

【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 07 F 5/02 (2006.01)

A 61 K 31/69 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

【F I】

C 07 F 5/02 C S P C

A 61 K 31/69

A 61 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

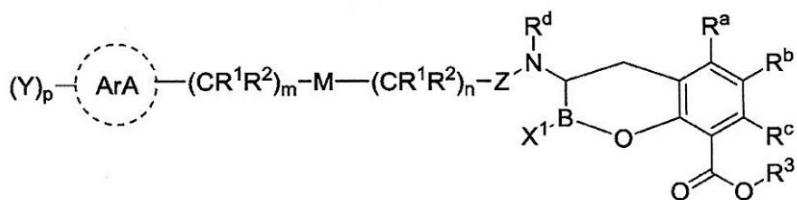
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

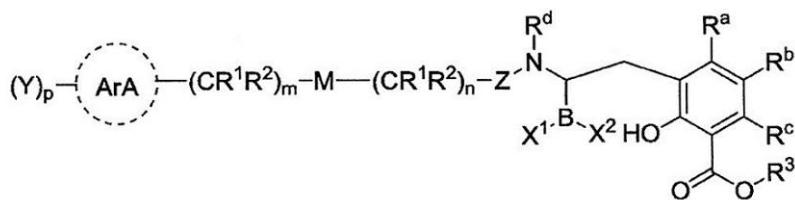
【請求項1】

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)-、SO₂-、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；

X^1 と X^2 は独立して、-OH、-OR⁸、又はFから選択され；

Z は、 $> C = O$ 、 $> C = S$ 、又は $> SO_2$ であり；

A_nAは、フルオロ、クロロ、ブロモ、-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、-OR¹⁻⁰、及び-SR¹⁻⁰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)_vNR⁴(CR⁶R⁷)_vNR⁴R⁵、-NR⁴(CR⁶R⁷)_vOR^{1,0}、-NR⁴(CR⁶R⁷)_vS(O)_{0,1,2}R^{1,0}、-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、-NR⁴(CR⁶R⁷)_vN(R⁴)C(=NR⁵)R⁶、-S(O)_{0,1,2}(CR⁶R⁷)_vC(=NR⁵)NR⁴R⁵、-(CR⁶R⁷)_vN(R⁴)C(=NR⁵)NR⁴R⁵、-NR⁴(CR⁶R⁷)_vN(R⁴)C(=NR⁵)NR⁴R⁵、-S(O)_{0,1,2}(CR⁶R⁷)_vC(=NR⁵)NR⁴R⁵、-O(CR⁶R⁷)_vN(R⁴)C(=NR⁵)NR⁴R⁵、-C(=NR⁵)NR⁴R⁵、-NR⁴(CR⁶R⁷)_vC(=NR⁵)NR⁴R⁵、-NR⁴C(=NR⁵)NR⁴R⁵、-C(=NR⁵)NR⁴R⁵、-NR⁴(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、-NR⁴R⁵、-ヘテロシクリル-N(R⁴)C(=NR⁵)NR⁴R⁵、-N(R⁴)-(CR⁶R⁷)_vヘテロアリール-NR⁴R⁵、-N(R⁴)-(CR⁶R⁷)_vヘテロシクリル-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、-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⁻、-NR⁴R⁹+(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

6

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、A r 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 $O H$ 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 $- NR^4 R^5$ 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】

$A r A$ は、ベンゼン、ナフタレン、ピリジン、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】

$A r A$ 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】

【請求項 19】

少なくとも1つのYは、- NR⁴R⁵、-(CR⁶R⁷)vNR⁴R⁵、- NR⁴(CR⁶R⁷)vNR⁴R⁵、- O(CR⁶R⁷)vNR⁴R⁵、- C(O)NR⁴(CR⁶R⁷)vNR⁴R⁵、- NR⁵C(=NR⁷)NR⁴(CR⁶R⁷)vNR⁴R⁵、- N(R⁴)C(=NR⁵)R⁶、-(CR⁶R⁷)vN(R⁴)C(=NR⁵)R⁶、- NR⁴(CR⁶R⁷)vN(R⁴)C(=NR⁵)R⁶、- (CR⁶R⁷)vC(=NR⁵)NR⁴R⁵、- NR⁴(CR⁶R⁷)vC(=NR⁵)NR⁴R⁵、- (CR⁶R⁷)vN(R⁴)C(=NR⁵)NR⁴R⁵、- NR⁴(CR⁶R⁷)vN(R⁴)C(=NR⁵)NR⁴R⁵、- NR⁴(CR⁶R⁷)vN(R⁴)C(=NR⁵)NR⁴R⁵、- NR⁴C(=NR⁵)NR⁴R⁵、- NR⁴(CR⁶R⁷)vC(=NR⁴)NR⁵、- (CR⁶R⁷)vC(=NR⁴)NR⁵、- NR⁴(CR⁶R⁷)vC(=NR⁴)NR⁵、- NR⁴C(=NR⁵)NR⁴R⁵、- NR⁴(CR⁶R⁷)vC(=NR⁴)NR⁵、- C(=NR⁴)NR⁴R⁵、- C(=NR⁴)NR⁴C(O)R⁶、- NR⁴C(O)R⁶、- (CR⁶R⁷)vC(O)NR⁴R⁵、- ヘテロシクリル-NR⁴R⁵、- ヘテロシクリル-N(R⁴)C(=NR⁵)NR⁴R⁵、- N(R⁴)-ヘテロシクリル-NR⁴R⁵、- (CR⁶R⁷)vヘテロシクリル-N(R⁴)C(=NR⁵)NR⁴R⁵、- (CR⁶R⁷)vヘテロシクリル、及び-NR⁴(CR⁶R⁷)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、 $-NR^4R^5$ 、 $-NR^4C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-C(=NR^4)NR^4R^5$ 、 $-N(R^4)C(=NR^5)R^6$ 、 $- (CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $- (CR^6R^7)_vN(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vOR^{10}$ 、 $- (CR^6R^7)_vNR^4(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-NR^5C(=NR^5)NR^4(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_vN(R^4)C(=NR^5)NR^4R^5$ 、 $-NR^5C(O)CR^6(NR^4R^5)(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $- (CR^6R^7)_vN(R^4)C(O)(CR^6R^7)_vNR^4R^5$ 、 $-C(=NR^4)NR^4C(O)R^6$ 、 $-NR^4(CR^6R^7)_v$ 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 $-NR^4R^5$ 、 $-$ 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。

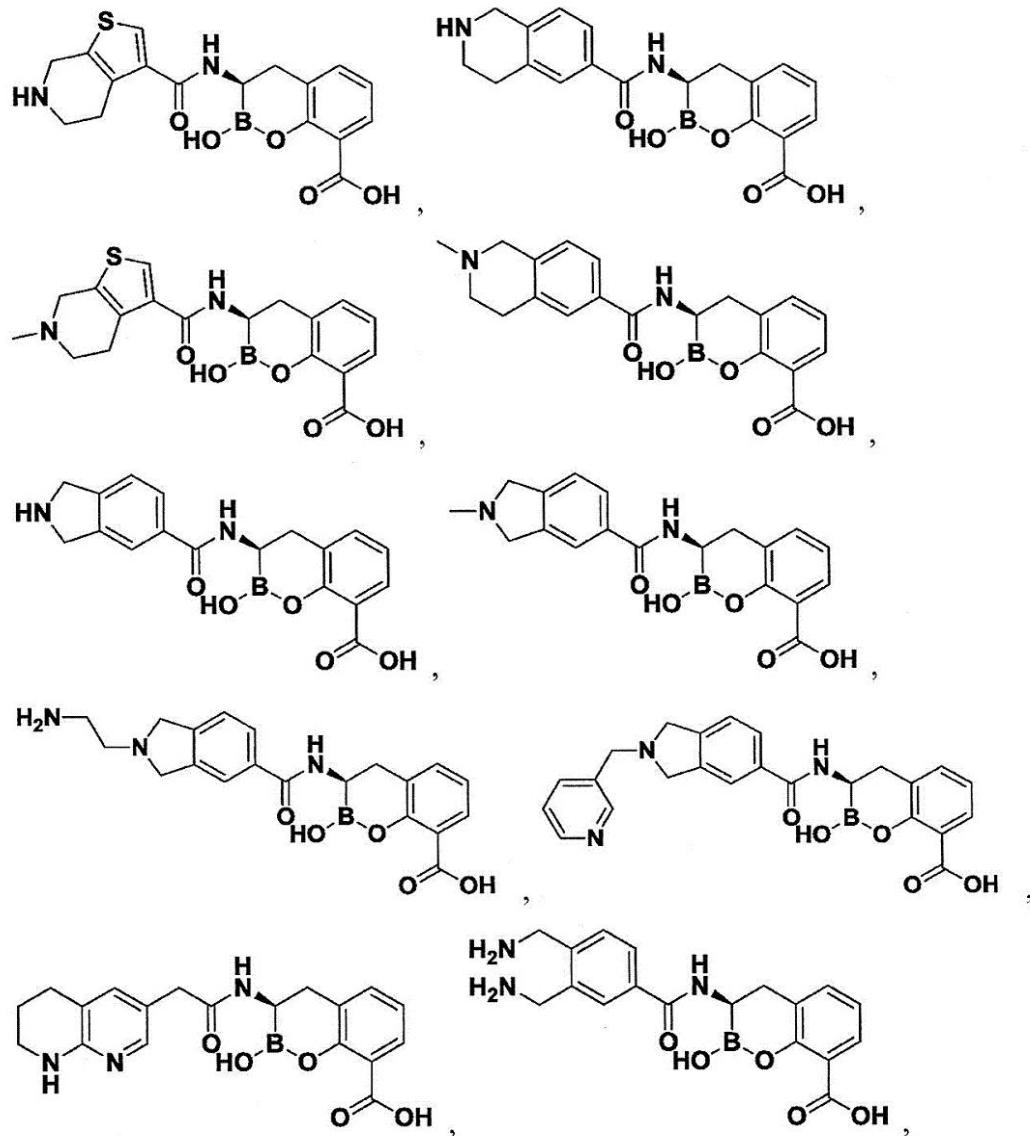
【請求項 3 7】

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。

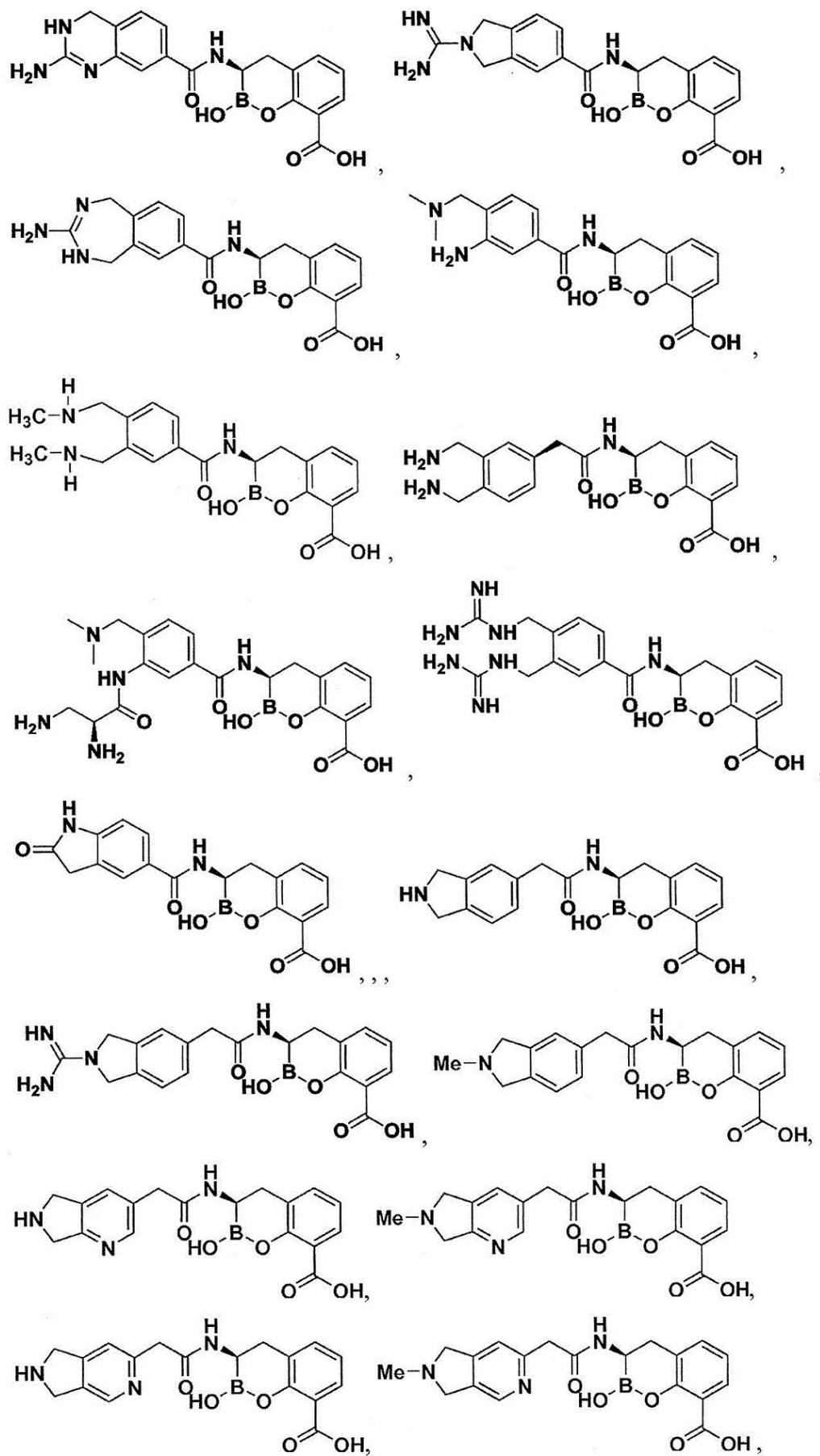
【請求項 3 8】

以下の構造：

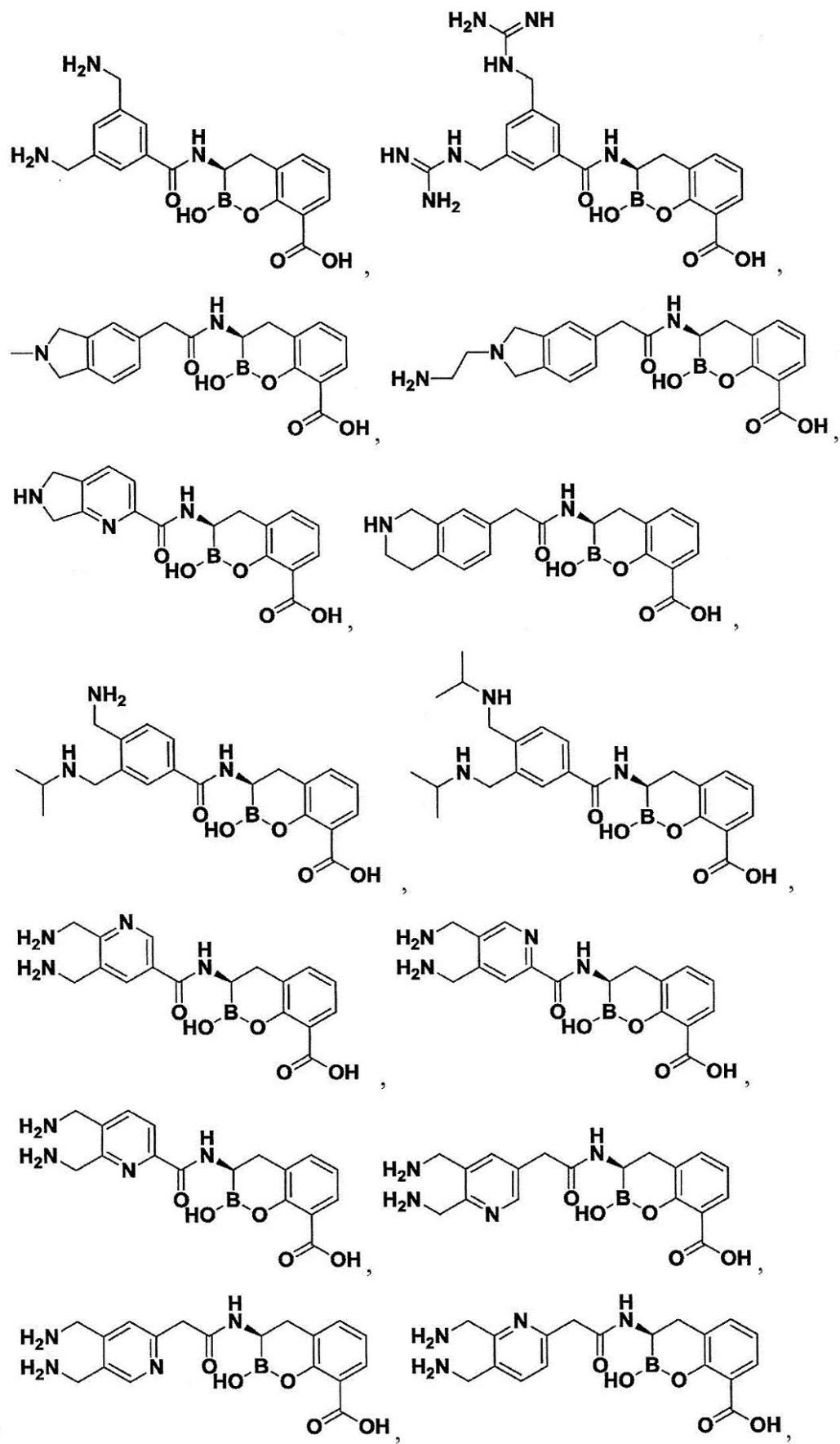
【化 2】



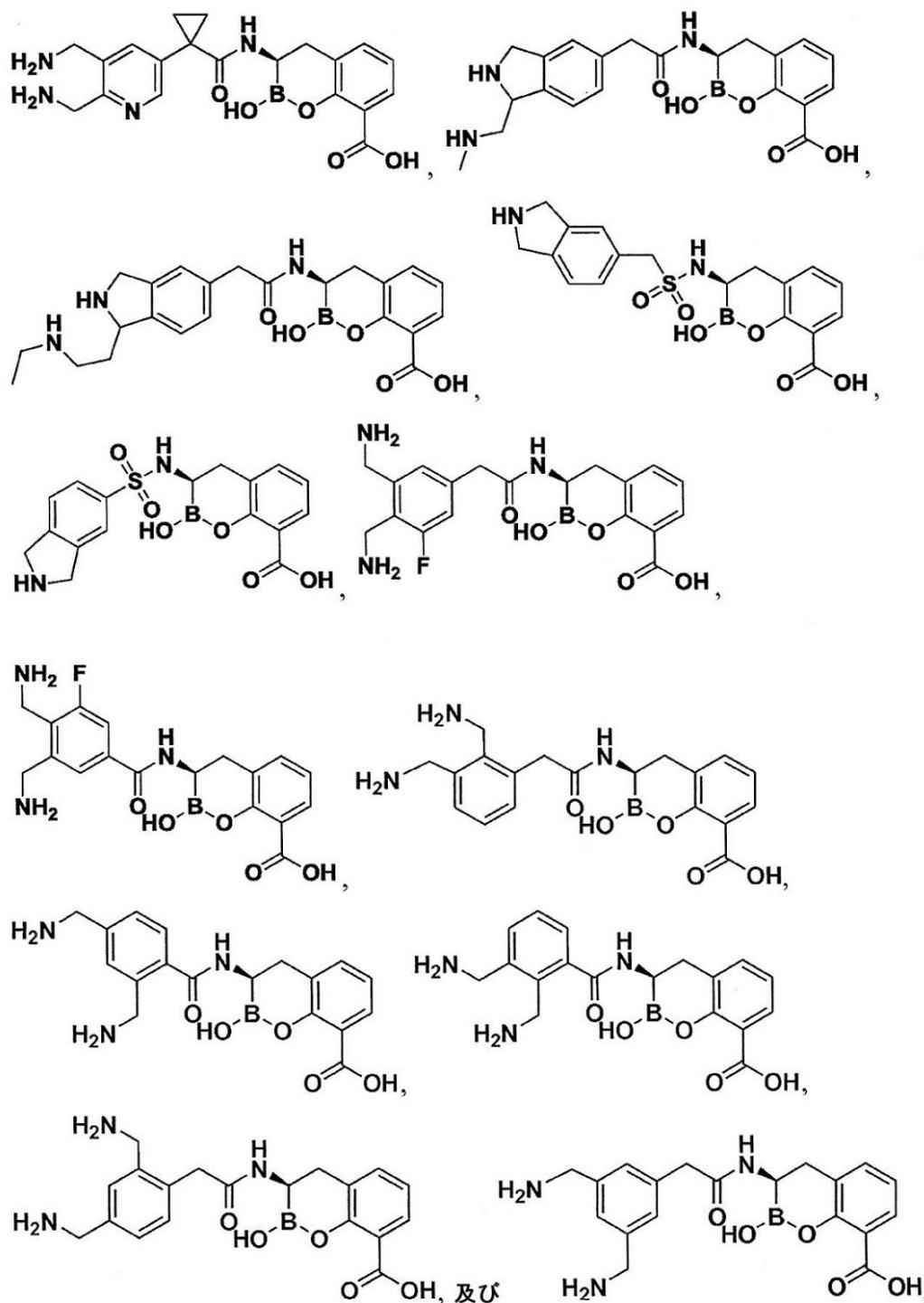
【化 3】



【化 4】



【化5】

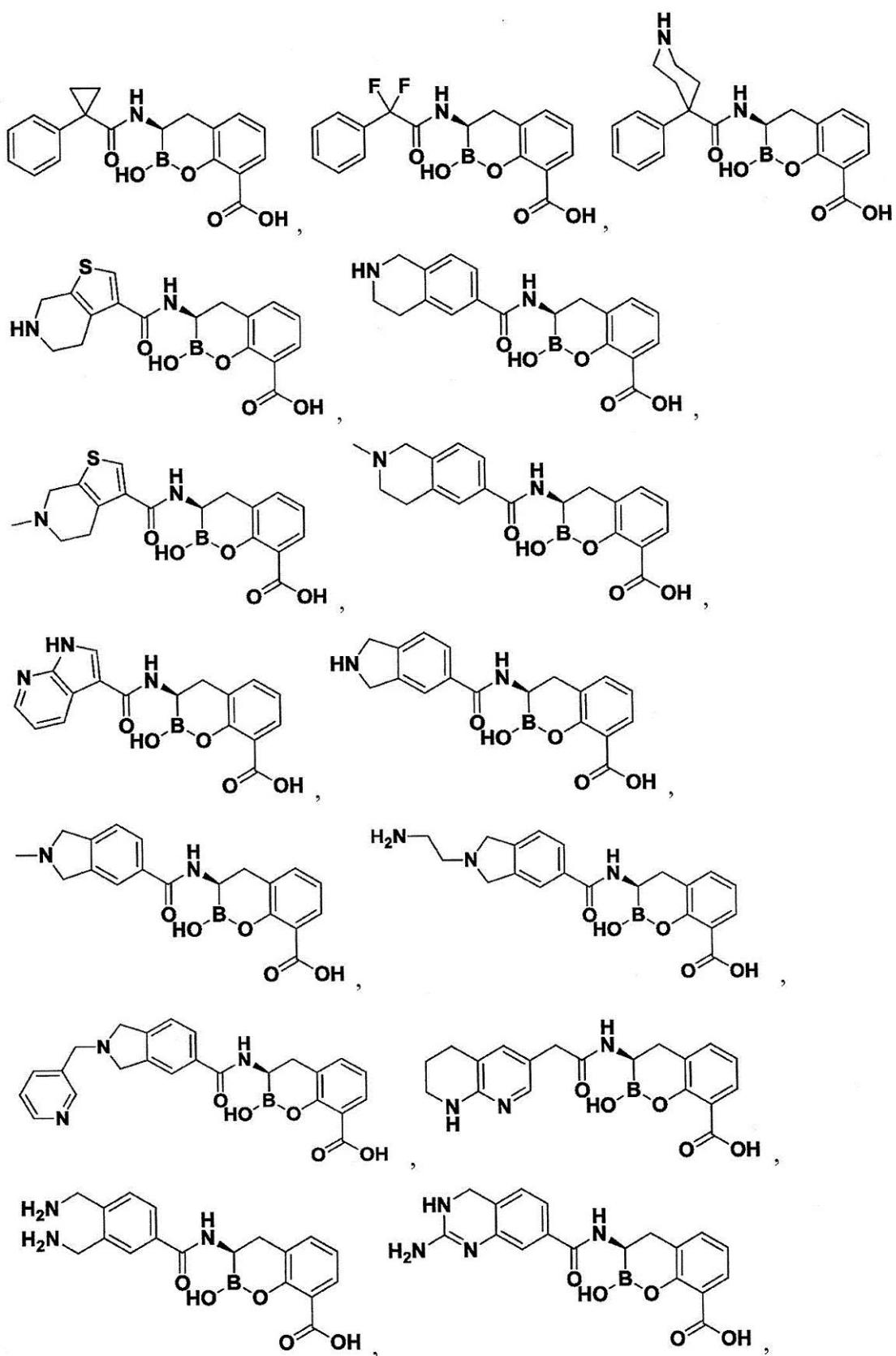


によって表わされる群から選択される請求項1に記載の化合物、又は、それらの薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、多形体、立体異性体、互変異性体、プロドラッグ、代謝物、N-オキシド、又は異性体であって、ここで、化合物は、式Iに係る閉鎖した環式形態に存在するか、及び上記構造に示されるように、式Iaに係る開放した非環式形態に存在するか、又はそれらの混合物で存在する、ことを特徴とする請求項1に記載の化合物。

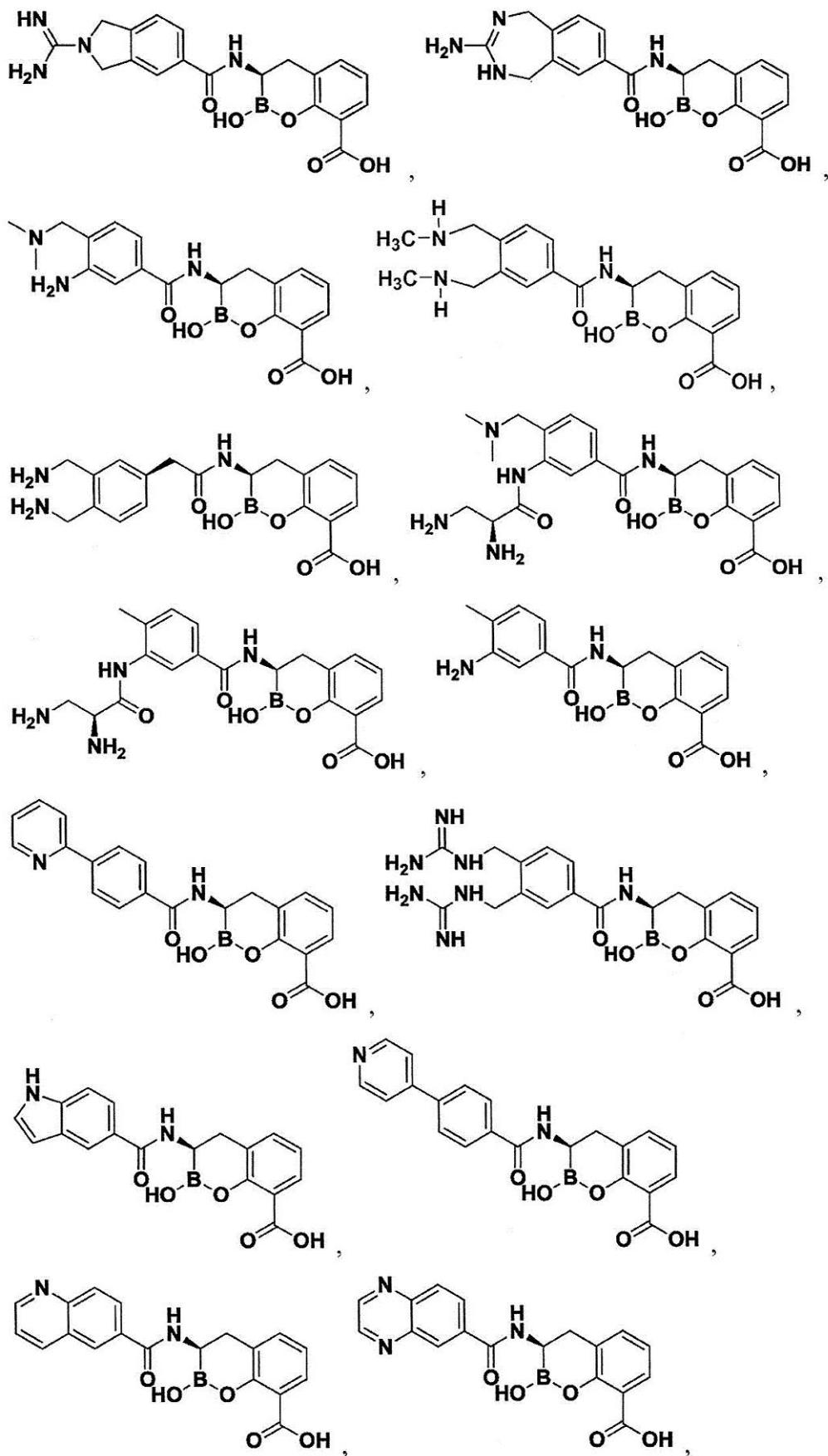
【請求項39】

以下の構造：

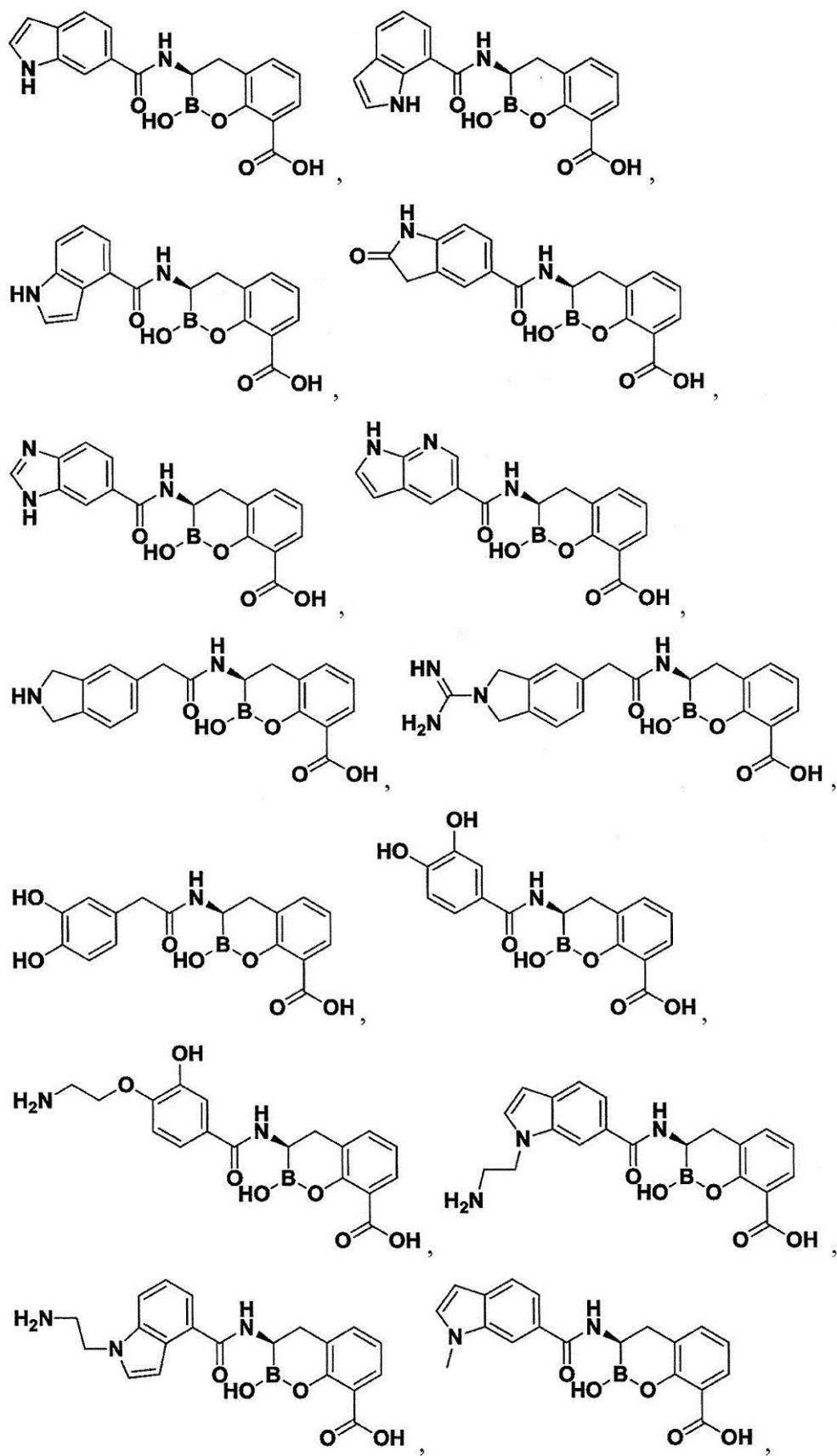
【化 6】



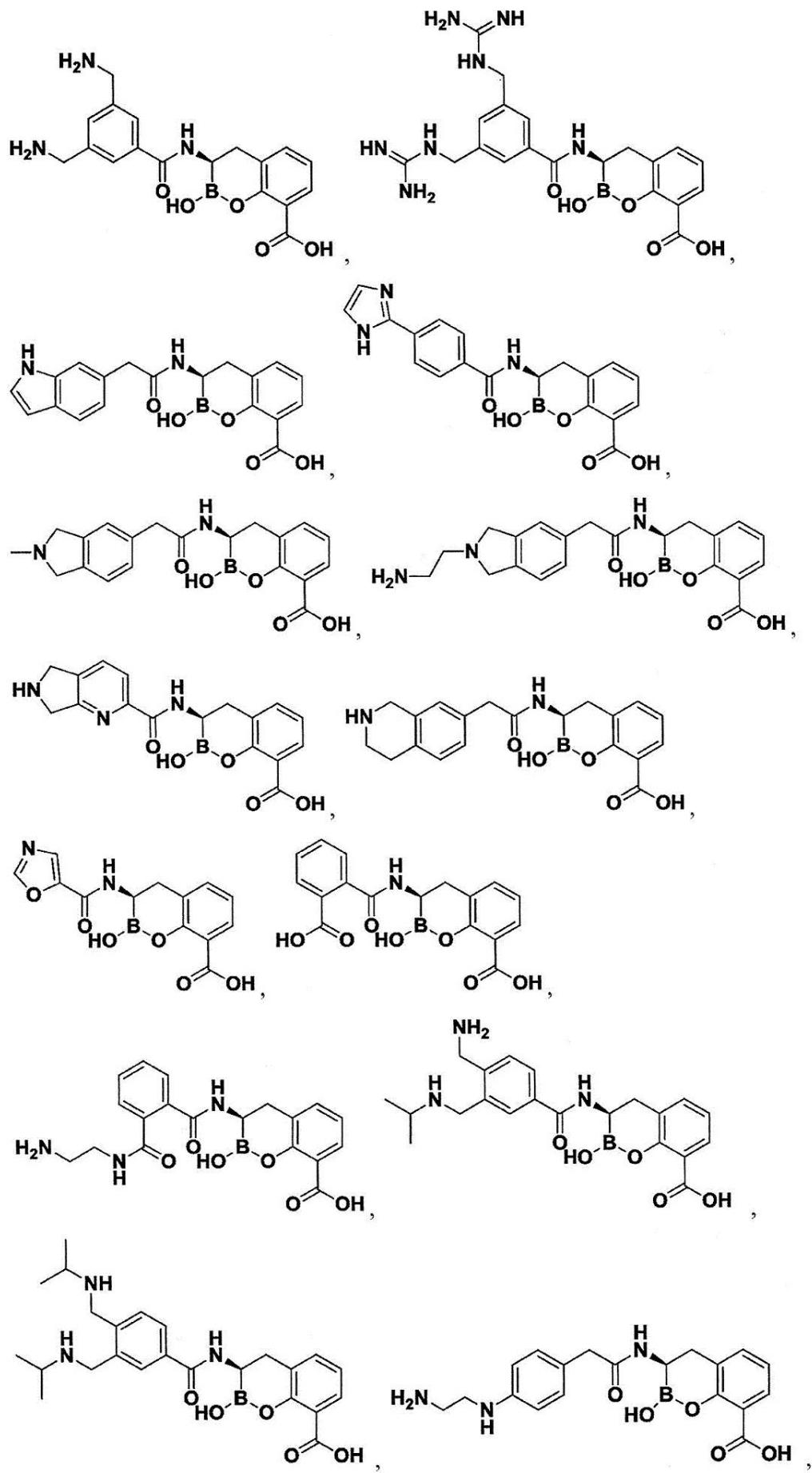
【化 7】



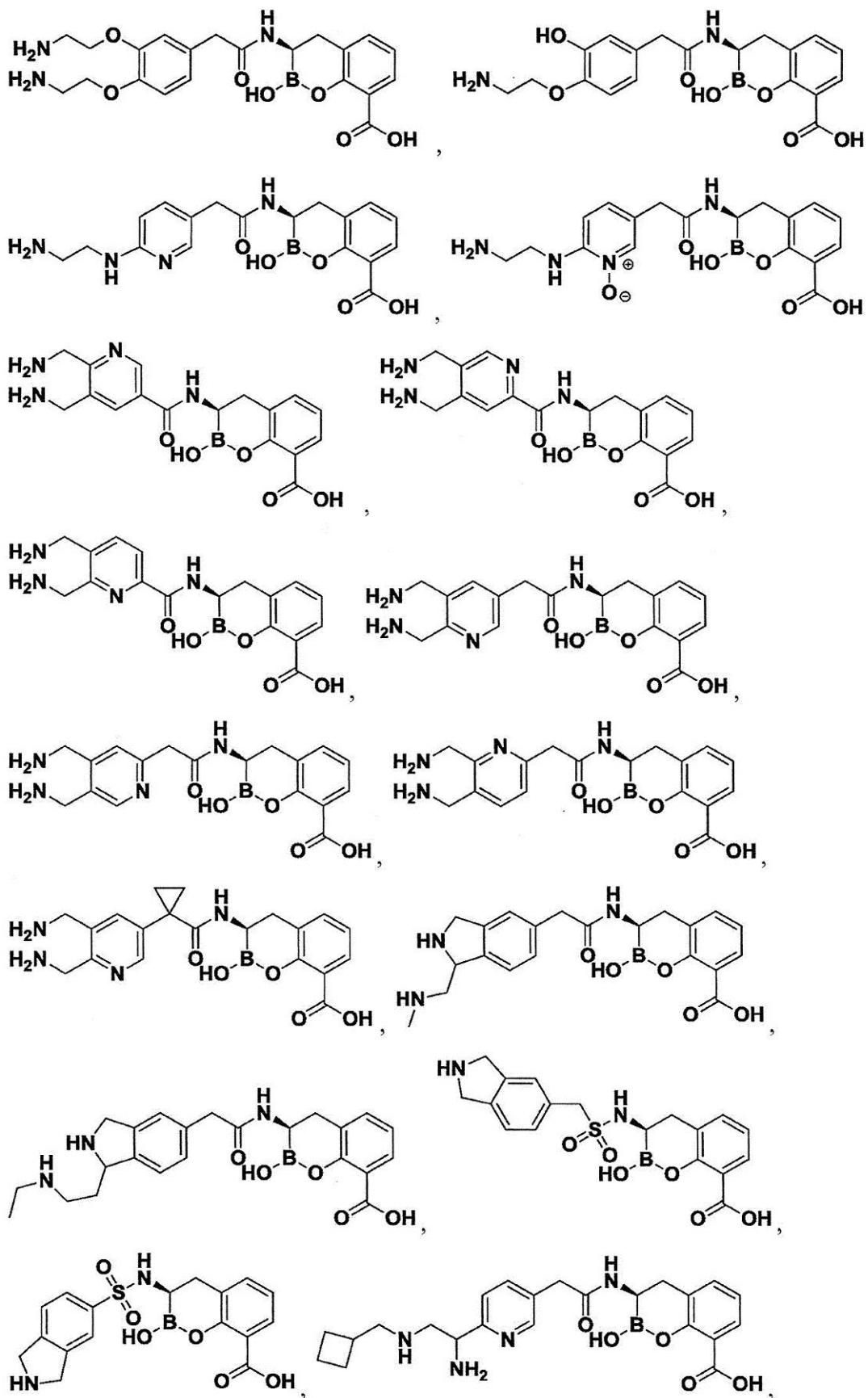
【化 8】



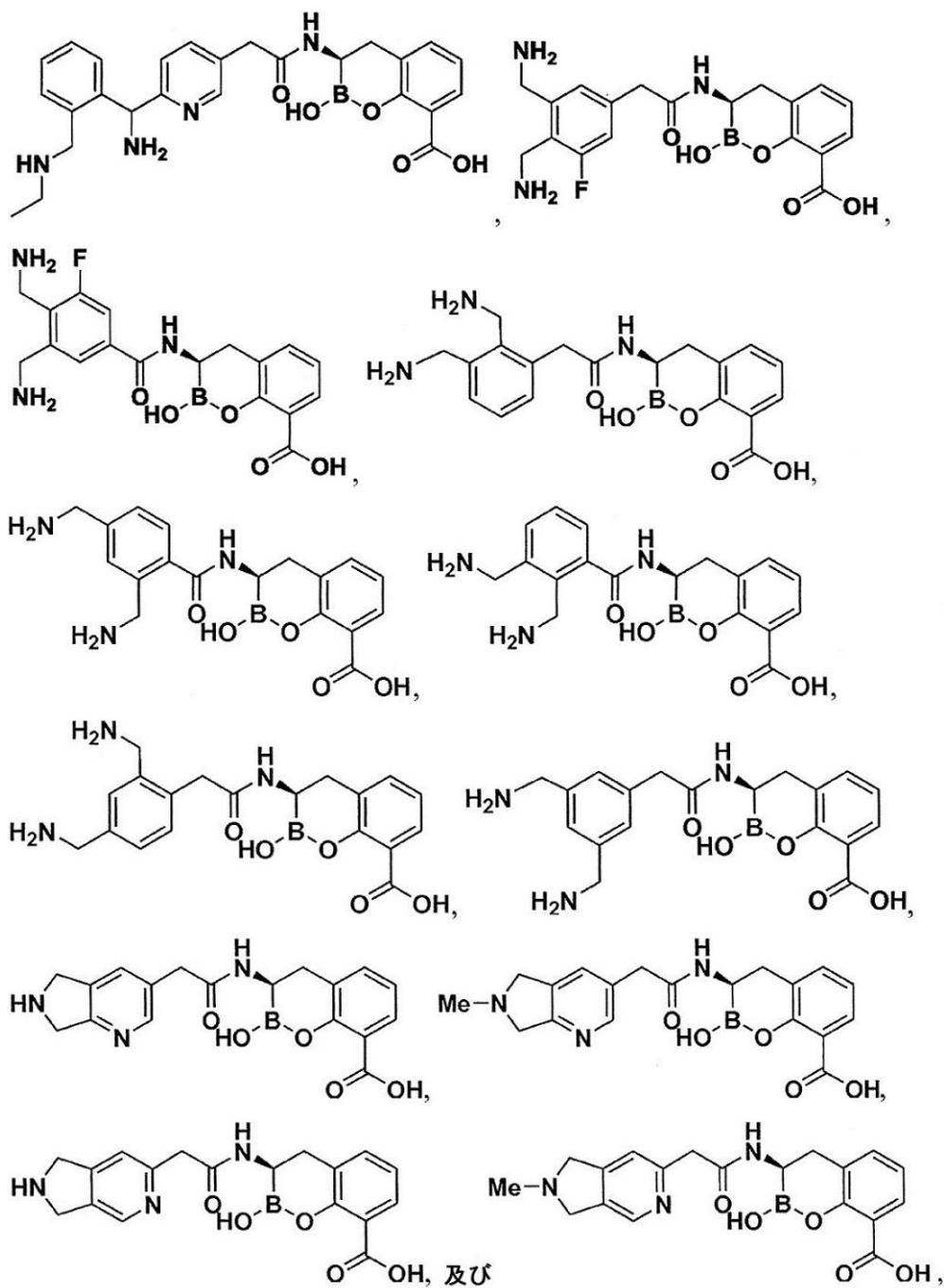
【化 9】



【化 1 0】



【化 1 1】



によって表わされる群から選択される化合物、又は、それらの薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、多形体、立体異性体、互変異性体、プロドラッグ、代謝物、N - オキシド、又は異性体であって、ここで、化合物は、式 I に係る閉鎖した環式形態に存在するか、及び上記構造に示されるように、式 I a に係る開放した非環式形態に存在するか、又はそれらの混合物で存在する、ことを特徴とする化合物。

【請求項 4 0】

請求項 1 乃至 3 9 の何れか 1 つに記載の化合物、又はそ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、及び、薬学的に許容可能な賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項 4 1】

ベータ - ラクタム系抗生物質を更に含む、請求項 4 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 2】

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41に記載の医薬組成物。

【請求項43】

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39の何れか1つに記載の化合物の使用。

【請求項44】

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40乃至42の何れか1つに記載の医薬組成物の使用。