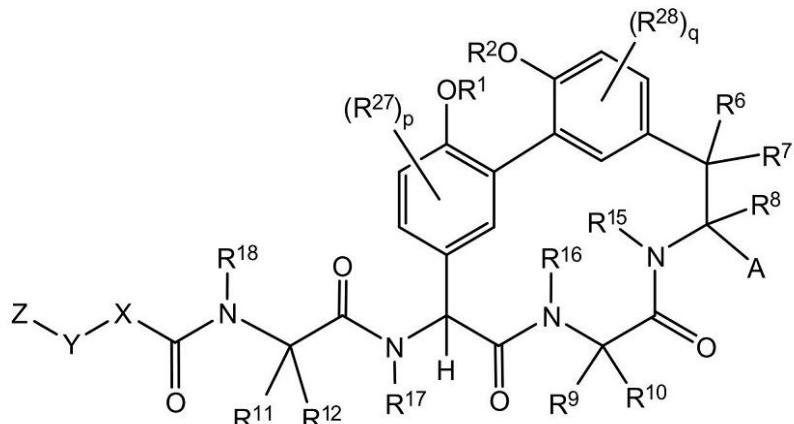


【化1】



式(I);

式中：

R¹ および R² はそれぞれ独立して、H、- (C₁ - C₆) アルキル、- (C₁ - C₆) アルキル - OR²³、- CH₂CH(OH)CH₂NH₂、- CH₂CH(ヘテロシクロアルキル)CH₂NH₂、- CH₂C(O)NH₂、- CH₂C(O)N(H)CH₂CN、- (C₁ - C₆) アルキル - C(O)OR²³、- (C₁ - C₆) アルキル - NR²¹R²²、- (C₁ - C₆) アルキル - C(O)NR²⁵R²⁶、- (C₁ - C₆) アルキル - N(R²³)C(O)(C₁ - C₆) アルキルNR²¹R²²、または - (C₁ - C₆) アルキル - C(O)N(R²³)(C₁ - C₆) アルキル、あるいは隨意に置換されたヘテロシクロアルキルであり；

R⁶、R⁷、および R⁸ はそれぞれ独立して、H、または - (C₁ - C₆) アルキルであり；

R⁹ は、H、- (C₁ - C₆) アルキル、- (C₁ - C₆) ハロアルキル、または - (C₃ - C₆) シクロアルキルであり；

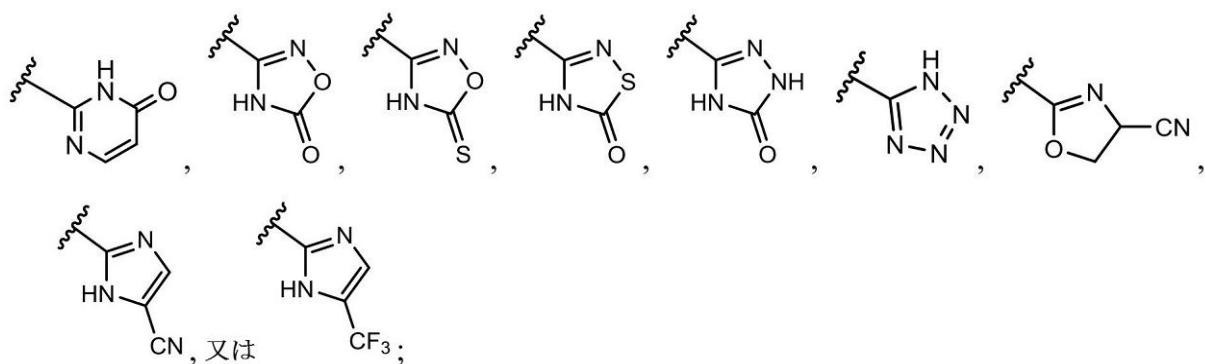
R¹⁰ は、H、または - (C₁ - C₆) アルキルであり；

R¹¹ および R¹² はそれぞれ独立して、H、- NH₂、- (C₁ - C₆) アルキル、- (C₁ - C₆) アルキル - OR²³、- (C₁ - C₆) アルキル - SR²³、- (C₁ - C₆) アルキル - C(O)OR²³、- (C₁ - C₆) アルキル - NR²¹R²²、- (C₁ - C₆) アルキル - CN、- (C₁ - C₆) アルキル - C(O)NR²⁵R²⁶、- (C₁ - C₆) アルキル - S(O) - (C₁ - C₆) アルキル、- (C₁ - C₆) アルキル - N(H)CH = NH、- (C₁ - C₆) アルキル - N(H)C(NH)NH₂、- (C₁ - C₆) アルキル - ヘテロシクロアルキル、隨意に置換された - (C₁ - C₆) アルキル - N(H) ヘテロシクロアルキル、または - (C₁ - C₆) アルキル - ヘテロアリールであり；または R¹¹ および R¹² は、組み合わされて、隨意に置換されたヘテロシクロアルキル環を形成し、および R¹² は H であり；

R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷、および R¹⁸ はそれぞれ独立して、H、- (C₁ - C₆) アルキル、- (C₃ - C₆) シクロアルキル、- (C₁ - C₆) アルキル - OR²³、- (C₁ - C₆) アルキル - C(O)OR²³、または - (C₁ - C₆) アルキル - NR²¹R²² であり；

A は、- CN、- CH₂CN、- CH = CHCN、- CH₂N(H)C(O)CH₂CN、- CH₂N(H)C(O)N(H)R²⁴、- C(O)N(H)R³⁴、- C(O)N(H)C(R²³)₂C(O)OR²⁹、- C(O)N(H)C(R²³)₂C = NR³⁰、- C(O)N(H)SO₃H、- C(O)N(H)CH = CH₂、- C(O)N(H)N(R²⁴)C(O)CH₂Cl、

【化2】



であり；

Xは、隨意に置換された- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル-、- $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ アルケニル-、- $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ アルキニル、- $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ シクロアルキル-、隨意に置換されたヘテロシクロアルキル、隨意に置換されたアリール、隨意に置換されたヘテロアリール、- $\text{O} - (\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル-、- $\text{N}(\text{R}^{2,4})(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル-、- $\text{N}(\text{R}^{2,4})(\text{C}_6 - \text{C}_{1,0})$ アリール-、または- $\text{SO}_2(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル-であり；

Yは、単結合、隨意に置換された- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル-、- $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ アルケニル-、- $(\text{C}_2 - \text{C}_6)$ アルキニル、- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル- $\text{N}(\text{R}^{2,4})(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル-、- $\text{O} - (\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル-、- $\text{O}(\text{C}_6 - \text{C}_{1,0})$ アリール-、- $\text{N}(\text{R}^{2,4})(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル-、- $\text{N}(\text{R}^{2,4})\text{C}(\text{O})(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル-、- $\text{C}(\text{O})(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル-、- $\text{S}(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル-、- $\text{SO}_2(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル-、- $\text{C}(\text{O})\text{NH}(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル-、- $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ シクロアルキル-、隨意に置換された- $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{2,4})$ アリール-、隨意に置換された- $\text{N}(\text{R}^{2,4})\text{C}(\text{O})$ アリール-、隨意に置換された- $\text{N}(\text{R}^{2,4})\text{SO}_2$ アリール-、隨意に置換されたアリール、または隨意に置換されたヘテロアリールであり；

Zは、H、ハロゲン、- NH_2 、- CN 、- CF_3 、- CO_2H 、- $(\text{C}_1 - \text{C}_{1,2})$ アルキル、- $(\text{C}_2 - \text{C}_{1,2})$ アルケニル、- $(\text{C}_2 - \text{C}_{1,2})$ アルキニル、- $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{2,5}\text{R}^{2,6}$ 、- $\text{O} - (\text{C}_1 - \text{C}_{1,2})$ アルキル、- $\text{N}(\text{R}^{2,4})(\text{C}_1 - \text{C}_{1,2})$ アルキル、- $\text{N}(\text{R}^{2,4})\text{C}(\text{O})(\text{C}_1 - \text{C}_{1,2})$ アルキル、隨意に置換された- $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$ シクロアルキル、- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル-ヘテロシクロアルキル、隨意に置換されたアリール、または隨意に置換されたヘテロアリールであり；

$\text{R}^{2,1}$ および $\text{R}^{2,2}$ はそれぞれ独立して、H、- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル、- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ ヘテロアルキル、- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル- CO_2H 、- $\text{C}(\text{O})(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル、- $\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{3,1})_2$ 、- $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{3,1})_2$ であり；または $\text{R}^{2,1}$ と $\text{R}^{2,2}$ およびそれらが結合される窒素原子は、ヘテロシクロアルキル環を形成し；

$\text{R}^{3,1}$ はそれぞれ独立して、Hまたは- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキルであり；または2つの $\text{R}^{3,1}$ およびそれらが結合される窒素原子は、ヘテロシクロアルキル環を形成し；

$\text{R}^{2,3}$ はそれぞれ独立して、Hまたは- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキルであり；

$\text{R}^{2,4}$ はそれぞれ独立して、Hまたは- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキルであり；

$\text{R}^{2,5}$ および $\text{R}^{2,6}$ はそれぞれ独立して、Hまたは隨意に置換された- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキルであり；または $\text{R}^{2,5}$ と $\text{R}^{2,6}$ およびそれらが結合される窒素原子は、ヘテロシクロアルキル環を形成し；

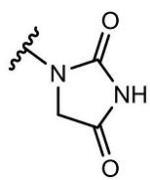
$\text{R}^{2,7}$ はそれぞれ独立して、ハロゲン、- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル、または- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ ヘテロアルキルであり；

$\text{R}^{2,8}$ はそれぞれ独立して、ハロゲン、- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ アルキル、または- $(\text{C}_1 - \text{C}_6)$ ヘテロアルキルであり；

$\text{R}^{2,9}$ は、- $\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ または隨意に置換されたアリールであり；

$\text{R}^{3,0}$ は、

【化3】



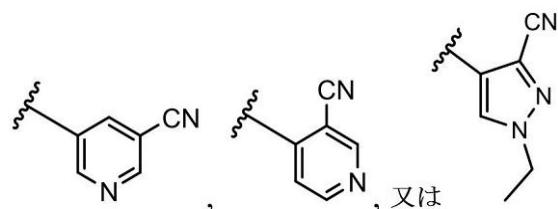
であり；

R^{3-2} は、H または $(C_1 - C_6)$ アルキルであり；

R^{3-3} は、 $-CH_2CN$ 、 $-OC(O)(C_1 - C_6)$ アルキル、または $-SO_2NH_2$ であり；

R^{3-4} は、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 $-CH_2CH_2CN$ 、 $-O(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-C(O)(C_1 - C_6)$ アルキル、 $-SO_2NH_2$ 、

【化4】



であり；

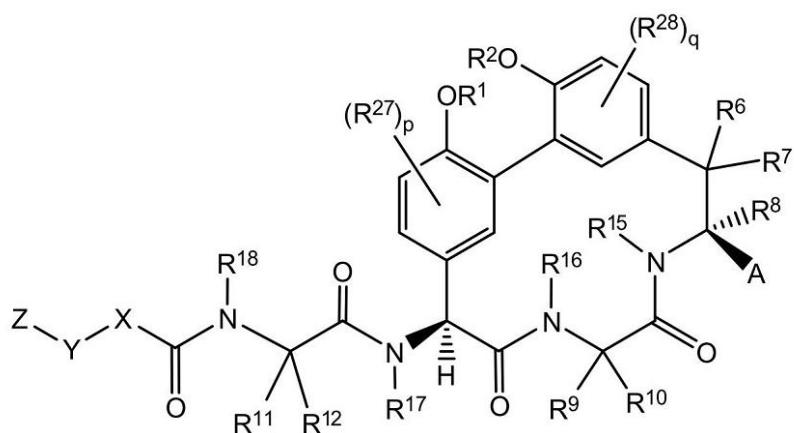
p は、0、1、または2 であり；および

q は、0、1、または2 である、化合物。

【請求項2】

式(Ia)の構造：

【化5】



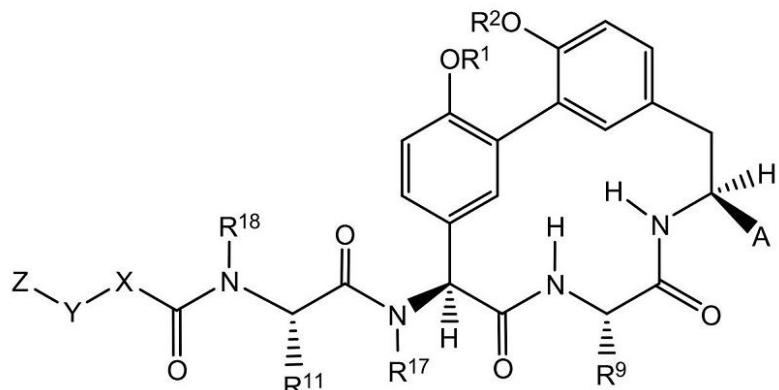
式(Ia).

を有する、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

式(Ib)の構造：

【化6】



式(Ib).

を有する、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

R¹⁻⁷が-CH₃であり、R¹⁸がHである、請求項1-3のいずれか1項に記載の化合物。

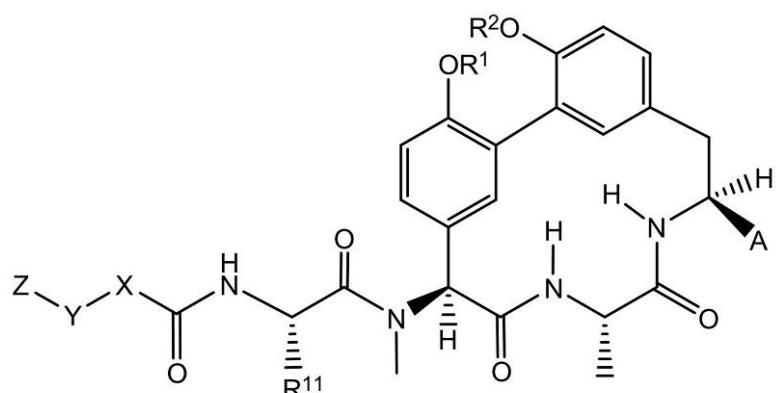
【請求項5】

R⁹が-(C₁-C₆)アルキルである、請求項1-4のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項6】

式(Ic)の構造:

【化7】



式(Ic).

を有する、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項7】

R¹⁻¹が-(C₁-C₆)アルキル-NR²⁻¹R²⁻²である、請求項1-6のいずれか1項に記載の化合物。

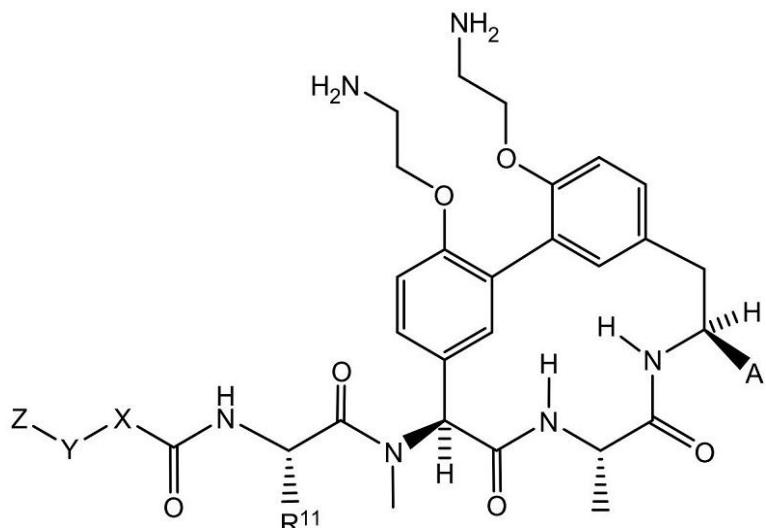
【請求項8】

R¹およびR²がそれぞれ独立して、H、または-(C₁-C₆)アルキル-NR²⁻¹R²⁻²である、請求項1-7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項9】

式(Id)の構造:

【化 8】



式(Id);

を有し、

式中、R¹が、-CH₂NH₂、-CH₂CH₂NH₂、または-CH₂CH₂CH₂NH₂である、請求項1または2に記載の化合物。

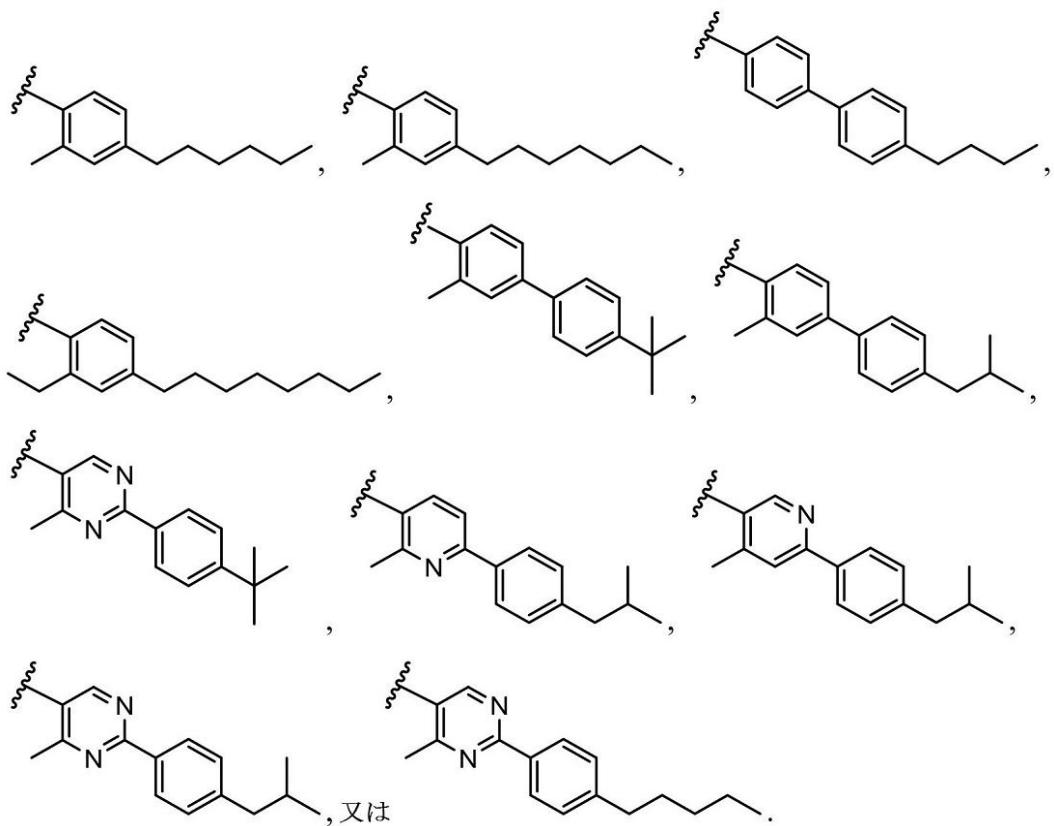
【請求項 10】

X が随意に置換されたアリール、随意に置換されたヘテロアリール、および、随意に置換された - (C₁ - C₆) アルキル - であり、Y が随意に置換されたアリール、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換された - (C₁ - C₆) アルキル - 、 - O - (C₁ - C₆) アルキル - 、 - N(H) - (C₁ - C₆) アルキル - 、または単結合であり、Z が - (C₁ - C₆) アルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換された - (C₃ - C₇) シクロアルキル、またはハロゲンである、請求項 1 - 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 11】

- X - Y - Z が、

【化9】

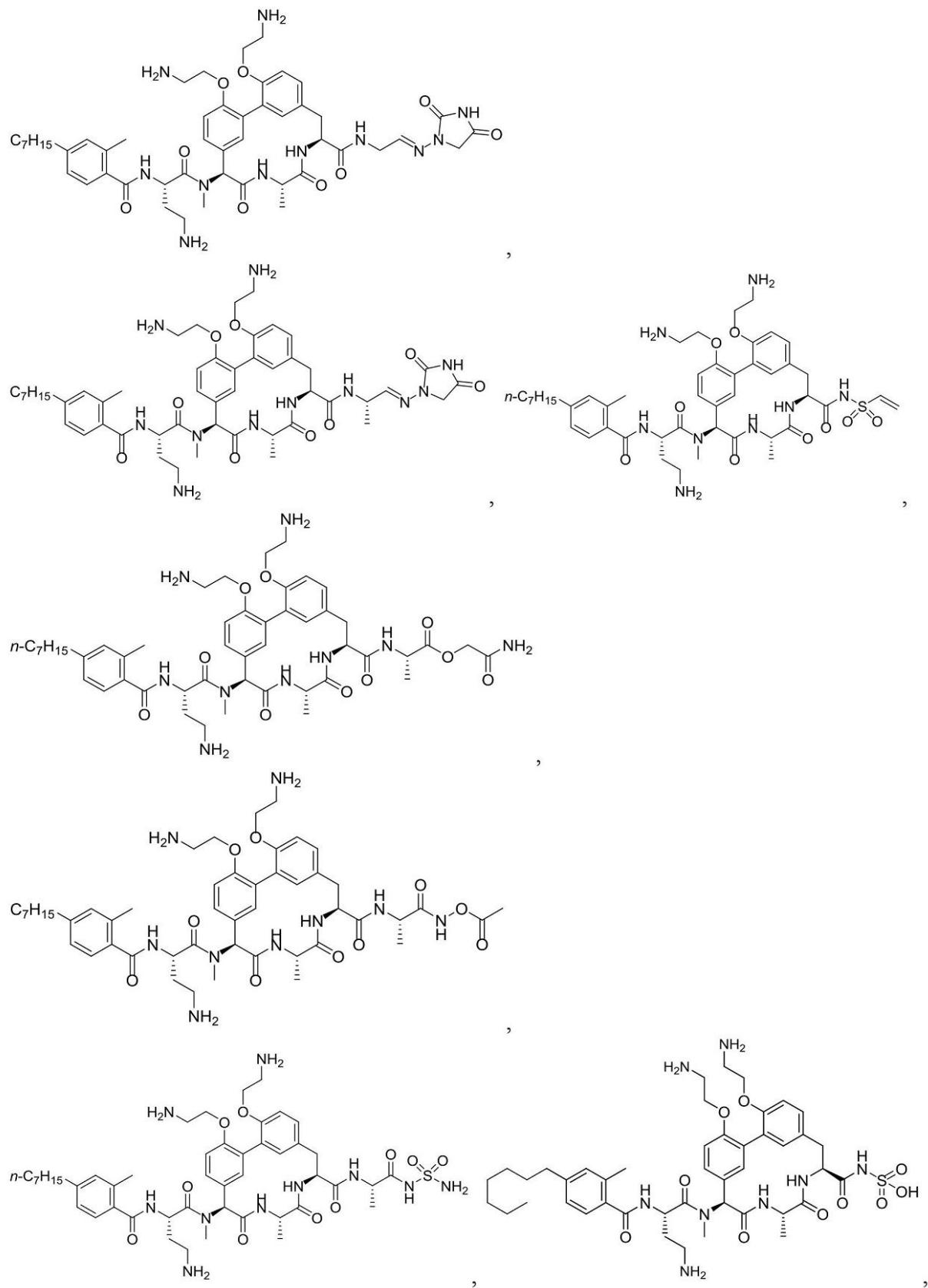


である、請求項1 - 9のいずれか1項に記載の化合物。

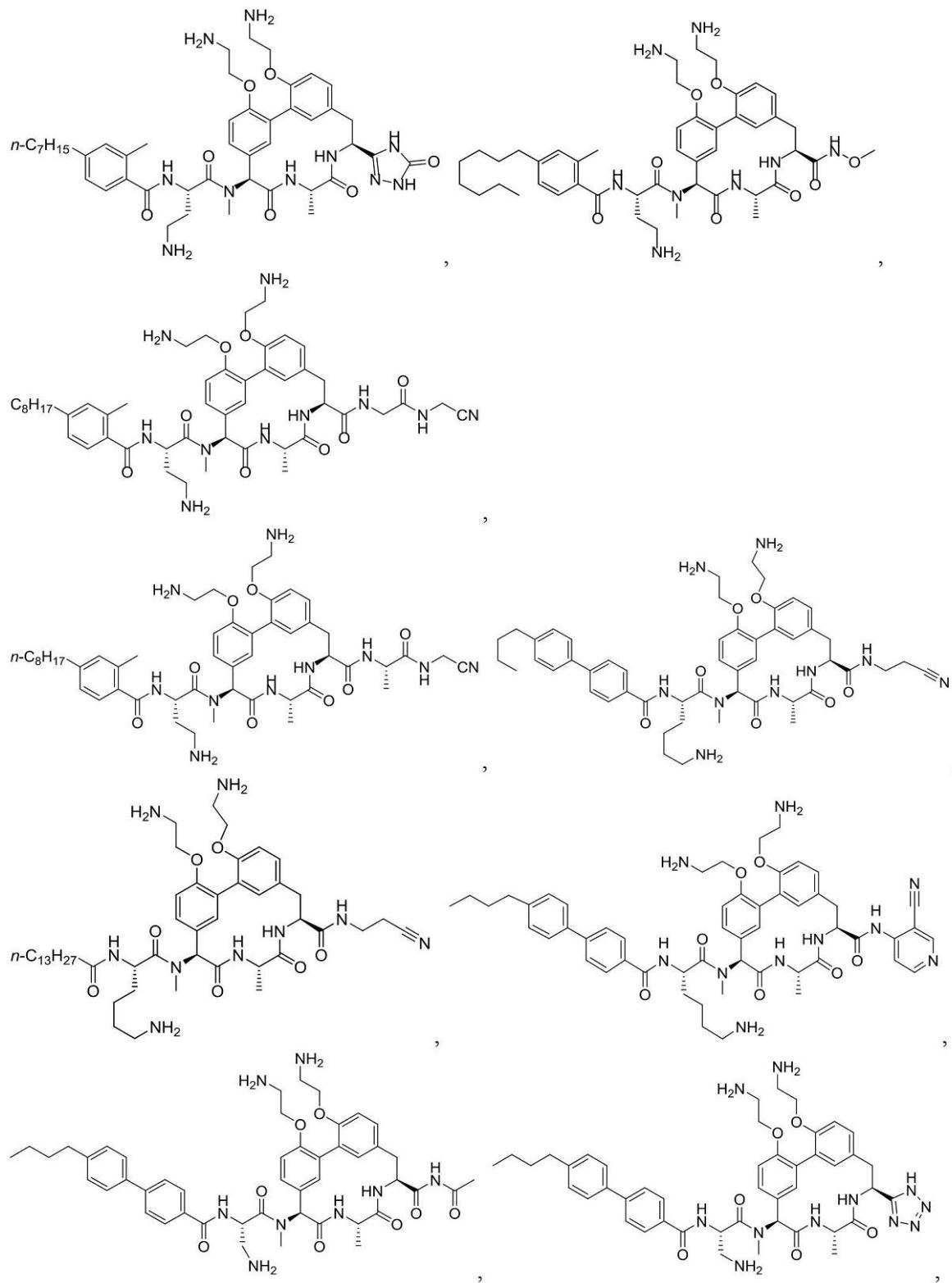
【請求項12】

化合物が、

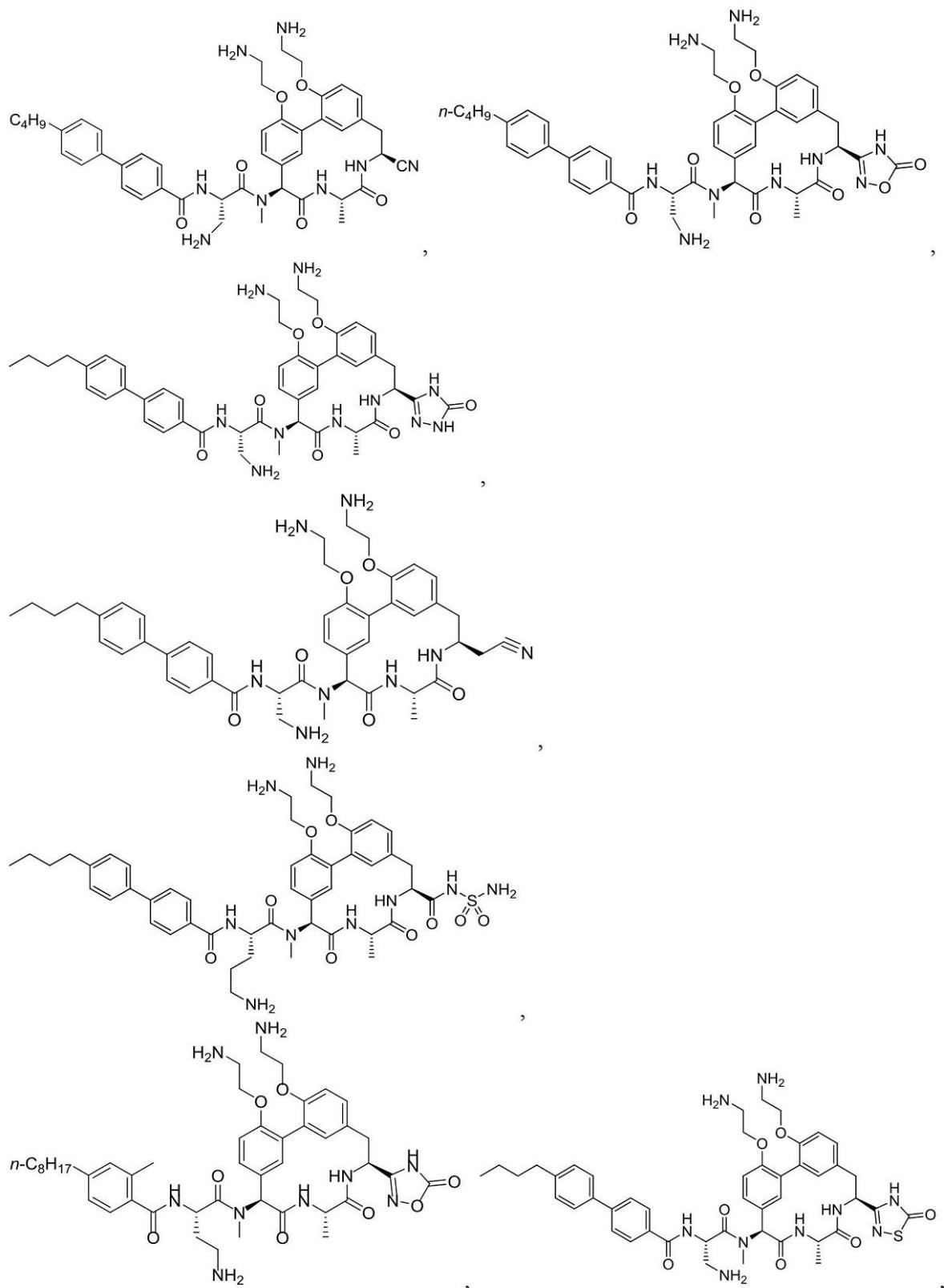
【化 1 0 - 1】



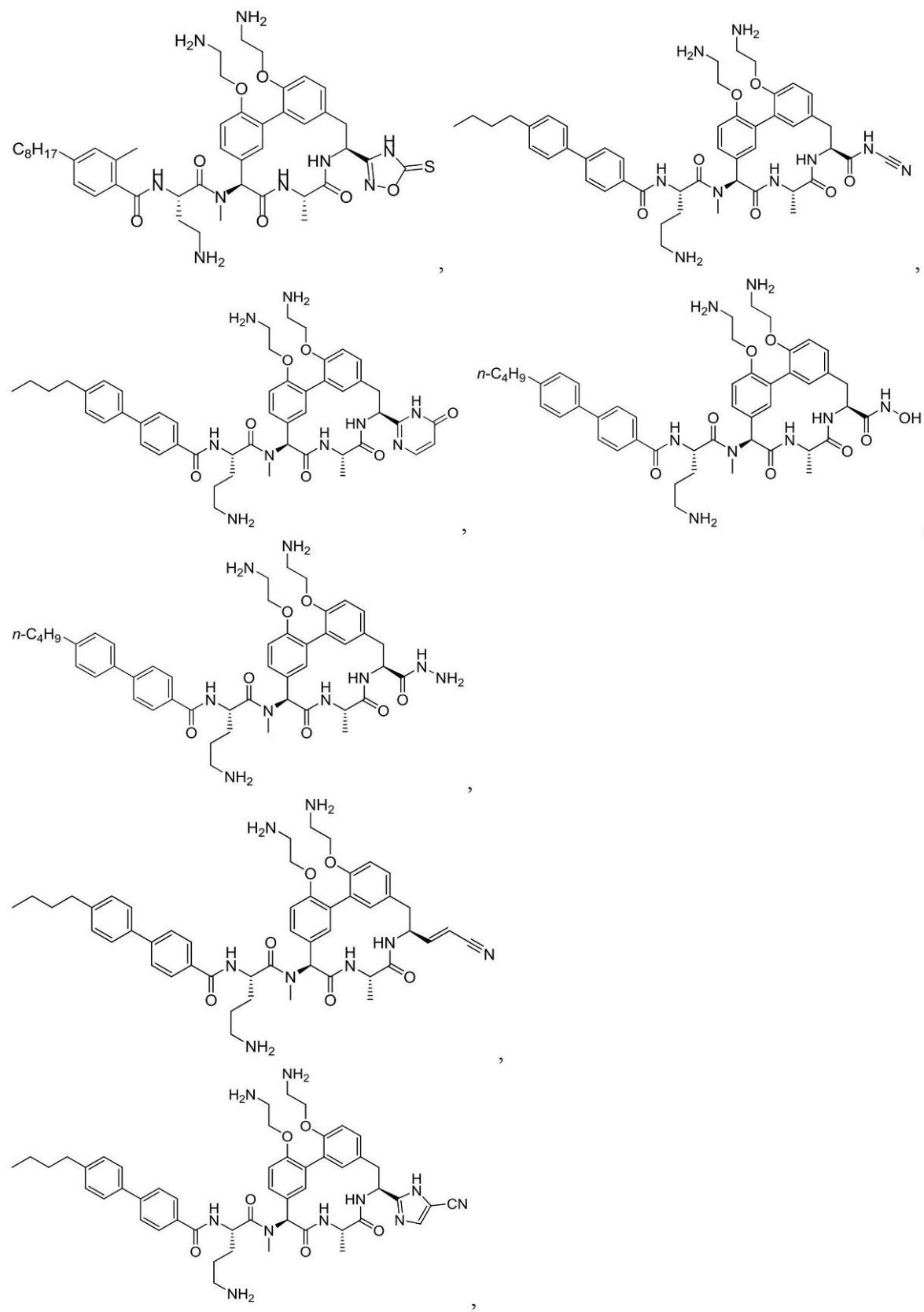
【化 1 0 - 2】



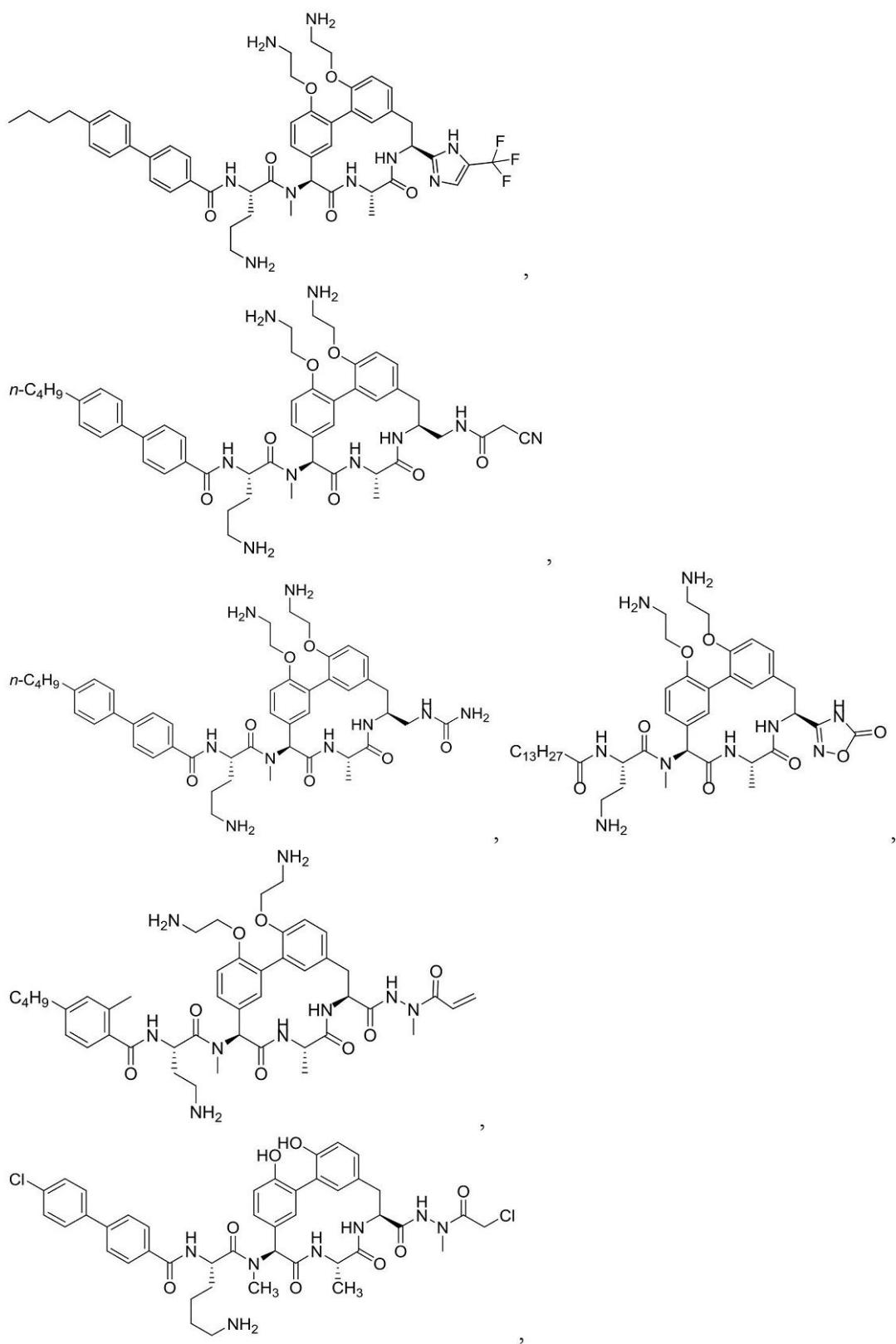
【化 1 0 - 3】



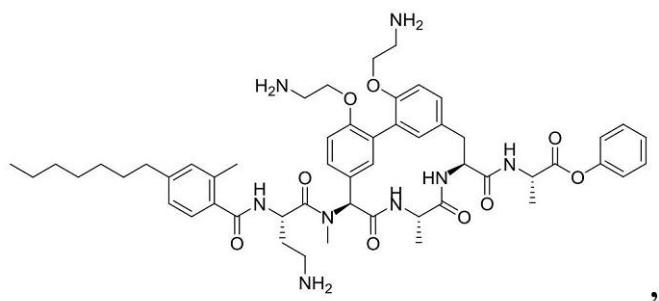
【化 1 0 - 4】



【化 1 0 - 5】



【化 10 - 6】



,

の構造、またはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、あるいはプロド ラッグを有する、
請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 13】

請求項 1 - 12 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、あるいはプロド ラッグ、および薬学的に許容可能な賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項 14】

患者の細菌感染の処置のための薬剤の調製で使用される、請求項 1 - 12 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、あるいはプロド ラッグ

。

【請求項 15】

細菌感染が、シードモナス・エルジノーサ、シードモナス・フルオレッセンス、シードモナス・アシドボランス、シードモナス・アルカリゲネス、シードモナス・ブチダ、ステノトロホモナス・マルトフィリア、バークホルデリア・セパシア、エロモナス・ハイドロフィラ、大腸菌、シトロバクター・フロインディ、サルモネラ・チフィリウム、サルモネラ・チフィ、サルモネラ・パラチフィ、サルモネラ・エンテリティディス、志賀赤痢菌、シゲラ・フレックスネリ、シゲラ・ソネイ、エンテロバクター・クロアカ、エンテロバクター・エロゲネス、クレブシエラ・ニューモニエ、クレブシエラ・オキシトカ、セラチア・マルセセンス、フランシセラ・ツラレンシス、モルガネラ・モルガニー、プロテウス・ミラビリス、プロテウス・ブルガリス、プロビデンシア・アルカリファシエンス、プロビデンシア・レットグリ、プロビデンシア・スチュアルティイ、アシネットバクター・バウマンニ、アシネットバクター・カルコアセティカス、アシネットバクター・ヘモリティカス、エルシニア・エンテロコリティカ、エルシニア・ペスチス、エルシニア・シードツベルクロシス、エルシニア・インターメディア、ボルデテラ・パートシス、ボルデテラ・パラパートシス、ボルデテラ・ブロンキセプチカ、ヘモフィルス・インフルエンザ、ヘモフィルス・パラインフルエンザ、ヘモフィルス・ヘモリティクス、ヘモフィルス・パラヘモリチカス、ヘモフィルス・デュクレイ、バストレラ・マルトシダ、バストレラ・ヘモリチカ、プランハメラ・カタラーリス、ヘリコバクター・ピロリ、カンピロバクター・フィタス、カンピロバクター・ジェジュニ、カンピロバクター・コリ、ボレリア・ブルグドルフェリ、ビブリオ・コレラエ、ビブリオ・パラヘモリチカス、レジオネラ・ニューモフィラ、リステリア・モノサイトゲネス、ナイセリア・ゴノレー、ナイセリア・メンギティディス、キンゲラ、モラクセラ、ガードネレラ・バギナリス、バクテロイデス・フラジリス、バクテロイデス・ディスタソニス、バクテロイデス 3452A ホモロジー群、バクテロイデス・ブルガタス、バクテロイデス・オバルス、バクテロイデス・テタイオタオミクロン、バクテロイデス・ユニフォルミス、バクテロイデス・エガーシイ、バクテロイデス・スプランクニクス、クロストリジウム・ディフィシル、マイコバクテリウム・ツベルクロシス、マイコバクテリウム・アビウム、マイコバクテリウム・イントロ

セルラーレ、マイコバクテリウム・レプレ、コリネバクテリウム・ジフテリエ、コリネバクテリウム・ウルセランス、ストレプトコッカス・ニューモニエ、ストレプトコッカス・アガラクチア、ストレプトコッカス・ピオゲネス、エンテロコッカス・フェカリス、エンテロコッカス・フェシウム、黄色ブドウ球菌、スタフィロコッカス・エピデルミデス、スタフィロコッカス・サブロフィチカス、スタフィロコッカス・インターメディウス、スタフィロコッカス・ヒイカス亜種、スタフィロコッカス・ヘモリチカス、スタフィロコッカス・ホミニス、またはスタフィロコッカス・サッカロリティカスに関係する感染である、請求項1-4に記載の化合物。