

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載
 【部門区分】第3部門第2区分
 【発行日】平成19年11月29日(2007.11.29)

【公表番号】特表2007-509980(P2007-509980A)
 【公表日】平成19年4月19日(2007.4.19)
 【年通号数】公開・登録公報2007-015
 【出願番号】特願2006-538361(P2006-538361)
 【国際特許分類】

C 0 7 H 17/00 (2006.01)
C 0 7 H 17/08 (2006.01)
A 6 1 K 31/7048 (2006.01)
A 6 1 K 31/7052 (2006.01)
A 6 1 P 31/04 (2006.01)
A 6 1 P 31/10 (2006.01)
A 6 1 P 33/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 31/12 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 1/04 (2006.01)
A 6 1 L 31/00 (2006.01)

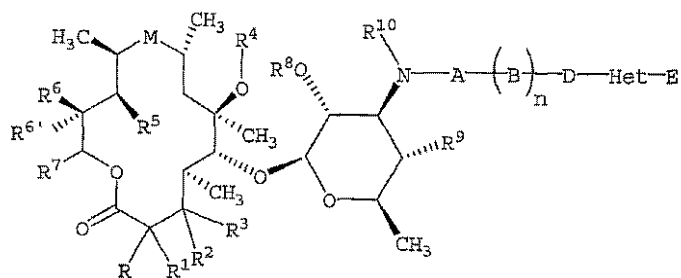
【F I】

C 0 7 H 17/00 C S P
 C 0 7 H 17/08 B
 A 6 1 K 31/7048
 A 6 1 K 31/7052
 A 6 1 P 31/04
 A 6 1 P 31/10
 A 6 1 P 33/00
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 L 31/00 B

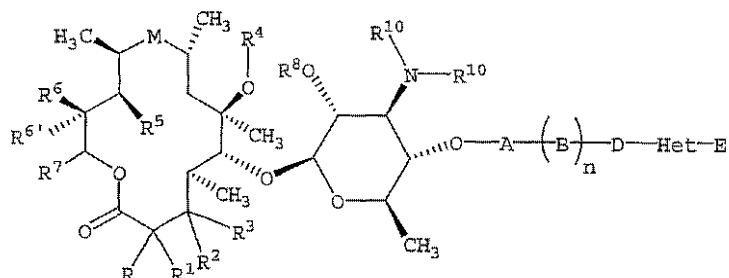
【手続補正書】
 【提出日】平成19年10月9日(2007.10.9)
 【手続補正1】
 【補正対象書類名】特許請求の範囲
 【補正対象項目名】全文
 【補正方法】変更
 【補正の内容】
 【特許請求の範囲】
 【請求項1】

式：

【化1】



または

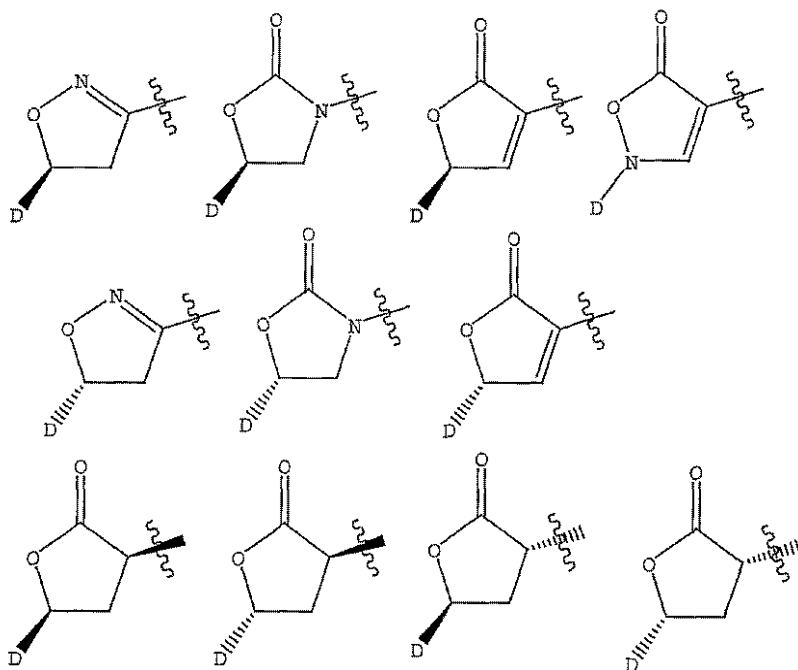


を有する化合物、またはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、もしくはプロドラッグであって、

ここで

D - H e t は、以下：

【化2】



からなる群より選択され、

A は、以下：

a) カルボニル、b) C_{1-6} アルキル、c) C_{2-6} アルケニル、d) $-C(O)-C_{1-6}$ アルキル、および e) $-C(O)-C_{2-6}$ アルケニルからなる群より選択され、

ここで

i) b) ~ e) のいずれかにおける、該 C_{1-6} アルキル基および該 C_{2-6} アルケニル基の 0 ~ 2 個の炭素原子は、必要に応じて O、 $S(O)_p$ 、および NR^{11} からなる群

より選択される部分により置換され、そして

i) b) ~ e) のいずれかは、必要に応じて 1 個以上の $R^{1,2}$ 基で置換され；

B は、以下：

a) - C(O)NH -、 b) - C(S)NH -、 c) - NHC(O) -、 d) - NHC(S) -、 e) - SO₂NH -、 f) - NHS(O)₂ -、 g) - OC(O)NH -、 h) - OC(S)NH -、 i) - NHC(O)NH -、 j) - NHC(S)NH -、 k) - NHC(O)O -、 l) - NHC(S)O -、 および m) - NR^{1,1} - からなる群より選択され；

n は、0 または 1 であり；

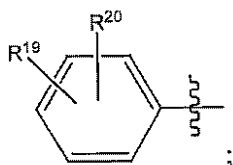
D は、以下：

a) - CH₂ -、 b) - C(O) -、 c) - C(S) -、 d) - C(=NOR^{1,1}) -、 e) - CH₂CH₂ -、 f) - OCH₂ -、 g) - SCH₂ -、 h) - SOCH₂ -、 i) - SO₂CH₂ -、 j) - NR^{1,1}CH₂ -、 k) - COCH₂ -、 l) - CSCH₂ -、 および m) - C(=NOR^{1,1})CH₂ - からなる群より選択され；

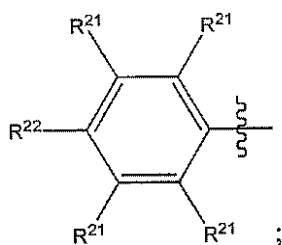
E は、以下：

【化 3】

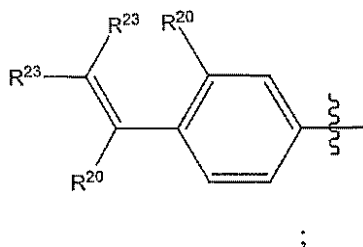
a)



b)



c)



d) 窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される 1 個以上のヘテロ原子を含む、5 ~ 10 員の、飽和、不飽和、または芳香族の複素環であって、そして必要に応じて 1 個以上の $R^{1,2}$ 基で置換される複素環；

e) 必要に応じて 1 個以上の $R^{1,2}$ 基で置換される、C₅₋₁₀ の飽和、不飽和、または芳香族の炭素環；

f) C₁₋₈ アルキル、

g) C₂₋₈ アルケニル、

- h) C_{2-8} アルキニル、
- i) C_{1-8} アルコキシ
- j) C_{1-8} アルキルチオ、
- k) C_{1-8} アシル
- l) $S(O)_r R^{11}$; ならびに
- m) 水素

からなる群より選択され、

ここで、f) ~ k) のいずれかは、必要に応じて

i) 1個以上の R^{12} 基;

ii) 窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される1個以上のヘテロ原子を含む、5~6員の、飽和、不飽和、または芳香族の複素環であって、そして必要に応じて1個以上の R^{12} 基で置換される複素環; または

iii) 必要に応じて1個以上の R^{12} 基で置換される、 C_{5-10} の飽和、不飽和、または芳香族の炭素環で置換され;

Mは、以下:

a) $-C(O)-$ 、b) $-C(=NOR^{11})-$ 、c) $-CH(-OR^{11})-$ 、d) $-NR^{11}-CH_2-$ 、e) $-CH_2-NR^{11}-$ 、f) $-CH(NR^{11}R^{11})-$ 、g) $-C(=NNR^{11}R^{11})-$ 、h) $-NR^{11}-C(O)-$ 、i) $-C(O)NR^{11}-$ 、および j) $-C(=NR^{11})-$ からなる群より選択され;

Rは、Hおよび C_{1-6} アルキルからなる群より選択され;

R^1 は、以下:

a) H、b) Cl、c) F、d) Br、e) I、f) $-NR^{11}R^{11}$ 、g) $-NR^{11}C(O)R^{11}$ 、h) $-OR^{11}$ 、i) $-OC(O)R^{11}$ 、j) $-OC(O)OR^{11}$ 、k) $-OC(O)NR^{11}R^{11}$ 、l) $-O-C_{1-6}$ アルキル $-R^{12}$ 、m) $-OC(O)-C_{1-6}$ アルキル $-R^{12}$ 、n) $-OC(O)O-C_{1-6}$ アルキル $-R^{12}$ 、o) $-OC(O)NR^{11}-C_{1-6}$ アルキル $-R^{12}$ 、p) C_{1-6} アルキル、q) C_{1-6} アルケニル、r) C_{1-6} アルキニルからなる群より選択され、

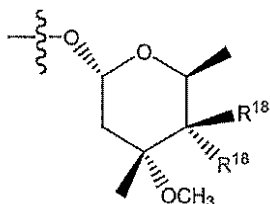
ここで、l) ~ r) のいずれかは必要に応じて1個以上の R^{12} 基で置換され;

R^2 は、Hであり;

R^3 は、以下:

a) H、b) $-OR^{11}$ 、c) $-O-C_{1-6}$ アルキル $-R^{12}$ 、d) $-OC(O)R^{11}$ 、e) $-OC(O)-C_{1-6}$ アルキル $-R^{12}$ 、f) $-OC(O)OR^{11}$ 、g) $-OC(O)O-C_{1-6}$ アルキル $-R^{12}$ 、h) $-OC(O)NR^{11}R^{11}$ 、i) $-OC(O)NR^{11}-C_{1-6}$ アルキル $-R^{12}$ 、および j)

【化4】



からなる群より選択されるか;

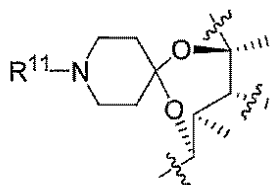
あるいは、 R^2 および R^3 は、一緒になってカルボニル基を形成し;

R^4 は、以下:

a) H、b) R^{11} 、c) $-C(O)R^{11}$ 、d) $-C(O)OR^{11}$ 、e) $-C(O)NR^{11}R^{11}$ 、f) $-C_{1-6}$ アルキル $-G-R^{11}$ 、g) $-C_{2-6}$ アルケニル $-G-R^{11}$ 、および h) $-C_{2-6}$ アルキニル $-G-R^{11}$ からなる群より選択されるか;

あるいは、 R^3 および R^4 は、それらが結合する原子と一緒にって

【化5】



を形成し、

Gは、以下：

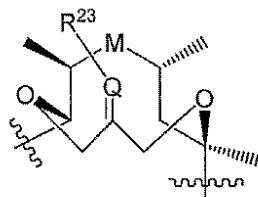
a) - C(O) -, b) - C(O)O -, c) - C(O)NR^{1 1} -, d) - C(=NR^{1 1}) -, e) - C(=NR^{1 1})O -, f) - C(=NR^{1 1})NR^{1 1} -, g) - OC(O) -, h) - OC(O)O -, i) - OC(O)NR^{1 1} -, j) - NR^{1 1}C(O) -, k) - NR^{1 1}C(O)O -, l) - NR^{1 1}C(O)NR^{1 1} -, m) - NR^{1 1}C(=NR^{1 1})NR^{1 1} -, および o) - S(O)_p - からなる群より選択され；

R⁵ は、以下：

a) R^{1 1}, b) - OR^{1 1}, c) - NR^{1 1}R^{1 1}, d) - O - C₁₋₆ アルキル - R^{1 2}, e) - C(O) - R^{1 1}, f) - C(O) - C₁₋₆ アルキル - R^{1 2}, g) - OC(O) - R^{1 1}, h) - OC(O) - C₁₋₆ アルキル - R^{1 2}, i) - OC(O)O - R^{1 1}, j) - OC(O)O - C₁₋₆ アルキル - R^{1 2}, k) - OC(O)NR^{1 1}R^{1 1}, l) - OC(O)NR^{1 1} - C₁₋₆ アルキル - R^{1 2}, m) - C(O) - C₂₋₆ アルケニル - R^{1 2}, および n) - C(O) - C₂₋₆ アルキニル - R^{1 2} からなる群より選択されるか；

あるいは、 R^4 および R^5 は、それらが結合する原子と一緒にって

【化6】



を形成し、

ここで、

Qは、CHまたはNであり、そして

R^{2 3} は、- OR^{1 1}、または R^{1 1} であり；

R⁶ は、以下：

a) - OR^{1 1}, b) - C₁₋₆ アルコキシ - R^{1 2}, c) - C(O)R^{1 1}, d) - OC(O)R^{1 1}, e) - OC(O)OR^{1 1}, f) - OC(O)NR^{1 1}R^{1 1}, および g) - NR^{1 1}R^{1 1} からなる群より選択されるか；

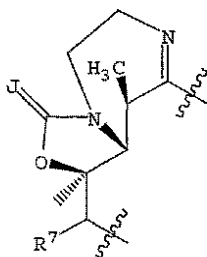
あるいは、 R^5 および R^6 は、それらが結合する原子と一緒にって、

a) - OC(R^{1 2})₂O -, b) - OC(O)O -, c) - OC(O)NR^{1 1} -, d) - NR^{1 1}C(O)O -, e) - OC(O)NOR^{1 1} -, f) - NOR^{1 1} - C(O)O -, g) - OC(O)NNR^{1 1}R^{1 1} -, h) - NNR^{1 1}R^{1 1} - C(O)O -, i) - OC(O)C(R^{1 2})₂ -, j) - C(R^{1 2})₂C(O)O -, k) - OC(S)O -, l) - OC(S)NR^{1 1} -, m) - NR^{1 1}C(S)O -, n) - OC(S)NOR^{1 1} -, o) - NOR^{1 1} - C(S)O -, p) - OC(S)NNR^{1 1}R^{1 1} -, q) - NNR^{1 1}R^{1 1} - C(S)O -, r) - OC(S)C(R^{1 2})₂ -, お

よび s) - C (R ^{1 2}) ₂ C (S) O - からなる群より選択されるリンカーを介して互いに結合することにより 5 員環を形成するか；

あるいは、M、R ⁵ および R ⁶ は、それらが結合する原子と一緒にあって

【化 7】



を形成し、

ここで、J は、O および N R ^{1 1} からなる群より選択され；

R ⁶ ' は、以下：

a) - H、b) - C _{1 - 4} アルキル、c) さらに C _{1 - 1 2} アルキルまたは、1 種以上のハロゲンで置換され得る、C _{2 - 4} アルケニル、d) さらに C _{1 - 1 2} アルキルまたは、1 種以上のハロゲンで置換され得る、C _{2 - 4} アルキニル、e) さらに C _{1 - 1 2} アルキルまたは、1 種以上のハロゲンで置換され得る、アリーールまたはヘテロアリーール、f) - C (O) H、g) - C O O H、h) - C N、i) - C O O R ^{1 1}、j) - C (O) N R ^{1 1} R ^{1 1}、k) - C (O) R ^{1 1}、および l) - C (O) S R ^{1 1} からなる群より選択され、ここで b) は、さらに a a) - O R ^{1 1}、b b) ハロゲン、c c) - S R ^{1 1}、d d) さらにハロゲン、ヒドロキシル、C _{1 - 6} アルコキシ、またはアミノで置換され得る、C _{1 - 1 2} アルキル、e e) - O R ^{1 1}、f f) - S R ^{1 1}、g g) - N R ^{1 1} R ^{1 1}、h h) - C N、i i) - N O ₂、j j) - N C (O) R ^{1 1}、k k) - C O O R ^{1 1}、l l) - N ₃、m m) = N - O - R ^{1 1}、n n) = N R ^{1 1}、o o) = N - N R ^{1 1} R ^{1 1}、p p) = N - N H - C (O) R ^{1 1}、および q q) = N - N H - C (O) N R ^{1 1} R ^{1 1} からなる群より選択される 1 個以上の置換基で置換されるか；

あるいは、R ⁶ および R ⁶ ' は、それらが結合する原子と一緒にあって、エポキシド、カルボニル、オレフィン、または置換されたオレフィン、または C ₃ ~ C ₇ の炭素環、カーボネート、またはカルバメートを形成し、ここで該カルバメートの窒素は、さらに C _{1 - 6} アルキルで置換され得；

R ⁷ は、a) C _{1 - 6} アルキル、b) C _{2 - 6} アルケニル、および c) C _{2 - 6} アルキニルからなる群より選択され、

ここで、a) ~ c) のいずれかは、必要に応じて 1 個以上の R ^{1 2} 基で置換され；

R ⁸ は、H および - C (O) R ^{1 1} からなる群より選択され；

R ⁹ は、H、OH、および O R ^{1 1} からなる群より選択され；

R ^{1 0} は、以下：

a) H、b) R ^{1 1}、c) - C _{1 - 6} アルキル - G - R ^{1 2}、d) - C _{2 - 6} アルケニル - G - R ^{1 2}、および e) - C _{2 - 6} アルキニル - G - R ^{1 2} からなる群より選択され、

ここで、c) ~ e) のいずれかにおいて C _{1 - 6} アルキル基、C _{2 - 6} アルケニル基、および C _{2 - 6} アルキニル基は、必要に応じて 1 個以上の R ^{1 2} 基で置換され；

R ^{1 1} は、各出現において、独立に a) H、b) C _{1 - 6} アルキル、c) C _{2 - 6} アルケニル、d) C _{2 - 6} アルキニル、e) C _{6 - 1 0} の飽和、不飽和、または芳香族の炭素環、f) 窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される 1 個以上のヘテロ原子を含む、3 ~ 1 2 員の飽和、不飽和、または芳香族の複素環、g) - C (O) - C _{1 - 6} アルキル、h) - C (O) - C _{2 - 6} アルケニル、i) - C (O) - C _{2 - 6} アルキニル、j) - C (O) - C _{6 - 1 0} の飽和、不飽和、または芳香族の炭素環、k) 窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される 1 個以上のヘテロ原子を含む、- C (O) - 3 ~ 1 2 員

の飽和、不飽和、または芳香族の複素環、l) - C(O)O - C₁₋₆ アルキル、m) - C(O)O - C₂₋₆ アルケニル、n) - C(O)O - C₂₋₆ アルキニル、o) - C(O)O - C₆₋₁₀ の飽和、不飽和、または芳香族の炭素環、p) 窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される1個以上のヘテロ原子を含む、- C(O)O - 3 ~ 12 員の飽和、不飽和、または芳香族の複素環、および q) - C(O)NR^{1 3} R^{1 3} からなる群より選択され、

ここで b) ~ p) のいずれかは、必要に応じて1個以上の R^{1 2} 基で置換されるか、

あるいは、NR^{1 1} R^{1 1} は、R^{1 1} 基が結合している窒素原子ならびに必要に応じて O、S(O)_p、および NR^{1 5} からなる群より選択される1個以上の部分を含む、3 ~ 7 員の飽和、不飽和の環、または芳香環を形成し、

R^{1 2} は、以下：

a) R^{1 4}、b) C₁₋₈ アルキル、c) C₂₋₈ アルケニル、d) C₂₋₈ アルキニル、e) C₃₋₁₂ の飽和、不飽和、または芳香族の炭素環、f) 窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される1個以上のヘテロ原子を含む、3 ~ 12 員の飽和、不飽和、または芳香族の複素環、ならびに g) - NR^{1 5} C(O)OR^{1 5} からなる群より選択され、

ここで b) ~ f) のいずれかは、必要に応じて1個以上の R^{1 4} 基で置換され、

R^{1 3} は、各出現において、独立に、以下：

a) H、b) C₁₋₆ アルキル、c) C₂₋₆ アルケニル、d) C₂₋₆ アルキニル、e) C₃₋₁₀ の飽和、不飽和、または芳香族の炭素環、ならびに f) 窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される1個以上のヘテロ原子を含む、3 ~ 10 員の飽和、不飽和、または芳香族の複素環からなる群より選択され、

ここで b) ~ f) のいずれかは必要に応じて、カルボニル；ホルミル；F；Cl；Br；I；CN；NO₂；OR^{1 5}；- S(O)_p R^{1 5}；- C(O)R^{1 5}；- C(O)O R^{1 5}；- OC(O)R^{1 5}；- C(O)NR^{1 5} R^{1 5}；- OC(O)NR^{1 5} R^{1 5}；- C(=NR^{1 5})R^{1 5}；- C(R^{1 5})(R^{1 5})OR^{1 5}；- C(R^{1 5})₂O C(O)R^{1 5}；- C(R^{1 5})(OR^{1 5})(CH₂)_rNR^{1 5} R^{1 5}；- NR^{1 5} R^{1 5}；- NR^{1 5} OR^{1 5}；- NR^{1 5} C(O)R^{1 5}；- NR^{1 5} C(O)OR^{1 5}；- NR^{1 5} C(O)NR^{1 5} R^{1 5}；- NR^{1 5} S(O)_r R^{1 5}；- C(OR^{1 5})(OR^{1 5})R^{1 5}；- C(R^{1 5})₂NR^{1 5} R^{1 5}；= NR^{1 5}；- C(S)NR^{1 5} R^{1 5}；- NR^{1 5} C(S)R^{1 5}；- OC(S)NR^{1 5} R^{1 5}；- NR^{1 5} C(S)OR^{1 5}；- NR^{1 5} C(S)NR^{1 5} R^{1 5}；- SC(O)R^{1 5}；C₁₋₈ アルキル、C₂₋₈ アルケニル；C₂₋₈ アルキニル、C₁₋₈ アルコキシ；C₁₋₈ アルキルチオ；C₁₋₈ アシル；飽和、不飽和、または芳香族の C₃₋₁₀ の炭素環；ならびに窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される1個以上のヘテロ原子を含む、飽和、不飽和、または芳香族の 3 ~ 10 員複素環、からなる群より選択される1個以上の部分で置換されるか、

あるいは、NR^{1 3} R^{1 3} は、R^{1 3} 基が結合している窒素原子ならびに必要に応じて O、S(O)_p、NR^{1 5} および N からなる群より選択される1個以上の部分を含む、3 ~ 10 員の飽和、不飽和の環、または芳香環を形成するか；

あるいは、CR^{1 3} R^{1 3} は、カルボニル基を形成し；

R^{1 4} は、各出現において、以下：

a) H、b) カルボニル、c) F、d) Cl、e) Br、f) I、g) (CR^{1 3} R^{1 3})_r CF₃、h) (CR^{1 3} R^{1 3})_r CN、i) (CR^{1 3} R^{1 3})_r NO₂、j) (CR^{1 3} R^{1 3})_r NR^{1 3} (CR^{1 3} R^{1 3})_t R^{1 6}、k) (CR^{1 3} R^{1 3})_r OR^{1 6}、l) (CR^{1 3} R^{1 3})_r S(O)_p (CR^{1 3} R^{1 3})_t R^{1 6}、m) (CR^{1 3} R^{1 3})_r C(O) (CR^{1 3} R^{1 3})_t R^{1 6}、n) (CR^{1 3} R^{1 3})_r OC(O) (CR^{1 3} R^{1 3})_t R^{1 6}、o) (CR^{1 3} R^{1 3})_r SC(O) (CR^{1 3} R^{1 3})_t R^{1 6}、p) (CR^{1 3} R^{1 3})_r C(O)O (CR^{1 3} R^{1 3})_t R^{1 6}、q) (CR^{1 3} R^{1 3})_r NR^{1 3} C(O) (CR^{1 3} R^{1 3})_t R^{1 6}、r) (CR^{1 3}

R^{13})_r C (O) N R^{13} (C R^{13} R^{13})_t R^{16} 、 s) (C R^{13} R^{13})_r C
 (= N R^{13}) (C R^{13} R^{13})_t R^{16} 、 t) (C R^{13} R^{13})_r C (= N N R^{13}
 R^{13}) (C R^{13} R^{13})_t R^{16} 、
 u) (C R^{13} R^{13})_r C (= N N R^{13} C (O) R^{13}) (C R^{13} R^{13})_t R^{16} 、
 v) (C R^{13} R^{13})_r C (= N O R^{16}) (C R^{13} R^{13})_t R^{16} 、
 w) (C R^{13} R^{13})_r N R^{13} C (O) O (C R^{13} R^{13})_t R^{16} 、
 x) (C R^{13} R^{13})_r O C (O) N R^{13} (C R^{13} R^{13})_t R^{16} 、
 y) (C R^{13} R^{13})_r N R^{13} C (O) N R^{13} (C R^{13} R^{13})_t R^{16} 、
 z) (C R^{13} R^{13})_r N R^{13} S (O)_p (C R^{13} R^{13})_t R^{16} 、
 a a) (C R^{13} R^{13})_r S (O)_p N R^{13} (C R^{13} R^{13})_t R^{16} 、 b b) (C R^{13} R^{13})_r N R^{13} S (O)_p N R^{13} (C R^{13} R^{13})_t R^{16} 、 c c) (C R^{13} R^{13})_r N R^{13} R^{13} 、 d d) C_{1-6} アルキル、 e e) C_{2-6} アルケニル、 f f) C_{2-6} アルキニル、 g g) (C R^{13} R^{13})_r - C_{3-10} の飽和、不飽和、または芳香族の炭素環、ならびに h h) 窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される 1 個以上のヘテロ原子を含む、(C R^{13} R^{13})_r - 3 ~ 10 員の飽和、不飽和、または芳香族の複素環からなる群より選択され、

ここで、d d) ~ h h) のいずれかは必要に応じて、1 個以上の R^{16} 基で置換されるか、

あるいは、2 個の R^{14} 基は、- O (C H ₂)_s O - を形成し得；

R^{15} は、以下：

a) H、 b) C_{1-6} アルキル、 c) C_{2-6} アルケニル、 d) C_{2-6} アルキニル、 e) C_{3-10} の飽和、不飽和、または芳香族の炭素環、 f) 窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される 1 個以上のヘテロ原子を含む、3 ~ 10 員の飽和、不飽和、または芳香族の複素環、 g) - C (O) - C_{1-6} アルキル、 h) - C (O) - C_{1-6} アルケニル、 i) - C (O) - C_{1-6} アルキニル、 j) - C (O) - C_{3-10} の飽和、不飽和、または芳香族の炭素環、ならびに k) 窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される 1 個以上のヘテロ原子を含む、- C (O) - 3 ~ 10 員の飽和、不飽和、または芳香族の複素環からなる群より選択され、

ここで、b) ~ j) のいずれかは必要に応じて、H ; F ; Cl ; Br ; I ; CN ; NO₂ ; OH ; NH₂ ; NH (C_{1-6} アルキル) ; N (C_{1-6} アルキル)₂ ; C_{1-6} アルコキシ ; アリール ; 置換アリール ; ヘテロアリール ; 置換ヘテロアリール ; ならびに必要に応じてアリール、置換アリール、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、F、Cl、Br、I、CN、NO₂、および OH からなる群より選択される 1 個以上の部分で置換された C_{1-6} アルキルからなる群より選択される 1 個以上の部分で置換され；

R^{16} は、各出現において、独立に、以下：

a) R^{17} 、 b) C_{1-6} アルキル、 c) C_{2-6} アルケニル、 d) C_{2-6} アルキニル、 e) - C_{3-10} の飽和、不飽和、または芳香族の炭素環、ならびに f) 窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される 1 個以上のヘテロ原子を含む、- 3 ~ 10 員の飽和、不飽和、または芳香族の複素環からなる群より選択され、

ここで、b) ~ f) のいずれかは必要に応じて、1 個以上の R^{17} 基で置換され、

R^{17} は、各出現において、独立に、以下：

a) H、 b) カルボニル、 c) F、 d) Cl、 e) Br、 f) I、 g) (C R^{13} R^{13})_r C F₃、 h) (C R^{13} R^{13})_r CN、 i) (C R^{13} R^{13})_r NO₂、 j) (C R^{13} R^{13})_r (C R^{13} R^{13})、 k) (C R^{13} R^{13})_r O R¹¹、 l) (C R^{13} R^{13})_r S (O)_p R¹³、 m) (C R^{13} R^{13})_r C (O) R¹³、 n) (C R^{13} R^{13})_r C (O) O R¹³、 o) (C R^{13} R^{13})_r O C (O) R¹³、 p) (C R^{13} R^{13})_r N R^{13} C (O) R¹³、 q) (C R^{13} R^{13})_r C (O) N R^{13} R^{13} 、 r) (C R^{13} R^{13})_r C (= N R^{13}) R¹³、 s) (C R^{13} R^{13})_r N R^{13} C (O) N R^{13} R^{13} 、 t) (C R^{13} R^{13})_r N R^{13} S (O)

R^{13} 、 u) ($CR^{13}R^{13}$) $_r$ $S(O)_p$ $NR^{13}R^{13}$ 、 v) ($CR^{13}R^{13}$) $_r$ $NR^{13}S(O)_p$ $NR^{13}R^{13}$ 、 w) C_{1-6} アルキル、 x) C_{2-6} アルケニル、 y) C_{2-6} アルキニル、 z) ($CR^{13}R^{13}$) $_r$ - C_{3-10} の飽和、不飽和、または芳香族の炭素環、ならびに aa) 窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される 1 個以上のヘテロ原子を含む、($CR^{13}R^{13}$) $_r$ - $3-10$ 員の飽和、不飽和、または芳香族の複素環からなる群より選択され、

ここで、 w) ~ aa) のいずれかは必要に応じて、 R^{13} ; F ; Cl ; Br ; I ; CN ; NO_2 ; -OR¹³ ; -NH₂ ; -NH(C_{1-6} アルキル) ; -N(C_{1-6} アルキル)₂ ; C_{1-6} アルコキシ ; C_{1-6} アルキルチオ ; および C_{1-6} アシルからなる群より選択される 1 個以上の部分で置換され ;

R^{18} は、各出現において、独立に、以下 :

a) H、 b) OR¹⁵、 c) -O- C_{1-6} アルキル - OC(O) R^{15} 、 d) -O- C_{1-6} アルキル - OC(O) R^{15} 、 e) -O- C_{1-6} アルキル - OC(O) NR^{15} 、 f) -O- C_{1-6} アルキル - C(O) $NR^{15}R^{15}$ 、 g) -O- C_{1-6} アルキル - $NR^{15}C(O)R^{15}$ 、 h) -O- C_{1-6} アルキル - $NR^{15}C(O)O$ 、 i) -O- C_{1-6} アルキル - $NR^{15}C(O)NR^{15}R^{15}$ 、 j) -O- C_{1-6} アルキル - $NR^{15}C(=NH)NR^{15}R^{15}$ 、 k) -O- C_{1-6} アルキル - $S(O)_pR^{15}$ 、 l) -O- C_{2-6} アルケニル - OC(O) R^{15} 、 m) -O- C_{2-6} アルケニル - OC(O)OR¹⁵、 n) -O- C_{2-6} アルケニル - OC(O) $NR^{15}R^{15}$ 、 o) -O- C_{2-6} アルケニル - C(O) $NR^{15}R^{15}$ 、 p) -O- C_{2-6} アルケニル - $NR^{15}C(O)R^{15}$ 、 q) -O- C_{2-6} アルケニル - $NR^{15}C(O)NR^{15}R^{15}$ 、 r) -O- C_{2-6} アルケニル - $NR^{15}C(=NH)NR^{15}R^{15}$ 、 t) -O- C_{2-6} アルケニル - $S(O)_pR^{15}$ 、 u) -O- C_{2-6} アルキニル - OC(O) R^{15} 、 v) -O- C_{2-6} アルキニル - OC(O)OR¹⁵、 w) -O- C_{2-6} アルキニル - OC(O) $NR^{15}R^{15}$ 、 x) -O- C_{2-6} アルキニル - C(O) $NR^{15}R^{15}$ 、 y) -O- C_{2-6} アルキニル - $NR^{15}C(O)R^{15}$ 、 z) -O- C_{2-6} アルキニル - $NR^{15}C(O)OR^{15}$ 、 aa) -O- C_{2-6} アルキニル - $NR^{15}C(O)NR^{15}R^{15}$ 、 bb) -O- C_{2-6} アルキニル - $NR^{15}C(=NH)NR^{15}R^{15}$ 、 cc) -O- C_{2-6} アルキニル - $S(O)_pR^{15}$; および dd) - $NR^{15}R^{15}$ からなる群より選択されるか、

あるいは、2 個の R^{18} 基は、一緒になって =O、=NOR¹⁵、または =NNR¹⁵ R^{15} を形成し ;

R^{19} は、 R^{12} であり ;

R^{20} は、以下 :

a) R^{13} 、 b) F、 c) Cl、 d) Br、 e) I、 f) CN、 g) NO_2 、および h) OR¹¹ からなる群より選択されるか ;

あるいは、 R^{19} および R^{20} は、一緒になって -O(CH₂) $_r$ O- であり ;

R^{21} は、各出現において、独立に、以下 :

a) H、 b) F、 c) Cl、 d) Br、 e) I、 f) CN、 g) -OR¹¹、 h) NO_2 、 i) - $NR^{11}R^{11}$ 、 j) C_{1-6} アルキル、 k) C_{1-6} アシル、および l) C_{1-6} アルコキシからなる群より選択され ;

R^{22} は、以下 :

a) C_{1-6} アルキル、 b) C_{2-6} アルケニル、 c) C_{2-6} アルキニル、 d) C_{1-6} アシル、 e) C_{1-6} アルコキシ、 f) C_{1-6} アルキルチオ、 g) 飽和、不飽和、または芳香族の C_{5-10} の炭素環、 h) 窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される 1 個以上のヘテロ原子を含む、飽和、不飽和、または芳香族の $5-10$ 員の複素環、 i) 窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される 1 個以上のヘテロ原子を含む、-O- C_{1-6} アルキルの飽和、不飽和、または芳香族の $5-10$ 員の複素環、 j) 窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される 1 個以上のヘテロ原子を含む、- NR^{11} -

C₁ - 6 アルキルの飽和、不飽和、または芳香族の5 ~ 10員の複素環、k)窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される1個以上のヘテロ原子を必要に応じて含む、飽和、不飽和、または芳香族の10員の2環系、l)窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される1個以上のヘテロ原子を必要に応じて含む、飽和、不飽和、または芳香族の13員の3環系、m) - OR^{1 1}、n) - NR^{1 1} R^{1 1}、o) S(O)_r R^{1 1}、ならびにp) R^{2 1} からなる群より選択され、

ここで、a) ~ l)のいずれかは必要に応じて1個以上のR^{1 2}基で置換されるか；

あるいは、R^{2 2}基および1個のR^{2 1}基は、それらが結合している原子と一緒にあって、必要に応じて1個以上のR^{1 2}基で置換された、5 ~ 7員の飽和または不飽和の炭素環を形成するか；または窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される1個以上の原子を含み、そして必要に応じて1個以上のR^{1 2}基で置換される、5 ~ 7員の飽和または不飽和の複素環を形成し；

R^{2 3}は、各出現において、独立に、以下：

a)水素；b)電子吸引基；c)アリール；d)置換アリール；e)ヘテロアリール；f)置換ヘテロアリール；およびg)必要に応じて1個以上のR^{1 2}基で置換される、C₁ - 6 アルキルからなる群より選択されるか；

あるいは、任意のR^{2 3}および任意のR^{2 0}は、それらが結合している原子と一緒にあって、必要に応じて1個以上のR^{1 2}基で置換される、5 ~ 7員の飽和または不飽和の炭素環を形成するか；または窒素、酸素、および硫黄からなる群より選択される1個以上の原子を含み、そして必要に応じて1個以上のR^{1 2}基で置換される、5 ~ 7員の飽和または不飽和の複素環を形成し；

pは、各出現において、0, 1, および2からなる群より選択され；

rは、各出現において、0, 1, および2からなる群より選択され；

sは、各出現において、1, 2, 3, または4からなる群より選択され；

tは、各出現において、0, 1, または2からなる群より選択され；

uは、各出現において、1, 2, 3, 4, または5からなる群より選択され；そして

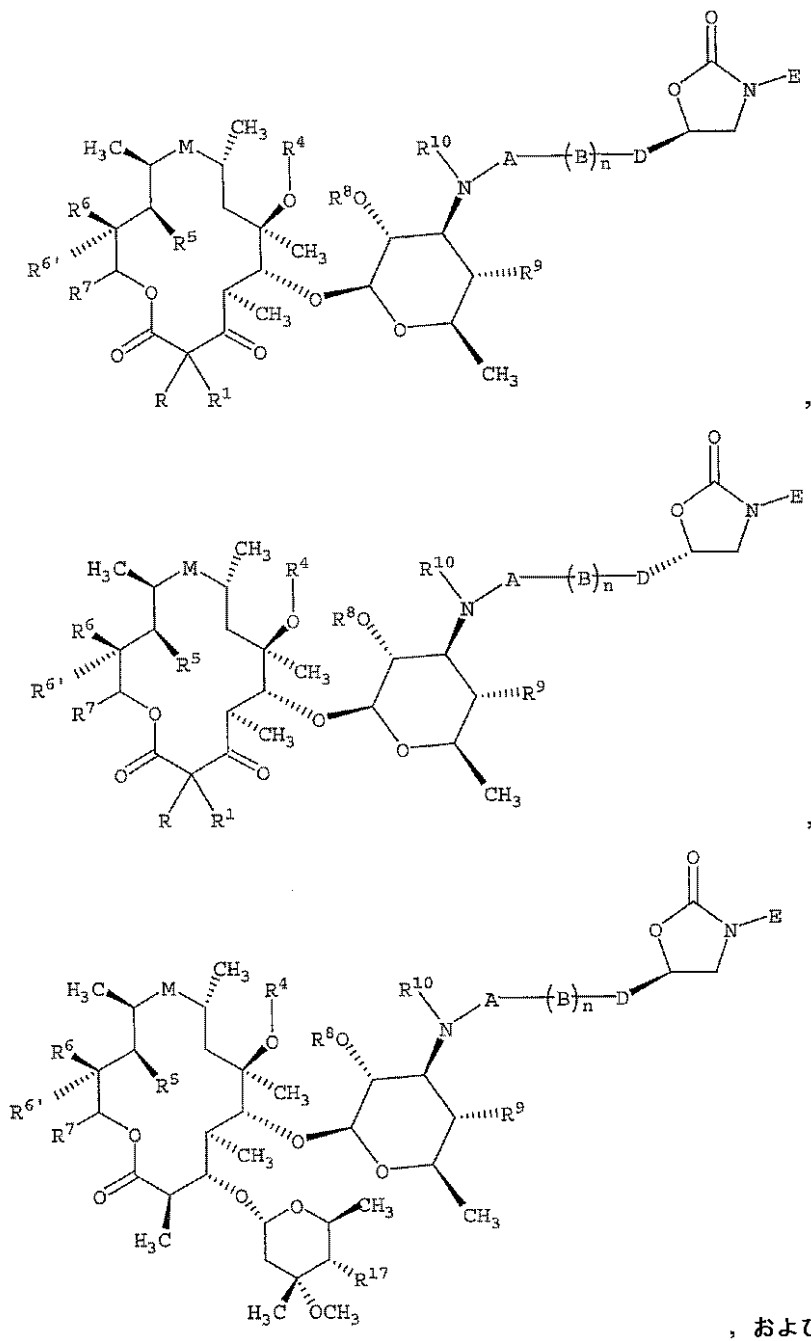
vは、各出現において、0, 1, 2, または3からなる群より選択される、

化合物、またはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、もしくはプロドラッグ。

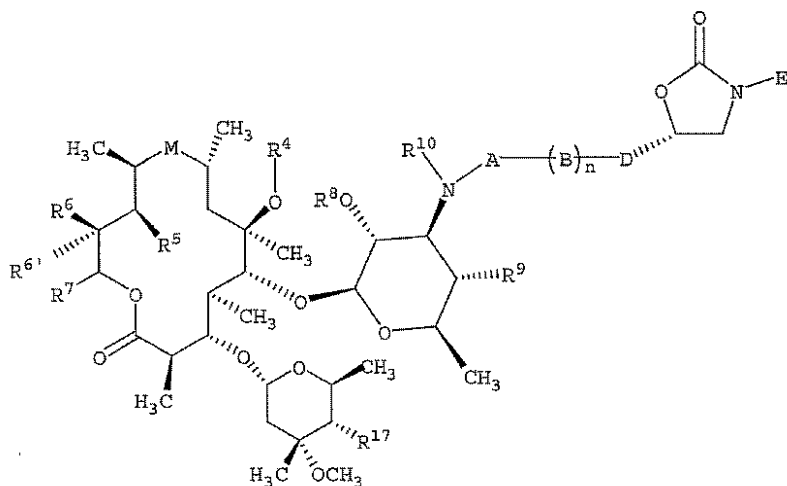
【請求項2】

以下：

【化 8 - 1】



【化 8 - 2】



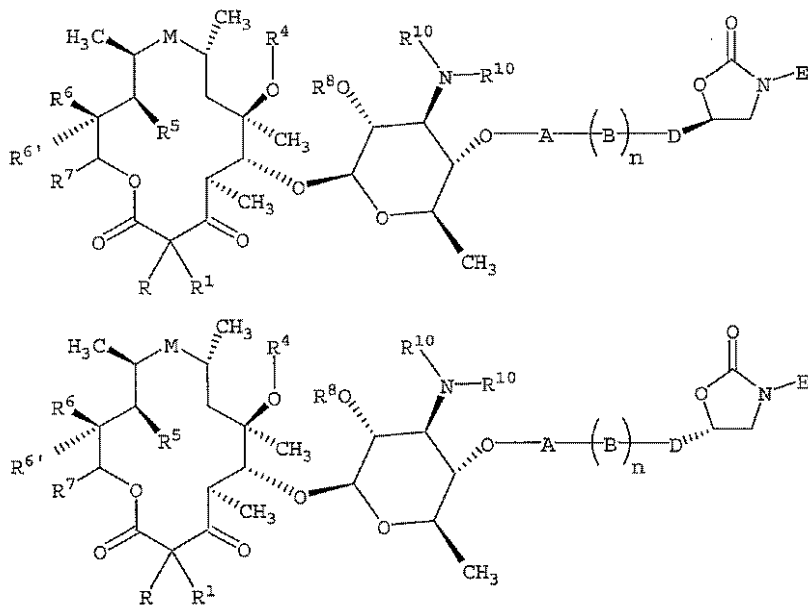
からなる群より選択される式を有する化合物、またはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、もしくはプロドラッグであって、

ここで、A、B、n、D、E、R、R¹、R⁴、R⁵、R⁶、R^{6'}、R⁷、R⁸、R⁹、およびR¹⁰は、請求項1において定義されるとおりである、化合物またはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、またはプロドラッグ。

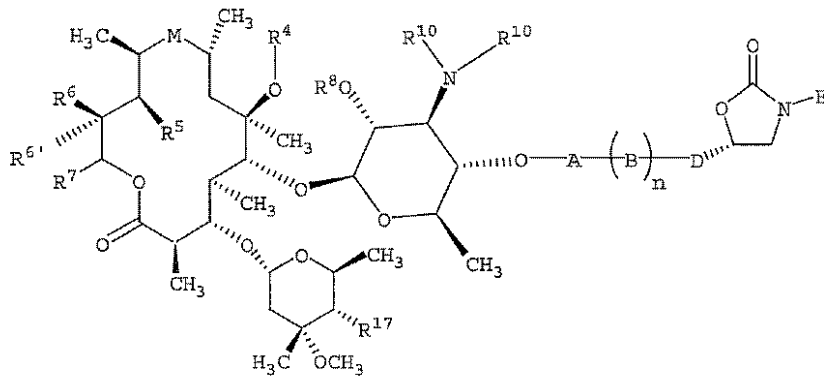
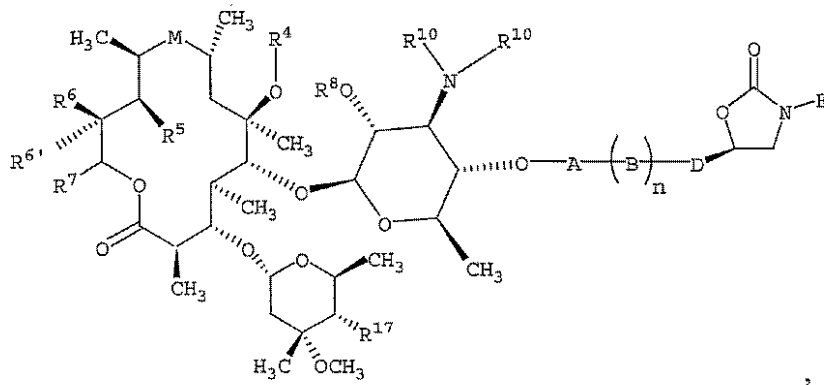
【請求項3】

以下：

【化 9 - 1】



【化9-2】



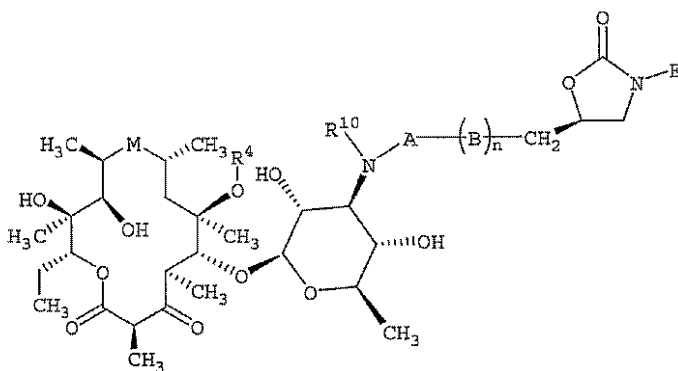
からなる群より選択される式を有する化合物、またはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、もしくはプロドラッグであって、

ここで、A、B、n、D、E、R、R¹、R⁴、R⁵、R⁶、R^{6'}、R⁷、R⁸、R⁹、およびR¹⁰は、請求項1において定義されるとおりである、化合物またはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、もしくはプロドラッグ。

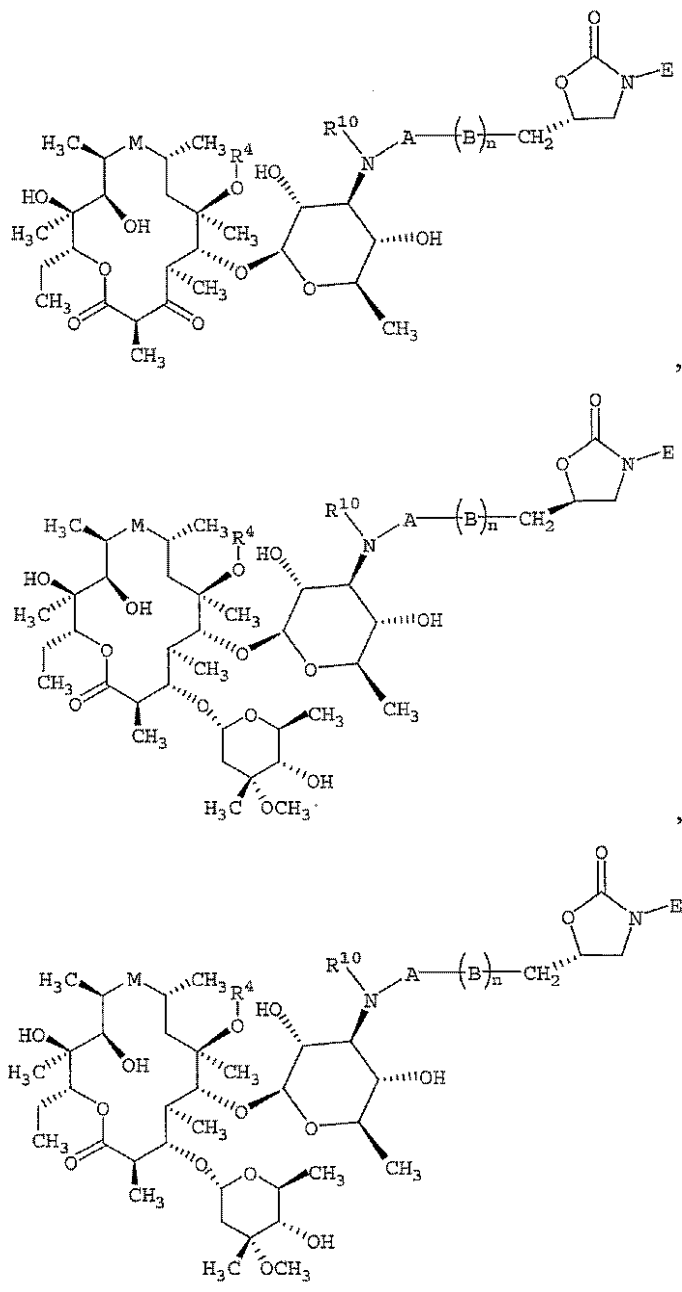
【請求項4】

以下：

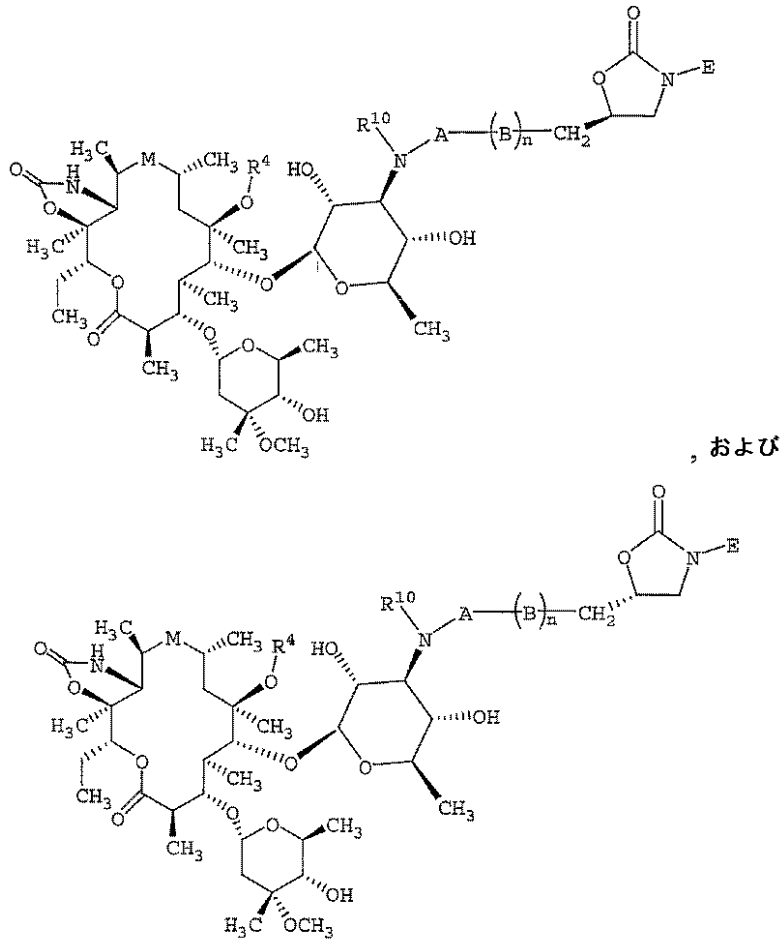
【化10-1】



【化 1 0 - 2】



【化10-3】



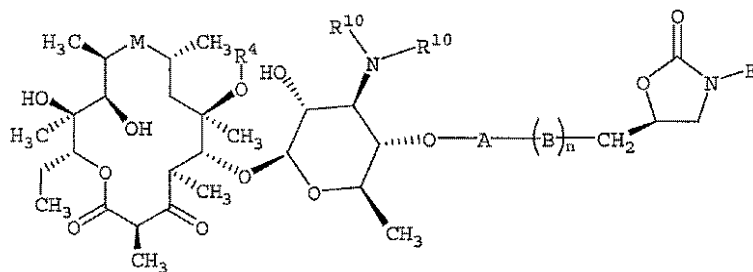
からなる群より選択される式を有する化合物、またはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、もしくはプロドラッグであって、

ここで、A、B、n、E、 R^4 、および R^{10} は、請求項1において定義されるとおりである、化合物またはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、もしくはプロドラッグ。

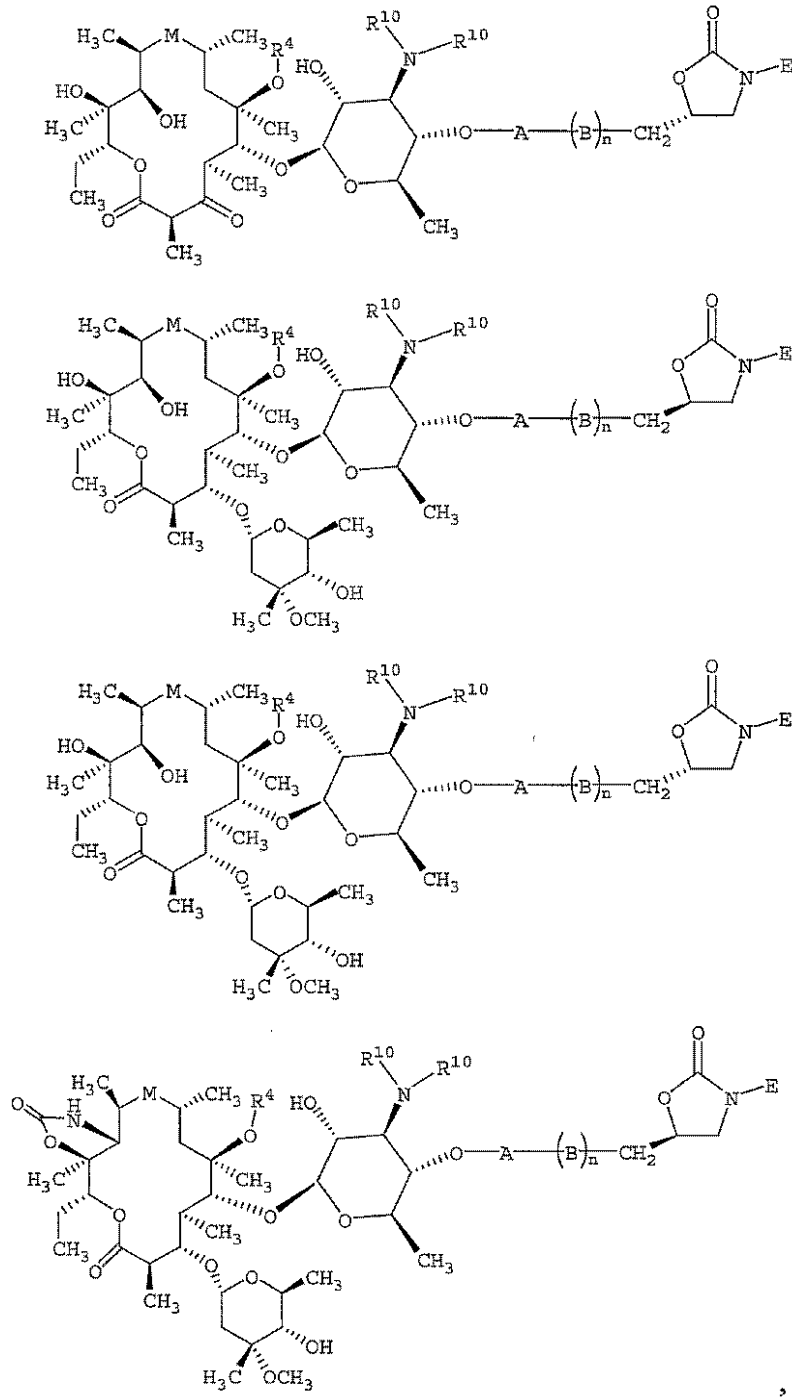
【請求項5】

以下：

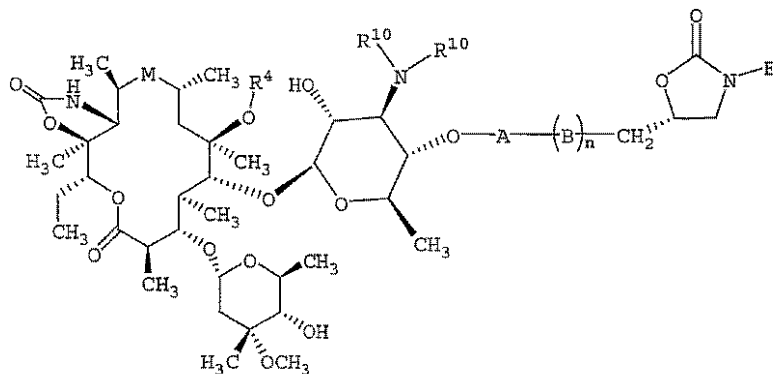
【化11-1】



【化 1 1 - 2】



【化 1 1 - 3】



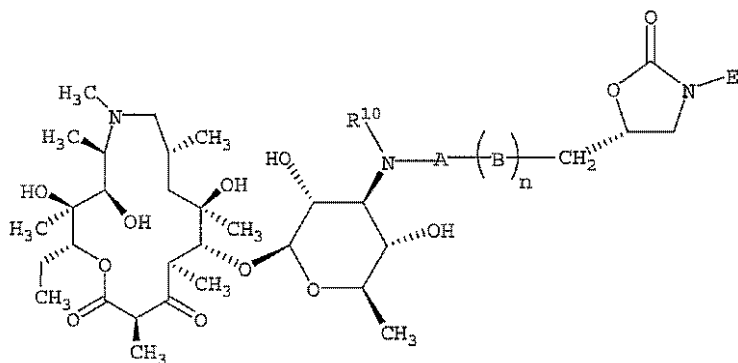
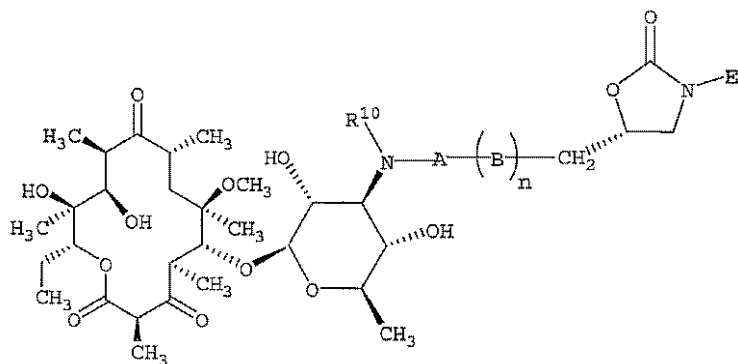
からなる群より選択される式を有する化合物、またはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、もしくはプロドラッグであって、

ここで、A、B、n、E、 R^4 、および R^{10} は、請求項1において定義されるとおりである、化合物またはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、もしくはプロドラッグ

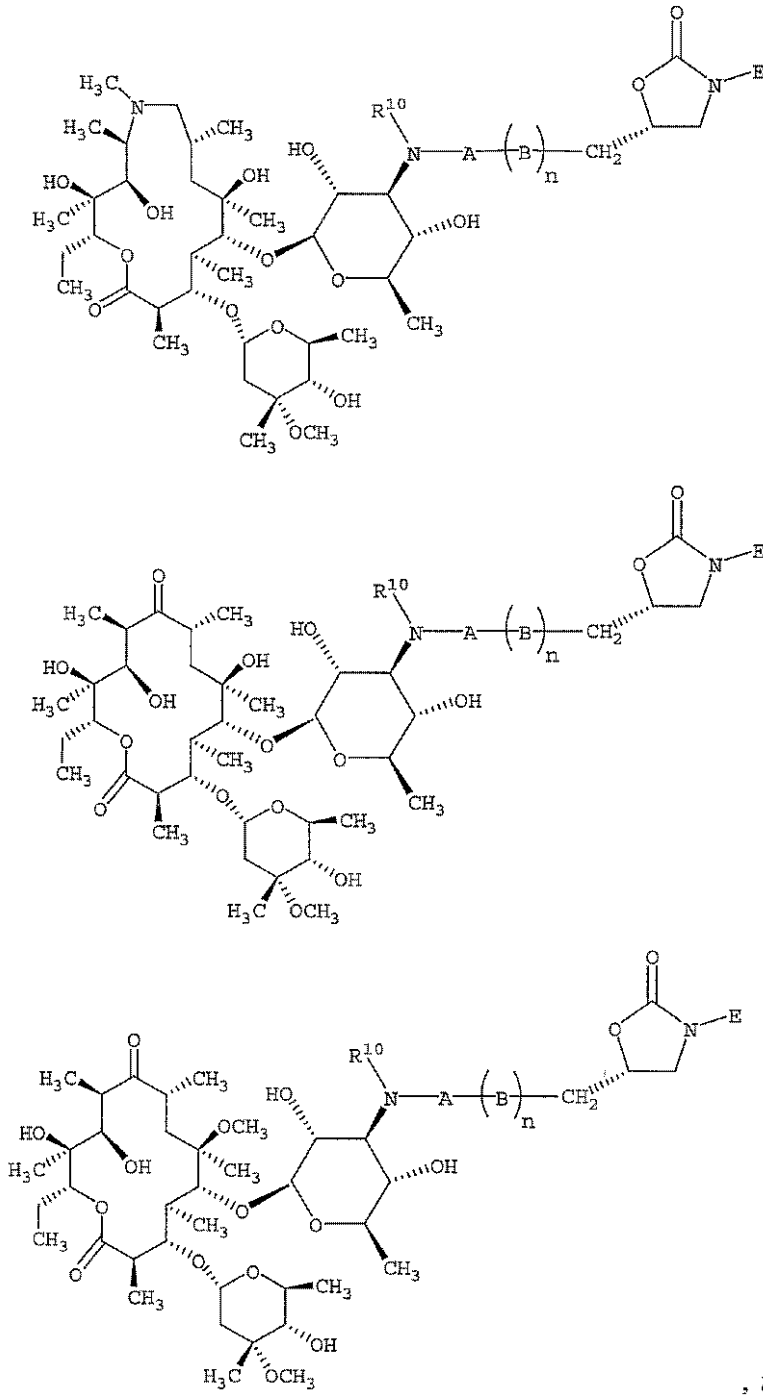
【請求項6】

以下：

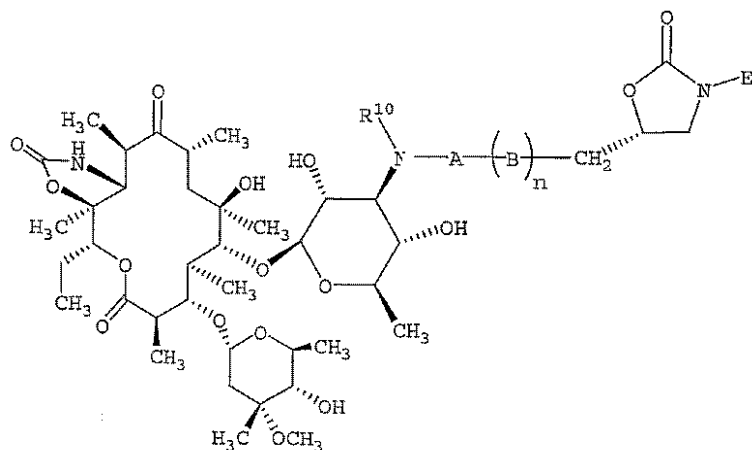
【化 1 2 - 1】



【化 1 2 - 2】



【化 1 2 - 3】



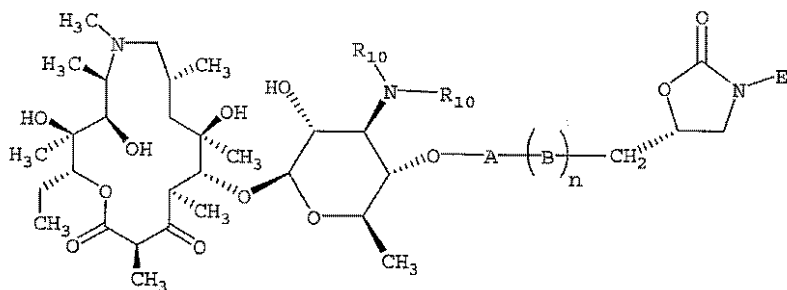
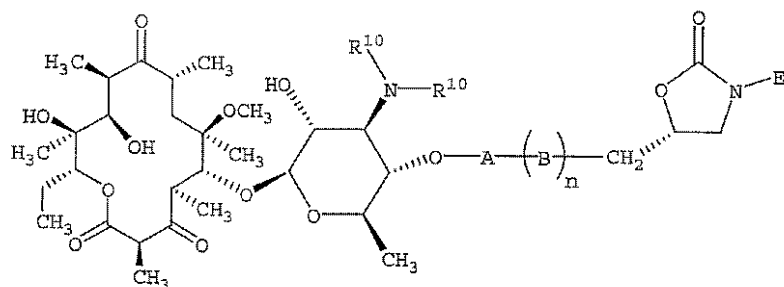
からなる群より選択される式を有する化合物、またはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、もしくはプロドラッグであって、

ここで、A、B、n、E、および R^{10} は、請求項 1 において定義されるとおりである、化合物、またはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、もしくはプロドラッグ。

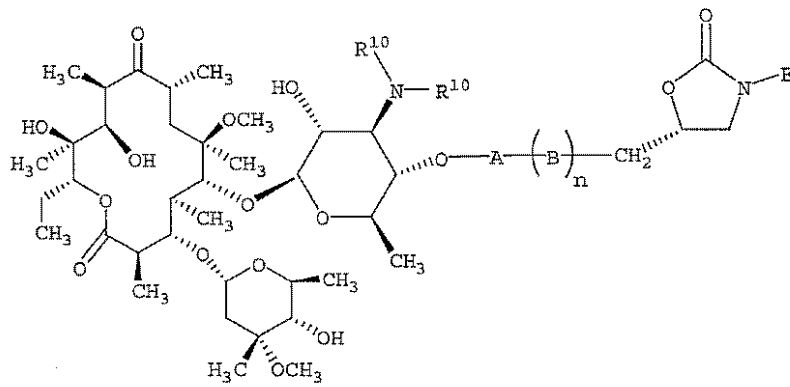
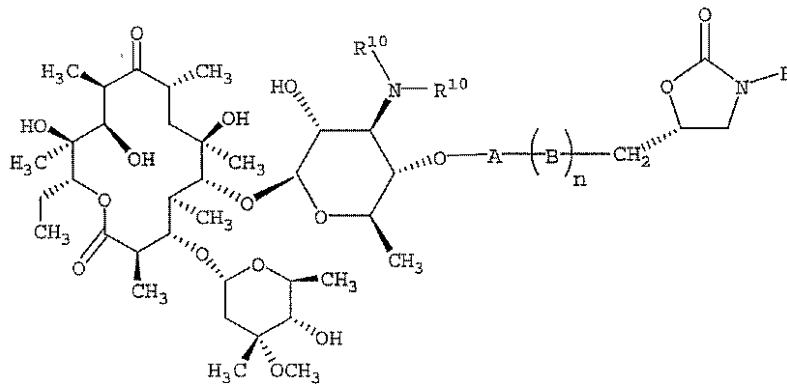
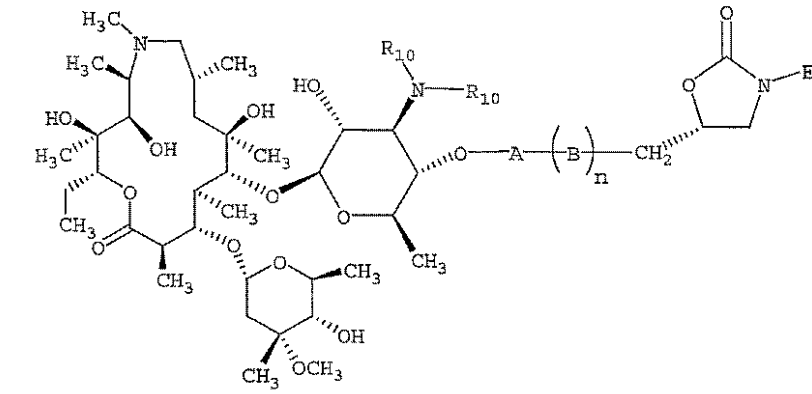
【請求項 7】

以下：

【化 1 3 - 1】

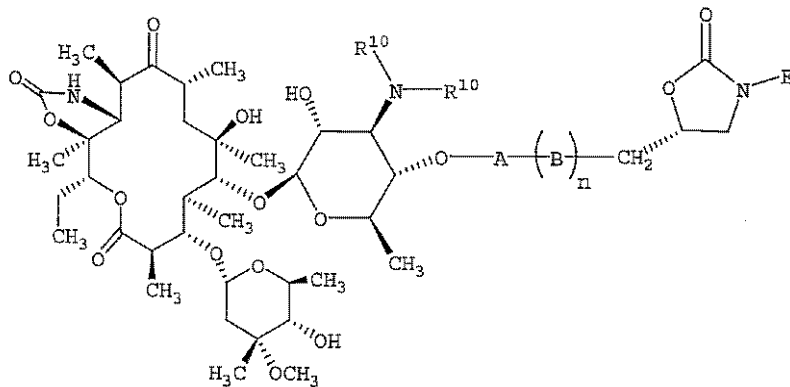


【化13-2】



, および

【化13-3】



からなる群より選択される式を有する化合物、またはそれらの薬学的に受容可能な塩、工

ステル、もしくはプロドラッグであって、

ここで、A、B、n、E、および R^{10} は、請求項1において定義されるとおりである、化合物またはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、もしくはプロドラッグ。

【請求項8】

nは、1である、請求項1～7のいずれかに記載の化合物。

【請求項9】

A - (B)_n - Dは、A - C(O)NH - Dである、請求項1～8のいずれかに記載の化合物。

【請求項10】

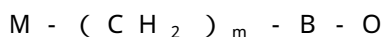
A - (B)_n - Dは、A - SO₂NH - Dである、請求項1～8のいずれかに記載の化合物。

【請求項11】

前記A - (B)_n - Dは、A - C(S)NH - Dである、請求項1～8のいずれかに記載の化合物。

【請求項12】

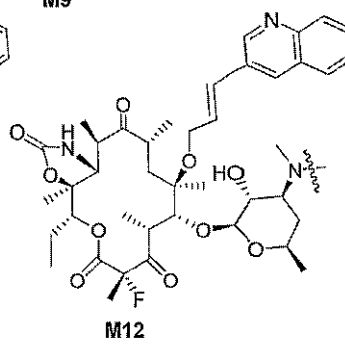
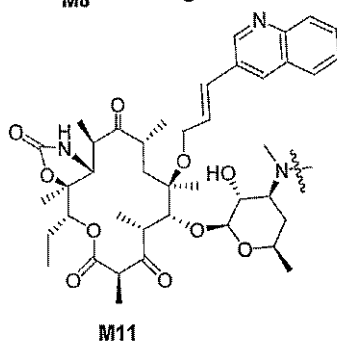
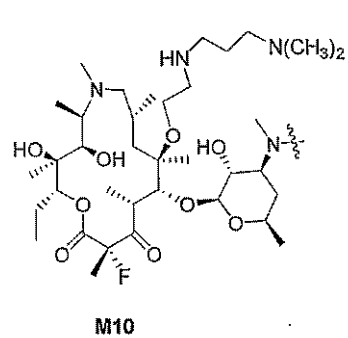
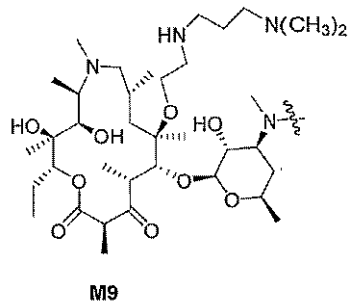
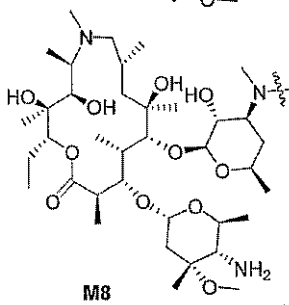
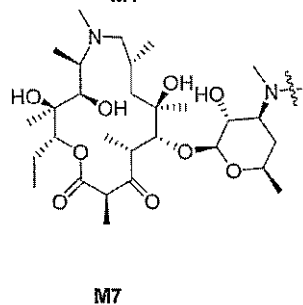
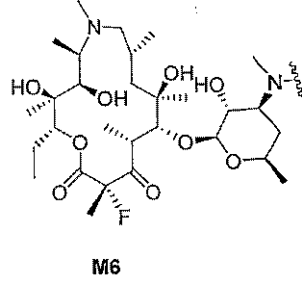
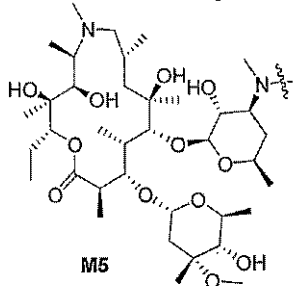
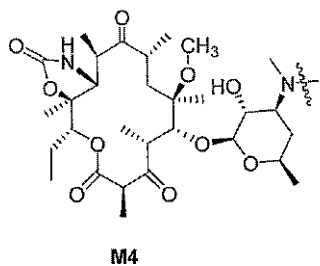
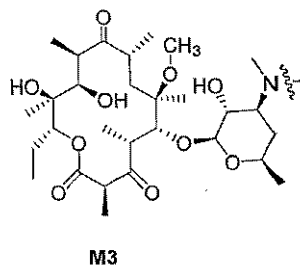
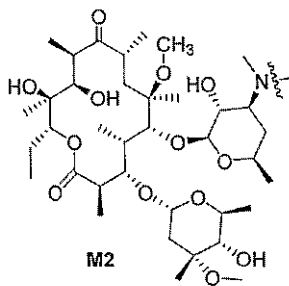
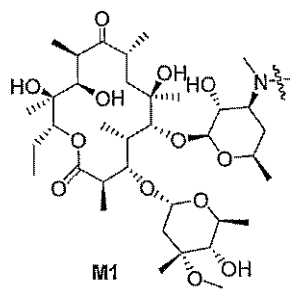
式：



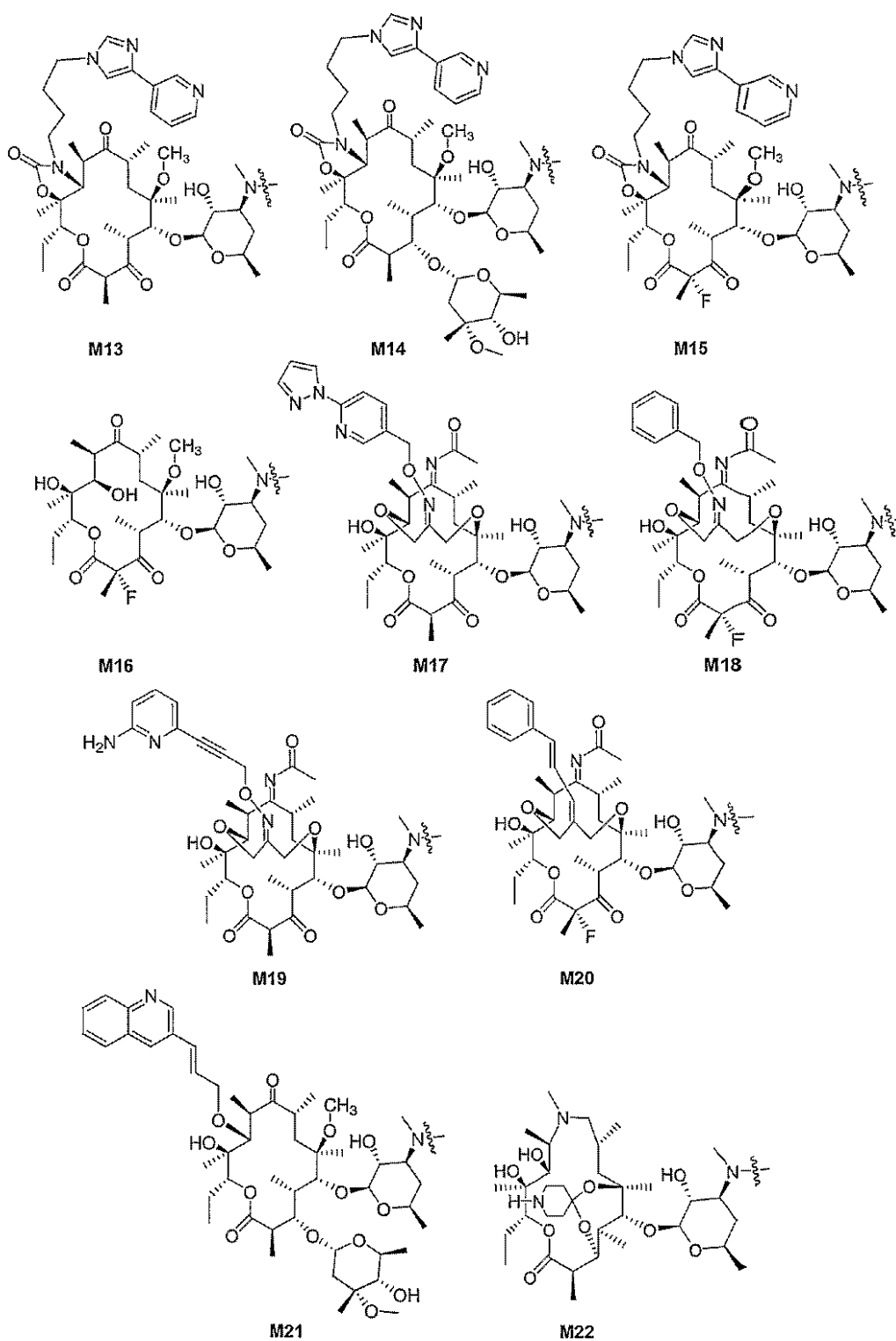
を有する化合物、またはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、もしくはプロドラッグであって、

ここで、Mは、以下：

【化 1 4 - 1】

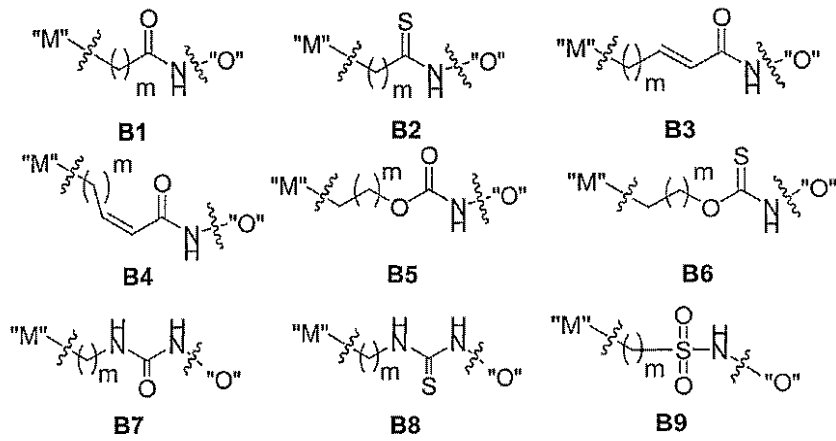


【化 1 4 - 2】



からなる群より選択されるマクロライドであり、
Bは、以下：

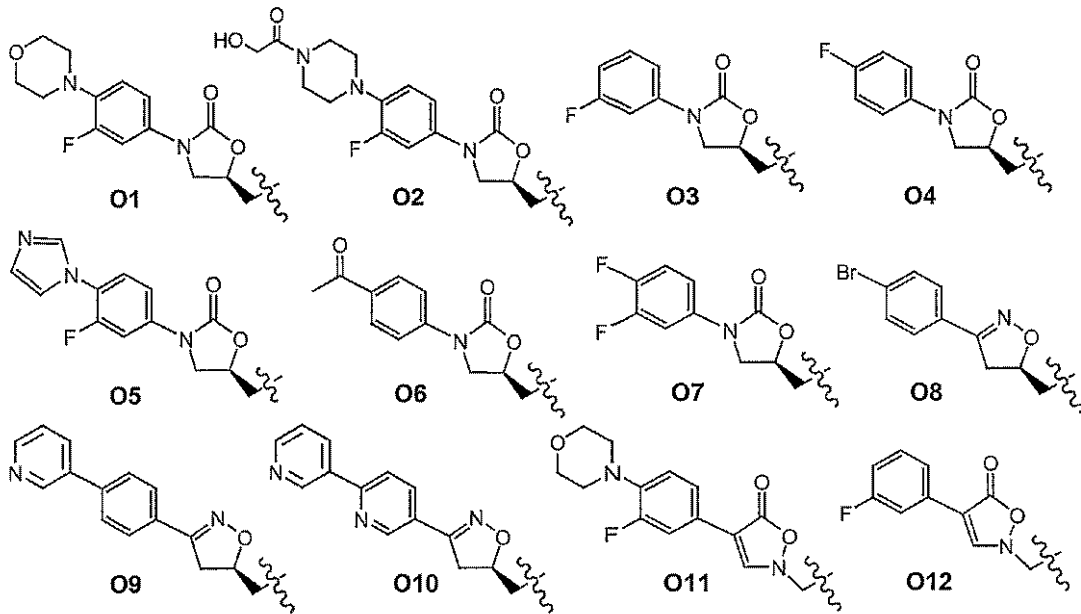
【化15】



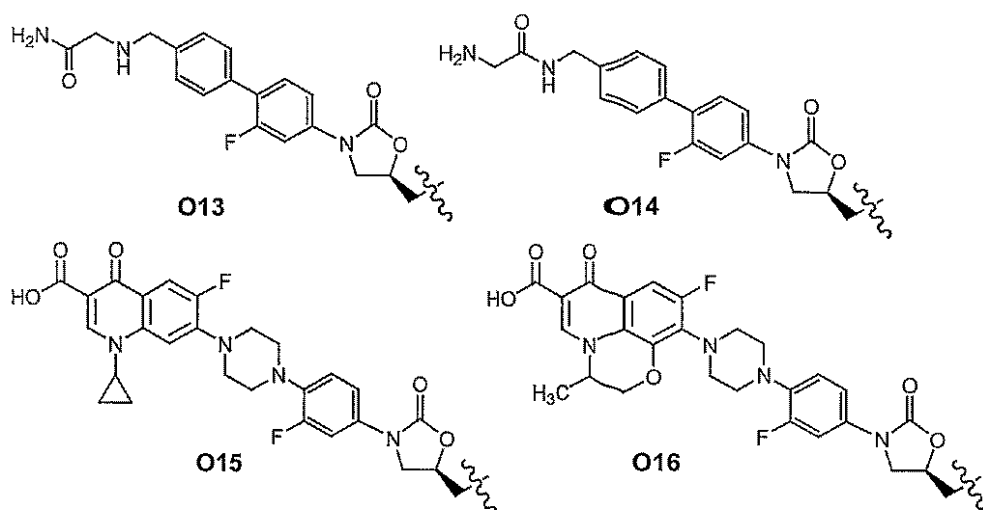
からなる群より選択されるリンカーであり、

Oは、以下：

【化16-1】



【化16-2】

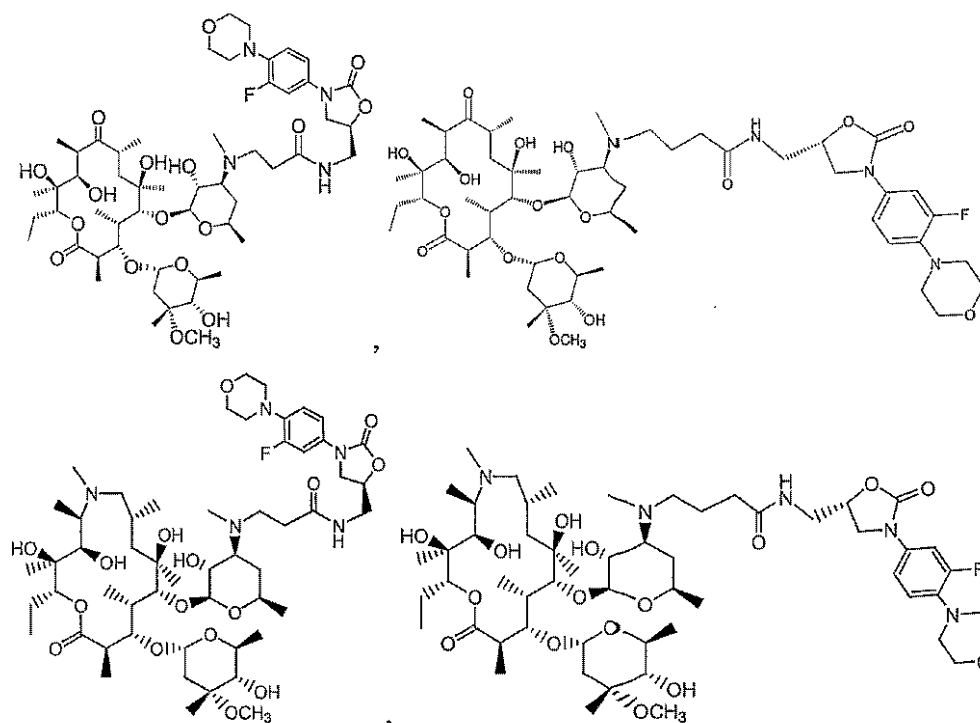


からなる群より選択される複素環側鎖であり、
 そしてmは、1～4の整数である、
 化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、エステル、もしくはプロドラッグ。

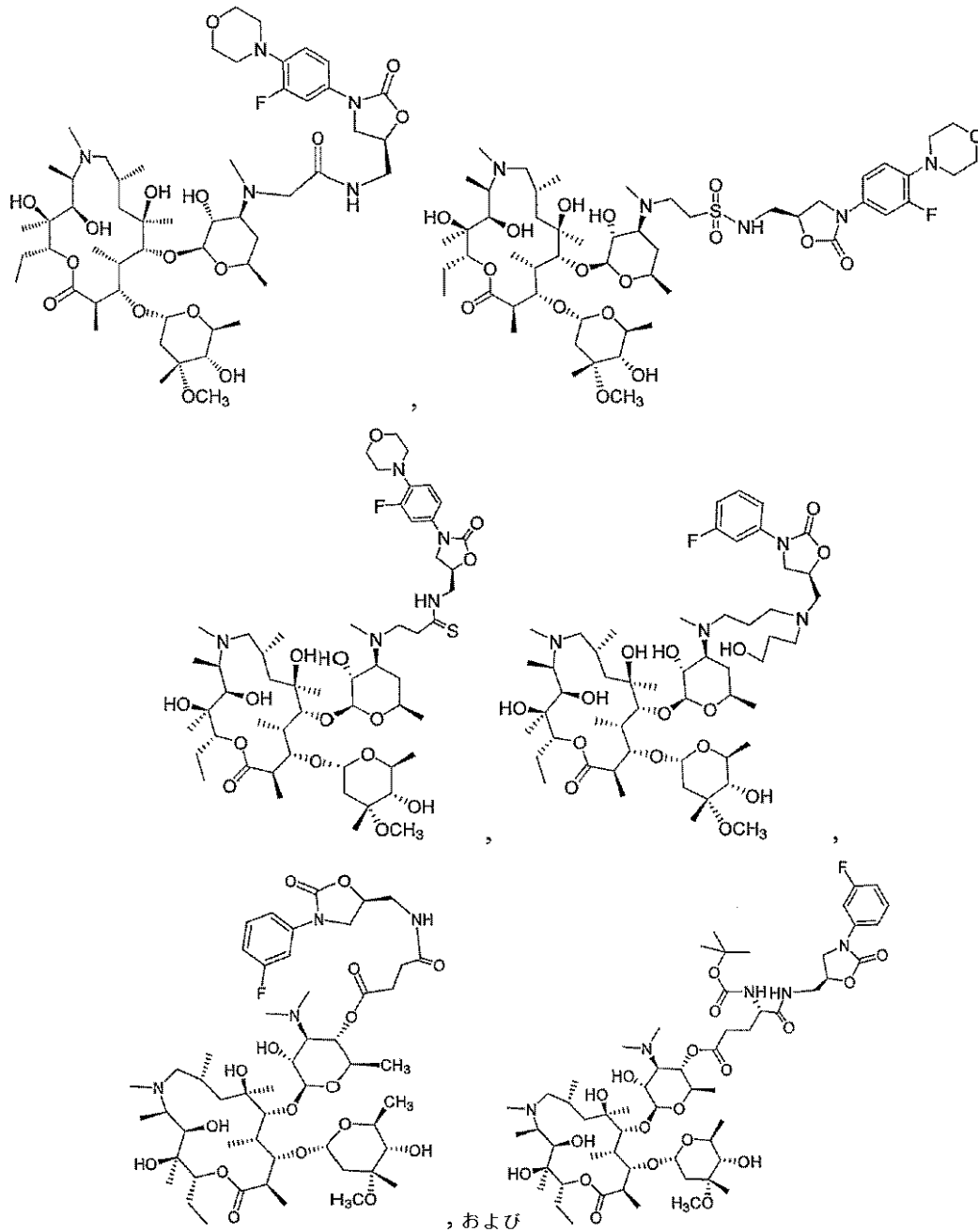
【請求項13】

以下：

【化17-1】



【化 17 - 2】



からなる群より選択される式を有する化合物、またはそれらの薬学的に受容可能な塩、エステル、もしくはプロドラッグ。

【請求項 14】

請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物および薬学的に受容可能なキャリアを含有する薬学的組成物。

【請求項 15】

哺乳動物における微生物感染を処置するための組成物であって、投与に適切な、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物の有効量を含む、組成物。

【請求項 16】

哺乳動物における真菌感染を処置するための組成物であって、投与に適切な、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物の有効量を含む、組成物。

【請求項 17】

哺乳動物における寄生虫性疾患を処置するための組成物であって、投与に適切な、請求項

1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物の有効量を含む、組成物。

【請求項18】

哺乳動物における増殖性疾患を処置するための組成物であって、投与に適切な、請求項1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物の有効量を含む、組成物。

【請求項19】

哺乳動物におけるウイルス感染を処置するための組成物であって、投与に適切な、請求項1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物の有効量を含む、組成物。

【請求項20】

哺乳動物における炎症性疾患を処置するための組成物であって、投与に適切な、請求項1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物の有効量を含む、組成物。

【請求項21】

哺乳動物における胃腸の運動性障害を処置するための組成物であって、投与に適切な、請求項1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物の有効量を含む、組成物。

【請求項22】

前記化合物が経口的に、非経口的に、または局所的に投与されるのに適している、請求項15 ~ 21 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項23】

請求項1 ~ 13 のいずれかに記載の化合物を合成する方法。

【請求項24】

請求項1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物を含有する医療デバイス。

【請求項25】

前記デバイスがステントである、請求項に記載24の医療デバイス。