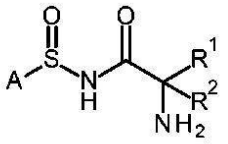
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和2年11月5日(2020.11.5)

【公表番号】特表2019-536750(P2019-536750A)
【公表日】令和1年12月19日(2019.12.19)
【年通号数】公開・登録公報2019-051
【出願番号】特願2019-518499(P2019-518499)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｃ 313/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 31/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/16 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 15/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 13/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 13/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/08 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/02 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/145 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 333/34 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/381 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 215/36 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/47 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4402 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 213/64 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/341 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 307/64 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 231/12 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/415 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｃ 313/06 ＣＳＰ
Ａ６１Ｐ 43/00 １１１
Ａ６１Ｐ 31/04
Ａ６１Ｐ 25/00
Ａ６１Ｐ 27/16
Ａ６１Ｐ 9/00
Ａ６１Ｐ 27/02
Ａ６１Ｐ 1/02
Ａ６１Ｐ 11/04
Ａ６１Ｐ 15/00
Ａ６１Ｐ 13/02
Ａ６１Ｐ 13/00
Ａ６１Ｐ 1/04

Ａ６１Ｐ　19/02
Ａ６１Ｐ　19/08
Ａ６１Ｐ　17/02
Ａ６１Ｋ　31/145
Ｃ０７Ｄ　333/34
Ａ６１Ｋ　31/381
Ｃ０７Ｄ　215/36
Ａ６１Ｋ　31/47
Ａ６１Ｋ　31/4402
Ｃ０７Ｄ　213/64
Ａ６１Ｋ　31/341
Ｃ０７Ｄ　307/64
Ｃ０７Ｄ　231/12　　Ｃ
Ａ６１Ｋ　31/415

【手続補正書】
【提出日】令和2年9月15日(2020.9.15)
【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】
以下の式の化合物、並びにその薬学的に許容される塩、水和物、及び溶媒和物から選択される化合物:
【化１】



(式中、
-Aは、独立して-A^C若しくは-A^Hであり;
-A^Cは、独立してフェニル若しくはナフチルであり、1つ以上の置換基-R^Xにより置換されていてもよく;
-A^Hは、独立して$C_{5\sim12}$ヘテロアリールであり、1つ以上の置換基-R^Xにより置換されていてもよく;
-R^Xの各々は、独立して:
-R^{XX}、-R^{XXU}、-R^{XXV}、-R^{XXH}、
-F、-Cl、-Br、-I、
-OH、-OR^{XX}、
-L^{XX}-OH、-L^{XX}-OR^{XX}、
-CF_3、-OCF_3、
-NH_2、-NHR^{XX}、-$NR^{XX}{}_2$、-R^{XM}、
-L^{XX}-NH_2、-L^{XX}-NHR^{XX}、-L^{XX}-$NR^{XX}{}_2$、-L^{XX}-R^{XM}、
-C(=O)OH、-C(=O)OR^{XX}、-OC(=O)R^{XX}、
-C(=O)NH_2、-C(=O)NHR^{XX}、-C(=O)$NR^{XX}{}_2$、-C(=O)R^{XM}、
-NHC(=O)R^{XX}、-NR^{XN}C(=O)R^{XX}、
-NHC(=O)NH_2、-NHC(=O)NHR^{XX}、-NHC(=O)$NR^{XX}{}_2$、-NHC(=O)R^{XM}、

$-NR^{XN}C(=O)NH_2$、$-NR^{XN}C(=O)NHR^{XX}$、$-NR^{XN}C(=O)NR^{XX}{}_2$、$-NR^{XN}C(=O)R^{XM}$、
$-NHC(=O)OR^{XX}$、$-NR^{XN}C(=O)OR^{XX}$、
$-OC(=O)NH_2$、$-OC(=O)NHR^{XX}$、$-OC(=O)NR^{XX}{}_2$、$-OC(=O)R^{XM}$、
$-NHC(=NH)NH_2$、
$-C(=O)R^{XX}$、
$-S(=O)NH_2$、$-S(=O)NHR^{XX}$、$-S(=O)NR^{XX}{}_2$、$-S(=O)R^{XM}$、
$-S(=O)_2NH_2$、$-S(=O)_2NHR^{XX}$、$-S(=O)_2NR^{XX}{}_2$、$-S(=O)_2R^{XM}$、
$-NHS(=O)R^{XX}$、$-NR^{XN}S(=O)R^{XX}$、
$-NHS(=O)_2R^{XX}$、$-NR^{XN}S(=O)_2R^{XX}$、
$-S(=O)R^{XX}$、$-S(=O)_2R^{XX}$、
$-SH$、$-SR^{XX}$、$-CN$、及び$-NO_2$
から選択され、

さらに、存在する場合、2つの隣接する基$-R^X$は、一緒になって、以下を形成してもよく:

$-O-CH_2-O-$若しくは$-O-CH_2CH_2-O-$;

$-L^{XX}-$の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキレンであり;

$-R^{XX}$の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;

$-R^{XXU}$の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の$C_{2\sim4}$アルケニルであり;

$-R^{XXV}$の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の$C_{2\sim4}$アルキニルであり;

$-R^{XXH}$の各々は、$C_{5\sim10}$ヘテロアリールであり、1つ以上の基$-R^{XMM}$により置換されていてもよく;

$-R^{XN}$の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキルであり;

$-R^{XM}$の各々は、独立してアゼチジノ、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、アゼパノ、若しくはジアゼパノであって、
1つ以上の以下から選択される基により置換されていてもよく:
$-R^{XMM}$、$-C(=O)R^{XMM}$、$-C(=O)OR^{XMM}$、及び$-S(=O)_2R^{XMM}$;

$-R^{XMM}$の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;

$-R^1$は、独立して-H若しくは$-R^{11}$であり;

$-R^{11}$は、独立して$-R^{11A}$若しくは$-R^{11B}$であり;

$-R^{11A}$は、独立して:
$-R^{A1}$、$-R^{A2}$、$-R^{A3}$、$-R^{A4}$、$-R^{A5}$、$-L^A-R^{A2}$、$-L^A-R^{A3}$、$-L^A-R^{A4}$、若しくは$-L^A-R^{A5}$であり;

$-R^{A1}$の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim6}$アルキルであり、1つ以上の基$-R^{AA2}$により置換されていてもよく;

$-R^{A2}$の各々は、飽和$C_{3\sim6}$シクロアルキルであり、1つ以上の基$-R^{AA1}$及び1つ以上の基$-R^{AA2}$により置換されていてもよく;

$-R^{A3}$の各々は、非芳香族$C_{3\sim7}$ヘテロシクリルであり、1つ以上の基$-R^{AA1}$及び1つ以上の基$-R^{AA2}$により置換されていてもよく;

$-R^{A4}$の各々は、独立してフェニル若しくはナフチルであり、1つ以上の基$-R^{AA1}$及び1つ以上の基$-R^{AA2}$により置換されていてもよく;

$-R^{A5}$の各々は、$C_{5\sim10}$ヘテロアリールであり、1つ以上の基$-R^{AA1}$及び1つ以上の基$-R^{AA2}$により置換されていてもよく;

$-L^A-$の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキレンであり;

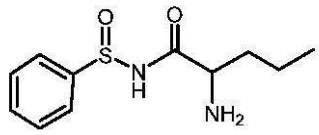
$-R^{AA1}$の各々は、独立して:
$-R^{AA}$、
$-L^{AA}-OH$、$-L^{AA}-OR^{AA}$、
$-L^{AA}-NH_2$、$-L^{AA}-NHR^{AA}$、$-L^{AA}-NR^{AA}{}_2$、及び$-L^{AA}-R^{AM}$
から選択され、

-R^{AA2}の各々は、独立して:
-F、-Cl、-Br、-I、
-OH、-OR^{AA}、
-OCF_3、
-NH_2、-NHR^{AA}、-$NR^{AA}{}_2$、-R^{AM}、
-C(=O)OH、-C(=O)OR^{AA}、-OC(=O)R^{AA}、
-C(=O)NH_2、-C(=O)NHR^{AA}、-C(=O)$NR^{AA}{}_2$、-C(=O)R^{AM}、
-NHC(=O)R^{AA}、-NR^{AN}C(=O)R^{AA}、
-NHC(=O)NH_2、-NHC(=O)NHR^{AA}、-NHC(=O)$NR^{AA}{}_2$、-NHC(=O)R^{AM}、
-NR^{AN}C(=O)NH_2、-NR^{AN}C(=O)NHR^{AA}、-NR^{AN}C(=O)$NR^{AA}{}_2$、-NR^{AN}C(=O)R^{AM}、
-NHC(=O)OR^{AA}、-NR^{AN}C(=O)OR^{AA}、
-OC(=O)NH_2、-OC(=O)NHR^{AA}、-OC(=O)$NR^{AA}{}_2$、-OC(=O)R^{AM}、
-NHC(=NH)NH_2、
-C(=O)R^{AA}、
-S(=O)NH_2、-S(=O)NHR^{AA}、-S(=O)$NR^{AA}{}_2$、-S(=O)R^{AM}、
-$S(=O)_2NH_2$、-$S(=O)_2NHR^{AA}$、-$S(=O)_2NR^{AA}{}_2$、-$S(=O)_2R^{AM}$、
-NHS(=O)R^{AA}、-NR^{AN}S(=O)R^{AA}、
-$NHS(=O)_2R^{AA}$、-$NR^{AN}S(=O)_2R^{AA}$、
-S(=O)R^{AA}、-$S(=O)_2R^{AA}$、
-SH、-SR^{AA}、-CN、及び-NO_2
から選択され、
-L^{AA}-の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキレンであり;
-R^{AA}の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;
-R^{AN}の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキルであり;
-R^{AM}の各々は、独立してアゼチジノ、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、アゼパノ、若しくはジアゼパノであって、
1つ以上の以下から選択される基により置換されていてもよく:
-R^{AMM}、-C(=O)R^{AMM}、-C(=O)OR^{AMM}、及び-$S(=O)_2R^{AMM}$;
-R^{AMM}の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;
-R^{11B}は、独立して:
-F、-Cl、-Br、-I、
-OH、-OR^{BB}、
-OCF_3、
-NH_2、-NHR^{BB}、-$NR^{BB}{}_2$、-R^{BM}、
-C(=O)OH、-C(=O)OR^{BB}、-OC(=O)R^{BB}、
-C(=O)NH_2、-C(=O)NHR^{BB}、-C(=O)$NR^{BB}{}_2$、-C(=O)R^{BM}、
-NHC(=O)R^{BB}、-NR^{BN}C(=O)R^{BB}、
-NHC(=O)NH_2、-NHC(=O)NHR^{BB}、-NHC(=O)$NR^{BB}{}_2$、-NHC(=O)R^{BM}、
-NR^{BN}C(=O)NH_2、-NR^{BN}C(=O)NHR^{BB}、-NR^{BN}C(=O)$NR^{BB}{}_2$、-NR^{BN}C(=O)R^{BM}、
-NHC(=O)OR^{BB}、-NR^{BN}C(=O)OR^{BB}、
-OC(=O)NH_2、-OC(=O)NHR^{BB}、-OC(=O)$NR^{BB}{}_2$、-OC(=O)R^{BM}、
-NHC(=NH)NH_2、
-C(=O)R^{BB}、
-S(=O)NH_2、-S(=O)NHR^{BB}、-S(=O)$NR^{BB}{}_2$、-S(=O)R^{BM}、
-$S(=O)_2NH_2$、-$S(=O)_2NHR^{BB}$、-$S(=O)_2NR^{BB}{}_2$、-$S(=O)_2R^{BM}$、
-NHS(=O)R^{BB}、-NR^{BN}S(=O)R^{BB}、
-$NHS(=O)_2R^{BB}$、-$NR^{BN}S(=O)_2R^{BB}$、
-S(=O)R^{BB}、-$S(=O)_2R^{BB}$、

-SH、-SR^{BB}、-CN、及び-NO_2
から選択され、
-R^{BB}の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;
-R^{BN}の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキルであり;
-R^{BM}の各々は、独立してアゼチジノ、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、アゼパノ、若しくはジアゼパノであって、
1つ以上の以下から選択される基により置換されていてもよく:
-R^{BMM}、-C(=O)R^{BMM}、-C(=O)OR^{BMM}、及び-S(=O)$_2R^{BMM}$;
-R^{BMM}の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;
-R^{2}は、独立して-H若しくは-R^{22}であり;
-R^{22}は、独立して-R^{22C}若しくは-R^{22D}であり;
-R^{22C}は、独立して:
-R^{C1}、-R^{C2}、-R^{C3}、-R^{C4}、-R^{C5}、-L^{C}-R^{C2}、-L^{C}-R^{C3}、-L^{C}-R^{C4}、若しくは-L^{C}-R^{C5}であり;
-R^{C1}の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim6}$アルキルであり、1つ以上の基-R^{CC2}により置換されていてもよく;
-R^{C2}の各々は、飽和$C_{3\sim6}$シクロアルキルであり、1つ以上の基-R^{CC1}及び1つ以上の基-R^{CC2}により置換されていてもよく;
-R^{C3}の各々は、非芳香族$C_{3\sim7}$ヘテロシクリルであり、1つ以上の基-R^{CC1}及び1つ以上の基-R^{CC2}により置換されていてもよく;
-R^{C4}の各々は、独立してフェニル若しくはナフチルであり、1つ以上の基-R^{CC1}及び1つ以上の基-R^{CC2}により置換されていてもよく;
-R^{C5}の各々は、$C_{5\sim10}$ヘテロアリールであり、1つ以上の基-R^{CC1}及び1つ以上の基-R^{CC2}により置換されていてもよく;
-L^{C}-の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキレンであり;
-R^{CC1}の各々は、独立して:
-R^{CC}、
-L^{CC}-OH、-L^{CC}-OR^{CC}、
-L^{CC}-NH_2、-L^{CC}-NHR^{CC}、-L^{CC}-N$R^{CC}{}_2$、及び-L^{CC}-R^{CM}
から選択され、
-R^{CC2}の各々は、独立して:
-F、-Cl、-Br、-I、
-OH、-OR^{CC}、
-OCF_3、
-NH_2、-NHR^{CC}、-N$R^{CC}{}_2$、-R^{CM}、
-C(=O)OH、-C(=O)OR^{CC}、-OC(=O)R^{CC}、
-C(=O)NH_2、-C(=O)NHR^{CC}、-C(=O)N$R^{CC}{}_2$、-C(=O)R^{CM}、
-NHC(=O)R^{CC}、-NR^{CN}C(=O)R^{CC}、
-NHC(=O)NH_2、-NHC(=O)NHR^{CC}、-NHC(=O)N$R^{CC}{}_2$、-NHC(=O)R^{CM}、
-NR^{CN}C(=O)NH_2、-NR^{CN}C(=O)NHR^{CC}、-NR^{CN}C(=O)N$R^{CC}{}_2$、-NR^{CN}C(=O)R^{CM}、
-NHC(=O)OR^{CC}、-NR^{CN}C(=O)OR^{CC}、
-OC(=O)NH_2、-OC(=O)NHR^{CC}、-OC(=O)N$R^{CC}{}_2$、-OC(=O)R^{CM}、
-NHC(=NH)NH_2、
-C(=O)R^{CC}、
-S(=O)NH_2、-S(=O)NHR^{CC}、-S(=O)N$R^{CC}{}_2$、-S(=O)R^{CM}、
-S(=O)$_2NH_2$、-S(=O)$_2$NHR^{CC}、-S(=O)$_2$N$R^{CC}{}_2$、-S(=O)$_2R^{CM}$、
-NHS(=O)R^{CC}、-NR^{CN}S(=O)R^{CC}、
-NHS(=O)$_2R^{CC}$、-NR^{CN}S(=O)$_2R^{CC}$、

-S(=O)R^{CC}、-S(=O)$_2R^{CC}$、
-SH、-SR^{CC}、-CN、及び-NO_2;
から選択され、
-L^{CC}-の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキレンであり;
-R^{CC}の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;
-R^{CN}の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキルであり;
-R^{CM}の各々は、独立してアゼチジノ、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、アゼパノ、若しくはジアゼパノであって、
1つ以上の以下から選択される基により置換されていてもよく:
-R^{CMM}、-C(=O)R^{CMM}、-C(=O)OR^{CMM}、及び-S(=O)$_2R^{CMM}$;
-R^{CMM}の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;
-R^{22D}は、独立して:
-F、-Cl、-Br、-I、
-OH、-OR^{DD}、
-OCF_3、
-NH_2、-NHR^{DD}、-N$R^{DD}{}_2$、-R^{DM}、
-C(=O)OH、-C(=O)OR^{DD}、-OC(=O)R^{DD}、
-C(=O)NH_2、-C(=O)NHR^{DD}、-C(=O)N$R^{DD}{}_2$、-C(=O)R^{DM}、
-NHC(=O)R^{DD}、-NR^{DN}C(=O)R^{DD}、
-NHC(=O)NH_2、-NHC(=O)NHR^{DD}、-NHC(=O)N$R^{DD}{}_2$、-NHC(=O)R^{DM}、
-NR^{DN}C(=O)NH_2、-NR^{DN}C(=O)NHR^{DD}、-NR^{DN}C(=O)N$R^{DD}{}_2$、-NR^{DN}C(=O)R^{DM}、
-NHC(=O)OR^{DD}、-NR^{DN}C(=O)OR^{DD}、
-OC(=O)NH_2、-OC(=O)NHR^{DD}、-OC(=O)N$R^{DD}{}_2$、-OC(=O)R^{DM}、
-NHC(=NH)NH_2、
-C(=O)R^{DD}、
-S(=O)NH_2、-S(=O)NHR^{DD}、-S(=O)N$R^{DD}{}_2$、-S(=O)R^{DM}、
-S(=O)$_2NH_2$、-S(=O)$_2$NHR^{DD}、-S(=O)$_2$N$R^{DD}{}_2$、-S(=O)$_2R^{DM}$、
-NHS(=O)R^{DD}、-NR^{DN}S(=O)R^{DD}、
-NHS(=O)$_2R^{DD}$、-NR^{DN}S(=O)$_2R^{DD}$、
-S(=O)R^{DD}、-S(=O)$_2R^{DD}$、
-SH、-SR^{DD}、-CN、及び-NO_2
から選択され、
-R^{DD}の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;
-R^{DN}の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキルであり;
-R^{DM}の各々は、独立してアゼチジノ、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、アゼパノ、若しくはジアゼパノであって、
1つ以上の以下から選択される基により置換されていてもよく:
-R^{DMM}、-C(=O)R^{DMM}、-C(=O)OR^{DMM}、及び-S(=O)$_2R^{DMM}$;
-R^{DMM}の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;
又は、-R^1及び-R^2は、それらが結合している炭素原子と一緒になって、飽和$C_{3\sim6}$シクロアルキル又は非芳香族$C_{3\sim7}$ヘテロシクリルを形成し、1つ以上の基-R^{CC2}により置換されていてもよく;
ただし、化合物は、以下の式の化合物、又はその薬学的に許容される塩、水和物若しくは溶媒和物ではない:

【化２】



)。

【請求項２】

-Aが-A^Cである、請求項1に記載の化合物。

【請求項３】

-Aが-A^Hである、請求項1に記載の化合物。

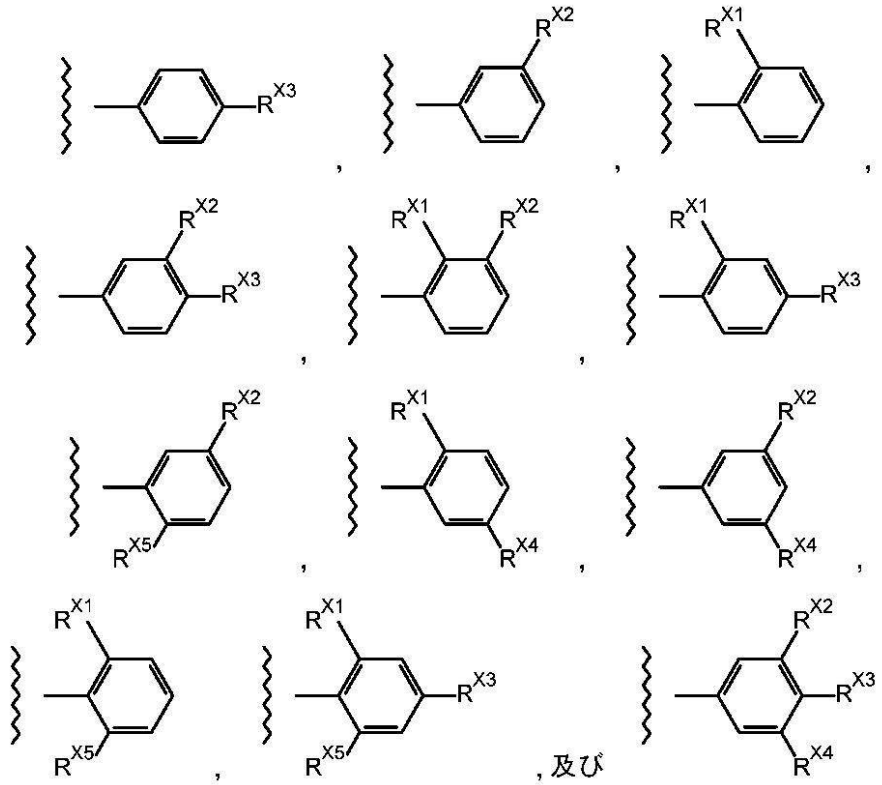
【請求項４】

-A^Cが、存在する場合、フェニルであり、1つ以上の置換基-R^Xにより置換されていてもよい、請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項５】

-A^Cが、存在する場合、独立して以下から選択される、請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物:

【化３】

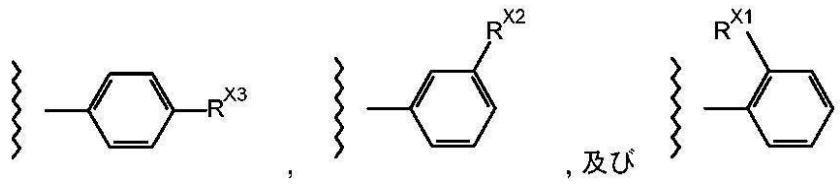


(式中、-R^{X1}、-R^{X2}、-R^{X3}、-R^{X4}、-R^{X5}、及び-R^{X6}の各々は、独立して-R^Xに関して定義された通りである)。

【請求項６】

-A^Cが、存在する場合、独立して以下から選択される、請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物:

【化４】

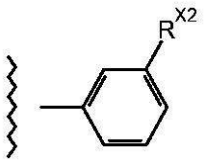


(式中、-R^{X1}、-R^{X2}、及び-R^{X3}の各々は、独立して-R^{X}に関して定義された通りである)。

【請求項７】

-A^{C}が、存在する場合、以下である、請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物:

【化５】

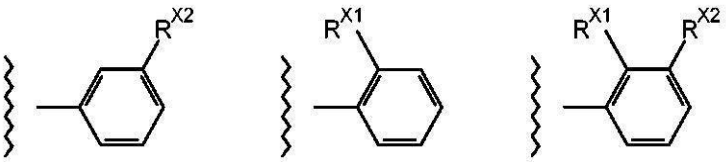


(式中、-R^{X2}は、独立して-R^{X}に関して定義された通りである)。

【請求項８】

-A^{C}が、存在する場合、独立して以下から選択される、請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物:

【化６】

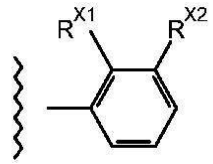


(式中、-R^{X1}及び-R^{X2}の各々は、独立して-R^{X}に関して定義された通りである)。

【請求項９】

-A^{C}が、存在する場合、以下である、請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物:

【化７】



(式中、-R^{X1}及び-R^{X2}の各々は、独立して-R^{X}に関して定義された通りである)。

【請求項１０】

-A^{H}が、存在する場合、$C_{5\sim6}$ヘテロアリール又は$C_{9\sim10}$ヘテロアリールであり、1つ以上の置換基-R^{X}により置換されていてもよい、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】

-A^{H}が、存在する場合、フラニル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、キノリニル、イソキノリニル、シンノリニル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、又はベンゾピラニルであり、1つ以上の置換基-R^{X}により置換されていてもよい、請求項1から9のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１２】

-A^Hが、存在する場合、ピリジル、フラニル、チエニル、又はキノリニルであり、1つ以上の置換基-R^Xにより置換されていてもよい、請求項1から9のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１３】

-R^Xの各々が、存在する場合、独立して:

-R^{XX}、-R^{XXU}、-R^{XXV}、-R^{XXH}、

-F、-Cl、-Br、-I、

-OH、-OR^{XX}、

-CF_3、-OCF_3、

-NH_2、-NHR^{XX}、-$NR^{XX}{}_2$、-R^{XM}、

-C(=O)OH、-C(=O)OR^{XX}、-OC(=O)R^{XX}、

-C(=O)NH_2、-C(=O)NHR^{XX}、-C(=O)$NR^{XX}{}_2$、-C(=O)R^{XM}、

-NHC(=O)R^{XX}、-NR^{XN}C(=O)R^{XX}、

-C(=O)R^{XX}、

-S(=O)NH_2、-S(=O)NHR^{XX}、-S(=O)$NR^{XX}{}_2$、-S(=O)R^{XM}、

-$S(=O)_2NH_2$、-$S(=O)_2NHR^{XX}$、-$S(=O)_2NR^{XX}{}_2$、-$S(=O)_2R^{XM}$、

-NHS(=O)R^{XX}、-NR^{XN}S(=O)R^{XX}、

-NHS$(=O)_2R^{XX}$、-NR^{XN}S$(=O)_2R^{XX}$、

-S(=O)R^{XX}、-S$(=O)_2R^{XX}$、

-SR^{XX}、-CN、及び-NO_2

から選択される、請求項1から12のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１４】

-R^Xの各々が、存在する場合、独立して:

-R^{XX}、-R^{XXU}、-R^{XXV}、

-F、-Cl、-Br、-I、

-OH、-OR^{XX}、

-CF_3、-OCF_3、

-NH_2、-NHR^{XX}、-$NR^{XX}{}_2$、-R^{XM}、

-C(=O)OH、-C(=O)OR^{XX}、-OC(=O)R^{XX}、

-SR^{XX}、-CN、及び-NO_2

から選択される、請求項1から12のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１５】

-R^Xの各々が、存在する場合、独立して:

-R^{XX}、

-F、-Cl、-Br、-I、

-OH、-OR^{XX}、

-CF_3、及び-OCF_3

から選択される、請求項1から12のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１６】

-R^1が-R^{11}である、請求項1から15のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１７】

-R^{11}が、存在する場合、-R^{11A}である、請求項1から16のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項１８】

-R^{11A}が、存在する場合、独立して-R^{A1}、-R^{A4}、-L^A-R^{A4}、又は-L^A-R^{A5}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】

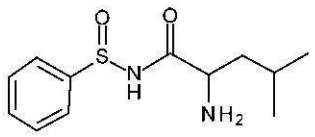
-R^{11A}が、存在する場合、-R^{A1}である、請求項1から17のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項２０】

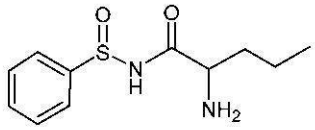
-R^{A1}の各々が、存在する場合、独立して-Me、-Et、-nPr、-iPr、-nBu、-iBu、-sBu、又は-tBuであり;1つ以上の基-R^{AA2}で置換されていてもよい、請求項1から19のいずれか一項

に記載の化合物。
【請求項２１】
-R^{A1}の各々が、存在する場合、-iBuであり;1つ以上の基-R^{AA2}により置換されていてもよい、請求項1から19のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項２２】
-R^{A1}の各々が、存在する場合、-iPrであり;1つ以上の基-R^{AA2}により置換されていてもよい、請求項1から19のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項２３】
-R^{A1}の各々が、存在する場合、独立して-Me、-Et、-nPr、-iPr、-nBu、-iBu、-sBu、又は-tBuである、請求項1から19のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項２４】
-R^{A1}の各々が、存在する場合、-iBuである、請求項1から19のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項２５】
-R^{A1}の各々が、存在する場合、-iPrである、請求項1から19のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項２６】
-R^{2}が-Hである、請求項1から25のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項２７】
以下の式の化合物、並びにその薬学的に許容される塩、水和物、及び溶媒和物から選択される、請求項1に記載の化合物：

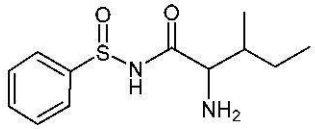
【化８】



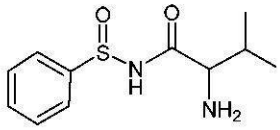
(ANASA-001),



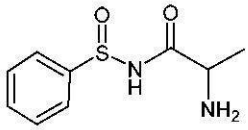
(ANASA-002),



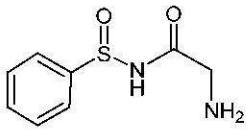
(ANASA-003),



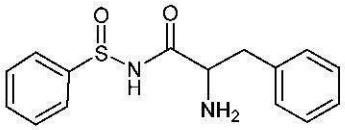
(ANASA-004),



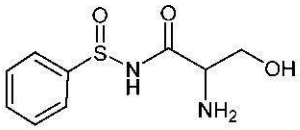
(ANASA-005),



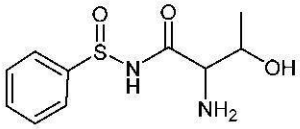
(ANASA-006),



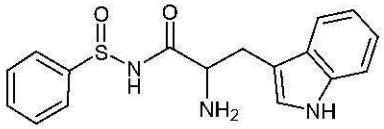
(ANASA-007),



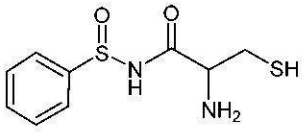
(ANASA-008),



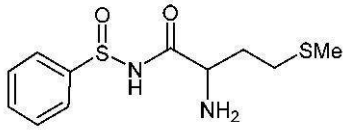
(ANASA-009),

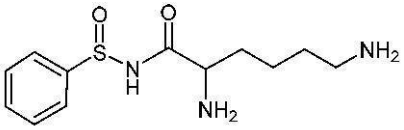


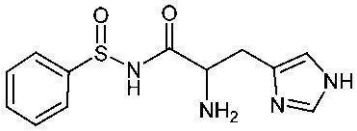
(ANASA-010),

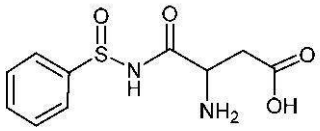


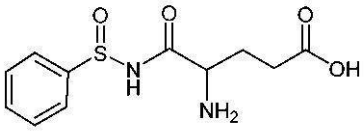
(ANASA-011),

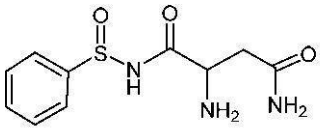

(ANASA-012),

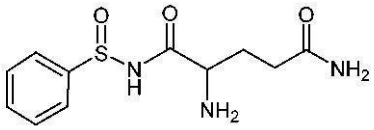

(ANASA-013),

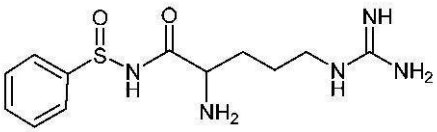

(ANASA-014),

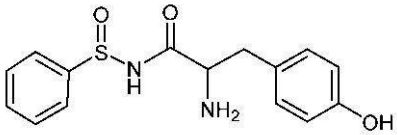

(ANASA-015),

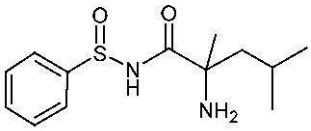

(ANASA-016),

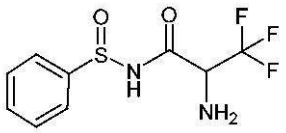

(ANASA-017),

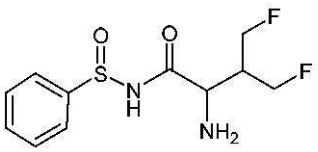

(ANASA-018),

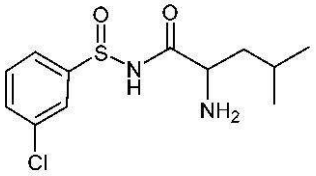

(ANASA-019),


(ANASA-020),

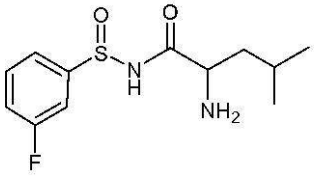

(ANASA-021),


(ANASA-022),

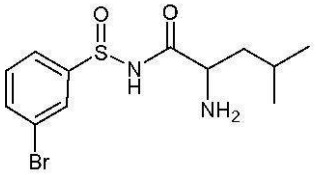

(ANASA-023),



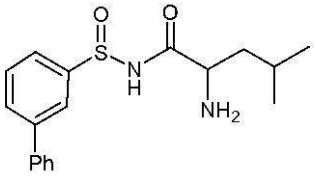
(ANASA-024),



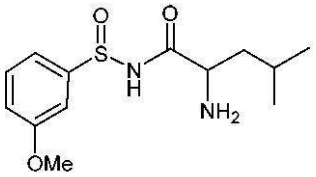
(ANASA-025),



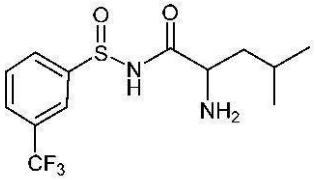
(ANASA-026),



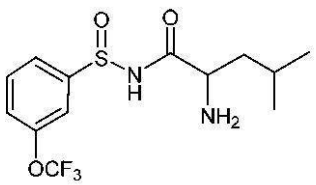
(ANASA-027),



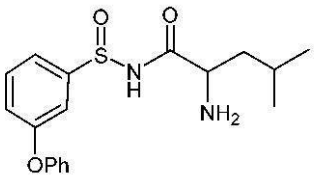
(ANASA-028),



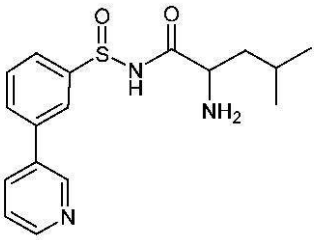
(ANASA-029),



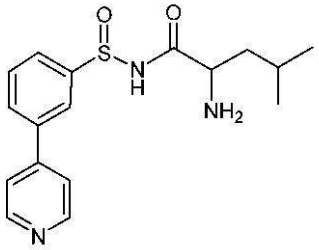
(ANASA-030),



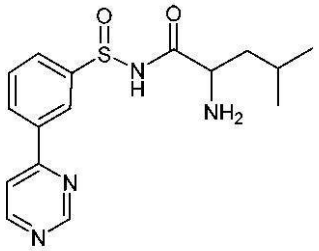
(ANASA-031),



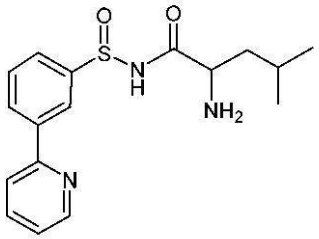
(ANASA-032),



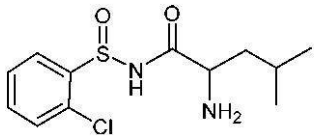
(ANASA-033),



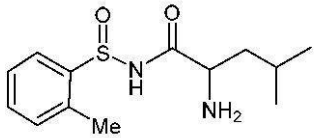
(ANASA-034),



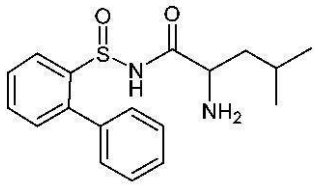
(ANASA-035),



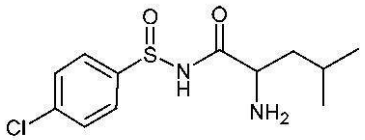
(ANASA-036),



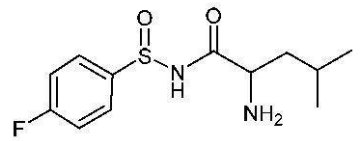
(ANASA-037),



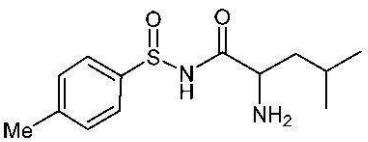
(ANASA-038),



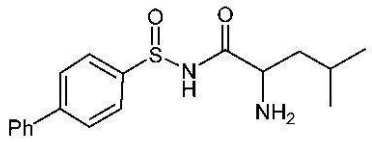
(ANASA-039),

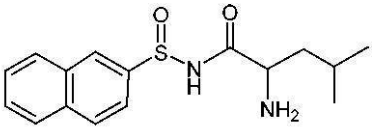


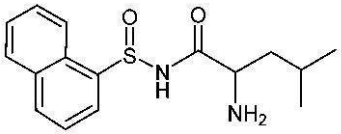
(ANASA-040),

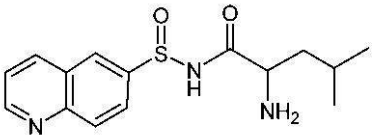


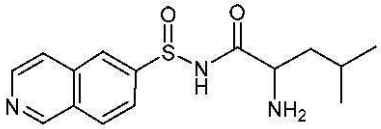
(ANASA-041),

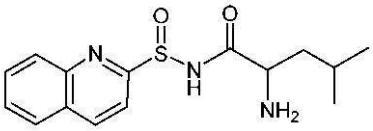

(ANASA-042),

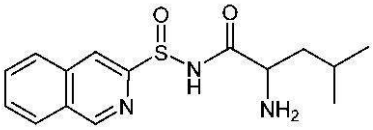

(ANASA-043),

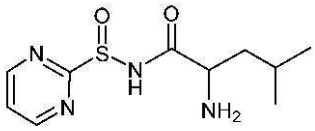

(ANASA-044),

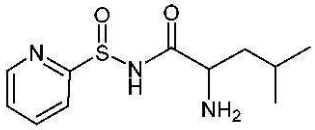

(ANASA-045),

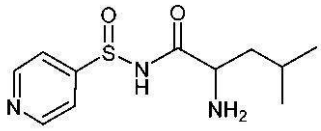

(ANASA-046),

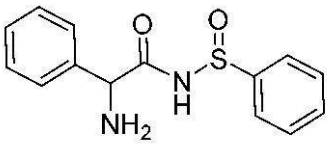

(ANASA-047),

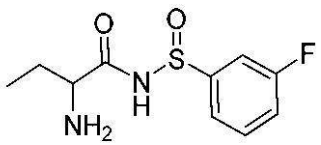

(ANASA-048),

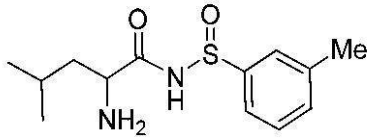

(ANASA-049),

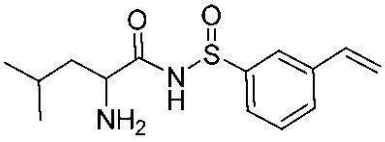

(ANASA-050),

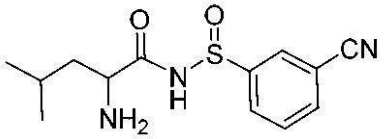

(ANASA-051),

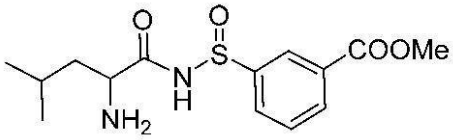

(ANASA-052),

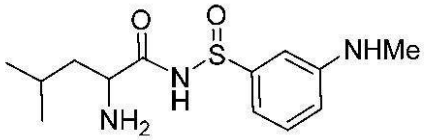

(ANASA-053),


(ANASA-054),

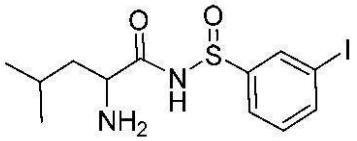

(ANASA-055),

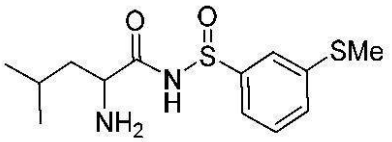

(ANASA-056),

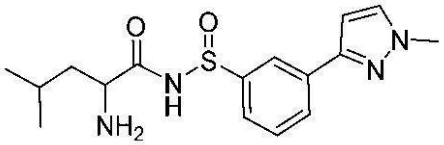

(ANASA-057),

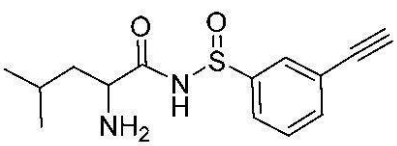

(ANASA-058),

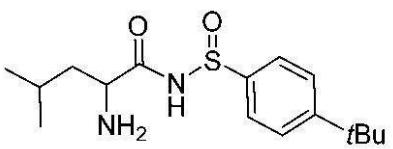
(ANASA-059),

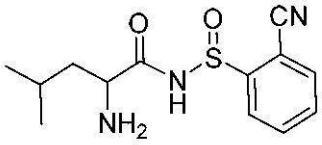

(ANASA-060),

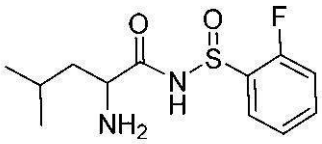

(ANASA-061),

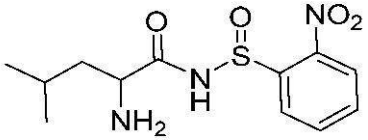

(ANASA-062),

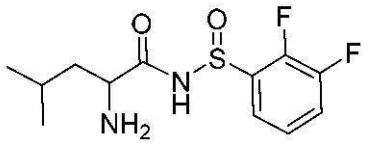

(ANASA-063),

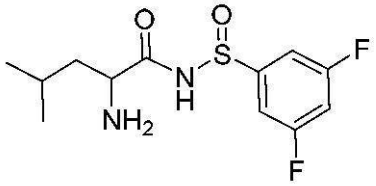

(ANASA-064),

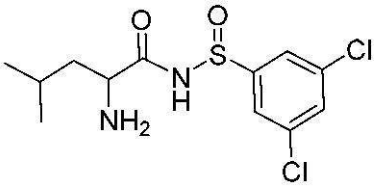

(ANASA-065),

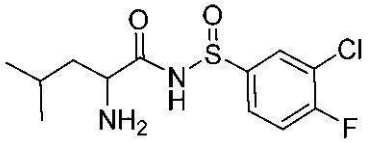

(ANASA-066),

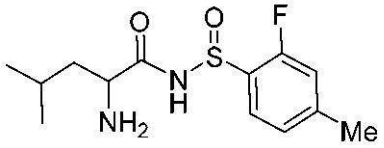

(ANASA-067),

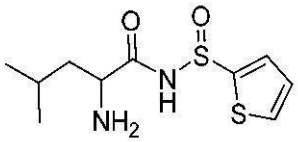

(ANASA-068),

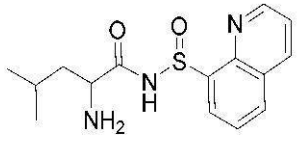

(ANASA-069),

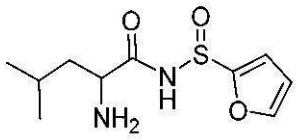

(ANASA-070),


(ANASA-071),


(ANASA-072),


(ANASA-073),


(ANASA-074),


(ANASA-075).

【請求項２８】

スルホキシド基の一部を形成する硫黄原子が、(R)配置にある、請求項1から27のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項２９】

スルホキシド基の一部を形成する硫黄原子が、(S)配置にある、請求項1から27のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項３０】
$-R^1$及び$-R^2$が結合している炭素原子が、(R)配置にある、請求項1から29のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項３１】
$-R^1$及び$-R^2$が結合している炭素原子が、(S)配置にある、請求項1から29のいずれか一項に記載の化合物。
【請求項３２】
請求項1から31のいずれか一項に記載の化合物、及び薬学的に許容される担体又は希釈剤を含む医薬組成物。
【請求項３３】
請求項1から31のいずれか一項に記載の化合物、及び薬学的に許容される担体又は希釈剤を混合するステップを含む、医薬組成物の調製方法。
【請求項３４】
有効量の請求項1から31のいずれか一項に記載の化合物をシンセターゼに接触させるステップを含む、細菌アミノアシル-tRNAシンセターゼを阻害するインビトロでの方法。
【請求項３５】
有効量の請求項1から31のいずれか一項に記載の化合物を細胞に接触させるステップを含む、細胞における細菌アミノアシル-tRNAシンセターゼ機能を阻害するインビトロでの方法。
【請求項３６】
細菌アミノアシル-tRNAシンセターゼの阻害により改善されるヒト又は動物の身体の障害の処置方法において使用するための、請求項32に記載の医薬組成物。
【請求項３７】
細菌感染の処置方法において使用するための、請求項32に記載の医薬組成物。
【請求項３８】
細菌がグラム陽性細菌である、請求項37に記載の医薬組成物。
【請求項３９】
細菌がグラム陰性細菌である、請求項37に記載の医薬組成物。
【請求項４０】
感染が、
中枢神経系感染;
外耳感染;
中耳感染;
急性中耳炎;
硬膜静脈洞の感染;
眼感染;
口腔感染;
歯、歯肉若しくは粘膜の感染;
上気道感染;
下気道感染;
尿生殖器感染;
尿路感染;
腹腔内感染;
胃腸感染;
婦人科感染;
敗血症、
骨若しくは関節の感染;
皮膚若しくは皮膚構造の感染;

細菌性心内膜炎;又は
熱傷感染
である、請求項37から39のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項４１】
細菌アミノアシル-tRNAシンセターゼの阻害により改善されるヒト又は動物の身体の障害の処置のための医薬の製造における、請求項1から31のいずれか一項に記載の化合物の使用。
【請求項４２】
細菌感染を処置するための医薬の製造における、請求項1から31のいずれか一項に記載の化合物の使用。
【請求項４３】
細菌がグラム陽性細菌である、請求項42に記載の使用。
【請求項４４】
細菌がグラム陰性細菌である、請求項42に記載の使用。
【請求項４５】
感染が、
中枢神経系感染;
外耳感染;
中耳感染;
急性中耳炎;
硬膜静脈洞の感染;
眼感染;
口腔感染;
歯、歯肉若しくは粘膜の感染;
上気道感染;
下気道感染;
尿生殖器感染;
尿路感染;
腹腔内感染;
胃腸感染;
婦人科感染;
敗血症、
骨若しくは関節の感染;
皮膚若しくは皮膚構造の感染;
細菌性心内膜炎;又は
熱傷感染
である、請求項42から44のいずれか一項に記載の使用。
【手続補正２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０５１５
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０５１５】
参考文献
本発明及び本発明が関連する技術の現状についてより完全に記載及び開示するために、いくつかの刊行物が本明細書において引用されている。これらの参考文献の引用すべてが、以下に提示されている。これらの参考文献の各々は、個々の参考文献の各々が参照により組み込まれているよう具体的及び個別に示されているのと同じ程度に、本開示にその全体が参照により本明細書に組み込まれている。

Cottrell *et al.*, 2005, “Inhibitors of Serine Proteases, Particularly HCV NS3-NS4A Protease”, international (PCT) patent publication number WO 2005/037860 A2 published 28 April 2005.

Duron *et al.*, 2014, “Cystathionine-Y-Gamma-Lyase (CSE) Inhibitors”, international (PCT) patent publication number WO 2014/018569 A1 published 30 January 2014.

Hurdle *et al.*, 2005, “Prospects for aminoacyl-tRNA synthetase inhibitors as new antimicrobial agents”, Antimicrobial Agents and Chemotherapy, Vol. 49, pp. 4821-4833.

Jirgensons *et al.*, 2016, “Novel N-acyl-sulfonamide derivatives as aminoacyl-tRNA synthetase inhibitors”, international (PCT) patent publication number WO 2016/129983 A1 published 18 August 2016.

Laupland *et al.*, 2003, “Treatment of staphylococcus aureus colonization and prophylaxis for infection with topical intranasal mupirocin: An evidence-based review”, Clinical Infectious Diseases, Vol. 37, pp. 933-938.

Ochsner *et al.*, 2007, “Aminoacyl-tRNA synthetases: essential and still promising targets for new anti-infective agents”, Expert Opinion on Investigational Drugs, Vol. 16, pp. 573-593.

Pham *et al.*, 2014, “Aminoacyl-tRNA synthetases as drug targets in eukaryotic parasties”, Int. J. Parasitol. Drugs Drug Resist., Vol. 4, Issue 1, pp. 1-13.

Savile *et al.*, 2005, “Subtilisin-catalyzed resolution of N-acyl arylsulfinamides”, J. Amer. Chem. Soc., Vol. 127, No. 7, pp. 2104-2113.

Vondenhoff *et al.*, 2011, “Aminoacyl-tRNA synthetase inhibitors as potential antibiotics”, Eur. J. Med. Chem., Vol. 46, pp. 5227-5236.

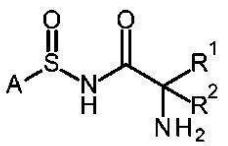
Zhang *et al.*, 2013, “Discovery of N-(4-sulfamoylpheny)thioureas as Tyrpanosoma brucei leucyl-tRNA synthetase inhibitors”, Organic & Biomolecular Chemistry, Vol. 11, pp. 5310-5324.

（付記）

（付記１）

以下の式の化合物、並びにその薬学的に許容される塩、水和物、及び溶媒和物から選択される化合物：

【化３７】



（式中、

-Aは、独立して-A^C若しくは-A^Hであり；

-A^Cは、独立してフェニル若しくはナフチルであり、1つ以上の置換基-R^Xにより置換されていてもよく；

-A^Hは、独立して$C_{5\sim12}$ヘテロアリールであり、1つ以上の置換基-R^Xにより置換されていてもよく；

-R^Xの各々は、独立して：

-R^{XX}、-R^{XXU}、-R^{XXV}、-R^{XXH}、

-F、-Cl、-Br、-I、

-OH、-OR^{XX}、
-L^{XX}-OH、-L^{XX}-OR^{XX}、
-CF_3、-OCF_3、
-NH_2、-NHR^{XX}、-$NR^{XX}{}_2$、-R^{XM}、
-L^{XX}-NH_2、-L^{XX}-NHR^{XX}、-L^{XX}-$NR^{XX}{}_2$、-L^{XX}-R^{XM}、
-C(=O)OH、-C(=O)OR^{XX}、-OC(=O)R^{XX}、
-C(=O)NH_2、-C(=O)NHR^{XX}、-C(=O)$NR^{XX}{}_2$、-C(=O)R^{XM}、
-NHC(=O)R^{XX}、-NR^{XN}C(=O)R^{XX}、
-NHC(=O)NH_2、-NHC(=O)NHR^{XX}、-NHC(=O)$NR^{XX}{}_2$、-NHC(=O)R^{XM}、
-NR^{XN}C(=O)NH_2、-NR^{XN}C(=O)NHR^{XX}、-NR^{XN}C(=O)$NR^{XX}{}_2$、-NR^{XN}C(=O)R^{XM}、
-NHC(=O)OR^{XX}、-NR^{XN}C(=O)OR^{XX}、
-OC(=O)NH_2、-OC(=O)NHR^{XX}、-OC(=O)$NR^{XX}{}_2$、-OC(=O)R^{XM}、
-NHC(=NH)NH_2、
-C(=O)R^{XX}、
-S(=O)NH_2、-S(=O)NHR^{XX}、-S(=O)$NR^{XX}{}_2$、-S(=O)R^{XM}、
-$S(=O)_2NH_2$、-$S(=O)_2NHR^{XX}$、-$S(=O)_2NR^{XX}{}_2$、-$S(=O)_2R^{XM}$、
-NHS(=O)R^{XX}、-NR^{XN}S(=O)R^{XX}、
-NHS(=O)$_2R^{XX}$、-$NR^{XN}S(=O)_2R^{XX}$、
-S(=O)R^{XX}、-$S(=O)_2R^{XX}$、
-SH、-SR^{XX}、-CN、及び-NO_2
から選択され、

さらに、存在する場合、2つの隣接する基-R^Xは、一緒になって、以下を形成してもよく:

-O-CH_2-O-若しくは-O-CH_2CH_2-O-;

-L^{XX}-の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキレンであり;

-R^{XX}の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;

-R^{XXU}の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の$C_{2\sim4}$アルケニルであり;

-R^{XXV}の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の$C_{2\sim4}$アルキニルであり;

-R^{XXH}の各々は、$C_{5\sim10}$ヘテロアリールであり、1つ以上の基-R^{XMM}により置換されていてもよく;

-R^{XN}の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキルであり;

-R^{XM}の各々は、独立してアゼチジノ、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、アゼパノ、若しくはジアゼパノであって、
1つ以上の以下から選択される基により置換されていてもよく:
-R^{XMM}、-C(=O)R^{XMM}、-C(=O)OR^{XMM}、及び-$S(=O)_2R^{XMM}$;

-R^{XMM}の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;

-R^1は、独立して-H若しくは-R^{11}であり;

-R^{11}は、独立して-R^{11A}若しくは-R^{11B}であり;

-R^{11A}は、独立して:
-R^{A1}、-R^{A2}、-R^{A3}、-R^{A4}、-R^{A5}、-L^A-R^{A2}、-L^A-R^{A3}、-L^A-R^{A4}、若しくは-L^A-R^{A5}であり;

-R^{A1}の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim6}$アルキルであり、1つ以上の基-R^{AA2}により置換されていてもよく;

-R^{A2}の各々は、飽和$C_{3\sim6}$シクロアルキルであり、1つ以上の基-R^{AA1}及び1つ以上の基-R^{AA2}により置換されていてもよく;

-R^{A3}の各々は、非芳香族$C_{3\sim7}$ヘテロシクリルであり、1つ以上の基-R^{AA1}及び1つ以上の基-R^{AA2}により置換されていてもよく;

-R^{A4}の各々は、独立してフェニル若しくはナフチルであり、1つ以上の基-R^{AA1}及び1つ

以上の基-R^{AA2}により置換されていてもよく;
-R^{A5}の各々は、$C_{5\sim10}$ヘテロアリールであり、1つ以上の基-R^{AA1}及び1つ以上の基-R^{AA2}により置換されていてもよく;
-L^{A}-の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキレンであり;
-R^{AA1}の各々は、独立して:
-R^{AA}、
-L^{AA}-OH、-L^{AA}-OR^{AA}、
-L^{AA}-NH_2、-L^{AA}-NHR^{AA}、-L^{AA}-$NR^{AA}{}_2$、及び-L^{AA}-R^{AM}
から選択され、
-R^{AA2}の各々は、独立して:
-F、-Cl、-Br、-I、
-OH、-OR^{AA}、
-OCF_3、
-NH_2、-NHR^{AA}、-$NR^{AA}{}_2$、-R^{AM}、
-C(=O)OH、-C(=O)OR^{AA}、-OC(=O)R^{AA}、
-C(=O)NH_2、-C(=O)NHR^{AA}、-C(=O)$NR^{AA}{}_2$、-C(=O)R^{AM}、
-NHC(=O)R^{AA}、-NR^{AN}C(=O)R^{AA}、
-NHC(=O)NH_2、-NHC(=O)NHR^{AA}、-NHC(=O)$NR^{AA}{}_2$、-NHC(=O)R^{AM}、
-NR^{AN}C(=O)NH_2、-NR^{AN}C(=O)NHR^{AA}、-NR^{AN}C(=O)$NR^{AA}{}_2$、-NR^{AN}C(=O)R^{AM}、
-NHC(=O)OR^{AA}、-NR^{AN}C(=O)OR^{AA}、
-OC(=O)NH_2、-OC(=O)NHR^{AA}、-OC(=O)$NR^{AA}{}_2$、-OC(=O)R^{AM}、
-NHC(=NH)NH_2、
-C(=O)R^{AA}、
-S(=O)NH_2、-S(=O)NHR^{AA}、-S(=O)$NR^{AA}{}_2$、-S(=O)R^{AM}、
-$S(=O)_2NH_2$、-$S(=O)_2NHR^{AA}$、-$S(=O)_2NR^{AA}{}_2$、-$S(=O)_2R^{AM}$、
-NHS(=O)R^{AA}、-NR^{AN}S(=O)R^{AA}、
-NHS(=O)$_2R^{AA}$、-NR^{AN}S(=O)$_2R^{AA}$、
-S(=O)R^{AA}、-S(=O)$_2R^{AA}$、
-SH、-SR^{AA}、-CN、及び-NO_2
から選択され、
-L^{AA}-の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキレンであり;
-R^{AA}の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;
-R^{AN}の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキルであり;
-R^{AM}の各々は、独立してアゼチジノ、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、アゼパノ、若しくはジアゼパノであって、
1つ以上の以下から選択される基により置換されていてもよく:
-R^{AMM}、-C(=O)R^{AMM}、-C(=O)OR^{AMM}、及び-$S(=O)_2R^{AMM}$;
-R^{AMM}の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;
-R^{11B}は、独立して:
-F、-Cl、-Br、-I、
-OH、-OR^{BB}、
-OCF_3、
-NH_2、-NHR^{BB}、-$NR^{BB}{}_2$、-R^{BM}、
-C(=O)OH、-C(=O)OR^{BB}、-OC(=O)R^{BB}、
-C(=O)NH_2、-C(=O)NHR^{BB}、-C(=O)$NR^{BB}{}_2$、-C(=O)R^{BM}、
-NHC(=O)R^{BB}、-NR^{BN}C(=O)R^{BB}、
-NHC(=O)NH_2、-NHC(=O)NHR^{BB}、-NHC(=O)$NR^{BB}{}_2$、-NHC(=O)R^{BM}、
-NR^{BN}C(=O)NH_2、-NR^{BN}C(=O)NHR^{BB}、-NR^{BN}C(=O)$NR^{BB}{}_2$、-NR^{BN}C(=O)R^{BM}、

-NHC(=O)OR^{BB}、-NR^{BN}C(=O)OR^{BB}、
-OC(=O)NH$_2$、-OC(=O)NHR^{BB}、-OC(=O)NR$^{BB}{}_2$、-OC(=O)R^{BM}、
-NHC(=NH)NH$_2$、
-C(=O)R^{BB}、
-S(=O)NH$_2$、-S(=O)NHR^{BB}、-S(=O)NR$^{BB}{}_2$、-S(=O)R^{BM}、
-S(=O)$_2$NH$_2$、-S(=O)$_2$NHR^{BB}、-S(=O)$_2$NR$^{BB}{}_2$、-S(=O)$_2$R^{BM}、
-NHS(=O)R^{BB}、-NR^{BN}S(=O)R^{BB}、
-NHS(=O)$_2$R^{BB}、-NR^{BN}S(=O)$_2$R^{BB}、
-S(=O)R^{BB}、-S(=O)$_2$R^{BB}、
-SH、-SR^{BB}、-CN、及び-NO$_2$
から選択され、
-R^{BB}の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和C$_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;
-R^{BN}の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和C$_{1\sim4}$アルキルであり;
-R^{BM}の各々は、独立してアゼチジノ、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、アゼパノ、若しくはジアゼパノであって、
1つ以上の以下から選択される基により置換されていてもよく:
-R^{BMM}、-C(=O)R^{BMM}、-C(=O)OR^{BMM}、及び-S(=O)$_2$R^{BMM};
-R^{BMM}の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和C$_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;
-R^{2}は、独立して-H若しくは-R^{22}であり;
-R^{22}は、独立して-R^{22C}若しくは-R^{22D}であり;
-R^{22C}は、独立して:
-R^{C1}、-R^{C2}、-R^{C3}、-R^{C4}、-R^{C5}、-L^{C}-R^{C2}、-L^{C}-R^{C3}、-L^{C}-R^{C4}、若しくは-L^{C}-R^{C5}であり;
-R^{C1}の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和C$_{1\sim6}$アルキルであり、1つ以上の基-R^{CC2}により置換されていてもよく;
-R^{C2}の各々は、飽和C$_{3\sim6}$シクロアルキルであり、1つ以上の基-R^{CC1}及び1つ以上の基-R^{CC2}により置換されていてもよく;
-R^{C3}の各々は、非芳香族C$_{3\sim7}$ヘテロシクリルであり、1つ以上の基-R^{CC1}及び1つ以上の基-R^{CC2}により置換されていてもよく;
-R^{C4}の各々は、独立してフェニル若しくはナフチルであり、1つ以上の基-R^{CC1}及び1つ以上の基-R^{CC2}により置換されていてもよく;
-R^{C5}の各々は、C$_{5\sim10}$ヘテロアリールであり、1つ以上の基-R^{CC1}及び1つ以上の基-R^{CC2}により置換されていてもよく;
-L^{C}-の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和C$_{1\sim4}$アルキレンであり;
-R^{CC1}の各々は、独立して:
-R^{CC}、
-L^{CC}-OH、-L^{CC}-OR^{CC}、
-L^{CC}-NH$_2$、-L^{CC}-NHR^{CC}、-L^{CC}-NR$^{CC}{}_2$、及び-L^{CC}-R^{CM}
から選択され、
-R^{CC2}の各々は、独立して:
-F、-Cl、-Br、-I、
-OH、-OR^{CC}、
-OCF$_3$、
-NH$_2$、-NHR^{CC}、-NR$^{CC}{}_2$、-R^{CM}、
-C(=O)OH、-C(=O)OR^{CC}、-OC(=O)R^{CC}、
-C(=O)NH$_2$、-C(=O)NHR^{CC}、-C(=O)NR$^{CC}{}_2$、-C(=O)R^{CM}、
-NHC(=O)R^{CC}、-NR^{CN}C(=O)R^{CC}、
-NHC(=O)NH$_2$、-NHC(=O)NHR^{CC}、-NHC(=O)NR$^{CC}{}_2$、-NHC(=O)R^{CM}、

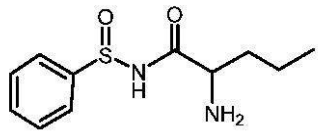
$-NR^{CN}C(=O)NH_2$、$-NR^{CN}C(=O)NHR^{CC}$、$-NR^{CN}C(=O)NR^{CC}{}_2$、$-NR^{CN}C(=O)R^{CM}$、
$-NHC(=O)OR^{CC}$、$-NR^{CN}C(=O)OR^{CC}$、
$-OC(=O)NH_2$、$-OC(=O)NHR^{CC}$、$-OC(=O)NR^{CC}{}_2$、$-OC(=O)R^{CM}$、
$-NHC(=NH)NH_2$、
$-C(=O)R^{CC}$、
$-S(=O)NH_2$、$-S(=O)NHR^{CC}$、$-S(=O)NR^{CC}{}_2$、$-S(=O)R^{CM}$、
$-S(=O)_2NH_2$、$-S(=O)_2NHR^{CC}$、$-S(=O)_2NR^{CC}{}_2$、$-S(=O)_2R^{CM}$、
$-NHS(=O)R^{CC}$、$-NR^{CN}S(=O)R^{CC}$、
$-NHS(=O)_2R^{CC}$、$-NR^{CN}S(=O)_2R^{CC}$、
$-S(=O)R^{CC}$、$-S(=O)_2R^{CC}$、
$-SH$、$-SR^{CC}$、$-CN$、及び$-NO_2$;
から選択され、
$-L^{CC}-$の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキレンであり;
$-R^{CC}$の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;
$-R^{CN}$の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキルであり;
$-R^{CM}$の各々は、独立してアゼチジノ、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、アゼパノ、若しくはジアゼパノであって、
1つ以上の以下から選択される基により置換されていてもよく:
$-R^{CMM}$、$-C(=O)R^{CMM}$、$-C(=O)OR^{CMM}$、及び$-S(=O)_2R^{CMM}$;
$-R^{AMM}$の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;
$-R^{22D}$は、独立して:
$-F$、$-Cl$、$-Br$、$-I$、
$-OH$、$-OR^{DD}$、
$-OCF_3$、
$-NH_2$、$-NHR^{DD}$、$-NR^{DD}{}_2$、$-R^{DM}$、
$-C(=O)OH$、$-C(=O)OR^{DD}$、$-OC(=O)R^{DD}$、
$-C(=O)NH_2$、$-C(=O)NHR^{DD}$、$-C(=O)NR^{DD}{}_2$、$-C(=O)R^{DM}$、
$-NHC(=O)R^{DD}$、$-NR^{DN}C(=O)R^{DD}$、
$-NHC(=O)NH_2$、$-NHC(=O)NHR^{DD}$、$-NHC(=O)NR^{DD}{}_2$、$-NHC(=O)R^{DM}$、
$-NR^{DN}C(=O)NH_2$、$-NR^{DN}C(=O)NHR^{DD}$、$-NR^{DN}C(=O)NR^{DD}{}_2$、$-NR^{DN}C(=O)R^{DM}$、
$-NHC(=O)OR^{DD}$、$-NR^{DN}C(=O)OR^{DD}$、
$-OC(=O)NH_2$、$-OC(=O)NHR^{DD}$、$-OC(=O)NR^{DD}{}_2$、$-OC(=O)R^{DM}$、
$-NHC(=NH)NH_2$、
$-C(=O)R^{DD}$、
$-S(=O)NH_2$、$-S(=O)NHR^{DD}$、$-S(=O)NR^{DD}{}_2$、$-S(=O)R^{DM}$、
$-S(=O)_2NH_2$、$-S(=O)_2NHR^{DD}$、$-S(=O)_2NR^{DD}{}_2$、$-S(=O)_2R^{DM}$、
$-NHS(=O)R^{DD}$、$-NR^{DN}S(=O)R^{DD}$、
$-NHS(=O)_2R^{DD}$、$-NR^{DN}S(=O)_2R^{DD}$、
$-S(=O)R^{DD}$、$-S(=O)_2R^{DD}$、
$-SH$、$-SR^{DD}$、$-CN$、及び$-NO_2$
から選択され、
$-R^{DD}$の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;
$-R^{DN}$の各々は、直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキルであり;
$-R^{DM}$の各々は、独立してアゼチジノ、ピロリジノ、ピペリジノ、ピペラジノ、モルホリノ、アゼパノ、若しくはジアゼパノであって、
1つ以上の以下から選択される基により置換されていてもよく:
$-R^{DMM}$、$-C(=O)R^{DMM}$、$-C(=O)OR^{DMM}$、及び$-S(=O)_2R^{DMM}$;

-R^{BMM}の各々は、独立して直鎖若しくは分岐の飽和$C_{1\sim4}$アルキル、フェニル、若しくはベンジルであり;

又は、-R^{1}及び-R^{2}は、それらが結合している炭素原子と一緒になって、飽和$C_{3\sim6}$シクロアルキル又は非芳香族$C_{3\sim7}$ヘテロシクリルを形成し、1つ以上の基-R^{CC2}により置換されていてもよく;

ただし、化合物は、以下の式の化合物、又はその薬学的に許容される塩、水和物若しくは溶媒和物ではない:

【化３８】



)。

（付記２）

-Aが-A^{C}である、付記1に記載の化合物。

（付記３）

-Aが-A^{H}である、付記1に記載の化合物。

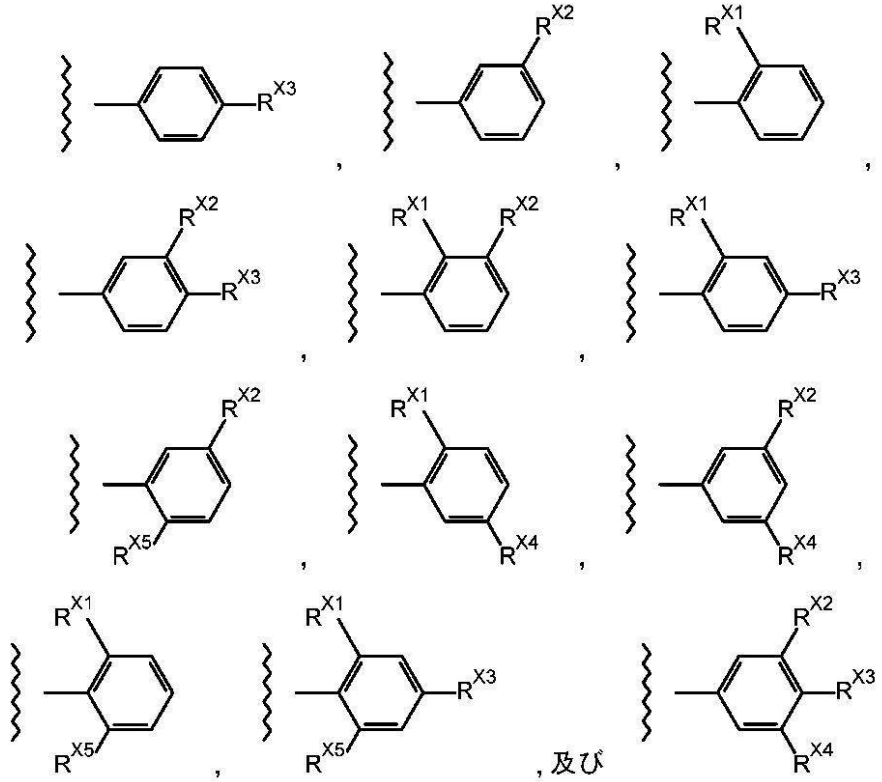
（付記４）

-A^{C}が、存在する場合、フェニルであり、1つ以上の置換基-R^{X}により置換されていてもよい、付記1から3のいずれか一項に記載の化合物。

（付記５）

-A^{C}が、存在する場合、独立して以下から選択される、付記1から3のいずれか一項に記載の化合物:

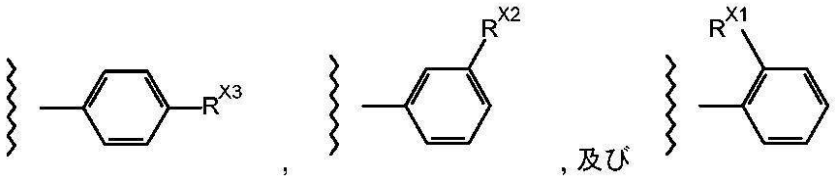
【化３９】



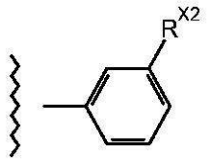
(式中、-R^{X1}、-R^{X2}、-R^{X3}、-R^{X4}、-R^{X5}、及び-R^{X6}の各々は、独立して-R^{X}に関して定義された通りである)。

（付記６）

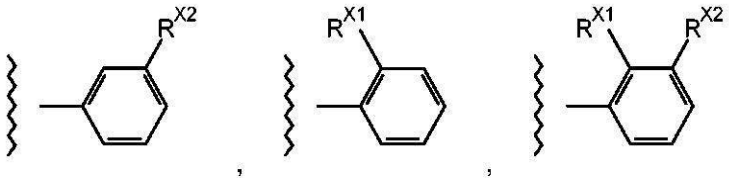
-A^Cが、存在する場合、独立して以下から選択される、付記1から3のいずれか一項に記載の化合物:
【化４０】



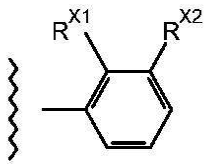
(式中、-R^{X1}、-R^{X2}、及び-R^{X3}の各々は、独立して-R^Xに関して定義された通りである)。
（付記７）
-A^Cが、存在する場合、以下である、付記1から3のいずれか一項に記載の化合物:
【化４１】



(式中、-R^{X2}は、独立して-R^Xに関して定義された通りである)。
（付記８）
-A^Cが、存在する場合、独立して以下から選択される、付記1から3のいずれか一項に記載の化合物:
【化４２】



(式中、-R^{X1}及び-R^{X2}の各々は、独立して-R^Xに関して定義された通りである)。
（付記９）
-A^Cが、存在する場合、以下である、付記1から3のいずれか一項に記載の化合物:
【化４３】



(式中、-R^{X1}及び-R^{X2}の各々は、独立して-R^Xに関して定義された通りである)。
（付記１０）
-A^Hが、存在する場合、$C_{5\sim6}$ヘテロアリール又は$C_{9\sim10}$ヘテロアリールであり、1つ以上の置換基-R^Xにより置換されていてもよい、付記1から9のいずれか一項に記載の化合物。
（付記１１）
-A^Hが、存在する場合、フラニル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、インドリル、ベンゾイミダゾリル、インダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、キノリニル、イソキノリニル、シンノリニル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、又はベンゾピラニルであり、1つ以上の置換基-

R^Xにより置換されていてもよい、付記1から9のいずれか一項に記載の化合物。
（付記１２）
$-A^H$が、存在する場合、ピリジル、フラニル、チエニル、又はキノリニルであり、1つ以上の置換基$-R^X$により置換されていてもよい、付記1から9のいずれか一項に記載の化合物。
（付記１３）
$-R^X$の各々が、存在する場合、独立して:
$-R^{XX}$、$-R^{XXU}$、$-R^{XXV}$、$-R^{XXH}$、
-F、-Cl、-Br、-I、
$-OH$、$-OR^{XX}$、
$-CF_3$、$-OCF_3$、
$-NH_2$、$-NHR^{XX}$、$-NR^{XX}{}_2$、$-R^{XM}$、
$-C(=O)OH$、$-C(=O)OR^{XX}$、$-OC(=O)R^{XX}$、
$-C(=O)NH_2$、$-C(=O)NHR^{XX}$、$-C(=O)NR^{XX}{}_2$、$-C(=O)R^{XM}$、
$-NHC(=O)R^{XX}$、$-NR^{XN}C(=O)R^{XX}$、
$-C(=O)R^{XX}$、
$-S(=O)NH_2$、$-S(=O)NHR^{XX}$、$-S(=O)NR^{XX}{}_2$、$-S(=O)R^{XM}$、
$-S(=O)_2NH_2$、$-S(=O)_2NHR^{XX}$、$-S(=O)_2NR^{XX}{}_2$、$-S(=O)_2R^{XM}$、
$-NHS(=O)R^{XX}$、$-NR^{XN}S(=O)R^{XX}$、
$-NHS(=O)_2R^{XX}$、$-NR^{XN}S(=O)_2R^{XX}$、
$-S(=O)R^{XX}$、$-S(=O)_2R^{XX}$、
$-SR^{XX}$、-CN、及び$-NO_2$
から選択される、付記1から12のいずれか一項に記載の化合物。
（付記１４）
$-R^X$の各々が、存在する場合、独立して:
$-R^{XX}$、$-R^{XXU}$、$-R^{XXV}$、
-F、-Cl、-Br、-I、
$-OH$、$-OR^{XX}$、
$-CF_3$、$-OCF_3$、
$-NH_2$、$-NHR^{XX}$、$-NR^{XX}{}_2$、$-R^{XM}$、
$-C(=O)OH$、$-C(=O)OR^{XX}$、$-OC(=O)R^{XX}$、
$-SR^{XX}$、-CN、及び$-NO_2$
から選択される、付記1から12のいずれか一項に記載の化合物。
（付記１５）
$-R^X$の各々が、存在する場合、独立して:
$-R^{XX}$、
-F、-Cl、-Br、-I、
$-OH$、$-OR^{XX}$、
$-CF_3$、及び$-OCF_3$
から選択される、付記1から12のいずれか一項に記載の化合物。
（付記１６）
$-R^1$が$-R^{11}$である、付記1から15のいずれか一項に記載の化合物。
（付記１７）
$-R^{11}$が、存在する場合、$-R^{11A}$である、付記1から16のいずれか一項に記載の化合物。
（付記１８）
$-R^{11A}$が、存在する場合、独立して$-R^{A1}$、$-R^{A4}$、$-L^A-R^{A4}$、又は$-L^A-R^{A5}$である、付記1から17のいずれか一項に記載の化合物。
（付記１９）
$-R^{11A}$が、存在する場合、$-R^{A1}$である、付記1から17のいずれか一項に記載の化合物。
（付記２０）

-R^{A1}の各々が、存在する場合、独立して-Me、-Et、-nPr、-iPr、-nBu、-iBu、-sBu、又は-tBuであり;1つ以上の基-R^{AA2}で置換されていてもよい、付記1から19のいずれか一項に記載の化合物。

（付記２１）

-R^{A1}の各々が、存在する場合、-iBuであり;1つ以上の基-R^{AA2}により置換されていてもよい、付記1から19のいずれか一項に記載の化合物。

（付記２２）

-R^{A1}の各々が、存在する場合、-iPrであり;1つ以上の基-R^{AA2}により置換されていてもよい、付記1から19のいずれか一項に記載の化合物。

（付記２３）

-R^{A1}の各々が、存在する場合、独立して-Me、-Et、-nPr、-iPr、-nBu、-iBu、-sBu、又は-tBuである、付記1から19のいずれか一項に記載の化合物。

（付記２４）

-R^{A1}の各々が、存在する場合、-iBuである、付記1から19のいずれか一項に記載の化合物。

（付記２５）

-R^{A1}の各々が、存在する場合、-iPrである、付記1から19のいずれか一項に記載の化合物。

（付記２６）

-R^{2}が-Hである、付記1から25のいずれか一項に記載の化合物。

（付記２７）

以下の式の化合物:ANASA-001からANASA-075、並びにその薬学的に許容される塩、水和物、及び溶媒和物から選択される、付記1に記載の化合物。

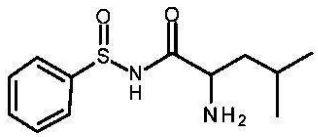
（付記２８）

以下の式の化合物:ANASA-001; ANASA-002; ANASA-003; ANASA-004; ANASA-007; ANASA-012; ANASA-021; ANASA-024; ANASA-025; ANASA-026; ANASA-027; ANASA-028; ANASA-029; ANASA-030; ANASA-036; ANASA-040; ANASA-043; ANASA-044; ANASA-050; ANASA-052; ANASA-053; ANASA-054; ANASA-055; ANASA-056; ANASA-057; ANASA-058; ANASA-059; ANASA-060; ANASA-061; ANASA-062; ANASA-063; ANASA-064; ANASA-065; ANASA-066; ANASA-067; ANASA-068; ANASA-069; ANASA-070; ANASA-071; ANASA-072; ANASA-073; ANASA-074; ANASA-075、並びにその薬学的に許容される塩、水和物、及び溶媒和物から選択される、付記1に記載の化合物。

（付記２９）

以下の式の化合物、並びにその薬学的に許容される塩、水和物、及び溶媒和物から選択される、付記1に記載の化合物:

【化４４】



（付記３０）

スルホキシド基の一部を形成する硫黄原子が、(R)配置にある、付記1から29のいずれか一項に記載の化合物。

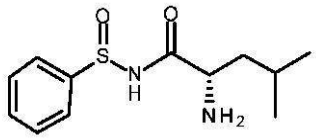
（付記３１）

スルホキシド基の一部を形成する硫黄原子が、(S)配置にある、付記1から29のいずれか一項に記載の化合物。

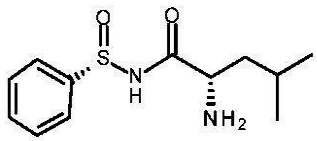
（付記３２）

-R^{1}及び-R^{2}が結合している炭素原子が、(R)配置にある、付記1から31のいずれか一項に

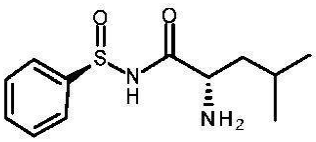
記載の化合物。
（付記３３）
-R^1及び-R^2が結合している炭素原子が、(S)配置にある、付記1から31のいずれか一項に記載の化合物。
（付記３４）
スルホキシド基の一部を形成する硫黄原子が、(R)配置にあり;
-R^1及び-R^2が結合している炭素原子が、(S)配置にある、付記1から29のいずれか一項に記載の化合物。
（付記３５）
スルホキシド基の一部を形成する硫黄原子が、(S)配置にあり;
-R^1及び-R^2が結合している炭素原子が、(S)配置にある、付記1から29のいずれか一項に記載の化合物。
（付記３６）
以下の式の化合物、並びにその薬学的に許容される塩、水和物、及び溶媒和物から選択される、付記1に記載の化合物:
【化４５】



（付記３７）
以下の式の化合物、並びにその薬学的に許容される塩、水和物、及び溶媒和物から選択される、付記1に記載の化合物:
【化４６】



（付記３８）
以下の式の化合物、並びにその薬学的に許容される塩、水和物、及び溶媒和物から選択される、付記1に記載の化合物:
【化４７】



（付記３９）
付記1から38のいずれか一項に記載の化合物、及び薬学的に許容される担体又は希釈剤を含む医薬組成物。
（付記４０）
付記1から38のいずれか一項に記載の化合物、及び薬学的に許容される担体又は希釈剤を混合するステップを含む、医薬組成物の調製方法。
（付記４１）
有効量の付記1から38のいずれか一項に記載の化合物をシンセターゼに接触させるステ

ップを含む、インビトロ又はインビボで細菌アミノアシル-tRNAシンセターゼを阻害する方法。
（付記４２）
有効量の付記1から38のいずれか一項に記載の化合物を細胞に接触させるステップを含む、インビトロ又はインビボで細胞における細菌アミノアシル-tRNAシンセターゼ機能を阻害する方法。
（付記４３）
治療によるヒト又は動物の身体の処置方法において使用するための、付記1から38のいずれか一項に記載の化合物。
（付記４４）
細菌アミノアシル-tRNAシンセターゼの阻害により改善されるヒト又は動物の身体の障害の処置方法において使用するための、付記1から38のいずれか一項に記載の化合物。
（付記４５）
細菌アミノアシル-tRNAシンセターゼの阻害により改善されるヒト又は動物の身体の障害を処置するための医薬の製造における、付記1から38のいずれか一項に記載の化合物の使用。
（付記４６）
治療有効量の付記1から38のいずれか一項に記載の化合物を、処置を必要とする対象に投与するステップを含む、細菌アミノアシル-tRNAシンセターゼの阻害により改善されるヒト又は動物の身体の障害の処置方法。
（付記４７）
細菌感染の処置方法において使用するための、付記1から38のいずれか一項に記載の化合物。
（付記４８）
細菌感染を処置するための医薬の製造における、付記1から38のいずれか一項に記載の化合物の使用。
（付記４９）
ヒト又は動物の身体の障害の処置方法であって、治療有効量の付記1から38のいずれか一項に記載の化合物を、処置を必要とする対象に投与するステップを含み、障害が細菌感染である方法。
（付記５０）
細菌がグラム陽性細菌である、付記47に記載の使用のための化合物、付記48に記載の使用、又は付記49に記載の方法。
（付記５１）
細菌がグラム陰性細菌である、付記47に記載の使用のための化合物、付記48に記載の使用、又は付記49に記載の方法。
（付記５２）
細菌が好気性細菌である、付記47に記載の使用のための化合物、付記48に記載の使用、又は付記49に記載の方法。
（付記５３）
細菌が嫌気性細菌である、付記47に記載の使用のための化合物、付記48に記載の使用、又は付記49に記載の方法。
（付記５４）
細菌が細胞内細菌である、付記47に記載の使用のための化合物、付記48に記載の使用、又は付記49に記載の方法。
（付記５５）
細菌が、
ブドウ球菌、例えば黄色ブドウ球菌(S. aureus);
腸球菌、例えばエンテロコッカス・フェカリス(E. faecalis);
連鎖球菌、例えば肺炎連鎖球菌(S. pneumoniae);

ヘモフィルス属、例えばインフルエンザ菌(H. influenza);
モラクセラ属、例えばモラクセラ・カタラーリス(M. catarrhalis);
エシェリキア属、例えば大腸菌(E. coli);
マイコバクテリア、例えば結核菌(M. tuberculosis);
クラミジア属、例えばクラミジア・トラコマティス(C. trachomatis);
リケッチア属、例えば発疹チフスリッケチア(R. prowazekii);又は
マイコプラズマ属、例えば肺炎マイコプラズマ(M. pneumoniae)
である、付記47に記載の使用のための化合物、付記48に記載の使用、又は付記49に記載の方法。
（付記５６）
感染が、
中枢神経系感染;
外耳感染;
急性中耳炎を含む中耳感染;
硬膜静脈洞の感染;
眼感染;
歯、歯肉若しくは粘膜の感染を含む口腔感染;
上気道感染;
下気道感染;
尿生殖器感染;
尿路感染;
腹腔内感染;
胃腸感染;
婦人科感染;
敗血症、
骨若しくは関節の感染;
皮膚若しくは皮膚構造の感染;
細菌性心内膜炎;又は
熱傷感染
である、付記47及び50から55のいずれか一項に記載の使用のための化合物、付記48及び50から55のいずれか一項に記載の使用、又は付記49から55のいずれか一項に記載の方法。