

【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 29 年 1 月 5 日 (2017.1.5)

【公表番号】特表 2016-506419 (P2016-506419A)

【公表日】平成 28 年 3 月 3 日 (2016.3.3)

【年通号数】公開・登録公報 2016-013

【出願番号】特願 2015-552833 (P2015-552833)

【国際特許分類】

C 0 7 F 5/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/69 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 F 5/02 C S P C

A 6 1 K 31/69

A 6 1 P 31/04

【手続補正書】

【提出日】平成 28 年 11 月 16 日 (2016.11.16)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

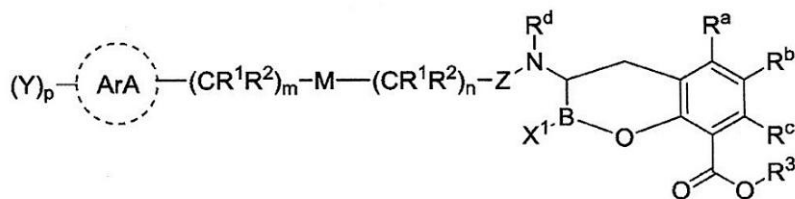
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

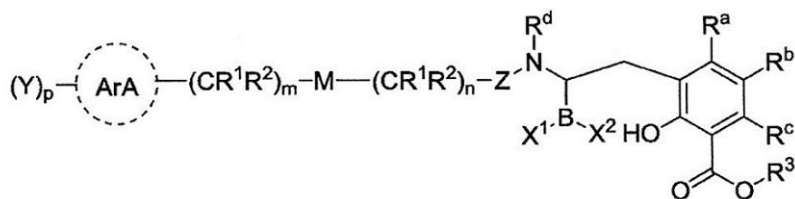
【請求項 1】

式 (I) 又は式 (Ia) の化合物、それらの薬学的に許容可能な塩、多形体、溶媒和物、プロドラッグ、N - オキシド、又は異性体であって：

【化 1】



式 (I)



式 (Ia),

式中：

M は単結合、- O -、- S -、- S (O) -、S O₂ -、又は - N (R⁴) - であり；

m は 0、1、又は 2 であり；

n は 0、1、2、又は 3 であり；

但し、n が 0 である場合、M は単結合であることを前提とし；

p は 2、3、4、又は 5 であり；

X¹ と X² は独立して、- OH、- OR⁸、又は F から選択され；

Z は、> C = O、> C = S、又は > SO₂ であり；

Ar A は、フルオロ、クロロ、プロモ、- CN、任意に置換した C₁ - C₆ アルキル、任意に置換した C₃ - C₆ シクロアルキル、任意に置換したヘテロ環、任意に置換したアリール、任意に置換したヘテロアリール、- OH、- OR¹⁰、及び - SR¹⁰ から成る群から選択される 1 以上の置換基で任意に置換した芳香環系又は芳香族複素環系であり；

Y はそれぞれ、- NR⁴R⁵、- (CR⁶R⁷)_vNR⁴R⁵、- NR⁴(CR⁶R⁷)_vNR⁴R⁵、- O(CR⁶R⁷)_vNR⁴R⁵、- S(O)_{0,1,2}(CR⁶R⁷)_vNR⁴R⁵、- N(R⁴)C(O)(CR⁶R⁷)_vNR⁴R⁵、- (CR⁶R⁷)_vN(R⁴)C(O)(CR⁶R⁷)_vNR⁴R⁵、- (CR⁶R⁷)_vNR⁴(CR⁶R⁷)_vNR⁴R⁵、- NR⁴(CR⁶R⁷)_vOR¹⁰、- NR⁴(CR⁶R⁷)_vS(O)_{0,1,2}R¹⁰、- C(O)NR⁴(CR⁶R⁷)_vNR⁴R⁵、- S(O)_{0,1,2}NR⁴(CR⁶R⁷)_vNR⁴R⁵、- NR⁵C(O)NR⁴(CR⁶R⁷)_vNR⁴R⁵、- OC(O)NR⁴(CR⁶R⁷)_vNR⁴R⁵、- NR⁵C(=NR⁷)NR⁴(CR⁶R⁷)_vNR⁴R⁵、- N(R⁴)C(=NR⁵)R⁶、- (CR⁶R⁷)_vN(R⁴)C(=NR⁵)R⁶、- O(CR⁶R⁷)_vN(R⁴)C(=NR⁵)R⁶、- S(O)_{0,1,2}(CR⁶R⁷)_vN(R⁴)C(=NR⁵)R⁶、- (CR⁶R⁷)_vC(=NR⁵)NR⁴R⁵、- NR⁴(CR⁶R⁷)_vC(=NR⁵)NR⁴R⁵、- O(CR⁶R⁷)_vC(=NR⁵)NR⁴R⁵、- S(O)_{0,1,2}(CR⁶R⁷)_vC(=NR⁵)NR⁴R⁵、- (CR⁶R⁷)_vN(R⁴)C(=NR⁵)NR⁴R⁵、- NR⁴(CR⁶R⁷)_vN(R⁴)C(=NR⁵)NR⁴R⁵、- O(CR⁶R⁷)_vN(R⁴)C(=NR⁵)NR⁴R⁵、- S(O)_{0,1,2}(CR⁶R⁷)_vN(R⁴)C(=NR⁵)NR⁴R⁵、- NR⁴C(=NR⁵)NR⁴C(=NR⁵)NR⁴R⁵、- (CR⁶R⁷)_vC(=NR⁴)NR⁵C(=NR⁴)NR⁴R⁵、- O(CR⁶R⁷)_vC(=NR⁴)NR⁵C(=NR⁴)NR⁴R⁵、- S(O)_{0,1,2}(CR⁶R⁷)_vC(=NR⁴)NR⁵C(=NR⁴)NR⁴R⁵、- NR⁴C(=NR⁵)NR⁴R⁵、- C(=NR⁴)NR⁴R⁵、- C(=NR⁴)NR⁴C(O)R⁶、- NR⁴SO₂R⁶、- NR⁴C(O)R⁶、- NR⁴C(=O)OR⁶、- C(O)NR⁴R⁵、- (CR⁶R⁷)_vC(O)NR⁴R⁵、- SO₂NR⁴R⁵、- ヘテロアリール - NR⁴R⁵、- ヘテロシクリル - NR⁴R⁵、- ヘテロアリール - N(R⁴)C(=NR⁵)NR⁴R⁵、- ヘテロシクリル - N(R⁴)C(=NR⁵)NR⁴R⁵、- N(R⁴) - ヘテロアリール - NR⁴R⁵、- N(R⁴) - ヘテロシクリル - NR⁴R⁵、- (CR⁶R⁷)_vヘテロアリール - NR⁴R⁵、- (CR⁶R⁷)_vヘテロシクリル - NR⁴R⁵、- (CR⁶R⁷)_vヘテロアリール - N(R⁴)C(=NR⁵)NR⁴R⁵、- (CR⁶R⁷)_vヘテロシクリル - N(R⁴)C(=NR⁵)NR⁴R⁵、- (CR⁶R⁷)_vヘテロアリール、- (CR⁶R⁷)_vヘテロシクリル、- O - ヘテロアリール、- O - ヘテロシクリル、- NR⁴(CR⁶R⁷)_vヘテロアリール、- NR⁴(CR⁶R⁷)_vヘテロシクリル、- O(CR⁶R⁷)_vヘテロアリール、- O(CR⁶R⁷)_vヘテロシクリル、- NR⁴(CR⁶R⁷)_vNR⁵ - ヘテロアリール、- NR⁴(CR⁶R⁷)_vNR⁵ - ヘテロシクリル、- O(CR⁶R⁷)_vNR⁵ - ヘテロアリール、- O(CR⁶R⁷)_vNR⁵ - ヘテロシクリル、- O(CR⁶R⁷)_vO - ヘテロシクリル、- NR⁴R⁵R⁹ + Q⁻、- (CR⁶R⁷)_vNR⁴R⁵R⁹ + Q⁻、- NR⁴R⁵R⁹ + (CR⁶R⁷)_vNR⁴R⁵R⁹ + Q⁻、- (CR⁶R⁷)_v(T)⁺Q⁻、及び - O(CR⁶R⁷)_vNR⁴R⁵R⁹ + Q⁻ から成る群から選択され；

ここで：

T はピリジン - 1 - イル、ピリミジン - 1 - イル、又はチアゾール - 3 - イルであり

；

Q は薬学的に許容可能なカウンターイオンであり；及び

v は 1 - 4 であり；

又は、Ar A に結合される炭素原子と一体となって形成される 2 つの Y は、任意に置換した炭素環又は任意に置換したヘテロ環を形成し；

R^a、R^b、及び R^c は独立して、水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、任意に置換した C₁ - C₆ アルキル、任意に置換した C₃ - C₆ シクロアルキル、任意に置換したヘテロシクリル、任意に置換したアリール、任意に置換したヘテロアリール、-OH、-OR¹⁰、-NR⁴R⁵、及び -SR¹⁰ から成る群から選択され；

R¹ と R² は、水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、任意に置換した C₁ - C₆ アルキル、任意に置換した C₃ - C₆ シクロアルキル、-OH、-OR¹⁰、-SR¹⁰、及び -NR⁴R⁵ から成る群から選択され、或いは、一体となって形成される R¹ と R² は、オキソ、オキシム、又は、結合される炭素を含む任意に置換した炭素環或いは任意に置換したヘテロ環を形成し；

R³ は、水素、任意に置換した C₁ - C₆ アルキル、又は薬学的に許容可能なプロドラッグであり；

R^d、R⁴、及び R⁵ は独立して、水素、-OH、-CN、任意に置換した C₁ - C₆ アルキル、任意に置換したアルコキシアルキル、任意に置換したヒドロキシアルキル、任意に置換したアミノアルキル、任意に置換したシクロアルキル、任意に置換したヘテロシクリル、任意に置換したアリール、任意に置換したヘテロアリール、任意に置換したシクロアルキルアルキル、任意に置換したヘテロシクリルアルキル、任意に置換したアラルキル、任意に置換したヘテロアラルキル、(ポリエチレングリコール)エチル、及び任意に置換したサッカライドから成る群から選択され；或いは、一体となって形成される R⁴ と R⁵ は、結合される窒素を含む任意に置換したヘテロ環を形成し；

R⁶ と R⁷ は独立して、水素、フルオロ、クロロ、ブロモ、任意に置換した C₁ - C₆ アルキル、任意に置換したアルコキシアルキル、任意に置換したヒドロキシアルキル、任意に置換した C₃ - C₆ シクロアルキル、-OH、-OR¹⁰、-SR¹⁰、-NR⁴R⁵、-NR⁴C(O)R⁵、-C(O)NR⁴R⁵、-NR⁴SO₂R⁵、任意に置換したヘテロシクリル、任意に置換したアリール、及び任意に置換したヘテロアリールから成る群から選択され；又は、一体となって形成される R⁶ と R⁷ は、オキソ、オキシム、又は、結合される炭素を含む任意に置換した炭素環又は任意に置換したヘテロ環を形成し；

R⁸ は、任意に置換した C₁ - C₆ アルキル、任意に置換した C₃ - C₆ シクロアルキル、又は薬学的に許容可能なボロン酸エステル基であり；

R⁹ は任意に置換した C₁ - C₆ アルキルであり；

R¹⁰ は、任意に置換した C₁ - C₆ アルキル又は任意に置換した C₃ - C₆ シクロアルキルである

ことを特徴とする化合物。

【請求項 2】

R^a、R^b、及び R^c は独立して、水素、フルオロ、クロロ、任意に置換した C₁ - C₆ アルキル、任意に置換した C₃ - C₆ シクロアルキル、-OH、-OR¹⁰、-NR⁴R⁵、及び -SR¹⁰ から成る群から選択される、ことを特徴とする請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^a、R^b、及び R^c は独立して、水素、フルオロ、又はクロロである、ことを特徴とする請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^a、R^b、及び R^c は水素である、ことを特徴とする請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

R³ は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、又はイソプロピルである、ことを特徴とする請求項 1 乃至 4 の何れか 1 つに記載の化合物。

【請求項 6】

R^3 は水素である、ことを特徴とする請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

X^1 と X^2 は OH である、ことを特徴とする請求項 1 乃至 6 の何れか 1 つに記載の化合物。

【請求項 8】

R^d は水素又は $C_1 - C_4$ アルキルである、ことを特徴とする請求項 1 乃至 7 の何れか 1 つに記載の化合物。

【請求項 9】

R^d は水素である、ことを特徴とする請求項 1 乃至 8 の何れか 1 つに記載の化合物。

【請求項 10】

Z は $>C=O$ である、ことを特徴とする請求項 1 乃至 9 の何れか 1 つに記載の化合物。

【請求項 11】

M は $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-SO_2-$ 、又は $-N(R^4)-$ であり；

m は 0 又は 1 であり；及び

n は 1 又は 2 である

ことを特徴とする請求項 1 乃至 10 の何れか 1 つに記載の化合物。

【請求項 12】

M は単結合又は $-O-$ であり；

m は 0 であり；及び

n は 1 又は 2 である。

ことを特徴とする請求項 1 乃至 10 の何れか 1 つに記載の化合物。

【請求項 13】

M は単結合であり；及び

m と n は 0 である

ことを特徴とする請求項 1 乃至 10 の何れか 1 つに記載の化合物。

【請求項 14】

M は単結合であり；及び

m 又は n は 1 である

ことを特徴とする請求項 1 乃至 10 の何れか 1 つに記載の化合物。

【請求項 15】

R^1 と R^2 はそれぞれ、フルオロ、クロロ、ブロモ、任意に置換した $C_1 - C_6$ アルキル、任意に置換した $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $-OH$ 、 $-OR^{10}$ 、 $-SR^{10}$ 、及び $-NR^4R^5$ から成る群から選択され、或いは、一体となって形成される R^1 と R^2 は、オキソ、オキシム、又は、結合される炭素を含む任意に置換した炭素環 或いは任意に置換したヘテロ環を形成する、ことを特徴とする請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 16】

ArA は、ベンゼン、ナフタレン、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン、トリアジン、チオフェン、フラン、ピロール、ピラゾール、トリアゾール、イミダゾール、チアゾール、イソチアゾール、オキサゾール、イソオキサゾール、インドール、インダゾール、アザインドール、アザインダゾール、インドリジン、イミダゾピリジン、ピラゾロ - ピリジン、チアゾロ - ピリジン、ピロロ - ピリミジン、チエノ - ピラゾール、ベンズイミダゾール、ベンゾチアゾール、ベンズオキサゾール、ベンゾフラン、ベンズイソオキサゾール、ベンズイソチアゾール、キノリン、イソキノリン、キノキサリン、キナゾリン、シンノリン、ベンゾトリアジン、ナフチリジン、ピリド - ピリミジン、ピリド - ピラジン、ピリドピリダジン、イソオキサゾロ - ピリジン、及びオキサゾロ - ピリジンから成る群から選択される、ことを特徴とする請求項 1 乃至 15 の何れか 1 つに記載の化合物。

【請求項 17】

ArA は、ベンゼン、ピリジン、ピリミジン、チオフェン、チアゾール、トリアゾール、インドール、ベンズイミダゾール、アザインドール、チエノピラゾール、キノリン、キナゾリン、及びキノキサリンから成る群から選択される、ことを特徴とする請求項 16 に

記載の化合物。

【請求項 18】

少なくとも 1 つの Y は、 $-NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-O(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-N(R^4)C(O)(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vN(R^4)C(O)(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-C(O)NR^4(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-S(O)_0,1,2NR^4(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-NR^5C(O)NR^4(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-O(C(O)NR^4(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-NR^5C(=NR^7)NR^4(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-N(R^4)C(=NR^5)R^6$ 、 $-(CR^6R^7)_vN(R^4)C(=NR^5)R^6$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vN(R^4)C(=NR^5)R^6$ 、 $-O(CR^6R^7)_vN(R^4)C(=NR^5)R^6$ 、 $-(CR^6R^7)_vC(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vC(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-O(CR^6R^7)_vC(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vN(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-N(R^4(CR^6R^7)_vN(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-O(CR^6R^7)_vN(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-NR^4C(=NR^5)NR^4C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vC(=NR^4)NR^5C(=NR^4)NR^4R^5$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vC(=NR^4)NR^5C(=NR^4)NR^4R^5$ 、 $-O(CR^6R^7)_vC(=NR^4)NR^5C(=NR^4)NR^4R^5$ 、 $-NR^4C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-C(=NR^4)NR^4R^5$ 、 $-C(=NR^4)NR^4C(O)R^6$ 、 $-NR^4SO_2R^6$ 、 $-NR^4C(O)R^6$ 、 $-NR^4C(=O)OR^6$ 、 $-C(O)NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vC(O)NR^4R^5$ 、 $-ヘテロアリール-NR^4R^5$ 、 $-ヘテロシクリル-NR^4R^5$ 、 $-ヘテロアリール-N(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-ヘテロシクリル-N(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-N(R^4)-ヘテロアリール-NR^4R^5$ 、 $-N(R^4)-ヘテロシクリル-NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vヘテロアリール-NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vヘテロシクリル-NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vヘテロアリール-N(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vヘテロシクリル-N(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vヘテロアリール$ 、 $-(CR^6R^7)_vヘテロシクリル$ 、 $-O-ヘテロアリール$ 、 $-O-ヘテロシクリル$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vヘテロアリール$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vヘテロシクリル$ 、 $-O(CR^6R^7)_vヘテロアリール$ 、 $-O(CR^6R^7)_vヘテロシクリル$ 、及び $-O(CR^6R^7)_vO-ヘテロシクリル$ から成る群から選択される、ことを特徴とする請求項 1 乃至 17 の何れか 1 つに記載の化合物。

【請求項 19】

少なくとも 1 つの Y は、 $-NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-O(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-C(O)NR^4(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-NR^5C(O)NR^4(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-NR^5C(=NR^7)NR^4(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-N(R^4)C(=NR^5)R^6$ 、 $-(CR^6R^7)_vN(R^4)C(=NR^5)R^6$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vN(R^4)C(=NR^5)R^6$ 、 $-(CR^6R^7)_vC(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vC(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vN(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vN(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-NR^4C(=NR^5)NR^4C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vC(=NR^4)NR^5C(=NR^4)NR^4R^5$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vC(=NR^4)NR^5C(=NR^4)NR^4R^5$ 、 $-O(CR^6R^7)_vC(=NR^4)NR^5C(=NR^4)NR^4R^5$ 、 $-NR^4C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-C(=NR^4)NR^4R^5$ 、 $-C(=NR^4)NR^4C(O)R^6$ 、 $-NR^4C(O)R^6$ 、 $-(CR^6R^7)_vC(O)NR^4R^5$ 、 $-ヘテロシクリル-NR^4R^5$ 、 $-ヘテロシクリル-N(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-N(R^4)-ヘテロシクリル-NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vヘテロシクリル-NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vヘテロシクリル-N(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vヘテロシクリル$ 、及び $-NR^4(CR^6R^7)_vヘテロシクリル$ から成る群から選択される、ことを特徴とする請求項 1 乃至 17 の何れか 1

つに記載の化合物。

【請求項 20】

少なくとも 1 つの Y は、 $-NR^4R^5$ 、 $-NR^4C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-C(=NR^4)NR^4R^5$ 、 $-N(R^4)C(=NR^5)R^6$ 、 $-(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vN(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vOR^{10}$ 、 $-(CR^6R^7)_vNR^4(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-NR^5C(=NR^5)NR^4(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vN(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-NR^5C(O)CR^6(NR^4R^5)(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vC(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vN(R^4)C(O)(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-C(=NR^4)NR^4C(O)R^6$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_v$ ヘテロアリール、及び $-O(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ から成る群から選択される、ことを特徴とする請求項 1 乃至 17 の何れか 1 つに記載の化合物。

【請求項 21】

少なくとも 1 つの Y は $-(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ である、ことを特徴とする請求項 20 に記載の化合物。

【請求項 22】

少なくとも 1 つの Y は、 $-$ ヘテロアリール $-NR^4R^5$ 、 $-$ ヘテロシクリル $-NR^4R^5$ 、 $-$ ヘテロアリール $-N(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-$ ヘテロシクリル $-N(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-N(R^4)-$ ヘテロアリール $-NR^4R^5$ 、 $-N(R^4)-$ ヘテロシクリル $-NR^4R^5$ 、 $-$ ヘテロアリール $-C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-$ ヘテロシクリル $-C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_v$ ヘテロアリール $-NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_v$ ヘテロシクリル $-NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_v$ ヘテロアリール $-N(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ 、及び $-(CR^6R^7)_v$ ヘテロシクリル $-N(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ から成る群から選択される、ことを特徴とする請求項 1 乃至 17 の何れか 1 つに記載の化合物。

【請求項 23】

少なくとも 1 つの Y は、2- (NR_4R_5) -ピリジル、2- (NR_4R_5) -ピリミジニル、2- (NR_4R_5) -チアゾリル、2- (NR_4R_5) -イミダゾリル、3- (NR_4R_5) -ピラゾリル、3- (R_4R_5N) -イソチアゾリル、2- (R_4R_5N) -オキサゾリル、ピペリジン、ピロリジン、4-アミノ-ピペリジニル、3-アミノ-ピロリジニル、ピペラジン、又は 4-カルボキシミドオイル-ピペラジニルである、ことを特徴とする請求項 22 に記載の化合物。

【請求項 24】

結合される炭素原子と一体となって形成される 2 つの Y 基は、任意に置換した炭素環又は任意に置換したヘテロ環を形成する、ことを特徴とする請求項 1 乃至 17 の何れか 1 つに記載の化合物。

【請求項 25】

炭素環又はヘテロ環は、フルオロ、クロロ、ブロモ、 $-CN$ 、任意に置換した C_1-C_6 アルキル、任意に置換した C_3-C_6 シクロアルキル、任意に置換したヘテロ環、任意に置換したアリール、任意に置換したヘテロアリール、 $-OH$ 、 $-OR^{10}$ 、 $-SR^{10}$ 、 $-NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-O(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-NR^4C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-C(=NR^4)NR^4R^5$ 、 $-$ ヘテロアリール $-NR^4R^5$ 、 $-$ ヘテロシクリル $-NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_v$ ヘテロアリール $-NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_v$ ヘテロシクリル $-NR^4R^5$ 、 $-(CR^6R^7)_v$ ヘテロアリール、及び $-(CR^6R^7)_v$ ヘテロシクリルから成る群から選択される 1 乃至 3 の置換基で任意に置換される、ことを特徴とする請求項 24 に記載の化合物。

【請求項 26】

2 つの Y 基は、結合される原子と共に、ピロリン又はテトラヒドロピリジンの環を形成

する、ことを特徴とする請求項 2 4 又は 2 5 に記載の化合物。

【請求項 2 7】

2 つの Y 基は、結合される原子と共に、ピロリン環を形成する、ことを特徴とする請求項 2 6 に記載の化合物。

【請求項 2 8】

p は 2 又は 3 である、ことを特徴とする請求項 1 乃至 2 7 の何れか 1 つに記載の化合物。

【請求項 2 9】

R⁴ と R⁵ は独立して、水素、任意に置換した C₁ - C₆ アルキル、任意に置換したアルコキシアルキル、任意に置換したヒドロキシアルキル、及び任意に置換したヘテロシクリルから選択される、ことを特徴とする請求項 1 乃至 2 8 の何れか 1 つに記載の化合物。

【請求項 3 0】

R⁴ と R⁵ は独立して、水素又は任意に置換した C₁ - C₆ アルキルである、ことを特徴とする請求項 2 9 に記載の化合物。

【請求項 3 1】

R⁴ と R⁵ は水素である、ことを特徴とする請求項 3 0 に記載の化合物。

【請求項 3 2】

R⁶ と R⁷ は独立して、水素、任意に置換した C₁ - C₆ アルキル、-OH、-NR⁴、R⁵、及び任意に置換したヘテロシクリルから選択され、又は、一体となって形成されるR⁶ と R⁷ は、結合される炭素を含む任意に置換したヘテロ環を形成する、ことを特徴とする請求項 1 乃至 3 1 の何れか 1 つに記載の化合物。

【請求項 3 3】

R⁶ と R⁷ は各々独立して、水素、フルオロ、又は任意に置換した C₁ - C₆ アルキルである、ことを特徴とする請求項 3 2 に記載の化合物。

【請求項 3 4】

R⁶ と R⁷ は水素である、ことを特徴とする請求項 3 3 に記載の化合物。

【請求項 3 5】

v は 1 である、ことを特徴とする請求項 3 2 乃至 3 4 の何れか 1 つに記載の化合物。

【請求項 3 6】

少なくとも 1 つの塩基性アミンを含む、請求項 1 乃至 3 5 の何れか 1 つに記載の化合物。

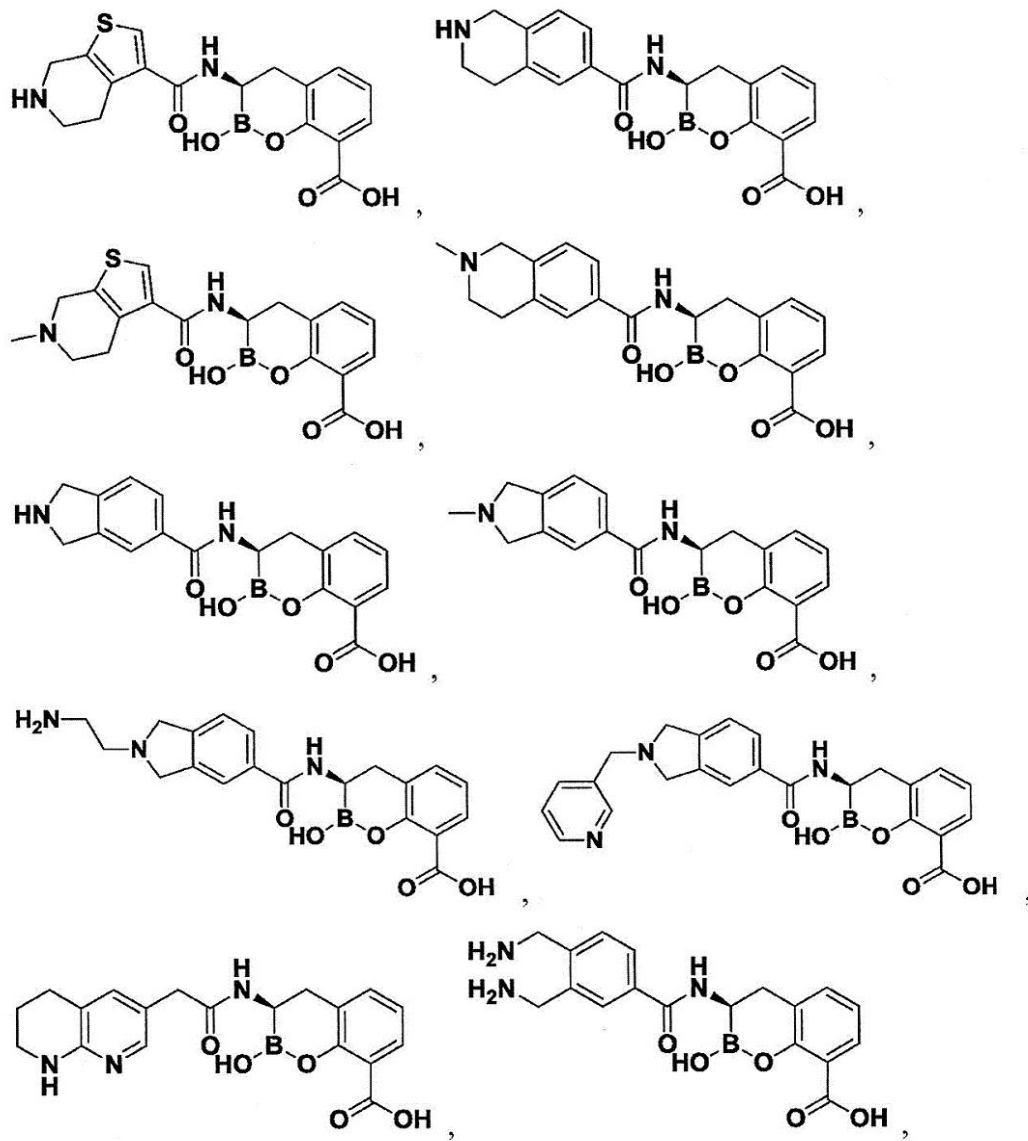
【請求項 3 7】

少なくとも 2 つの塩基性アミンを含む、請求項 3 6 に記載の化合物。

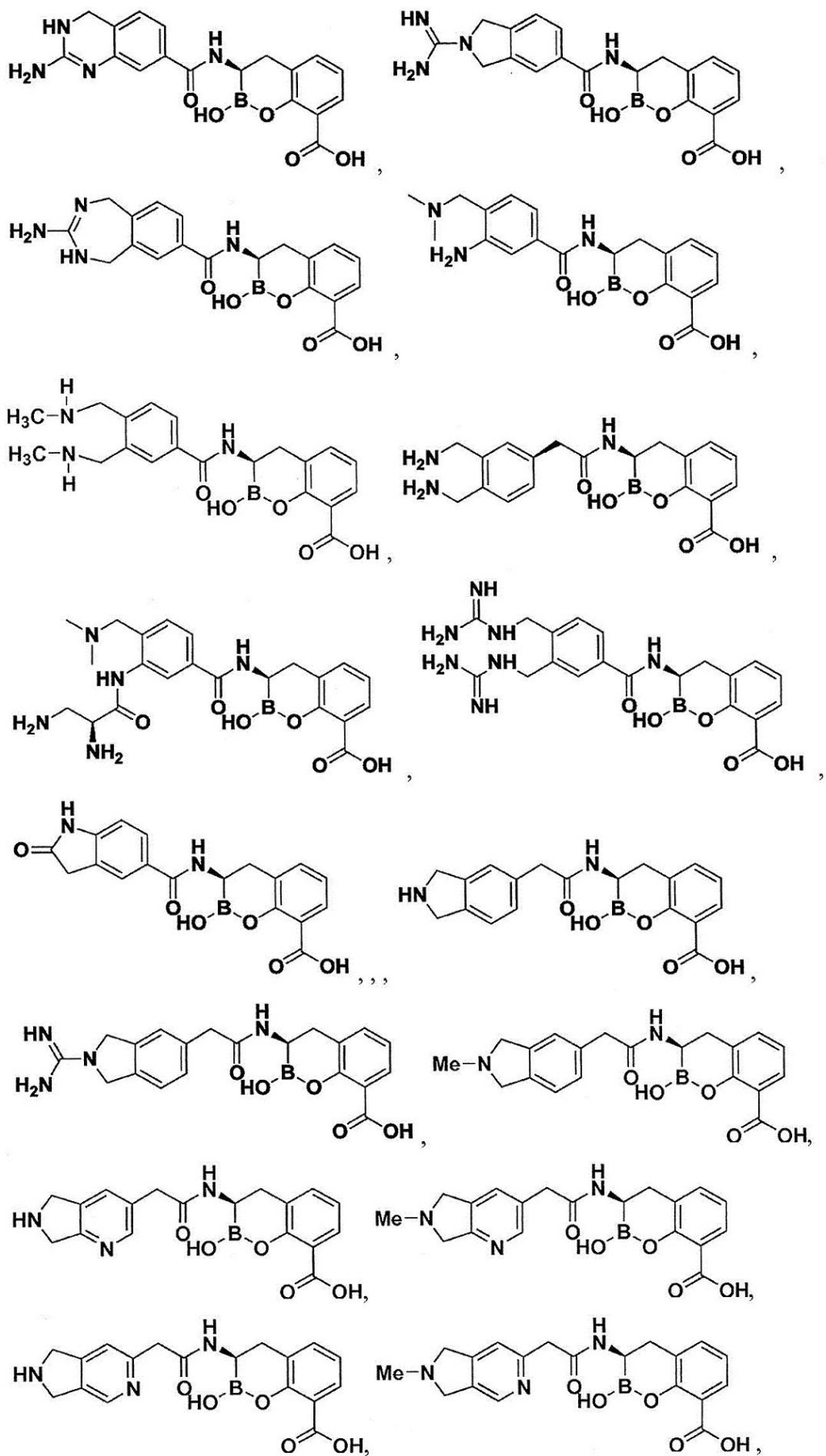
【請求項 3 8】

以下の構造：

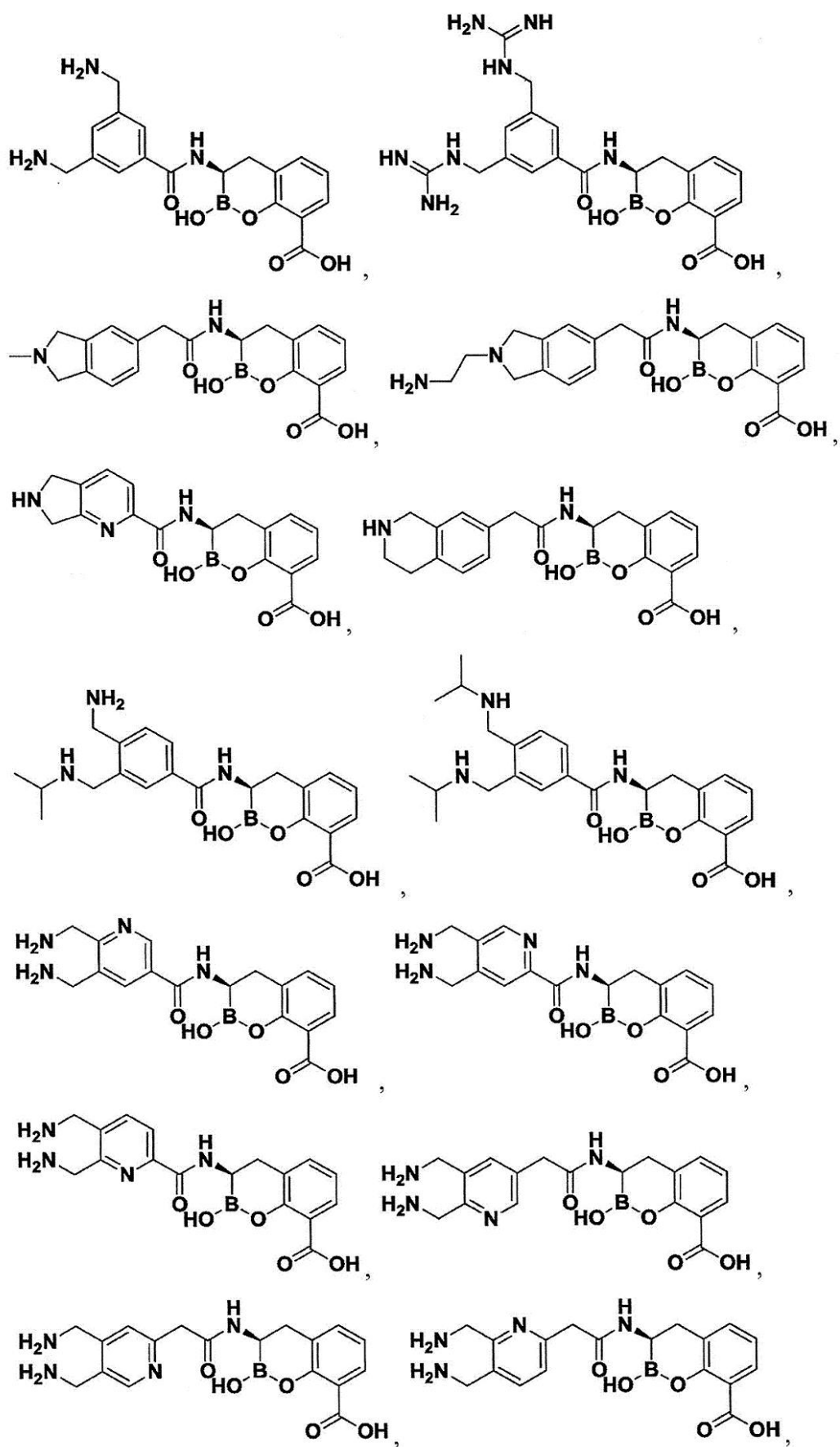
【化 2】



【化 3】



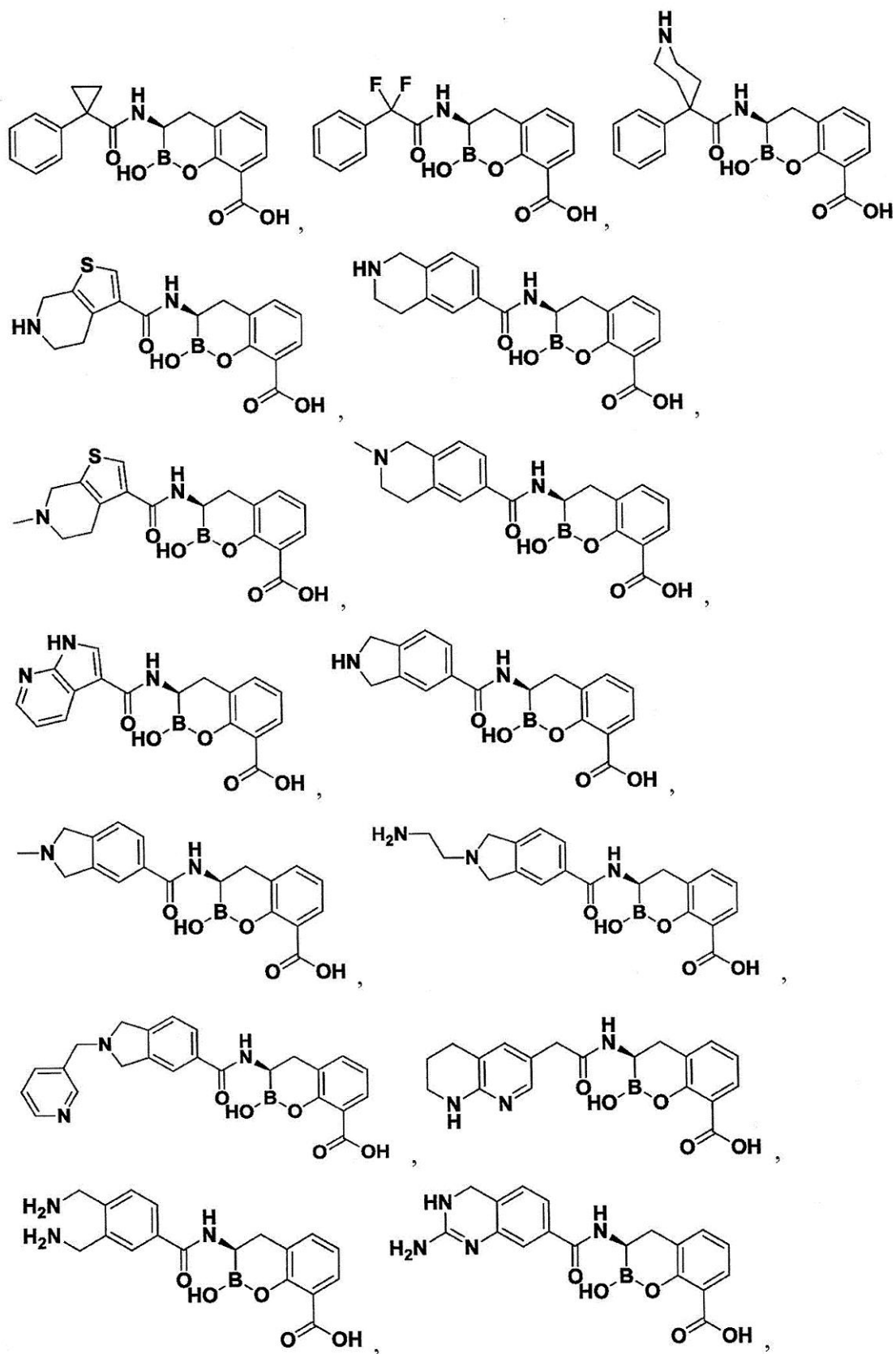
【化 4】



[illegible]

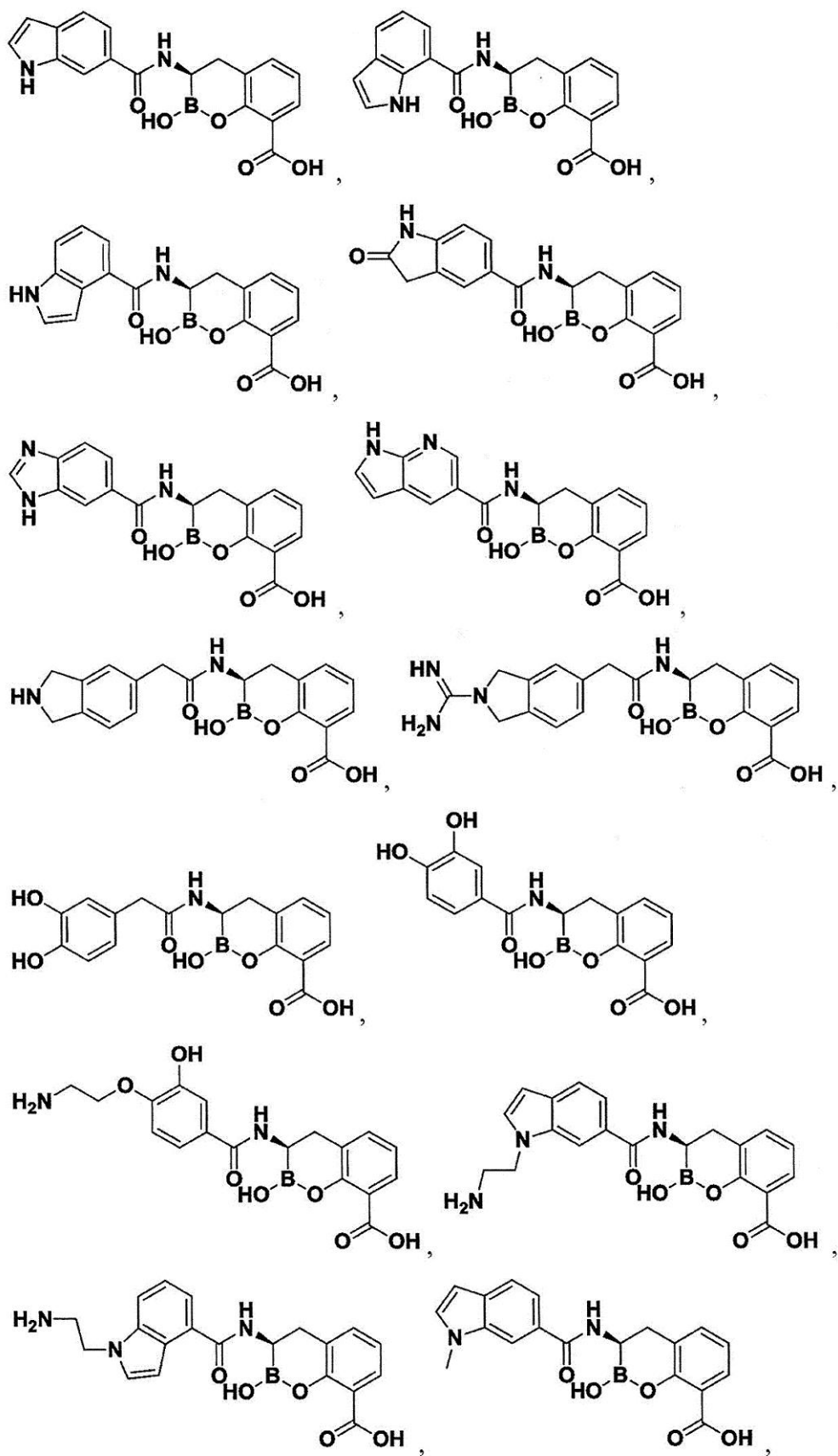
以下の構造：

【化 6】

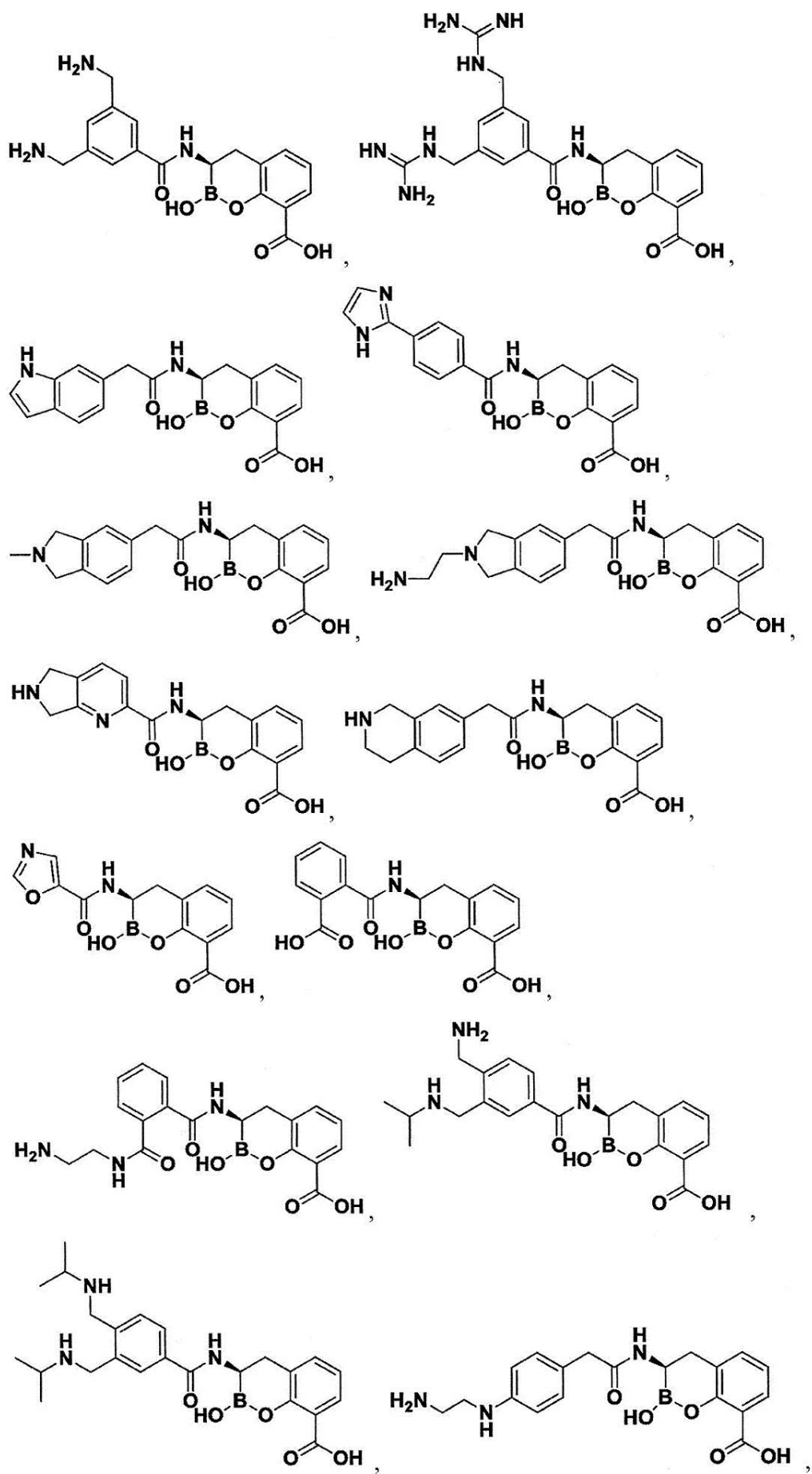


The image displays 12 chemical structures of substituted 2-aminobenzylboronic acid derivatives, arranged in a 4x3 grid. Each structure consists of a 2-aminobenzylboronic acid moiety (a benzene ring with an amino group at position 2, a methylene group at position 1, and a boronic acid group at position 3) linked via an amide bond to various aromatic and heterocyclic groups. The substituents include: 1) 1,2,4-triazol-5-yl, 2) 1,2,4,5-tetrahydropyrimidin-5-yl, 3) 4-aminophenyl, 4) 4-(diaminomethyl)phenyl, 5) 4-(dimethylaminomethyl)phenyl, 6) 4-(2-aminoethyl)phenyl, 7) 4-(2-amino-1-methyl-ethyl)phenyl, 8) 4-(2-amino-1-methyl-ethyl)phenyl, 9) 4-(2-amino-1-methyl-ethyl)phenyl, 10) 4-(2-amino-1-methyl-ethyl)phenyl, 11) 4-(2-amino-1-methyl-ethyl)phenyl, and 12) 4-(2-amino-1-methyl-ethyl)phenyl.

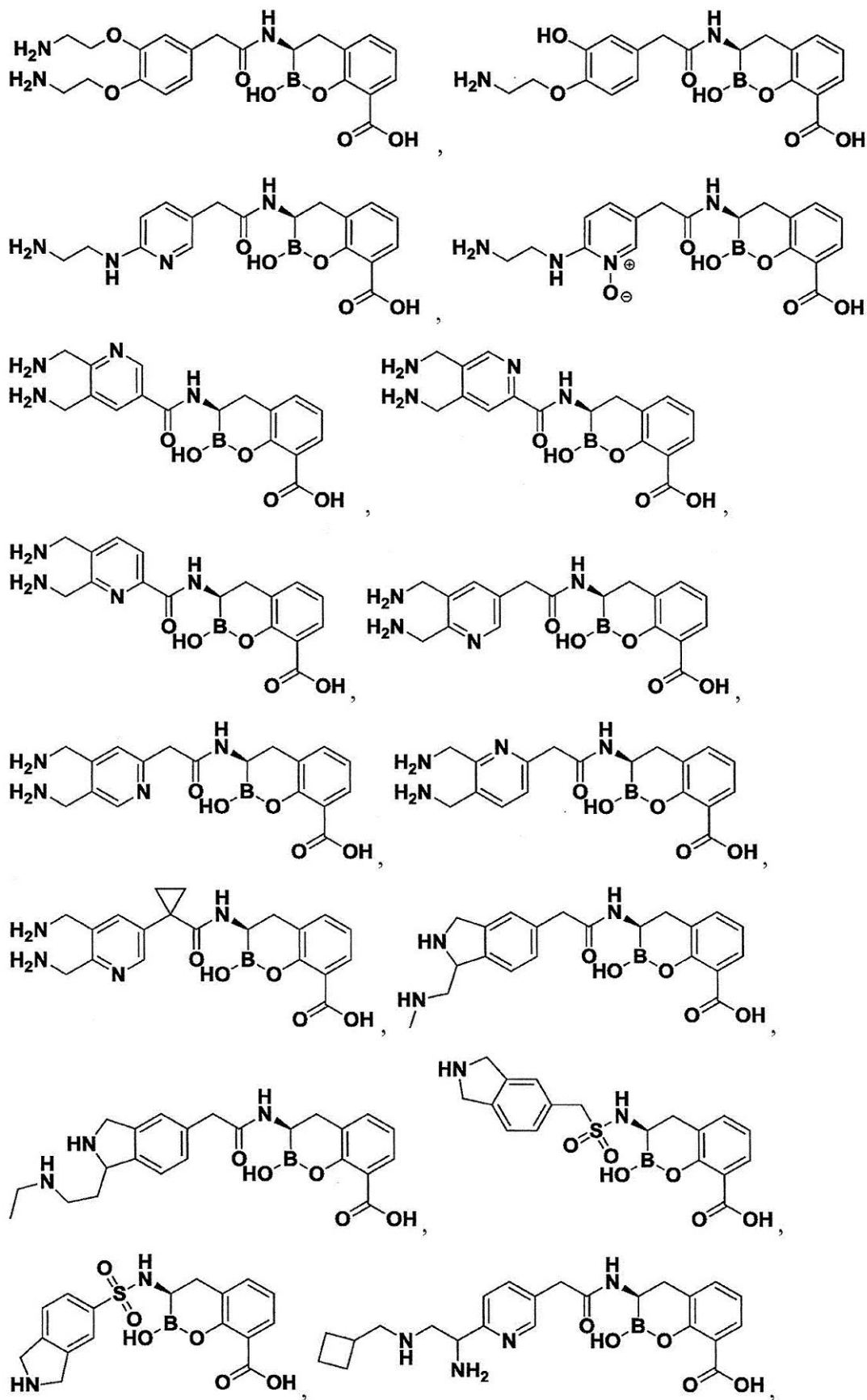
【化 8】



【化 9】



【化 10】



ベータ - ラクタム系抗生物質は、ペニシリン、セファロスポリン、カルバペネム、モノ

バクタム、架橋したモノバクタム、又はそれらの組み合わせである、ことを特徴とする請求項 4 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 3】

細菌感染を処置するための薬の製造における、ベータ - ラクタム系抗生物質の治療上効果的な量と組み合わせた、請求項 1 乃至 3 9 の何れか 1 つに記載の化合物の使用。

【請求項 4 4】

細菌感染を処置するための薬の製造における、任意にベータ - ラクタム系抗生物質と組み合わせた、請求項 4 0 乃至 4 2 の何れか 1 つに記載の医薬組成物の使用。