、546、ME1036、セフチオフル、セフキノム、セフォベシン、RWJ-442831、RWJ-333441、およびRWJ-333442からなる群から選択される、項目87に記載の方法。

(項目89)

前記 - ラクタム抗菌剤が、セフタジジム、ピアペナム、ドリペナム、エルタペナム、イミペナム、メロペナム、テビペナム、テビペナムピボキシル、アパペナム、およびパニペナムからなる群から選択される、項目87に記載の方法。

(項目90)

前記 - ラクタム抗菌剤が、アズトレオナム、チゲモナム、BAL30072、SYN2416、およびカルモナムからなる群から選択される、項目87に記載の方法。

(項目91)

前記被験体が、哺乳動物である、項目84から90のいずれか一項に記載の方法。

(項目92)

前記哺乳動物が、ヒトである、項目91に記載の方法。

(項目93)

前記感染が、*Pseudomonas acidovorans*、*Pseudomonas alcaligenes*、*Pseudomonas putida*、*Burkholderia cepacia*、*Aeromonas hydrophilia*、*Francisella tularensis*、*Morganelle morgani*、*Proteus mirabilis*、*Proteus vulgaris*、*Providencia alcalifaciens*、*Providencia rettgeri*、*Providencia stuartii*、*Acinetobacter baumannii*、*Bordetella pertussis*、*Bordetella parapertussis*、*Bordetella bronchiseptica*、*Haemophilus ducreyi*、*Pasteurella multocida*、*Pasteurella haemolytica*、*Branhamella catarrhalis*、*Borrelia burgdorferi*、*Kingella*、*Gardnerella vaginalis*、*Bacteroides distasonis*、*Bacteroides 3452A*ホモロジー群、*Clostridium difficile*、*Mycobacterium tuberculosis*、*Mycobacterium avium*、*Mycobacterium intracellulare*、*Mycobacterium leprae*、*Corynebacterium diphtheriae*、*Corynebacterium ulcerans*、*Streptococcus pneumoniae*、*Streptococcus agalactiae*、*Streptococcus pyogenes*、*Enterococcus faecalis*、*Enterococcus faecium*、*Sta*

phyllococcus aureus、Staphylococcus epidermidis、Staphylococcus saprophyticus、Staphylococcus intermedius、Staphylococcus hyicus subsp. hyicus、Staphylococcus haemolyticus、Staphylococcus hominis、およびStaphylococcus saccharolyticusからなる群から選択される細菌を含む、項目84から92のいずれか一項に記載の方法。

(項目94)

前記感染が、Pseudomonas aeruginosa、Pseudomonas fluorescens、Stenotrophomonas maltophilia、Escherichia coli、Citrobacter freundii、Salmonella typhimurium、Salmonella typhi、Salmonella paratyphi、Salmonella enteritidis、Shigella dysenteriae、Shigella flexneri、Shigella sonnei、Enterobacter cloacae、Enterobacter aerogenes、Klebsiella pneumoniae、Klebsiella oxytoca、Serratia marcescens、Acinetobacter calcoaceticus、Acinetobacter haemolyticus、Yersinia enterocolitica、Yersinia pestis、Yersinia pseudotuberculosis、Yersinia intermedia、Haemophilus influenzae、Haemophilus parainfluenzae、Haemophilus haemolyticus、Haemophilus parahaemolyticus、Helicobacter pylori、Campylobacter fetus、Campylobacter jejuni、Campylobacter coli、Vibrio cholerae、Vibrio parahaemolyticus、Legionella pneumophila、Listeria monocytogenes、Neisseria gonorrhoeae、Neisseria meningitidis、Moraxella、Bacteroides fragilis、Bacteroides vulgatus、Bacteroides ovalus、Bacteroides thetaiotaomicron、Bacteroides uniformis、Bacteroides eggertii、およびBacteroides splanchnicusからなる群から選択される細菌を含む、項目84から92のいずれか一項に記載の方法。