

【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3年10月28日(2021.10.28)

【公表番号】特表2020-533374(P2020-533374A)

【公表日】令和2年11月19日(2020.11.19)

【年通号数】公開・登録公報2020-047

【出願番号】特願2020-515090(P2020-515090)

【国際特許分類】

C 0 7 K 7/54 (2006.01)

A 6 1 K 38/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/06 (2006.01)

C 1 2 N 9/99 (2006.01)

【F I】

C 0 7 K 7/54

A 6 1 K 38/12

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 45/06

C 1 2 N 9/99

【手続補正書】

【提出日】令和3年9月14日(2021.9.14)

【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

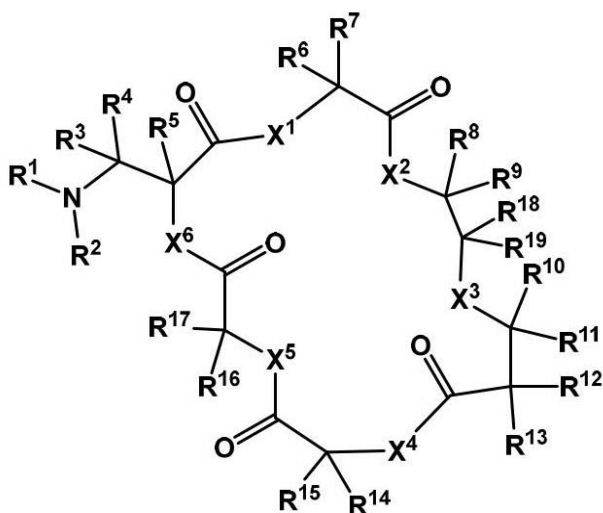
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化 1】



式(I);

[式中:]

X^1 は、 $-O-$ 又は $-NR^{1a}-$ であり;

X^2 は、 $-O-$ 又は $-NR^{2a}-$ であり;

X^3 は、 $-O-$ 又は $-NR^{3a}-$ であり;

X^4 は、 $-O-$ 又は $-NR^{4a}-$ であり;

X^5 は、 $-O-$ 又は $-NR^{5a}-$ であり;

X^6 は、 $-O-$ 又は $-NR^{6a}-$ であり;

但し、 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 X^5 、又は X^6 の少なくとも1つは、 $-O-$ であり;

R^{1a} 、 R^{2a} 、 R^{3a} 、 R^{4a} 、 R^{5a} 、及び R^{6a} は、それぞれ独立して、水素又は置換されてもよい C_1-C_6 アルキルであり;

R^1 と R^2 は、それぞれ独立して、水素、置換されてもよい C_1-C_6 アルキル、置換されてもよい C_2-C_6 アルケニル、置換されてもよい C_2-C_6 アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよい(C_1-C_6 アルキル)シクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよい(C_1-C_6 アルキル)ヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、置換されてもよい(C_1-C_6 アルキル)アリール、置換されてもよいヘテロアリール、置換されてもよい(C_1-C_6 アルキル)ヘテロアリール、 $-S(=O)_2R^a$ 、 $-S(=O)_2NR^bR^c$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)OR^b$ 、 $-C(=O)NR^bR^c$ 、又は $-(C=NR^b)NR^bR^c$ である;

又は R^1 と R^2 は、それらが付く窒素原子と一緒にあって、置換されてもよいヘテロシクロアルキルを形成し;

R^3 と R^4 は、それぞれ独立して、水素、置換されてもよい C_1-C_6 アルキル、置換されてもよい C_2-C_6 アルケニル、置換されてもよい C_2-C_6 アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、又は置換されてもよいヘテロアリールである;

又は R^3 と R^4 は、それらが付く炭素原子と一緒にあって、オキソを形成し;

R^5 は、水素、ハロゲン、置換されてもよい C_1-C_6 アルキル、置換されてもよい C_2-C_6 アルケニル、又は置換されてもよい C_2-C_6 アルキニルであり;

R^6 と R^7 は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、置換されてもよい C_1-C_6 アルキル、置換されてもよい C_2-C_6 アルケニル、置換されてもよい C_2-C_6 アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよい(C_1-C_6 アルキル)シクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよい(C_1-C_6 アルキル)ヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、置換されてもよい(C_1-C_6

アルキル) アリール、置換されてもよいヘテロアリール、又は置換されてもよい (C₁ - C₆ アルキル) ヘテロアリールであり;

R⁸とR⁹は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、置換されてもよいC₁－C₆アルキル、置換されてもよいC₂－C₆アルケニル、置換されてもよいC₂－C₆アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよい(C₁－C₆アルキル)シクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよい(C₁－C₆アルキル)ヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、置換されてもよい(C₁－C₆アルキル)アリール、置換されてもよいヘテロアリール、又は置換されてもよい(C₁－C₆アルキル)ヘテロアリールであり；

R^{10} と R^{11} は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、置換されてもよい C_1-C_{20} アルキル、置換されてもよい C_2-C_{20} アルケニル、置換されてもよい C_2-C_{20} アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよい(C_1-C_6 アルキル)シクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよい(C_1-C_6 アルキル)ヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、置換されてもよい(C_1-C_6 アルキル)アリール、置換されてもよいヘテロアリール、又は置換されてもよい(C_1-C_6 アルキル)ヘテロアリールであり；

$R^{1,2}$ と $R^{1,3}$ は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、置換されてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、置換されてもよい $C_2 - C_6$ アルケニル、置換されてもよい $C_2 - C_6$ アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) シクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) ヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) アリール、置換されてもよいヘテロアリール、又は置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) ヘテロアリールである；

又は R^{10} と R^{12} は、一緒になって、置換されてもよいシクロアルキル又は置換されてもよいシクロアルケニルを形成し；

R¹⁴とR¹⁵は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、置換されてもよいC₁－C₆アルキル、置換されてもよいC₂－C₆アルケニル、置換されてもよいC₂－C₆アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよい(C₁－C₆アルキル)シクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよい(C₁－C₆アルキル)ヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、置換されてもよい(C₁－C₆アルキル)アリール、置換されてもよいヘテロアリール、又は置換されてもよい(C₁－C₆アルキル)ヘテロアリールである；

又は R¹⁻⁴ と R^{4-a} は、それらが付く原子と一緒にあって、置換されてもよいヘテロシクロアルキルを形成し；

R¹⁶とR¹⁷は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、置換されてもよいC₁－C₆アルキル、置換されてもよいC₂－C₆アルケニル、置換されてもよいC₂－C₆アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよい(C₁－C₆アルキル)シクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよい(C₁－C₆アルキル)ヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、置換されてもよい(C₁－C₆アルキル)アリール、置換されてもよいヘテロアリール、又は置換されてもよい(C₁－C₆アルキル)ヘテロアリールであり；

R^{18} と R^{19} は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、置換されてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、置換されてもよい $C_2 - C_6$ アルケニル、置換されてもよい $C_2 - C_6$ アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) シクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) ヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) アリール、置換されてもよいヘテロアリール、又は置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) ヘテロアリールである；

又は R^{18} と R^{19} は、それらが付く炭素原子と一緒に成つて、オキソを形成し；

それぞれの R^a は、独立して、置換されてもよい C₁ - C₆ アルキル、置換されてもよ

い C_2-C_6 アルケニル、置換されてもよい C_2-C_6 アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、又は置換されてもよいヘテロアリールであり；

それぞれの R^b と R^c は、独立して、水素、置換されてもよい C_1-C_6 アルキル、置換されてもよい C_2-C_6 アルケニル、置換されてもよい C_2-C_6 アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、又は置換されてもよいヘテロアリールである；

又は R^b と R^c は、それらが付く窒素原子と一緒にあって、置換されてもよいヘテロシクロアルキルを形成する」の化合物、又はその医薬的に許容される塩、溶媒和物、又は立体異性体。

【請求項 2】

R^{18} と R^{19} が、それらが付く炭素原子と一緒にあって、オキソを形成する、請求項 1 の化合物。

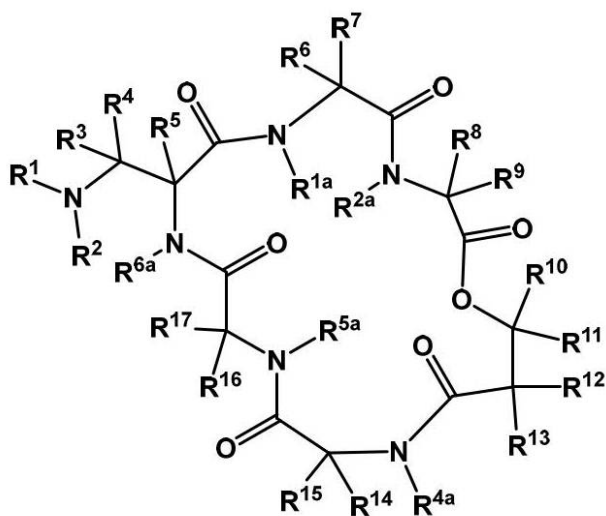
【請求項 3】

R^{18} と R^{19} が水素である、請求項 1 の化合物。

【請求項 4】

式 (I a)：

【化 2】



式 (Ia).

の構造を有する、請求項 1 から 3 のいずれか一項の化合物。

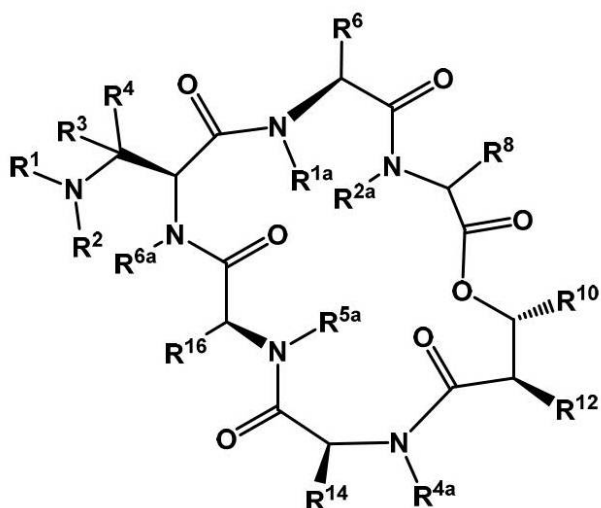
【請求項 5】

R^1 、 R^2 、 R^5 、 R^9 、 R^{11} 、 R^{13} 、 R^{15} 、および R^{17} が水素である、請求項 1 ～ 請求項 4 のいずれか 1 項の化合物。

【請求項 6】

式 (I b)：

【化 3】



式 (Ib).

の構造を有する、請求項 1～請求項 5 のいずれか 1 項の化合物。

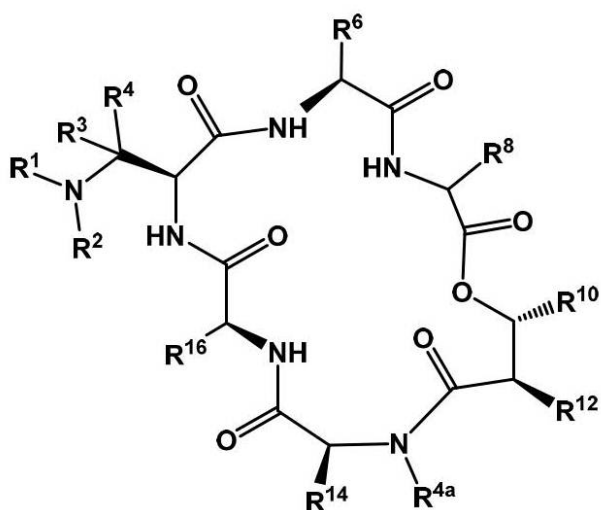
【請求項 7】

R^{1 a}、R^{2 a}、R^{5 a}およびR^{6 a}が水素である、請求項1～請求項6のいずれか1項の化合物。

【請求項 8】

式 (I c) :

【化 4】



式 (Ic).

の構造を有する、請求項 1 ～ 請求項 7 のいずれか 1 項の化合物。

【請求項 9】

R³ と R⁴ が水素であり、R^{4 a} が水素又は C₁ - C₆ アルキルである、請求項 1 ～ 請求項 8 のいずれか 1 項の化合物。

【請求項 10】

$$\frac{\text{R}^6 \text{ が、 } 1、2、\text{又は} 3 \text{ 個のハロゲン、}-\text{OR}^b、-\text{NR}^b \text{R}^c、-\text{NC}(=\text{NR}^b) \\ \text{NR}^b \text{R}^c、-\text{S}(=\text{O})_2 \text{R}^a、-\text{NR}^b \text{S}(=\text{O})_2 \text{R}^a、-\text{S}(=\text{O})_2 \text{NR}^b \text{R}^c、-\text{C}(=\text{O}) \text{R}^a、-\text{OC}(=\text{O}) \text{R}^a、-\text{C}(=\text{O}) \text{OR}^a、-\text{OC}(=\text{O}) \text{OR}^b、-\text{C}(=\text{O}) \text{NR}^b \text{R}^c、-\text{NR}^b \text{C}(=\text{O}) [(\text{R}^d)_2]_{1-4} \text{NR}^b \text{R}^c、-} \\ \text{OC}[(\text{R}^d)_2]_{2-4} \text{OR}^b、-\text{OC}[(\text{R}^d)_2]_{2-4} \text{NR}^b \text{R}^c、-\text{OC}[($$

$$\frac{\text{R}^{\text{d}})_2]_{2-4} \text{OC}[(\text{R}^{\text{d}})_2]_{2-4} \text{NR}^{\text{b}} \text{R}^{\text{c}}, -\text{OC}[(\text{R}^{\text{d}})_2]_{2-4} \text{N}}{\text{C}(=\text{NR}^{\text{b}}) \text{NR}^{\text{b}} \text{R}^{\text{c}}, -\text{OC}(=\text{O}) \text{NR}^{\text{b}} \text{R}^{\text{c}}, -\text{NR}^{\text{b}} \text{C}(=\text{O}) \text{NR}^{\text{b}} \text{R}^{\text{c}}}$$

、 $-\text{NR}^{\text{b}} \text{C}(=\text{O}) \text{R}^{\text{a}}, -\text{NR}^{\text{b}} \text{C}(=\text{O}) \text{OR}^{\text{b}}, -\text{O}-$ （置換されてもよいヘテロシクロアルキル）、 $-\text{O}-$ （置換されてもよいアリール）、 $-\text{O}-$ （置換されてもよいヘテロアリール）、又はヘテロアリールで置換されてもよい C_1-C_6 アルキルであり；
そして

それぞれの R^d は、独立して、水素、ハロゲン、-OH、-OCH₃、又は C₁-C₆ アルキルである、請求項 1～請求項 9 のいずれか 1 項の化合物。

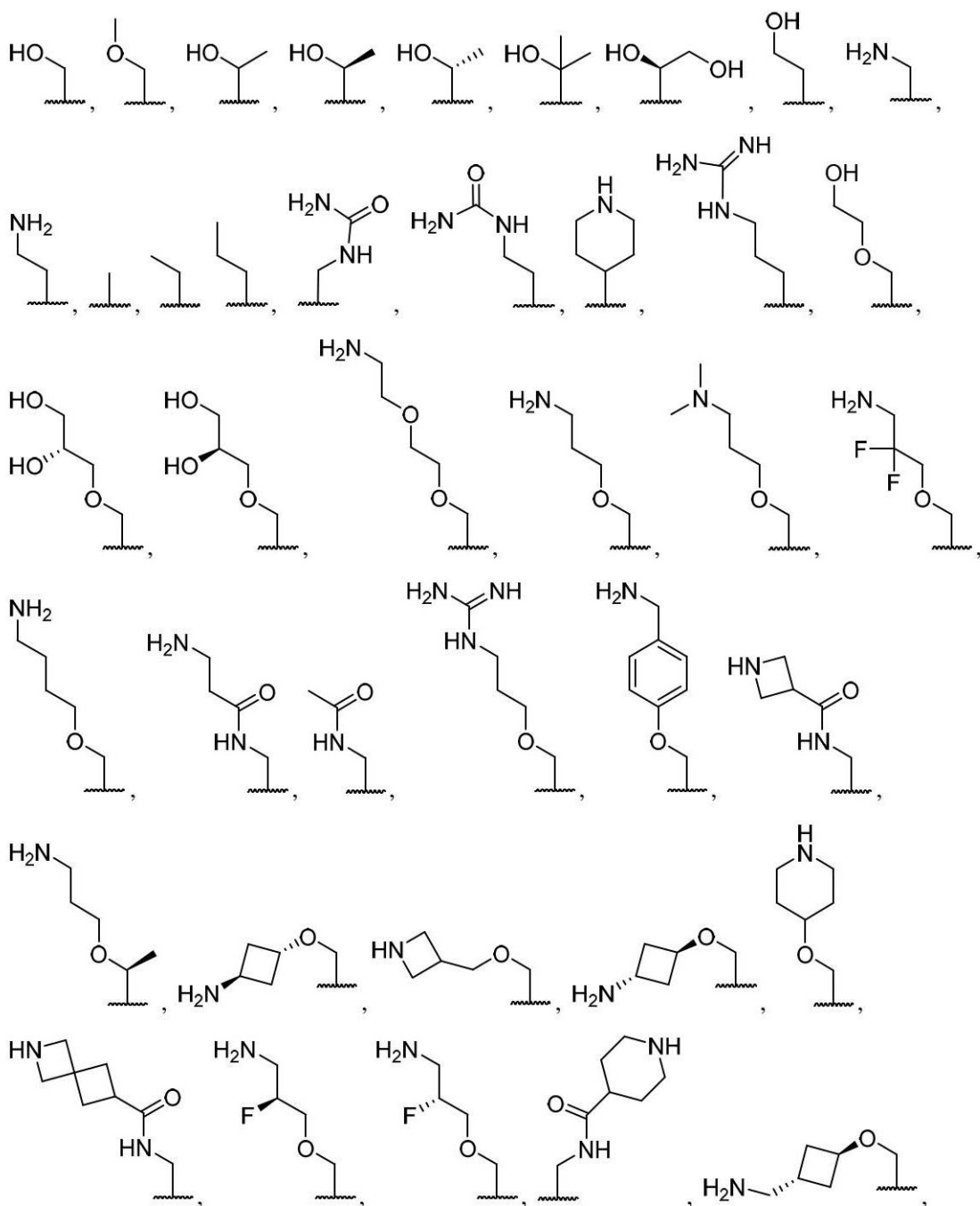
【請求項 11】

R⁶が、1、2、又は3個の－OR^bで置換されてもよいC₁－C₆アルキルである、
請求項1～請求項10のいずれか1項の化合物。

【請求項 1 2】

 R^6 が :

【化 5 - 1】



【請求項 13】

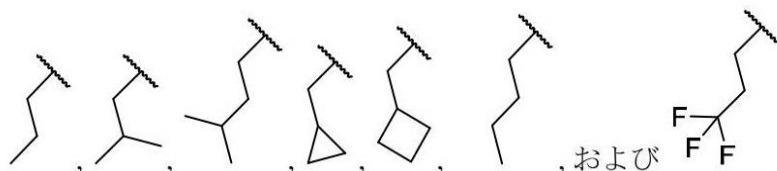
【請求項 14】

【請求項 15】

【請求項 16】

【請求項 17】

【化 6】



【請求項 18】

【請求項 19】

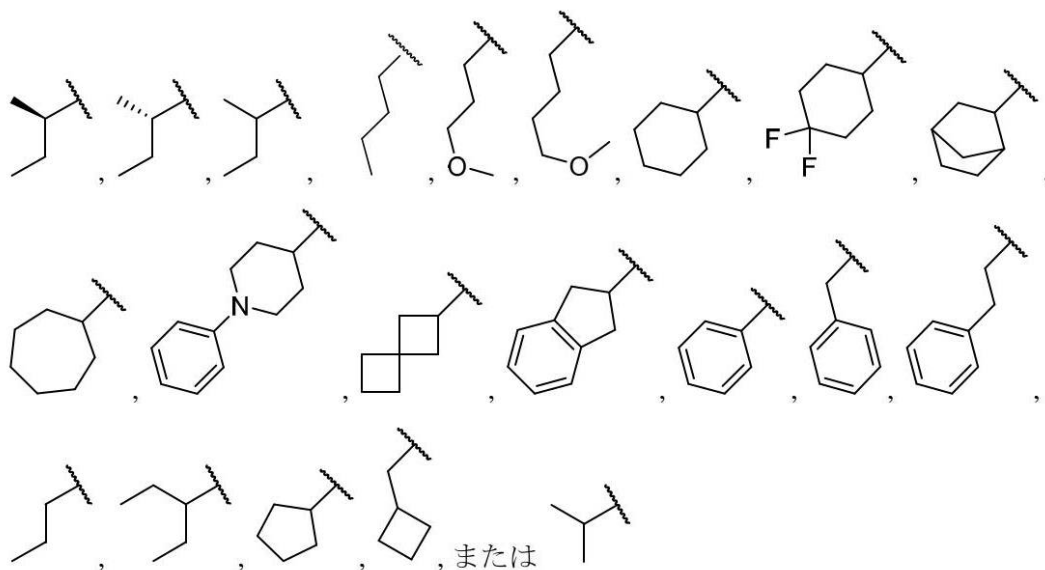
R¹⁻⁶ が、C₁-C₆ アルキル、(C₁-C₆ アルキル) シクロアルキル、シクロアルキル、(C₁-C₆ アルキル) アリール、又はアリールであり、それぞれは、1、2、又は3個のハロゲン、-OR^b、-NR^bR^c、-S(=O)₂R^a、-NR^bS(=O)₂

${}_2R^a$ 、 $-S(=O){}_2NR^bR^c$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-OC(=O)R^a$ 、 $-C(=O)OR^a$ 、 $-OC(=O)OR^b$ 、 $-C(=O)NR^bR^c$ 、 $-OC(=O)NR^bR^c$ 、 $-NR^bC(=O)NR^bR^c$ 、 $-NR^bC(=O)R^a$ 、 $-NR^bC(=O)OR^b$ 、又はアリールで置換されてもよい、請求項 1～請求項 18 のいずれか 1 項の化合物。

【請求項 20】

R^{16} が：

【化 7】



より選択される、請求項 1～請求項 19 のいずれか 1 項の化合物。

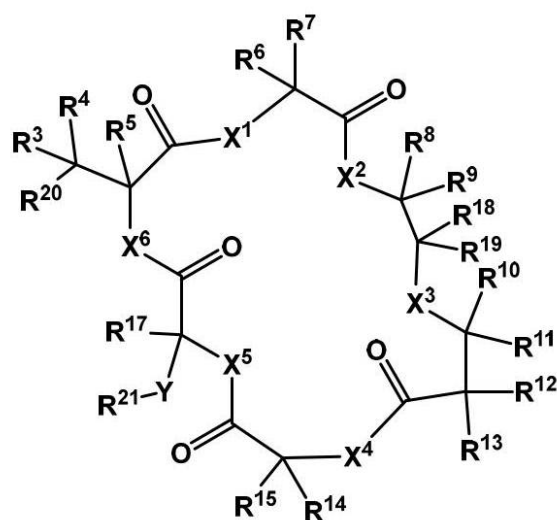
【請求項 21】

R^a が独立して C_1-C_6 アルキルであり、そしてそれぞれの R^b と R^c が独立して水素又は C_1-C_6 アルキルである、請求項 1～請求項 20 のいずれか 1 項の化合物。

【請求項 22】

式 (III)：

【化 8】



式 (III);

[式中:]

X^1 は、 $-O-$ 又は $-NR^{1a}-$ であり；

X^2 は、 $-O-$ 又は $-NR^{2a}-$ であり；

X^3 は、 $-O-$ 又は $-NR^{3a}-$ であり；

X^4 は、 $-O-$ 又は $-NR^{4a}-$ であり；

X^5 は、 $-O-$ 又は $-NR^{5a}-$ であり；

X^6 は、 $-O-$ 又は $-NR^{6a}-$ であり；

但し、 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 X^5 、又は X^6 の少なくとも 1 つは、 $-O-$ であり；

Y は、結合であるか又は置換されてもよい C_1-C_6 アルキレンであり；

R^{1a} 、 R^{2a} 、 R^{3a} 、 R^{4a} 、 R^{5a} 、及び R^{6a} は、それぞれ独立して、水素又は置換されてもよい C_1-C_6 アルキルであり；

R^1 と R^2 は、それぞれ独立して、水素、置換されてもよい C_1-C_6 アルキル、置換されてもよい C_2-C_6 アルケニル、置換されてもよい C_2-C_6 アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) シクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) ヘテロシクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) アリール、置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) ヘテロアリール、 $-S(=O)_2R^a$ 、 $-S(=O)_2NR^bR^c$ 、 $-C(=O)R^a$ 、 $-C(=O)OR^b$ 、又は $-C(=O)NR^bR^c$ である；

又は R^1 と R^2 は、それらが付く窒素原子と一緒にあって、置換されてもよいヘテロシクロアルキルを形成し；

R^3 と R^4 は、それぞれ独立して、水素、置換されてもよい C_1-C_6 アルキル、置換されてもよい C_2-C_6 アルケニル、置換されてもよい C_2-C_6 アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、又は置換されてもよいヘテロアリールである；

又は R^3 と R^4 は、それらが付く炭素原子と一緒にあって、オキソを形成し；

R^5 は、水素、ハロゲン、置換されてもよい C_1-C_6 アルキル、置換されてもよい C_2-C_6 アルケニル、又は置換されてもよい C_2-C_6 アルキニルであり；

R^6 と R^7 は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、置換されてもよい C_1-C_6 アルキル、置換されてもよい C_2-C_6 アルケニル、置換されてもよい C_2-C_6 アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) シクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) ヘテロシクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) アリール、又は置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) ヘテロアリールであり；

R^8 と R^9 は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、置換されてもよい C_1-C_6 アルキル、置換されてもよい C_2-C_6 アルケニル、置換されてもよい C_2-C_6 アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) シクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) ヘテロシクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) アリール、又は置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) ヘテロアリールであり；

R^{10} と R^{11} は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、置換されてもよい C_1-C_20 アルキル、置換されてもよい C_2-C_{20} アルケニル、置換されてもよい C_2-C_{20} アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) シクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) ヘテロシクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) アリール、又は置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) ヘテロアリールであり；

R^{12} と R^{13} は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、置換されてもよい C_1-C_6 アルキル、置換されてもよい C_2-C_6 アルケニル、置換されてもよい C_2-C_6 アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) シクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) ヘテロシクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) アリール、又は置換されてもよい (C_1-C_6 アルキル) ヘテロアリールである；

又は R^{10} と R^{12} は、一緒にあって、置換されてもよいシクロアルキル又は置換されてもよいシクロアルケニルを形成し；

R^{14} と R^{15} は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、置換されてもよい C_1-C_6 アルキル、置換されてもよい C_2-C_6 アルケニル、置換されてもよい C_2-C_6 アルキ

ニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) シクロアルキル、置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) ヘテロシクロアルキル、置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) アリール、又は置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) ヘテロアリールである；

又は R^{14} と R^{4a} は、それらが付く原子と一緒にあって、置換されてもよいヘテロシクロアルキルを形成し；

R^{17} は、水素、ハロゲン、置換されてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、置換されてもよい $C_2 - C_6$ アルケニル、置換されてもよい $C_2 - C_6$ アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) シクロアルキル、置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) ヘテロシクロアルキル、置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) アリール、又は置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) ヘテロアリールであり；

R^{18} と R^{19} は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、置換されてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、置換されてもよい $C_2 - C_6$ アルケニル、置換されてもよい $C_2 - C_6$ アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) シクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) ヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) アリール、置換されてもよいヘテロアリール、又は置換されてもよい ($C_1 - C_6$ アルキル) ヘテロアリールである；

又は R^{18} と R^{19} は、それらが付く炭素原子と一緒にあって、オキソを形成し；

R^{20} は、ヒドロキシル又は $-NR^{1}R^{2}$ であり；

R^{21} は、置換されてもよいシクロアルキルであり；

それぞれの R^a は、独立して、置換されてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、置換されてもよい $C_2 - C_6$ アルケニル、置換されてもよい $C_2 - C_6$ アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、又は置換されてもよいヘテロアリールであり；

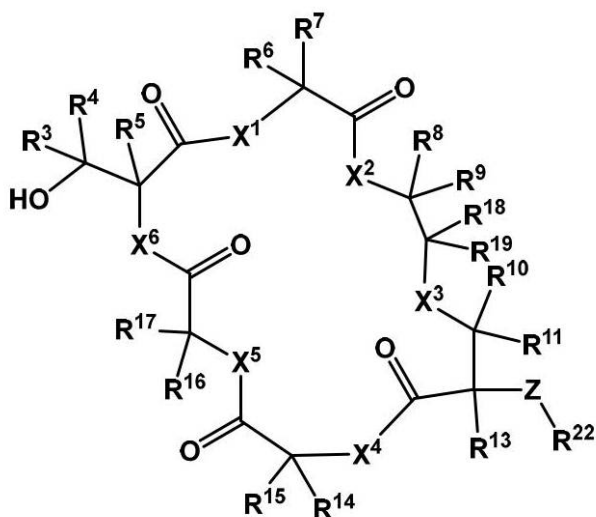
それぞれの R^b と R^c は、独立して、水素、置換されてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、置換されてもよい $C_2 - C_6$ アルケニル、置換されてもよい $C_2 - C_6$ アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、又は置換されてもよいヘテロアリールである；

又は R^b と R^c は、それらが付く窒素原子と一緒にあって、置換されてもよいヘテロシクロアルキルを形成する」の化合物、又はその医薬的に許容される塩、溶媒和物、又は立体異性体。

【請求項 23】

式 (V)：

【化 9】



式 (V);

〔式中：

X^1 は、 $-O-$ 又は $-NR^{1a}-$ であり；

X^2 は、 $-O-$ 又は $-NR^{2a}-$ であり；

X^3 は、 $-O-$ 又は $-NR^{3a}-$ であり；

X^4 は、 $-O-$ 又は $-NR^{4a}-$ であり；

X^5 は、 $-O-$ 又は $-NR^{5a}-$ であり；

X^6 は、 $-O-$ 又は $-NR^{6a}-$ であり；

R^{1a} 、 R^{2a} 、 R^{3a} 、 R^{4a} 、 R^{5a} 、及び R^{6a} は、それぞれ独立して、水素又は置換されてもよい C_1-C_6 アルキルであり；

R^3 と R^4 は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、置換されてもよい C_1-C_6 アルキル、置換されてもよい C_2-C_6 アルケニル、置換されてもよい C_2-C_6 アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、又は置換されてもよいヘテロアリールである；

又は R^3 と R^4 は、それらが付く炭素原子と一緒にあって、オキソを形成し；

R^5 は、水素、ハロゲン、置換されてもよい C_1-C_6 アルキル、置換されてもよい C_2-C_6 アルケニル、又は置換されてもよい C_2-C_6 アルキニルであり；

R^6 と R^7 は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、置換されてもよい C_1-C_6 アルキル、置換されてもよい C_2-C_6 アルケニル、置換されてもよい C_2-C_6 アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6) アルキルシクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6) アルキルヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、置換されてもよい (C_1-C_6) アルキルアリール、置換されてもよいヘテロアリール、又は置換されてもよい (C_1-C_6) アルキルヘテロアリールであり；

R^8 と R^9 は、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、置換されてもよい C_1-C_6 アルキル、置換されてもよい C_2-C_6 アルケニル、置換されてもよい C_2-C_6 アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6) アルキルシクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよい (C_1-C_6) アルキルヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、置換されてもよい (C_1-C_6) アルキルアリール、置換されてもよいヘテロアリール、又は置換されてもよい (C_1-C_6) アルキルヘテロアリールであり；

R^{10} は、置換されてもよい C_2-C_{20} アルキルであり；

R^{11} は、水素、ハロゲン、置換されてもよい C_1-C_6 アルキル、置換されてもよい C_2-C_6 アルケニル、置換されてもよい C_2-C_6 アルキニル、置換されてもよいシク

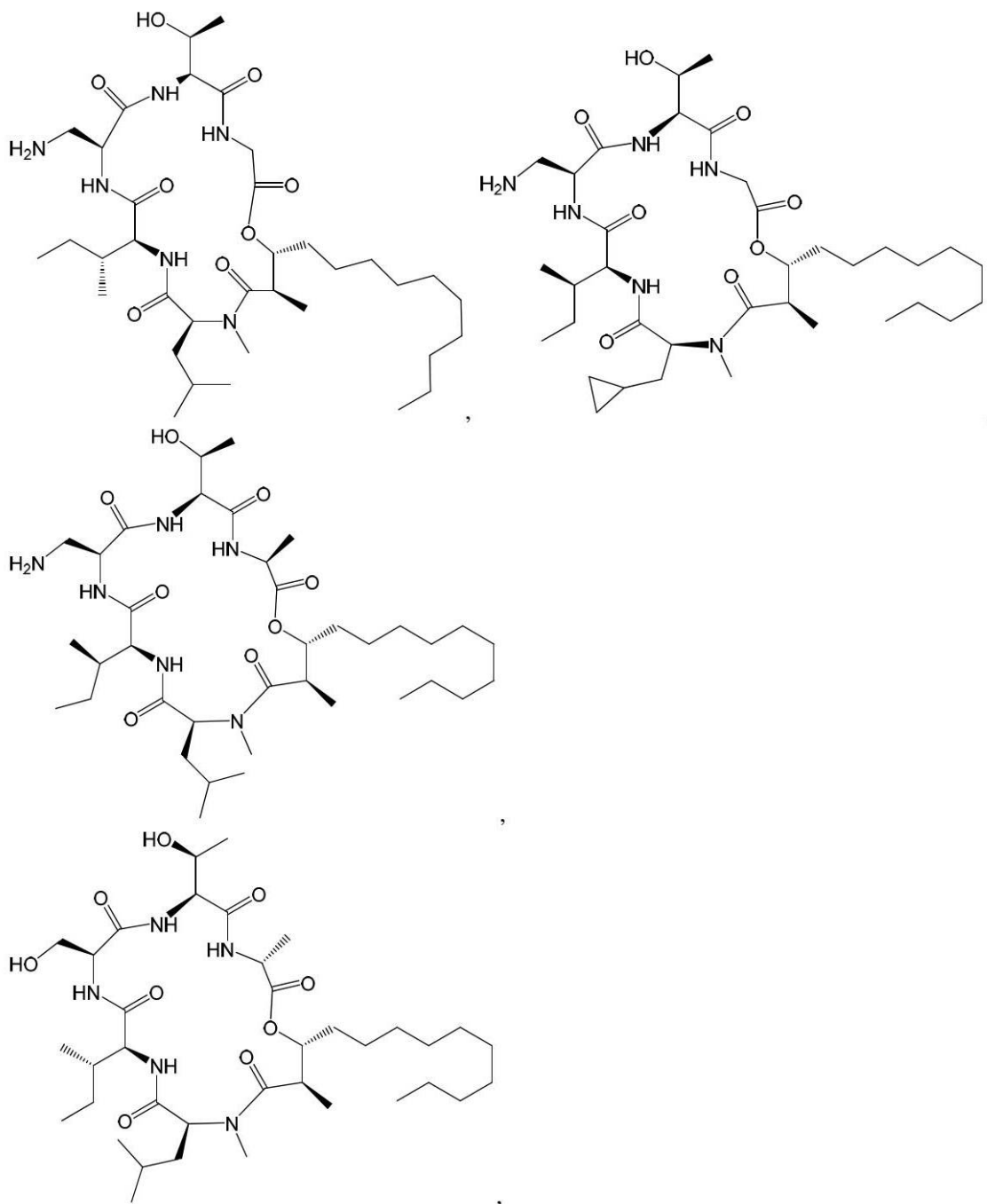
それぞれの R^b と R^c は、独立して、水素、置換されてもよい C₁ - C₆ アルキル、置

換されてもよい C_2-C_6 アルケニル、置換されてもよい C_2-C_6 アルキニル、置換されてもよいシクロアルキル、置換されてもよいヘテロシクロアルキル、置換されてもよいアリール、又は置換されてもよいヘテロアリールである；

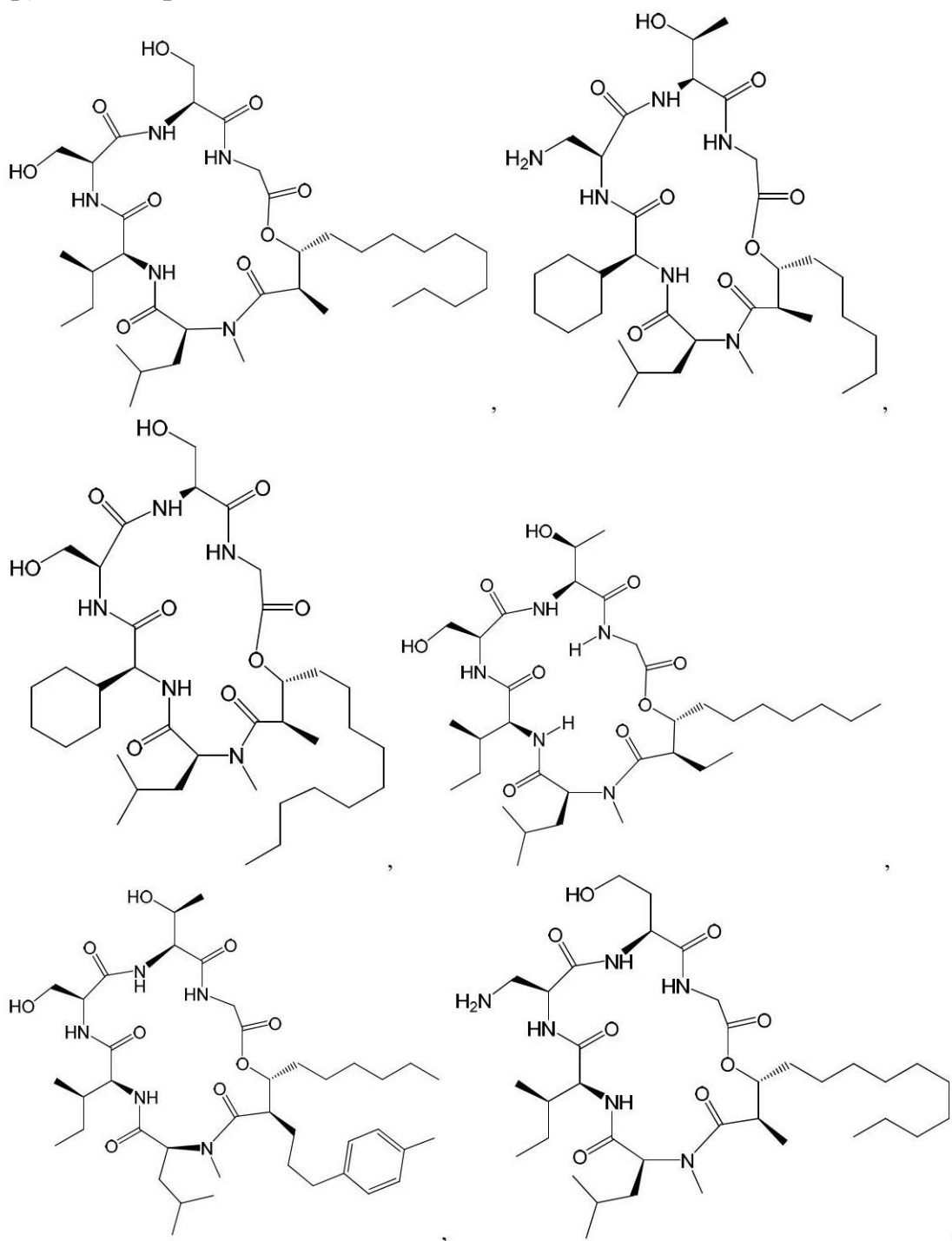
又は R^b と R^c は、それらが付く窒素原子と一緒に、置換されてもよいヘテロシクロアルキルを形成する」の化合物、又はその医薬的に許容される塩、溶媒和物、又は立体異性体。

【請求項 24】

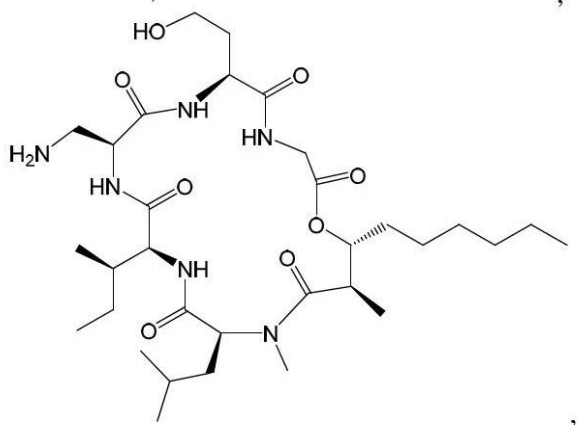
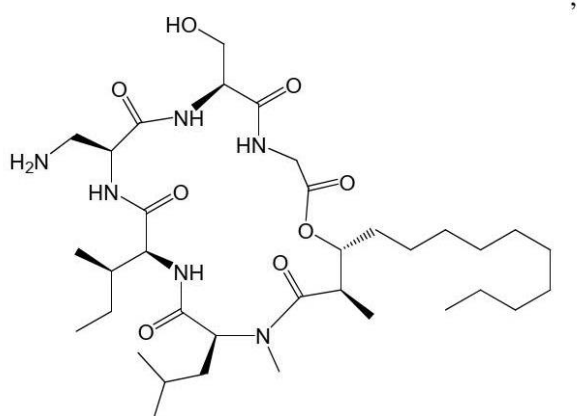
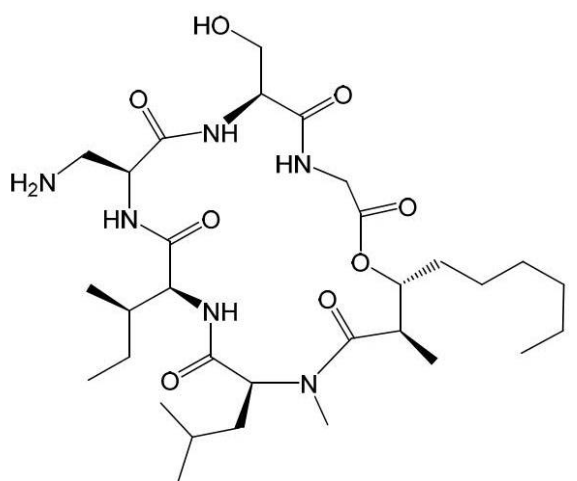
【化 10-1】



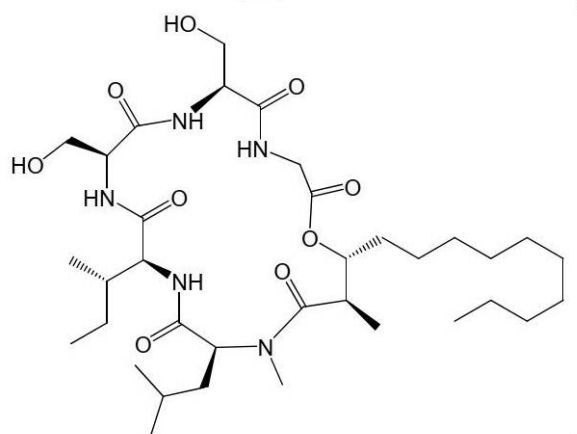
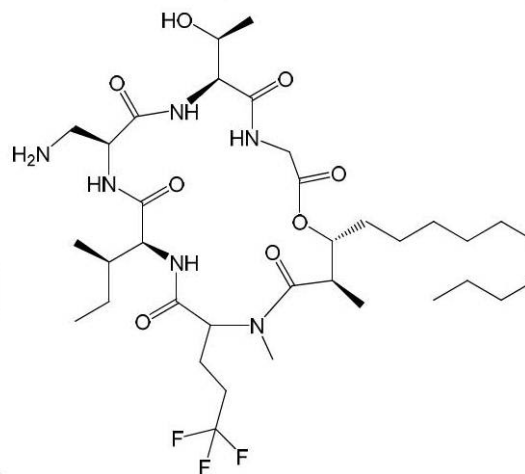
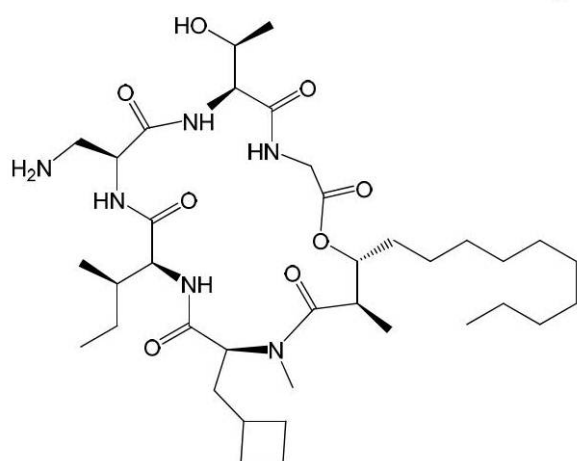
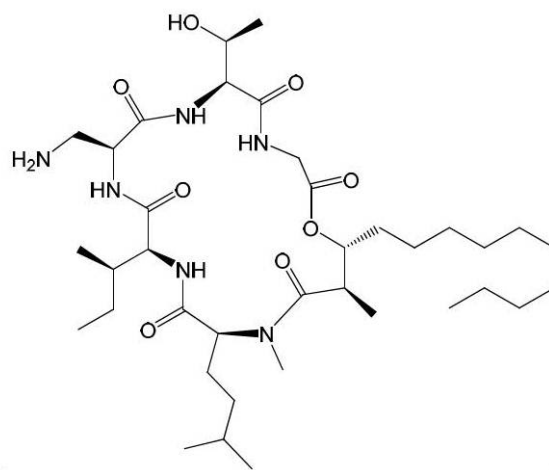
【化 10 - 2】



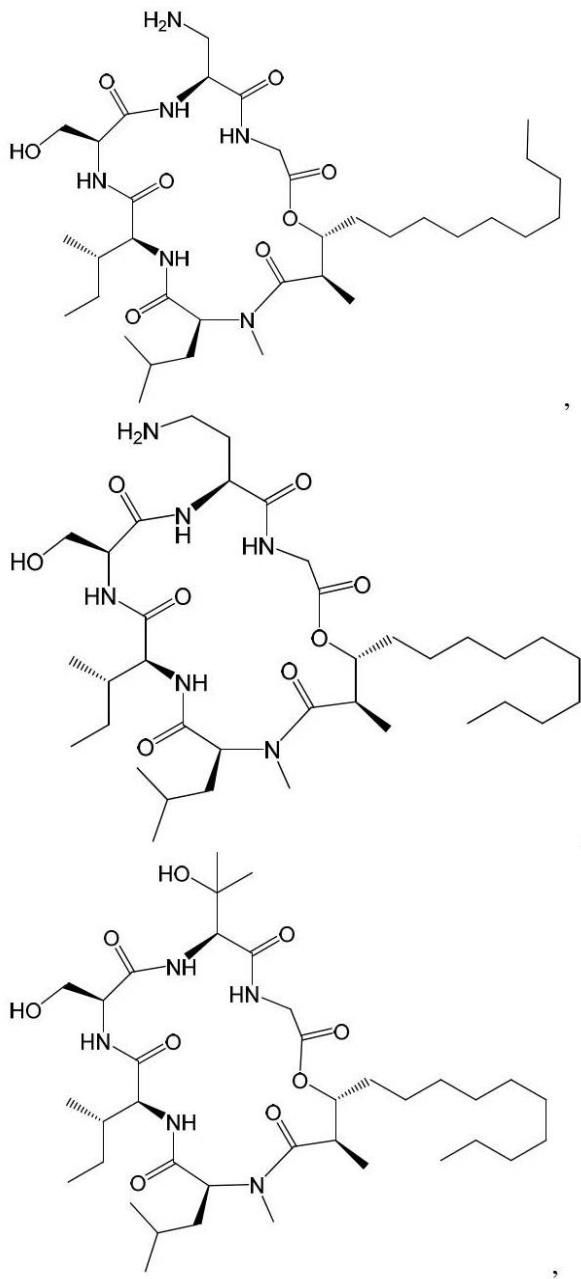
【化 10 - 3】



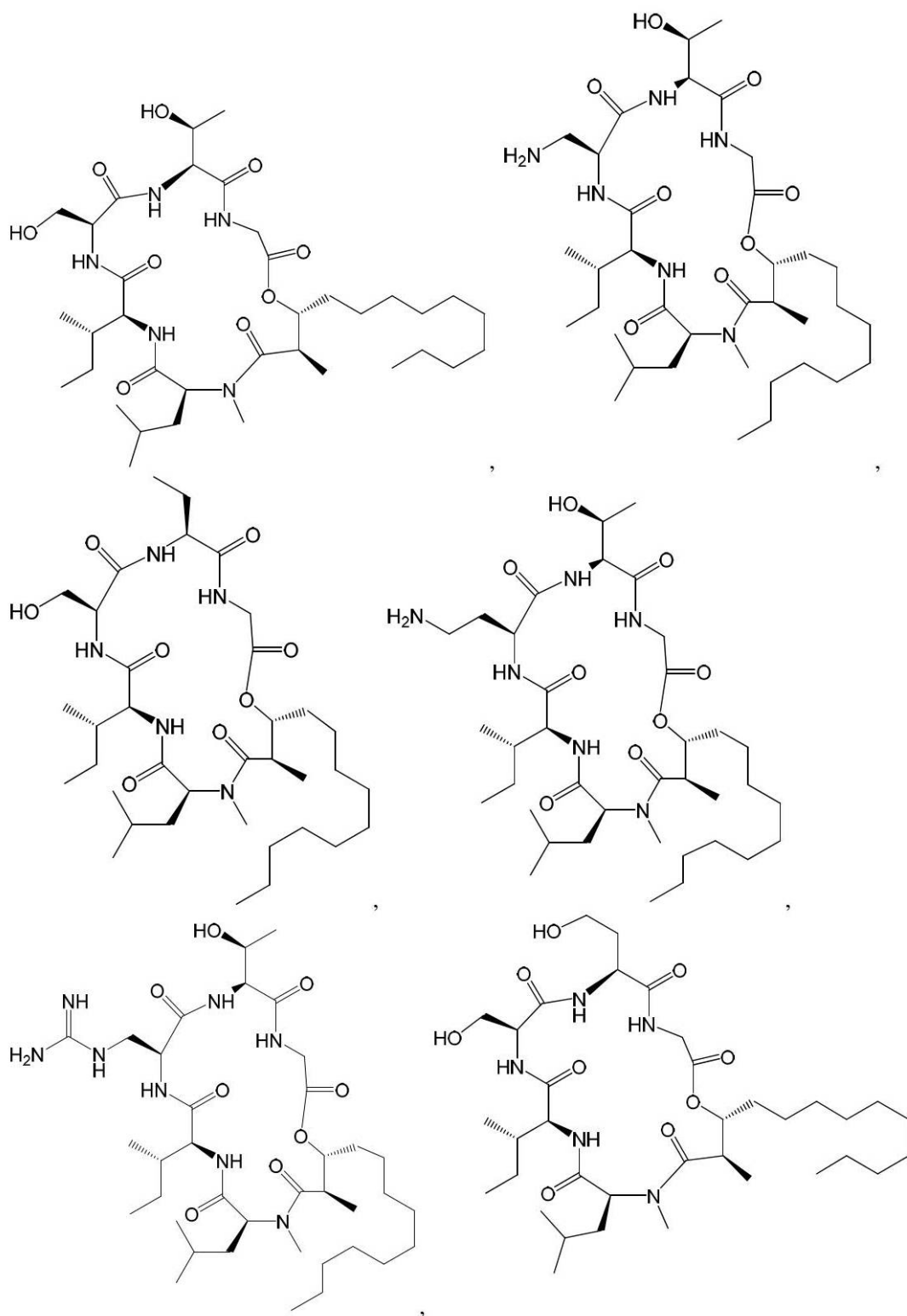
The chemical structure shows a large cyclic peptide derivative. It features a 14-membered ring with several amide bonds. A long alkyl chain (octyl group) is attached to one of the nitrogen atoms in the ring. The structure includes various stereocenters, indicated by wedged and dashed bonds, and a terminal amino group (H₂N).



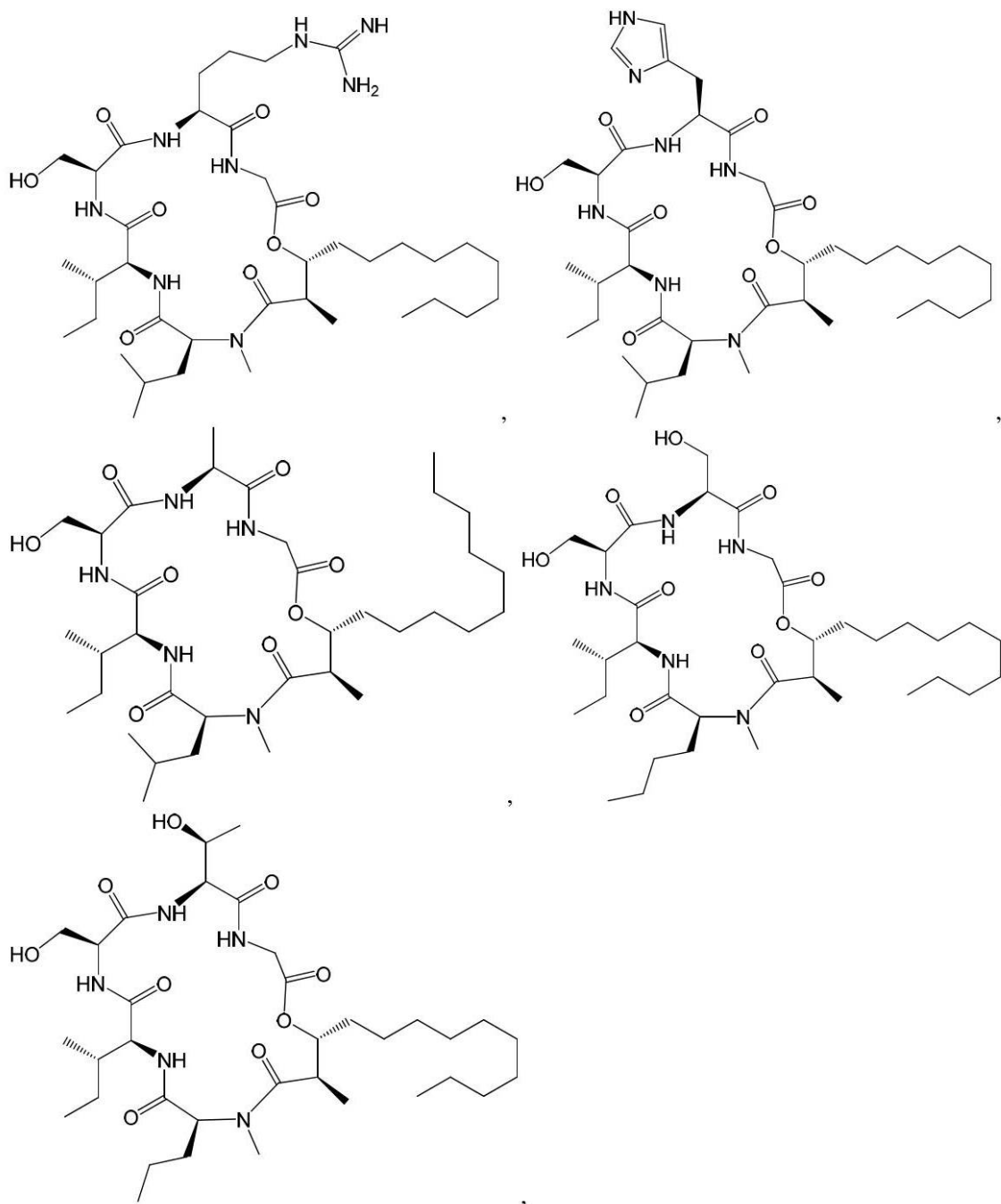
【化 10 - 5】



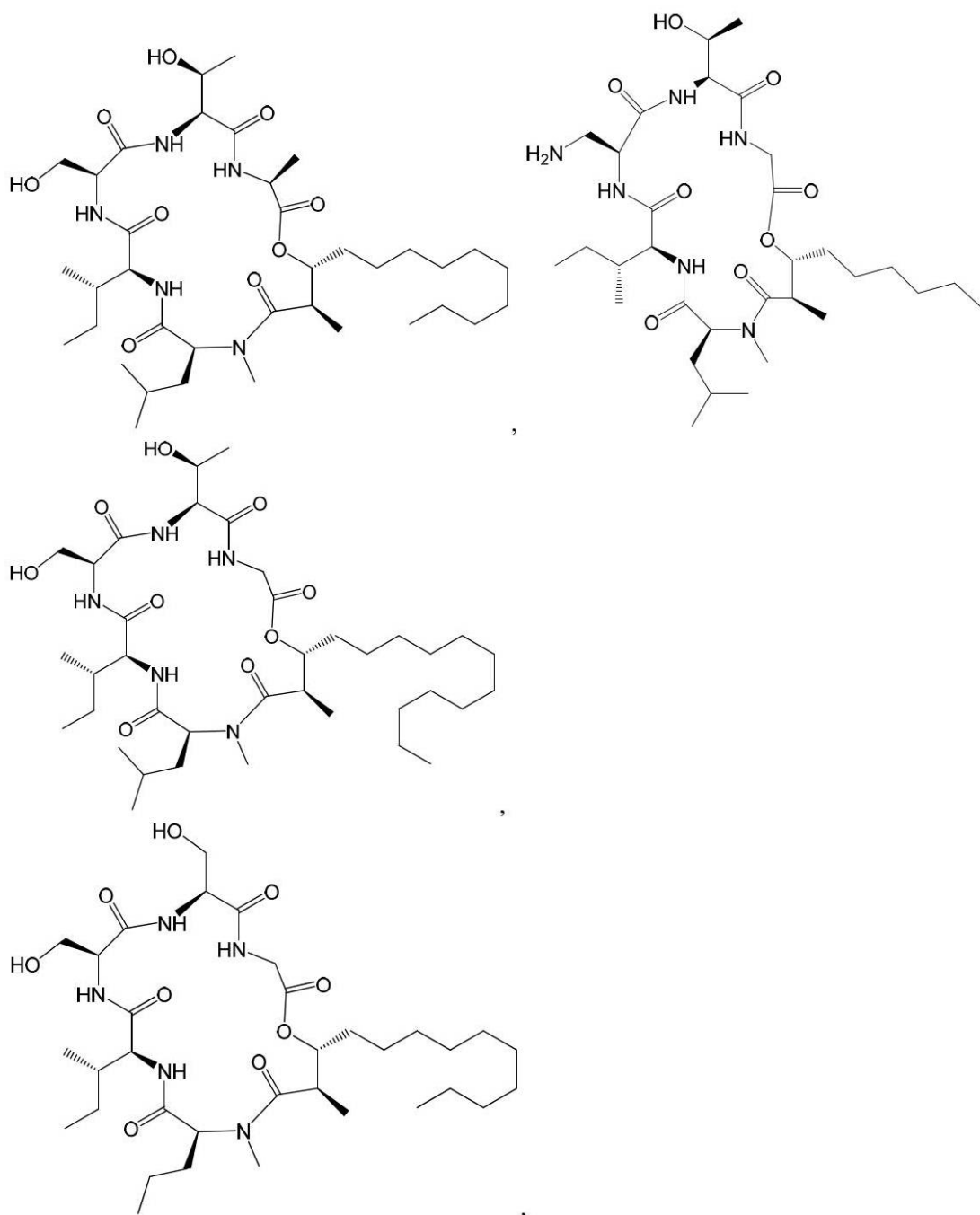
【化 10 - 6】



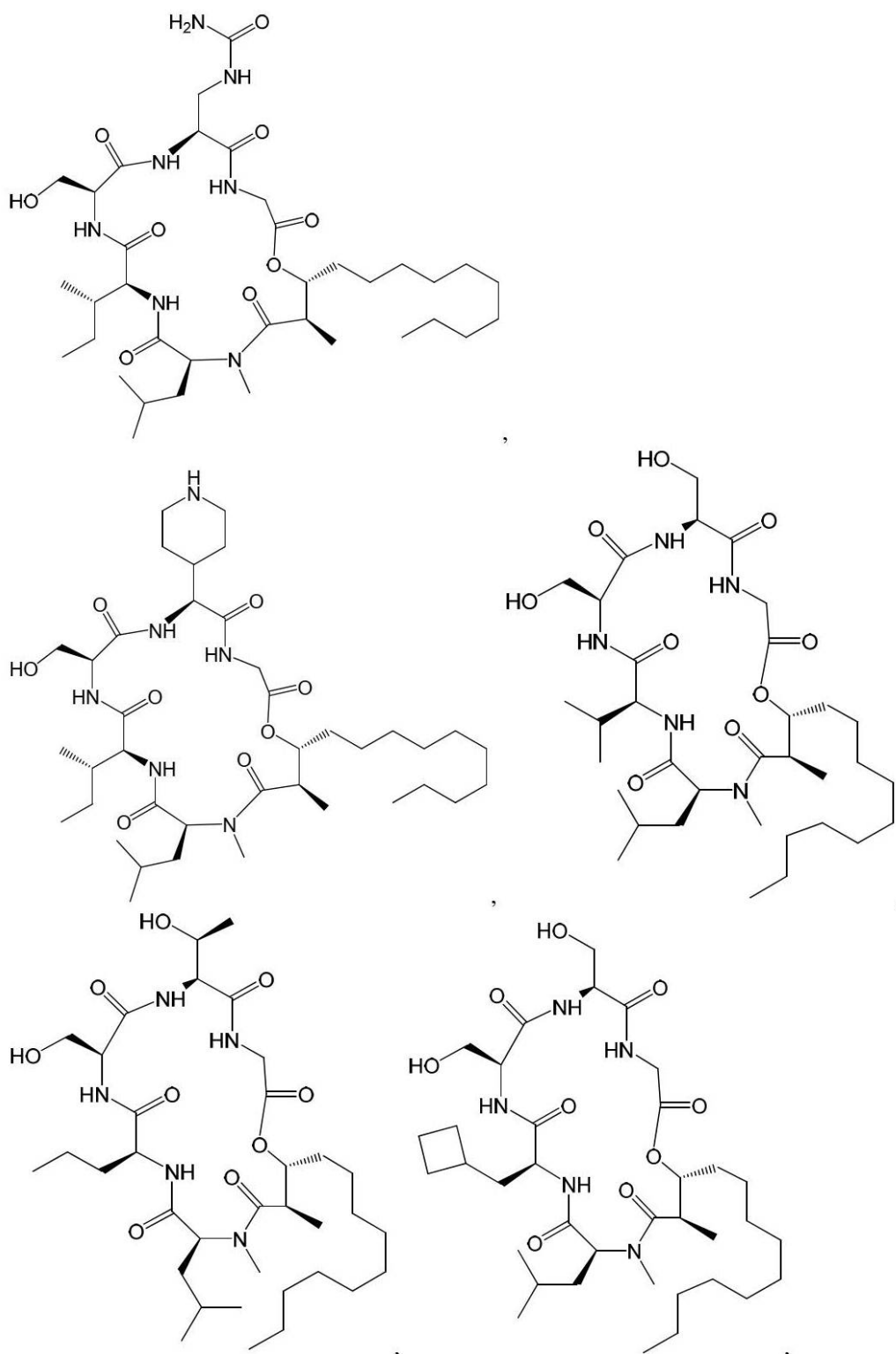
【化 10 - 7】



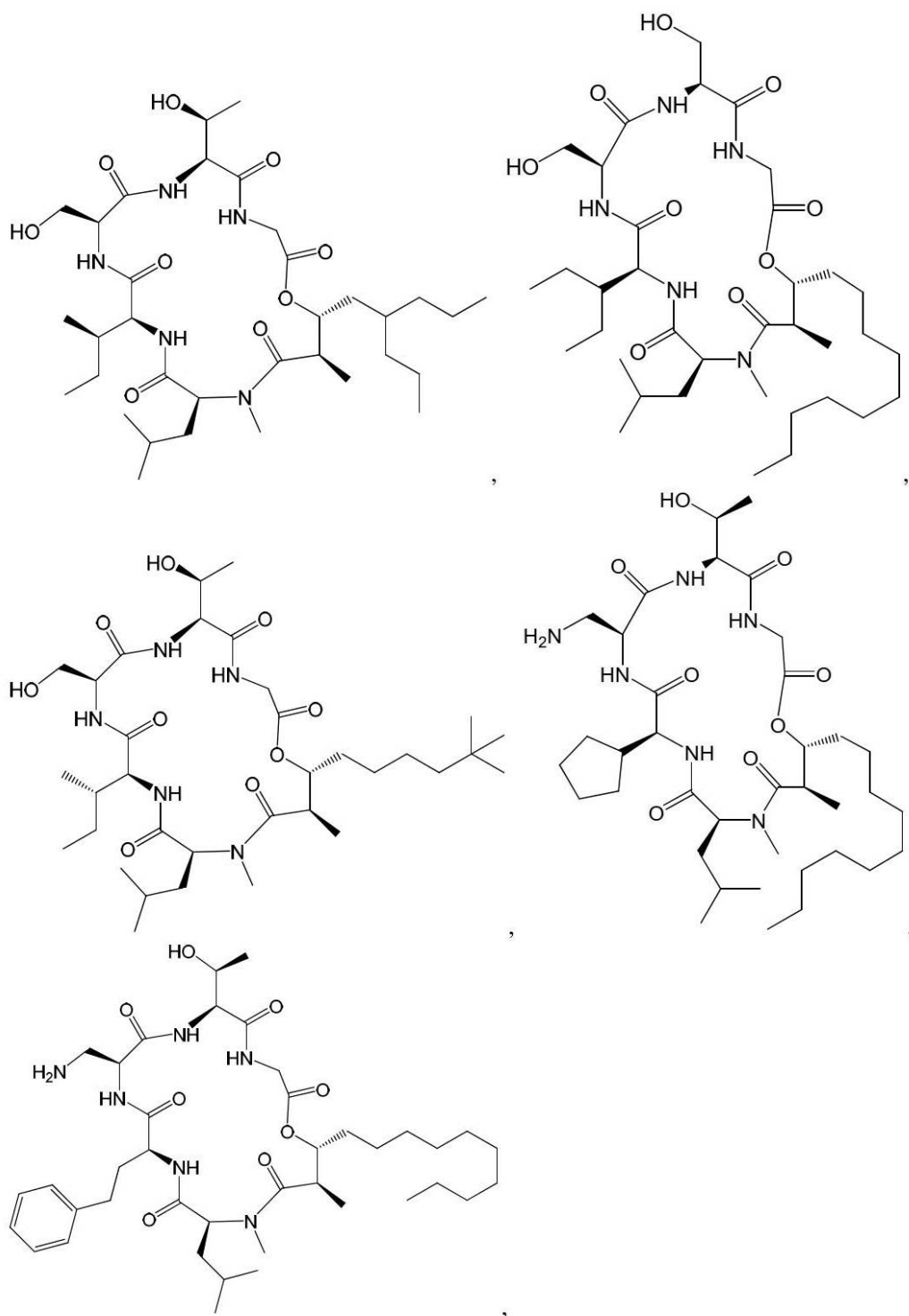
【化 10 - 8】



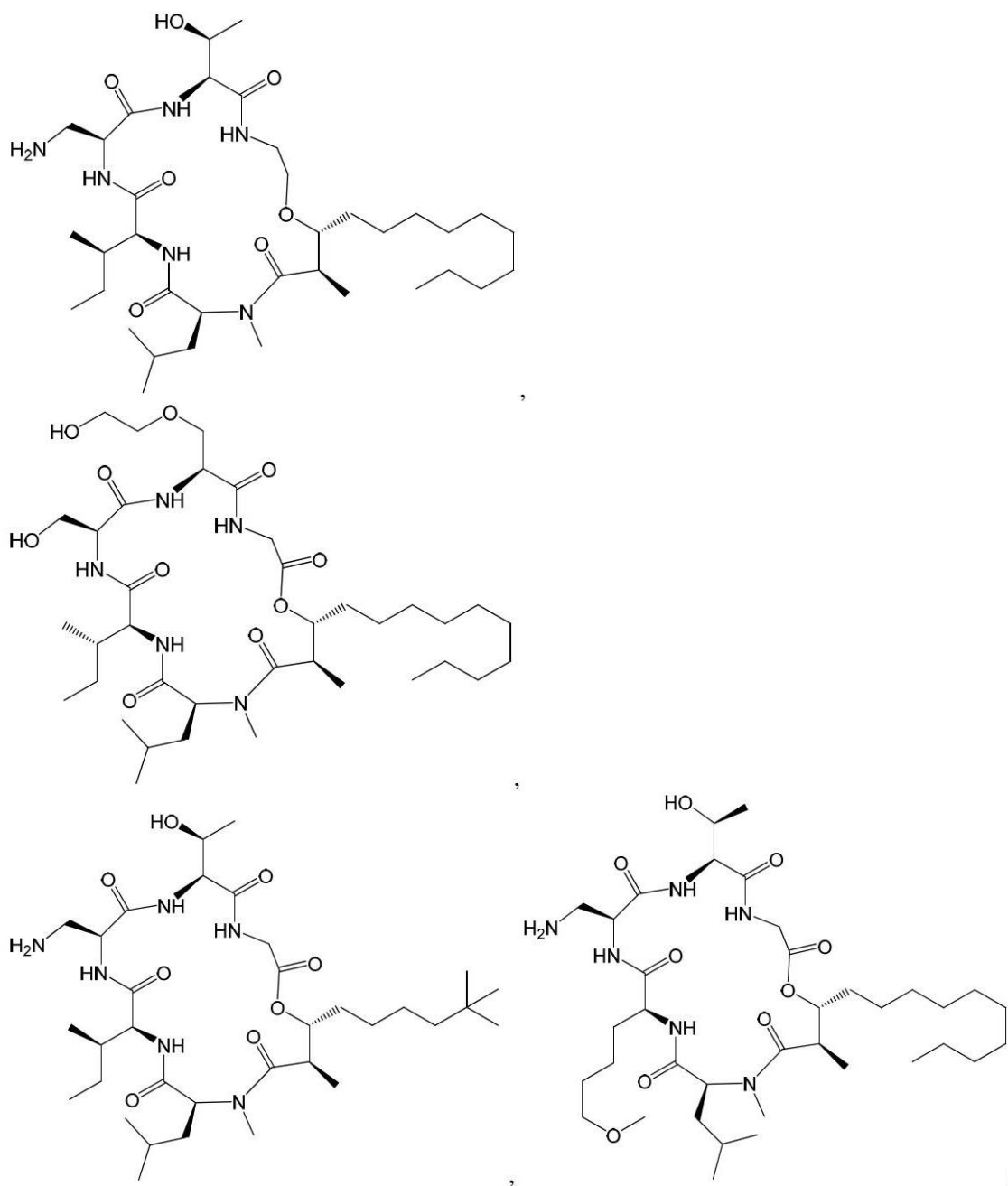
【化 10 - 9】



【化 10 - 10】



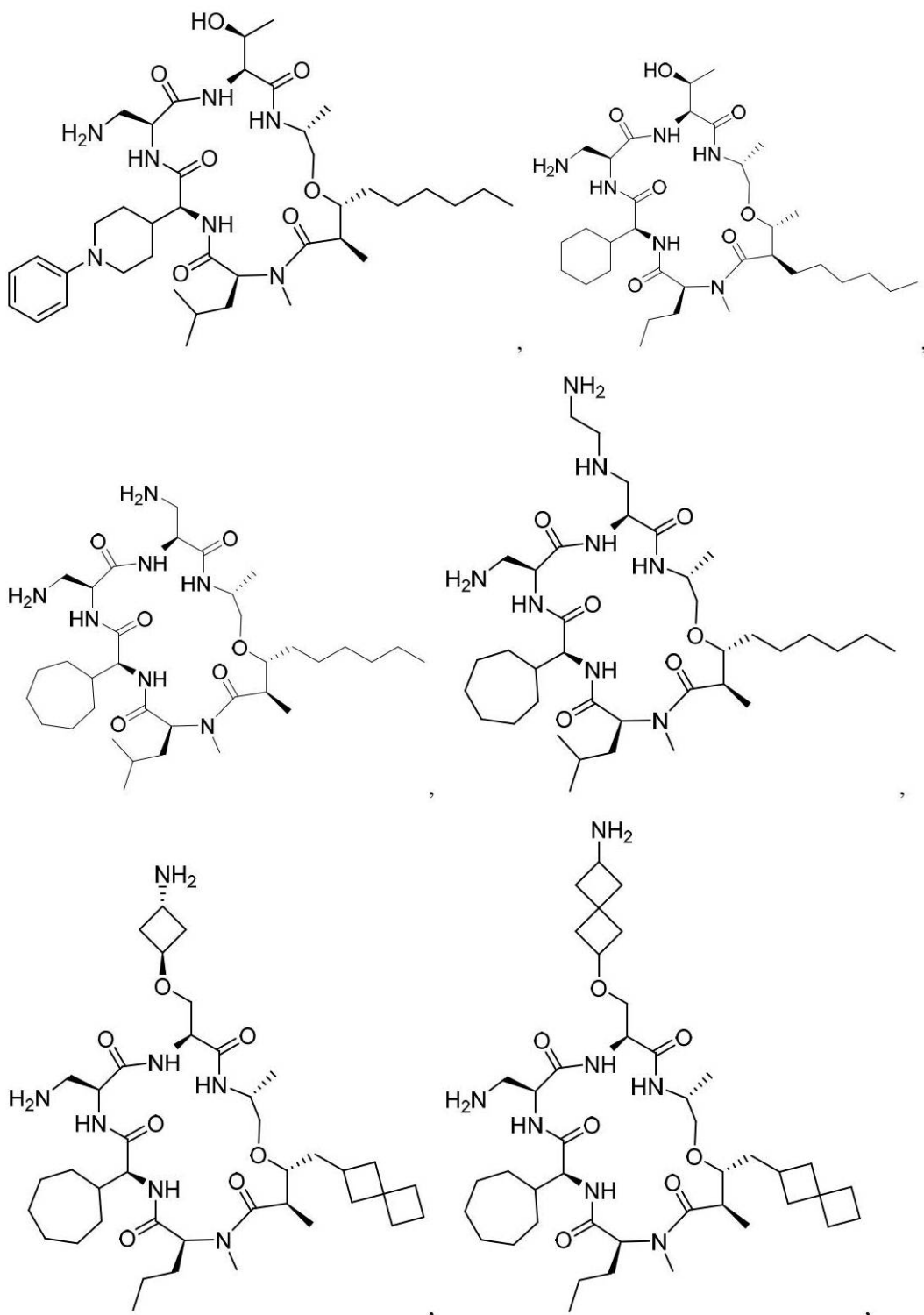
【化 10 - 11】



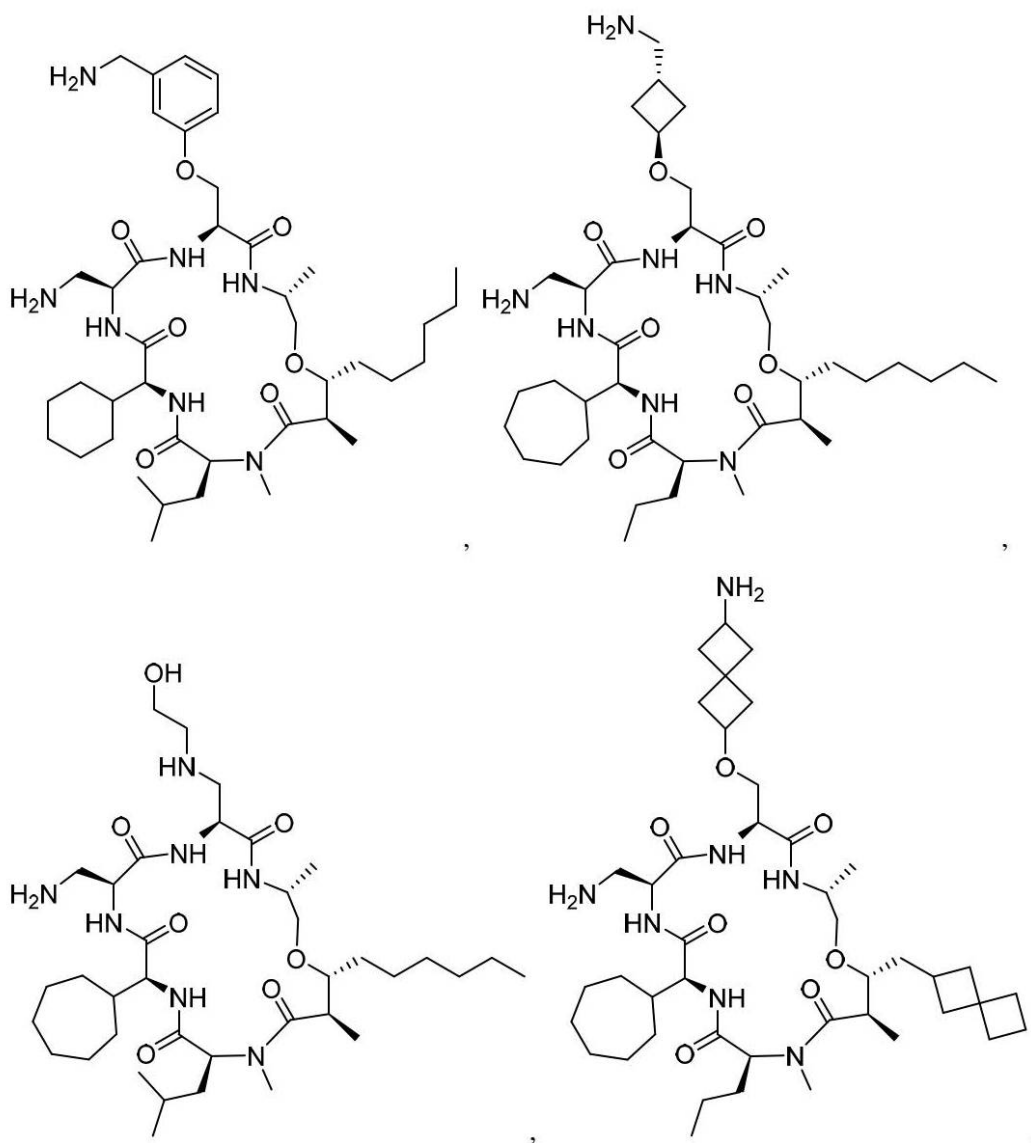
より選択される化合物、又はその医薬的に許容される塩、溶媒和物、又は立体異性体。

【請求項 25】

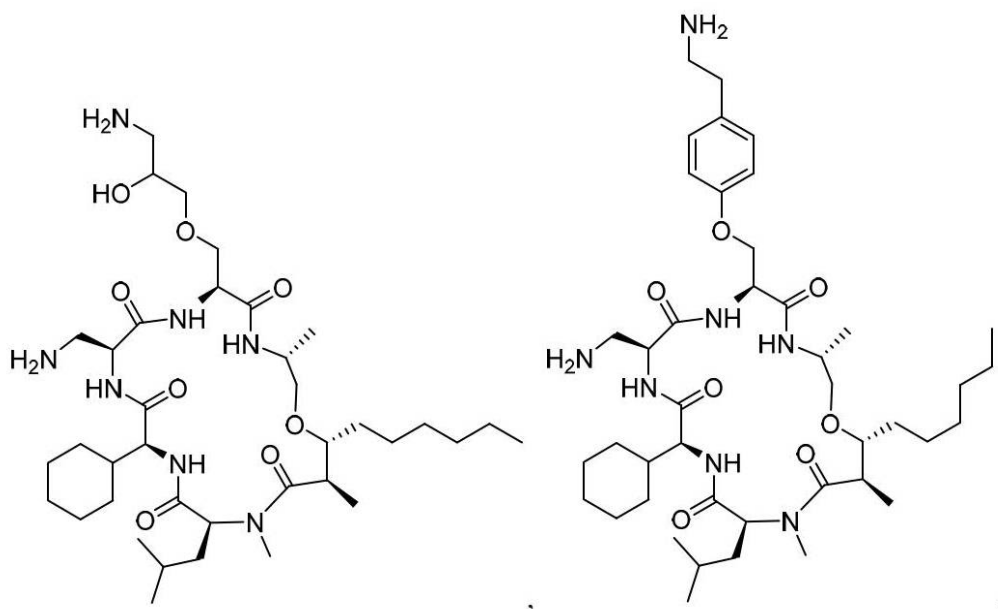
【化 1 1 - 1】



【化 1 1 - 2】



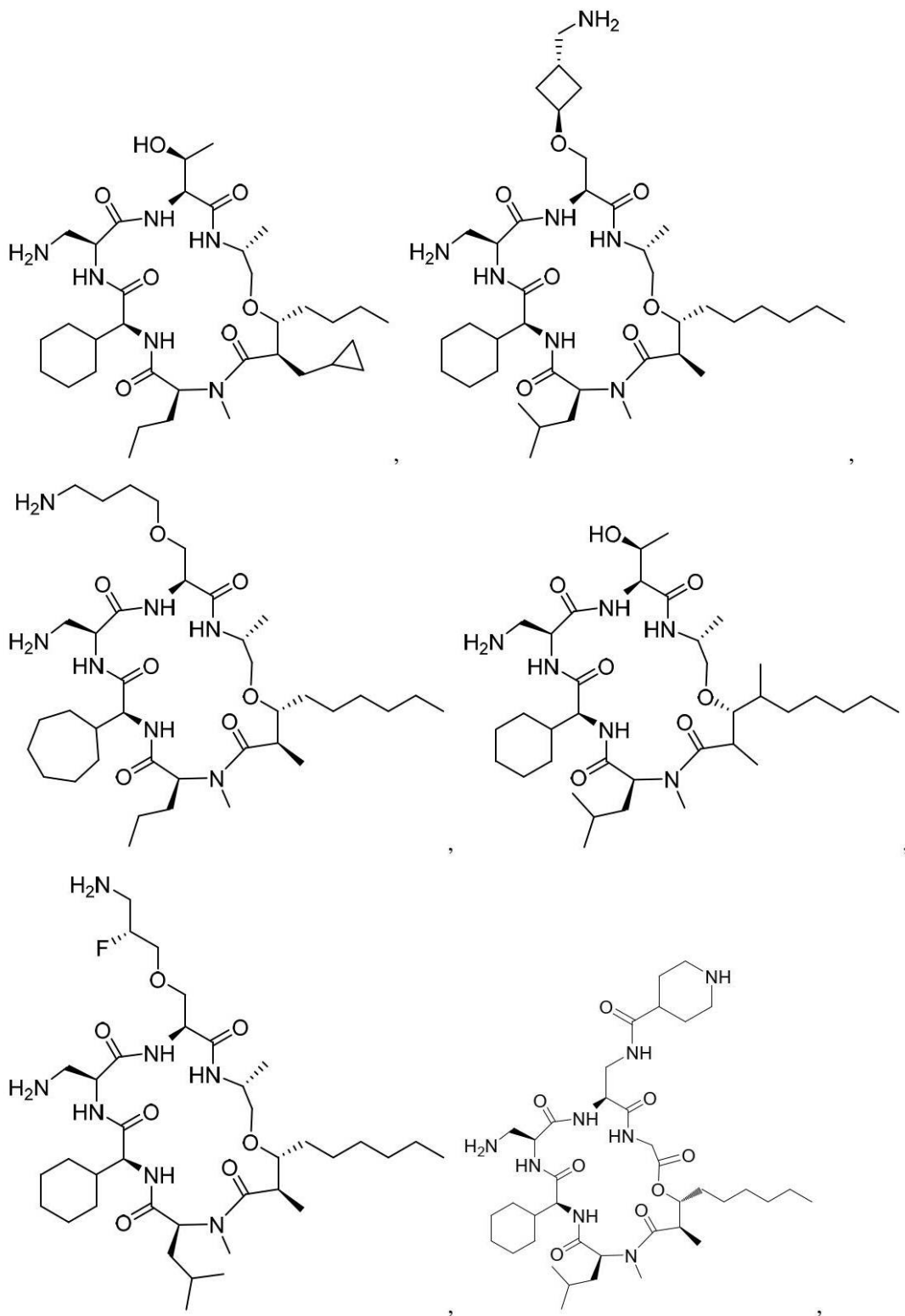
【化 1 1 - 3】



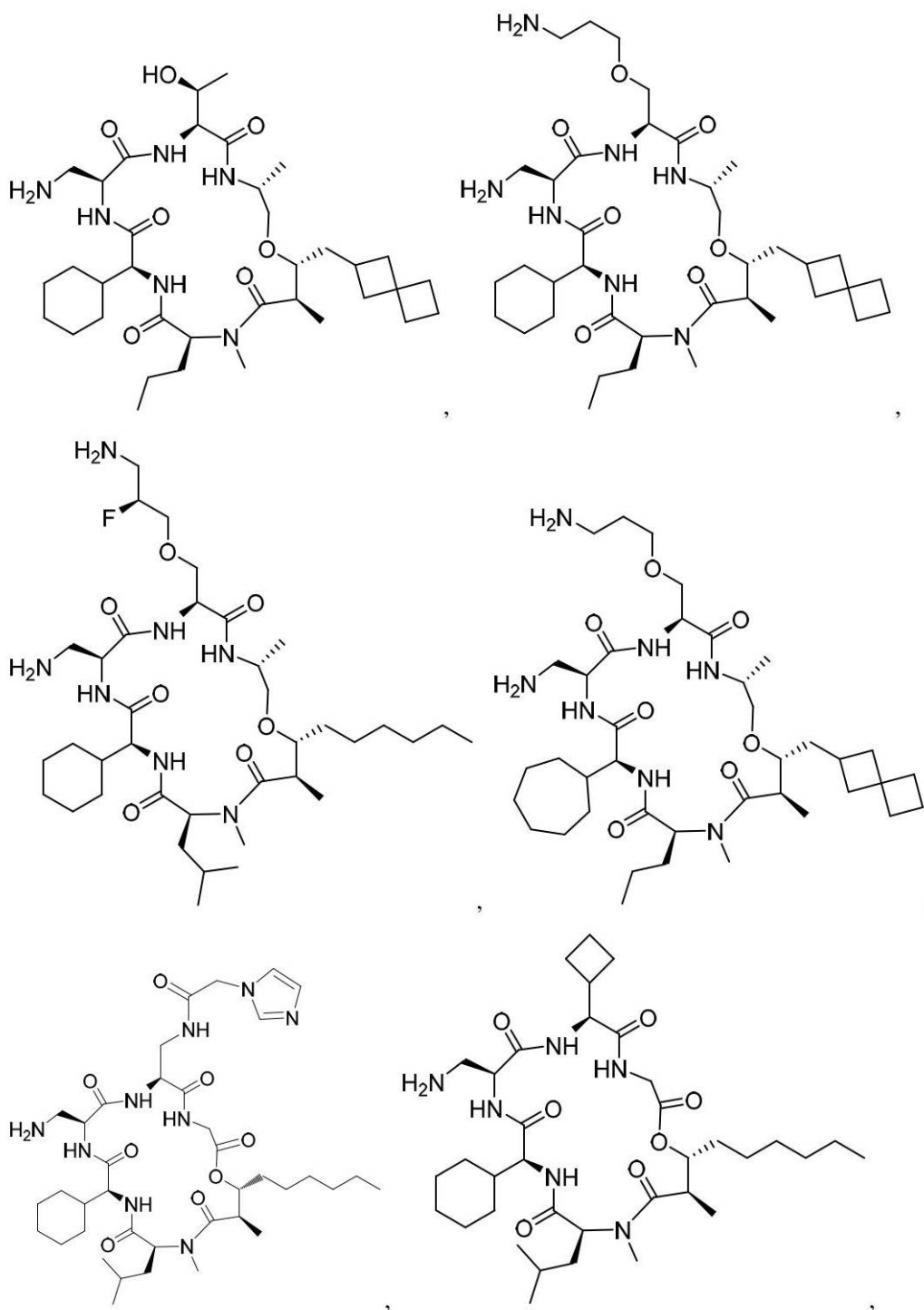
より選択される化合物、又はその医薬的に許容される塩、溶媒和物、又は立体異性体である、請求項 2 4 の化合物。

【請求項 2 6】

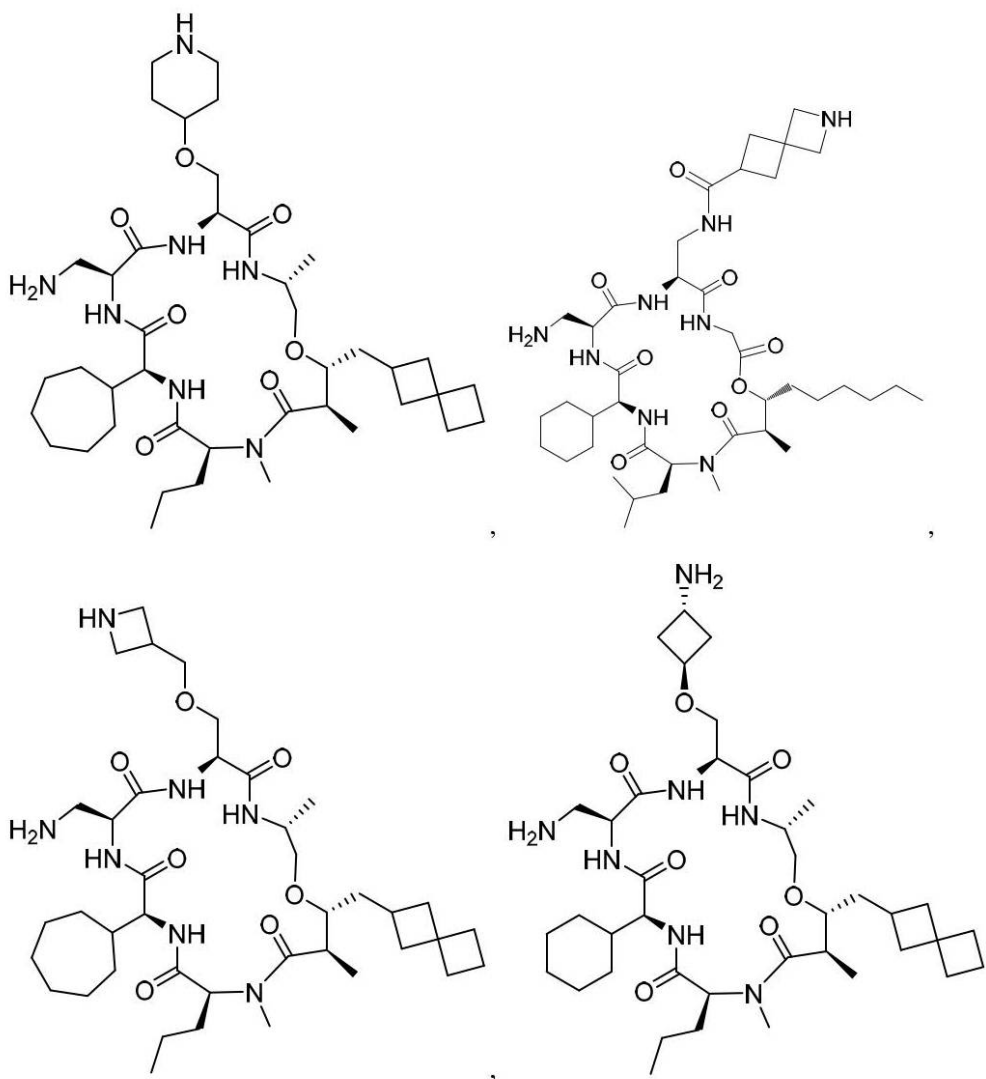
【化 1 2 - 1】



【化 1 2 - 2】



【化 1 2 - 3】



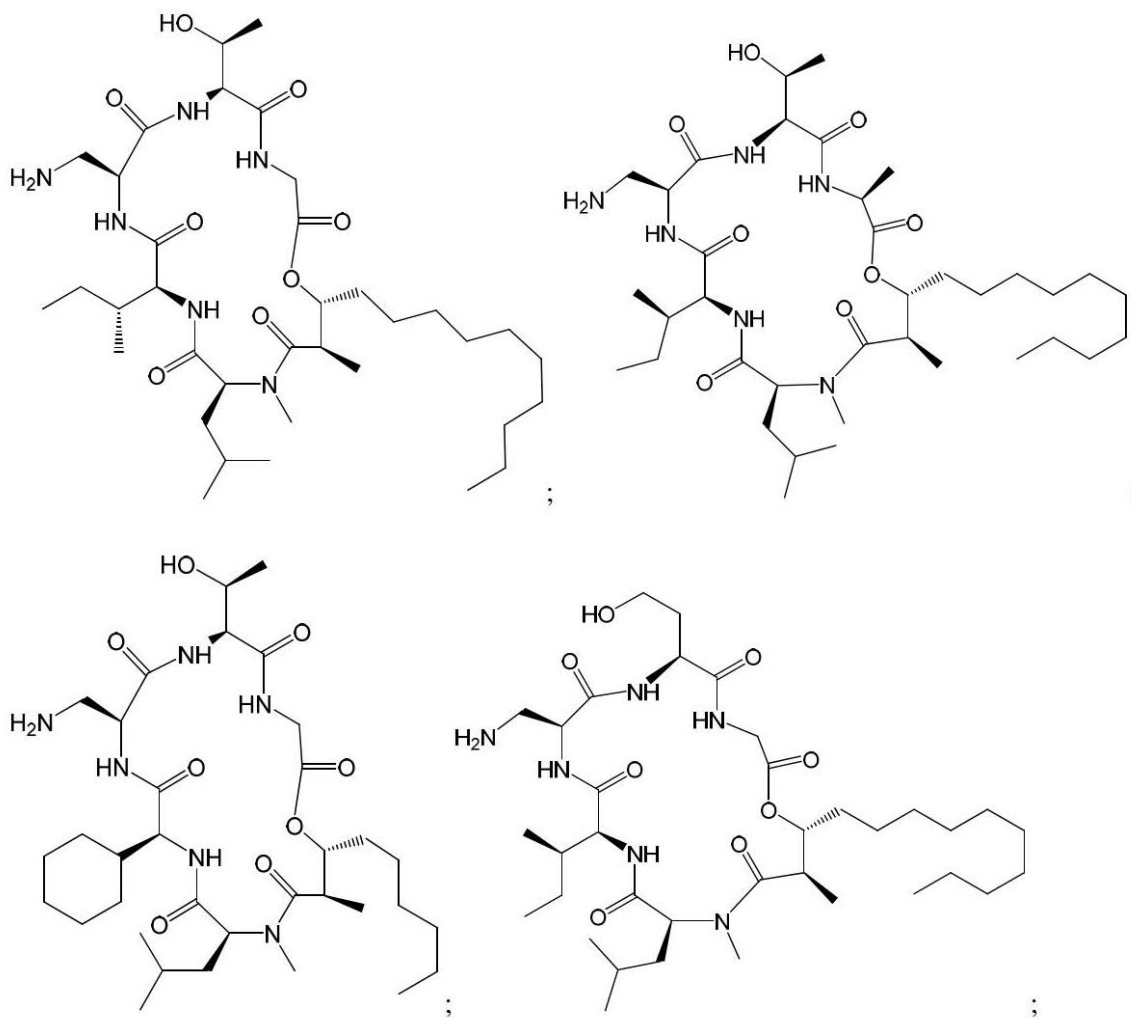
より選択される化合物、又はその医薬的に許容される塩、溶媒和物、又は立体異性体である、請求項 2 4 の化合物。

【請求項 2 7】

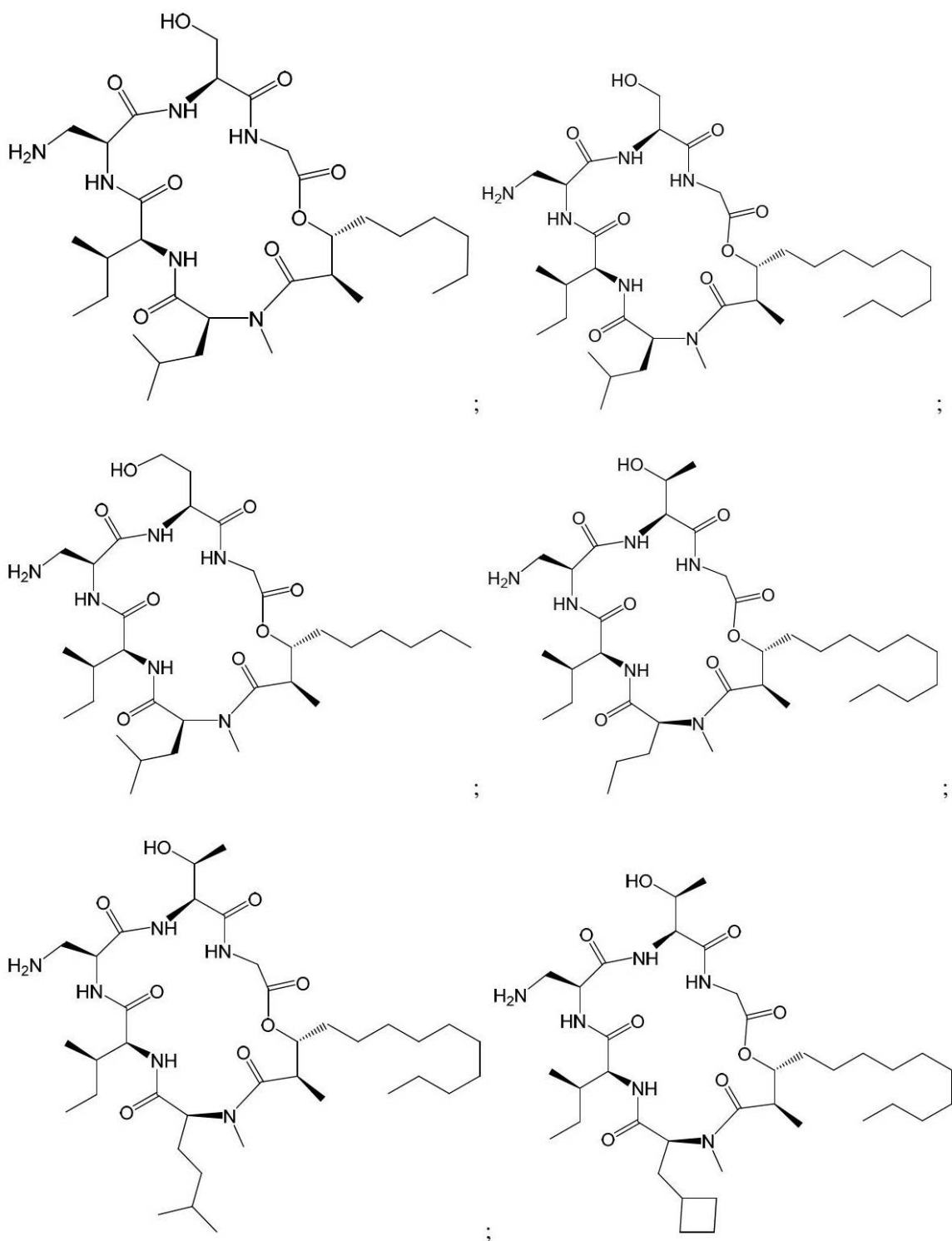
請求項 1 の化合物、又はその医薬的に許容される塩、溶媒和物、又は立体異性体と医薬的に許容される賦形剤を含んでなる医薬組成物。

【請求項 2 8】

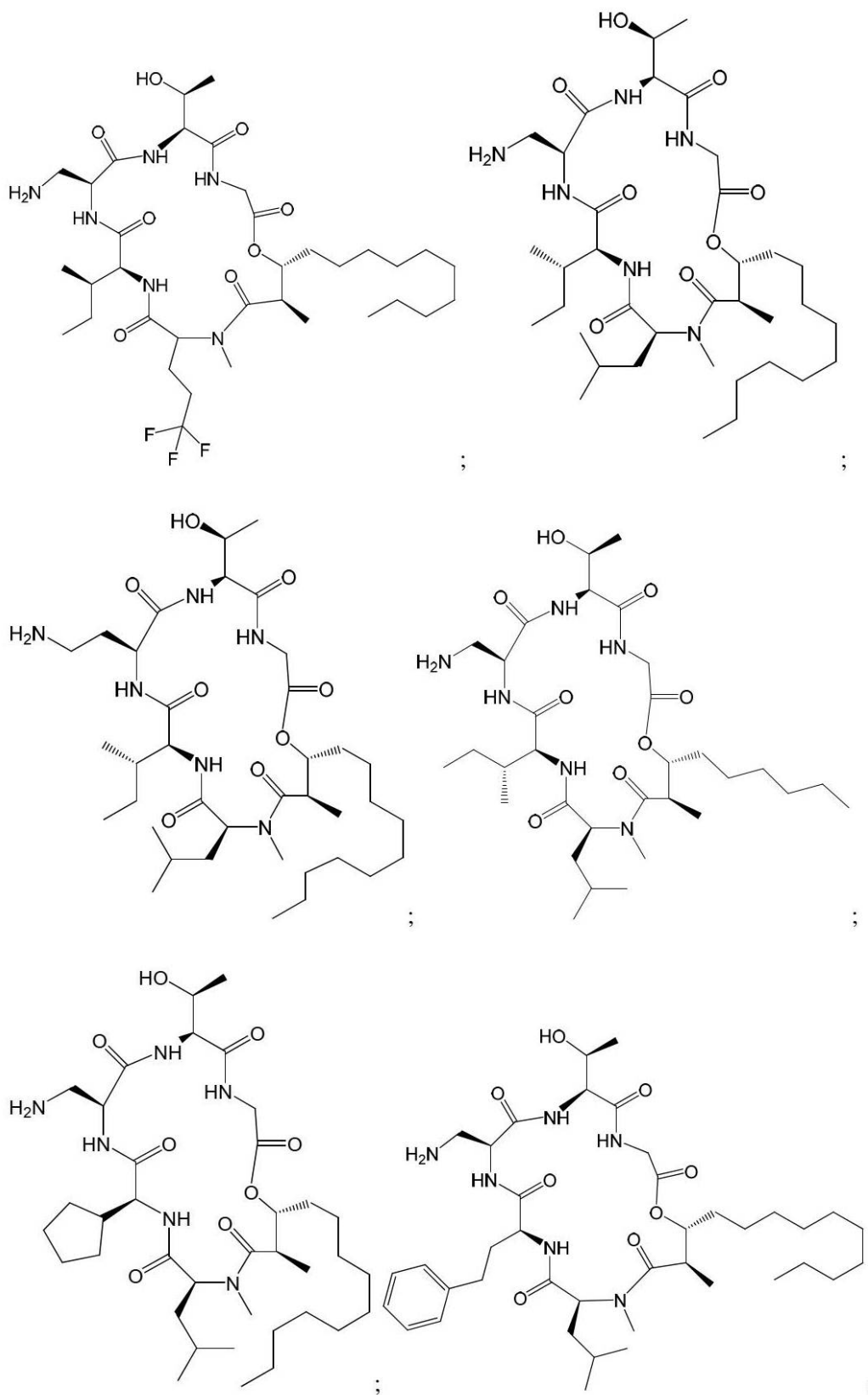
【化 1 3 - 1】



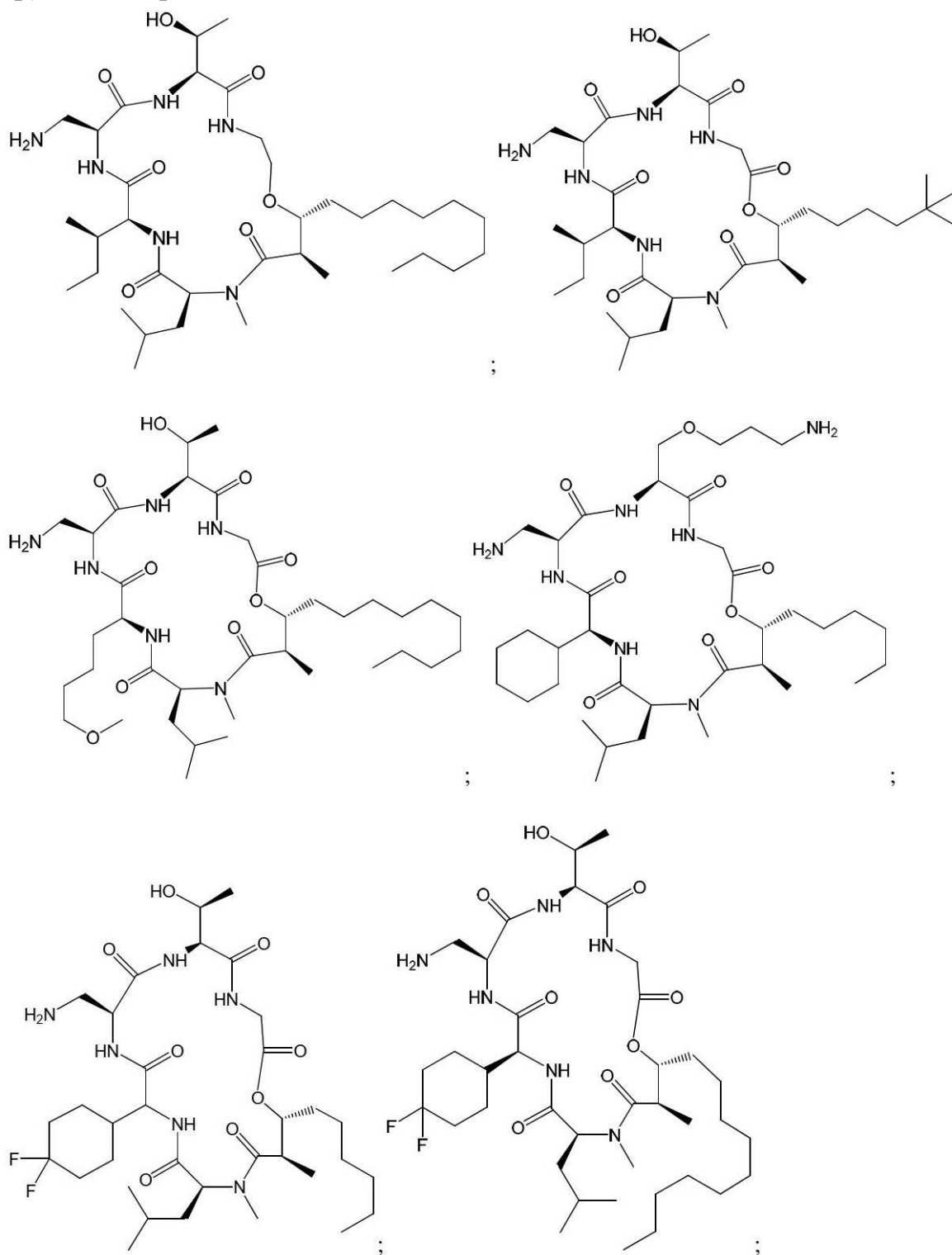
【化 1 3 - 2】



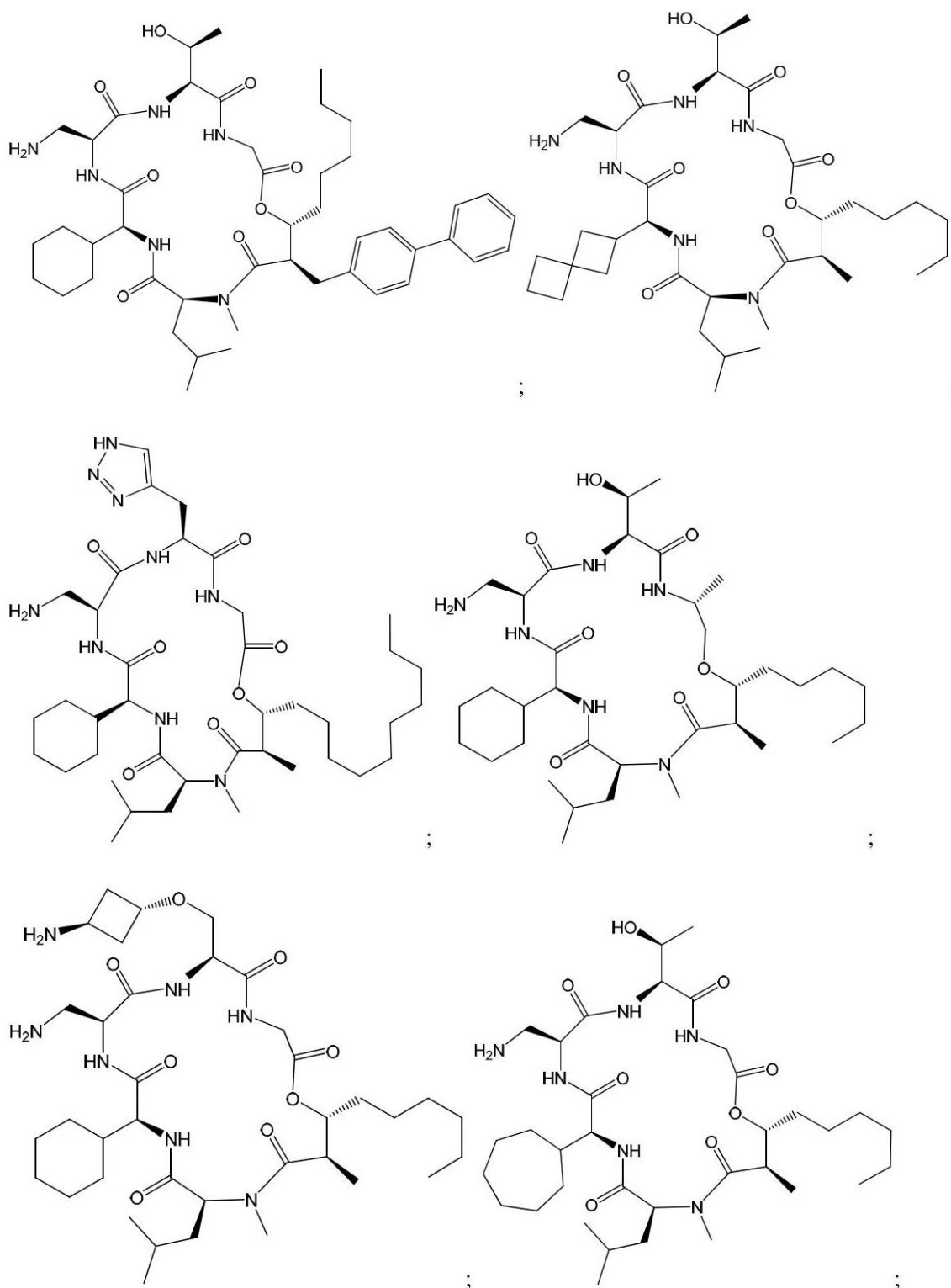
【化 1 3 - 3】



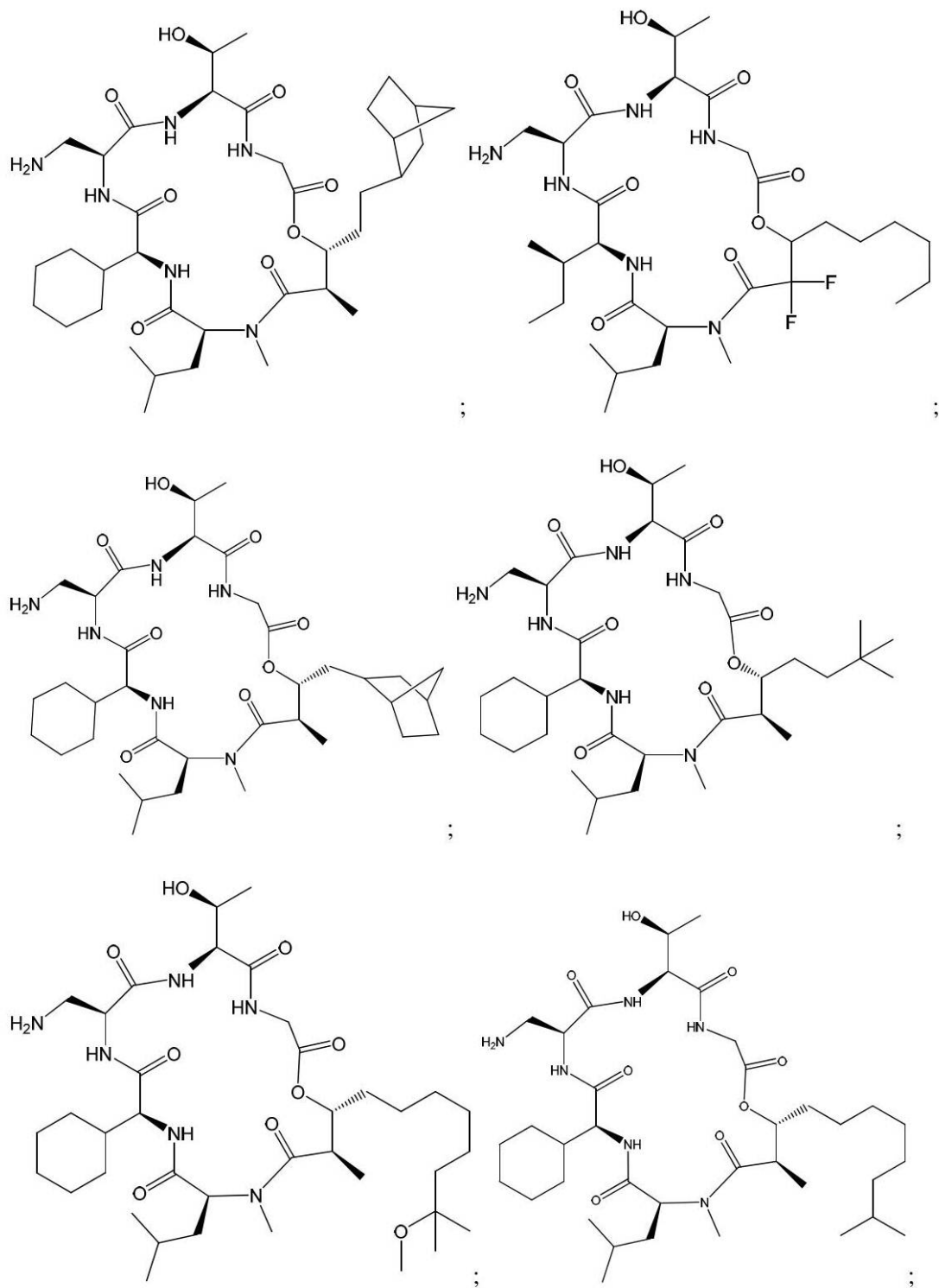
【化 1 3 - 4】



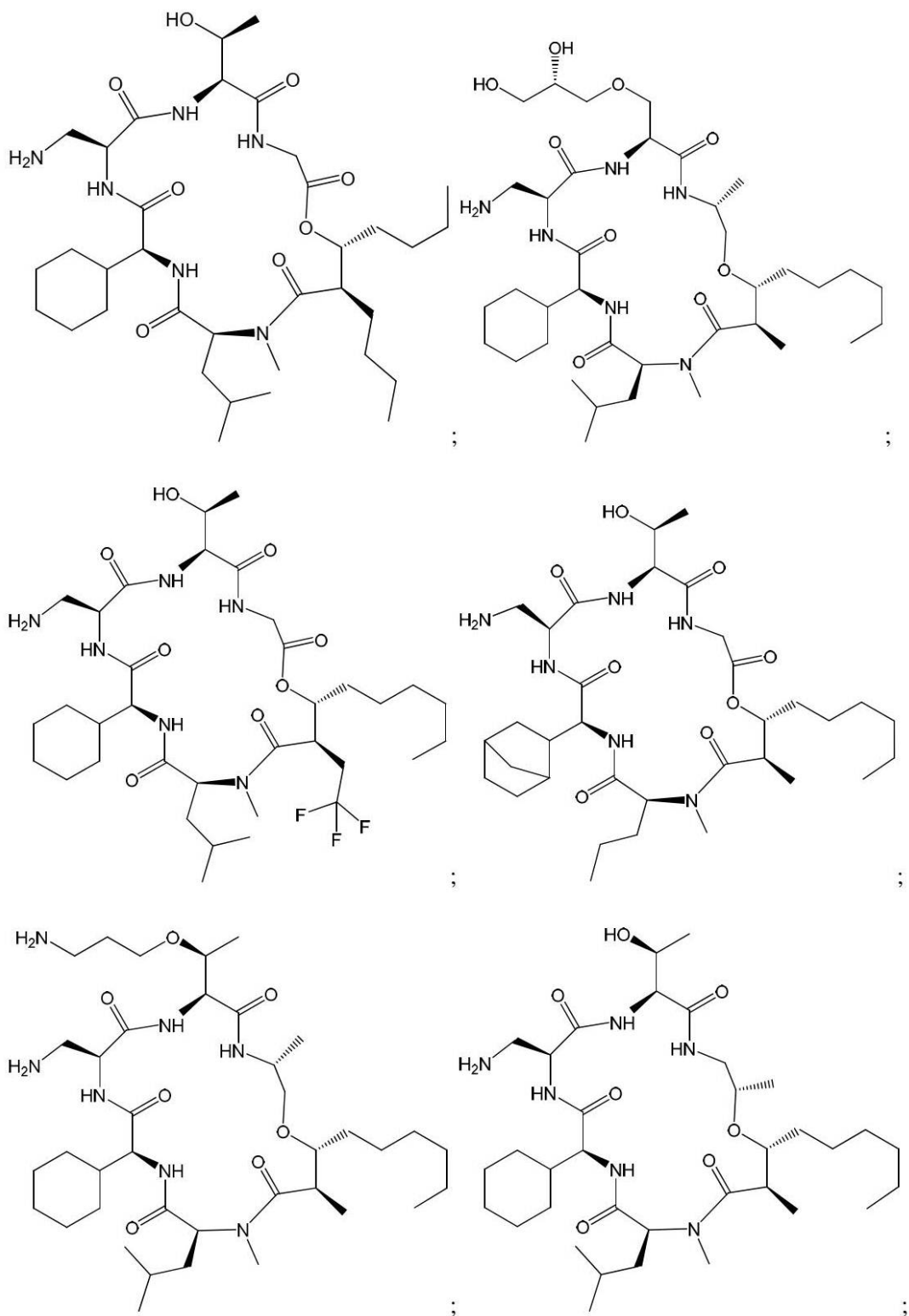
【化 1 3 - 5】



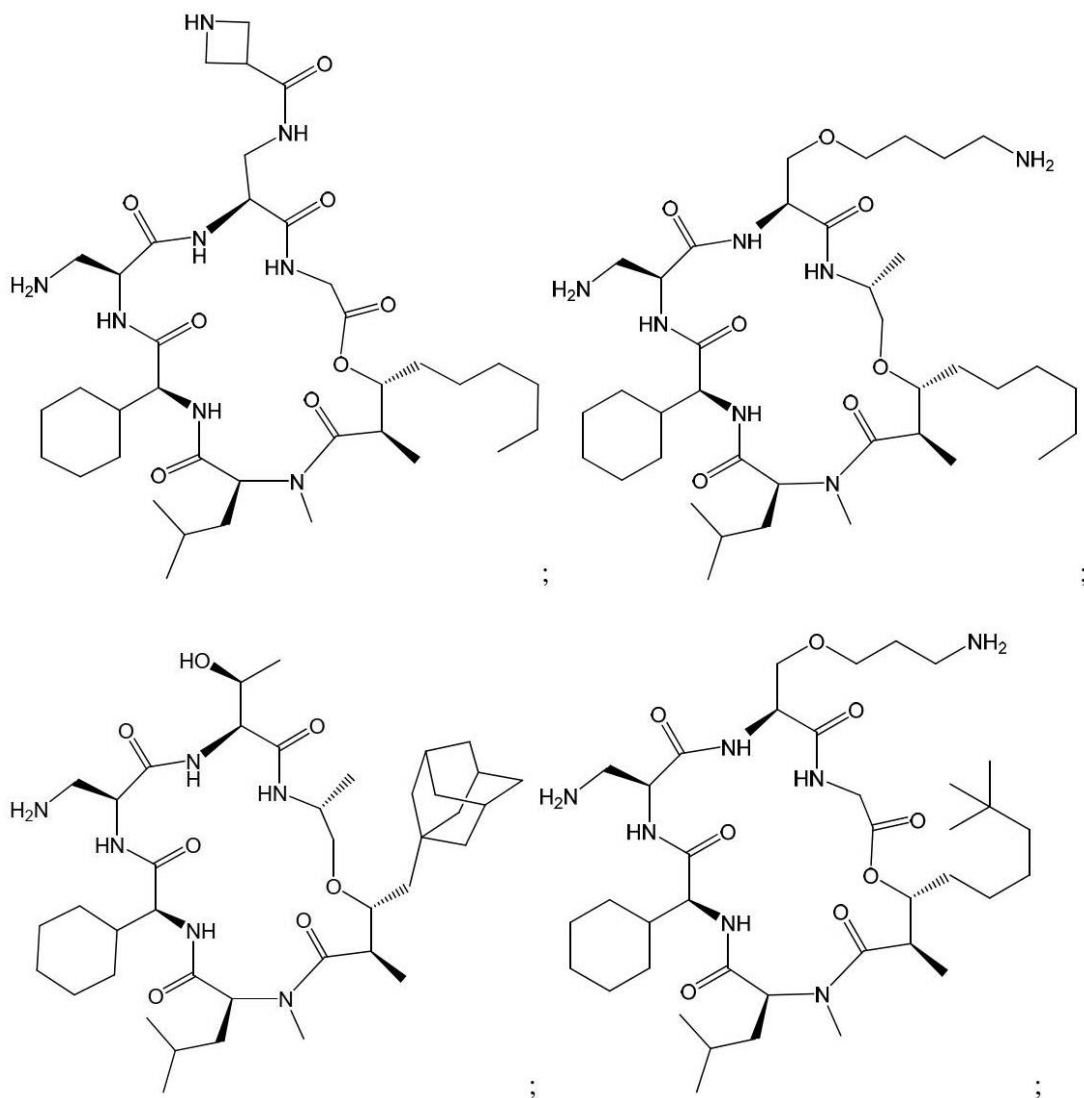
【化 1 3 - 6】



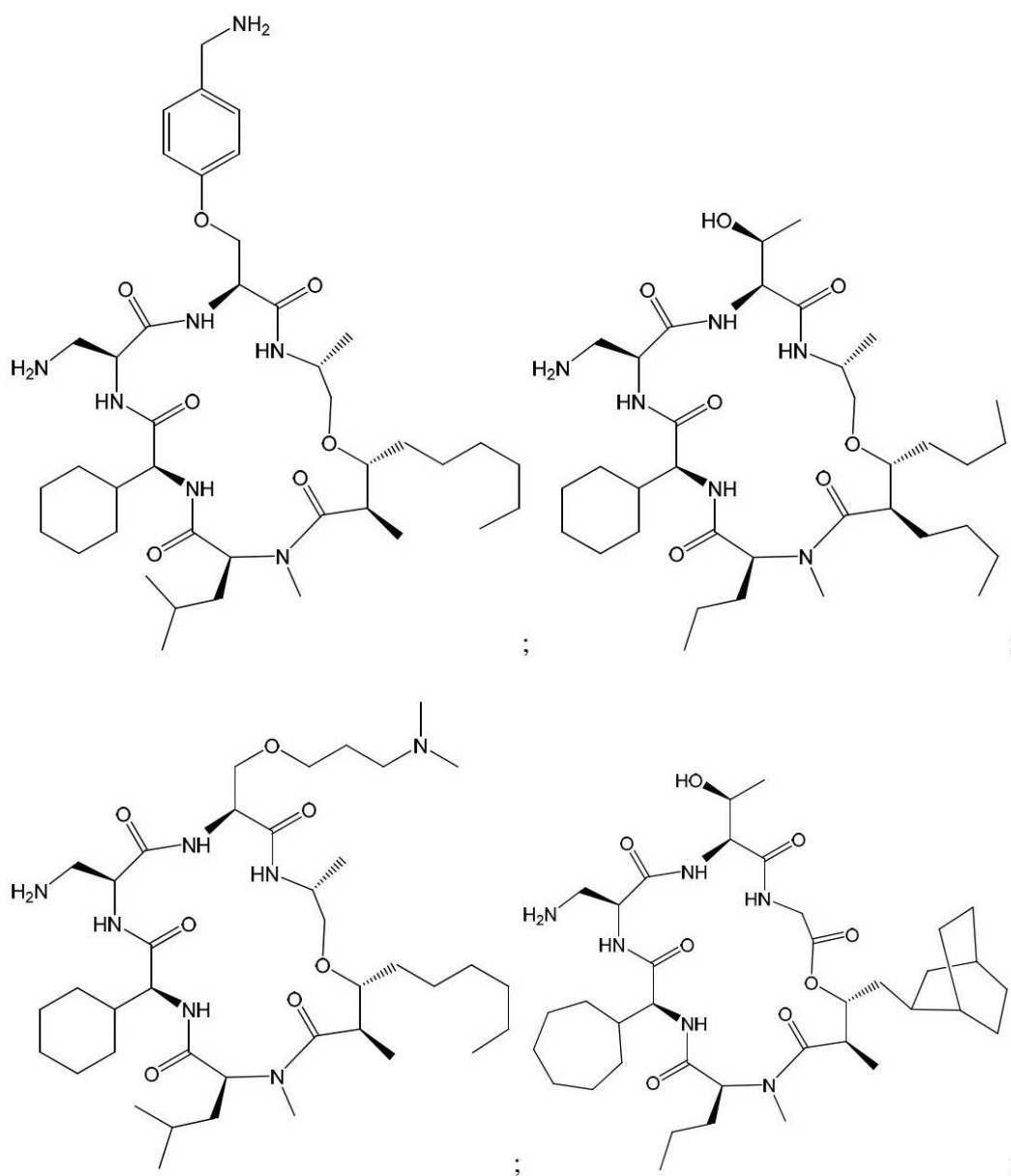
【化 1 3 - 7】



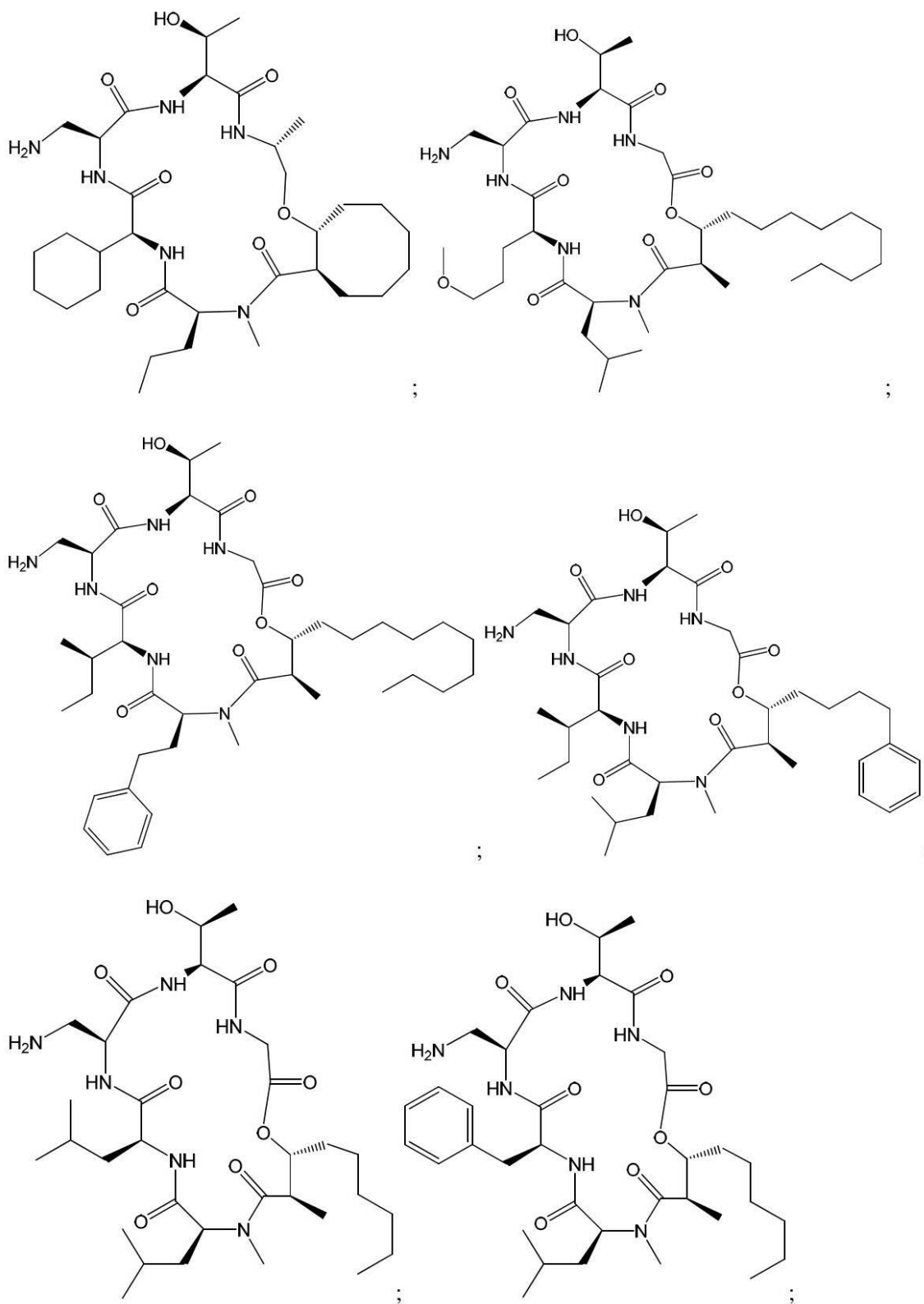
【化 1 3 - 8】



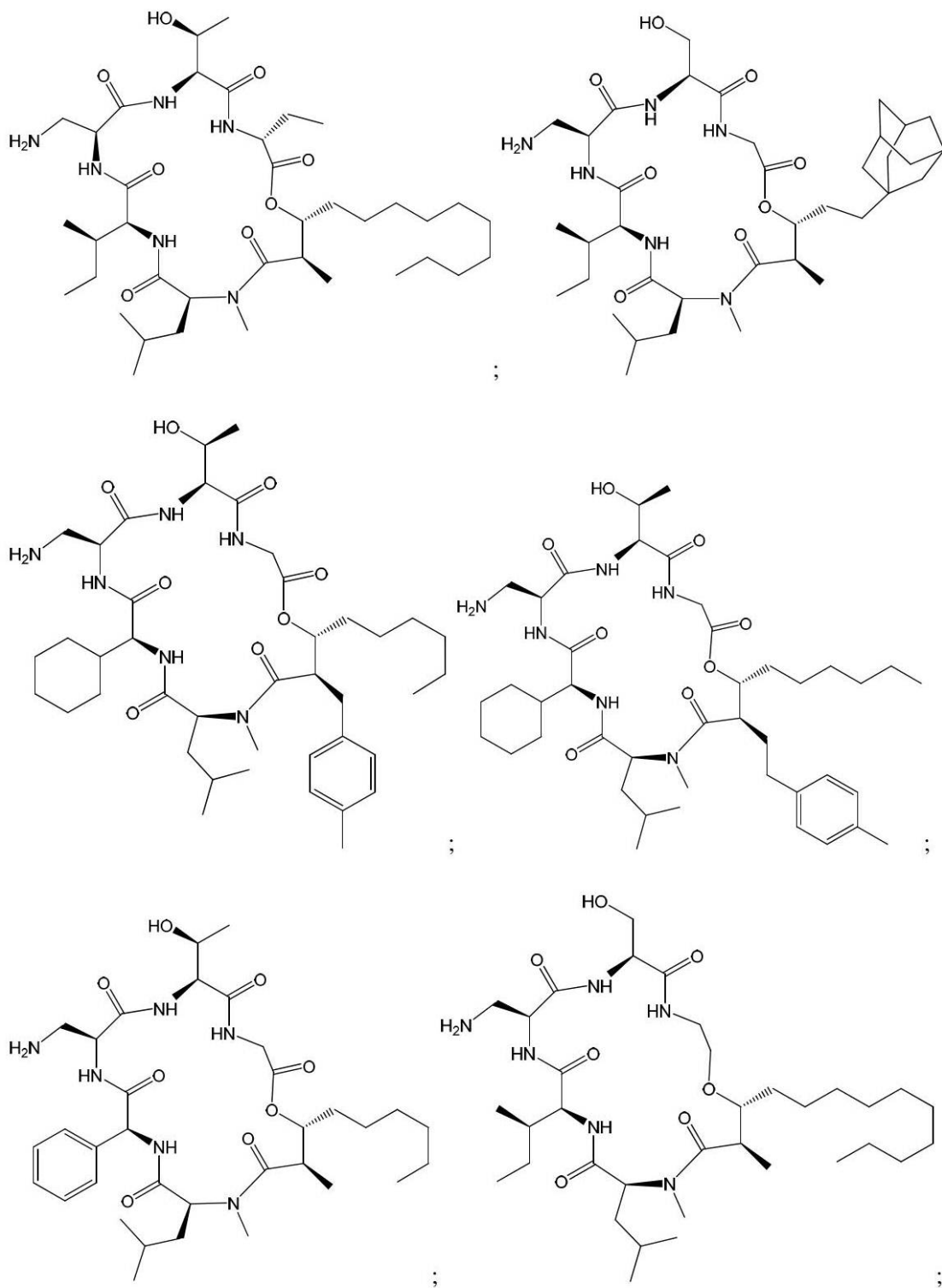
【化 1 3 - 9】



【化 1 3 - 1 1】

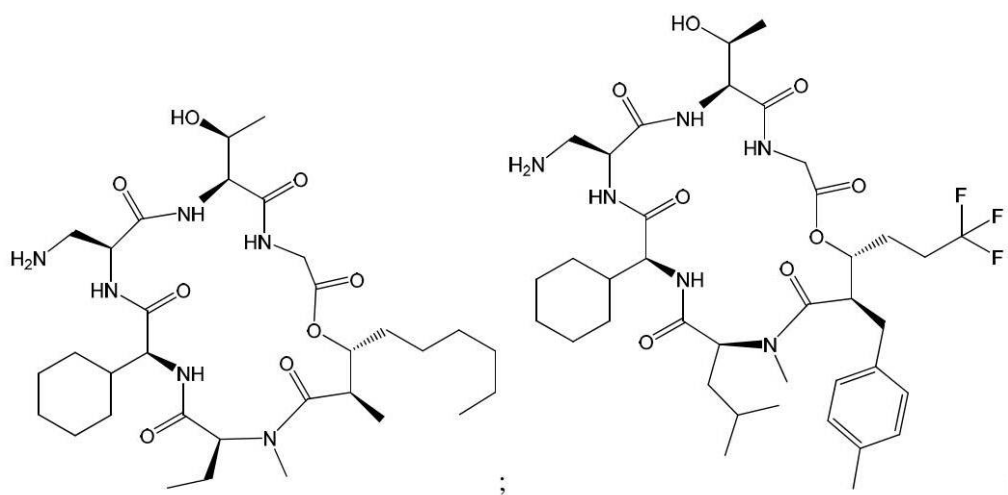
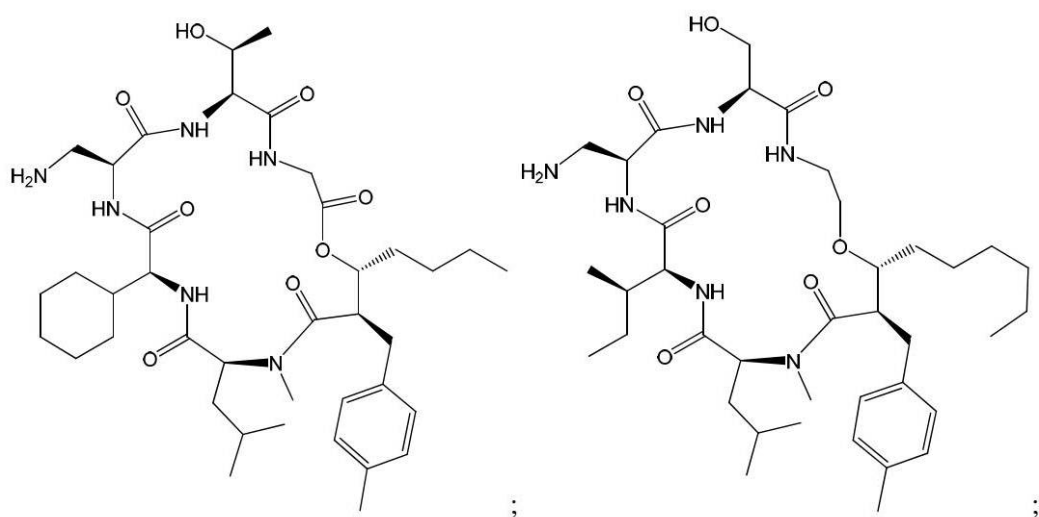
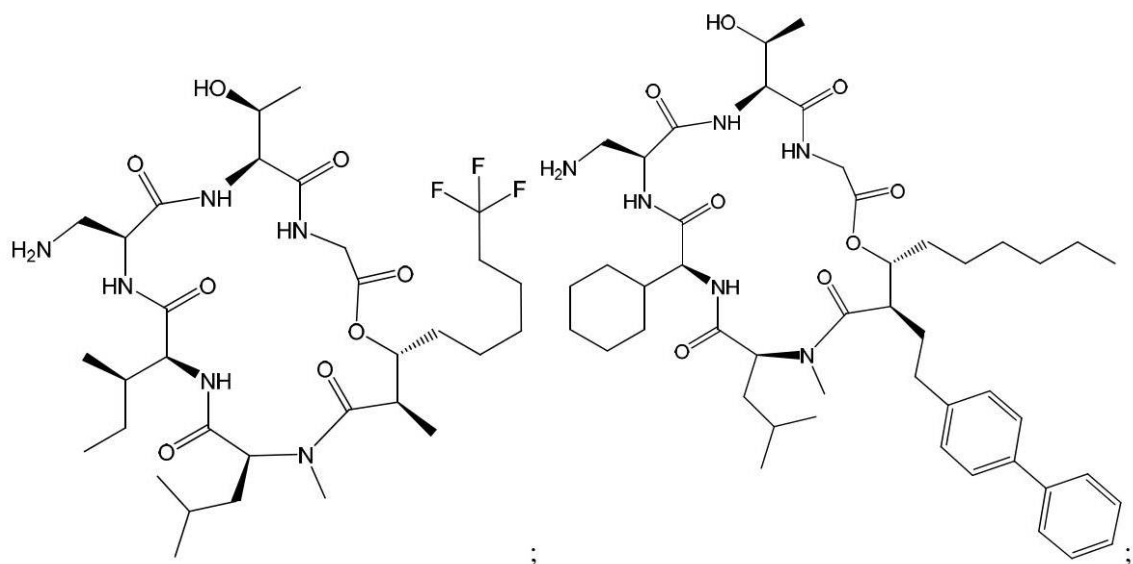


【化 1 3 - 1 2】

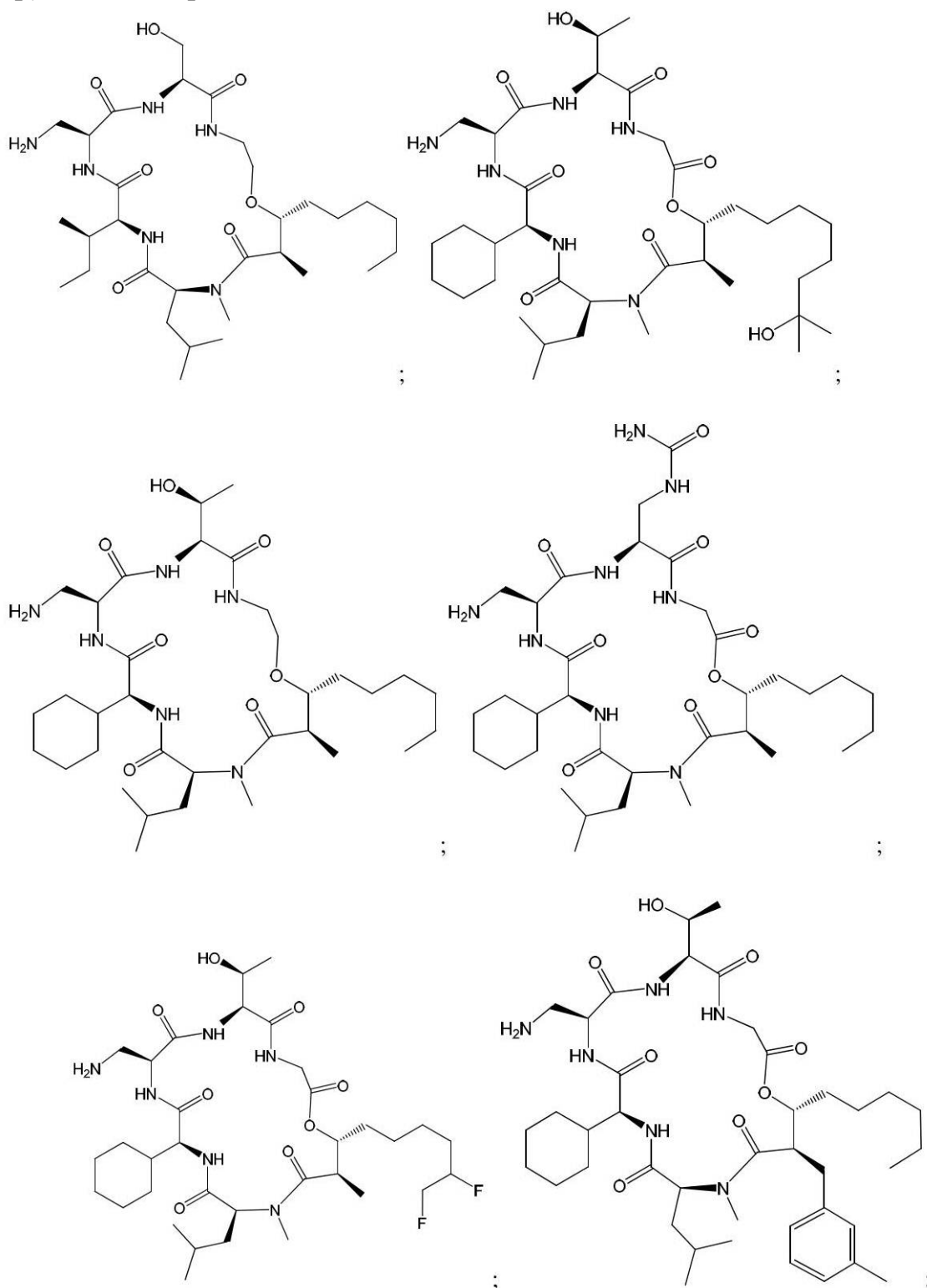


Chemical structures of 12 macrocyclic peptides, numbered 1 to 12, arranged in a 4x3 grid. Each structure is a cyclic peptide with a 12-residue backbone. The side chains vary significantly between the peptides, including cyclohexyl, isobutyl, isopentyl, 4-phenoxymethyl, and various branched alkyl groups. Some structures also feature a hydroxyl group on the side chain. The peptides are labeled 1 through 12, with semicolons separating the columns.

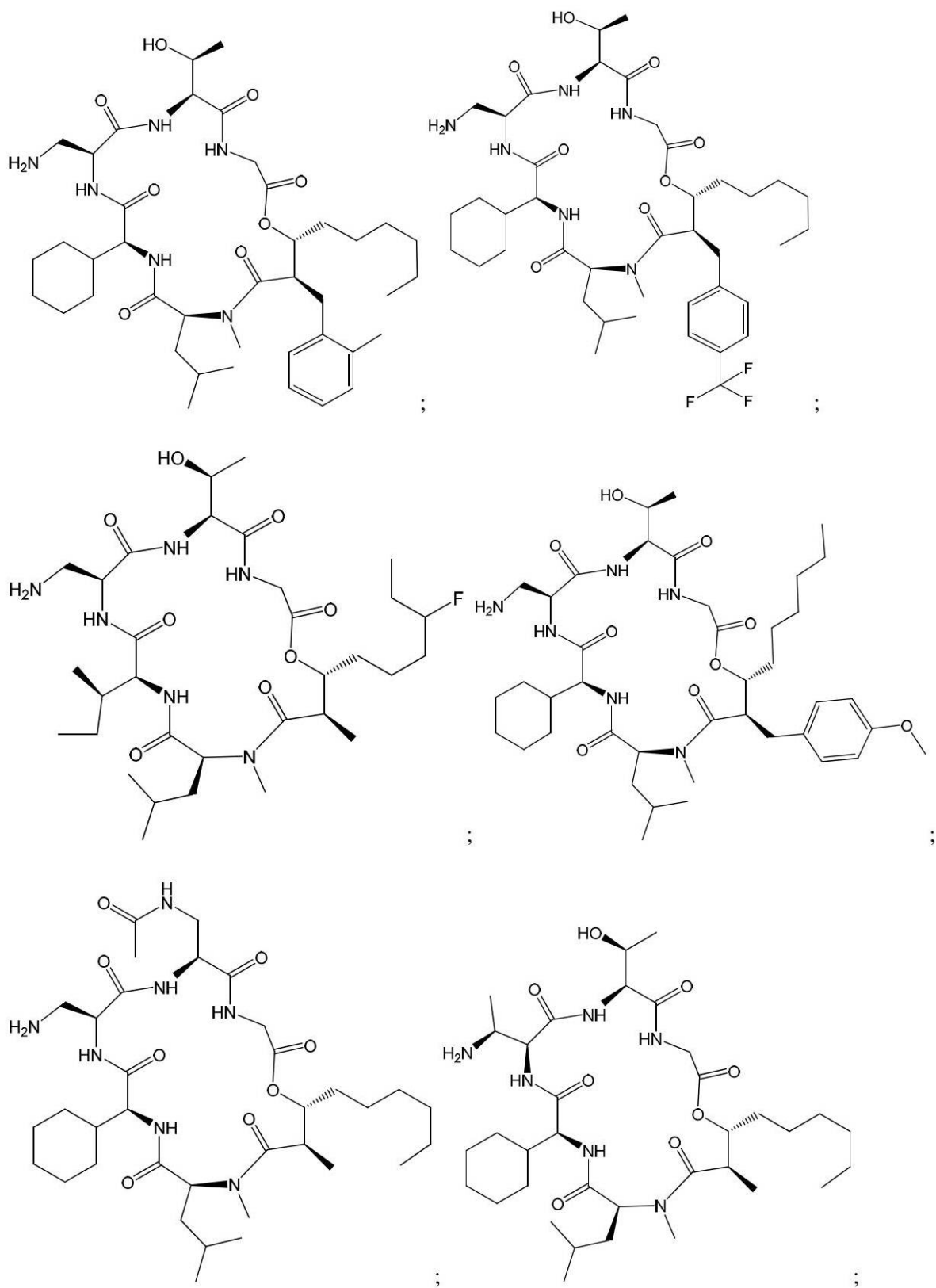
【化 1 3 - 1 4】



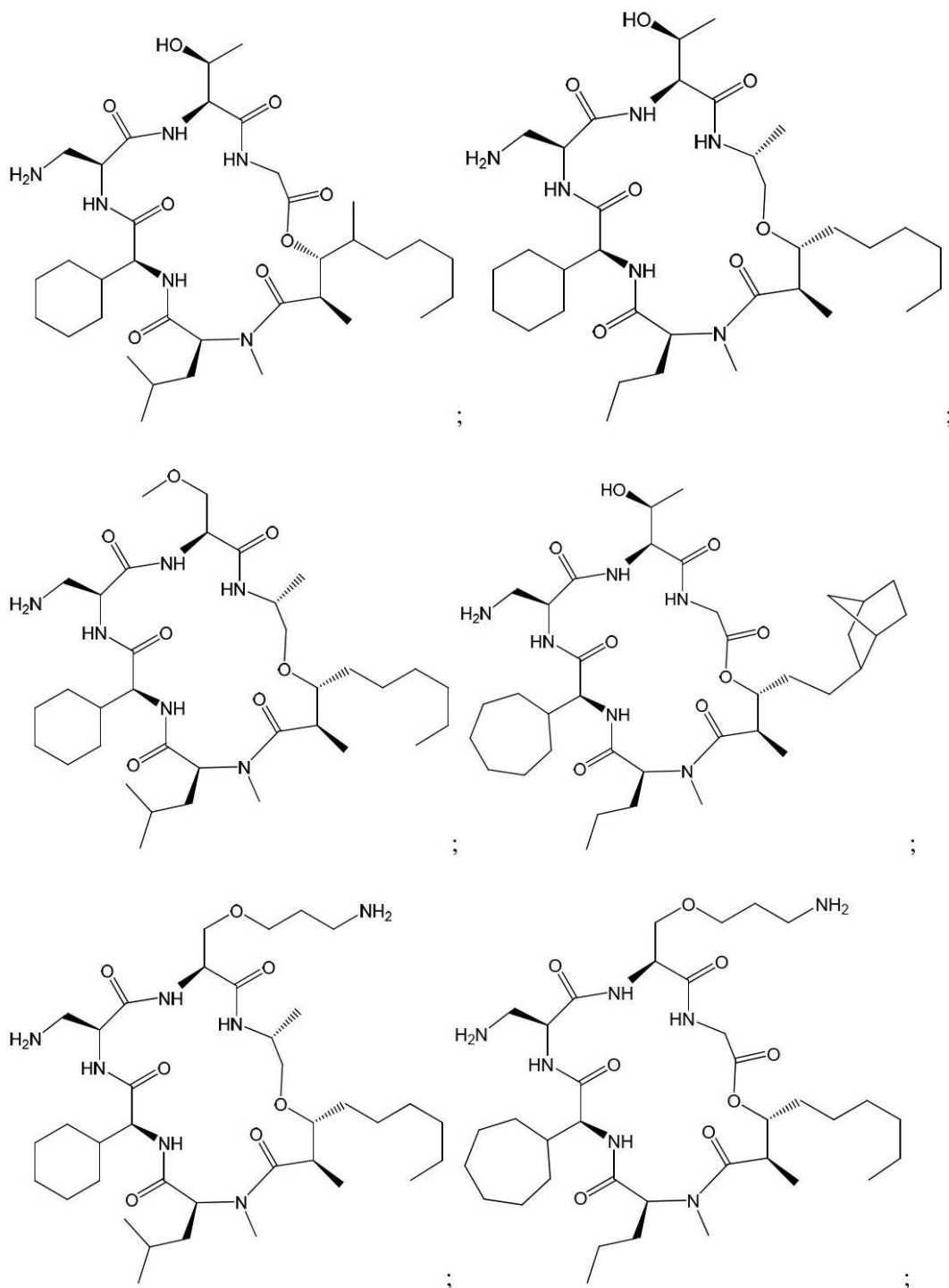
【化 1 3 - 1 5】



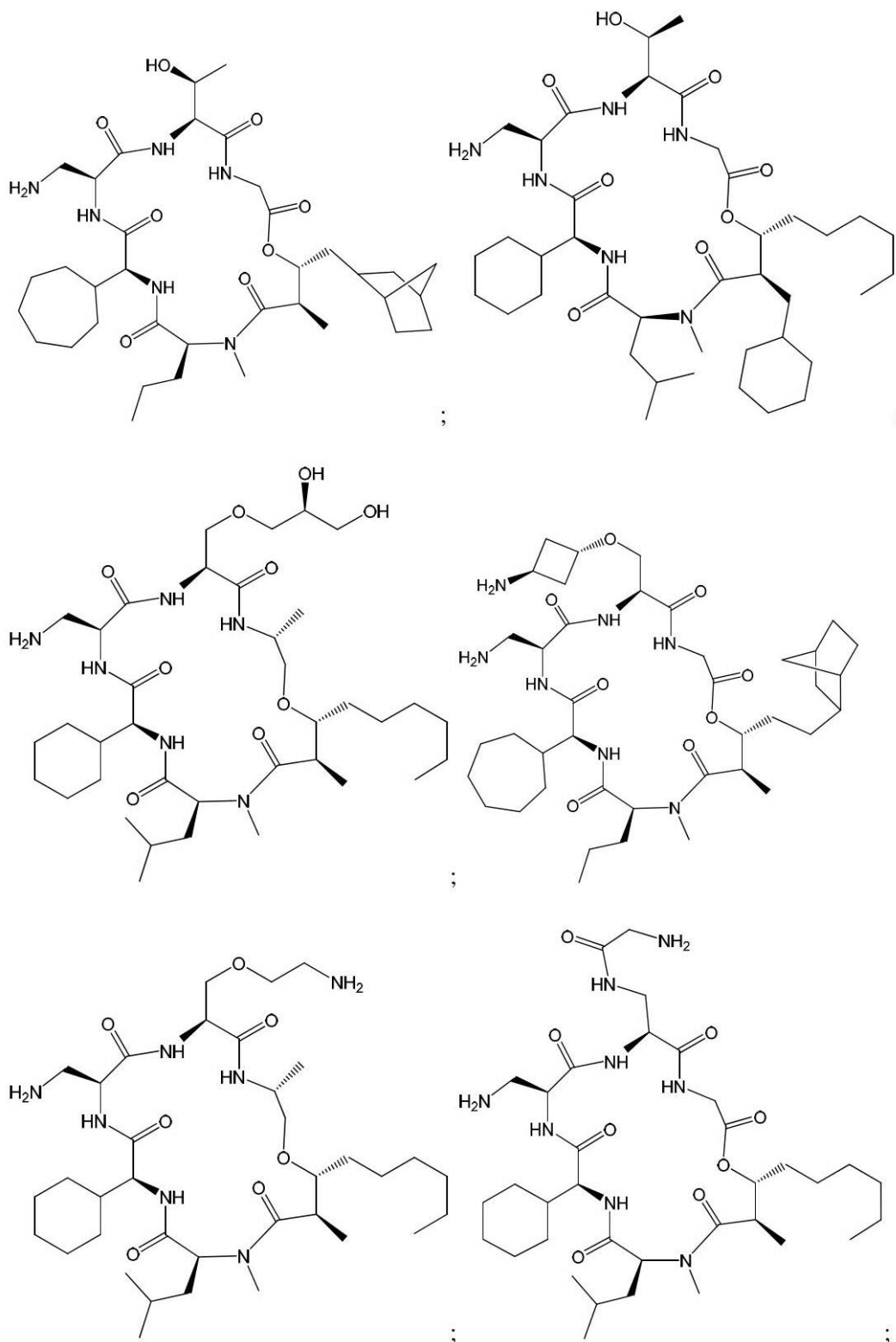
【化 1 3 - 1 6】



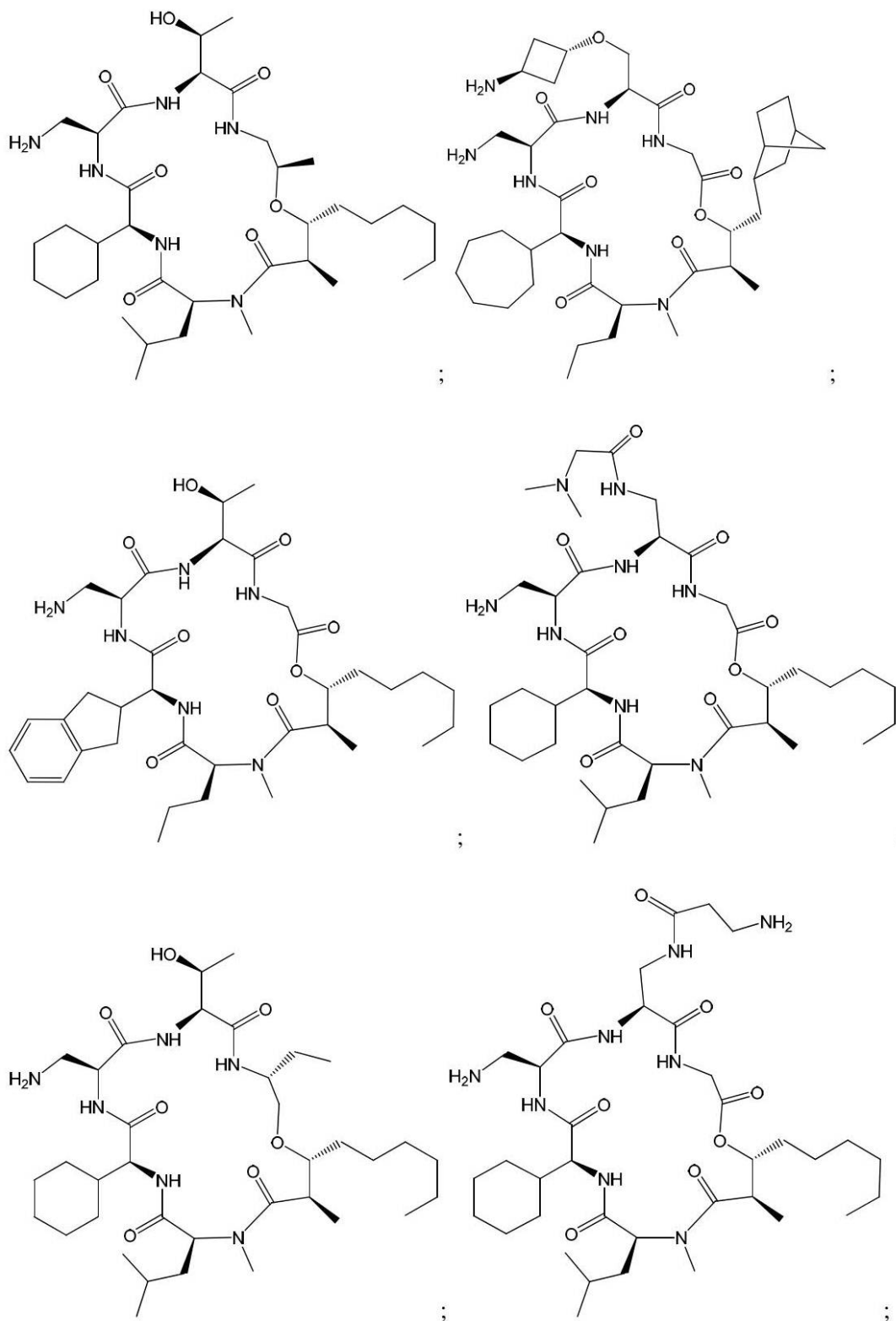
【化 1 3 - 1 7】



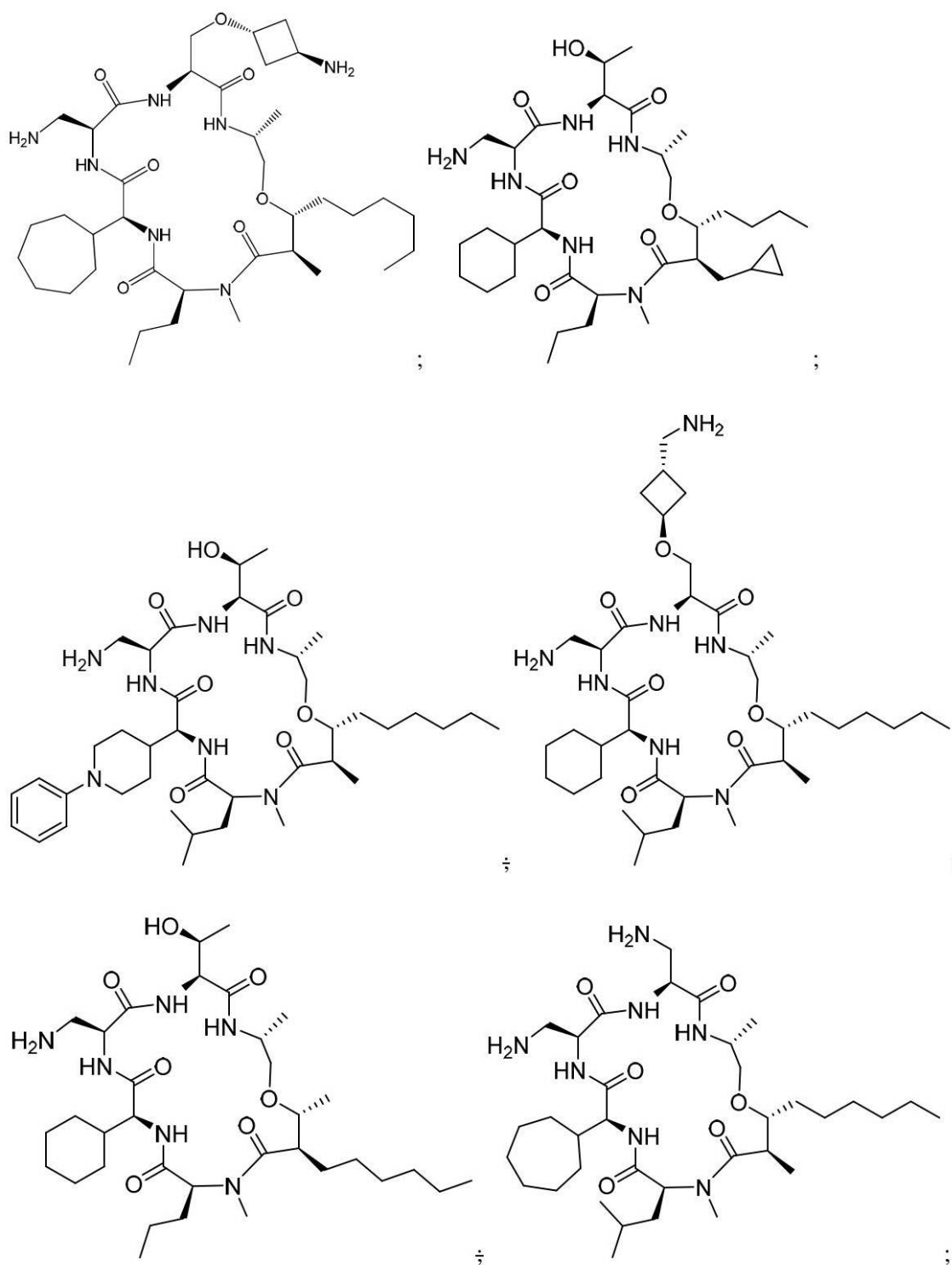
【化 1 3 - 1 8】



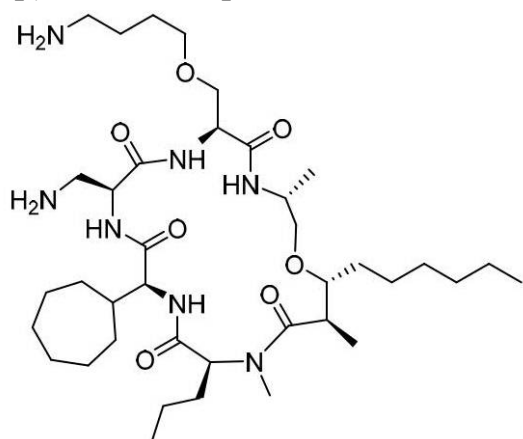
【化 1 3 - 1 9】



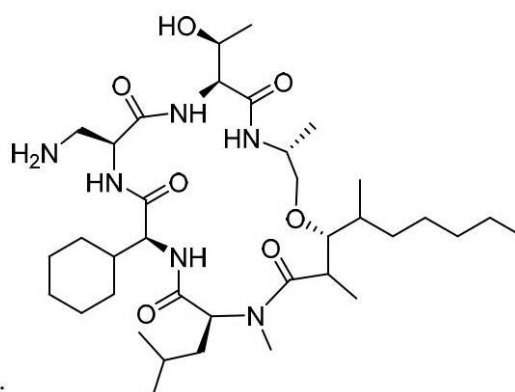
【化 13 - 20】



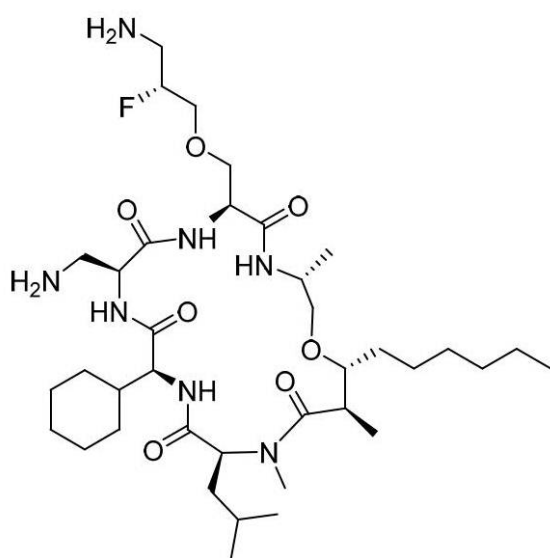
【化 1 3 - 2 1】



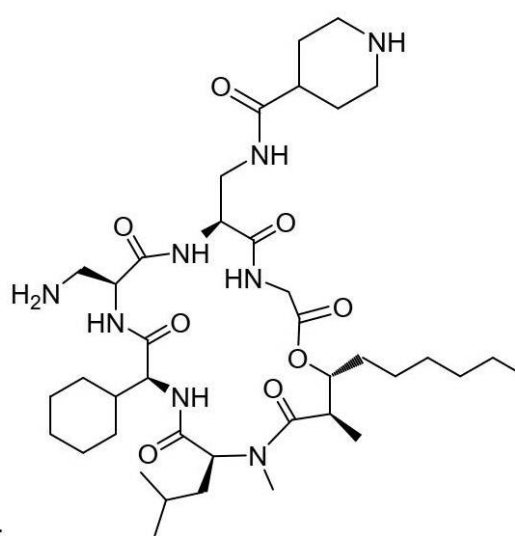
;



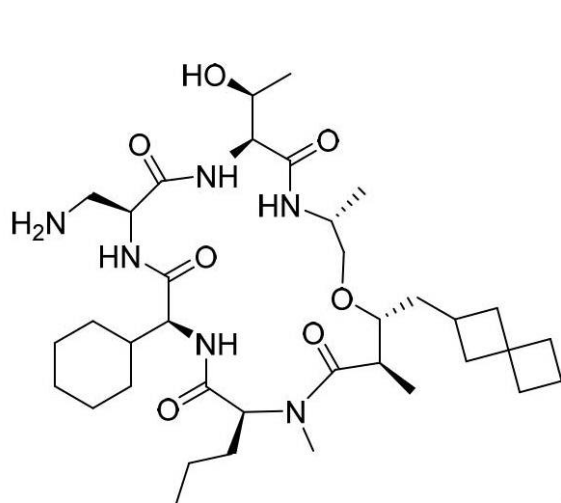
;



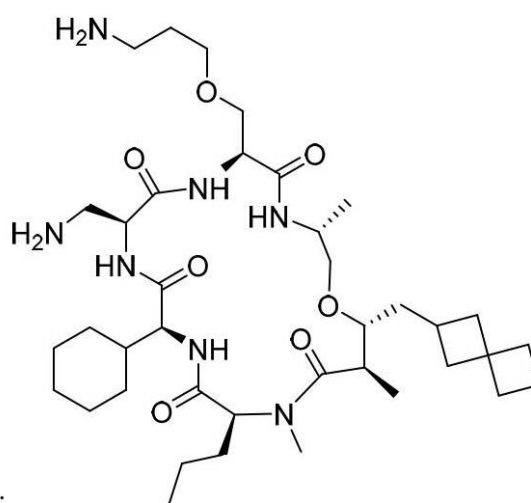
;



;

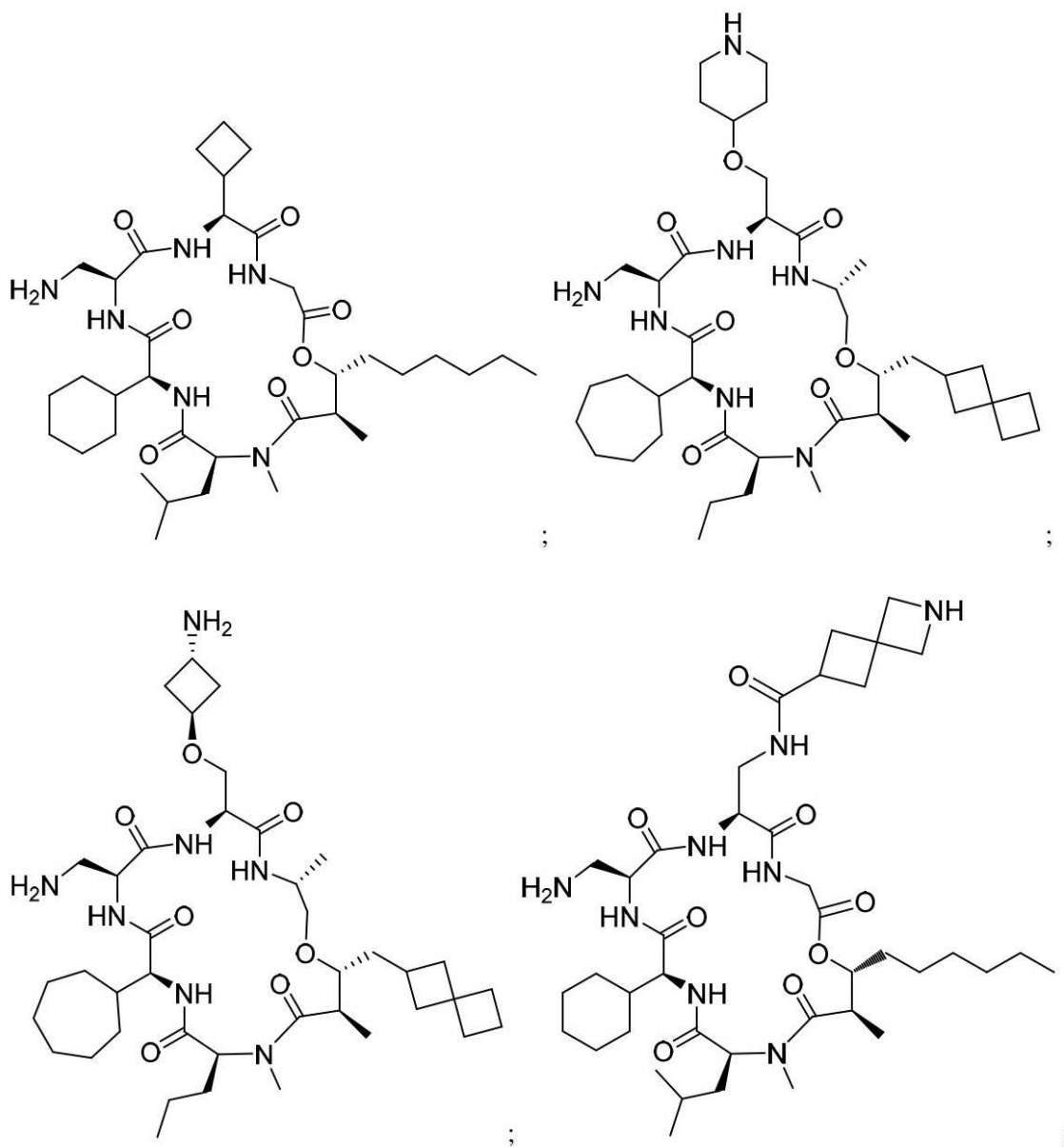


;

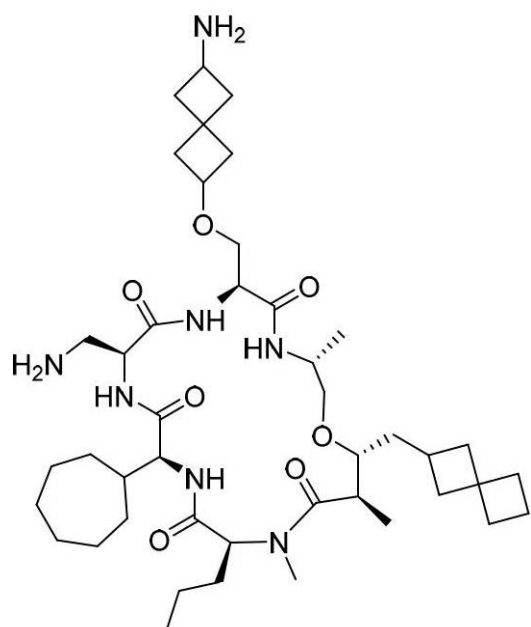


;

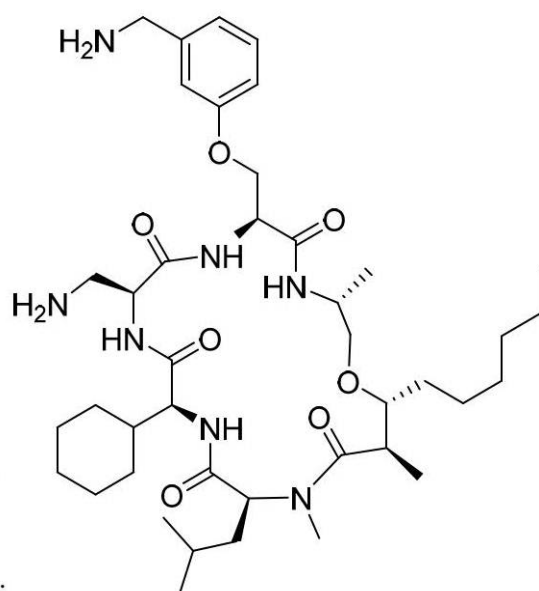
【化 1 3 - 2 3】



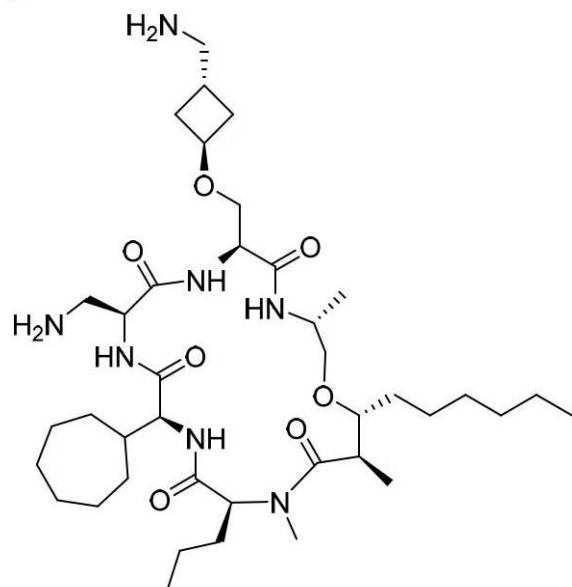
【化 1 3 - 2 4】



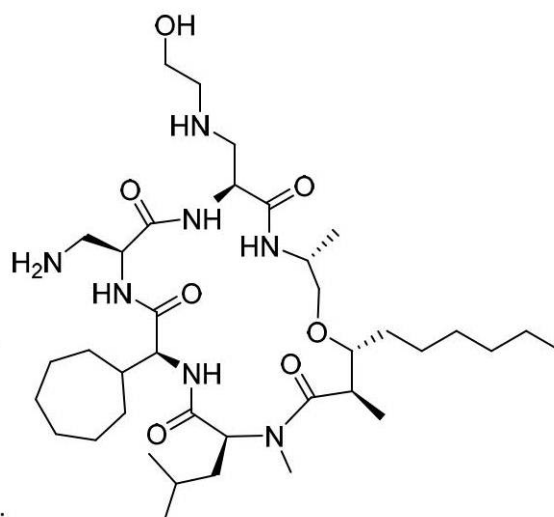
;



;

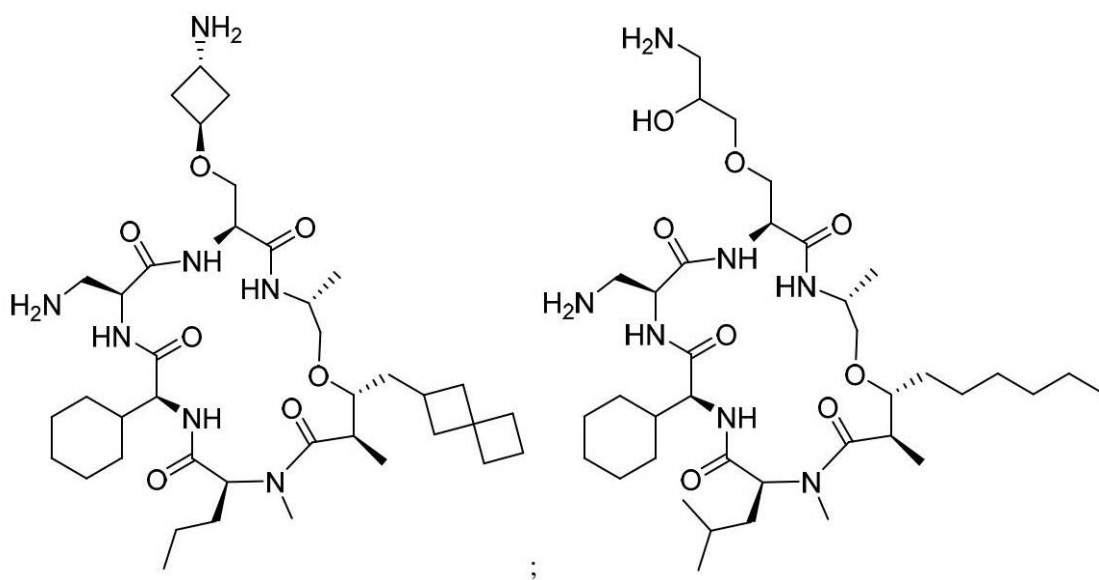
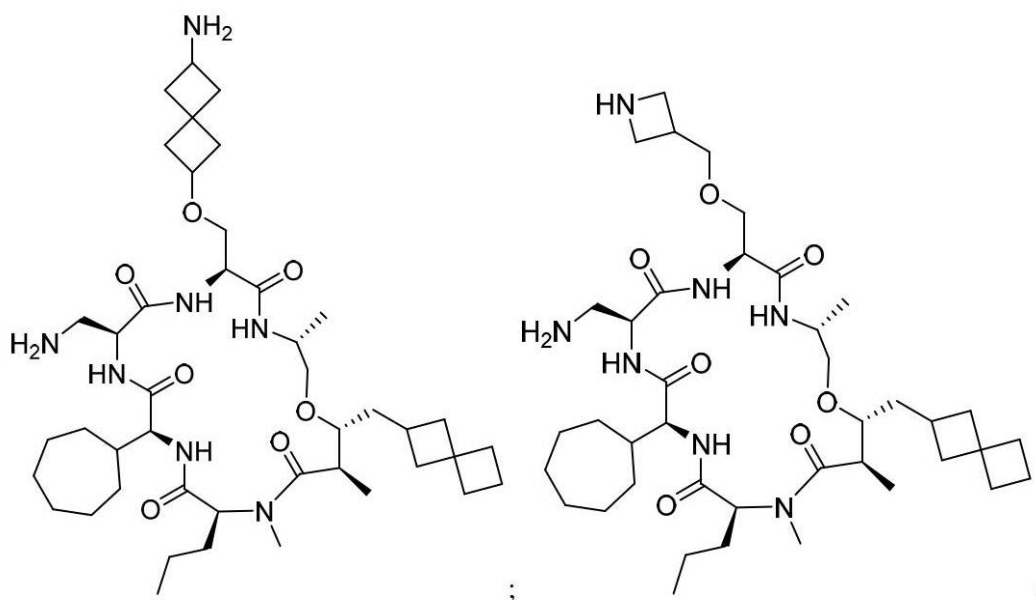


;



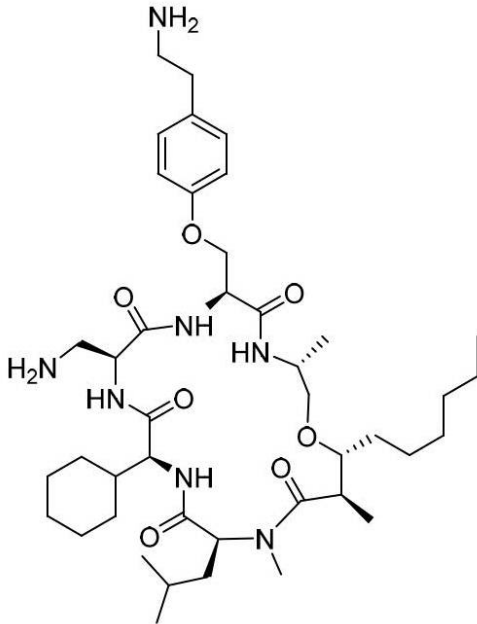
;

【化 1 3 - 2 5】



;および

【化 1 3 - 2 6】



より選択される化合物、又はその医薬的に許容される塩、溶媒和物、又は立体異性体である、請求項 1 の化合物。

【請求項 2 9】

患者における細菌感染症の治療用医薬品の製造への、請求項 1 ～請求項 2 8 のいずれか 1 項の化合物、又はその医薬的に許容される塩、溶媒和物、又は立体異性体の使用。

【請求項 3 0】

人を除く哺乳動物における細菌感染症の治療の方法であって、請求項 1 ～請求項 2 8 のいずれか 1 項の化合物、又はその医薬的に許容される塩、溶媒和物、又は立体異性体の有効量を該哺乳動物にとって有益な効果をもたらすのに十分な頻度と期間で該哺乳動物へ投与することを含んでなる、前記方法。

【請求項 3 1】

細菌感染症の治療用医薬組成物であって、請求項 1 ～請求項 2 8 のいずれか 1 項の化合物、又はその医薬的に許容される塩、溶媒和物、又は立体異性体を含む、前記組成物。