



(12) Translation of
european patent specification

(11) NO/EP 2678349 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07H 17/08 (2006.01)
A61K 31/7048 (2006.01)
A61P 31/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2016.04.18
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2016.01.13
(86)	European Application Nr.	12749570.3
(86)	European Filing Date	2012.02.20
(87)	The European Application's Publication Date	2014.01.01
(30)	Priority	2011.02.21, JP, 2011034578
(84)	Designated Contracting States:	AL AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MK MT NL NO PL PT RO RS SE SI SK SM TR
	Designated Extension States:	BA ME
(73)	Proprietor	Taisho Pharmaceutical Co., Ltd., 24-1, Takada 3-chome Toshima-ku, Tokyo 170-8633, JP-Japan
(72)	Inventor	SUGIMOTO, Tomohiro, c/o TAISHO PHARMACEUTICAL CO. LTD.24-1 Takada 3-chomeToshima-ku, Tokyo 170-8633, JP-Japan SASAMOTO, Naoki, c/o TAISHO PHARMACEUTICAL CO. LTD.24-1 Takada 3-chomeToshima-ku, Tokyo 170-8633, JP-Japan KUROSAKA, Jun, c/o TAISHO PHARMACEUTICAL CO. LTD.24-1 Takada 3-chomeToshima-ku, Tokyo 170-8633, JP-Japan HAYASHI, Masato, c/o TAISHO PHARMACEUTICAL CO. LTD.24-1 Takada 3-chomeToshima-ku, Tokyo 170-8633, JP-Japan YAMAMOTO, Kanako, c/o TAISHO PHARMACEUTICAL CO. LTD.24-1 Takada 3-chomeToshima-ku, Tokyo 170-8633, JP-Japan KASHIMURA, Masato, c/o TAISHO PHARMACEUTICAL CO. LTD.24-1 Takada 3-chomeToshima-ku, Tokyo 170-8633, JP-Japan USHIKI, Yasunobu, c/o TAISHO PHARMACEUTICAL CO. LTD.24-1 Takada 3-chomeToshima-ku, Tokyo 170-8633, JP-Japan OGITA, Haruhisa, c/o TAISHO PHARMACEUTICAL CO. LTD.24-1 Takada 3-chomeToshima-ku, Tokyo 170-8633, JP-Japan MIURA, Tomoaki, c/o MEIJI SEIKA PHARMA CO. LTD.760 Morooka-choKouhoku-ku, Yokohama-shi, Kanagawa 222-8567, JP-Japan KANEMOTO, Kenichi, c/o MEIJI SEIKA PHARMA CO. LTD.760 Morooka-choKouhoku-ku, Yokohama-shi, Kanagawa 222-8567, JP-Japan KUMURA, Kou, c/o MEIJI SEIKA PHARMA CO. LTD.760 Morooka-choKouhoku-ku, Yokohama-shi, Kanagawa 222-8567, JP-Japan YOSHIDA, Satoshi, c/o MEIJI SEIKA PHARMA CO. LTD.760 Morooka-choKouhoku-ku, Yokohama-shi, Kanagawa 222-8567, JP-Japan TAMURA, Keiji, c/o MEIJI SEIKA PHARMA CO. LTD.760 Morooka-choKouhoku-ku, Yokohama-shi, Kanagawa 222-8567, JP-Japan SHITARA, Eiki, c/o MEIJI SEIKA PHARMA CO. LTD.760 Morooka-choKouhoku-ku, Yokohama-shi, Kanagawa 222-8567, JP-Japan
(74)	Agent or Attorney	Zacco Norway AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54) Title **C-4" POSITION SUBSTITUTED MACROLIDE DERIVATIVE**

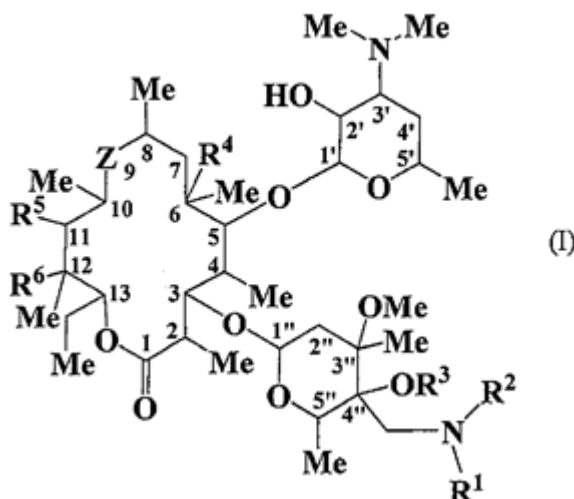
(56) References Cited: WO-A1-98/09978, WO-A1-98/56801, WO-A1-2008/106224

Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

Patentkrav

1. Forbindelse representert ved formelen (I):

[Formel 1]



5 hvori, i formelen,

Me representerer en metylgruppe,

R¹ representerer en C₁₋₆-alkylgruppe (C₁₋₆-alkylgruppen kan være substituert med én eller to substituerter valgt fra en hydroksygruppe, en C₁₋₆-alkoksygruppe, aminogruppe, en C₁₋₆-alkylaminogruppe og en gruppe representert ved formelen -NR⁷⁸COR⁷⁹ eller formelen-NR⁸⁰SO₂R⁸¹, R⁷⁸ og R⁸⁰, som kan være like eller forskjellige, representerer et hydrogenatom eller en C₁₋₆-alkylgruppe, og R⁷⁹ og R⁸¹, som kan være like eller forskjellige, representerer en C₁₋₆-alkylgruppe) eller en C₁₋₆-alkylsulfonylgruppe,

R² representerer en 4- til 8-leddet mettet heterosyklisk gruppe (den mettede heterosykliske gruppen kan være substituert med én eller to substituerter valgt fra en C₇₋₁₂-aralkylgruppe og en C₁₋₆-alkylgruppe), en C₁₋₆-alkanoylgruppe (C₁₋₆-alkanoylgruppen kan være substituert med en aminogruppe eller en C₁₋₆-alkylaminogruppe) eller en C₁₋₆-alkylgruppe som kan være substituert med 1 til 3 substituerter valgt fra substituentgruppe 1, eller

R¹ og R² kan kombineres med hverandre for å danne, sammen med nitrogenomet til hvilket de er bundet, en 4- til 8-leddet mettet nitrogenholdig heterosyklisk gruppe (den mettede nitrogenholdige heterosykliske gruppen kan være substituert med 1 til 3 substituerter valgt fra en hydroksygruppe, aminogruppe, en C₁₋₆-alkylaminogruppe og en C₁₋₆-alkylgruppe (C₁₋₆-alkylgruppen kan være substituert med en aminogruppe eller en C₁₋₆-alkylaminogruppe)), substituentgruppe 1 er en gruppe bestående av en C₁₋₆-alkylsulfonylgruppe, en C₁₋₆-alkoksygruppe, en C₃₋₆-sykloalkylgruppe,

- hydroksygruppe, fenylgruppe (fenylgruppen kan være substituert med 1 til 3 C₁₋₆-alkoksygrupper), en 4- til 8-leddet mettet heterosyklisk gruppe (den mettede heterosykliske gruppen kan være substituert med 1 til 3 C₁₋₆-alkylgrupper) og en gruppe representert ved formelen -CONR⁷R⁸, formelen -SO₂NR⁹R¹⁰, formelen -NR¹¹COR¹², formelen -NR¹³CO₂R¹⁴, formelen -NR¹⁵SO₂R¹⁶ eller formelen -NR¹⁷R¹⁸, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹³, R¹⁴ og R¹⁵, som kan være like eller forskjellige, representerer et hydrogenatom eller en C₁₋₆-alkylgruppe, R¹² representerer en fenylgruppe (fenylgruppen kan være substituert med 1 til 3 C₁₋₆-alkoksygrupper),
- 10 R¹⁶ representerer en C₁₋₆-alkoksygruppe eller fenylgruppe (fenylgruppen kan være substituert med 1 til 3 C₁₋₆-alkoksygrupper), R¹⁷ og R¹⁸, som kan være like eller forskjellige, representerer et hydrogenatom, en C₁₋₆-alkylgruppe (C₁₋₆-alkylgruppen kan være substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra en hydroksygruppe, en C₁₋₆-alkoksygruppe og en C₃₋₆-sykloalkylgruppe), en C₂₋₆-alkenylgruppe, en C₃₋₆-sykloalkylgruppe, en C₁₋₆-alkanoylgruppe, en C₇₋₁₂-aralkylgruppe (C₇₋₁₂-aralkylgruppen kan være substituert med 1 til 3 C₁₋₆-alkoksygrupper) eller en heteroaralkylgruppe (heteroaralkylgruppen kan være substituert med 1 til 3 C₁₋₆-alkoksygrupper), eller
- 20 R¹⁷ og R¹⁸ kan kombineres med hverandre for å danne, sammen med nitrogenatomet til hvilket de er bundet, en 4- til 8-leddet mettet nitrogenholdig heterosyklisk gruppe som kan være substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra substituentgruppe 2, eller en 6-leddet delvis mettet nitrogenholdig heterosyklisk gruppe som kan være substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra substituentgruppe 2,
- 25 substituentgruppe 2 er en gruppe bestående av en hydroksygruppe, en C₁₋₆-alkoksygruppe, oksogruppe, en C₁₋₆-alkoksyiminogruppe, aminogruppe, en C₁₋₆-alkylaminogruppe, en gruppe representert ved formelen -CONR¹⁹R²⁰ (R¹⁹ og R²⁰, som kan være like eller forskjellige, representerer et hydrogenatom eller en C₁₋₆-alkylgruppe), en C₁₋₆-haloalkylgruppe og en C₁₋₆-alkylgruppe (C₁₋₆-alkylgruppen kan være substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra en hydroksygruppe, en C₁₋₆-alkoksygruppe, aminogruppe og en C₁₋₆-alkylaminogruppe), R³ representerer et hydrogenatom eller
- 30 R³ og R¹ kan kombineres med hverandre for å danne en karbonylgruppe, R⁴ representerer en hydroksygruppe, en C₁₋₆-alkoksygruppe eller en gruppe representert ved formelen OCONR²¹R²² (R²¹ og R²², som kan være like eller
- 35

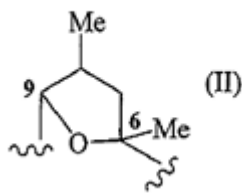
forskjellige, representerer et hydrogenatom, en C₁₋₆-alkylgruppe eller en C₂₋₆-alkenylgruppe substituert med én heteroarylgruppe),

Z representerer en gruppe representert ved formelen CHR²³ (R²³ representerer en hydroksygruppe eller en aminogruppe), formelen C(=O) eller formelen C(=N-OR²⁴),

R²⁴ representerer et hydrogenatom, en C₁₋₆-alkylgruppe (C₁₋₆-alkylgruppen kan være substituert med en C₁₋₆-alkoksygruppe, aminogruppe eller en C₁₋₆-alkylaminogruppe) eller en 4- til 8-leddet mettet heterosyklisk gruppe, eller

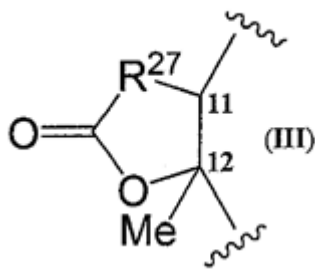
R⁴ og Z kan kombineres med hverandre for å representere, sammen med karbonatomene til hvilke de binder, en syklisk struktur representert ved formelen (II):

[Formel 2]



R⁵ og R⁶ kombineres med hverandre for å representere, sammen med karbonatomene til hvilke de binder, en syklisk struktur representert ved formelen (III):

[Formel 3]



R²⁷ representerer et oksygenatom eller en gruppe representert ved formelen CHR²⁸ eller formelen NR²⁹,

R²⁸ representerer et hydrogenatom, en cyanogruppe eller en C₁₋₆-alkylsulfanylggruppe (C₁₋₆-alkylsulfanylggruppen kan være substituert med en heteroarylgruppe som kan være substituert med én aminogruppe),

R²⁹ representerer et hydrogenatom, en hydroksygruppe, en C₁₋₆-alkoksygruppe (C₁₋₆-alkoksygruppen kan være substituert med en fenylgruppe), en 4- til 8-leddet mettet heterosyklisk gruppe (den mettede heterosykliske gruppen kan være substituert med en C₁₋₆-alkylsulfonylggruppe eller difenylmetylgruppe), en gruppe representert ved formelen -NR³⁰R³¹, formelen -NR³²CSNR³³R³⁴, formelen -NR³²CO₂R³⁵, formelen -NR³²COR³⁶, formelen -NR³²SO₂R³⁷, formelen -

$\text{NR}^{32}\text{CONR}^{38}\text{R}^{39}$, formelen $-\text{NR}^{32}\text{SO}_2\text{NR}^{40}\text{R}^{41}$ eller formelen $-\text{N}=\text{C}-\text{NR}^{42}\text{R}^{43}$ eller en C_{1-6} -alkylgruppe som kan være substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra substituengruppe 3,

R^{30} og R^{31} , som kan være like eller forskjellige, representerer et hydrogenatom eller en C_{1-6} -alkylgruppe (C_{1-6} -alkylgruppen kan være substituert med en C_{1-6} -alkylsulfonylgruppe, fenylgruppe eller en heteroarylgruppe),

R^{32} , R^{33} , R^{34} , R^{37} , R^{40} , R^{41} , R^{42} og R^{43} , som kan være like eller forskjellige, representerer et hydrogenatom eller en C_{1-6} -alkylgruppe,

R^{35} representerer et hydrogenatom, en C_{1-6} -alkylgruppe eller en C_{7-12} -aralkylgruppe,

R^{36} representerer et hydrogenatom, en C_{1-6} -alkylgruppe (C_{1-6} -alkylgruppen kan være substituert med en C_{1-6} -alkylsulfonylgruppe) eller en C_{7-12} -aralkylgruppe,

R^{38} og R^{39} , som kan være like eller forskjellige, representerer et hydrogenatom, en C_{1-6} -alkylgruppe (C_{1-6} -alkylgruppen kan være substituert med en C_{3-6} -sykloalkylgruppe), en C_{2-6} -alkenylgruppe, en C_{7-12} -aralkylgruppe (C_{7-12} -aralkylgruppen kan være substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra et halogenatom, en C_{1-6} -alkylgruppe og en C_{1-6} -alkoksygruppe) eller en heteroaralkylgruppe,

substituentgruppe 3 er en gruppe bestående av en hydroksygruppe, en C_{1-6} -alkoksygruppe, en C_{3-6} -sykloalkylgruppe, en C_{1-6} -alkylsulfonylgruppe, en C_{1-6} -alkylsulfonylgruppe, fenylgruppe, fenoksygruppe, benzyloksygruppe, fenylsulfonylgruppe, fenylsulfonylgruppe, cyanogruppe, en C_{7-12} -aralkylgruppe, en 4- til 8-leddet mettet heterosyklisk gruppe (den mettede heterosykliske gruppen kan være substituert med en C_{1-6} -alkylsulfonylgruppe

eller difenylmetylgruppe), en heteroarylgruppe (heteroarylgruppen kan være substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra en C_{1-6} -alkylgruppe, en C_{7-12} -aralkylgruppe, fenylgruppe og en heteroarylgruppe), og en gruppe representert ved formelen $-\text{NR}^{44}\text{CO}_2\text{R}^{45}$, formelen $-\text{OSO}_2\text{NR}^{46}\text{R}^{47}$, formelen $-\text{NR}^{49}\text{SO}_2\text{NR}^{50}\text{R}^{51}$, formelen $-\text{CONR}^{52}\text{SO}_2\text{NR}^{53}\text{R}^{54}$, formelen $-\text{OCONR}^{55}\text{R}^{56}$, formelen $-\text{NR}^{57}\text{COR}^{58}$, formelen $-\text{CONR}^{59}\text{R}^{80}$, formelen $-\text{NR}^{61}\text{CONR}^{62}\text{R}^{63}$, formelen $-\text{OCOR}^{64}$, formelen $-\text{SO}_2\text{NR}^{65}\text{R}^{66}$, formelen $-\text{NR}^{67}\text{SO}_2\text{R}^{68}$, formelen $-\text{NR}^{69}\text{R}^{70}$ eller formelen $-\text{CONR}^{71}\text{SO}_2\text{R}^{72}$,

R^{44} til R^{57} , R^{61} , R^{67} , R^{71} og R^{72} , som kan være like eller forskjellige, representerer et hydrogenatom eller en C_{1-6} -alkylgruppe,

R^{58} representerer en C_{1-6} -alkylgruppe, en C_{1-6} -haloalkylgruppe eller fenylgruppe,

R^{59} og R^{60} , som kan være like eller forskjellige, representerer et hydrogenatom, en C_{1-6} -alkylgruppe, fenylgruppe, en C_{7-12} -aralkylgruppe eller en heteroaralkylgruppe,

R^{62} og R^{63} , som kan være like eller forskjellige, representerer et hydrogenatom eller en C_{1-6} -alkylgruppe (C_{1-6} -alkylgruppen kan være substituert med en aminogruppe eller en C_{1-6} -alkylaminogruppe),

R^{64} representerer en C_{1-6} -alkylgruppe eller fenylgruppe,

R^{65} og R^{56} , som kan være like eller forskjellige, representerer et hydrogenatom, en C_{1-6} -alkylgruppe eller fenylgruppe,

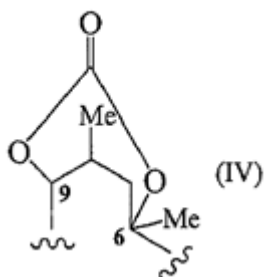
R^{68} representerer en C_{1-6} -alkylgruppe, en C_{1-6} -haloalkylgruppe, en C_{3-6} -sykloalkylgruppe, fenylgruppe (fenylgruppen kan være substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra en C_{1-6} -alkylgruppe, en C_{1-6} -alkylsufonylgruppe, en C_{1-6} -alkoksygruppe, cyanogruppe og karboksygruppe) eller en heteroarylgruppe som kan være substituert med 1 til 3 C_{1-6} -alkylgrupper,

R^{69} og R^{70} , som kan være like eller forskjellige, representerer et hydrogenatom, en C_{1-6} -alkylgruppe, fenylgruppe, en heteroarylgruppe som kan være substituert med én cyanogruppe, en C_{7-12} -aralkylgruppe eller en heteroaralkylgruppe, eller

R^{69} og R^{70} kan kombineres med hverandre for å danne, sammen med nitrogenetatomet til hvilket de er bundet, en 4- til 8-leddet mettet nitrogenholdig heterosyklisk gruppe (den mettede nitrogenholdige heterosykliske gruppen kan være substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra en C_{1-6} -alkylgruppe og oksogruppe),

når R^{27} er et oksygenatom, kan R^4 og Z kombineres med hverandre for å representere, sammen med karbonatomene til hvilke de binder, en sykklisk struktur representert ved formelen (IV):

[Formel 4]

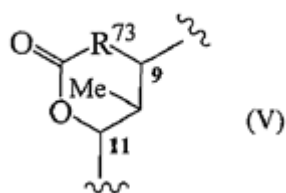


eller

R^5 og Z kan kombineres med hverandre for å representere en sykklisk struktur representert ved formelen (V);

6

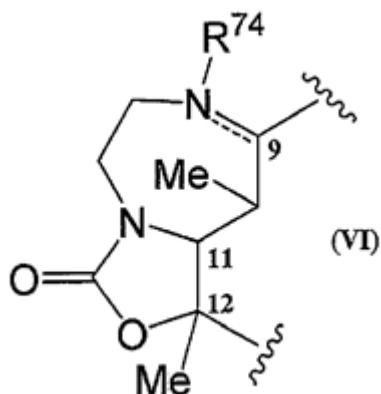
[Formel 5]



R^{73} representerer et oksygenatom eller en gruppe representert ved formelen NH eller

R^5 , R^6 og Z kan kombineres med hverandre for å representere en syklisk struktur representert ved formelen (VI):

[Formel 6]

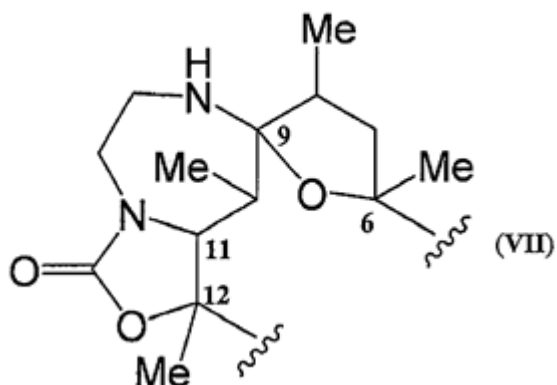


dobbelbindingen inneholdende en brutt linje representerer en enkeltbinding eller en dobbeltbinding, og

R^{74} eksisterer bare når dobbeltbindingen inneholdende en brutt linje er en enkeltbinding for å representere et hydrogenatom eller

R^5 , R^6 , Z og R^4 kan kombineres med hverandre for å representere en syklisk struktur representert ved formelen (VII):

[Formel 7]



eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav.

2. Forbindelsen ifølge krav 1 eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav, hvori R^1 er en C_{1-6} -alkylgruppe eller en C_{1-6} -alkylsulfonylgruppe,

R^2 er en 4- til 8-leddet mettet heterosyklisk gruppe (den mettede heterosykliske gruppen kan være substituert med én eller to substituenten valgt fra en C_{7-12} -aralkylgruppe og en C_{1-6} -alkylgruppe), en C_{1-6} -alkanoylgruppe (C_{1-6} -alkanoylgruppen kan være substituert med en aminogruppe eller en C_{1-6} -alkylaminogruppe) eller en C_{1-6} -alkylgruppe som kan være substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra substituentgruppe 1, eller

R^1 og R^2 kan kombineres med hverandre for å danne, sammen med nitrogenatomet til hvilket de er bundet, en 4- til 8-leddet mettet nitrogenholdig heterosyklisk gruppe (den mettede nitrogenholdige heterosykliske gruppen kan være substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra en hydroksygruppe, aminogruppe, en C_{1-6} -alkylaminogruppe og en C_{1-6} -alkylgruppe (C_{1-6} -alkylgruppen kan være substituert med en aminogruppe eller en C_{1-6} -alkylaminogruppe)), og

R^{38} og R^{39} , som kan være like eller forskjellige, representerer et hydrogenatom, en C_{1-6} -alkylgruppe (C_{1-6} -alkylgruppen kan være substituert med en C_{3-6} -sykloalkylgruppe), en C_{7-12} -aralkylgruppe (C_{7-12} -aralkylgruppen kan være substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra et halogenatom, en C_{1-6} -alkylgruppe og en C_{1-6} -alkoksygruppe) eller en heteroaralkylgruppe.

3. Forbindelsen ifølge krav 1 eller 2 eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav, hvori R^2 er en C_{1-6} -alkylgruppe substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra substituentgruppe 1.

4. Forbindelsen ifølge krav 1 eller 2 eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav, hvori R^2 er en C_{1-6} -alkylgruppe substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra substituentgruppe 4, og

substituentgruppe 4 er en gruppe bestående av en hydroksygruppe og en gruppe representert ved formelen $-NR^{17}R^{18}$.

5. Forbindelsen ifølge krav 4 eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav, hvori R^{17} og R^{18} , som kan være like eller forskjellige, representerer et hydrogenatom eller en C_{1-6} -alkylgruppe (C_{1-6} -alkylgruppen kan være substituert med en C_{3-6} -sykloalkylgruppe).

6. Forbindelsen ifølge krav 1 eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav, hvori R^{27} er en gruppe representert ved formelen NR^{29} .

5 7. Forbindelsen ifølge krav 6 eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav, hvori R^{29} er et hydrogenatom, en gruppe representert ved formelen - $NR^{30}R^{31}$, formelen - $NR^{32}CO_2R^{35}$ formelen - $NR^{32}SO_2R^{37}$, formelen - $NR^{32}CONR^{38}R^{39}$ eller formelen - $NR^{32}SO_2NR^{40}R^{41}$ eller en C_{1-6} -alkylgruppe substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra substituentgruppe 3.

10 8. Forbindelsen ifølge krav 6 eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav, hvori R^{29} er en C_{1-6} -alkylgruppe substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra substituentgruppe 5, og
substituentgruppe 5 er en gruppe bestående av en hydroksygruppe, en C_{1-6} -alkylsulfonylgruppe, en 4- til 8-leddet mettet heterosyklisk gruppe (den mettede
15 heterosykliske gruppen kan være substituert med en C_{1-6} -alkylsulfonylgruppe) og en gruppe representert ved formelen - $OSO_2NR^{46}R^{47}$, formelen - $NR^{49}SO_2NR^{50}R^{51}$, formelen - $CONR^{59}R^{60}$, formelen - $SO_2NR^{65}R^{66}$, formelen - $NR^{67}SO_2R^{68}$ eller formelen - $NR^{69}R^{70}$.

20 9. Forbindelsen ifølge krav 6 eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav, hvori R^{29} er en C_{1-6} -alkylgruppe substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra substituentgruppe 6, og
substituentgruppe 6 er en gruppe bestående av en C_{1-6} -alkylsulfonylgruppe og
en gruppe representert ved formelen - $OSO_2NR^{46}R^{47}$, formelen - $SO_2NR^{65}R^{66}$ eller
25 formelen - $NR^{67}SO_2R^{68}$.

10. Forbindelsen ifølge krav 6 eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav, hvori R^{29} er en C_{1-6} -alkylgruppe substituert med en C_{1-6} -alkylsulfonylgruppe.

30 11. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 10 eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav, hvori R^1 er en C_{1-6} -alkylgruppe.

35 12. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11 eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav, hvori R^4 er en hydroksygruppe eller en C_{1-6} -alkoksygruppe.

13. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11 eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav, hvori R^4 er en metoksygruppe.

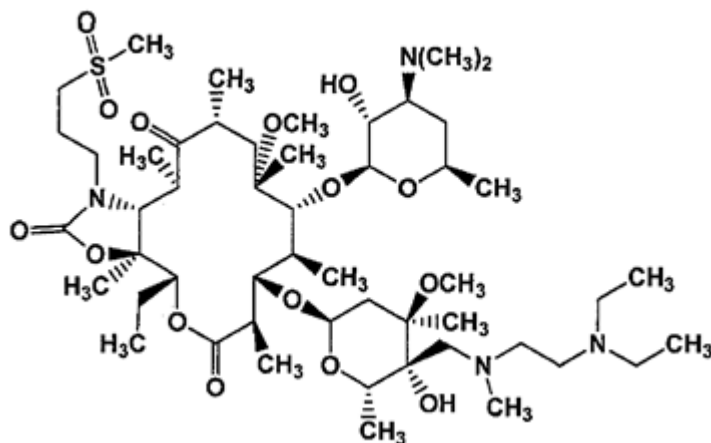
5 14. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 13 eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav, hvori R^3 er et hydrogenatom.

10 15. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 14 eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav, hvori Z er en gruppe representert ved formelen $C(=O)$ eller en gruppe representert ved formelen $C(=N-OR^{24})$.

16. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 14 eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav, hvori Z er en gruppe representert ved formelen $C(=O)$.

15 17. Forbindelsen ifølge krav 1 eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav, hvori R^1 er en C_{1-6} -alkylgruppe og
 hvori R^2 er en C_{1-6} -alkylgruppe substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra substituentgruppe 4, og substituentgruppe 4 er en gruppe bestående av en hydroksygruppe og en gruppe representert ved formelen $-NR^{17}R^{18}$, og hvori R^{17}
 20 og R^{18} , som kan være
 like eller forskjellige, representerer et hydrogenatom eller en C_{1-6} -alkylgruppe (C_{1-6} -alkylgruppe kan være substituert med en C_{3-6} -sykloalkylgruppe) og hvori R^{27} er en gruppe representert ved formelen NR^{29} , og R^{29} er en C_{1-6} -alkylgruppe
 25 substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra substituentgruppe 5, og substituentgruppe 5 er en gruppe bestående av en hydroksygruppe, en C_{1-6} -alkylsulfonylgruppe, en 4- til 8-leddet mettet heterosyklisk gruppe (den mettede heterosykliske gruppen kan være substituert med en C_{1-6} -alkylsulfonylgruppe) og en gruppe representert ved formelen $-OSO_2NR^{46}R^{47}$, formelen-
 $NR^{49}SO_2NR^{50}R^{51}$, formelen $-CONR^{59}R^{60}$, formelen $-SO_2NR^{65}R^{66}$, formelen-
 30 $NR^{67}SO_2R^{68}$ eller formelen $-NR^{69}R^{70}$.

18. Forbindelsen ifølge krav 1 representert ved følgende formel eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav.

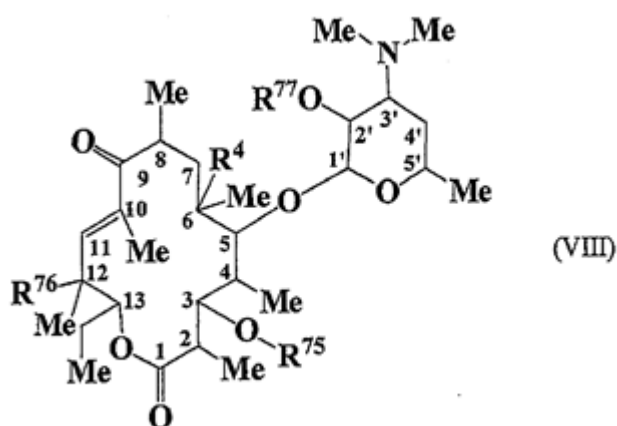


19. Medikament inneholdende et substrat valgt fra gruppen bestående av
5 forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 18, et salt derav, et
hydrat derav og et solvat derav som aktiv ingrediens.

20. Medikamentet ifølge krav 19, som brukes til profylakse og/eller terapeutisk
behandling av en infeksjonssykdom.

10

21. Forbindelse representert ved formelen (VIII): formel (VIII):
[Formel 8]

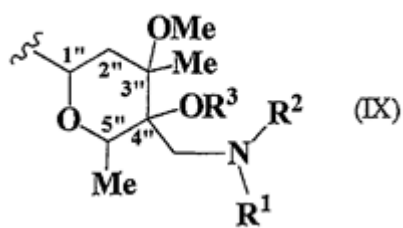


15

hvor, i formelen,

R^{75} representerer en gruppe representert ved formelen (IX):

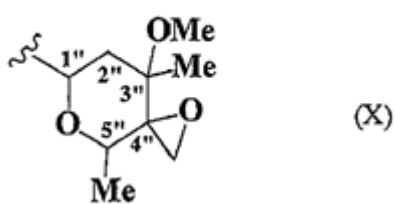
[Formel 9]



eller

en gruppe representert ved formelen (X):

[Formel 10]



- 5 R^{76} representerer en hydroksygruppe eller imidazolykarbonyloksygruppe,
 R^{77} representerer et hydrogenatom eller en beskyttende gruppe for en
hydroksygruppe, og
 R^1 , R^2 , R^3 , og R^4 har samme betydning som de som er definert i krav 1, eller et
salt derav,
10 eller et hydrat eller et solvat derav.

22. Forbindelsen ifølge krav 21 eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat
derav, hvori R^1 er en C_{1-6} -alkylgruppe eller en C_{1-6} -alkylsulfonylgruppe, og R^2 er
en 4- til 8-leddet mettet heterosyklisk gruppe (den mettede heterosykliske
15 gruppen kan være substituert med én eller to substituenten valgt fra en C_{7-12} -
aralkylgruppe og en C_{1-6} -alkylgruppe), en C_{1-6} -alkanoylgruppe (C_{1-6} -
alkanoylgruppen kan være substituert med en aminogruppe eller en C_{1-6} -
alkylaminogruppe), eller en C_{1-6} -alkylgruppe som kan være substituert med 1 til
3 substituenten valgt fra substituentgruppe 1, eller

20 R^1 og R^2 kan kombineres med hverandre for å danne, sammen med
nitrogenatomet til hvilket de er bundet, en 4- til 8-leddet mettet nitrogenholdig
heterosyklisk gruppe (den mettede nitrogenholdige heterosykliske gruppen kan
være substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra en hydroksygruppe,
aminogruppe, en C_{1-6} -alkylaminogruppe og en C_{1-6} -alkylgruppe (C_{1-6} -
25 alkylgruppen kan være substituert med en aminogruppe eller en C_{1-6} -
alkylaminogruppe)).

23. Forbindelsen ifølge krav 21 eller 22 eller et salt derav eller et hydrat eller et solvat derav, hvori R^{77} er en trimetylsilylgruppe, trietylsilylgruppe, t-butyldimetylsilylgruppe, acetylgruppe, propionylgruppe, benzoylgruppe, benzyloxykarbonylgruppe eller t-butyloxykarbonylgruppe.