1. Junginys, kurio formulė (III):



ir farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos, apsaugotos formos, solvatai ir hidratai, tokie kaip farmaciniu požiūriu priimtinos jo druskos ir hidratai.

kur:

-X- reiškia -C(O)-, -NHC(O)-, -OC(O)-, -CH2- arba -SO2-;

-R1 kartu su karbonilo grupe ir azoto alfa atomu prie anglies, prie kurios jis yra prijungtas, yra fenilalanino, leucino arba valino liekana;

-R2 kartu su karbonilo grupe ir azoto alfa atomu prie anglies, prie kurios jis yra prijungtas, yra leucino, izoleucino, fenilalanino, treonino, valino arba norvalino liekana;

-R3 kartu su karbonilo grupe ir azoto alfa atomu prie anglies, prie kurios jis yra prijungtas, yra treonino arba leucino liekana;

-R4 yra C1-6 alkilas, pakeistas viena hidroksilo grupe arba viena amino grupe;

-R15 yra grupė, kurios sudėtyje yra aminas:



kur:

-RA yra -LA-RAA arba vandenilis;

-Q- yra kovalentinė jungtis arba -CH(RB)-;

-RB yra vandenilis arba -LB-RBB;

arba, kai -Q- yra -CH(RB)-, -RA ir -RB kartu suformuoja 5-10 narių monociklinį arba biciklinį karbociklą, arba -RA ir -RB kartu suformuoja 5-10 narių monociklinį arba biciklinį heterociklą;

ir, kai -Q- yra kovalentinė jungtis, -RA yra -LA-RAA, ir, kai -Q- yra -CH(RB)-, vienas arba abu iš -RA ir -RB yra kitokie nei vandenilis;

-R16 nepriklausomai yra vandenilis arba C1-4 alkilas;

-R17 nepriklausomai yra vandenilis arba C1-4 alkilas;

arba -NR16R17 yra guanidino grupė;

arba -R17 ir -RA kartu suformuoja 5-10 narių monociklinį arba biciklinį heterociklą, kurio sudėtyje yra azotas;

arba, kai -Q- yra -CH(RB)-, -R17 ir -RB kartu suformuoja 5-10 narių monociklinį arba biciklinį heterociklą, kurio sudėtyje yra azotas;

ir, kur -R17 ir -RA kartu suformuoja monociklinį heterociklą, kurio sudėtyje yra azotas, kiekvienas žiedo anglies atomas -R17 ir -RA grupėse yra pasirinktinai mono- arba dipakeistas -RC, ir monociklinis heterociklas yra pakeistas mažiausiai viena grupe, pasirinkta iš -RC, -RN, -RNA ir -LB-RBB, ten, kur yra,

ir, kur -R17 ir -RB kartu suformuoja monociklinį heterociklą, kurio sudėtyje yra azotas, kiekvienas žiedo anglies atomas -R17 ir -RB grupėse yra pasirinktinai mono- arba dipakeistas -RC, ir monociklinis heterociklas yra pakeistas mažiausiai viena grupe, pasirinkta iš -RC ir -RN, ten, kur yra, arba monociklinis heterociklas yra pasirinktinai pakeistas, kai -RA yra -LA-RAA,

ir monocikliniame heterocikle, kurio sudėtyje yra azotas, pasirinktinai papildomai yra dar vienas azoto, deguonies arba sieros žiedo atomas, ir kur yra dar vienas žiedo azoto atomas, jis pasirinktinai yra pakeistas -RN, išskyrus kitą žiedo azoto atomą, kuris yra prijungtas prie anglies, kuri yra α prie grupės -X-, kur žiedo azoto atomas yra pasirinktinai pakeistas -RNA grupe;

kur -R17 ir -RA arba -R17 ir -RB kartu suformuoja biciklinį heterociklą, kurio sudėtyje yra azotas, kiekvienas žiedo anglies atomas -R17 ir -RA arba -R17 ir -RB grupėse yra pasirinktinai mono- arba dipakeistas -RD grupe;

ir bicikliniame žiedo, kuriame yra azotas, atomas heterocikle pasirinktinai turi vieną, du arba tris papildomus heteroatomus, kur kiekvienas heteroatomas yra nepriklausomai pasirinktas iš grupės, susidedančios iš azoto, deguonies ir sieros, ir kur yra daugiau žiedo azoto atomų, kiekvienas kitas žiedo azoto atomas yra pasirinktinai pakeistas -RN, išskyrus žiedo azoto atomą, kuris yra prijungtas prie anglies atomo, kuris yra α prie grupės -X-, kur žiedo azoto atomas yra pasirinktinai pakeistas -RNA grupe;

kur -RA ir -RB kartu suformuoja 5-10 narių monociklinį karbociklą arba heterociklą, kiekvienas žiedo anglies atomas -RA ir -RB grupėse yra pasirinktinai mono- arba dipakeistas -RC grupe, ir žiedo azoto atomas, kur toks yra monocikliniame heterocikle, yra pasirinktinai pakeistas -RN grupe, išskyrus žiedo azoto atomą, kuris yra prijungtas prie anglies atomo, kuris yra α prie grupės -X-, kur žiedo azoto atomas yra pasirinktinai pakeistas -RNA grupe;

kur -RA ir -RB kartu suformuoja 5-10 narių biciklinį karbociklą arba heterociklą, kiekvienas žiedo anglies atomas -RA ir -RB grupėse yra pasirinktinai mono- arba dipakeistas -RD grupe, ir žiedo azoto atomas, jei toks yra bicikliniame heterocikle, yra pasirinktinai pakeistas -RN grupe, išskyrus žiedo azoto atomą, kuris yra prijungtas prie anglies atomo, kuris yra α prie grupės -X-, kur žiedo azoto atomas yra pasirinktinai pakeistas -RNA grupe;

ir kur R17 ir -RA arba -R17 ir -RB kartu suformuoja 5-10 narių monociklinį arba biciklinį heterociklą, kurio sudėtyje yra azotas, arba kur -RA ir -RB kartu suformuoja 5-10 narių monociklinį arba biciklinį karbociklą, arba kartu suformuoja 5-10 narių monociklinį arba biciklinį heterociklą, žiedo anglies atomas -R17 ir -RA, -R17 ir -RB arba -RA ir -RB grupėse pasirinktinai yra pakeistas okso (=O) grupe;

kiekvienas -RC nepriklausomai yra -LC-RCC;

kiekvienas -RD nepriklausomai yra pasirinktas iš -RC, halogeno, -NO2, -OH ir -NH2;

kiekvienas -RN nepriklausomai yra -LN-RNN;

kiekviena -RNA nepriklausomai yra -RL-RNN arba -RNN;

-RAA, -RBB ir kiekvienas -RCC ir -RNN, ten, kur yra, yra nepriklausomai pasirinktas iš C1-12 alkilo, C3-10 cikloalkilo, C4-10 heterociklilo ir C5-12 arilo;

kiekvienas -LA- nepriklausomai yra kovalentinis ryšys arba jungiančioji grupė, pasirinkta iš -RL-\*, -O-LAA-\*, -OC(O)-LAA-\*, -N(R11)-LAA-\* ir -C (O)-LAA-\*, kur žvaigždutė nurodo grupės -LA- prijungimo prie -RAA vietą;

kiekvienas -LB- ir -LC- nepriklausomai yra kovalentinė jungtis arba jungiančioji grupė, pasirinkta iš -RL-\*, -O-LAA-\*, -OC(O)-LAA-\*, -N(R11)-LAA-\* , -N(R11)C(O)-LAA-\*, -C(O)-LAA-\*, -C(O)O-LAA-\* ir -C(O)N(R11)-LAA-\* ir pasirinktinai papildomai pasirinktas iš -N(R11)S(O)-LAA-\*, -N(R11)S(O)2-LAA-\*, -S(O)N(R11)-LAA-\* ir -S(O)2N(R11)-LAA-\*, kur žvaigždutė nurodo grupės -LB- prijungimo prie -RBB arba grupės -LC- prie -RCC vietą;

kiekvienas -LN- yra nepriklausomai kovalentinė jungtis arba grupė, pasirinkta iš -S(O)-LAA-\*, -S(O)2-LAA-\*, -C(O)-LAA-\* ir -C(O)N(R11)-LAA-\*, kur žvaigždutė nurodo grupės -LN- prijungimo prie -RNN vietą;

ir kiekvienas -LAA- yra nepriklausomai kovalentinė jungtis arba -RL-;

ir kiekvienas -RL- yra nepriklausomai pasirinktas iš C1-12 alkileno, C2-12 heteroalkileno, C3-10 cikloalkileno ir C5-10 heterociklileno, ir kur -LAA- yra prijungtas prie grupės C1-12 alkilo, -RL- nėra C1-12 alkilenas;

ir kiekviena C1-12 alkilo, C3-10 cikloalkilo, C4-10 heterociklilo, C5-12 arilo, C1-12 alkileno, C2-12 heteroalkileno, C3-10 cikloalkileno ir C5-10 heterociklileno grupė pasirinktinai yra pakeista, kur -RS yra pasirinktinas anglies pakaitas, ir -R12 yra pasirinktinas azoto pakaitas;

kiekvienas -RS yra nepriklausomai pasirinktas iš -OH, -OR12, -OC(O)R12, halogeno, -R12, -NHR12, -NR12R13, -NHC(O)R12, -N(R12)C(O)R12, -SH, -SR12, -C(O)R12, -C(O)OH, -C(O)OR12, -C(O)NH2, -C(O)NHR12 ir C(O)NR12R13, pavyzdžiui, kur kiekvienas -RS yra nepriklausomai pasirinktas iš -OR12, halogeno ir -R12; išskyrus tai, kad -R12 nėra C1-12 alkilo grupės pakaitas; arba kai anglies atomas yra dipakeistas -RS grupe, šios grupės kartu su anglimi, prie kurios jos yra prijungtos, gali sudaryti C3-6 karbociklą arba C5-6 heterociklą, kur karbociklas ir heterociklas pasirinktinai yra pakeisti viena arba daugiau -R12 grupių;

kiekvienas -R12 nepriklausomai yra C1-6 alkilas, C1-6 halogenalkilas, fenilas arba benzilas;

kiekvienas -R13 nepriklausomai yra C1-6 alkilas, C1-6 halogenalkilas, fenilas arba benzilas;

arba -R12 ir -R13, kai yra prijungti prie N, kartu gali sudaryti 5 arba 6 narių heterociklinį žiedą, kuris pasirinktinai yra pakeistas C1-6 alkilu, C1-6 halogenalkilu, fenilu arba benzilu;

kiekvienas -R11 yra nepriklausomai vandenilis arba C1-4 alkilas; ir -R8 yra vandenilis arba metilas.

2. Junginys pagal 1 punktą, kur:

(i) -X- yra -C(O)-; ir (arba)

(ii) -R8 yra metilas; ir (arba)

(iii) -R1 kartu su karbonilo grupe ir azoto alfa atomu prie anglies, prie kurios jis yra prijungtas, yra fenilalanino liekana arba leucino liekana; ir (arba)

(iv) -R2 kartu su karbonilo grupe ir azoto alfa atomu prie anglies, prie kurios jis yra prijungtas, yra leucino liekana; ir (arba)

(v) -R3 kartu su karbonilo grupe ir azoto alfa atomu prie anglies, prie kurios jis yra prijungtas, yra treonino liekana; ir (arba)

vi) -R4 kartu su karbonilo grupe ir azoto alfa atomu prie anglies, prie kurios jis yra prijungtas, yra α,γ-diaminosviesto rūgštis (Dab), serino liekana, treonino liekana, lizino liekana, ornitino liekana arba α,β-diaminpropiono rūgštis (Dap), pavyzdžiui, kur -R4 kartu su karbonilo grupe ir azoto alfa atomu prie anglies, prie kurios jis yra prijungtas, yra α,γ-diaminosviesto rūgštis (Dab) arba α,β-diaminpropiono (Dap), pavyzdžiui, L-Dab arba L-Dap; ir (arba)

(vii) -R16 yra vandenilis; ir (arba)

(viii) -R17 yra vandenilis.

3. Junginys pagal 1 arba 2 punktą, kur -R15 yra:



kur -RB yra -LB-RBB.

4. Junginys pagal 3 punktą, kur -LB- yra kovalentinė jungtis.

5. Junginys pagal 3 punktą, kur -LB- yra C1-12 alkilenas.

6. Junginys pagal bet kurį vieną iš 3-5 punktų, kur -RBB nepriklausomai yra grupė, pasirinkta iš C1-12 alkilo, C4-10 heterociklilo ir C5-12 arilo, ir kiekviena grupė pasirinktinai yra pakeista viena arba daugiau -RS grupių arba viena arba daugiau -RN grupių.

7. Junginys pagal 6 punktą, kur -RBB yra C1-12 alkilas, pasirinktinai pakeistas viena arba daugiau -RS grupių, pavyzdžiui, kur -RBB yra C1-12 alkilas.

8. Junginys pagal 6 punktą, kur -RBB yra C5-12 arilas, pasirinktinai pakeistas viena arba daugiau -RS grupių arba viena arba daugiau -RN grupių, pavyzdžiui, kur -RBB yra fenilas arba naftilas, pasirinktinai pakeistas viena arba daugiau -RS grupių.

9. Junginys pagal 1 arba 2 punktą, kur -R15 yra:



pavyzdžiui,



kur -RA yra -LA-RAA.

10. Junginys pagal 9 punktą, kur -LA- yra -RL-\* arba -O-LAA-\*.

11. Junginys pagal 10 punktą, kur -LAA- yra C1-12 alkilenas, pavyzdžiui, -CH2-.

12. Junginys pagal bet kurį vieną iš 9-11 punktų, kur -RAA yra C5-12 arilas, pasirinktinai pakeistas viena arba daugiau -RS grupių, arba viena arba daugiau -RN grupių, pavyzdžiui, kur -RAA yra fenilas, pasirinktinai pakeistas viena arba daugiau -RS grupių.

13. Farmacinė kompozicija, apimanti junginį pagal bet kurį vieną iš 1-12 punktų ir biologiškai priimtiną pagalbinę medžiagą, pasirinktinai kartu su antruoju aktyviuoju agentu.

14. Junginys pagal bet kurį vieną iš 1-12 punktų arba farmacinė kompozicija pagal 14 punktą, skirti panaudoti taikant gydymo būdą.

15. Junginys pagal bet kurį vieną iš 1-12 punktų arba farmacinė kompozicija pagal 14 punktą, skirti panaudoti taikant mikrobinės infekcijos gydymo būdą, tokį kaip gramneigiamos bakterinės infekcijos gydymo būdą, pavyzdžiui, kur gramneigiamos bakterijos yra pasirinktos iš grupės, susidedančios iš *Escherichia* spp., *Klebsiella* spp., *Enterobacter* spp., *Salmonella* spp., *Shigella* spp., *Citrobacter* spp., *Morganella morganii*, *Yersinia pseudotuberculosis* ir kitų *Enterobacteriaceae*, *Pseudomonas* spp., *Acinetobacter* spp., *Moraxella*, *Helicobacter*, *Stenotrophomonas*, *Bdellovibrio*, acto rūgšties bakterijų, *Legionella* ir alfa-proteobakterijų.