

【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】平成21年10月22日(2009.10.22)

【公表番号】特表2009-514894(P2009-514894A)

【公表日】平成21年4月9日(2009.4.9)

【年通号数】公開・登録公報2009-014

【出願番号】特願2008-539114(P2008-539114)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4184 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

C 0 7 D 403/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/04 C S P

C 0 7 D 403/04

A 6 1 K 31/4184

A 6 1 K 31/4439

C 0 7 D 403/14

A 6 1 K 31/506

C 0 7 D 401/14

A 6 1 K 31/444

A 6 1 P 31/04

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成21年9月3日(2009.9.3)

【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

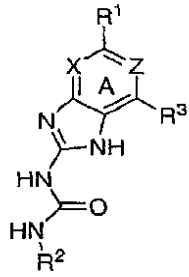
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

化学式 I の化合物：

【化 1】



I

または薬学的に許容されるその塩であって、

Zは窒素またはC - R⁴から選択され、

Xは窒素またはC - R⁴から選択され、

R¹はQ - R^xまたはR^yであって、

QはC₁ - C₆脂肪族であって、ここで3メチレン以下のQのユニットは、-NH-、-NR-、-O-、-S-、-CO₂-、-OC(O)-、-C(O)CO-、-C(O)-、-C(S)-、-C(O)NH-、-C(O)NR-、-C(=N-CN)、-NHCO-、-NRCO-、-NHC(O)O-、-NRC(O)O-、-SO₂NH-、-SO₂NR-、-NHSO₂-、-NRSO₂-、-NHC(O)NH-、-NRC(O)NH-、-NHC(O)NR-、-NRC(O)NR、-OC(O)NH-、-OC(O)NR-、-NHSO₂NH-、-NRSO₂NH-、-NHSO₂NR-、-NRSO₂NR-、-SO-、または-SO₂-によって任意にかつ独立して代替され、

Qは、任意に1個から3個の個別発生のR^Qで置換され、

Rは、C₁ - C₆脂肪族化合物、C₃ - C₁₀脂環式、C₃ - C₁₀脂環式、または3員環から8員環の飽和もしくは部分的に不飽和の単環、または5員環から6員環の単環のアリール環（各環は、窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される、0個から3個のヘテロ原子を持つ）から選択されるか；あるいは窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される、0個から5個のヘテロ原子を持つ8員環から12員環の飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和の二環系から選択され；前記単環または二環は、R^T、-T - Ar¹、ハロゲン、オキソ、チオキソ、-OR^T、-SR^T、-N(R^T)₂、-NO₂、-C₁ - C₄ハロアルキル、-C₁ - C₄ハロアルコキシ、-CN、-CO₂R^T、-COR^T、-CON(R^T)₂、-OCOR^T、-NR^TCOR^T、-SO₂R^T、-SO₂N(R^T)₂または-NR^TSO₂R^Tの1個から3個の個別発生で任意に置換され、

各R^Tは、独立して水素または非置換のC₁ - C₆脂肪族化合物であるか、

同一の置換基または異なる置換基上の任意の2個のR^Tまたは2個のR基は、各基が結合する原子とともに、3員環から8員環の飽和または部分的に不飽和の単環、または酸素もしくは硫黄から独立して選択される、0個から3個のヘテロ原子を持つ5員環から6員環の単環のアリール環窒素を任意に形成し、前記単環は、R^R、-T - Ar¹、ハロゲン、オキソ、チオキソ、-OR^R、-SR^R、-N(R^R)₂、-NO₂、-C₁ - C₄ハロアルキル、-C₁ - C₄ハロアルコキシ、-CN、-CO₂R^R、-COR^R、-CON(R^R)₂、-OCOR^R、-NR^RCOR^R、-SO₂R^R、-SO₂N(R^R)₂または-NR^RSO₂R^Rの1個から3個の個別発生で任意に置換され、各R^Rは独立して水素または非置換のC₁ - C₆脂肪族化合物であり、

Tは(CH₂)_yであり、

yは0、1、または2であり、

Ar¹は、

(a) 3員環から8員環の飽和または部分的に不飽和の環、

(b) 5員環から6員環のアリール環、

(c) 窒素、酸素または硫黄から独立して選択される、1個から3個のヘテロ原子を持つ3員環から7員環の複素環、

(d) 窒素、酸素または硫黄から独立して選択される、1個から4個のヘテロ原子を持つ5員環から6員環のヘテロアリール環、または、

(e) 窒素、酸素または硫黄から独立して選択される、0個から5個のヘテロ原子を持つ8員環から12員環の飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和の二環系から選択され、

Ar^1 は $-R^W$ 、オキソ、チオキソ、 $-CO_2R^W$ 、 $-OR^W$ 、 $-N(R^W)_2$ 、 $-SR^W$ 、 $-NO_2$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 C_{1-4} ハロアルキル、 $-C_{1-4}$ ハロアルコキシ、 $-C(O)N(R^W)_2$ 、 $-NR^WC(O)R^W$ 、 $-SO_2R^W$ 、 $-SO_2N(R^W)_2$ 、 $-NR^WSO_2R^W$ 、 $-NR^WCON(R^W)_2$ 、 $-NR^WCO_2R^W$ 、 $-COR^W$ 、 $-OCOR^W$ 、 $-OCON(R^W)_2$ 、 $-SOR^W$ 、 $-NR^WSO_2N(R^W)_2$ 、 $-COCOR^W$ 、 $-COCH_2COR^W$ 、 $-OP(O)(OR^W)_2$ 、 $-P(O)(OR^W)_2$ 、 $-OP(O)_2OR^W$ 、 $-P(O)_2OR^W$ 、 $-PO(R^W)_2$ 、または $-OPO(R^W)_2$ の1個から3個の個別発生で任意に置換され、

R^W のそれぞれの発生は、水素、 C_{1-6} 脂肪族化合物、3員環から8員環の飽和または部分的に不飽和の単環、または5員環から6員環の単環のアリール環から独立して選択され、各環は、窒素、酸素または硫黄から独立して選択される、0個から4個のヘテロ原子を持ち、前記 C_{1-6} 脂肪族化合物、前記3員環から8員環のまたは5員環から7員環の単環は、 R^S 、 $-T-Ar^3$ 、ハロゲン、オキソ、チオキソ、 $-OR^S$ 、 $-SR^S$ 、 $-N(R^S)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-C_{1-4}$ ハロアルキル、 $-C_{1-4}$ ハロアルコキシ、 $-CN$ 、 $-CO_2R^S$ 、 $-COR^S$ 、 $-CONHR^S$ 、 $-OCOR^S$ 、 $-NR^SCOR^S$ 、 $-SO_2R^S$ 、 $-SO_2N(R^S)_2$ または $-NR^SSO_2R^S$ の1個から3個の個別発生で任意に置換され、

R^S は水素または非置換の C_{1-6} 脂肪族化合物であり、

Ar^3 は、

(a) 3員環から8員環の飽和または部分的に不飽和の環、

(b) 5員環から6員環のアリール環、

(c) 窒素、酸素または硫黄から独立して選択される、1個から3個のヘテロ原子を持つ3員環から7員環の複素環、

(d) 窒素、酸素または硫黄から独立して選択される、1個から4個のヘテロ原子を持つ5員環から6員環のヘテロアリール環、または

(e) 窒素、酸素または硫黄から独立して選択される、0個から5個のヘテロ原子を持つ8員環から12員環の飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和の二環系から選択され、

Ar^3 は、 $-R^J$ 、オキソ、チオキソ、 $-CO_2R^J$ 、 $-OR^J$ 、 $-N(R^J)_2$ 、 $-SR^J$ 、 $-NO_2$ 、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-C_{1-4}$ ハロアルキル、 $-C_{1-4}$ ハロアルコキシ、 $-C(O)N(R^J)_2$ 、 $-NR^JC(O)R^J$ 、 $-SO_2R^J$ 、 $-SO_2N(R^J)_2$ 、 $-NR^JSO_2R^J$ 、 $-NR^JCON(R^J)_2$ 、 $-NR^JCO_2R^J$ 、 $-COR^J$ 、 $-OCOR^J$ 、 $-OCON(R^J)_2$ 、 $-SOR^J$ 、 $-NR^JSO_2N(R^J)_2$ 、 $-COCOR^J$ 、 $-COCH_2COR^J$ 、 $-OP(O)(OR^J)_2$ 、 $-P(O)(OR^J)_2$ 、 $-OP(O)_2OR^J$ 、 $-P(O)_2OR^J$ 、 $-PO(R^J)_2$ 、または $-OPO(R^J)_2$ の1個から3個の個別発生で任意に置換され、

R^J のそれぞれの発生は、水素、 C_{1-6} 脂肪族化合物、3員環から8員環の飽和または部分的に不飽和の単環、または5員環から6員環の単環のアリール環から独立して選択され、各環は窒素、酸素または硫黄から独立して選択される、0個から4個のヘテロ原子を持ち、前記 C_{1-6} 脂肪族化合物、前記3員環から8員環のまたは5員環から6員環の単環は、 R^1 、ハロゲン、オキソ、チオキソ、 $-OR^1$ 、 $-SR^1$ 、 $-N(R^1)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-C_{1-4}$ ハロアルキル、 $-C_{1-4}$ ハロアルコキシ、 $-CN$ 、 $-CO_2R^1$ 、 $-COR^1$ 、 $-CONHR^1$ 、 $-OCOR^1$ 、 $-NR^1COR^1$ 、 $-SO_2R^1$ 、 $-SO_2N(R^1)_2$ または $-NR^1SO_2R^1$ の1個から3個の個別発生で任意に置換され、

R^1 は水素または非置換の C_{1-6} 脂肪族化合物であり、

R^Q は、ハロゲン、 L 、 $-(L_n)-R^S$ 、 $-(L_n)-N(R^S)_2$ 、 $-(L_n)-SR^S$ 、 $-(L_n)-OR^S$ 、 $-(L_n)-(C_{3-10}$ 脂環式)、 $-(L_n)-(C_{6-10})$ アリール)、 $-(L_n)-(5$ 員環から 10 員環のヘテロアリール)、 $-(L_n)-(5$ 員環から 10 員環のヘテロシクリール)、オキソ、チオキソ、 $-C_{1-4}$ ハロアルコキシ、 $-C_{1-4}$ ハロアルキル、 $-(L_n)-NO_2$ 、 $-(L_n)-CN$ 、 $-(L_n)-CF_3$ 、 $-(L_n)-OCF_3$ 、 $-CO_2R^S$ 、 $-COR^S$ 、 $-OC(O)R^S$ 、または $-NR^SC(O)R^S$ から選択され、

n は 0 または 1 であるか、または

任意の 2 個の R^Q または 2 個の R^S 基、または R^Q 基と、同一の置換基あるいは異なる置換基上の R または R^S 基の任意の組み合わせは、各基が結合する原子とともに、3 員環から 8 員環の飽和または部分的に不飽和の単環、あるいは 5 員環から 6 員環の単環のアリール環を任意に形成し、各環は窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される、0 個から 3 個のヘテロ原子を持ち、いずれの前記単環も R^Q 、 $-T-Ar^3$ 、ハロゲン、オキソ、チオキソ、 $-OR^Q$ 、 $-SR^Q$ 、 $-N(R^Q)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-C_{1-4}$ ハロアルキル、 $-C_{1-4}$ ハロアルコキシ、 $-CN$ 、 $-CO_2R^Q$ 、 $-COR^Q$ 、 $-CON(R^Q)_2$ 、 $-OCOR^Q$ 、 $-NR^QCOR^Q$ 、 $-SO_2R^Q$ 、 $-SO_2N(R^Q)_2$ 、または $-NR^QSO_2R^Q$ の 1 個から 3 個の個別発生で任意に置換され、

R^Q は水素または非置換の C_{1-6} 脂肪族化合物であり、

L は C_{1-6} 脂肪族化合物であって、3 個以下のメチレンユニットは $-NH-$ 、 $-NR^5$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-OC(O)-$ 、 $-C(O)CO-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-C(O)NH-$ 、 $-C(O)NR^5-$ 、 $-C(=N-CN)$ 、 $-NHC(O)-$ 、 $-NR^5CO-$ 、 $-NHC(O)O-$ 、 $-NR^5C(O)O-$ 、 $-SO_2NH-$ 、 $-SO_2NR^5-$ 、 $-NHSO_2-$ 、 $-NR^5SO_2-$ 、 $-NHC(O)NH-$ 、 $-NR^5C(O)NH-$ 、 $-NHC(O)NR^5-$ 、 $-NR^5C(O)NR^5$ 、 $-OC(O)NH-$ 、 $-OC(O)NR^5-$ 、 $-NHSO_2NH-$ 、 $-NR^5SO_2NH-$ 、 $-NHSO_2NR^5-$ 、 $-NR^5SO_2NR^5-$ 、 $-SO-$ 、または $-SO_2-$ によって代替され、

R^S は、 C_{1-6} 脂肪族化合物、 C_{3-10} 脂環式、または 3 員環から 8 員環の飽和もしくは部分的に不飽和の単環、または 5 員環から 6 員環のアリール環（各環は窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される、0 個から 3 個のヘテロ原子を持つ）、あるいは窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される、0 個から 5 個のヘテロ原子を持つ、8 員環から 12 員環の飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和の二環系から選択され、前記それぞれの環は、 R^N 、 $-T-Ar^3$ 、ハロゲン、オキソ、 $-OR^N$ 、 $-SR^N$ 、 $-N(R^N)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-C_{1-4}$ ハロアルキル、 $-C_{1-4}$ ハロアルコキシ、 $-CN$ 、 $-CO_2R^N$ 、 $-COR^N$ 、 $-CON(R^N)_2$ 、 $-OCOR^N$ 、 $-NR^NCOR^N$ 、 $-SO_2R^N$ 、 $-SO_2N(R^N)_2$ 、または $-NR^NSO_2R^N$ の 1 個から 3 個の個別発生で任意に置換され、

R^N は水素または非置換の C_{1-6} 脂肪族化合物であるか、または、

同一の置換基または異なる置換基上の任意の 2 個の R^S 基は、各 R^S 基が結合する原子とともに、3 員環から 8 員環の飽和または部分的に不飽和の単環、または窒素、酸素または硫黄から独立して選択される、0 個から 3 個のヘテロ原子を持つ 5 員環から 6 員環のアリール環を任意に形成し、

前記環は、 R^M 、 $-T-Ar^3$ 、ハロゲン、オキソ、チオキソ、 $-OR^M$ 、 $-SR^M$ 、 $-N(R^M)_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-C_{1-4}$ ハロアルキル、 C_{1-4} ハロアルコキシ、 $-CN$ 、 $-CO_2R^M$ 、 $-COR^M$ 、 $-CON(R^M)_2$ 、 $-OCOR^M$ 、 $-NR^MCOR^M$ 、 $-SO_2R^M$ 、 $-SO_2N(R^M)_2$ または $-NR^MSO_2R^M$ の 1 個から 3 個の個別発生で任意に置換され、

R^M は水素または非置換の C_{1-6} 脂肪族化合物であり、

R^X は、 $-R'$ 、ハロゲン、 $=NR'$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-C_{1-4}$ ハロアルキル、 $-C_{1-4}$ ハロアルコキシ、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、 $-N(R')_2$ 、 $-NR'COR'$ 、 $-NR'CON(R')$ 、 $-NR'CO_2R'$ 、 $-COR'$ 、 $-CO_2R'$ 、 $-OCOR$

、 $-\text{CON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{OCON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{SOR}'$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{COCOR}'$ 、 $-\text{COCH}_2\text{COR}'$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}')_2$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}')_2$ 、 $-\text{OP}(\text{O})_2\text{OR}'$ 、 $-\text{P}(\text{O})_2\text{OR}'$ 、 $-\text{PO}(\text{R}')_2$ 、または $-\text{OPO}(\text{R}')_2$ から選択され、

R' のそれぞれの発生は独立して水素、 C_{1-6} 脂肪族化合物、 C_{3-10} 脂環式、または3員環から8員環の飽和または部分的に不飽和の単環、または窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される、0個から3個のヘテロ原子を持つ5員環から6員環のアリール環；あるいは窒素、酸素もしくは硫黄から独立して選択される、0個から5個のヘテロ原子を持つ8員環から12員環の飽和の、部分的に不飽和の、または完全に不飽和の二環系であり、前記それぞれの環は、 $-\text{R}^w$ 、 $-\text{T}-\text{Ar}^1$ 、オキソ、チオキソ、 $-\text{CO}_2\text{R}^w$ 、 $-\text{OR}^w$ 、 $-\text{N}(\text{R}^w)_2$ 、 $-\text{SR}^w$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 C_{1-4} ハロアルキル、 $-\text{C}_{1-4}$ ハロアルコキシ、ハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^w)_2$ 、 $-\text{NR}^w\text{C}(\text{O})\text{R}^w$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^w$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^w)_2$ 、 $-\text{NR}^w\text{SO}_2\text{R}^w$ 、 $-\text{NR}^w\text{CON}(\text{R}^w)_2$ 、 $-\text{NR}^w\text{CO}_2\text{R}^w$ 、 $-\text{COR}^w$ 、 $-\text{OCOR}^w$ 、 $-\text{OCON}(\text{R}^w)_2$ 、 $-\text{SOR}^w$ 、 $-\text{NR}^w\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^w)_2$ 、 $-\text{COCOR}^w$ 、 $-\text{COCH}_2\text{COR}^w$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}^w)_2$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^w)_2$ 、 $-\text{OP}(\text{O})_2\text{OR}^w$ 、 $-\text{P}(\text{O})_2\text{OR}^w$ 、 $-\text{PO}(\text{R}^w)_2$ 、または $-\text{OPO}(\text{R}^w)_2$ の1個から3個の個別発生で任意に置換され、または

R^w の2個の発生、 R' の2個の発生、または1個の R^w と1個の R' とは、それらが結合する原子とともに、3員環から8員環の飽和または部分的に不飽和の単環、または窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される、0個から3個のヘテロ原子を持つ5員環から6員環のアリール環；あるいは窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される、0個から5個のヘテロ原子を持つ8員環から12員環の飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和の二環系を任意に形成し、前記単環または二環は、 R^t 、 $-\text{T}-\text{Ar}^3$ 、ハロゲン、オキソ、チオキソ、 $-\text{OR}^t$ 、 $-\text{SR}^t$ 、 $-\text{N}(\text{R}^t)_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}_{1-4}$ ハロアルキル、 $-\text{C}_{1-4}$ ハロアルコキシ、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^t$ 、 $-\text{COR}^t$ 、 $-\text{CON}(\text{R}^t)_2$ 、 $-\text{OCOR}^t$ 、 $-\text{NR}^t\text{COR}^t$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^t$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^t)_2$ 、または $-\text{NR}^t\text{SO}_2\text{R}^t$ の1個から3個の個別発生で任意に置換され、

R^y は、 $-\text{R}^k$ 、ハロゲン、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}_{1-4}$ ハロアルキル、 $-\text{C}_{1-4}$ ハロアルコキシ、 $-\text{OR}'$ 、 $-\text{SR}'$ 、 $-\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NR}'\text{COR}'$ 、 $-\text{NR}'\text{CON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NR}'\text{CO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{COR}'$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{OCOR}'$ 、 $-\text{CON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{OCON}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{C}(\text{R}')=\text{NOR}'$ 、 $-\text{C}(\text{R}')=\text{NOH}$ 、 $-\text{C}(\text{R}')=\text{NR}'$ 、 $-\text{C}(\text{R}')=\text{N}-\text{N}(\text{R})_2$ 、 $-\text{SOR}'$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{R}'$ 、 $-\text{NR}'\text{SO}_2\text{N}(\text{R}')_2$ 、 $-\text{COCOR}'$ 、 $-\text{COCH}_2\text{COR}'$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}')_2\text{R}'$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}')_2$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}')_2$ 、 $-\text{OP}(\text{O})_2\text{OR}'$ 、 $-\text{P}(\text{O})_2\text{OR}'$ 、 $-\text{PO}(\text{R}')_2$ 、または $-\text{OPO}(\text{R}')_2$ から選択され、

R^k は、水素、 C_{1-6} 脂肪族化合物、 C_{3-10} 脂環式、または窒素、酸素または硫黄から独立して選択される、0個から3個のヘテロ原子を持つ3員環から8員環の飽和または部分的に不飽和の単環、または窒素、酸素または硫黄から独立して選択される、0個から5個のヘテロ原子を持つ8員環から12員環の飽和または部分的に不飽和の二環系から選択され、前記 C_{1-6} 脂肪族化合物、 C_{3-10} 脂環式または前記単環もしくは二環は、 $-\text{R}^w$ 、 $-\text{T}-\text{Ar}^1$ 、オキソ、チオキソ、 $-\text{CO}_2\text{R}^w$ 、 $-\text{OR}^w$ 、 $-\text{N}(\text{R}^w)_2$ 、 $-\text{SR}^w$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{C}_{1-4}$ ハロアルキル、 $-\text{C}_{1-4}$ ハロアルコキシ、ハロゲン、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^w)_2$ 、 $-\text{NR}^w\text{C}(\text{O})\text{R}^w$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^w$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^w)_2$ 、 $-\text{NR}^w\text{SO}_2\text{R}^w$ 、 $-\text{NR}^w\text{CON}(\text{R}^w)_2$ 、 $-\text{NR}^w\text{CO}_2\text{R}^w$ 、 $-\text{COR}^w$ 、 $-\text{OCOR}^w$ 、 $-\text{OCON}(\text{R}^w)_2$ 、 $-\text{SOR}^w$ 、 $-\text{NR}^w\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^w)_2$ 、 $-\text{COCOR}^w$ 、 $-\text{COCH}_2\text{COR}^w$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}^w)_2$ 、 $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^w)_2$ 、 $-\text{OP}(\text{O})_2\text{OR}^w$ 、 $-\text{P}(\text{O})_2\text{OR}^w$ 、 $-\text{PO}(\text{R}^w)_2$ 、または

- O P O (R ^W) ₂ の 1 個 から 4 個 の 個 別 発 生 で 任 意 に 置 換 さ れ、
 任 意 の 前 記 環 の 任 意 の 窒 素 原 子 は、 - R ⁺、 - N (R ⁺) ₂、 - C O R ⁺、 - C O ₂ R ⁺
 、 - C O C O R ⁺、 - C O C H ₂ C O R ⁺、 - S O ₂ R ⁺、 - S O ₂ N (R ⁺) ₂、 - C
 (= S) N (R ⁺) ₂、 - C (= N H) - N (R ⁺) ₂、 また は - N R ⁺ S O ₂ R ⁺ と 任
 意 に 置 換 さ れ、

R ⁺ は 水 素、 C ₁ - ₆ 脂 肪 族 化 合 物、 フ ェ ニ ル、 - O (P h)、 - C H ₂ (P h)、 - (C H ₂) ₁ ₂ (P h)、 - C H = C H (P h) で あ る か、 また は 酸 素、 窒 素、 あ る い は 硫 黄 から 独 立 し て 選 択 さ れ る、 1 個 から 4 個 の ヘ テ ロ 原 子 を 持 つ 非 置 換 の 5 員 環 から 6 員 環 の ヘ テ ロ ア リ ー ル も し く は 複 素 環 で あ り、 前 記 脂 肪 族 基 また は 前 記 R ⁺ の フ ェ ニ ル 環 は、
 - N H ₂、 - N H (C ₁ - ₄ 脂 肪 族 化 合 物)、 - N (C ₁ - ₄ 脂 肪 族 化 合 物) ₂、 ハ 口 ゲ ン、 - C ₁ - ₄ 脂 肪 族 化 合 物、 - O H、 - O (C ₁ - ₄ 脂 肪 族 化 合 物)、 - N O ₂、 - C N、 - C O ₂ H、 - C O ₂ (C ₁ - ₄ 脂 肪 族 化 合 物)、 - C ₁ - ₄ ハ 口 ア ル キ ル、 - C ₁ - ₄ ハ 口 ア ル コ キ シ の 1 個 から 3 個 の 個 別 発 生 で 任 意 に 置 換 さ れ、 前 記 R ⁺ の C ₁ - ₄ 脂 肪 族 基 は 非 置 換 で あ り、

R ² は 非 置 換 の C ₁ - ₄ 脂 肪 族 基 で あ り、

R ³ は、 - A r ²、 - C (O) N H R ^V、 - C (O) N (R ^V) ₂、 - C (O) R ^V、 - C O ₂ R ^V、 - C (O) C (O) N (R ^V) ₂、 - S O ₂ R ^V、 - S O ₂ N (R ^V) ₂、 - S O ₂ N H R ^V、 - C (R ^V) = N O R ^V、 - C (R ^V) = N O H、 また は - C (R ^V) = N R ^V から 選 択 さ れ、

各 R ^V は、 - T - A r ¹ また は C ₁ - ₆ 脂 肪 族 基 から 独 立 し て 選 択 さ れ、 前 記 C ₁ - ₆ 脂 肪 族 基 は、 - R ^W、 - T - A r ¹、 オ キ ソ、 チ オ キ ソ、 - C O ₂ R ^W、 - O R ^W、 - N (R ^W) ₂、 - S R ^W、 - N O ₂、 - C ₁ - ₄ ハ 口 ア ル キ ル、 - C ₁ - ₄ ハ 口 ア ル コ キ シ、 ハ 口 ゲ ン、 - C N、 - C (O) N (R ^W) ₂、 - N R ^W C (O) R ^W、 - S O ₂ R ^W、 - S O ₂ N (R ^W) ₂、 - N R ^W S O ₂ R ^W、 - N R ^W C O N (R ^W) ₂、 - N R ^W C O ₂ R ^W、 - C O R ^W、 - O C O R ^W、 - O C O N (R ^W) ₂、 - S O R ^W、 - N R ^W S O ₂ N (R ^W) ₂、 - C O C O R ^W、 - C O C H ₂ C O R ^W、 - O P (O) (O R ^W) ₂、 - P (O) (O R ^W) ₂、 - O P (O) ₂ O R ^W、 - P (O) ₂ O R ^W、 - P O (R ^W) ₂、 また は - O P O (R ^W) ₂ から 独 立 し て 選 択 さ れ る、 1 個 から 3 個 の 基 と 任 意 に 置 換 さ れ、

A r ² は、 窒 素、 酸 素 また は 硫 黄 から 独 立 し て 選 択 さ れ る、 1 個 から 4 個 の ヘ テ ロ 原 子 を 持 つ 5 員 環 から 6 員 環 の ヘ テ ロ ア リ ー ル 環、 また は 窒 素、 酸 素、 も し く は 硫 黄 から 独 立 し て 選 択 さ れ る、 1 個 から 3 個 の ヘ テ ロ 原 子 を 持 つ 5 員 環 から 6 員 環 の 複 素 環 で あ り、 但 し 前 記 環 は 環 A と の 結 合 点 に 隣 接 し た 位 置 に 水 素 結 合 受 容 体 を 持 つ こ と を 条 件 と し、

A r ² は、 - R ^W、 - T - A r ¹、 オ キ ソ、 チ オ キ ソ、 - C O ₂ R ^W、 - O R ^W、 - N (R ^W) ₂、 - S R ^W、 - N O ₂、 - C ₁ - ₄ ハ 口 ア ル キ ル、 - C ₁ - ₄ ハ 口 ア ル コ キ シ、 ハ 口 ゲ ン、 - C N、 - C (O) N (R ^W) ₂、 - N R ^W C (O) R ^W、 - S O ₂ R ^W、 - S O ₂ N (R ^W) ₂、 - N R ^W S O ₂ R ^W、 - N R ^W C O N (R ^W) ₂、 - N R ^W C O ₂ R ^W、 - C O R ^W、 - O C O R ^W、 - O C O N (R ^W) ₂、 - S O R ^W、 - N R ^W S O ₂ N (R ^W) ₂、 - C O C O R ^W、 - C O C H ₂ C O R ^W、 - O P (O) (O R ^W) ₂、 - P (O) (O R ^W) ₂、 - O P (O) ₂ O R ^W、 - P (O) ₂ O R ^W、 - P O (R ^W) ₂、

また は - O P O (R ^W) ₂ の 1 個 から 3 個 の 基 の 個 別 発 生 で 任 意 に 置 換 さ れ、 また は A r ² の 隣 接 位 置 上 に あ る 2 個 の 置 換 基 は、 3 員 環 から 8 員 環 の 飽 和 また は 部 分 的 に 不 飽 和 の 単 環、 また は 窒 素、 酸 素、 も し く は 硫 黄 から 独 立 し て 選 択 さ れ る、 0 個 から 3 個 の ヘ テ ロ 原 子 を 持 つ 5 員 環 から 6 員 環 の ア リ ー ル 環 を と も に 形 成 す る こ と が で き、 前 記 3 員 環 から 8 員 環 の また は 前 記 5 員 環 から 6 員 環 の 環 は、 R ^T、 - T - A r ³、 ハ 口 ゲ ン、 オ キ ソ、 チ オ キ ソ、 - O R ^T、 - S R ^T、 - N (R ^T) ₂、 - N O ₂、 - C ₁ - ₄ ハ 口 ア ル キ ル、 - C ₁ - ₄ ハ 口 ア ル コ キ シ、 - C N、 - C O ₂ R ^T、 - C O R ^T、 - C O N (R ^T) ₂、 - O C O R ^T、 - N R ^T C O R ^T、 - S O ₂ R ^T、 - S O ₂ N (R ^T) ₂、 また は - N R ^T S O ₂ R ^T の 1 個 から 3 個 の 個 別 発 生 で 任 意 に 置 換 さ れ、 前 記 任 意 の 環 の 任 意 の 窒 素 原 子 は、 - R ⁺、 - N (R ⁺) ₂、 - C O R ⁺、 - C O ₂ R ⁺、 - C O C O R ⁺、 - C

OCH_2COR^+ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^+$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^+)_2$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{N}(\text{R}^+)_2$ 、
 $-\text{C}(=\text{NH})-\text{N}(\text{R}^+)_2$ 、または $-\text{NR}^+\text{SO}_2\text{R}^+$ と任意に置換され、

R^4 は、水素またはハロゲンから選択され、

但し、1-エチル-3-(5-(2,3-ジヒドロ-1-イソプロピル-2-オキソ-1H-イミダゾール-4-イル))-7-(ピリミジン-2-イル)-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル]尿素、および

1-エチル-3-(5-(1,1-ジメチル尿素)-7-(ピリミジン-2-イル))-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル]尿素の化合物が除外されることを条件とする

化合物または薬学的に許容されるその塩。

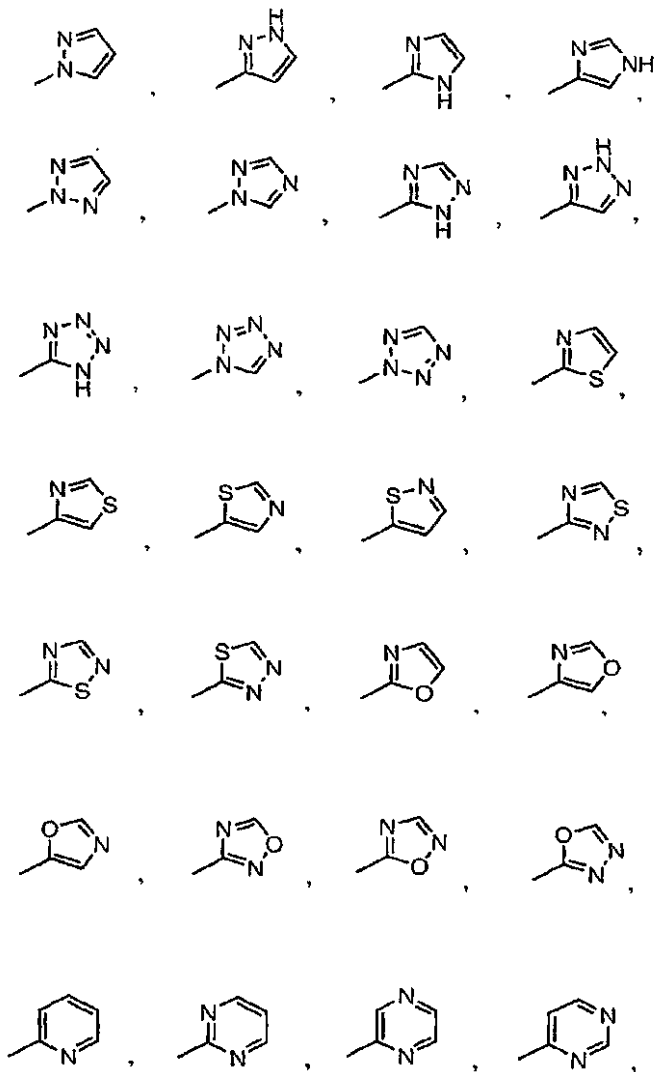
【請求項2】

R^3 は Ar^2 である、請求項1に記載の化合物。

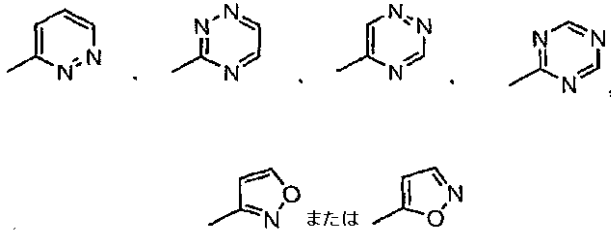
【請求項3】

Ar^2 は、

【化2】



【化 3】

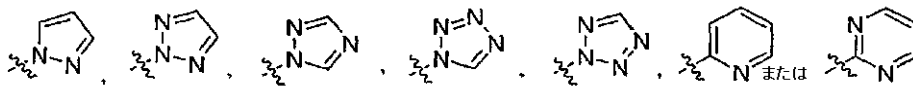


の任意に置換される環から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

Ar^2 は、以下の任意に置換される環：

【化 4】

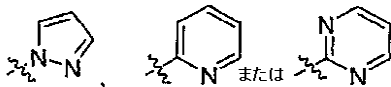


から選択される、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

Ar^2 は、以下の任意に置換される環：

【化 5】

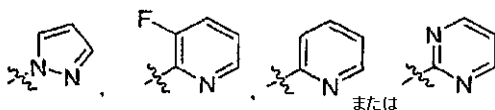


から選択される、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

Ar^2 は以下の環：

【化 6】

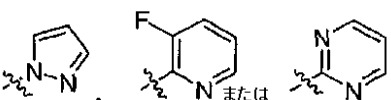


から選択される、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

Ar^2 は以下の環：

【化 7】



から選択される、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

R^2 は、メチル、エチル、イソプロピル、またはシクロプロピルから選択される、請求項 1 から請求項 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9】

R^2 はエチルである、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

Z は C - R^4 である、請求項 1 から請求項 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 11】

R⁴ は水素である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

R⁴ はハロゲンである、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 13】

R⁴ はフッ素である、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 14】

X は C - R⁴ である、請求項 1 から請求項 11 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 15】

R⁴ は水素である、請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 16】

R⁴ はハロゲンである、請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 17】

R⁴ はフッ素である、請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 18】

X は C - R⁴ であり、Z は C - R⁴ である、請求項 1 から請求項 9 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 19】

R⁴ は水素である、請求項 18 に記載の化合物。

【請求項 20】

R¹ は R^Y である、請求項 1 から請求項 19 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 21】

R^Y は、- R^K、ハロゲン、- CN、- OR[']、- N(R['])₂ - NR[']CON(R['])₂、- NR[']CO₂R[']、- CO₂R[']、または - CON(R['])₂ から選択される、請求項 20 に記載の化合物。

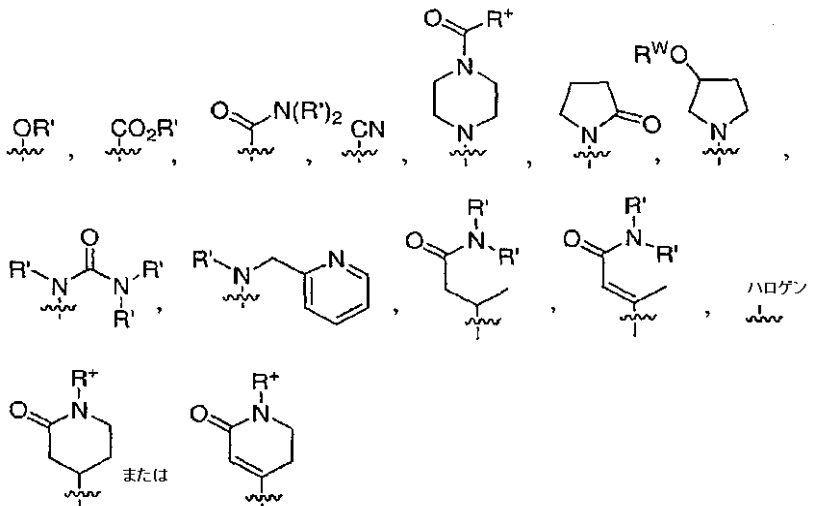
【請求項 22】

R^K は、水素、C₁ - 6 脂肪族化合物、C₃ - 10 脂環式、または窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される、0 個から 3 個のヘテロ原子を持つ 3 員環から 8 員環の飽和単環、または窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される、0 個から 5 個のヘテロ原子を持つ 8 員環から 12 員環の飽和二環系から選択される、請求項 21 に記載の化合物。

【請求項 23】

R^Y は、

【化 8】

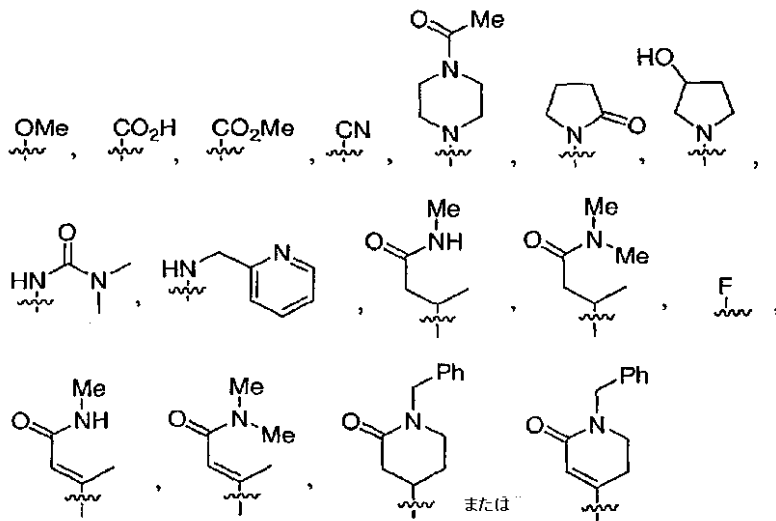


から選択される、請求項 21 に記載の化合物。

【請求項 24】

R^Y は、

【化 9】

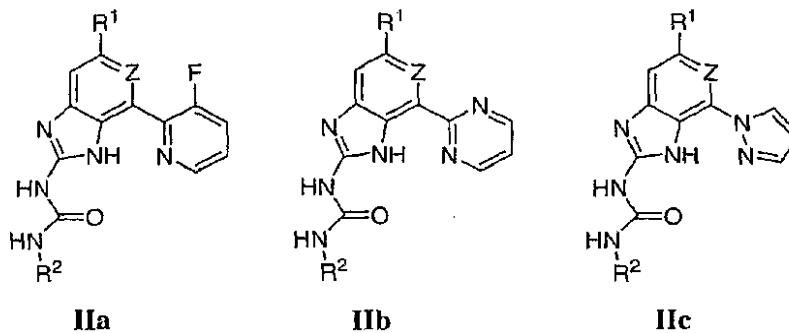


から選択される、請求項 23 に記載の化合物。

【請求項 25】

化学式 I I a、I I b、または I I c の化合物：

【化 10】



または薬学的に許容されるその塩である、請求項 1 または請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 26】

Z は C - R⁴ である、請求項 25 に記載の化合物。

【請求項 27】

R⁴ は水素である、請求項 26 に記載の化合物。

【請求項 28】

R⁴ はハロゲンである、請求項 26 に記載の化合物。

【請求項 29】

R⁴ はフッ素である、請求項 28 に記載の化合物。

【請求項 30】

R² は、メチル、エチル、イソプロピル、またはシクロプロピルから選択される、請求項 25 から請求項の 29 のいずれか 1 項に記載の化合物。

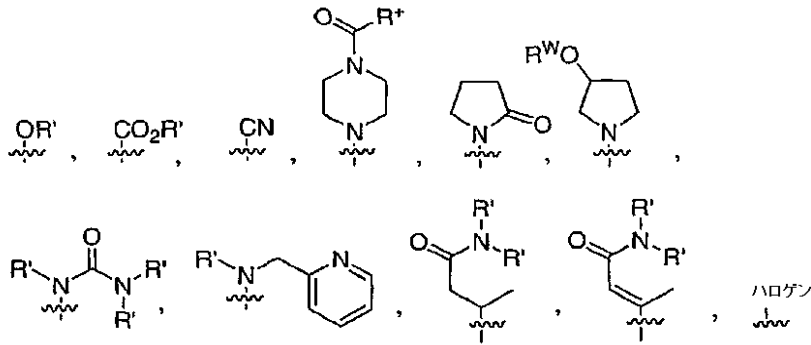
【請求項 31】

R² はエチルである、請求項 30 に記載の化合物。

【請求項 32】

R¹ は R^Y であり、R^Y は、

【化 1 1】



【化 1 2】

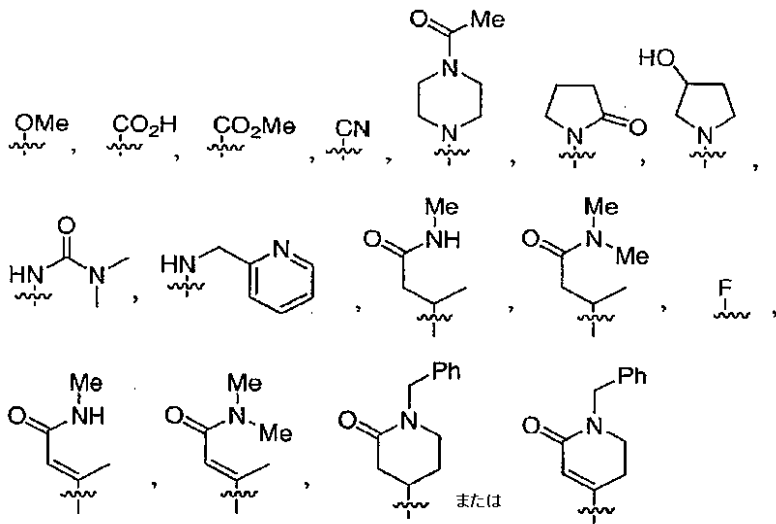


から選択される、請求項 2 5 から請求項 3 1 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 3 3】

R'^+ は、

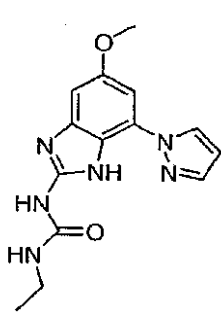
【化 1 3】



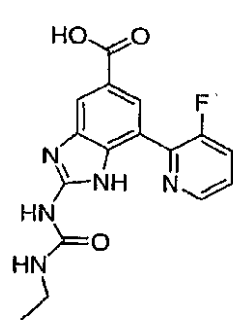
から選択される、請求項 3 2 に記載の化合物。

【請求項 3 4】

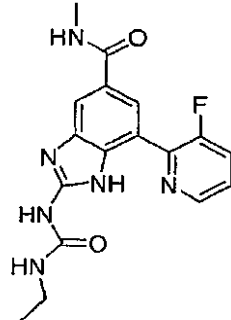
【化 1 4】



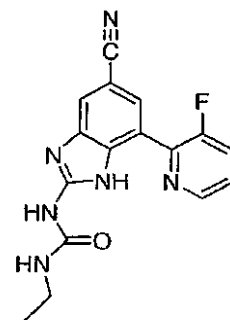
I-1



I-2

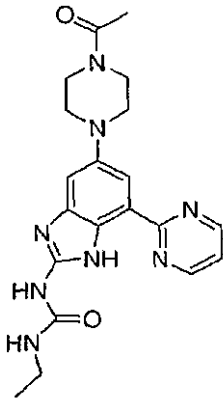


I-3

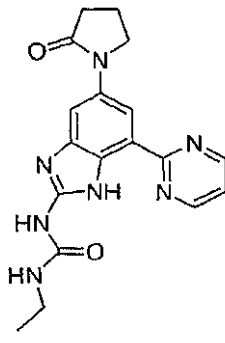


I-4

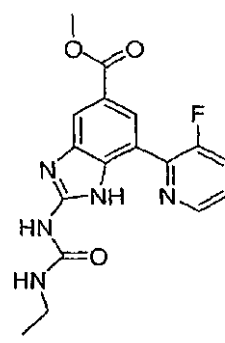
【化 1 5】



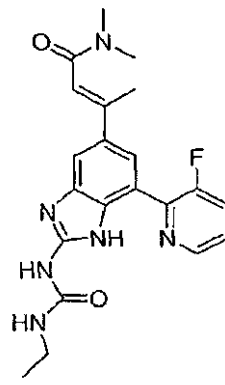
I-5



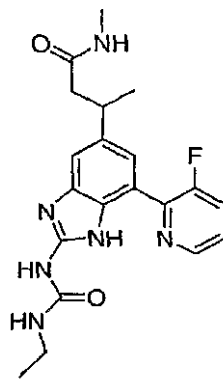
I-6



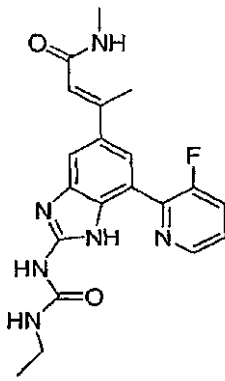
I-7



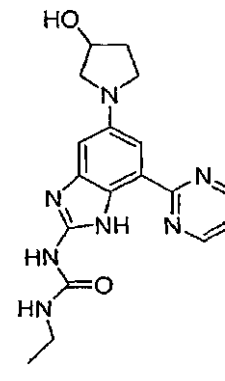
I-8



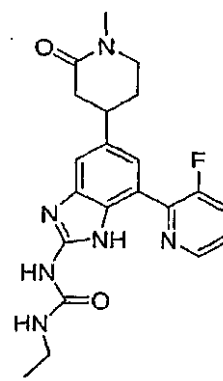
I-9



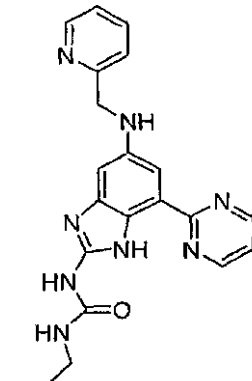
I-10



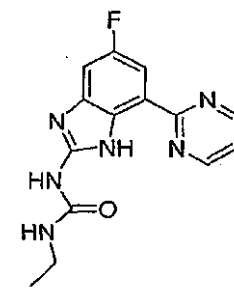
I-12



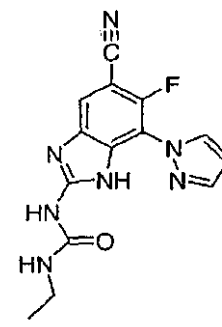
I-13



I-14

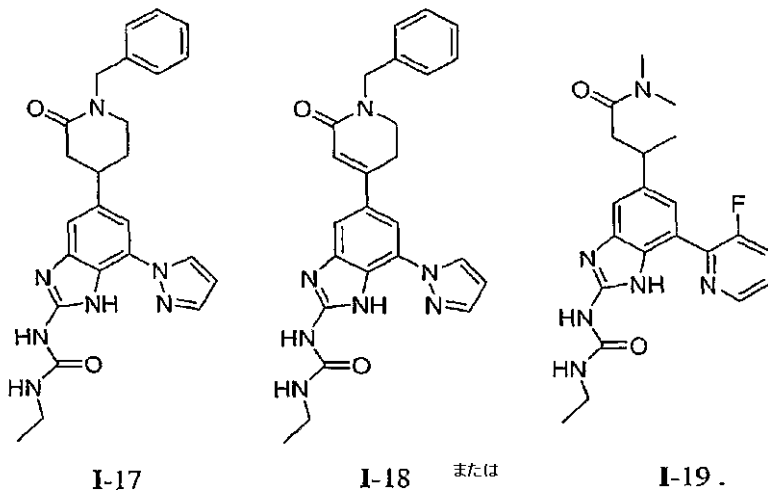


I-15



I-16

【化 16】



から選択される化合物。

【請求項 35】

請求項 1 または請求項 2 に記載の化合物、および薬学的に許容されるキャリア、アジュバント、または賦形剤を含む組成物。

【請求項 36】

抗生剤、抗炎症薬、抗ウイルス薬、または細菌性生物の抗生剤への感受性を高める薬剤から選択される、さらなる治療薬をさらに含む、請求項 35 に記載の組成物。

【請求項 37】

生体サンプル中において、ジャイレースまたは Topo IV 活性を阻害する方法であって、請求項 1 または請求項 2 に記載の化合物、または請求項 35 に記載の組成物に、前記生体サンプルを接触させるステップを含む、方法。

【請求項 38】

患者において、ジャイレースまたは Topo IV 活性を阻害するための組成物であって、請求項 1 または請求項 2 に記載の化合物、または請求項 35 に記載の組成物を含む組成物。

【請求項 39】

生体サンプル中において、ジャイレースまたは Topo IV 活性を阻害する方法であって、請求項 1 または請求項 2 に記載の化合物、または請求項 35 に記載の組成物に、前記生体サンプルを接触させるステップを含む、方法。

【請求項 40】

患者において、ジャイレースまたは Topo IV 活性を阻害するための組成物であって、請求項 1 または請求項 2 に記載の化合物、または請求項 35 に記載の組成物を含む組成物。

【請求項 41】

患者において、細菌の量を減少させるための組成物であって、請求項 1 または請求項 2 の化合物、または請求項 35 に記載の組成物を含む組成物。

【請求項 42】

患者において、細菌感染を予防、治療、または重篤度を緩和するための組成物であって、請求項 1 または請求項 2 に記載の化合物、または請求項 35 に記載の組成物を含む組成物。

【請求項 43】

前記治療または予防される細菌感染は、感受性細菌性生物の存在を特徴とする、請求項 42 に記載の組成物。

【請求項 44】

前記感受性細菌性生物は、肺炎連鎖球菌 (Streptococcus pneumoniae)、化膿連鎖球菌 (Streptococcus pyogenes)、エンテロコッカス・フェカリス (Enterococcus faecalis)、エンテロコッカス・フェシウム (Enterococcus faecium)、肺炎桿菌 (Klebsiella pneumoniae)、エンテロバクター種 (Enterobacter spp.)、プロテウス種 (Proteus spp.)、緑膿菌 (Pseudomonas aeruginosa)、大腸菌 (E. coli)、霊菌 (Serratia marcescens)、黄色ブドウ球菌 (Staphylococcus aureus)、コアグラゼ陰性ブドウ球菌 (Coag. Neg. Staph)、ヘモフィルス・インフルエンザ菌 (Haemophilus influenzae)、炭疽菌 (Bacillus anthracis)、マイコプラズマ肺炎菌 (Mycoplasma pneumoniae)、モラクセラ・カタラーリス菌 (Moraxella catarrhalis)、クラミジア肺炎菌 (Chlamydia pneumoniae)、レジオネラ・ニューモフィラ (Legionella pneumophila)、ヒト型結核菌 (Mycobacterium tuberculosis)、表皮ブドウ球菌 (Staphylococcus epidermidis)、またはヘリコバクター・ピロリ (Helicobacter pylori) のうちの1つ以上の存在を特徴とする、請求項43に記載の組成物。

【請求項45】

前記感受性細菌性生物は、肺炎連鎖球菌、大便連鎖球菌、または黄色ブドウ球菌のうちの1つ以上の存在を特徴とする、請求項44に記載の組成物。

【請求項46】

前記感受性細菌性生物は、大腸菌、モラクセラ・カタラーリス菌、またはヘモフィルス・インフルエンザ菌のうちの1つ以上の存在を特徴とする、請求項44に記載の組成物。

【請求項47】

前記治療または予防される細菌感染は、上気道感染、下気道感染、耳感染、胸膜肺および気管支炎、尿路感染、腹腔内感染、心血管感染、血液感染、敗血症、中枢神経系感染、皮膚軟組織感染、胃腸感染、骨関節感染、生殖器感染、眼感染、または肉芽種性感染症のうちの1つ以上から選択される、請求項43、44、45または46のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項48】

治療される前記細菌感染は、咽頭炎、静脈洞炎、外耳炎、中耳炎、気管支炎、蓄膿症、肺炎、膀胱炎および腎盂腎炎、腎臓結石、前立腺炎、腹膜炎、透析関連腹膜炎、実質臓器の腫瘍、心内膜炎、心筋炎、心膜炎、輸血関連敗血症、髄膜炎、脳炎、脳腫瘍、骨髄炎、関節炎、生殖器潰瘍、尿道炎、膣炎、子宮頸管炎、歯肉炎、結膜炎、角膜炎、水晶体過敏性眼内炎、または発熱性好中球減少症の患者の感染のうちの1つ以上から選択される、請求項47に記載の組成物。

【請求項49】

前記化合物とともに複数の投薬形態として、または別の投薬形態として、さらなる治療薬と組み合わせて投与されることを特徴とする、請求項41または請求項42に記載の組成物。

【請求項50】

細菌性生物の抗生剤への感受性を高める薬と組み合わせて投与されることを特徴とする、請求項41または請求項42に記載の組成物。