

【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30年8月30日 (2018.8.30)

【公表番号】特表2017-523197(P2017-523197A)

【公表日】平成29年8月17日 (2017.8.17)

【年通号数】公開・登録公報2017-031

【出願番号】特願2017-505253(P2017-505253)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/86 (2006.01)

A 6 1 K 31/4412 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 213/86 C S P

A 6 1 K 31/4412

A 6 1 P 31/04

【手続補正書】

【提出日】平成30年7月20日 (2018.7.20)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

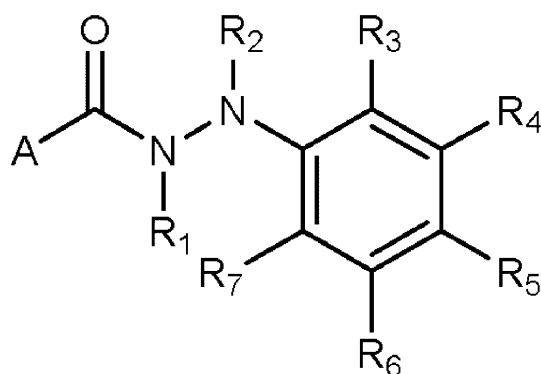
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物：

【化 1】



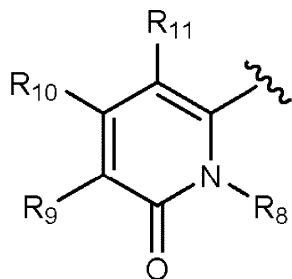
(I)

[ 式中、

A は、A<sub>1</sub>、A<sub>2</sub>、A<sub>3</sub> および A<sub>4</sub> から選択されるラジカルであり；

A<sub>1</sub> は

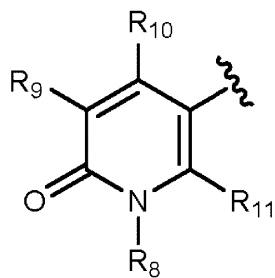
【化 2】



であり；

A<sub>2</sub> は

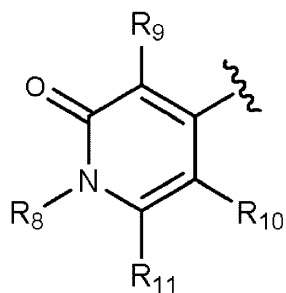
【化 3】



であり；

A<sub>3</sub> は

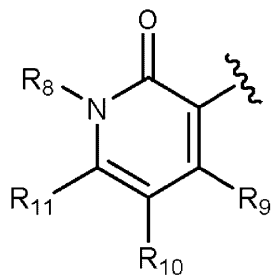
【化 4】



であり；

A<sub>4</sub> は

【化 5】



であり；

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は独立して、水素、C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、ハロ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルから選択され；

R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub> および R<sub>7</sub> は独立して、水素、-OH、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ 6 ア

ルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル、 $-NR_{12}R_{13}$ 、 $-N(R_{12})COR_{13}$ 、 $-N(R_{12})SO_2R_{13}$ 、ハロ $C_1 \sim 6$  アルキル、ヒドロキシ $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ $C_1 \sim 6$  アルキル、 $-COOR_{12}$ 、 $-CN$ 、 $-CONR_{12}R_{13}$ 、 $-SO_2-C_1 \sim 4$  アルキル、 $-SO_2-O-C_1 \sim 4$  アルキルおよび  $-SO_2-NR_{12}R_{13}$  から選択され；

$R_8$  は、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_2 \sim 6$  アルケニル、 $C_2 \sim 6$  アルキニル、ハロ $C_1 \sim 6$  アルキル、ヒドロキシ $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル $C_1 \sim 4$  アルキル、Ph $C_1 \sim 4$  アルキルおよび  $-C_1 \sim 4$  アルキル- $CONR_{12}R_{13}$  から選択され；

$R_9$ 、 $R_{10}$  および  $R_{11}$  は独立して、水素、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル $C_0 \sim 4$  アルキル、 $-NR_{12}R_{13}$ 、 $-N(R_{12})COR_{13}$ 、 $-N(R_{12})SO_2R_{13}$ 、ハロ $C_1 \sim 6$  アルキル、ヒドロキシ $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ $C_1 \sim 6$  アルキル、 $-COOR_{12}$ 、 $-CN$ 、 $-CONR_{12}R_{13}$ 、 $-SO_2-C_1 \sim 4$  アルキル、 $-SO_2-O-C_1 \sim 4$  アルキルおよび  $-SO_2-NR_{12}R_{13}$  から選択され；

$R_{12}$  および  $R_{13}$  はそれぞれ独立して、水素および  $C_1 \sim 4$  アルキルから選択され；  
ただし、以下の生成物：

1 - メチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロ - ピリジン - 2 - カルボン酸  $N'$  - フェニルヒドラジド、

1 - ベンジル - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロ - ピリジン - 3 - カルボン酸  $N'$  - ( 2 - (トリフルオロメチル)フェニル) - ヒドラジド、

1 - ベンジル - 4 , 6 - ジメチル - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロ - ピリジン - 3 - カルボン酸  $N'$  - フェニル - ヒドラジド、

1 - メチル - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロ - ピリジン - 4 - カルボン酸  $N'$  - ( 2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) - ヒドラジド、

1 - ( ( 3 - メチルフェニル)メチル) - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロ - ピリジン - 3 - カルボン酸  $N'$  - ( 3 - (トリフルオロメチル)フェニル) - ヒドラジドおよび

1 - ( ( 2 - クロロフェニル)メチル) - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロ - ピリジン - 3 - カルボン酸  $N'$  - フェニル -  $N'$  - メチル - ヒドラジド

は除外される]

またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

#### 【請求項 2】

$R_8$  が、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_2 \sim 6$  アルケニル、 $C_2 \sim 6$  アルキニル、ハロ $C_1 \sim 6$  アルキル、ヒドロキシ $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル $C_1 \sim 4$  アルキルおよび Ph $C_1 \sim 4$  アルキルから選択される、請求項 1 に記載の化合物。

#### 【請求項 3】

A が  $A_1$  である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

#### 【請求項 4】

$R_1$  および  $R_2$  が独立して、水素および  $C_1 \sim 4$  アルキルから選択される、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の化合物。

#### 【請求項 5】

$R_1$  および  $R_2$  が水素である、請求項 4 に記載の化合物。

#### 【請求項 6】

$R_1$  および  $R_2$  のうち一方が水素であり、他方が  $C_1 \sim 4$  アルキルである、請求項 4 に記載の化合物。

#### 【請求項 7】

$R_1$  および  $R_2$  が  $C_1 \sim 4$  アルキルである、請求項 4 に記載の化合物。

#### 【請求項 8】

$R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$  および  $R_7$  が独立して、水素、ハロゲン、 $-OH$ 、 $C_1 \sim 6$  ア

ルキルおよび  $C_1 \sim 4$  アルコキシから選択される、請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 9】

$R_5$  が、ハロゲン、 $-OH$ 、 $C_1 \sim 6$  アルキルおよび  $C_1 \sim 4$  アルコキシから選択され、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_6$  および  $R_7$  が独立して、水素およびハロゲンから選択される、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

$R_5$  が、ハロゲン、 $-OH$ 、 $C_1 \sim 6$  アルキルおよび  $C_1 \sim 4$  アルコキシから選択され、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_6$  および  $R_7$  が水素である、請求項 8 または 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

$R_8$  が、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_2 \sim 4$  アルキニル、ハロ  $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル  $C_1 \sim 4$  アルキルおよび Ph  $C_1 \sim 4$  アルキルから選択される、請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 12】

$R_8$  が、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_2 \sim 4$  アルキニル、ハロ  $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ  $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル  $C_1 \sim 4$  アルキル、Ph  $C_1 \sim 4$  アルキルおよび  $-C_1 \sim 4$  アルキル -  $CONR_{12}R_{13}$  から選択される、請求項 1 ~ 11 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 13】

$R_8$  が、 $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_2 \sim 4$  アルキニル、ハロ  $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル  $C_1 \sim 4$  アルキルおよび Ph  $C_1 \sim 4$  アルキルから選択される、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 14】

$R_9$ 、 $R_{10}$  および  $R_{11}$  が独立して、水素、 $C_1 \sim 4$  アルキルおよび  $C_1 \sim 4$  アルコキシから選択される、請求項 1 ~ 13 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 15】

$R_9$ 、 $R_{10}$  および  $R_{11}$  が独立して、水素および  $C_1 \sim 4$  アルコキシから選択される、請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 16】

$R_9$ 、 $R_{10}$  および  $R_{11}$  が水素である、請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 17】

1 - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸,  $N' - (4 - \text{フルオロフェニル}) - \text{ヒドラジド}$ ;

1 - エチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸,  $N' - (4 - \text{フルオロフェニル}) - \text{ヒドラジド}$ ;

1 - (2 - メトキシエチル) - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸,  $N' - (4 - \text{フルオロフェニル}) - \text{ヒドラジド}$ ;

1 - ジフルオロメチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸,  $N' - (4 - \text{フルオロフェニル}) - \text{ヒドラジド}$ ;

1 - ベンジル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸,  $N' - (4 - \text{フルオロフェニル}) - \text{ヒドラジド}$ ;

1 - シクロプロピルメチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸,  $N' - (4 - \text{フルオロフェニル}) - \text{ヒドラジド}$ ;

4 - メトキシ - 1 - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸,  $N' - (4 - \text{フルオロフェニル}) - \text{ヒドラジド}$ ;

1 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イル) - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸,  $N' - (4 - \text{フルオロフェニル}) - \text{ヒドラジド}$ ;

5 - エチル - 1 - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸,  $N' - (4 - \text{フルオロフェニル}) - \text{ヒドラジド}$ ;

6 - オキソ - 1 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) - 1, 6 - ジヒドロピリジン -

2 - カルボン酸，N' - (4 - フルオロフェニル) - ヒドラジド；

1 - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸，N' - (4 - メトキシフェニル) - ヒドラジド；

1 - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸，N' - (4 - クロロフェニル) - ヒドラジド；

1 - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸，N' - (4 - メチルフェニル) - ヒドラジド；

1 - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸，N' - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - ヒドラジド；

1 - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸，N' - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - ヒドラジド；

1 - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸，N' - (4 - フルオロフェニル) - N, N' - ジメチル - ヒドラジド；

1 - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸，N' - (4 - フルオロフェニル) - N' - メチル - ヒドラジド；

1 - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸，N' - (4 - フルオロフェニル) - N - メチル - ヒドラジド；

1 - (2 - (ジメチルアミノ) - 2 - オキソエチル) - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸，N' - (4 - フルオロフェニル) - ヒドラジド；

1 - (2 - アミノ - 2 - オキソエチル) - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸，N' - (4 - フルオロフェニル) - ヒドラジド；

1 - エチル - 2 - オキソ - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸，N' - (4 - フルオロフェニル) - ヒドラジド；

1 - メチル - 2 - オキソ - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸，N' - (4 - フルオロフェニル) - ヒドラジド；

1 - メチル - 2 - オキソ - 1, 2 - ジヒドロピリジン - 4 - カルボン酸，N' - (4 - フルオロフェニル) - ヒドラジド；および

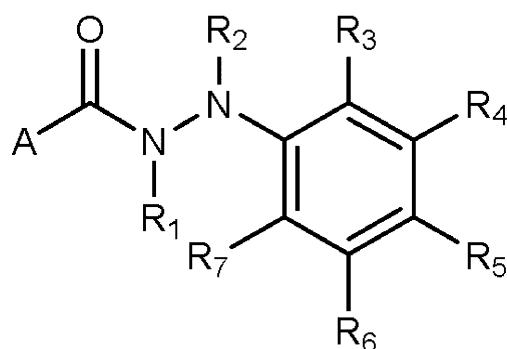
1 - メチル - 6 - オキソ - 1, 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボン酸 N' - (4 - フルオロフェニル) - ヒドラジド；

からなる群より選択される、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物。

【請求項 18】

式 (I) の化合物：

【化 6】



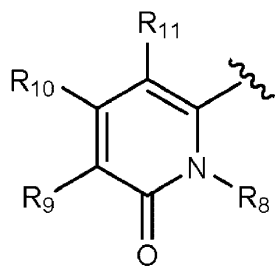
(I)

[ 式中、

A は、A<sub>1</sub>、A<sub>2</sub>、A<sub>3</sub> および A<sub>4</sub> から選択されるラジカルであり；

A<sub>1</sub> は

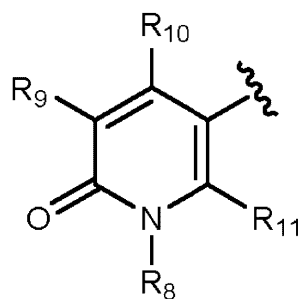
【化 7】



であり；

A<sub>2</sub> は

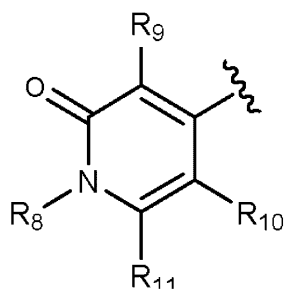
【化 8】



であり；

A<sub>3</sub> は

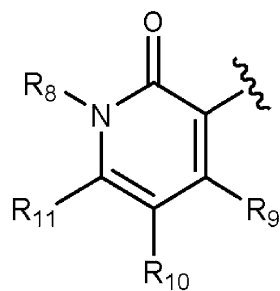
【化 9】



であり；

A<sub>4</sub> は

【化 10】



であり；

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は独立して、水素、C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、ハロ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルから選択され；

R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub> および R<sub>7</sub> は独立して、水素、-OH、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ 6 ア

ルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル、 $-NR_{12}R_{13}$ 、 $-N(R_{12})COR_{13}$ 、 $-N(R_{12})SO_2R_{13}$ 、ハロ $C_1 \sim 6$  アルキル、ヒドロキシ $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ $C_1 \sim 6$  アルキル、 $-COOR_{12}$ 、 $-CN$ 、 $-CONR_{12}R_{13}$ 、 $-SO_2-C_1 \sim 4$  アルキル、 $-SO_2-O-C_1 \sim 4$  アルキルおよび  $-SO_2-NR_{12}R_{13}$  から選択され；

$R_8$  は、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_2 \sim 6$  アルケニル、 $C_2 \sim 6$  アルキニル、ハロ $C_1 \sim 6$  アルキル、ヒドロキシ $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ $C_1 \sim 4$  アルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル $C_1 \sim 4$  アルキル、Ph $C_1 \sim 4$  アルキルおよび  $-C_1 \sim 4$  アルキル- $CONR_{12}R_{13}$  から選択され；

$R_9$ 、 $R_{10}$  および  $R_{11}$  は独立して、水素、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル $C_0 \sim 4$  アルキル、 $-NR_{12}R_{13}$ 、 $-N(R_{12})COR_{13}$ 、 $-N(R_{12})SO_2R_{13}$ 、ハロ $C_1 \sim 6$  アルキル、ヒドロキシ $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ $C_1 \sim 6$  アルキル、 $-COOR_{12}$ 、 $-CN$ 、 $-CONR_{12}R_{13}$ 、 $-SO_2-C_1 \sim 4$  アルキル、 $-SO_2-O-C_1 \sim 4$  アルキルおよび  $-SO_2-NR_{12}R_{13}$  から選択され；

$R_{12}$  および  $R_{13}$  はそれぞれ独立して、水素および  $C_1 \sim 4$  アルキルから選択される]

またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物を含む薬剤。

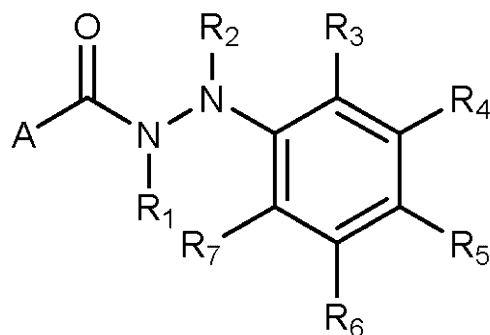
【請求項 19】

A、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$  および  $R_{13}$  が、請求項 2 ~ 16 のいずれか 1 項で定められるものであるか、前記式 (I) の化合物が、請求項 17 で定められるものである、請求項 18 に記載薬剤。

【請求項 20】

式 (I) の化合物：

【化 11】



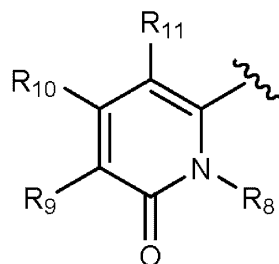
(I)

[ 式中、

A は、 $A_1$ 、 $A_2$ 、 $A_3$  および  $A_4$  から選択されるラジカルであり；

$A_1$  は

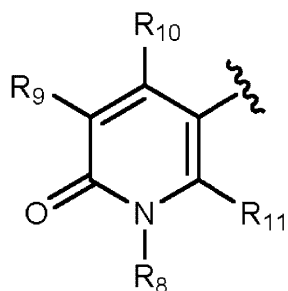
【化 12】



であり；

A<sub>2</sub> は

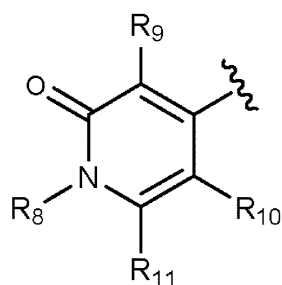
【化 1 3】



であり；

A<sub>3</sub> は

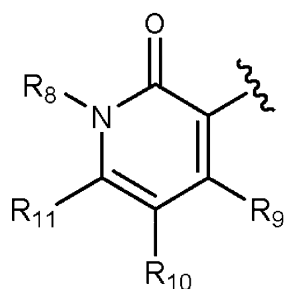
【化 1 4】



であり；

A<sub>4</sub> は

【化 1 5】



であり；

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は独立して、水素、C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、ハロ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルから選択され；

R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub> および R<sub>7</sub> は独立して、水素、-OH、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、C<sub>3</sub> ~ 6 シクロアルキル、-NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>、-N(R<sub>12</sub>)COR<sub>13</sub>、-N(R<sub>12</sub>)SO<sub>2</sub>R<sub>13</sub>、ハロ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、-COOR<sub>12</sub>、-CN、-CONR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、-SO<sub>2</sub>-O-C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび -SO<sub>2</sub>-NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub> から選択され；

R<sub>8</sub> は、C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、C<sub>2</sub> ~ 6 アルケニル、C<sub>2</sub> ~ 6 アルキニル、ハロ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、C<sub>3</sub> ~ 6 シクロアルキル C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、Ph C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび -C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル - CONR<sub>12</sub>R<sub>13</sub> から選択され；



$R_9$ 、 $R_{10}$  および  $R_{11}$  は独立して、水素、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル、 $C_0 \sim 4$  アルキル、 $-NR_{12}R_{13}$ 、 $-N(R_{12})COR_{13}$ 、 $-N(R_{12})SO_2R_{13}$ 、ハロ $C_1 \sim 6$  アルキル、ヒドロキシ $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ、 $C_1 \sim 4$  アルコキシ $C_1 \sim 6$  アルキル、 $-COOR_{12}$ 、 $-CN$ 、 $-CONR_{12}R_{13}$ 、 $-SO_2-C_1 \sim 4$  アルキル、 $-SO_2-O-C_1 \sim 4$  アルキルおよび  $-SO_2-NR_{12}R_{13}$  から選択され；

$R_{12}$  および  $R_{13}$  はそれぞれ独立して、水素および  $C_1 \sim 4$  アルキルから選択される]

またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物を含む抗菌剤。

【請求項 21】

A. バウマニ (A. baumannii) 感染症を治療または予防するための請求項 20 に記載の抗菌剤。

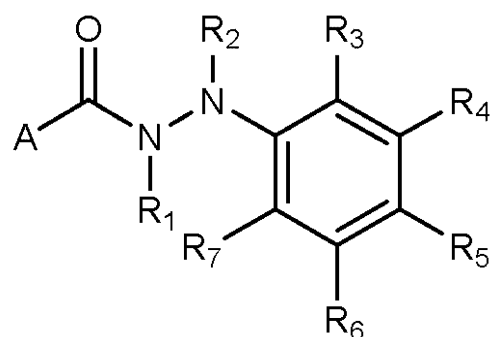
【請求項 22】

A、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$  および  $R_{13}$  が、請求項 2 ~ 16 のいずれか 1 項で定められるものであるか、前記式 (I) の化合物が、請求項 17 で定められるものである、請求項 20 又は 21 に記載の使用化合物。

【請求項 23】

式 (I) の化合物：

【化 16】



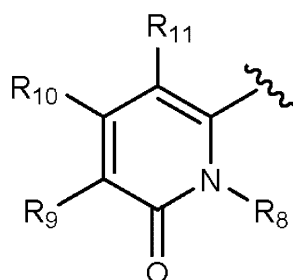
(I)

[ 式中、

A は、 $A_1$ 、 $A_2$ 、 $A_3$  および  $A_4$  から選択されるラジカルであり；

$A_1$  は

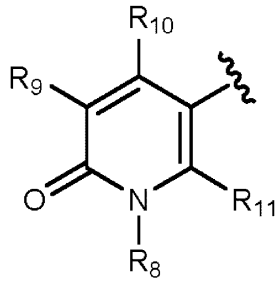
【化 17】



であり；

$A_2$  は

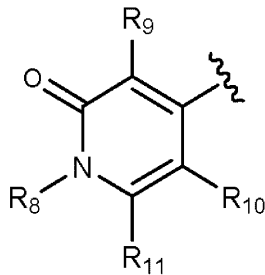
## 【化 18】



であり；

A<sub>3</sub> は

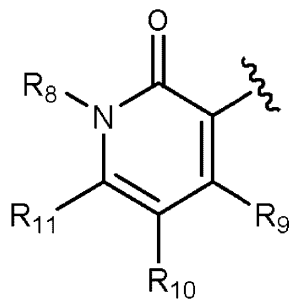
## 【化 19】



であり；

A<sub>4</sub> は

## 【化 20】



であり；

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は独立して、水素、C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、ハロ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルから選択され；

R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub> および R<sub>7</sub> は独立して、水素、-OH、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、C<sub>3</sub> ~ 6 シクロアルキル、-NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>、-N(R<sub>12</sub>)COR<sub>13</sub>、-N(R<sub>12</sub>)SO<sub>2</sub>R<sub>13</sub>、ハロ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、-COOR<sub>12</sub>、-CN、-CONR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、-SO<sub>2</sub>-O-C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび -SO<sub>2</sub>-NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub> から選択され；

R<sub>8</sub> は、C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、C<sub>2</sub> ~ 6 アルケニル、C<sub>2</sub> ~ 6 アルキニル、ハロ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、C<sub>3</sub> ~ 6 シクロアルキル C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、Ph C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび -C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル - CONR<sub>12</sub>R<sub>13</sub> から選択され；

R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub> および R<sub>11</sub> は独立して、水素、C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、C<sub>3</sub> ~ 6 シクロアルキル C<sub>0</sub> ~ 4 アルキル、-NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>、-N(R<sub>12</sub>)COR<sub>13</sub>、-N(R<sub>12</sub>)SO<sub>2</sub>R<sub>13</sub>、ハロ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ

シ、 $C_{1 \sim 4}$  アルコキシ  $C_{1 \sim 6}$  アルキル、 $-COOR_{12}$ 、 $-CN$ 、 $-CONR_{12}R_{13}$ 、 $-SO_2-C_{1 \sim 4}$  アルキル、 $-SO_2-O-C_{1 \sim 4}$  アルキルおよび  $-SO_2-NR_{12}R_{13}$  から選択され；

$R_{12}$  および  $R_{13}$  はそれぞれ独立して、水素および  $C_{1 \sim 4}$  アルキルから選択される]

またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物の薬剤製造のための使用。

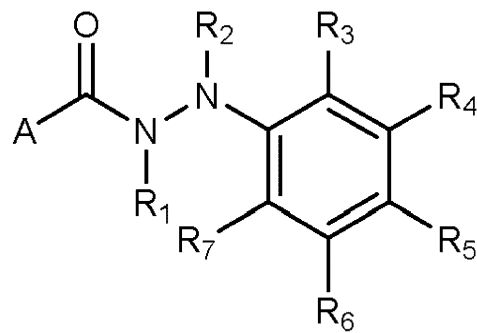
【請求項 24】

$A$ 、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$  および  $R_{13}$  が、請求項 2 ~ 16 のいずれか 1 項で定められるものであるか、前記式 (I) の化合物が、請求項 17 で定められるものである、請求項 23 に記載の化合物の使用。

【請求項 25】

式 (I) の化合物：

【化 21】



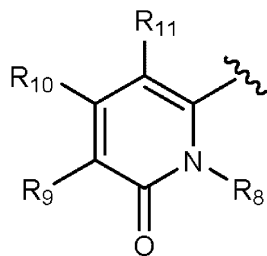
(I)

[ 式中、

$A$  は、 $A_1$ 、 $A_2$ 、 $A_3$  および  $A_4$  から選択されるラジカルであり；

$A_1$  は

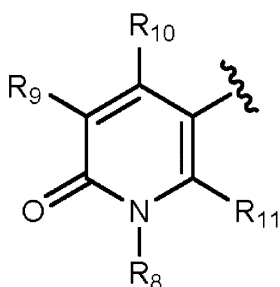
【化 22】



であり；

$A_2$  は

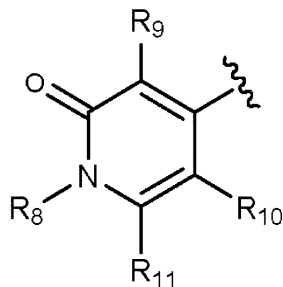
【化 23】



であり；

A<sub>3</sub> は

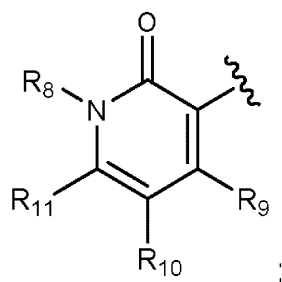
【化 2 4】



であり；

A<sub>4</sub> は

【化 2 5】



であり；

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は独立して、水素、C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、ハロ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルから選択され；

R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub> および R<sub>7</sub> は独立して、水素、-OH、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、C<sub>3</sub> ~ 6 シクロアルキル、-NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>、-N(R<sub>12</sub>)COR<sub>13</sub>、-N(R<sub>12</sub>)SO<sub>2</sub>R<sub>13</sub>、ハロ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、-COOR<sub>12</sub>、-CN、-CONR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、-SO<sub>2</sub>-O-C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび -SO<sub>2</sub>-NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub> から選択され；

R<sub>8</sub> は、C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、C<sub>2</sub> ~ 6 アルケニル、C<sub>2</sub> ~ 6 アルキニル、ハロ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、C<sub>3</sub> ~ 6 シクロアルキル C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、Ph C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび -C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル - CONR<sub>12</sub>R<sub>13</sub> から選択され；

R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub> および R<sub>11</sub> は独立して、水素、C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、C<sub>3</sub> ~ 6 シクロアルキル C<sub>0</sub> ~ 4 アルキル、-NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>、-N(R<sub>12</sub>)COR<sub>13</sub>、-N(R<sub>12</sub>)SO<sub>2</sub>R<sub>13</sub>、ハロ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、-COOR<sub>12</sub>、-CN、-CONR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、-SO<sub>2</sub>-O-C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび -SO<sub>2</sub>-NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub> から選択され；

R<sub>12</sub> および R<sub>13</sub> はそれぞれ独立して、水素および C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルから選択される

]

またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物の抗菌剤製造のための使用。

【請求項 2 6】

前記抗菌剤が A . バウマニ ( A . baumannii ) 感染症を治療または予防するためのものである、請求項 2 5 に記載の化合物の使用。

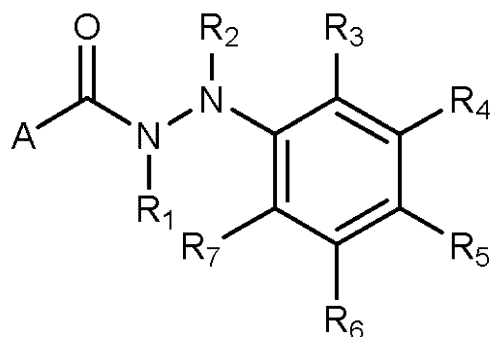
## 【請求項 27】

A、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$  および  $R_{13}$  が、請求項 2～16 のいずれか 1 項で定められるものであるか、前記式 (I) の化合物が、請求項 17 で定められるものである、請求項 23 に記載の化合物の使用。

## 【請求項 28】

式 (I) の化合物：

## 【化 26】



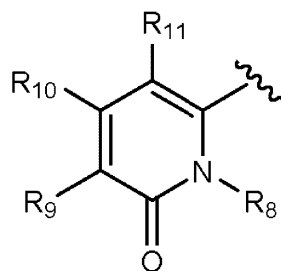
(I)

[ 式中、

A は、 $A_1$ 、 $A_2$ 、 $A_3$  および  $A_4$  から選択されるラジカルであり；

$A_1$  は

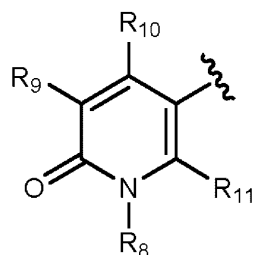
## 【化 27】



であり；

$A_2$  は

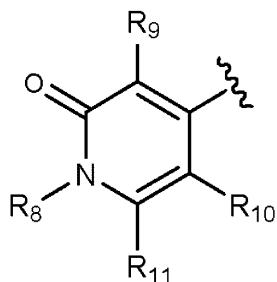
## 【化 28】



であり；

$A_3$  は

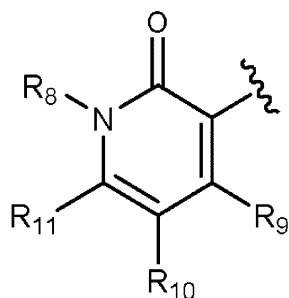
## 【化 2 9】



であり；

A<sub>4</sub> は

## 【化 3 0】



であり；

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は独立して、水素、C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、ハロ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルから選択され；

R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub> および R<sub>7</sub> は独立して、水素、-OH、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、C<sub>3</sub> ~ 6 シクロアルキル、-NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>、-N(R<sub>12</sub>)COR<sub>13</sub>、-N(R<sub>12</sub>)SO<sub>2</sub>R<sub>13</sub>、ハロ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、-COOR<sub>12</sub>、-CN、-CONR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、-SO<sub>2</sub>-O-C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび -SO<sub>2</sub>-NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub> から選択され；

R<sub>8</sub> は、C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、C<sub>2</sub> ~ 6 アルケニル、C<sub>2</sub> ~ 6 アルキニル、ハロ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、C<sub>3</sub> ~ 6 シクロアルキル C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、Ph C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび -C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル - CONR<sub>12</sub>R<sub>13</sub> から選択され；

R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub> および R<sub>11</sub> は独立して、水素、C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、C<sub>3</sub> ~ 6 シクロアルキル C<sub>0</sub> ~ 4 アルキル、-NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>、-N(R<sub>12</sub>)COR<sub>13</sub>、-N(R<sub>12</sub>)SO<sub>2</sub>R<sub>13</sub>、ハロ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 4 アルコキシ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、-COOR<sub>12</sub>、-CN、-CONR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>、-SO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub> ~ 4 アルキル、-SO<sub>2</sub>-O-C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルおよび -SO<sub>2</sub>-NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub> から選択され；

R<sub>12</sub> および R<sub>13</sub> はそれぞれ独立して、水素および C<sub>1</sub> ~ 4 アルキルから選択される

]

あるいはその薬学的に許容される塩または溶媒和物と、少なくとも 1 つの薬学的に許容される添加剤および / または担体とを含む、医薬組成物。

## 【請求項 2 9】

細菌感染症を治療または予防するための、請求項 2 8 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 0】

前記細菌感染症が A . パウマニ ( A . b a u m a n n i i ) 感染症である、請求項 2 9

に記載の医薬組成物。

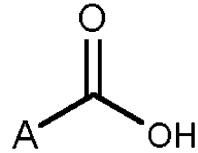
【請求項 3 1】

A、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$  および  $R_{13}$  が、請求項 2 ～ 16 のいずれか 1 項で定められるものであるか、前記式 (I) の化合物が、請求項 17 で定められるものである、請求項 28 ～ 30 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 3 2】

請求項 1 ～ 16 のいずれかに記載の化合物を調製する方法であって、式 (II) の化合物

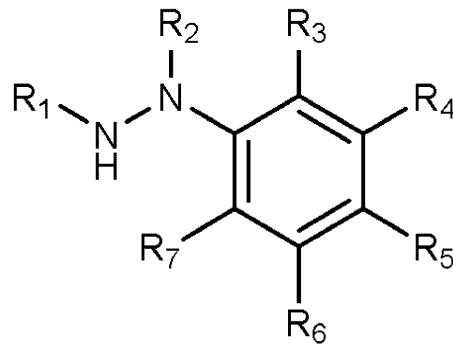
【化 3 1】



(II)

と、式 (III) の化合物

【化 3 2】



(III)

またはその薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物とを反応させることを含み、

A および  $R_1 \sim R_{13}$  が、請求項 1 ～ 16 のいずれかに記載されるものと同じ意味を有する、上記方法。