

【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28年8月18日 (2016.8.18)

【公開番号】特開2016-121171 (P2016-121171A)

【公開日】平成28年7月7日 (2016.7.7)

【年通号数】公開・登録公報2016-040

【出願番号】特願2016-15912 (P2016-15912)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/10 (2006.01)

C 0 7 D 251/16 (2006.01)

C 0 7 D 403/10 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 239/48 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/53 (2006.01)

A 6 1 K 31/513 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

C 0 7 D 487/10 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 239/22 (2006.01)

C 0 7 D 239/47 (2006.01)

C 0 7 D 471/10 (2006.01)

A 6 1 P 31/06 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 239/10 C S P

C 0 7 D 251/16 B

C 0 7 D 403/10

C 0 7 D 401/04

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 239/48

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 417/12

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 403/06

C 0 7 D 403/04

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 405/12
 A 6 1 K 31/53
 A 6 1 K 31/513
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 K 31/551
 A 6 1 K 31/55
 C 0 7 D 487/10
 A 6 1 P 31/04
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 C 0 7 D 239/22
 C 0 7 D 239/47 Z
 C 0 7 D 471/10 1 0 1
 A 6 1 P 31/06
 A 6 1 P 13/02 1 0 5

【手続補正書】

【提出日】平成28年6月6日(2016.6.6)

【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

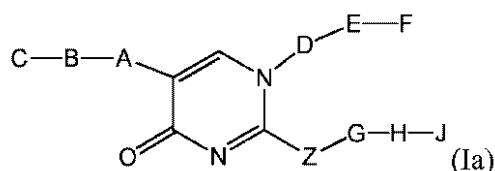
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式：

【化 1】



(式中、Zは NR^4 COおよび NR^4CONR^4 からなる群から選択され、 R^4 は水素であり、

C - B - A -、- D - E - Fおよび- G - H - Jは化学的部分であり、

- D - E - Fは、水素であり、

Aは、

(d d) 1 個もしくは複数の窒素原子を含む 6 員、7 員、8 員、9 員、10 員、11 員、または 12 員の飽和または芳香族複素環、(e e) 3 ~ 14 員の芳香族炭素環、ならびに (f f) - (CR^6R^6)_t -

からなる群から選択され、

(d d) または (e e) は 1 つもしくは複数の R^5 基で置換されてもよく；

Gは、

(a) 単結合、

(b) - ($\text{C}_{1 \sim 8}$ アルキル) - であって、

(i) 該 - ($\text{C}_{1 \sim 8}$ アルキル) - における 0 - 4 個の炭素原子は - NR^6 - 部分によって置換されてもよく、

(i i) 該 - ($\text{C}_{1 \sim 8}$ アルキル) - は 1 つもしくは複数の R^5 基で置換されてもよく

(f) - NR^6 - 、(d d) 窒素および酸素からなる群から選択される 1 個もしくは複数のヘテロ原子を含む 3 ~ 14 員芳香族複素環、(e e) 3 ~ 14 員の飽和または芳香族炭

素環、ならびに $(ff) - (CR^6R^6)_t -$

からなる群から選択され、

(dd) または (ee) は 1 つもしくは複数の R^5 基で置換されてもよく、

B は、

(b) 1 個もしくは複数の窒素原子を含む 3 ~ 14 員飽和複素環、

$(d) - (C_{1-8} \text{ アルキル}) -$ 、 $(e) - (C_{2-8} \text{ アルケニル}) -$

(ここで、

i) すぐ上の $(d) \sim (e)$ のいずれかの 0 ~ 4 個の炭素原子は $-O-$ 、 $-NR^6-$ または $-C(=NR^6)-$ からなる群から選択される部分で置換されてもよく、

ii) すぐ上の $(d) \sim (e)$ のいずれかは 1 つまたは複数の R^5 基で置換されてもよく、

iii) すぐ上の $(d) \sim (e)$ のいずれかは $-(C_{1-8} \text{ アルキル}) - R^5$ 基で置換されてもよい) ; ならびに

$(g) - (CR^6R^6)_t -$

からなる群から独立に選択され、

H は、

(a) 単結合、

(b) 窒素および酸素からなる群から選択される 1 個もしくは複数のヘテロ原子を含む 3 ~ 14 員の飽和または芳香族複素環、

(c) 3 ~ 14 員の飽和または芳香族炭素環

(ここで、(b) または (c) は 1 つもしくは複数の R^5 基で置換されていてもよい) ;

$(d) - (C_{1-8} \text{ アルキル}) -$

(ここで、

i) すぐ上の $(d) \sim (f)$ のいずれかの 0 ~ 4 個の炭素原子は $-O-$ 、 $-S(O)_p$ 、 $-NR^6-$ 、 $-(C=O)-$ および $-NR^6S(O)_p-$ からなる群から選択される部分で置換されてもよく、

ii) すぐ上の (d) は 1 つまたは複数の R^5 基で置換されてもよく、

ならびに

$(g) - (CR^6R^6)_t -$

からなる群から選択され、

C は、

(a) 水素、 $(h) - CN$ 、 $(k) - NR^6(CR^6R^6)_tR^8$ 、 $(l) - OR^8$ 、 $(m) - S(O)_p(CR^6R^6)_tR^8$ 、 $(n) - C(O)(CR^6R^6)_tR^8$ 、 $(s) - C(O)NR^6(CR^6R^6)_tR^8$ 、 $(t) - C(=NR^6)(CR^6R^6)_tR^8$ 、 $(y) - OC(O)NR^6(CR^6R^6)_tR^8$ 、 $(dd) - NR^6R^8$ 、 $(ee) - NR^6(CR^6R^6)R^8$ 、 $(ff) - OH$ 、 $(gg) - NR^8R^8$ 、 $(ii) - S(O)_pR^8$ 、 $(kk) - NR^6C(NR^6)NR^6R^8$ 、 $(ll) C_{1-8} - \text{アルキル基}$ 、 $(mm) C_{2-8} - \text{アルケニル基}$ 、 (oo) 窒素および硫黄からなる群から選択される 1 個もしくは複数のヘテロ原子を含む 3 ~ 14 員の飽和または芳香族複素環、 $(pp) 3 \sim 14 \text{ 員飽和炭素環}$ 、および $(vv) - C(O)(CR^6)[(CR^6R^6)_tR^8]R^8$

からなる群から選択され、

ここで、 $(ll) \sim (mm)$ および $(oo) \sim (pp)$ は 1 つまたは複数の R^7 基で置換されてもよく、

J は、

(a) 水素、 $(c) F$ 、 $(d) Cl$ 、 $(g) - CF_3$ 、 $(h) - CN$ 、 $(j) - NO_2$ 、 $(k) - NR^6(CR^6R^6)_tR^8$ 、 $(l) - OR^8$ 、 $(m) - S(O)_p(CR^6R^6)_tR^8$ 、 $(s) - C(O)NR^6(CR^6R^6)_tR^8$ 、 $(aa) - NR^6S(O)_p(CR^6R^6)_tR^8$ 、 $(dd) - NR^6R^8$ 、 $(ee) - NR^6(CR^6R^6)R^8$ 、 $(ff) - OH$ 、 $(gg) - NR^8R^8$ 、 $(hh) - OCH_3$ 、 $(ii) - S(O)_p$

R^8 、 $(kk) - NR^6 C(NR^6) NR^6 R^8$ 、 $(ll) C_{1-8}$ - アルキル基、 (oo) 窒素、酸素および硫黄からなる群から選択される 1 個もしくは複数のヘテロ原子を含む 3 ~ 14 員の飽和または芳香族複素環、 $(pp) 3 \sim 14$ 員の飽和または芳香族炭素環、 $(qq) - (CR^6 R^6)_t NR^6 (CR^6 R^6)_t R^8$ 、 $(ss) - (CR^6 R^6)_t N[(CR^6 R^6)_t R^8][(CR^6 R^6)_t R^8]$ 、 $(uu) -$ ハロアルキルおよび $(ww) - (CR^6 R^6)_t C(O) NR^8 R^8$

からなる群から独立に選択され、

$(ll) \sim (pp)$ は 1 つまたは複数の R^7 基で置換されてもよく；

R^5 は、 (a) 水素、 (b) F、 (c) Cl、 $(f) - CF_3$ 、 $(g) - CN$ 、 $(i) - NO_2$ 、 $(j) - NR^6 R^6$ 、 $(k) - OR^8$ 、 $(l) - NR^6 (CNR^6) NR^6 R^6$ 、 $(m) - C_{1-8}$ アルキル、 $(p) - (C_{1-8}$ アルキル) - (1 個もしくは複数の窒素および酸素を含む 3 ~ 14 員芳香族複素環)、 $(q) - (C_{1-8}$ アルキル) - (3 ~ 14 員飽和炭素環)、 $(r) -$ ハロアルキル、 $(s) - SR^6$ 、 (t) 窒素、酸素および硫黄からなる群から選択される 1 個もしくは複数のヘテロ原子を含む - 3 ~ 14 員の飽和または芳香族複素環、ならびに $(u) - 3 \sim 14$ 員飽和炭素環から選択され；

(m) 、 $(p) \sim (r)$ および $(t) \sim (u)$ は 1 つまたは複数の R^8 で置換されてもよく；

R^6 は (a) 水素、 $(b) - C_{1-8}$ アルキル、 $(c) -$ ハロアルキル、 (d) 窒素、酸素および硫黄からなる群から選択される 1 個もしくは複数のヘテロ原子を含む - 3 ~ 14 員の飽和または芳香族複素環、ならびに $(e) - 3 \sim 14$ 員の飽和または芳香族炭素環から選択されるか、あるいは 2 つの R^6 基は一緒になって炭素環を形成しており；

$(b) \sim (e)$ は 1 つまたは複数の R^8 で置換されてもよく；

R^7 は、 (a) 水素、 (b) F、 (c) Cl、 $(f) - CF_3$ 、 $(g) - CN$ 、 $(i) - NO_2$ 、 $(j) - NR^6 R^6$ 、 $(k) - OR^6$ 、 $(l) - NR^6 (CNR^6) NR^6 R^6$ 、 $(m) - C_{1-8}$ アルキル、 $(n) - C_{1-8}$ アルケニル、 $(p) - (C_{1-8}$ アルキル) - (窒素および酸素からなる群から選択される 1 個もしくは複数のヘテロ原子を含む 3 ~ 14 員芳香族複素環)、 $(q) - (C_{1-8}$ アルキル) - (3 ~ 14 員芳香族炭素環)、 $(r) -$ ハロアルキル、 $(s) - NR^6 R^8$ 、 $(t) - OR^8$ 、 $(u) - (CR^6 R^6)_t NR^6 R^8$ 、 $(v) - CR^6 R^8 R^8$ 、 $(w) - SR^6$ 、 (x) 窒素、酸素および硫黄からなる群から選択される 1 個もしくは複数のヘテロ原子を含む - 3 ~ 14 員芳香族複素環、 $(y) - 3 \sim 14$ 員の飽和または芳香族炭素環、 $(z) - (CR^6 R^6)_t C(O) NR^8 R^8$ 、 $(aa) - S(O)_p R^8$ 、 $(bb) - NR^6 C(O) NR^6 R^6$ 、 $(cc) - NR^6 C(O) R^6$ 、ならびに $(dd) - C(=NR^6) NR^6 R^6$ から選択され；

(m) 、 (n) 、 (q) 、 (x) および (y) は 1 つまたは複数の R^9 で置換されてもよく；

R^8 は、 (a) 水素、 (b) F、 (c) Cl、 $(f) - CF_3$ 、 $(g) - CN$ 、 $(i) - NO_2$ 、 $(j) - NR^6 R^9$ 、 $(k) - OR^9$ 、 $(l) - NR^6 (CNR^6) NR^6 R^6$ 、 $(m) - C_{1-8}$ アルキル、 $(n) - C_{1-8}$ アルケニル、 $(p) - (C_{1-8}$ アルキル) - (窒素および硫黄からなる群から選択される 1 個もしくは複数のヘテロ原子を含む 3 ~ 14 員の飽和または芳香族複素環)、 $(q) - (C_{1-8}$ アルキル) - (3 ~ 14 員飽和炭素環)、 (r) 窒素、酸素および硫黄からなる群から選択される 1 個もしくは複数のヘテロ原子を含む - 3 ~ 14 員の飽和または芳香族複素環、 $(s) - 3 \sim 14$ 員の飽和または芳香族炭素環、 $(t) -$ ハロアルキル、 $(u) - C(O) (CR^6 R^6)_t R^9$ 、 $(v) - SR^6$ 、 $(x) - NR^6 C(O) NR^6 R^9$ 、 $(y) - NR^6 C(O) R^9$ 、 $(z) - NR^6 (CNR^9) (NR^6 R^6)$ 、 $(bb) - C(=NR^9) NR^6 R^6$ 、 $(cc) - S(O)_p R^9$ 、 $(dd) - (CR^6 R^6)_t C(O) NR^6 R^9$ 、 $(ee) - (CR^6 R^6)_t OR^9$ および $(ff) - (CR^6 R^6)_t NR^6 R^9$ から選択され；

(m) 、 (n) および $(p) \sim (s)$ は 1 つまたは複数の R^9 で置換されてもよく；

R^9 は、 (a) 水素、 (b) F、 (c) Cl、 $(f) - CF_3$ 、 $(g) - CN$ 、 $(i) -$

NO_2 、 $(j) - \text{NR}^6 \text{R}^{10}$ 、 $(k) - \text{OR}^6$ 、 $(l) - \text{NR}^6 (\text{CNR}^6) \text{NR}^6 \text{R}^6$ 、 $(n) - \text{C}_{1 \sim 8}$ アルキル、 $(o) - \text{C}_{1 \sim 8}$ アルケニル、 (q) 窒素、酸素および硫黄からなる群から選択される1個もしくは複数のヘテロ原子を含む - 3 ~ 14 員の飽和または芳香族複素環、 $(s) - \text{ハロアルキル}$ 、 $(t) - (\text{CR}^6 \text{R}^6)_t \text{OR}^6$ 、 $(v) - \text{C}(\text{O}) \text{R}^6$ 、 $(w) - \text{SR}^6$ 、 $(x) - \text{C}(\text{O}) \text{OR}^{10}$ 、 $(y) - \text{S}(\text{O})_p \text{R}^6$ 、 $(z) - (\text{C}_{1 \sim 8} \text{アルキル}) - (\text{窒素および酸素からなる群から選択される1個もしくは複数のヘテロ原子を含む3 ~ 14 員の飽和または芳香族複素環})$ 、 $(cc) - \text{C}(=\text{NR}^6) \text{NR}^6 \text{R}^6$ 、 $(ee) - \text{NR}^6 \text{C}(\text{O}) \text{NR}^6 \text{R}^6$ 、 $(gg) - \text{NR}^6 \text{C}(\text{O}) \text{R}^6$ 、ならびに $(hh) - (\text{CR}^6 \text{R}^6)_t \text{NR}^6 \text{R}^{10}$ から選択され；

(n) 、 (o) 、 (q) および (z) は1つまたは複数の R^{10} で置換されてもよく；
 R^{10} は、 (a) 水素、 (b) F、 (c) Cl、 $(f) - \text{CF}_3$ 、 $(g) - \text{CN}$ 、 $(j) - \text{NR}^6 \text{R}^6$ 、 $(k) - \text{OR}^6$ 、 $(l) - \text{NR}^6 (\text{CNR}^6) \text{NR}^6 \text{R}^6$ 、 $(n) - \text{C}_{1 \sim 8}$ アルキル、 (q) 1個もしくは複数の窒素原子を含む - 3 ~ 14 員芳香族複素環、 $(s) - \text{ハロアルキル}$ 、 $(t) - (\text{CR}^6 \text{R}^6)_t \text{OR}^6$ 、 $(v) - \text{C}(\text{O}) \text{R}^6$ 、 $(w) - \text{SR}^6$ 、 $(x) - \text{C}(\text{O}) \text{OR}^6$ 、 $(y) - \text{S}(\text{O})_p \text{R}^6$ 、 $(z) - (\text{C}_{1 \sim 8} \text{アルキル}) - (\text{窒素および酸素からなる群から選択される1個もしくは複数のヘテロ原子を含む3 ~ 14 員の飽和または芳香族複素環})$ 、 $(cc) - \text{C}(=\text{NR}^6) \text{NR}^6 \text{R}^6$ 、 $(ee) - \text{NR}^6 \text{C}(\text{O}) \text{NR}^6 \text{R}^6$ 、 $(gg) - \text{NR}^6 \text{C}(\text{O}) \text{R}^6$ 、ならびに $(hh) - (\text{CR}^6 \text{R}^6)_t \text{NR}^6 \text{R}^6$ から選択され；

p は0または2であり、

t は1、2または3である）

を有する化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体。

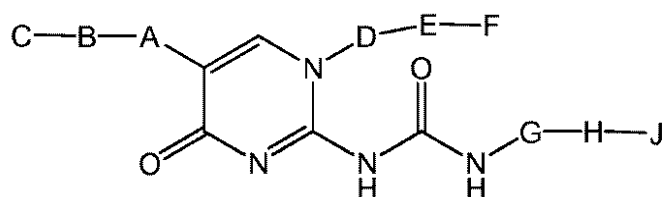
【請求項2】

Z が $-\text{NR}^4 \text{CONR}^4 -$ である、請求項1に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体。

【請求項3】

式：

【化2】



を有する、請求項2に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体。

【請求項4】

A が、

(a) 1個もしくは複数の窒素原子を含む6員の飽和または芳香族複素環、ならびに

(b) 3 ~ 14 員芳香族炭素環

から選択され、 (a) または (b) は1つもしくは複数の R^5 基で置換されてもよく；

B が、 $(a) - (\text{C}_{2 \sim 8} \text{アルキル}) -$ および $(b) - (\text{C}_{2 \sim 8} \text{アルケニル})$ から選択され、

i) すぐ上の (a) および (b) のいずれかにおける0 ~ 4 個の炭素原子は $-\text{O}-$ 、 $-\text{NR}^6 -$ および $-\text{C}(=\text{NR}^6) -$ からなる群から選択される部分で置き換えられてもよく、

ii) すぐ上の (a) および (b) のいずれかは1つまたは複数の R^5 基で置換されてもよく、

iii) すぐ上の (a) および (b) のいずれかは $-(\text{C}_{1 \sim 8} \text{アルキル}) - \text{R}^5$ 基で置換されてもよく、そして

C が、(a) NH_2 、(b) $-\text{NHC}(=\text{NH})\text{NH}_2$ および (c) 水素から選択される、請求項 3 に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体。

【請求項 5】

A が、アゼパニル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、フェニル、ピリジニル、シクロヘキセニル、シクロヘキサジエニル、ジヒドロピリジニル、テトラヒドロピリジニル、およびピペリジニルから選択され；

すぐ上の A のいずれかが 1 つまたは複数の R^5 基で置換されてもよく；

B が $-(\text{C}_{2-8} \text{ アルキル})-$ であり、

i) すぐ上の (a) の 0 ~ 4 個の炭素原子は、 $-\text{O}-$ および $-\text{NR}^6-$ からなる群から選択される部分で置き換えられてもよく、

i i) すぐ上の (a) は 1 つまたは複数の R^5 基で置換されてもよく、

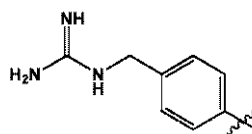
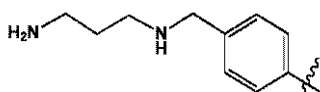
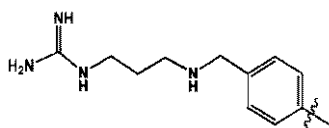
i i i) すぐ上の (a) は $-(\text{C}_{1-8} \text{ アルキル})-\text{R}^5$ 基で置換されてもよく；

C が (a) NH_2 、(b) $-\text{NHC}(=\text{NH})\text{NH}_2$ および (c) 水素から選択される、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体。

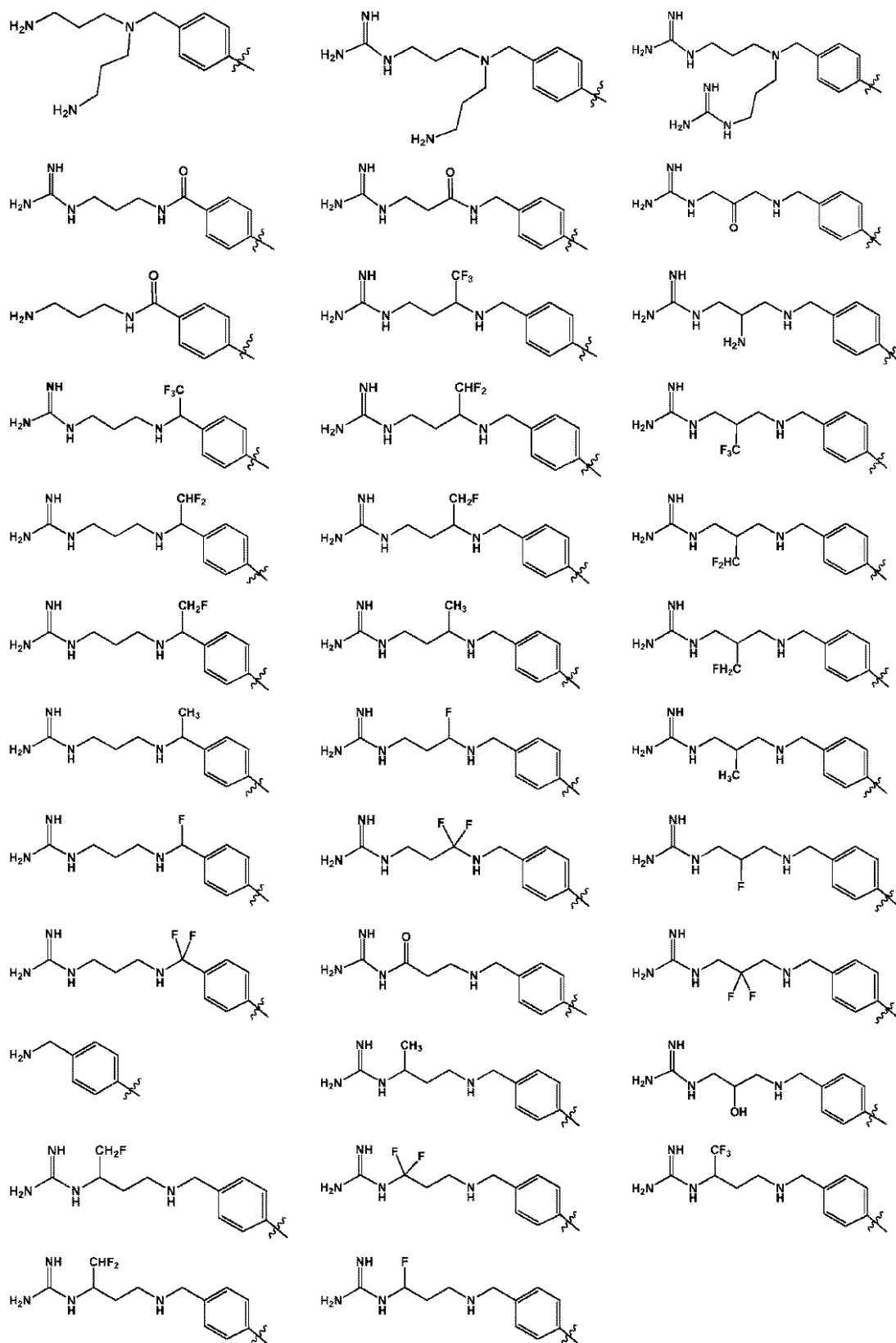
【請求項 6】

C - B - A - が、

【化 3】



【化 4】



からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体。

【請求項 7】

G が、

(a) 窒素および酸素からなる群から選択される 1 個もしくは複数のヘテロ原子を含む

3 ~ 14 員の芳香族複素環、

(b) 3 ~ 14 員の飽和または芳香族炭素環、ならびに

(c) 単結合

から選択され、(a) または (b) は 1 つもしくは複数の R^5 基で置換されてもよい、請求項 3 に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体。

【請求項 8】

R^5 が、(a) 水素、(b) F、(c) Cl、(f) - CF_3 、(g) - CN、(i) - NO_2 、(j) - NH_2 、(k) - OR^6 、(l) - $NHC(=NH)NH_2$ 、(m) - C_{1-8} アルキル、(p) - (C_{1-8} アルキル) - (窒素および酸素からなる群から選択される 1 個もしくは複数のヘテロ原子を含む 3 ~ 14 員芳香族複素環)、(q) - (C_{1-8} アルキル) - (3 ~ 14 員飽和炭素環)、(r) - ハロアルキル、(s) - SR^6 、(t) 窒素、酸素および硫黄からなる群から選択される 1 個もしくは複数のヘテロ原子を含む - 3 ~ 14 員の飽和または芳香族複素環、ならびに (u) - 3 ~ 14 員飽和炭素環から選択される、請求項 4 に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体。

【請求項 9】

R^6 が (a) 水素、(b) - C_{1-8} アルキル、(c) - ハロアルキル、(d) 窒素、酸素および硫黄からなる群から選択される 1 個もしくは複数のヘテロ原子を含む - 3 ~ 14 員の飽和または芳香族複素環および (e) - 3 ~ 14 員の飽和または芳香族炭素環から選択されるか、あるいは 2 つの R^6 基は一緒になって炭素環を形成している、請求項 4 に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体。

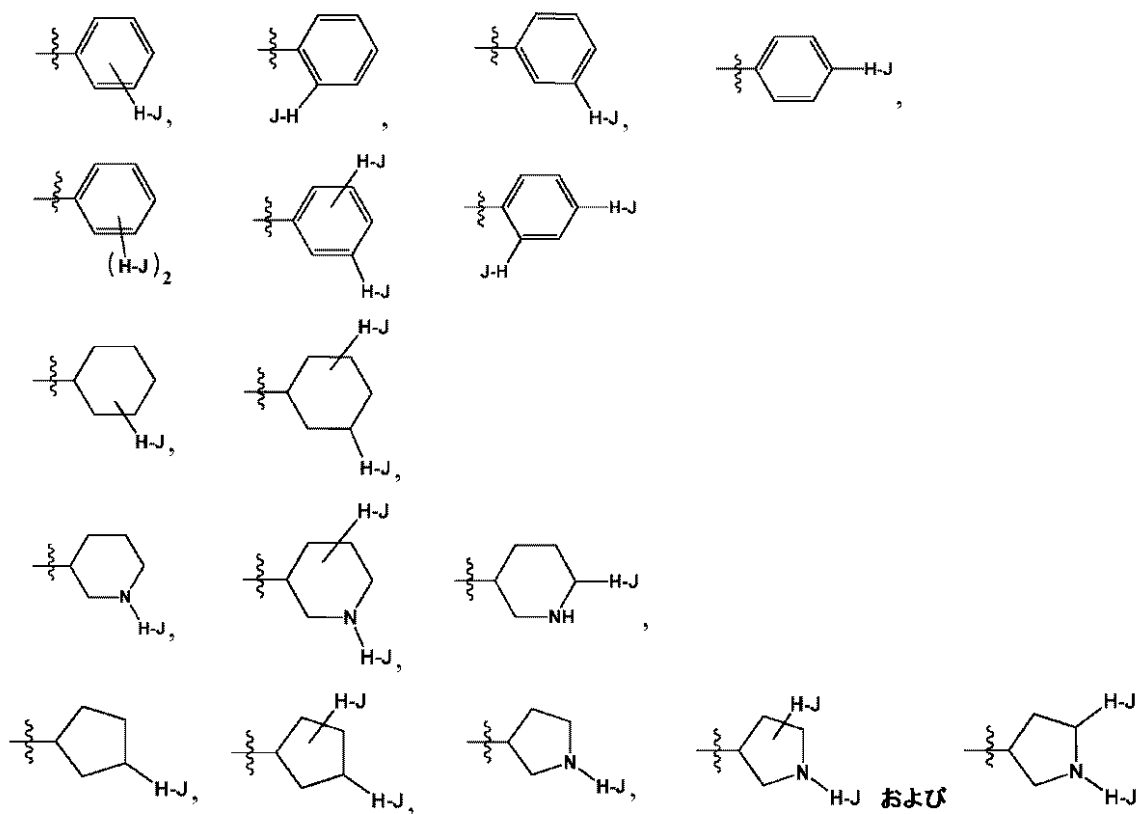
【請求項 10】

G が、アゼパニル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、フェニル、ピリジニル、シクロヘキセニル、シクロヘキサジエニル、ジヒドロピリジニル、フラニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピリジニル、アゼチジニル、ピロリジニル、ピベリジニル、および単結合から選択される、請求項 7 に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体。

【請求項 11】

- G - H - J が、

【化 5】

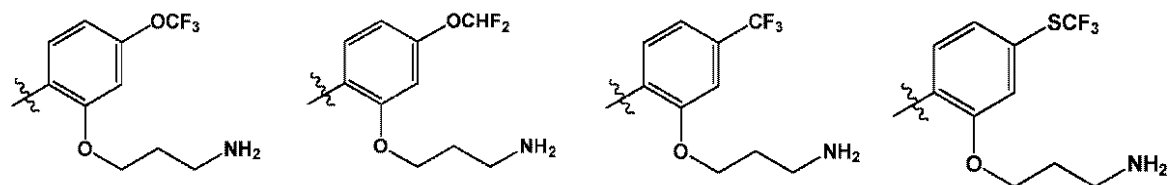


から選択される、請求項 1 に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体。

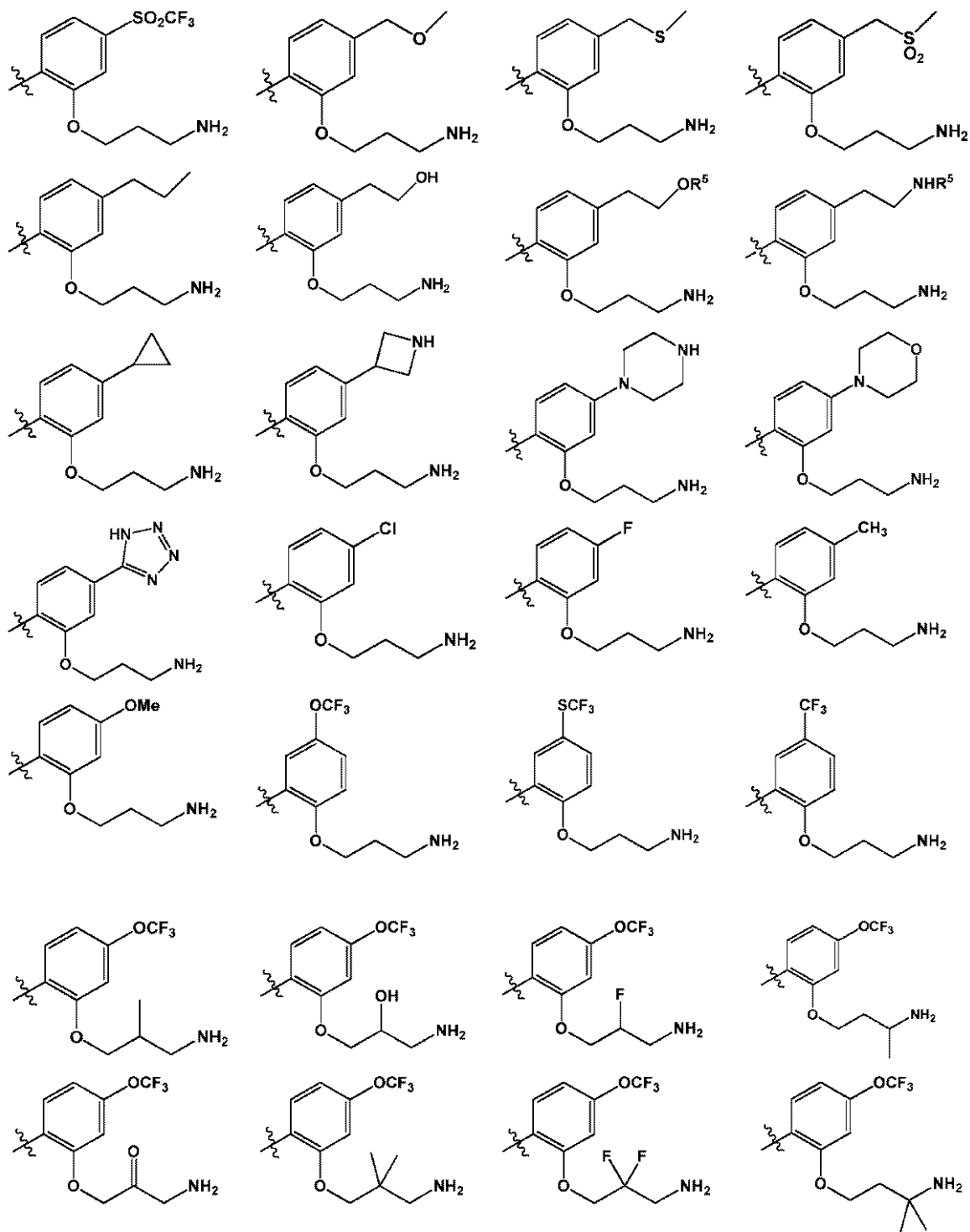
【請求項 1 2】

各 - G - H - J が、

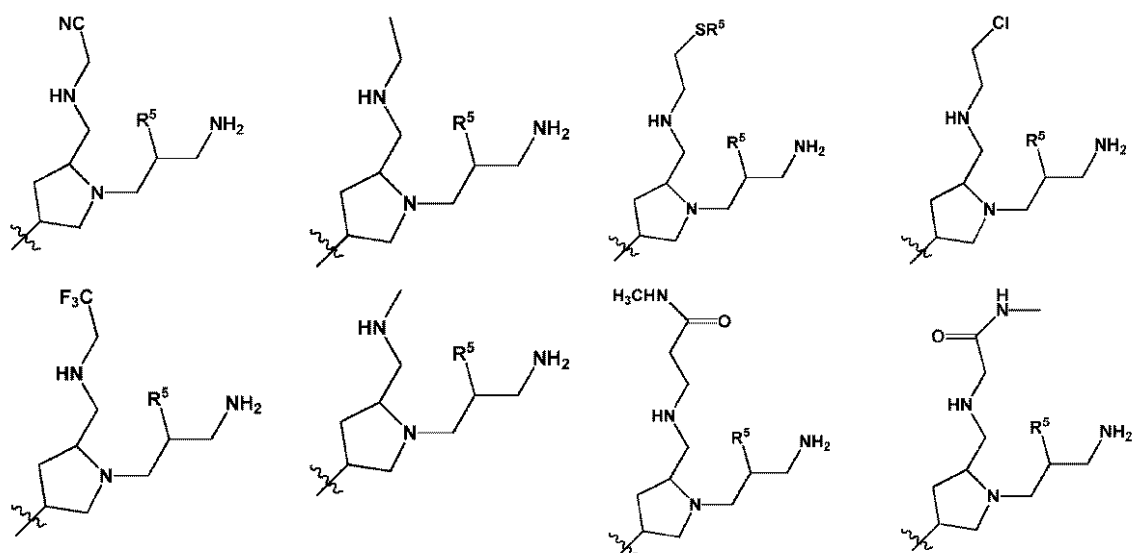
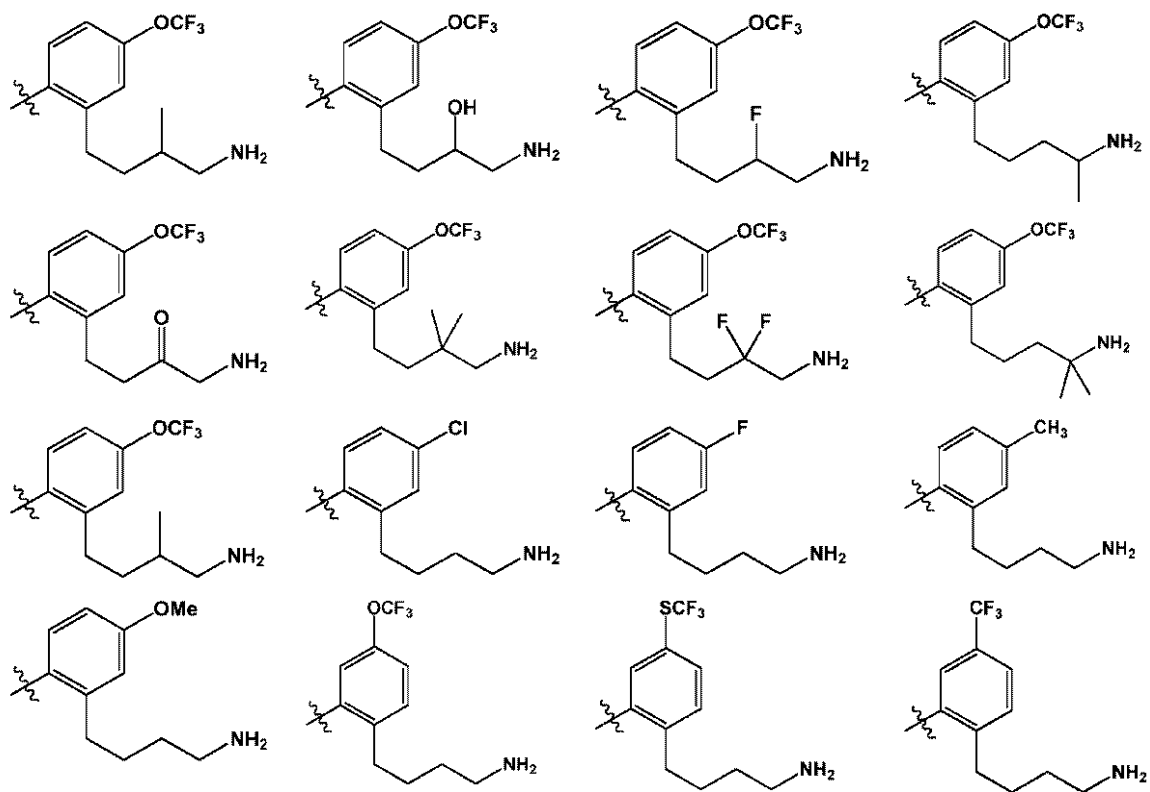
【化 6】



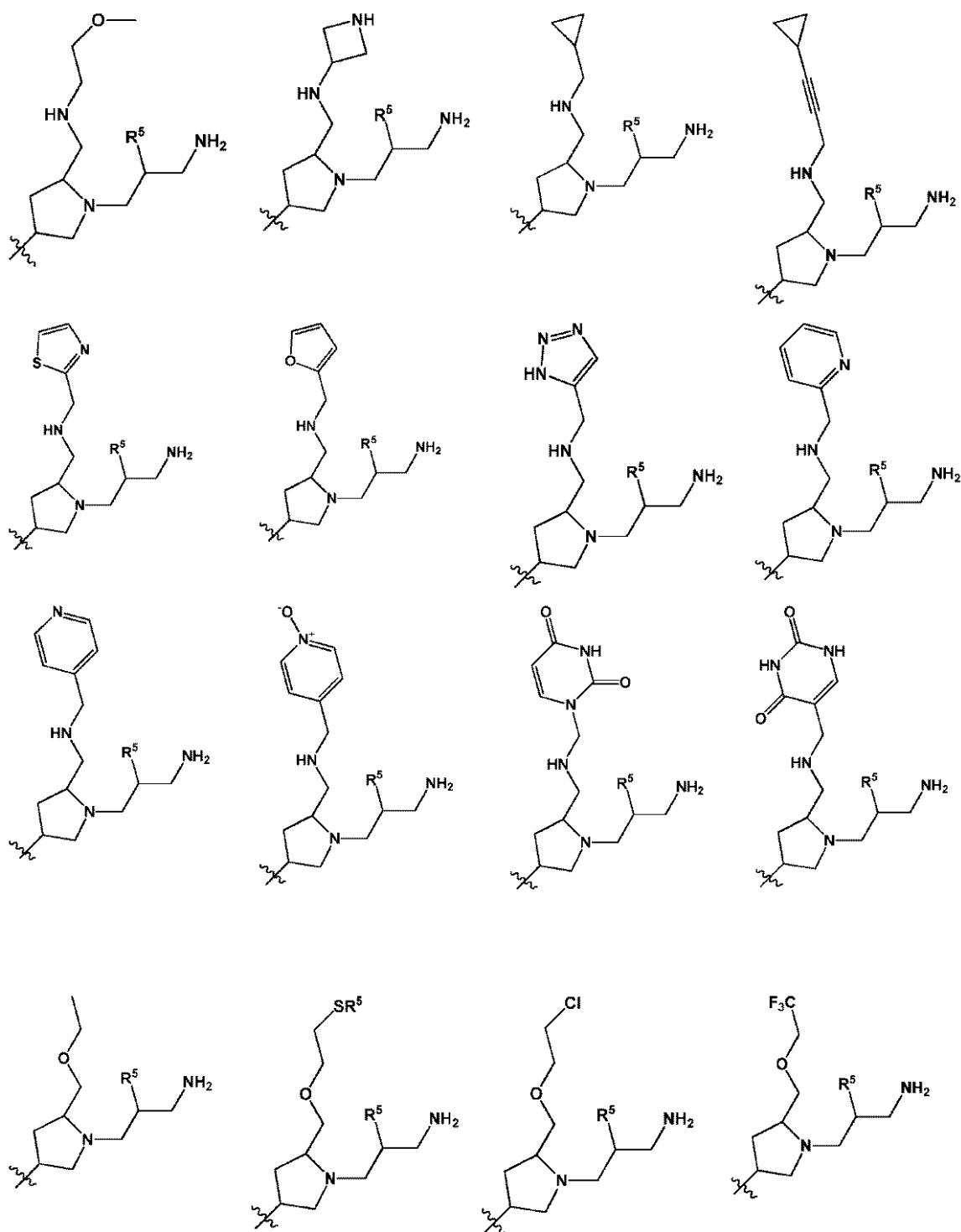
【化 7】



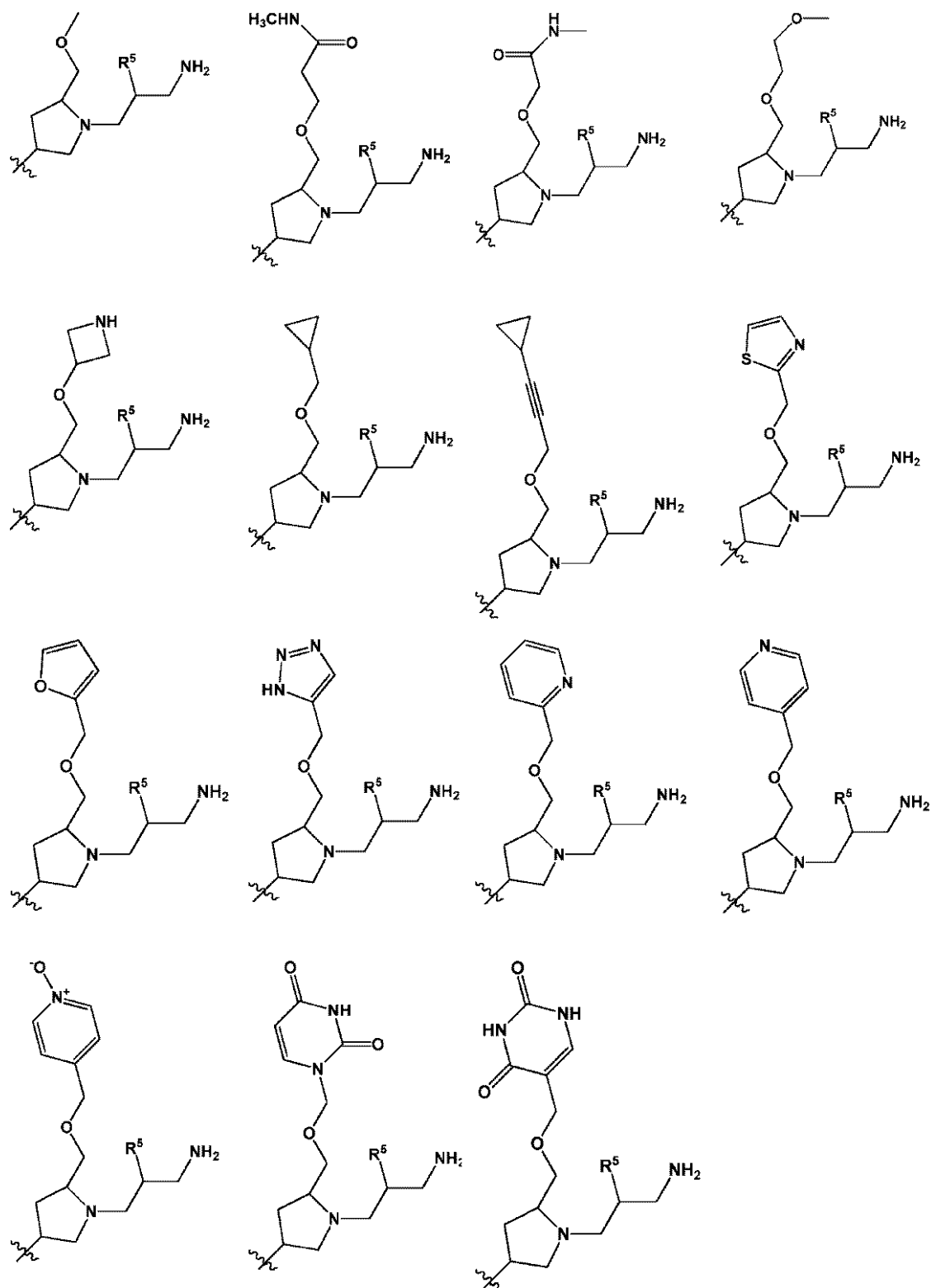
【化 8】



【化 9】



【化 10】



(式中、 R^5 は請求項 9 に規定される通りである)

から選択される、請求項 11 に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体。

【請求項 13】

リボソームと結合する、請求項 1 ~ 12 のいずれかに記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体。

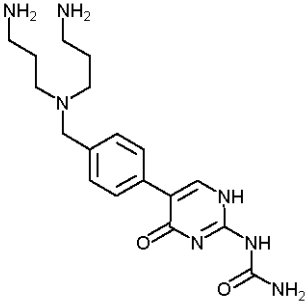
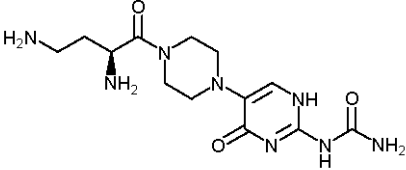
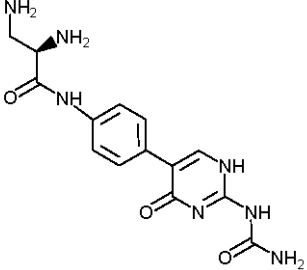
【請求項 1 4】

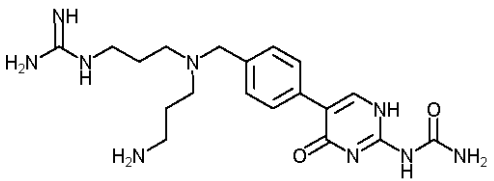
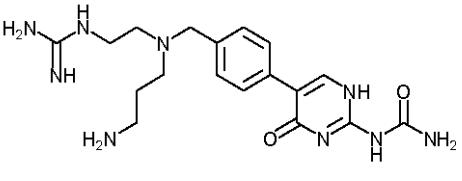
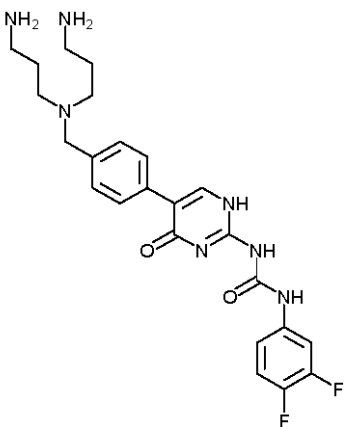
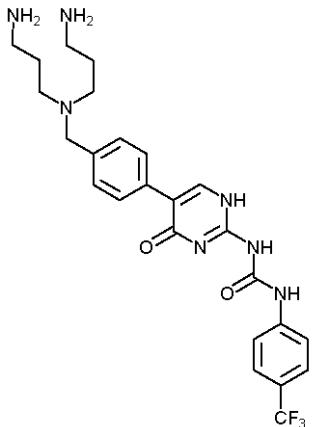
前記リボソームが細菌リボソームである、請求項 1 3 に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体。

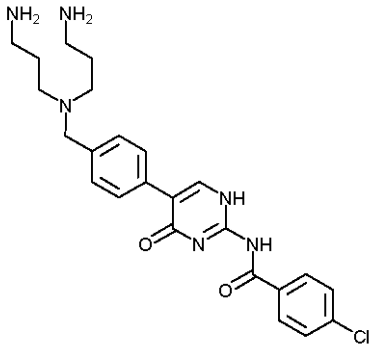
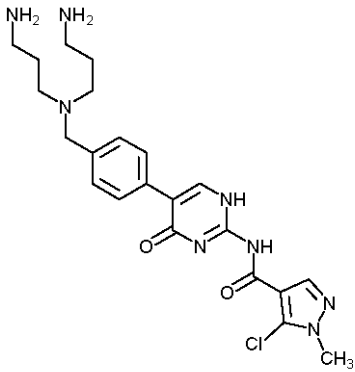
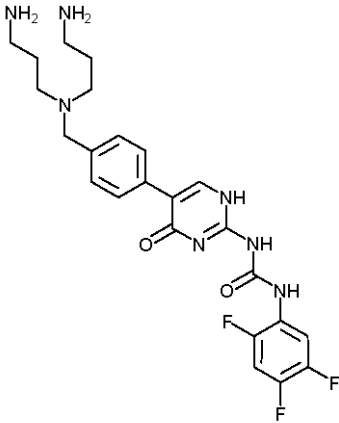
【請求項 1 5】

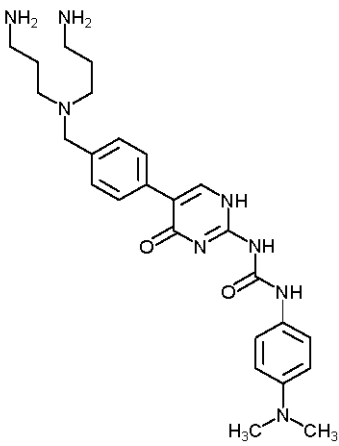
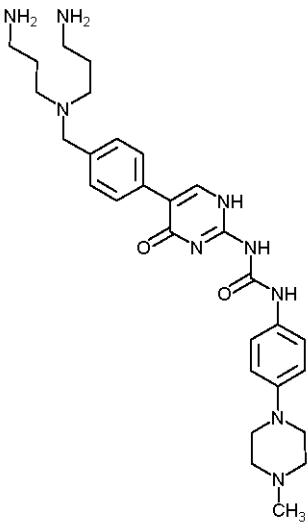
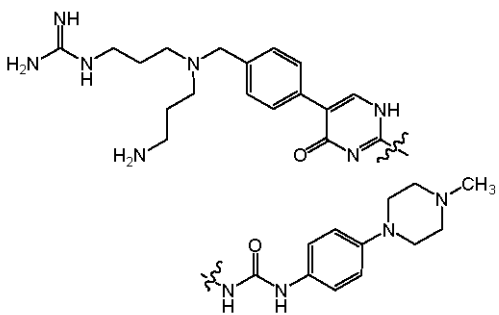
以下

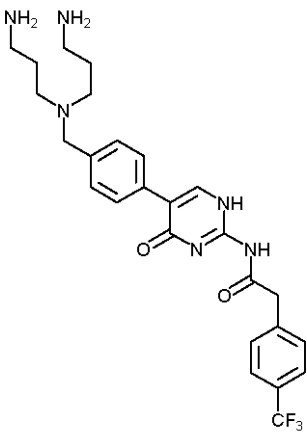
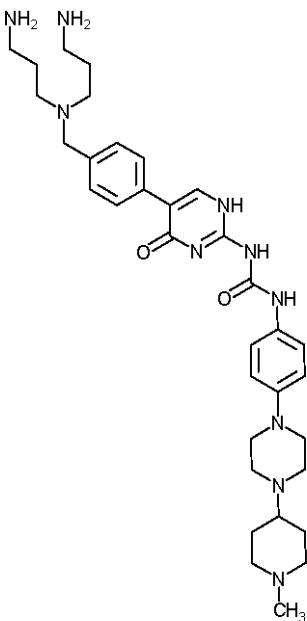
【化 1 1】

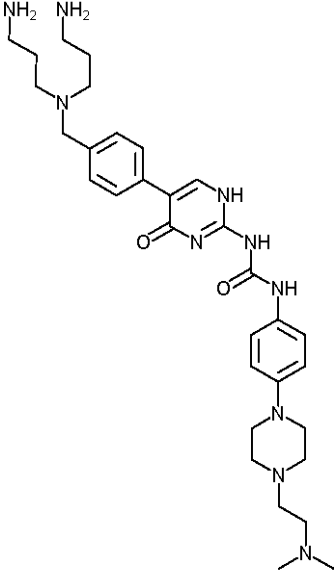
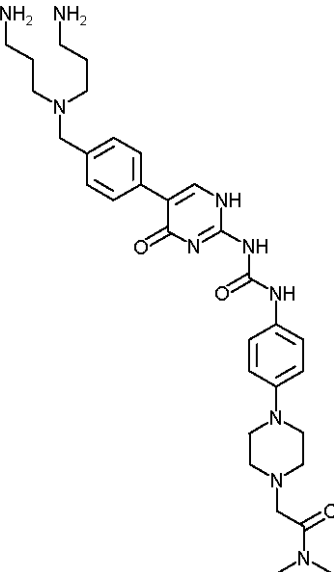
化合物 番号	構造	LCMS
149		374.20
161		338.90
162		332.00

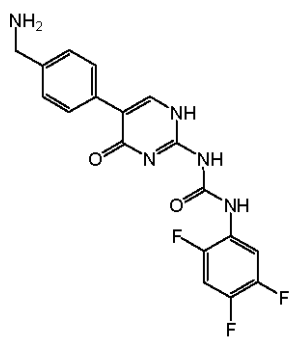
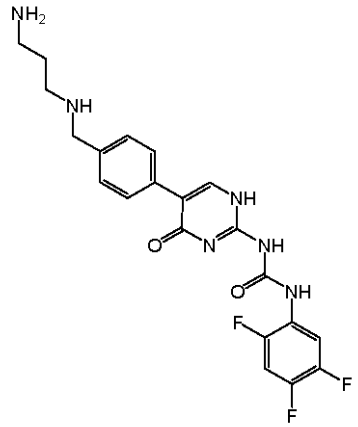
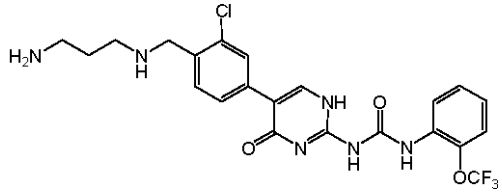
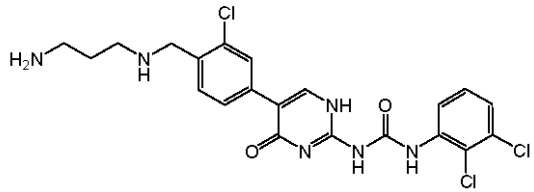
168		416.10
170		402.40
171		486.20
172		518.20

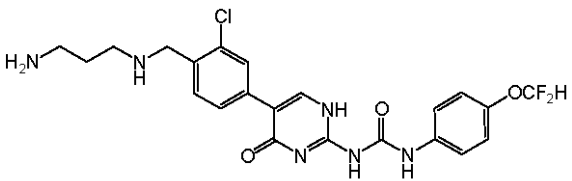
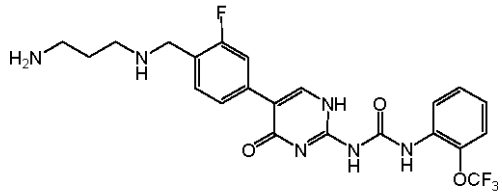
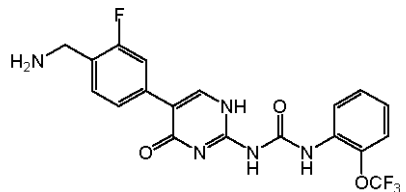
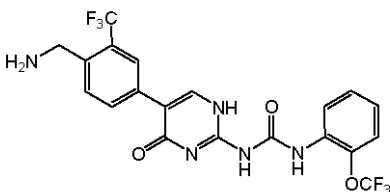
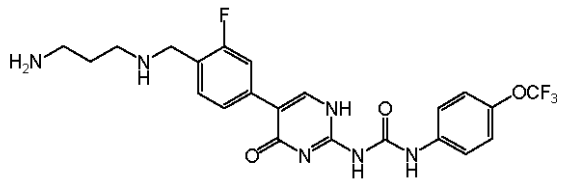
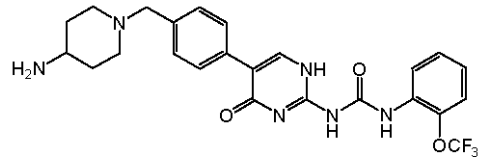
173		469.20
174		473.20
178		504.20

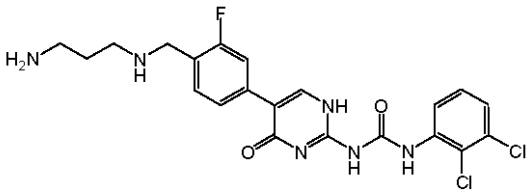
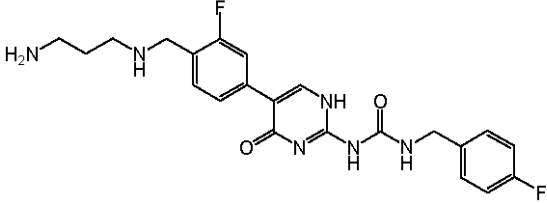
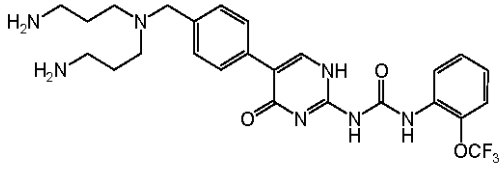
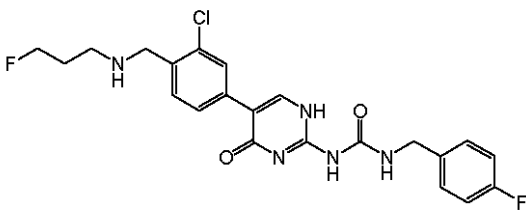
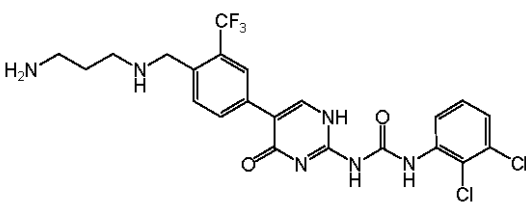
188		493.40
191		548.40
202		590.40

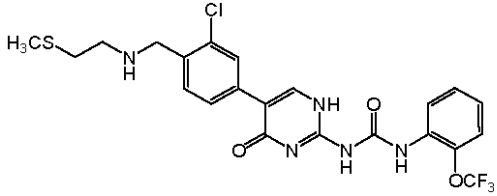
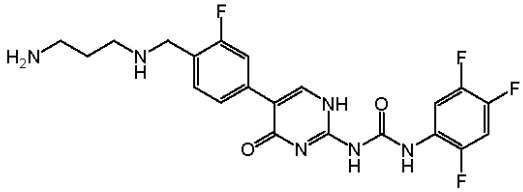
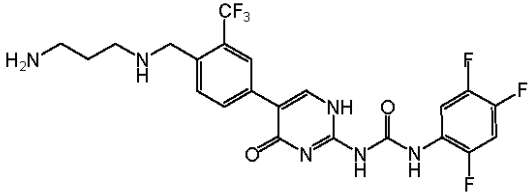
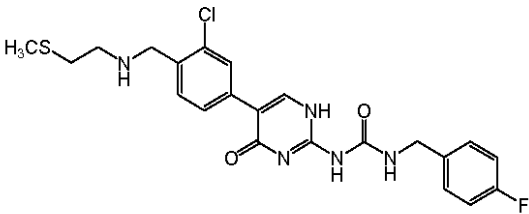
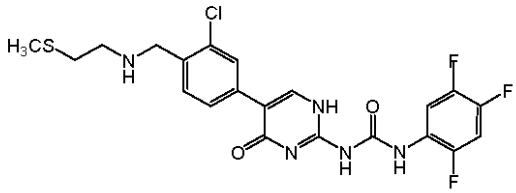
205	 <p>Chemical structure of compound 205: A pyrimidine-2,4-dione core substituted at the 6-position with a 4-(bis(2-aminoethyl)aminomethyl)phenyl group and at the 2-position with a 2-(4-(trifluoromethyl)phenyl)acetamido group.</p> <chem>NCCNCCN(CCCN)Cc1ccc(cc1)c2nc(=O)[nH]c3nc(NC(=O)Cc4ccc(cc4)C(F)(F)F)c(=O)n23</chem>	517.20
209	 <p>Chemical structure of compound 209: A pyrimidine-2,4-dione core substituted at the 6-position with a 4-(bis(2-aminoethyl)aminomethyl)phenyl group and at the 2-position with a 2-(4-(4-methylpiperidin-1-yl)phenyl)acetamido group.</p> <chem>CN1CCN(CC1)N2CCN(CC2)N3Cc4ccc(cc4)NC(=O)Nc5nc(=O)[nH]c6nc(NC(=O)Cc7ccc(cc7)C(F)(F)F)c(=O)n56</chem>	631.50

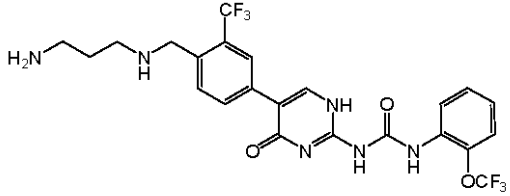
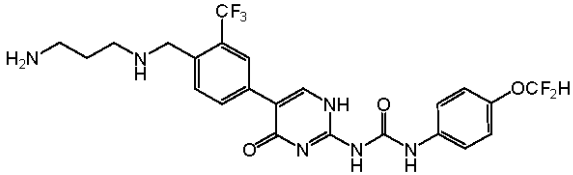
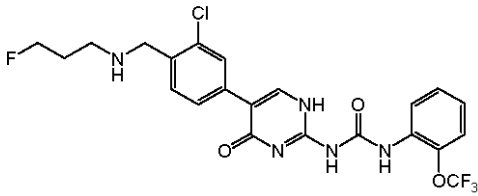
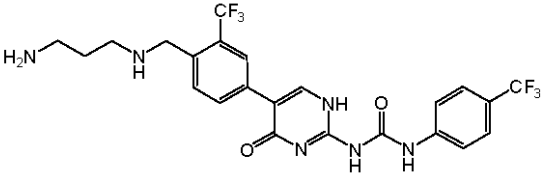
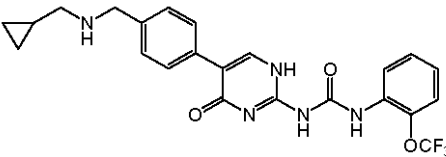
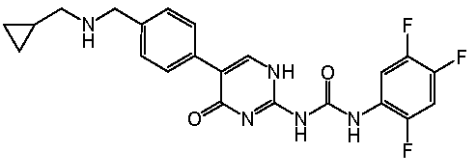
210	 <p>Chemical structure of compound 210: A pyrimidine-2,4-dione core substituted at the 6-position with a 4-(bis(2-aminoethyl)amino)phenyl group and at the 2-position with a hydrazide group. The hydrazide is linked to a 4-(4-(dimethylamino)phenyl)phenyl group.</p>	605.40
211	 <p>Chemical structure of compound 211: A pyrimidine-2,4-dione core substituted at the 6-position with a 4-(bis(2-aminoethyl)amino)phenyl group and at the 2-position with a hydrazide group. The hydrazide is linked to a 4-(4-(dimethylamino)phenyl)phenyl group, which is further substituted with a dimethylacetamido group.</p>	619.30

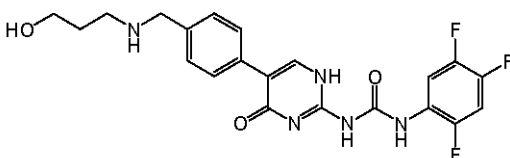
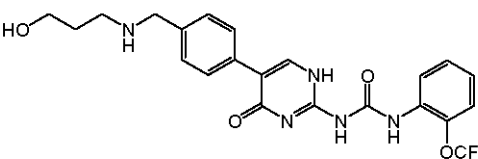
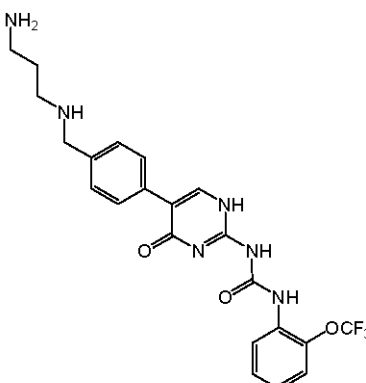
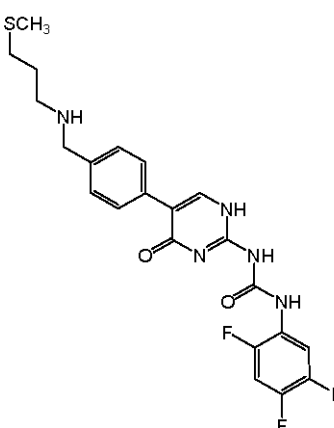
238		390.00
239		447.10
242		511.30
243		493.20

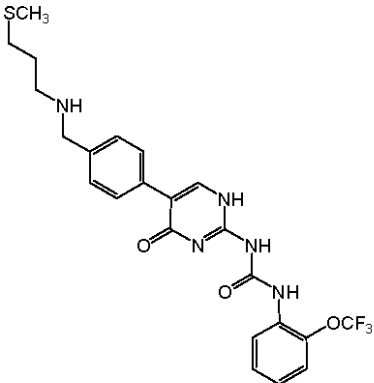
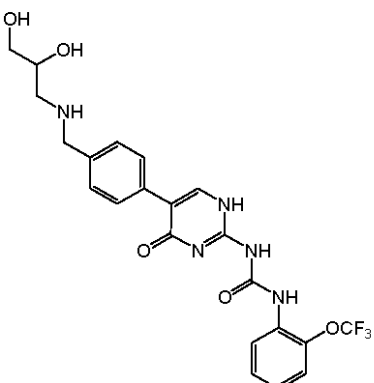
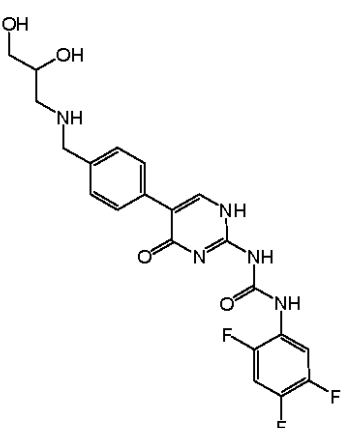
244		493.20
246		495.20
247		438.20
248		488.20
249		495.20
251		503.30

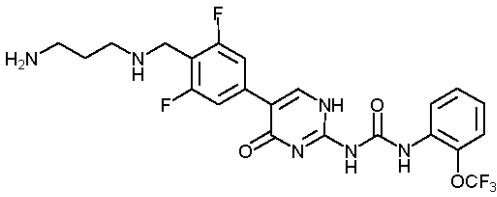
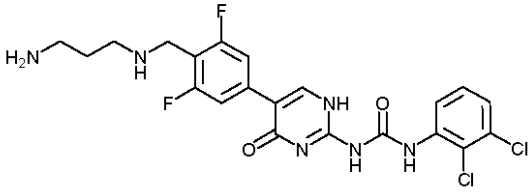
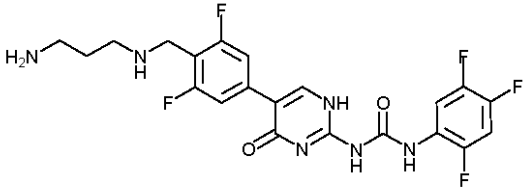
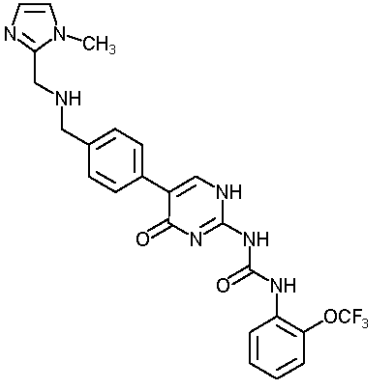
252		479.10
255		443.20
256		534.40
257		462.20
259		529.20

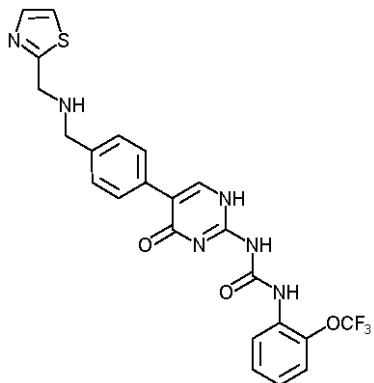
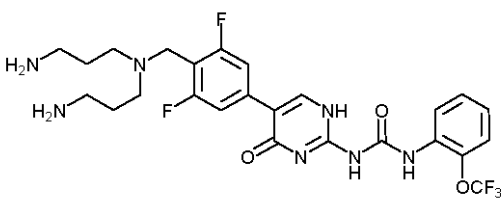
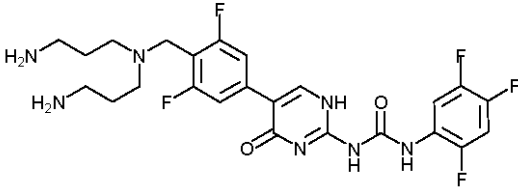
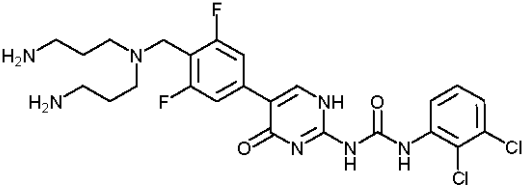
260	 <chem>CCSCCNCCc1ccc(Cl)cc1-c2nc(=O)[nH]c(=O)n2NC(=O)Nc3ccccc3C(F)(F)F</chem>	528.20
265	 <chem>NCCCNCCc1ccc(F)cc1-c2nc(=O)[nH]c(=O)n2NC(=O)Nc3cc(F)c(F)cc3F</chem>	465.20
266	 <chem>NCCCNCCc1ccc(C(F)(F)F)cc1-c2nc(=O)[nH]c(=O)n2NC(=O)Nc3cc(F)c(F)cc3F</chem>	515.30
267	 <chem>CCSCCNCCc1ccc(Cl)cc1-c2nc(=O)[nH]c(=O)n2NC(=O)Nc3ccc(F)cc3</chem>	476.30
268	 <chem>CCSCCNCCc1ccc(Cl)cc1-c2nc(=O)[nH]c(=O)n2NC(=O)Nc3cc(F)c(F)cc3F</chem>	498.10

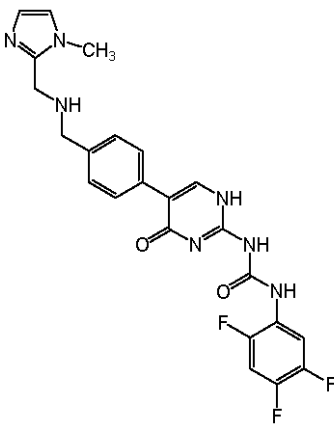
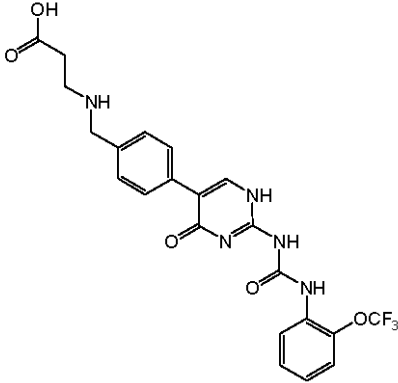
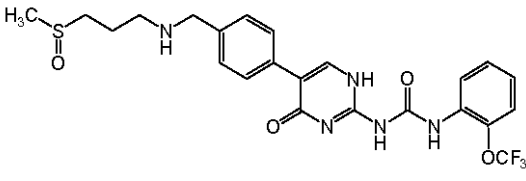
269		545.30
270		527.30
271		514.20
273		529.20
274		474.00
275		444.00

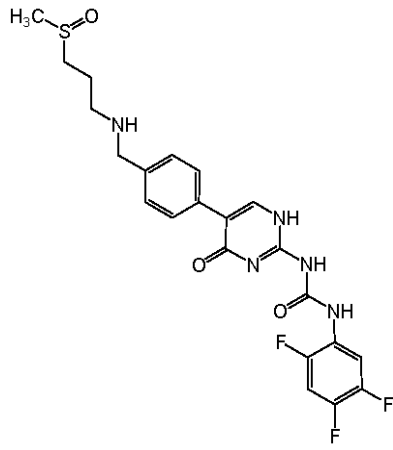
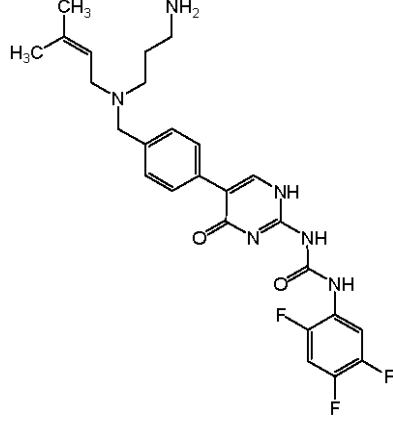
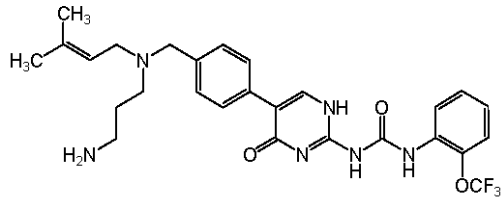
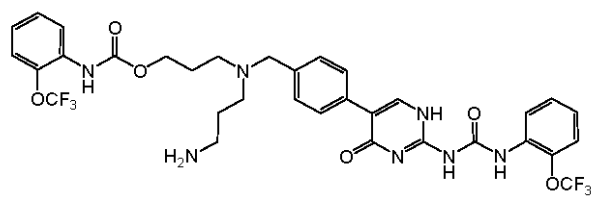
276		448.00
277		478.00
278		477.20
281		478.00

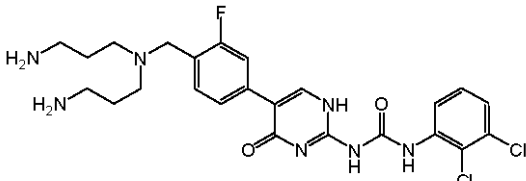
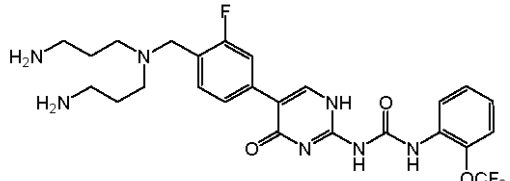
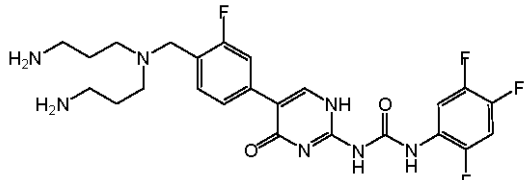
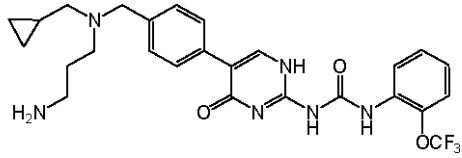
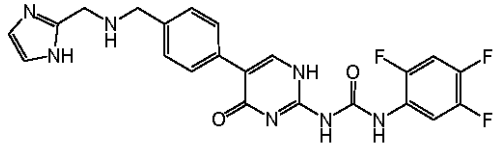
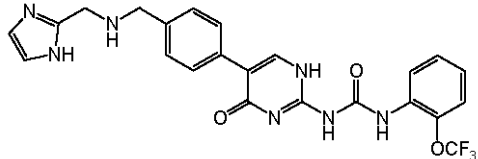
282	 <chem>CSCCNCc1ccc(cc1)c2nc(=O)[nH]c3nc(=O)[nH]c3n2NC(=O)Nc4ccccc4OC(F)(F)F</chem>	508.00
283	 <chem>OCC(O)CNc1ccc(cc1)c2nc(=O)[nH]c3nc(=O)[nH]c3n2NC(=O)Nc4ccccc4OC(F)(F)F</chem>	494.00
284	 <chem>OCC(O)CNc1ccc(cc1)c2nc(=O)[nH]c3nc(=O)[nH]c3n2NC(=O)Nc4cc(F)c(F)c(F)c4</chem>	464.00

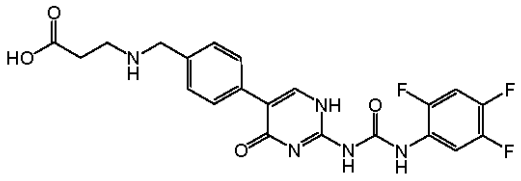
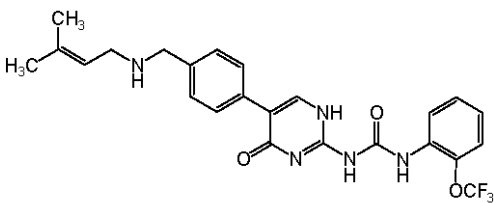
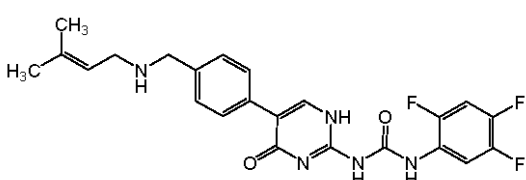
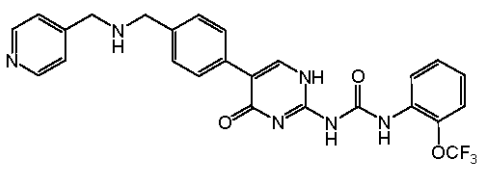
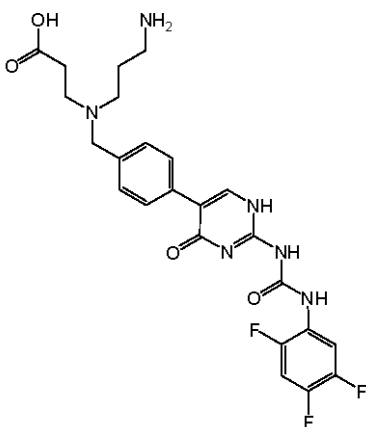
285	 <chem>NCCCNCCc1cc(F)c(cc1F)c2nc(=O)[nH]c2NC(=O)Nc3cc(OC(F)(F)F)ccc3</chem>	513.30
286	 <chem>NCCCNCCc1cc(F)c(cc1F)c2nc(=O)[nH]c2NC(=O)Nc3cc(Cl)c(Cl)cc3</chem>	497.20
287	 <chem>NCCCNCCc1cc(F)c(cc1F)c2nc(=O)[nH]c2NC(=O)Nc3cc(F)c(F)c(F)c3</chem>	483.20
290	 <chem>Cn1cc[nH]1CCNCc2ccc(cc2)c3nc(=O)[nH]c3NC(=O)Nc4cc(OC(F)(F)F)ccc4</chem>	514.00

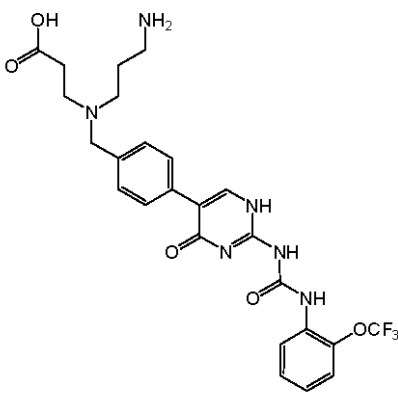
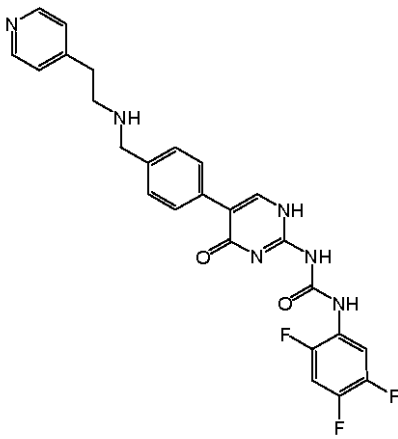
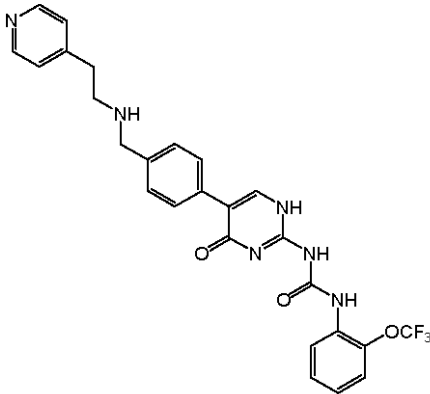
291		517.00
294		570.40
295		540.30
297		554.20

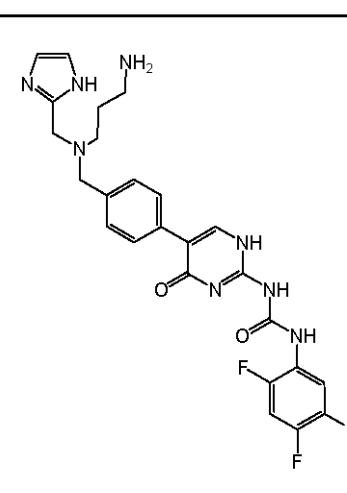
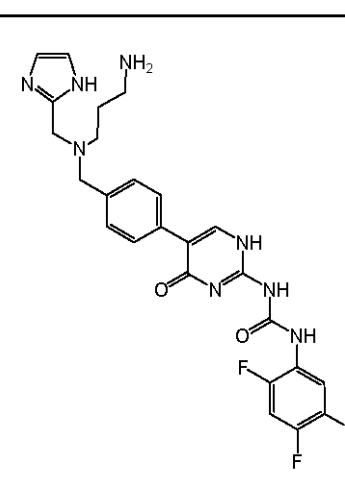
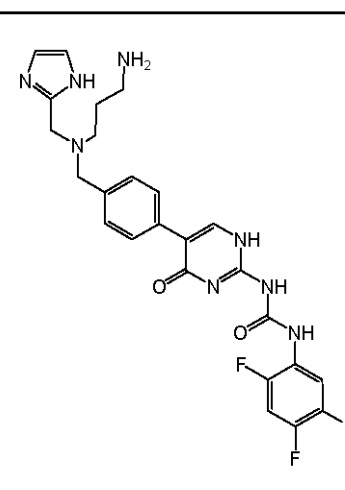
299		484.00
300		492.00
301		524.00

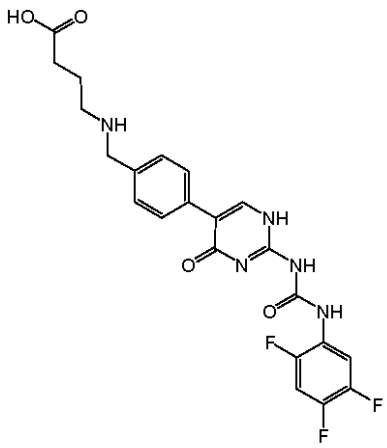
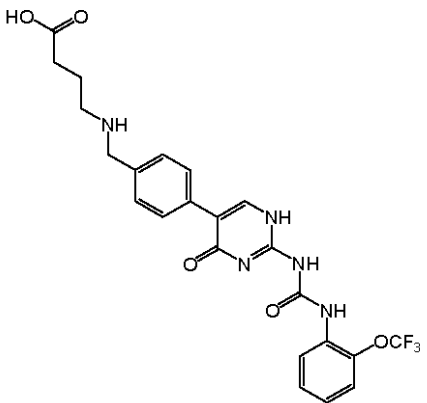
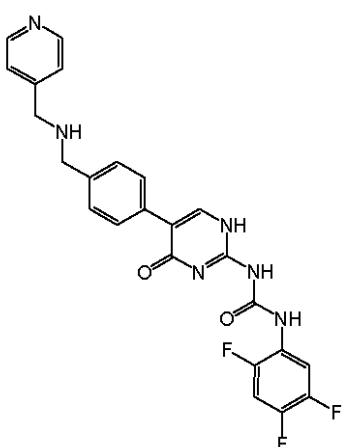
302	 <chem>CS(=O)CCNCc1ccc(cc1)-c2nc(=O)n[nH]2Nc3cc(F)c(F)c(F)c3</chem>	494.00
303	 <chem>CC(C)CNCc1ccc(cc1)-c2nc(=O)n[nH]2Nc3cc(F)c(F)c(F)c3</chem>	515.00
304	 <chem>CC(C)CNCc1ccc(cc1)-c2nc(=O)n[nH]2Nc3cc(F)c(F)c(F)c3</chem>	545.00
305	 <chem>CC(C)CNCc1ccc(cc1)-c2nc(=O)n[nH]2Nc3cc(F)c(F)c(F)c3</chem>	738.00

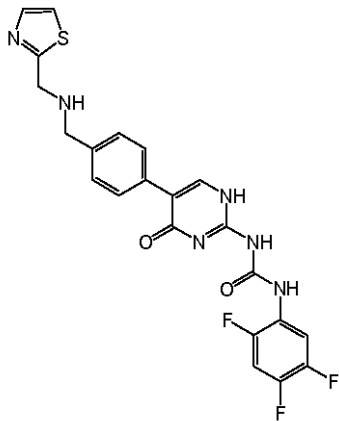
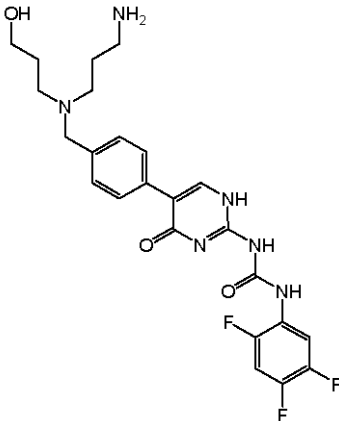
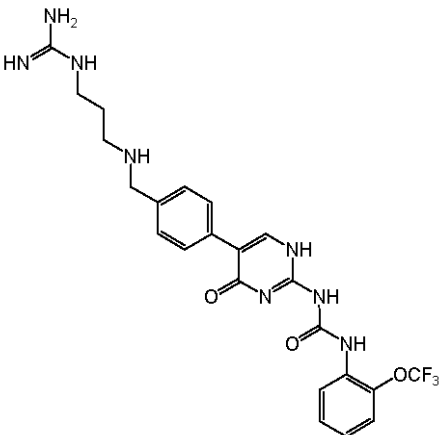
307		536.30
308		552.40
311		522.30
312		531.00
313		468.00
314		500.00

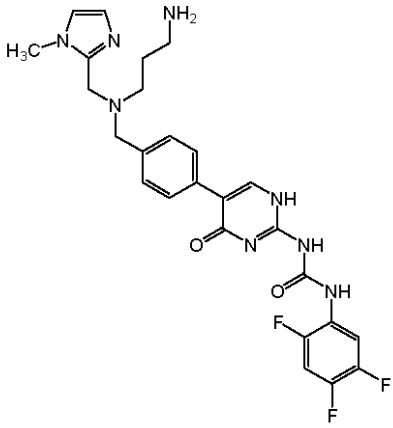
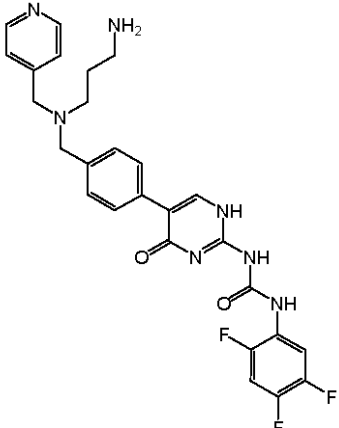
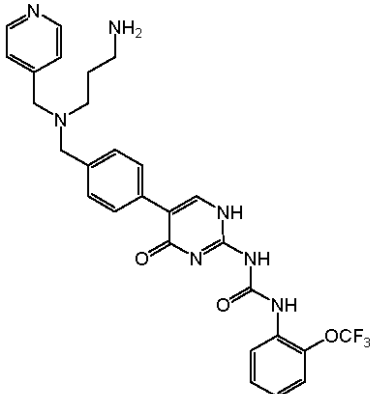
315		462.00
316		488.00
317		458.00
319		511.00
320		519.00

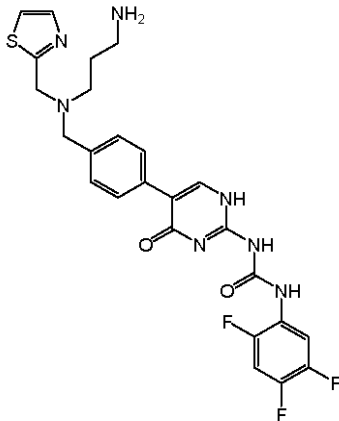
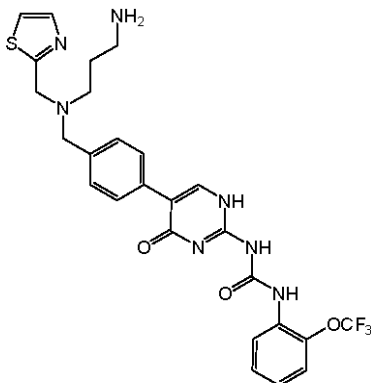
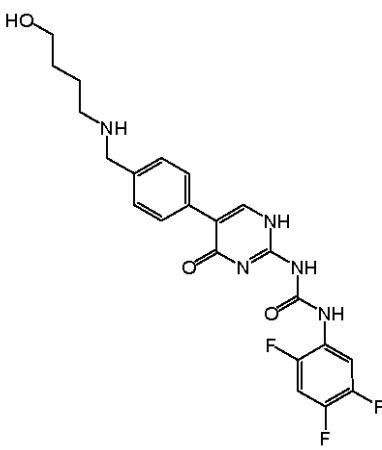
321	 <chem>CC(N)CN(CCC(=O)O)Cc1ccc(cc1)c2nc(=O)[nH]c3nc(NC(=O)Nc4ccccc4OC(F)(F)F)n3c2=O</chem>	549.00
322	 <chem>Fc1cc(F)c(NC(=O)Nc2nc3c(nc(=O)n3)C(=O)c4ccc(cc4)NCCc5cccnc5)c2F</chem>	495.00
323	 <chem>COc1ccccc1NC(=O)Nc2nc3c(nc(=O)n3)C(=O)c4ccc(cc4)NCCc5cccnc5</chem>	525.00

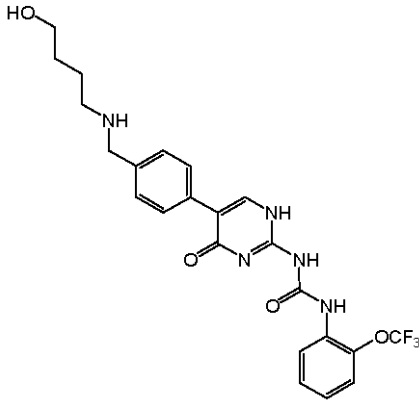
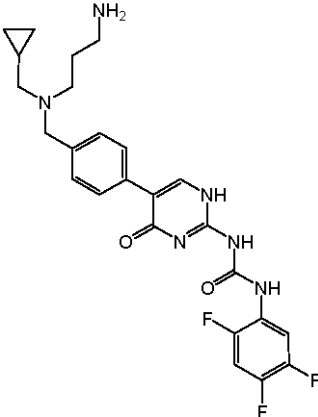
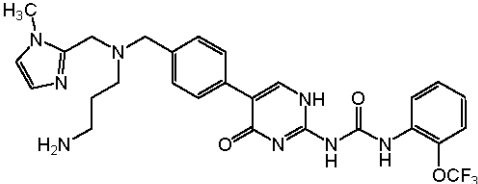
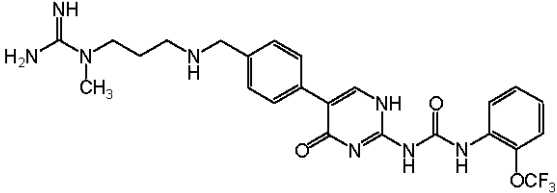
324		535.00
325		527.00
326		557.00

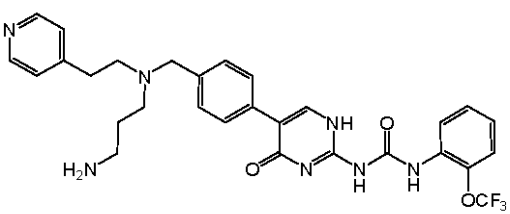
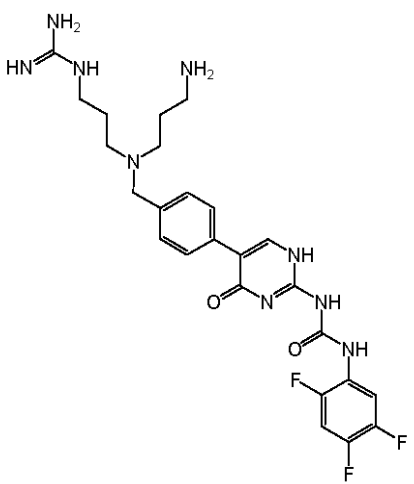
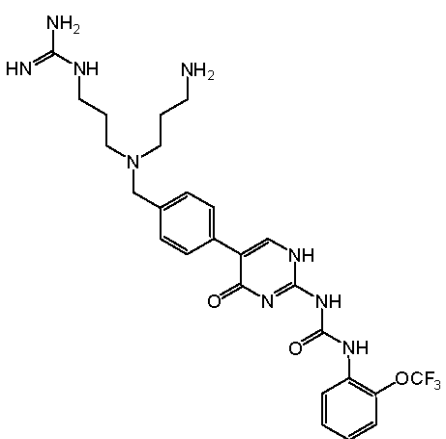
327		476.00
328		506.00
329		481.00

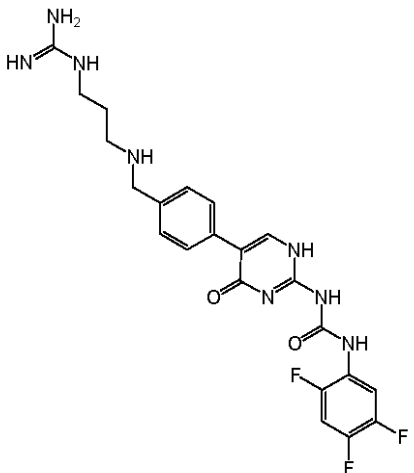
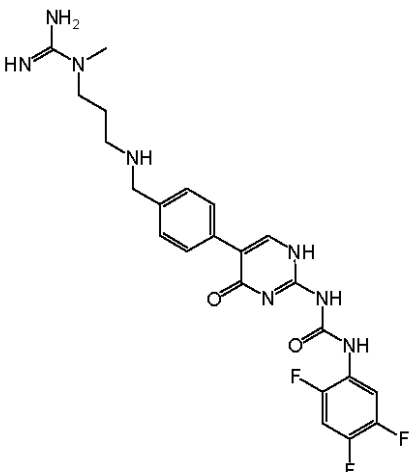
330	 <chem>Nc1ccsc1CNc2ccc(cc2)C3=CNC(=O)N=C3NC(=O)Nc4cc(F)c(F)c(F)c4</chem>	487.00
331	 <chem>NCC(O)CNc1ccc(cc1)C2=CNC(=O)N=C2NC(=O)Nc3cc(F)c(F)c(F)c3</chem>	505.00
332	 <chem>NC(=N)NCCNc1ccc(cc1)C2=CNC(=O)N=C2NC(=O)Nc3cc(OC(F)(F)F)ccc3</chem>	519.10

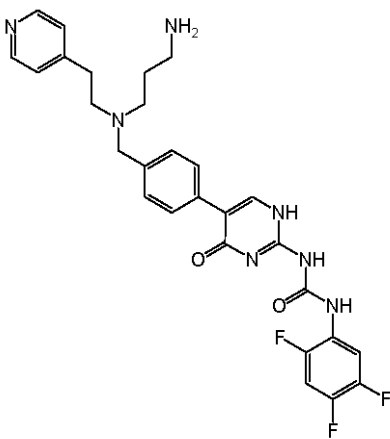
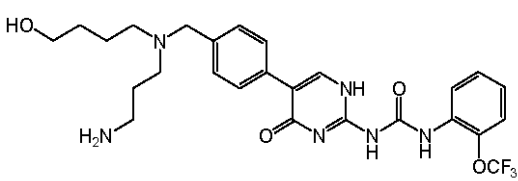
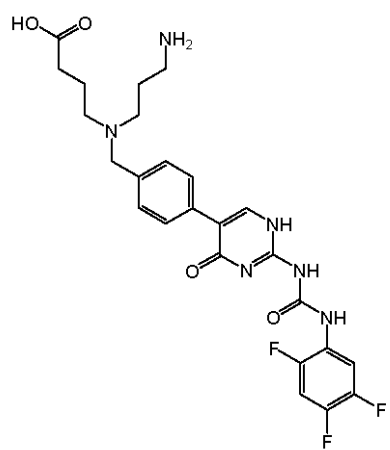
336	 <chem>CC1=CN(CCN1CCN(CCN)C2=CC=C(C=C2)C3=NC(=O)NC(=N3)NC(=O)Nc4cc(F)c(F)c(F)c4)C5=CC=CC=C5</chem>	541.00
337	 <chem>NCCN(CCN(CCN)C2=CC=C(C=C2)C3=NC(=O)NC(=N3)NC(=O)Nc4cc(F)c(F)c(F)c4)CC5=CC=CC=N5</chem>	538.00
338	 <chem>NCCN(CCN(CCN)C2=CC=C(C=C2)C3=NC(=O)NC(=N3)NC(=O)Nc4ccccc4OC(F)(F)F)CC5=CC=CC=N5</chem>	568.00

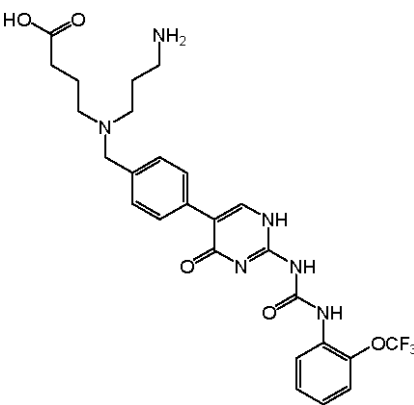
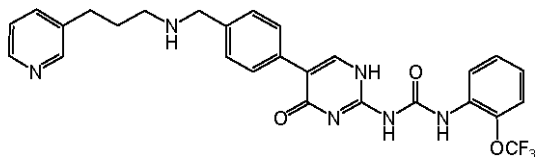
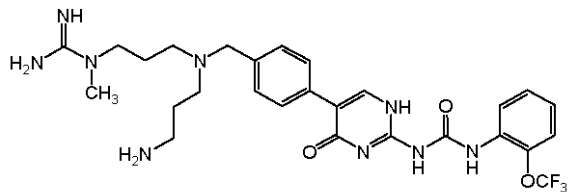
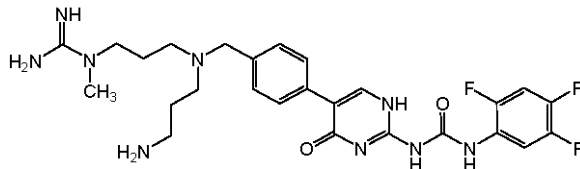
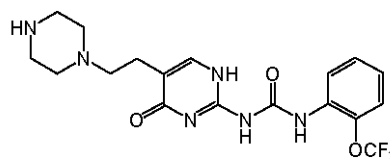
339		544.00
340		574.00
341		462.00

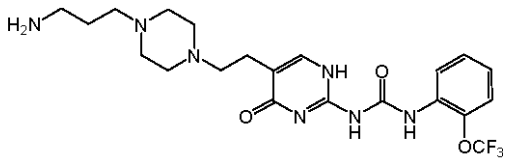
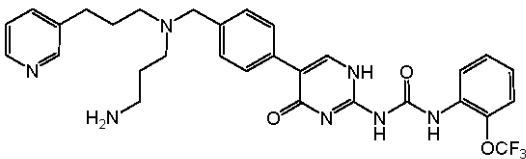
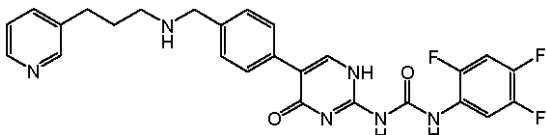
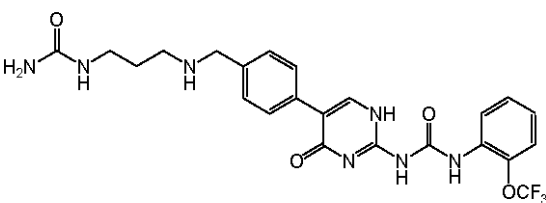
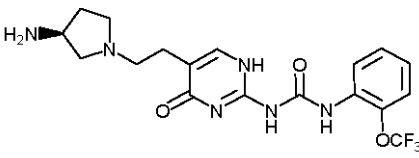
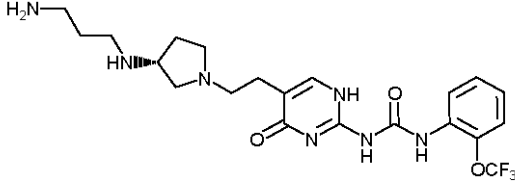
342		492.00
344		501.00
345		571.00
346		533.00

347	 <chem>CC1(CCN(C1Cc2ccc(cc2)C3=CNC(=O)NC(=O)Nc4ccccc4OC(F)(F)F)C(=O)N5C=NC(=O)N=C5)CCN</chem>	582.00
348	 <chem>FC1=CC(=C(C(=C1)F)C(=O)Nc2ccccc2OC(F)(F)F)C(=O)N3C=NC(=O)N=C3C4=CC=C(C=C4)CN(CCCNC(=O)N)CCN</chem>	546.00
349	 <chem>CC1(CCN(C1Cc2ccc(cc2)C3=CNC(=O)NC(=O)Nc4ccccc4OC(F)(F)F)C(=O)N5C=NC(=O)N=C5)CCN</chem>	576.00

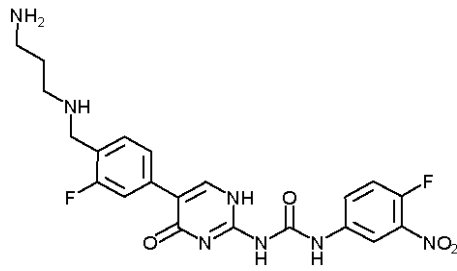
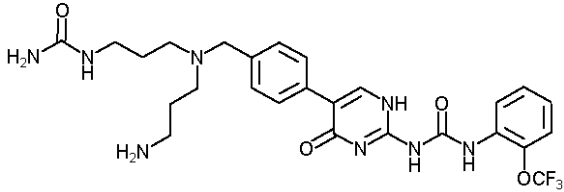
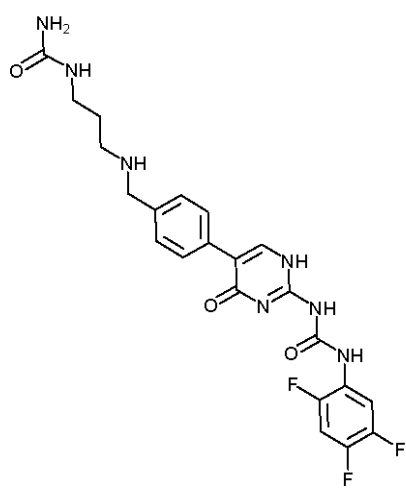
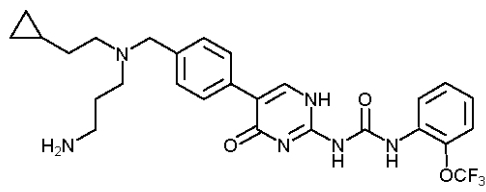
350	 <chem>NC(=N)NCCNCc1ccc(cc1)-c2nc(=O)n([NH-]c3cc(F)cc(F)c3F)c2=O</chem>	489.00
353	 <chem>CN(C)C(=N)NCCNCc1ccc(cc1)-c2nc(=O)n([NH-]c3cc(F)cc(F)c3F)c2=O</chem>	503.00

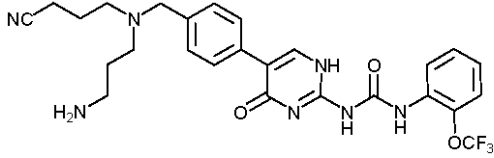
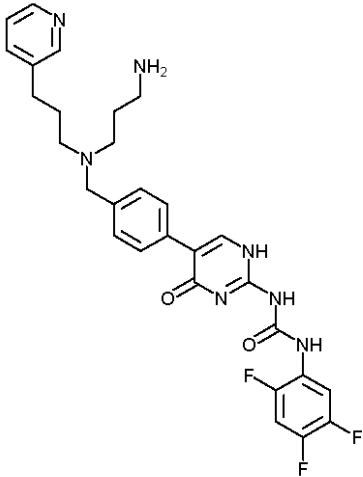
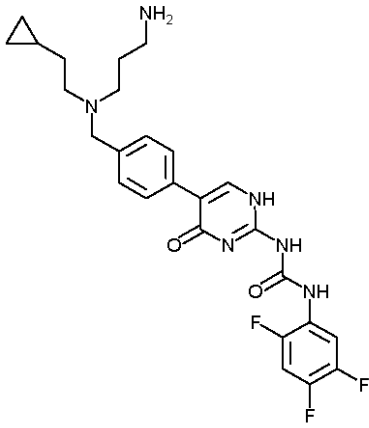
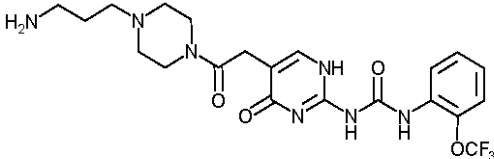
354	 <chem>NCCN(Cc1ccc(cc1)C2=NC(=O)N=C(NC(=O)Nc3cc(F)c(F)c(F)c3)c2)c4ccncc4</chem>	552.00
355	 <chem>NCCCN(CCCO)Cc1ccc(cc1)C2=NC(=O)N=C(NC(=O)Nc3cc(OC(F)(F)F)ccc3)c2</chem>	549.00
358	 <chem>NCCN(CCC(=O)O)Cc1ccc(cc1)C2=NC(=O)N=C(NC(=O)Nc3cc(F)c(F)c(F)c3)c2</chem>	533.00

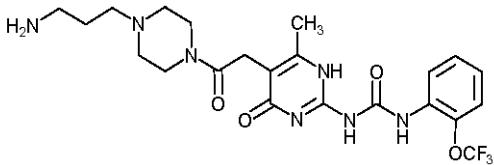
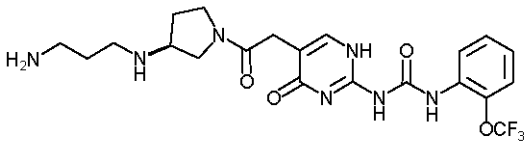
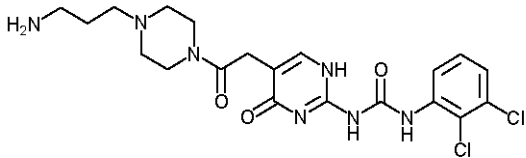
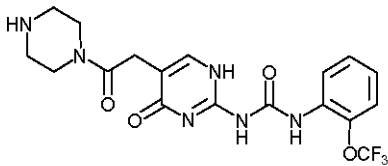
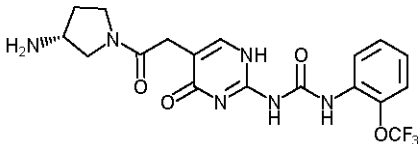
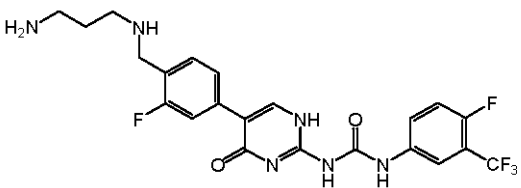
359		563.00
364		539.00
365		590.00
366		560.00
368		427.10

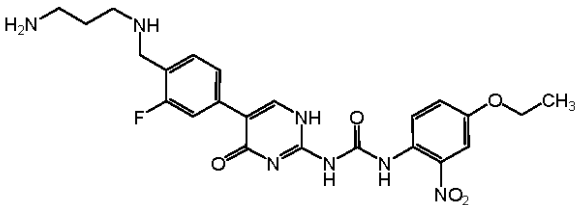
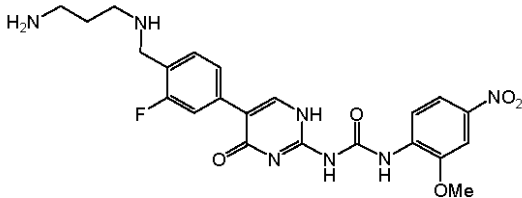
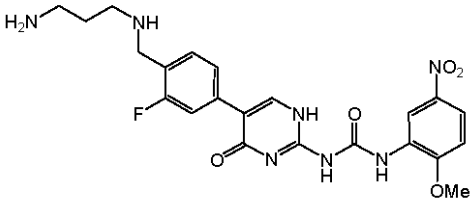
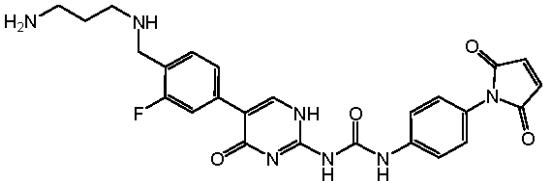
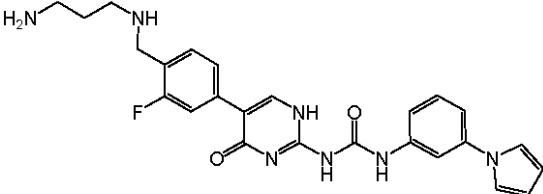
369		484.10
372		596.00
373		509.00
374		520.00
381		427.10
384		484.10

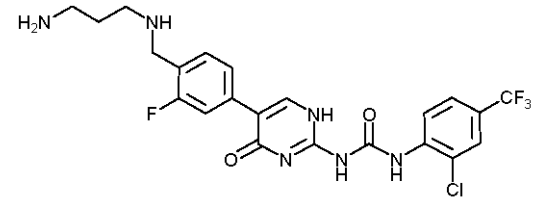
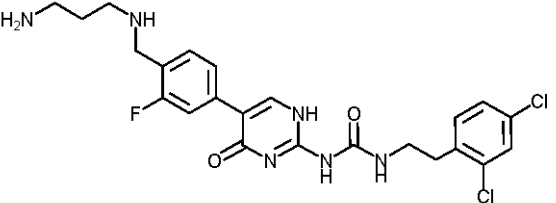
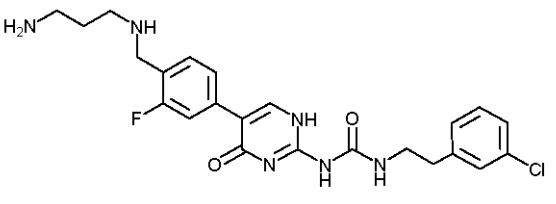
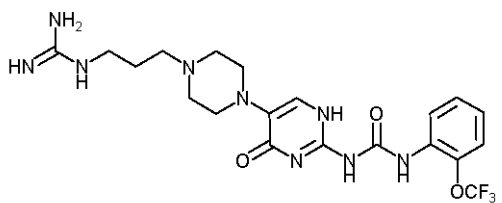
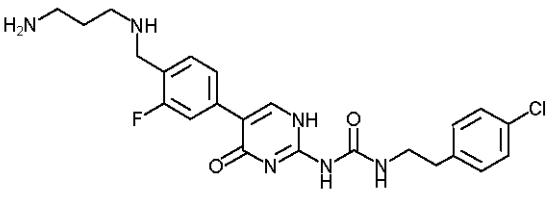
385	 <chem>NCCCN[C@H]1CCN1CCc2nc(=O)c3nc(NC(=O)Nc4cc(Cl)cc(Cl)c4)c(=O)n3c2</chem>	468.10
386	 <chem>NCCCNCCc1ccc(F)c(c1)c2nc(=O)c3nc(NC(=O)Nc4ccc(C#N)cc4)c(=O)n3c2</chem>	436.00
387	 <chem>NCCCNCCc1ccc(F)c(c1)c2nc(=O)c3nc(NC(=O)Nc4cc(Cl)c(Cl)cc4)c(=O)n3c2</chem>	480.00
388	 <chem>NCCCNCCc1ccc(F)c(c1)c2nc(=O)c3nc(NC(=O)Nc4cc(Cl)c(Cl)c(Cl)c4)c(=O)n3c2</chem>	514.50

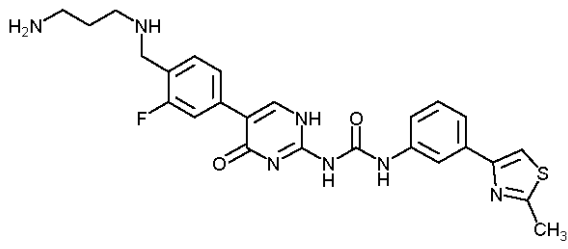
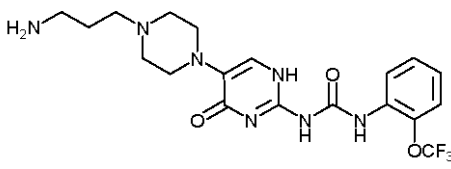
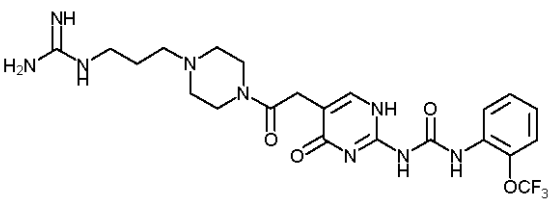
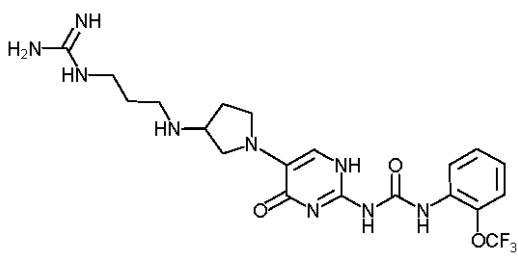
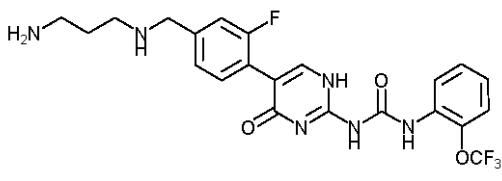
389	 <chem>NCCNCc1ccc(F)c(c1)c2nc(=O)[nH]c3c2n(c(=O)[nH]3)NC(=O)Nc4ccc(F)c([N+](=O)[O-])c4</chem>	474.00
394	 <chem>NC(=O)NCCCN(CCCN)Cc1ccc(cc1)c2nc(=O)[nH]c3c2n(c(=O)[nH]3)NC(=O)Nc4cc(OC(F)(F)F)ccc4</chem>	577.00
395	 <chem>NC(=O)NCCCN(CCCN)Cc1ccc(cc1)c2nc(=O)[nH]c3c2n(c(=O)[nH]3)NC(=O)Nc4cc(F)c(F)c(F)c4</chem>	490.00
397	 <chem>NC(=O)NCCCN(CCCN)Cc1ccc(cc1)c2nc(=O)[nH]c3c2n(c(=O)[nH]3)NC(=O)Nc4cc(OC(F)(F)F)ccc4</chem>	545.00

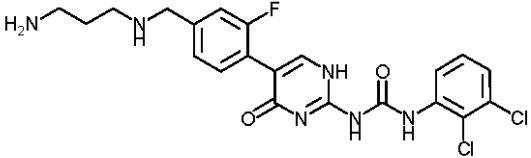
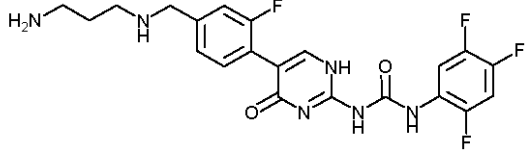
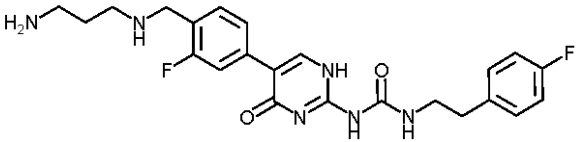
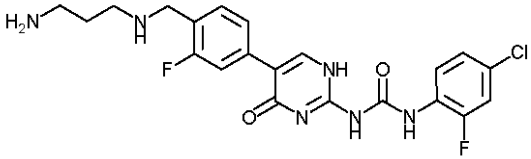
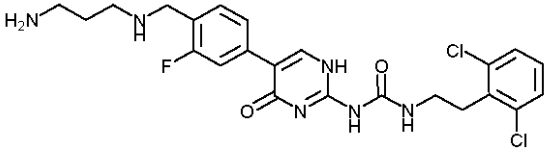
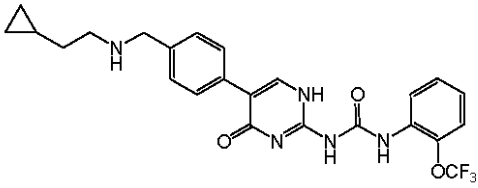
398		544.00
399		566.00
401		515.00
405		498.20

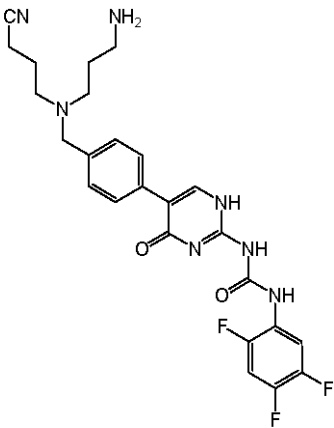
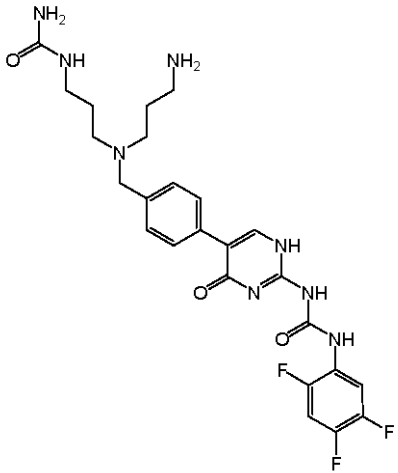
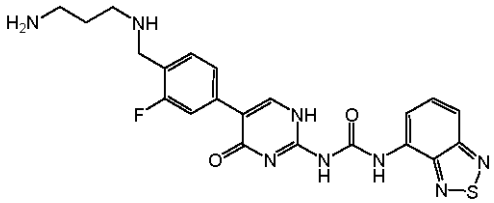
406		512.10
407		498.10
408		482.00
409		441.00
410		441.00
413		497.00

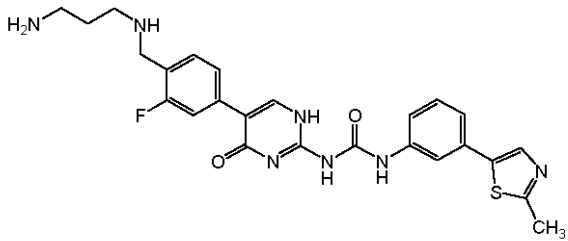
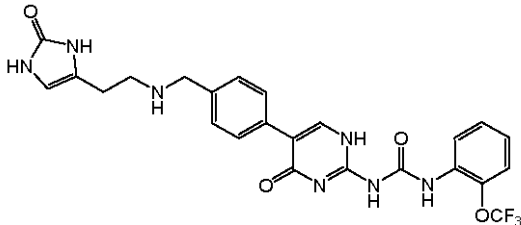
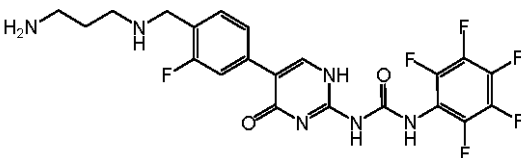
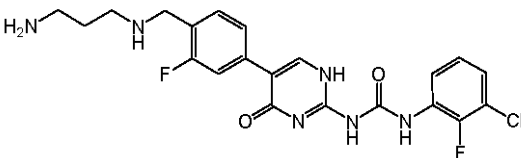
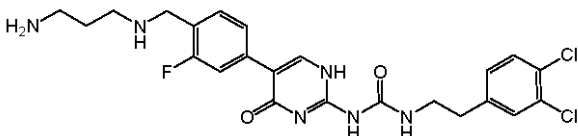
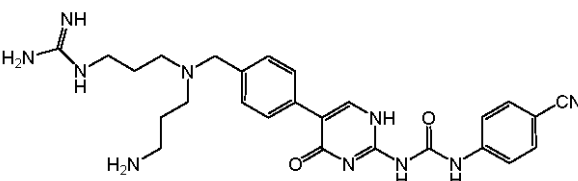
414		500.00
415		486.00
416		486.00
417		506.00
418		476.00

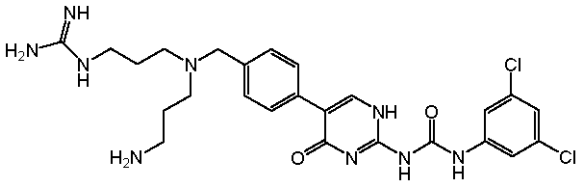
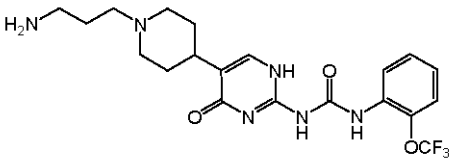
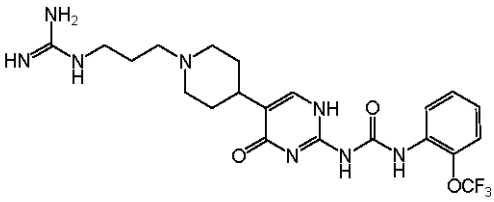
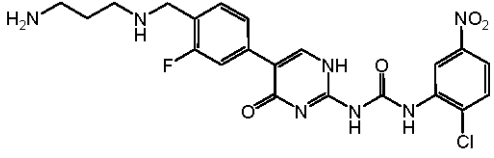
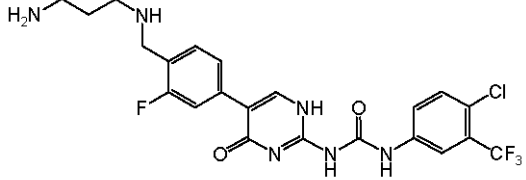
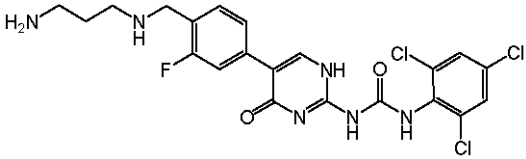
419		513.00
420		507.00
421		473.00
422		498.10
423		473.00

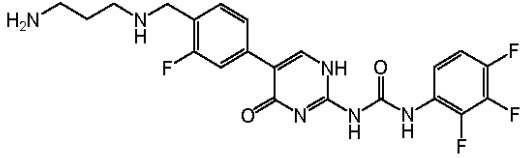
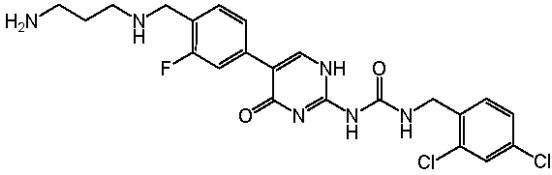
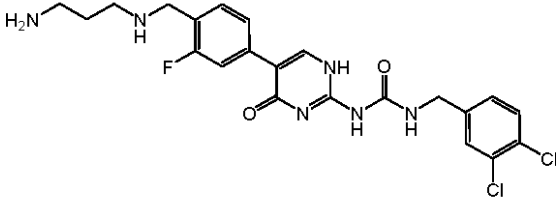
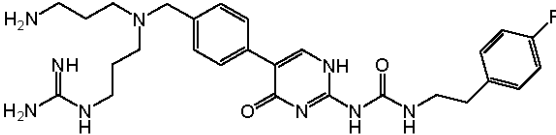
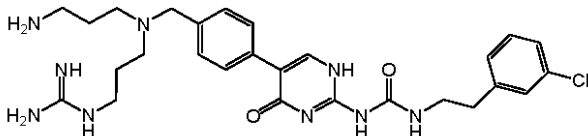
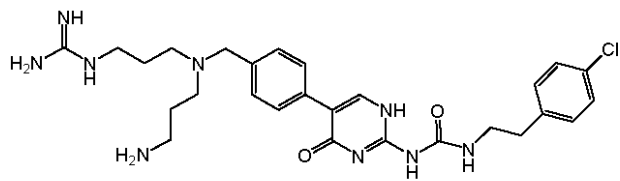
424	 <chem>NCCCNc1ccc(cc1C2=NC(=O)NC(=N2)NC(=O)Nc3ccc(cc3c4nc(C)s4)N)C5=CC=CC=C5</chem>	508.00
425	 <chem>NCCCN(CCCN1CCN(C1)C2=NC(=O)NC(=N2)NC(=O)Nc3cc(OC(F)(F)F)ccc3)C4=CC=CC=C4</chem>	456.00
429	 <chem>Nc1nc(NC(=O)N2CCN(C2)C3=CC(=O)NC(=N3)NC(=O)Nc4cc(OC(F)(F)F)ccc4)C5=CC=CC=C5</chem>	540.20
431	 <chem>Nc1nc(NC(=O)N2CCN(C2)C3=CC(=O)NC(=N3)NC(=O)Nc4cc(OC(F)(F)F)ccc4)C5=CC=CC=C5</chem>	498.10
432	 <chem>NCCCNc1ccc(cc1C2=NC(=O)NC(=N2)NC(=O)Nc3cc(OC(F)(F)F)ccc3)C4=CC=CC=C4</chem>	495.10

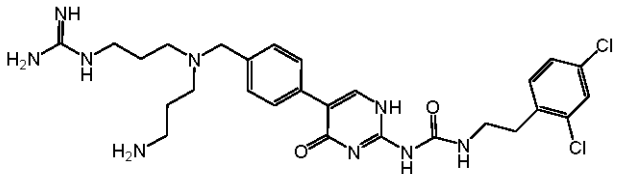
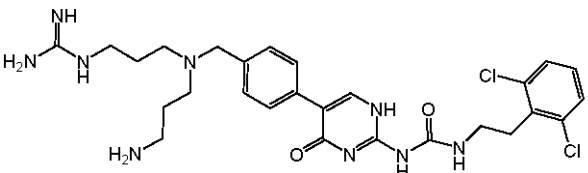
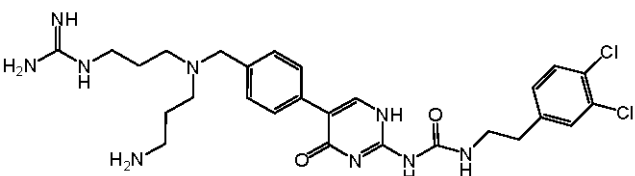
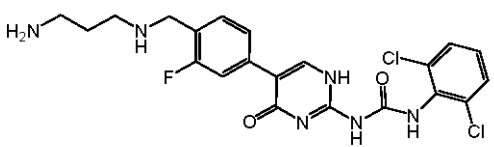
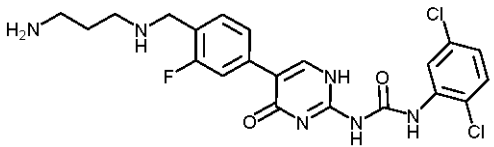
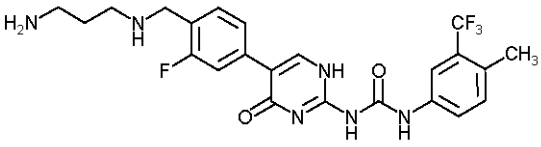
433		479.10
434		465.00
435		457.00
436		463.00
437		507.00
441		488.00

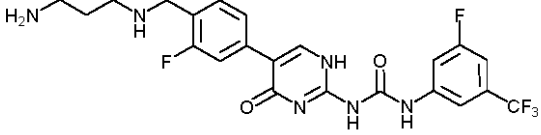
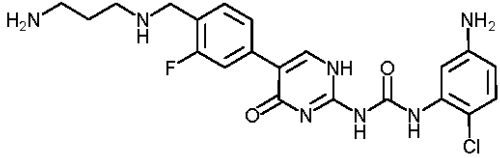
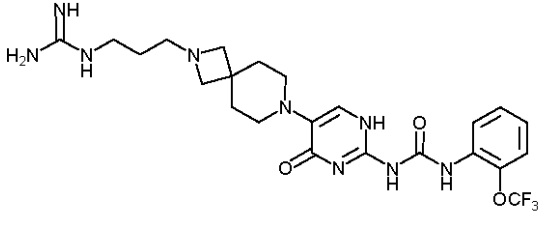
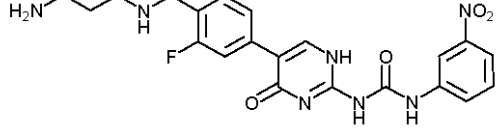
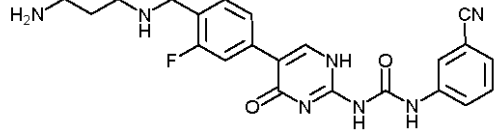
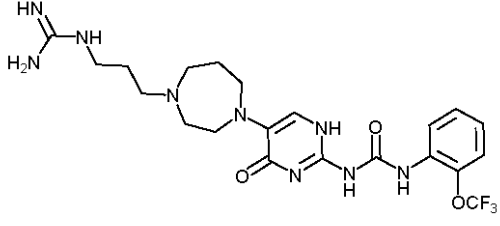
443		514.00
444		547.00
445		469.10

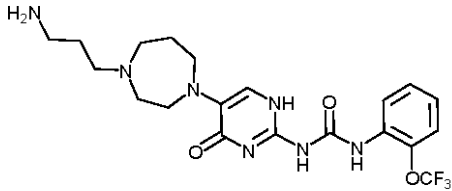
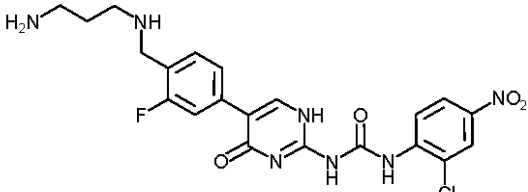
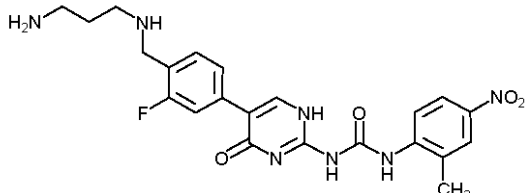
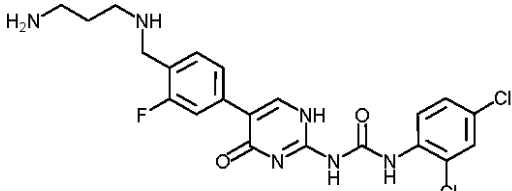
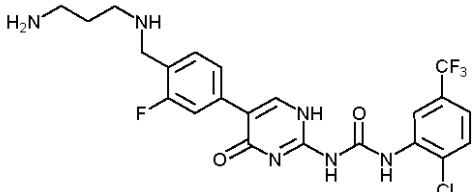
446		508.10
448		530.00
449		501.00
450		463.00
451		507.00
452		517.00

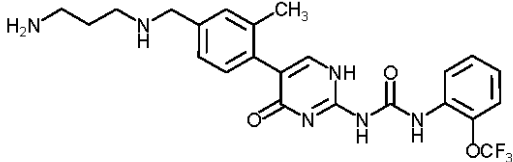
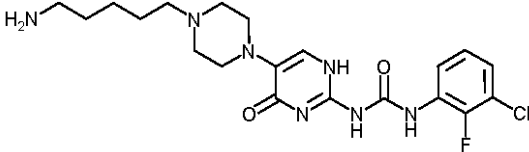
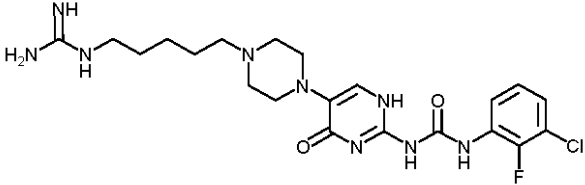
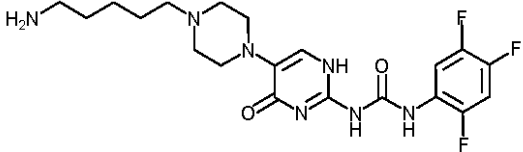
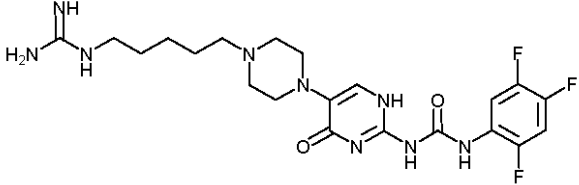
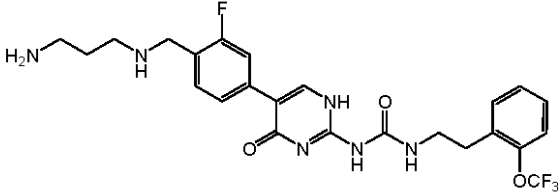
453		560.00
455		455.10
456		497.20
457		490.10
459		513.00
461		513.00

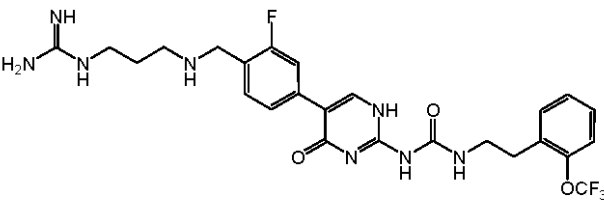
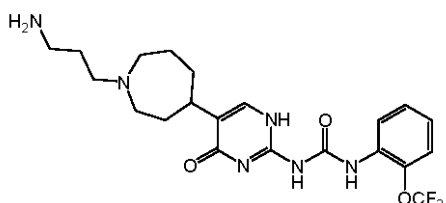
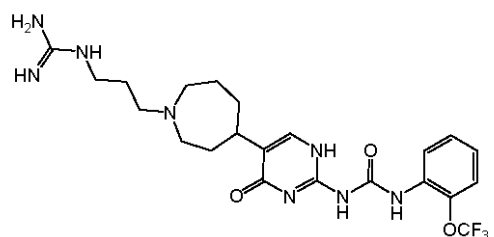
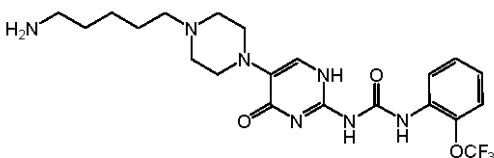
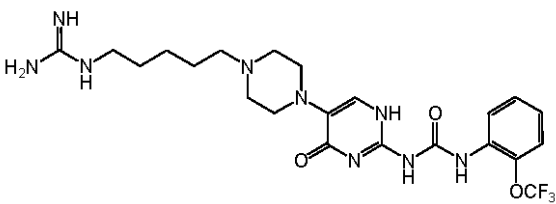
462		465.00
463		493.00
464		493.00
465		538.00
466		554.00
475		544.00

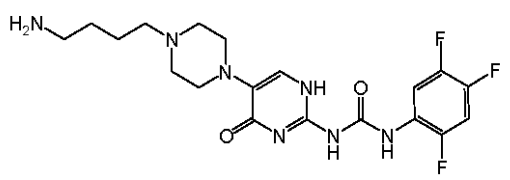
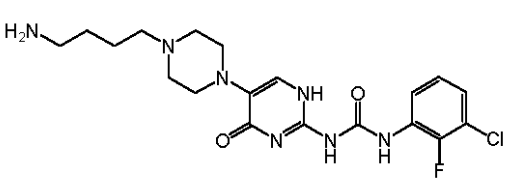
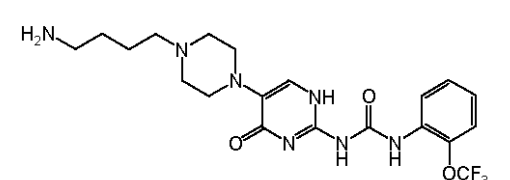
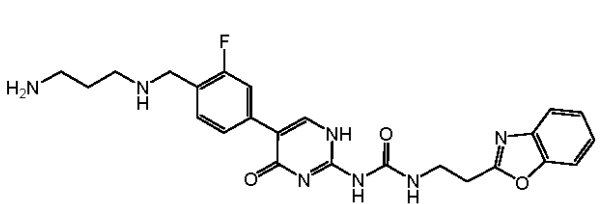
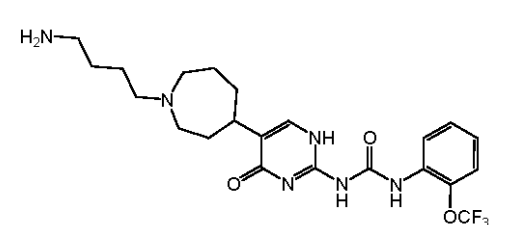
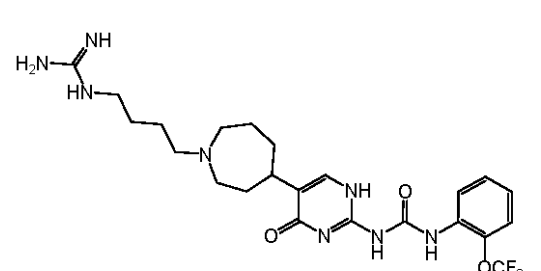
476		588.00
477		588.00
478		588.00
479		479.00
480		479.00
481		493.10

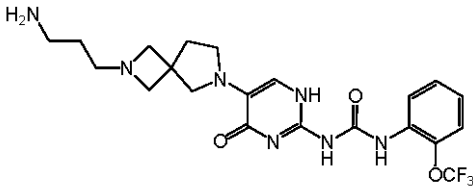
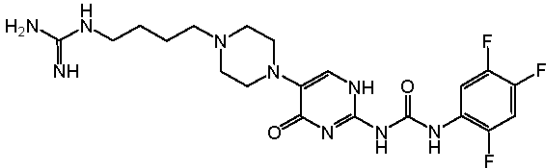
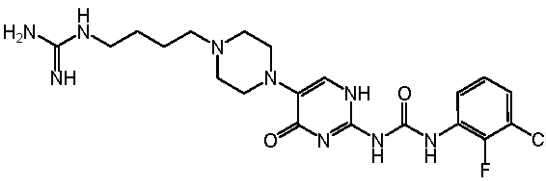
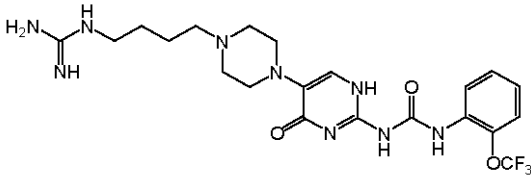
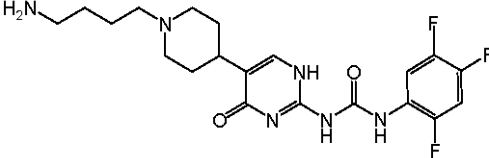
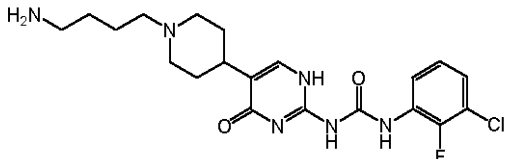
482		497.00
483		459.90
484		538.20
485		456.00
486		436.20
491		512.10

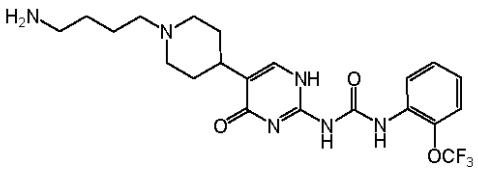
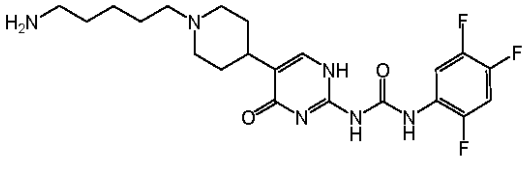
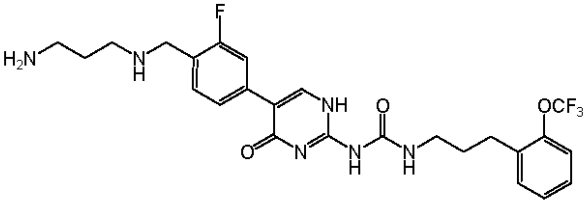
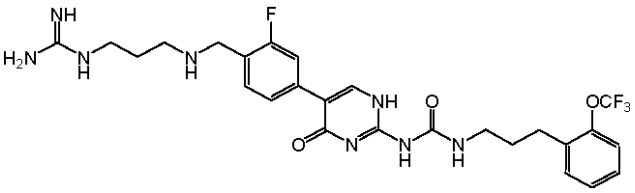
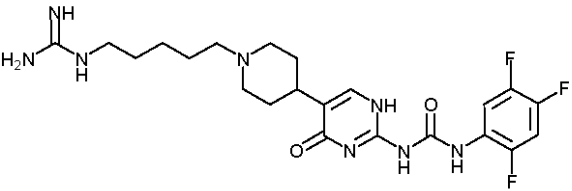
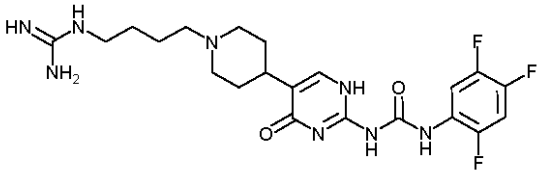
492		470.10
494		490.00
495		470.00
496		479.00
497		513.00

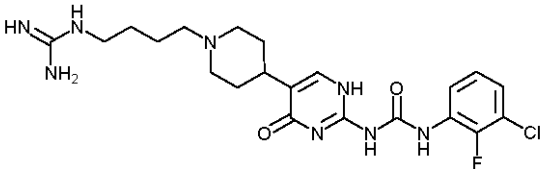
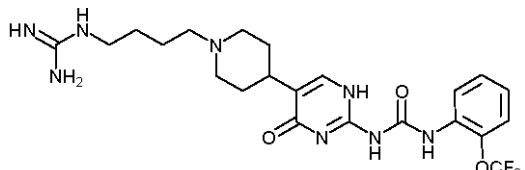
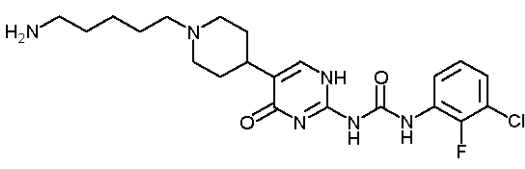
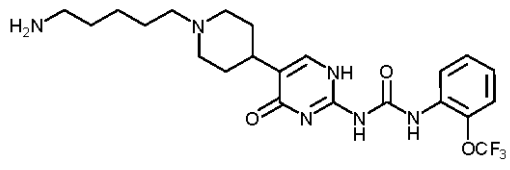
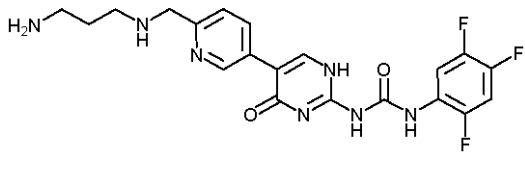
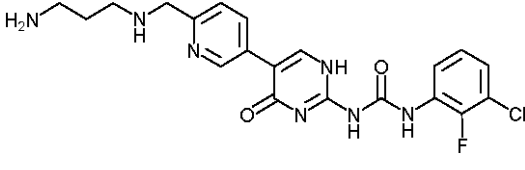
500		491.10
501		552.00
502		494.00
504		454.00
505		496.00
512		523.10

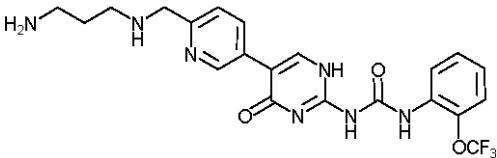
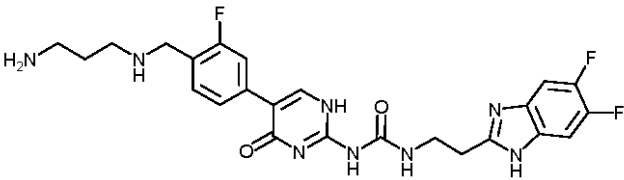
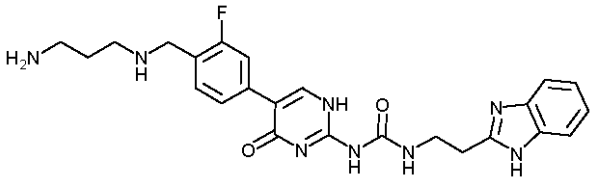
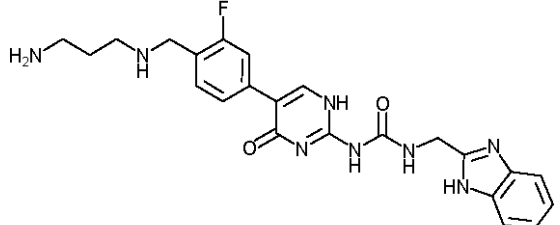
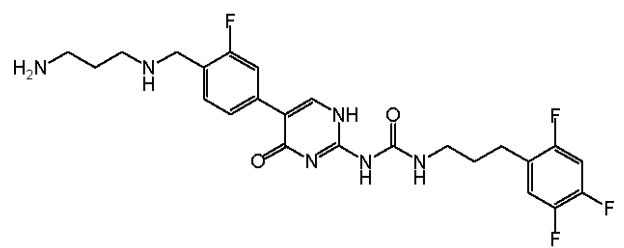
513		565.10
516		469.10
517		511.10
518		484.00
519		526.00

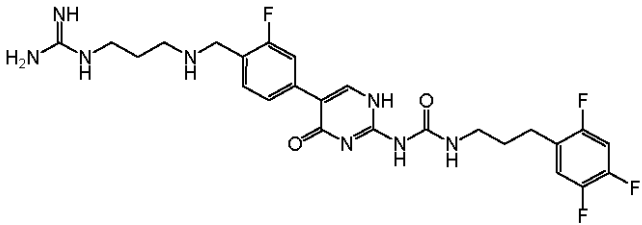
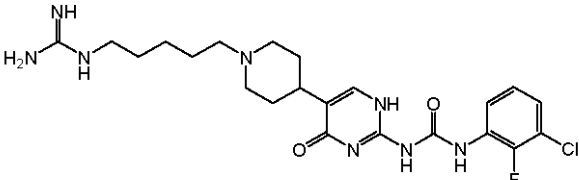
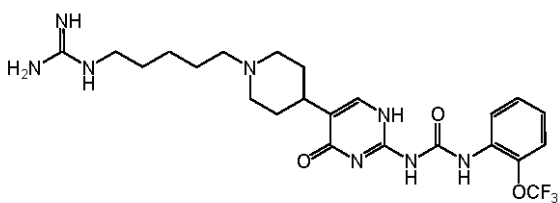
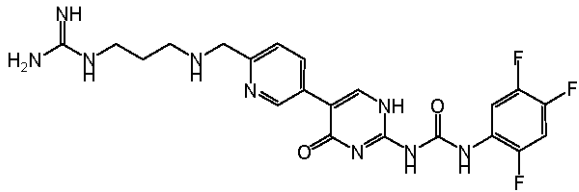
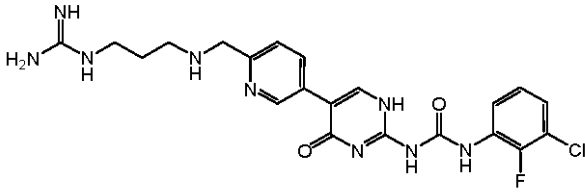
520		440.00
521		436.00
522		469.00
523		480.10
524		483.10
525		525.10

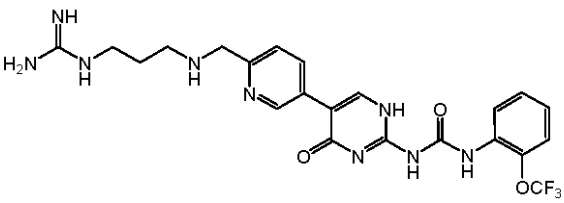
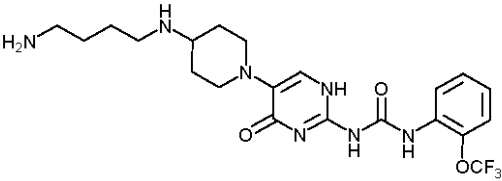
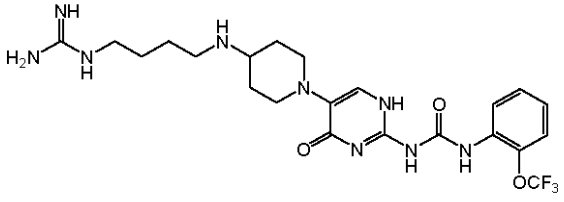
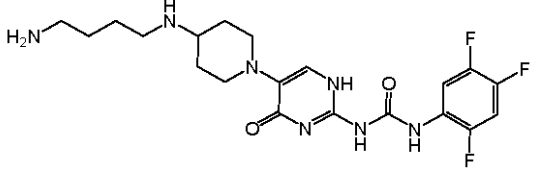
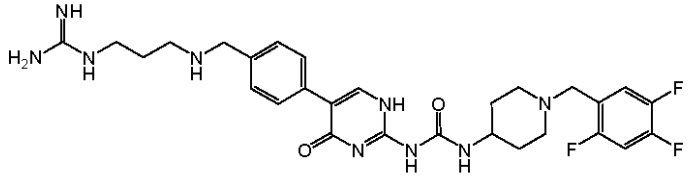
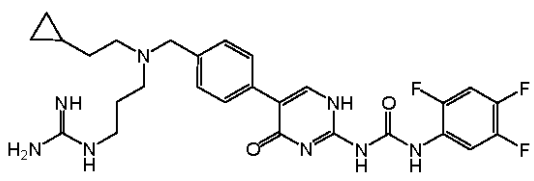
527		482.00
532		442.00
533		480.00
534		512.00
535		440.00
536		438.00

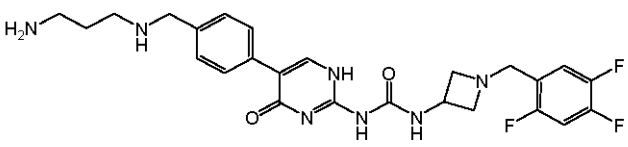
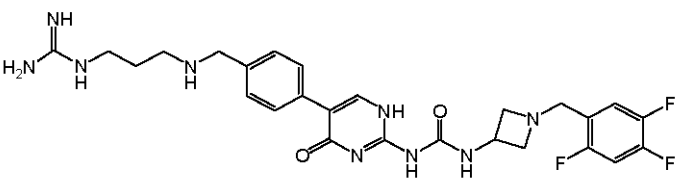
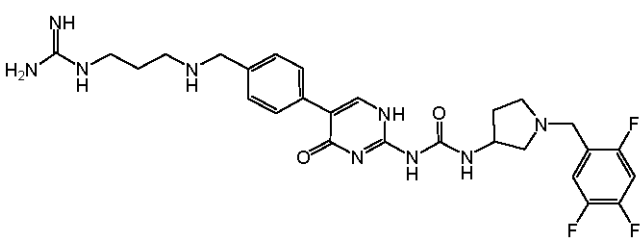
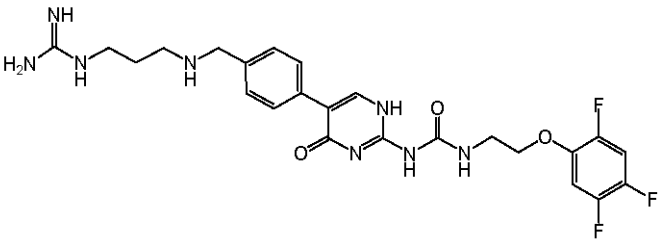
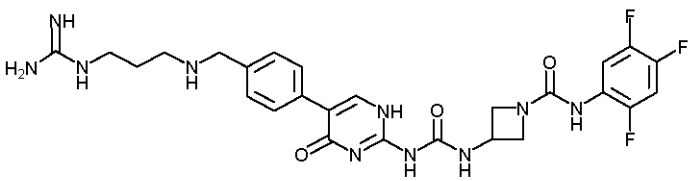
537		469.00
538		454.00
539		537.10
540		579.10
545		495.00
546		481.00

547		480.00
548		511.00
549		452.00
550		483.00
551		449.00
552		447.00

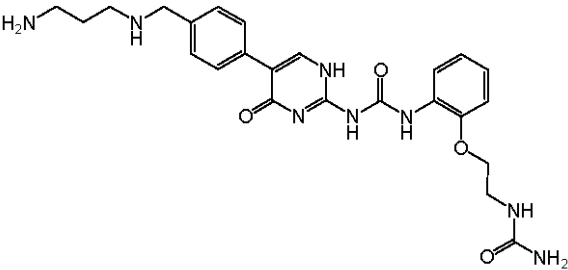
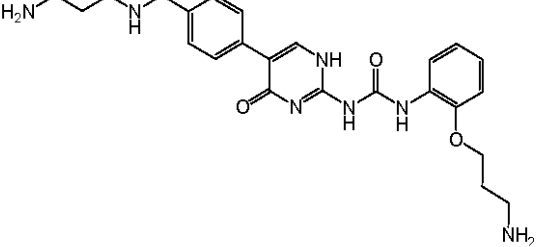
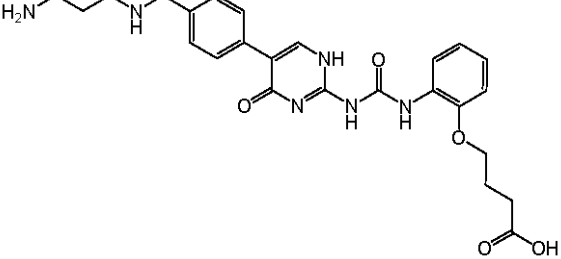
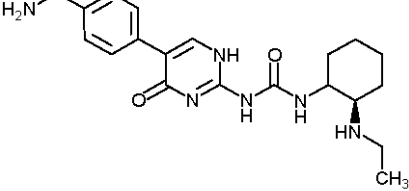
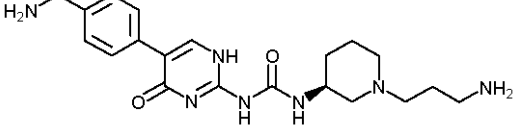
553		478.00
554		515.10
555		479.00
556		465.00
574		507.10

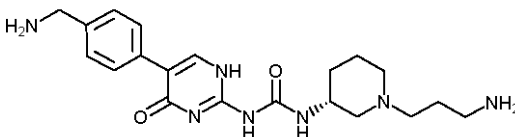
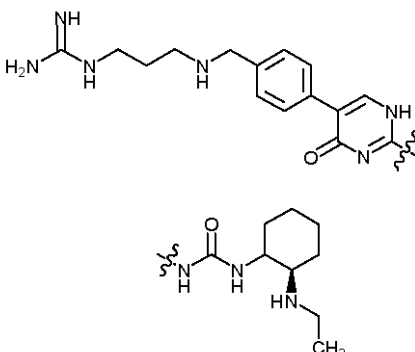
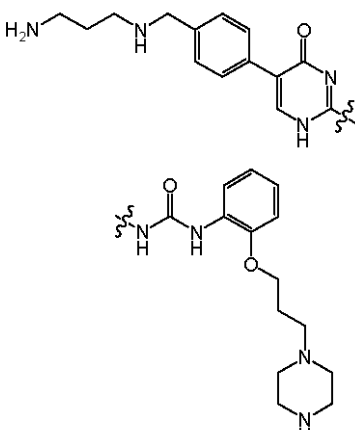
582		549.10
583		494.00
584		525.00
585		489.00
593		489.10

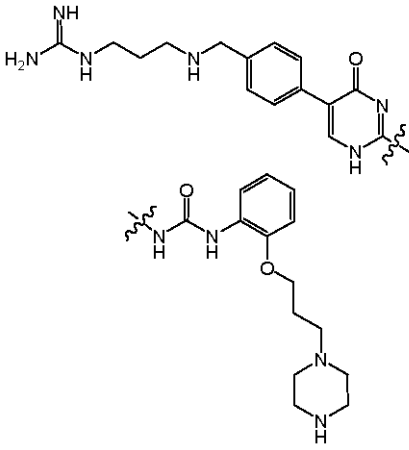
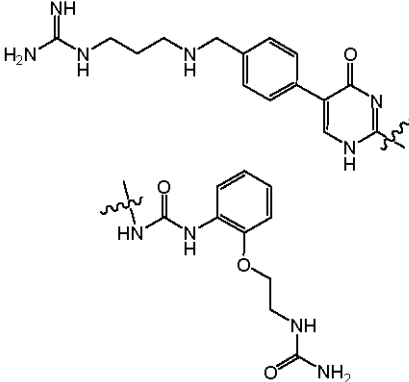
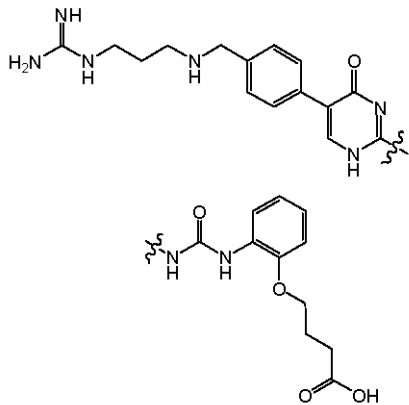
594		520.10
599		484.10
605		526.10
619		454.10
652		586.10
680		557.10

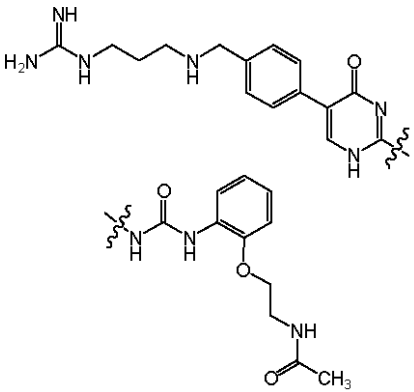
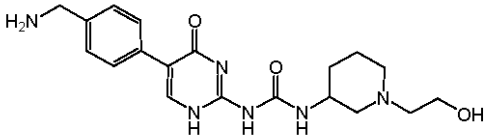
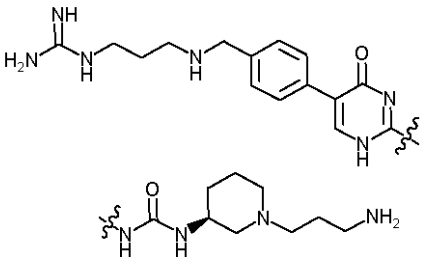
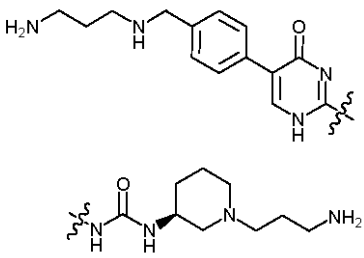
710		516.10
712		558.20
735		572.30
739		533.20
747		587.10

779	 <chem>NC(=N)NCCCNCCc1ccc(cc1)-c2nc(=O)[nH]c(=O)n2NC(=O)Nc3cc(F)ccc3S(=O)(=O)N4CCN4</chem>	608.10
780	 <chem>NC(=N)NCCCNCCc1ccc(cc1)-c2nc(=O)[nH]c(=O)n2C(=O)N3CCN3C4=CC(F)=CC(F)=C4</chem>	572.20
1283	 <chem>NC(=O)CCNCCc1ccc(cc1)-c2nc(=O)[nH]c(=O)n2NC(=O)Nc3cc(OCc4cc(NC(=O)C)ccc4)ccc3</chem>	494.00
1291	 <chem>NC(=O)CCNCCc1ccc(cc1)-c2nc(=O)[nH]c(=O)n2NC(=O)Nc3cc(OCCCN(C)C)ccc3</chem>	494.00
1294	 <chem>NC(=O)CCNCCc1ccc(cc1)-c2nc(=O)[nH]c(=O)n2NC(=O)Nc3cc(OCCCO)ccc3</chem>	467.00

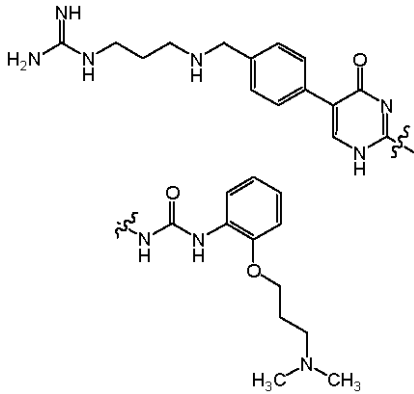
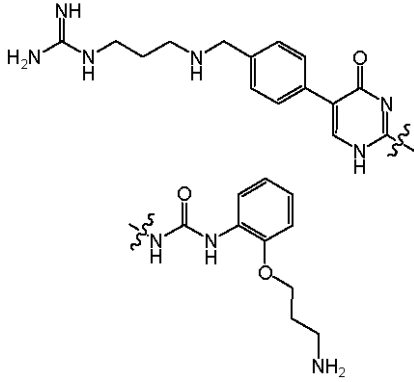
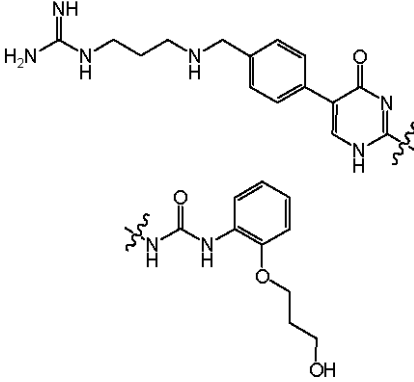
1295		495.00
1296		466.00
1297		495.00
1302		385.10
1303		400.10

1304		400.10
1308		484.80
1311		533.0 [M-H] ⁻

1312		577
1313		537
1314		537

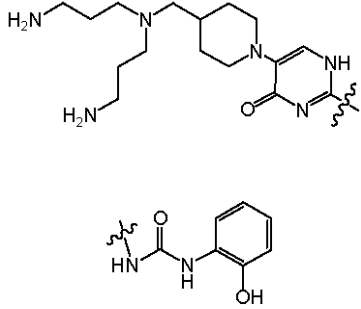
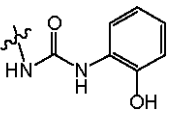
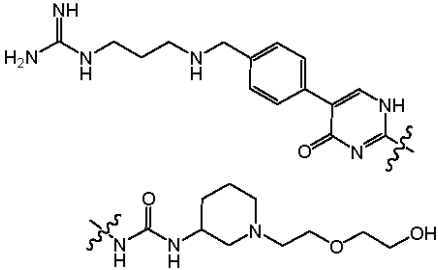
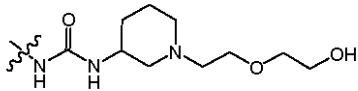
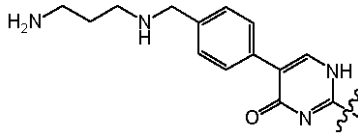
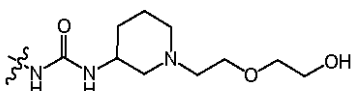
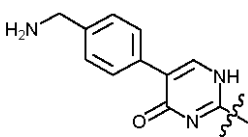
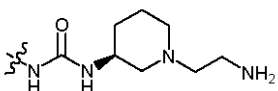
1315		536
1317		386.9
1318		500.6
1319		457.1

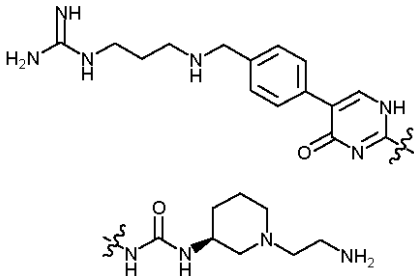
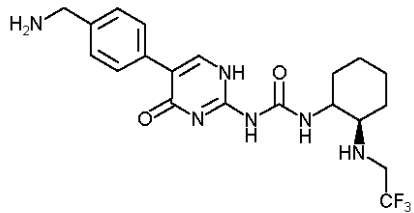
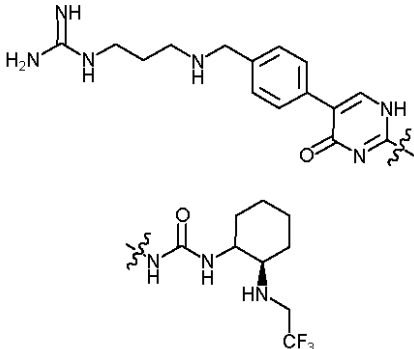
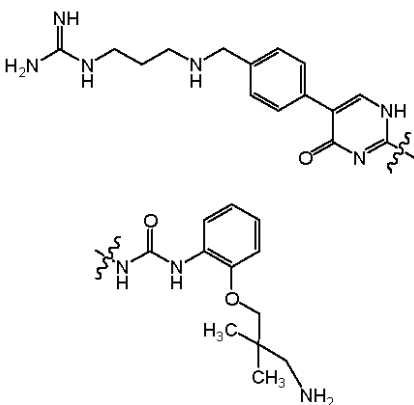
1320		499.4
1321		457.1
1322		486.8
1323		444.5

1331		536
1332		508
1333		509

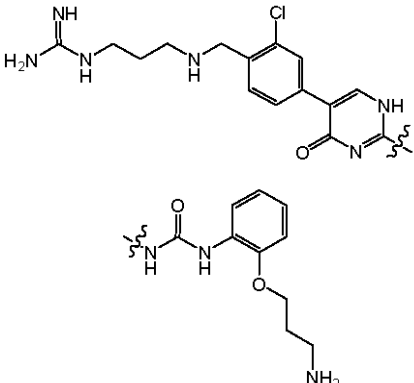
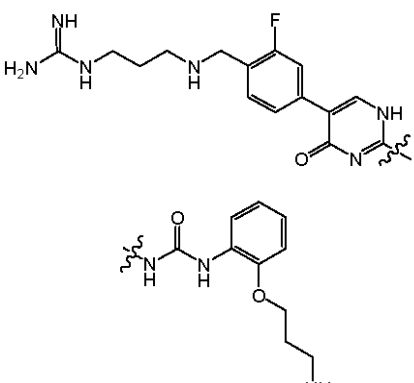
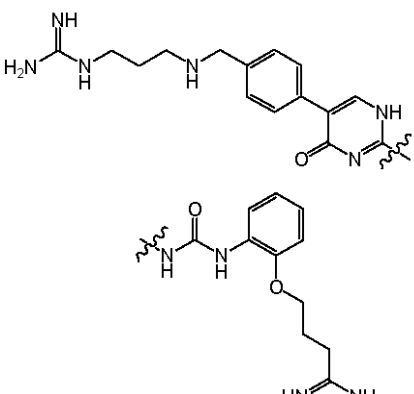
1337		512.8
1338		413.8
1339		516.3
1340		473.8

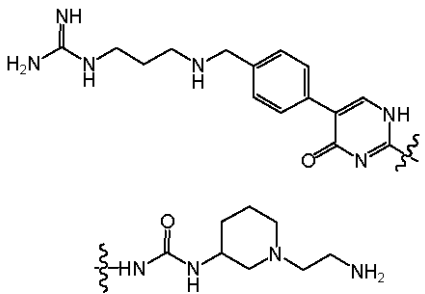
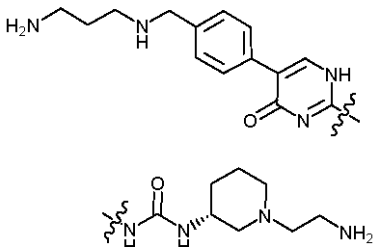
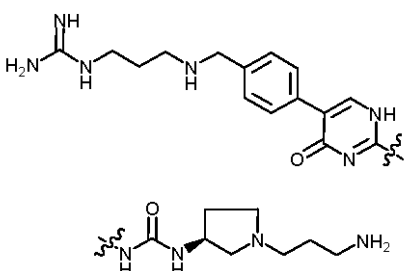
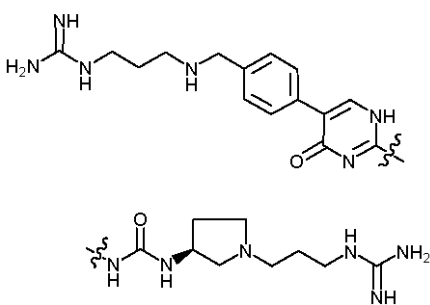
1341	 <chem>Nc1ccc(cc1)C2=CN(C(=O)N2)C3=CC=CC=C3</chem> <chem>NC(=O)N1CCN(CC1)CCOCCO</chem>	431.9
1345	 <chem>Nc1ccc(cc1)C2=CN(C(=O)N2)C3=CC=CC=C3</chem> <chem>NC(=O)N1CCN(CC1)CCOCCO</chem>	526.3
1346	 <chem>Nc1ccc(cc1)C2=CN(C(=O)N2)C3=CC=CC=C3</chem> <chem>NC(=O)N1CCN(CC1)CCOCCO</chem>	625.3
1347	 <chem>Nc1ccc(cc1)C2=CN(C(=O)N2)C3=CC=CC=C3</chem> <chem>NC(=O)N1CCN(CC1)CCOCCO</chem>	484.0

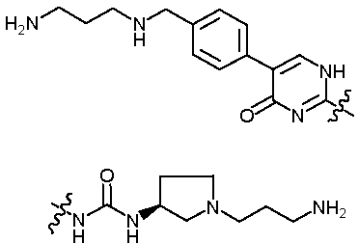
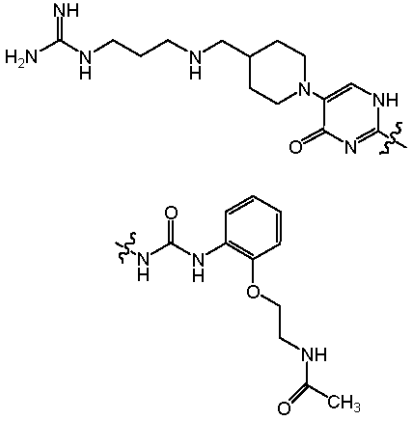
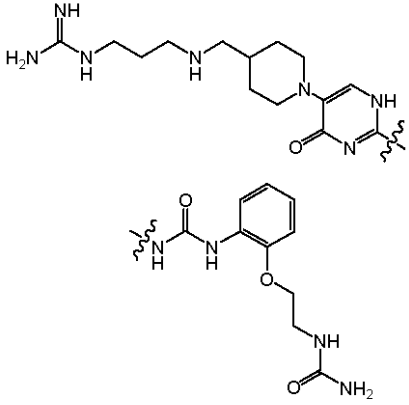
1348	 	541.1
1353	 	529.7
1354	 	489.4
1355	 	386.1

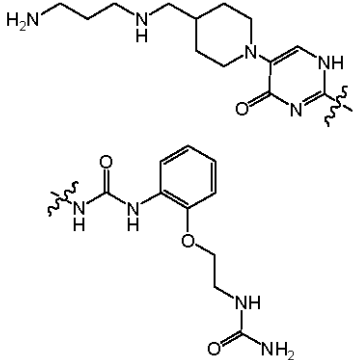
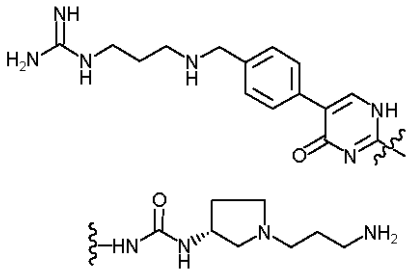
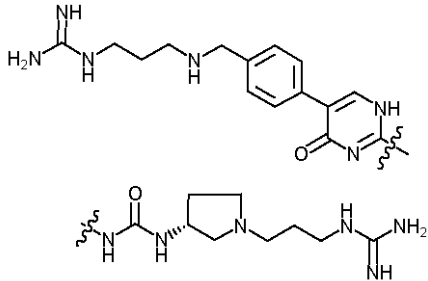
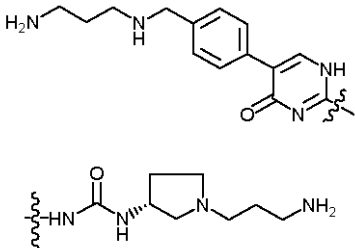
1356		485.5
1357		439.0
1358		538.1
1362		536

1363	 <chem>NCCCNCCc1ccc(cc1C2=NC(=O)NC(=N2)*)C(=O)Nc3ccccc3OCCCN=C(N)N</chem>	493
1364	 <chem>NCCCNCCc1ccc(cc1C2=NC(=O)NC(=N2)*)C(=O)Nc3ccccc3OCCCN(C)C(N)</chem>	520 [M-H] ⁻
1375	 <chem>NCCCNCCc1ccc(cc1C2=NC(=O)NC(=N2)*)C(=O)Nc3ccccc3OCCCN(F)C(N)</chem>	526

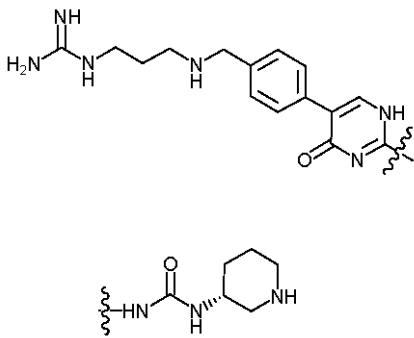
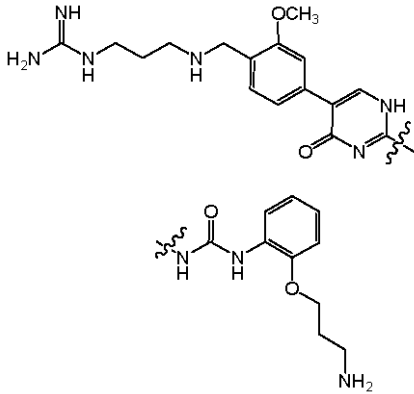
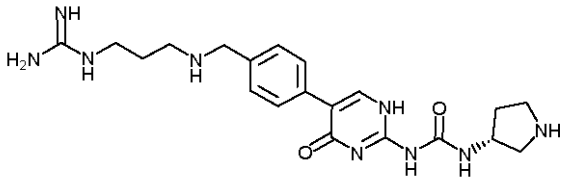
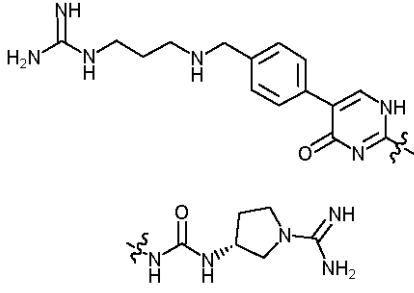
1376		542
1377		526
1378		535

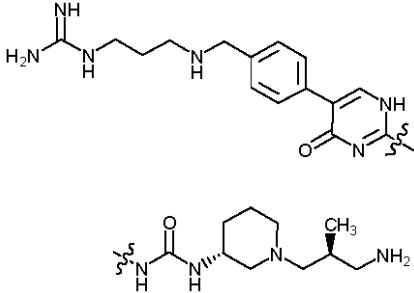
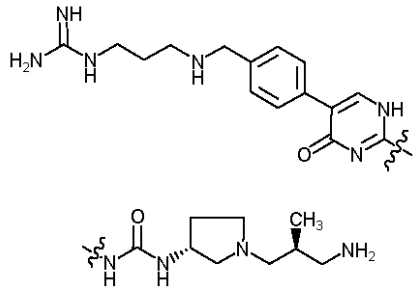
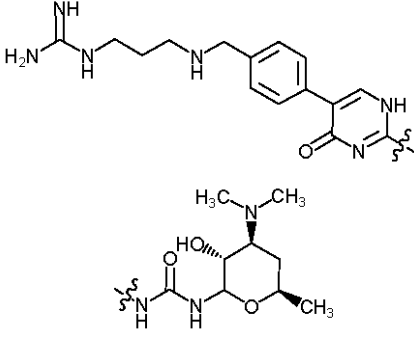
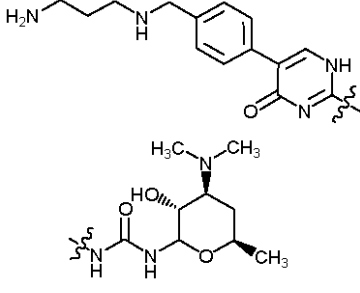
1382		485.0
1383		442.8
1384		484.8
1385		526.8

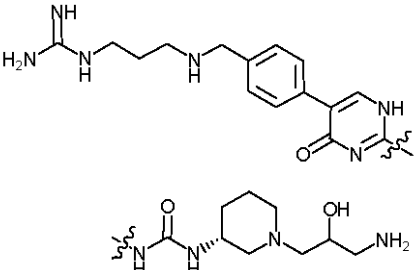
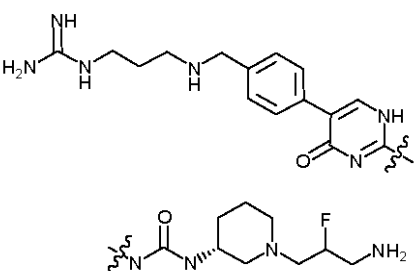
1386		443.0
1387		543.3
1388		544.3

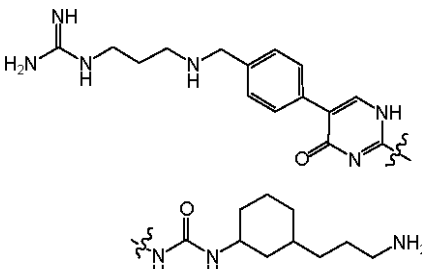
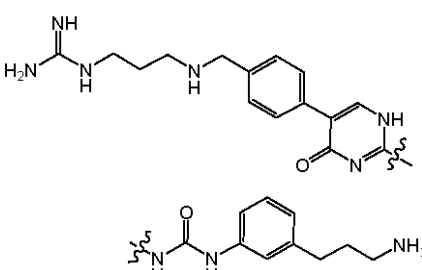
1389		502.4
1394		485.6
1395		527.8
1396		443.2

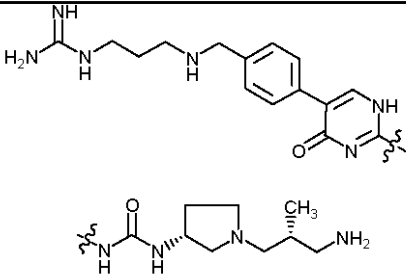
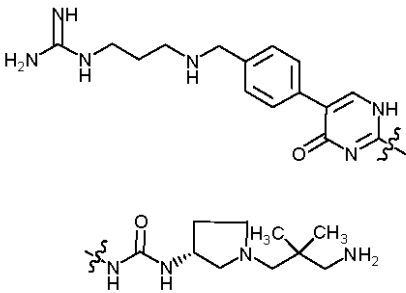
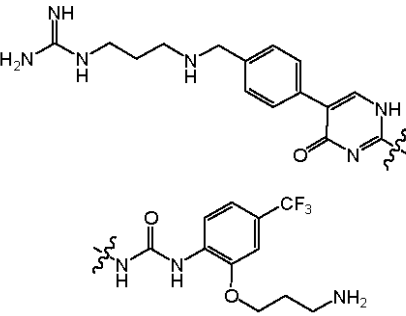
1401	 <chem>N=C(N)NCCCCNCc1ccc(C)cc1-c2nc3c(ncn3C(=O)c4nc5c(ncn5C(=O)Nc6ccccc6OCCCN)C(=O)N)C(=O)N</chem>	522
1402	 <chem>N=C(N)NCCCCNCc1ccc(C)cc1-c2nc3c(ncn3C(=O)Nc4ccccc4OCCNC)C(=O)N</chem>	538
1403	 <chem>N=C(N)NCCCCNCc1ccc(C)cc1-c2nc3c(ncn3C(=O)Nc4ccccc4OCCNF(F)F)C(=O)N</chem>	544

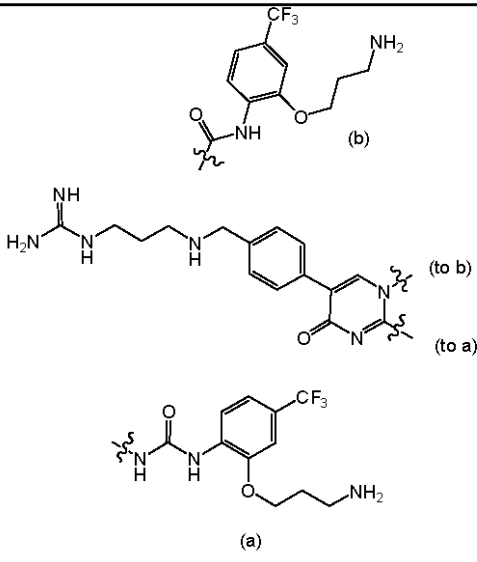
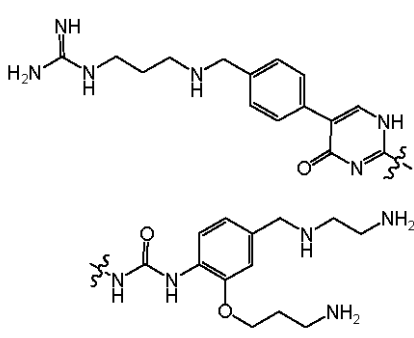
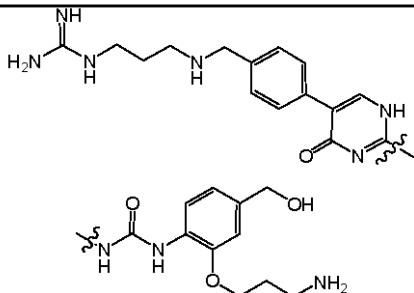
1407		442.4
1409		538
1419		428.8
1420		470.2

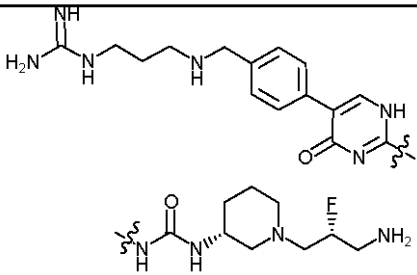
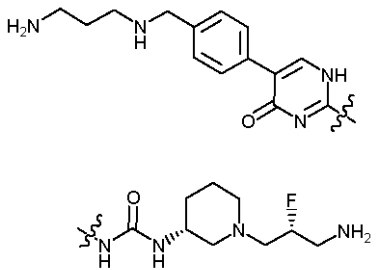
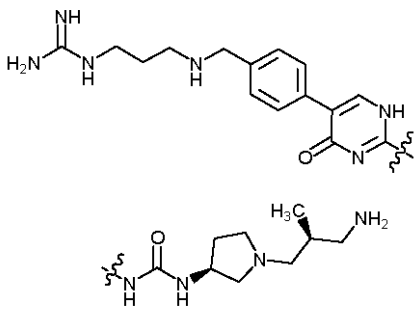
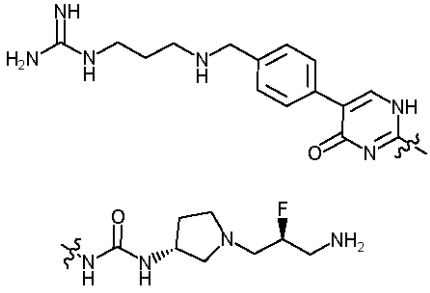
1424		513.0
1425		498.8
1429		516.1
1430		474.6

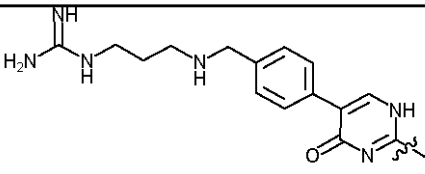
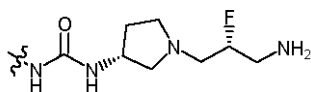
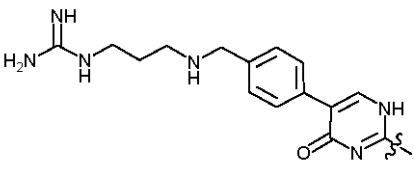
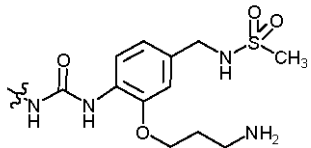
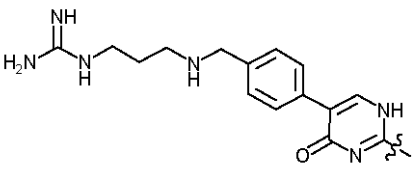
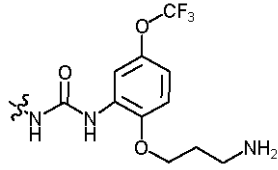
1445		516.0
1454		517.1

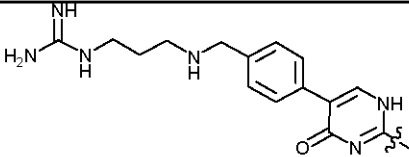
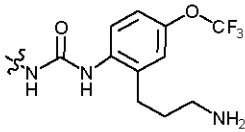
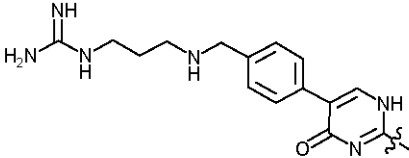
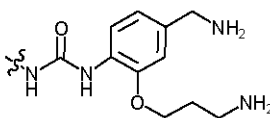
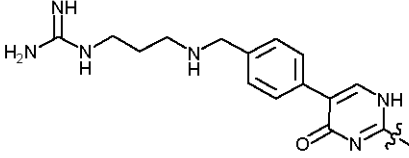
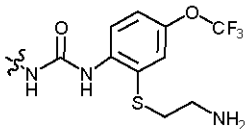
3000b		498.00
3001b		492.30
3002b		498.80

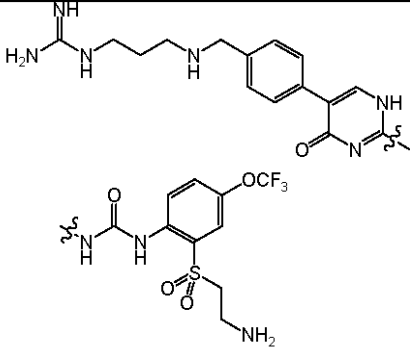
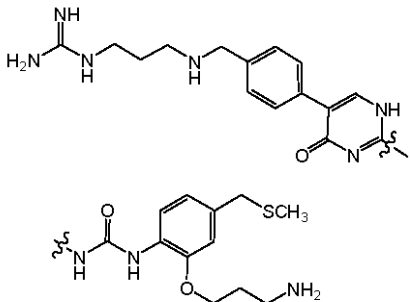
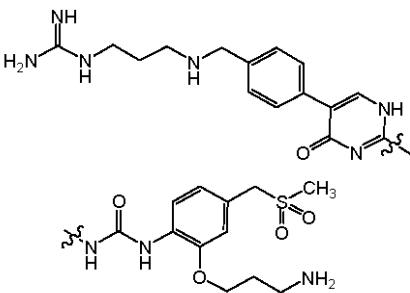
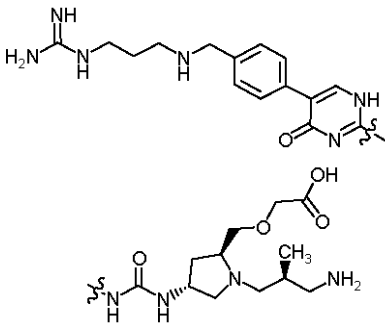
	 <p>The structure shows a peptide backbone with a side chain containing a 4-(pyrimidin-2-yl)phenyl group. The pyrimidine ring has a wavy line at the 5-position. Below it is a cyclopropane ring with a wavy line at the 1-position and a 2-amino-2-methylpropyl group at the 3-position.</p>	
3003b	 <p>The structure is identical to the one above, showing a peptide backbone with a side chain containing a 4-(pyrimidin-2-yl)phenyl group and a cyclopropane ring with a wavy line at the 1-position and a 2-amino-2-methylpropyl group at the 3-position.</p>	513.60
3004b	 <p>The structure shows a peptide backbone with a side chain containing a 4-(pyrimidin-2-yl)phenyl group. The pyrimidine ring has a wavy line at the 5-position. Below it is a cyclopropane ring with a wavy line at the 1-position and a 2-amino-2-methylpropyl group at the 3-position.</p>	576.30
3005b		418.30 [M+2H] ⁺ /2

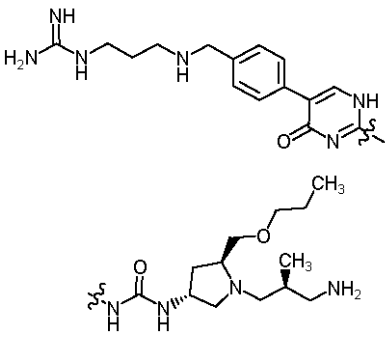
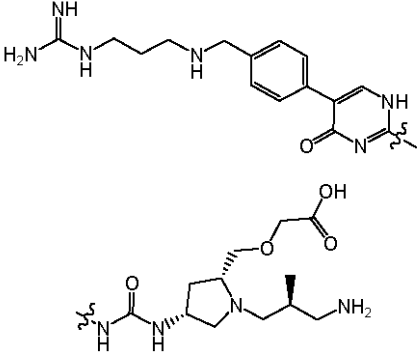
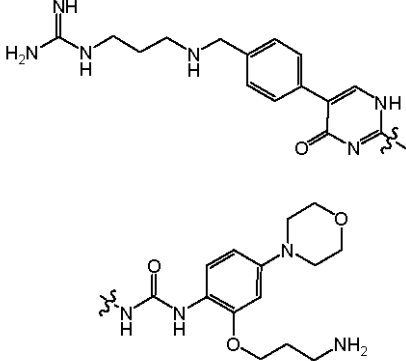
	 <p>(b)</p> <p>(a)</p>	
3006b		480.90
3007b		538.30
3008b		517.80

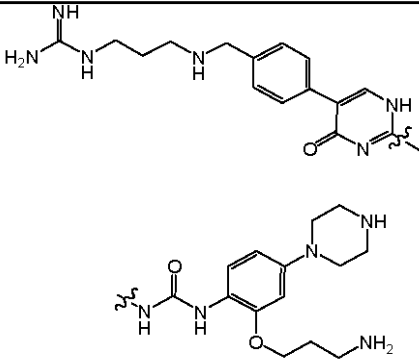
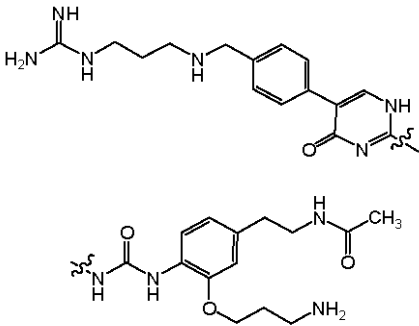
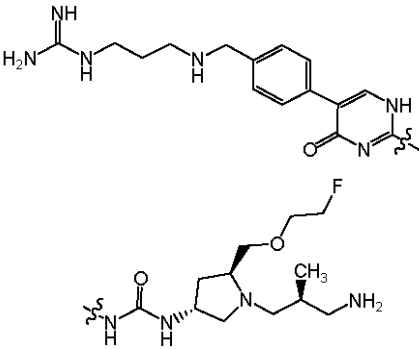
	 <p>The structure shows a hydrazide group (H₂N-C(=NH)-NH-) connected to a piperidine ring. The piperidine ring is substituted with a 2-((4-(benzimidazol-2-yl)phenyl)methyl)amino group and a (2-aminoethyl)fluoromethyl group.</p>	
3009b	 <p>The structure shows a hydrazide group (H₂N-C(=NH)-NH-) connected to a piperidine ring. The piperidine ring is substituted with a 2-((4-(benzimidazol-2-yl)phenyl)methyl)amino group and a (2-aminoethyl)fluoromethyl group.</p>	474.80
3010b	 <p>The structure shows a hydrazide group (H₂N-C(=NH)-NH-) connected to a piperidine ring. The piperidine ring is substituted with a 2-((4-(benzimidazol-2-yl)phenyl)methyl)amino group and a (2-aminoethyl)fluoromethyl group.</p>	
3011b	 <p>The structure shows a hydrazide group (H₂N-C(=NH)-NH-) connected to a piperidine ring. The piperidine ring is substituted with a 2-((4-(benzimidazol-2-yl)phenyl)methyl)amino group and a (2-aminoethyl)fluoromethyl group.</p>	
3012b		

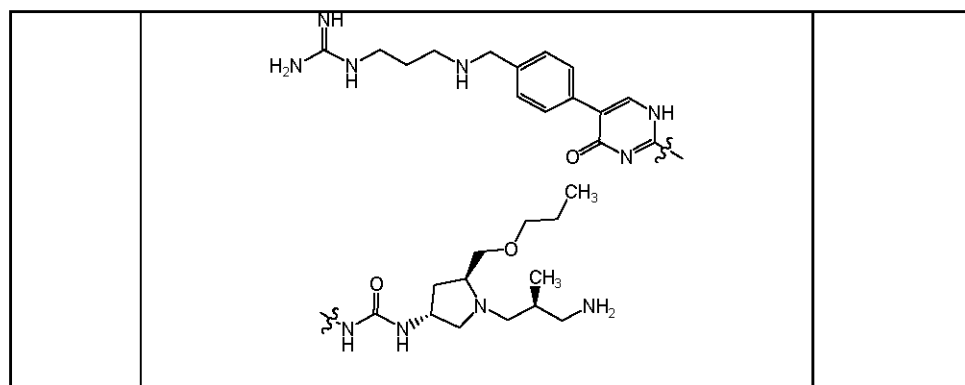
	 	
3013b	 	615.6
3014b	 	592.3
3015b		576.3

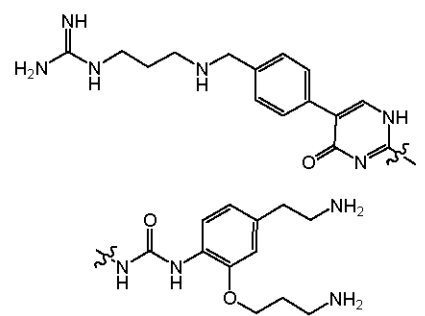
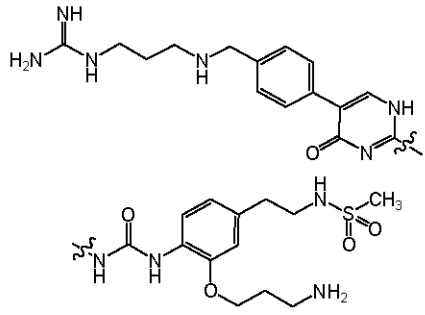
	 	
3016b	 	537.1
3017b	 	
3018b		626.0

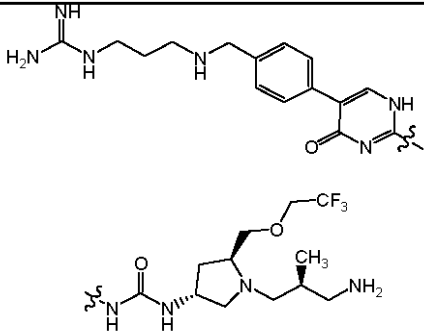
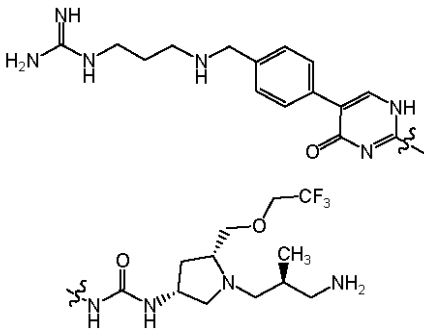
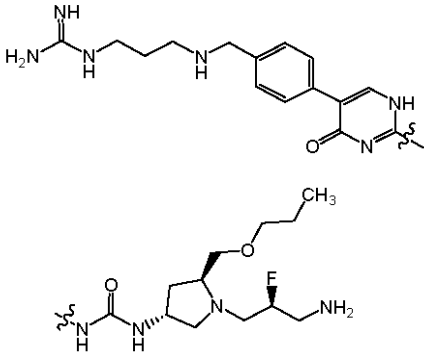
		
3019b		568.0
3020b		600.6
3021b		

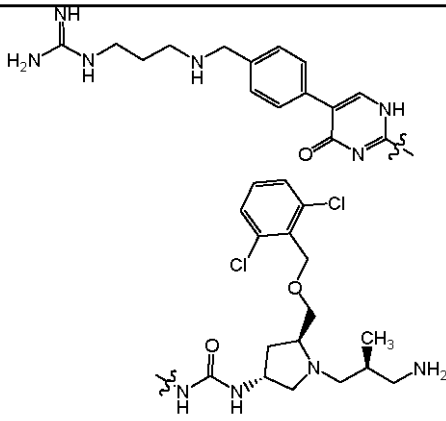
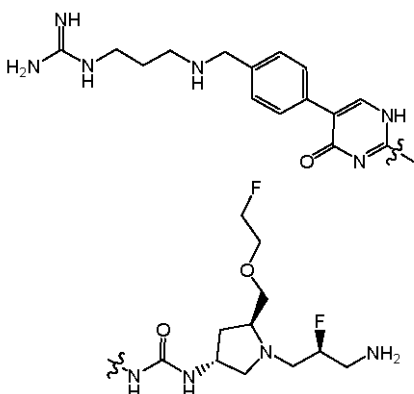
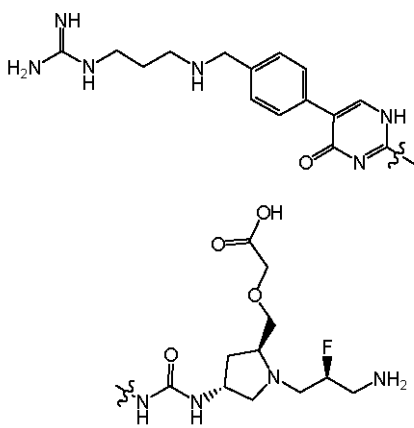
3022b		
3023b		
3024b		593.2
3025b		592.4

		
3026b		593.0
3027b		
3028b		



3029b		551.2
3030b		629.3
3031b		

		
3032b		
3033b		
3034b		

		
3035b		
3036b		

からなる群から選択される化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体。

【請求項 16】

請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体および薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 17】

ヒトまたは動物の病状を処置、予防するまたはそのリスクを低減するための組成物であって、有効量の請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体を含む、組成物。

【請求項 18】

有効量の請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体を含む、ヒトまたは動物の微生物感染症を処置するための組成物。

【請求項 19】

ヒトまたは動物における微生物感染症を処置するための医薬品の製造における、請求項

1 ~ 1 5 のいずれか一項に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体の使用。

【請求項 2 0】

有効量の請求項 1 ~ 1 5 のいずれか一項に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体を含む、ヒトまたは動物における微生物感染症を処置するまたはそのリスクを低減するための組成物であって、前記微生物感染症が、皮膚感染症、グラム陽性感染症、グラム陰性感染症、院内皮膚感染症、院内グラム陽性感染症、院内グラム陰性感染症、院内肺炎、市中肺炎、ウイルス感染後肺炎、院内感染肺炎 / 人工呼吸器関連肺炎、気道感染症、慢性気道感染症 (C R T I)、急性骨盤感染症、複雑性皮膚および皮膚組織感染症、非複雑性皮膚および軟部組織感染症 (u S S T I) および複雑性皮膚および軟部組織感染症を含む皮膚軟部組織感染症 (S S T I)、腹部感染症、複雑性腹内感染症、尿路感染症、菌血症、敗血症、心内膜炎、房室シャント感染症、バスキュラーアクセス感染症、髄膜炎、外科的予防、腹膜感染症、骨感染症、関節感染症、メチシリン耐性黄色ブドウ球菌 (*S t a p h y l o c o c c u s a u r e u s*) 感染症、バンコマイシン耐性腸球菌 (*E n t e r o c o c c i*) 感染症、リネゾリド耐性生物体感染症、炭疽菌感染症、野兔病菌感染症、ペスト菌感染症および結核からなる群から選択される組成物。

【請求項 2 1】

耳に、眼に、鼻に、経口で、非経口で、局所に、またはは静脈内に投与されることを特徴とする、請求項 1 7、1 8 および 2 0 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 2 2】

前記医薬は、耳に、眼に、鼻に、経口で、非経口で、局所に、またはは静脈内に投与されることを特徴とする、請求項 1 9 に記載の使用。

【請求項 2 3】

請求項 1 ~ 1 5 のいずれか一項に記載の化合物または薬学的に許容されるその塩もしくは互変異性体を含む医療用デバイス。

【請求項 2 4】

前記デバイスがステントである、請求項 2 3 に記載の医療用デバイス。