

【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 07 D 213/86 (2006.01)

A 61 K 31/4412 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

【F I】

C 07 D 213/86 C S P

A 61 K 31/4412

A 61 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

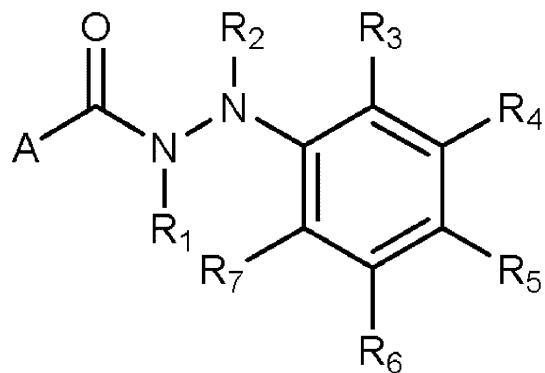
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物：

【化1】



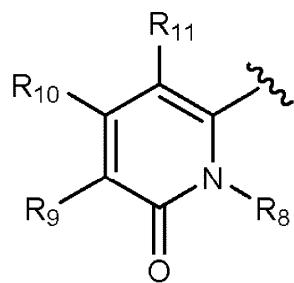
(I)

〔式中、

Aは、A₁、A₂、A₃およびA₄から選択されるラジカルであり；

A₁は

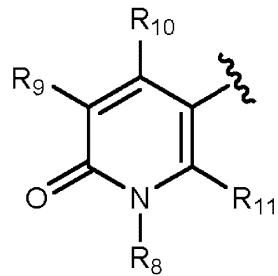
【化2】



であり；

A₂は

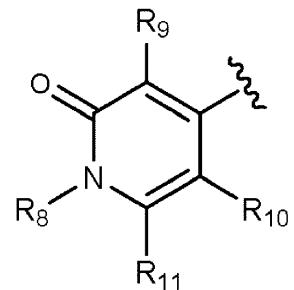
【化3】



であり；

A₃は

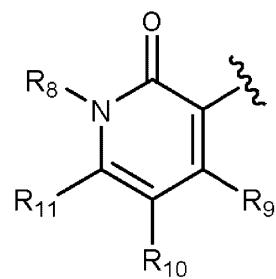
【化4】



であり；

A₄は

【化5】



であり；

R₁およびR₂は独立して、水素、C_{1～4}アルキル、ハロC_{1～4}アルキル、ヒドロキシC_{1～4}アルキルおよびC_{1～4}アルコキシC_{1～4}アルキルから選択され；

R₃、R₄、R₅、R₆およびR₇は独立して、水素、-OH、ハロゲン、C_{1～6}ア

ルキル、 $C_{3\sim 6}$ シクロアルキル、 $-NR_{1\sim 2}R_{1\sim 3}$ 、 $-N(R_{1\sim 2})COR_{1\sim 3}$ 、 $-N(R_{1\sim 2})SO_2R_{1\sim 3}$ 、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、 $-COOR_{1\sim 2}$ 、 $-CN$ 、 $-CO$
 $NR_{1\sim 2}R_{1\sim 3}$ 、 $-SO_2-C_{1\sim 4}$ アルキル、 $-SO_2-O-C_{1\sim 4}$ アルキルおよび
 $-SO_2-NR_{1\sim 2}R_{1\sim 3}$ 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、 $PhC_{1\sim 4}$ アルキルおよび
 $-C_{1\sim 4}$ アルキル $-CONR_{1\sim 2}R_{1\sim 3}$ 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、 $-NR_{1\sim 2}R_{1\sim 3}$ 、 $-N(R_{1\sim 2})COR_{1\sim 3}$ 、 $-N(R_{1\sim 2})SO_2R_{1\sim 3}$ 、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、 $-COOR_{1\sim 2}$ 、 $-CN$ 、 $-CONR_{1\sim 2}R_{1\sim 3}$ 、 $-SO_2-C_{1\sim 4}$ アルキル、 $-SO_2-O-C_{1\sim 4}$ アルキルおよび $-SO_2-NR_{1\sim 2}R_{1\sim 3}$ 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 $PhC_{1\sim 4}$ 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C₁～₄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】

R₅が、ハロゲン、-OH、C₁～₆アルキルおよびC₁～₄アルコキシから選択され、R₃、R₄、R₆およびR₇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】

R₅が、ハロゲン、-OH、C₁～₆アルキルおよびC₁～₄アルコキシから選択され、R₃、R₄、R₆およびR₇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】

R₈が、C₁～₄アルキル、C₂～₄アルキニル、ハロC₁～₄アルキル、C₃～₆シクロアルキルC₁～₄アルキルおよびPhC₁～₄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】

R₈が、C₁～₄アルキル、C₂～₄アルキニル、ハロC₁～₄アルキル、C₁～₄アルコキシC₁～₄アルキル、C₃～₆シクロアルキルC₁～₄アルキル、PhC₁～₄アルキルおよび-C₁～₄アルキル-C(=O)NR₁～₂R₁～₃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】

R₈が、C₁～₄アルキル、C₂～₄アルキニル、ハロC₁～₄アルキル、C₃～₆シクロアルキルC₁～₄アルキルおよびPhC₁～₄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】

R₉、R₁₀およびR₁₁が独立して、水素、C₁～₄アルキルおよびC₁～₄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】

R₉、R₁₀およびR₁₁が独立して、水素およびC₁～₄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】

R₉、R₁₀およびR₁₁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-フルオロフェニル)-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-フルオロフェニル)-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-フルオロフェニル)-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-フルオロフェニル)-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-フルオロフェニル)-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-フルオロフェニル)-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-フルオロフェニル)-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-フルオロフェニル)-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-フルオロフェニル)-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-

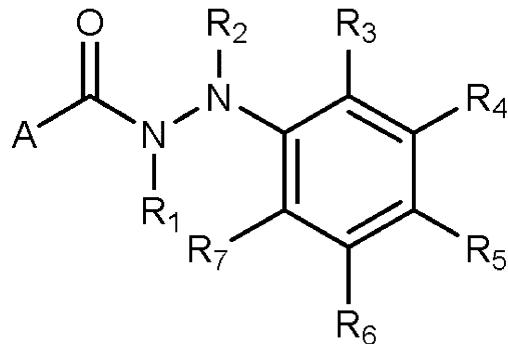
2 - カルボン酸 , N' - (4 - フルオロフェニル) - ヒドラジド ;
 1 - メチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸 , N' - (4 - メトキシフェニル) - ヒドラジド ;
 1 - メチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸 , N' - (4 - クロロフェニル) - ヒドラジド ;
 1 - メチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリジン - 2 - カルボン酸 , N' - (4 - メチルフェニル) - ヒドラジド ;
 1 - メチル - 6 -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

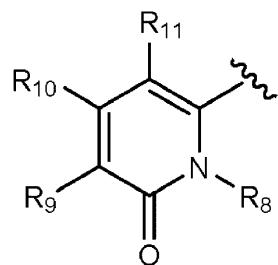


(I)

[式中、

A は、 A₁ 、 A₂ 、 A₃ および A₄ から選択されるラジカルであり ;
 A₁ は

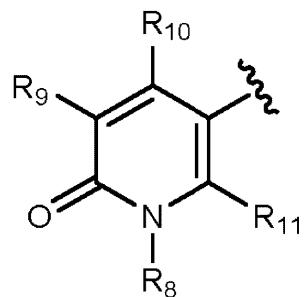
【化7】



であり；

A₂は

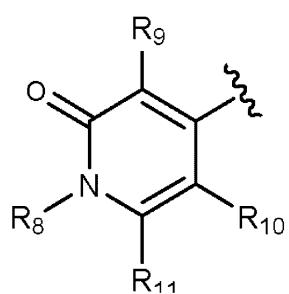
【化8】



であり；

A₃は

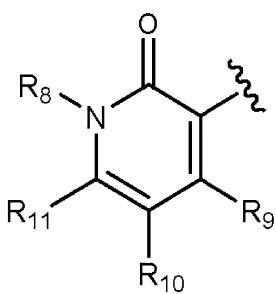
【化9】



であり；

A₄は

【化10】



であり；

R₁およびR₂は独立して、水素、C_{1～4}アルキル、ハロC_{1～4}アルキル、ヒドロキシC_{1～4}アルキルおよびC_{1～4}アルコキシC_{1～4}アルキルから選択され；

R₃、R₄、R₅、R₆およびR₇は独立して、水素、-OH、ハロゲン、C_{1～6}ア

ルキル、 $C_{3\sim 6}$ シクロアルキル、 $-NR_{1\sim 2}R_{1\sim 3}$ 、 $-N(R_{1\sim 2})COR_{1\sim 3}$ 、 $-N(R_{1\sim 2})SO_2R_{1\sim 3}$ 、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、 $-COOR_{1\sim 2}$ 、 $-CN$ 、 $-CO$
 $NR_{1\sim 2}R_{1\sim 3}$ 、 $-SO_2-C_{1\sim 4}$ アルキル、 $-SO_2-O-C_{1\sim 4}$ アルキルおよび
 $-SO_2-NR_{1\sim 2}R_{1\sim 3}$ 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、 $PhC_{1\sim 4}$ アルキルおよび
 $-C_{1\sim 4}$ アルキル $-CONR_{1\sim 2}R_{1\sim 3}$ 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、 $-NR_{1\sim 2}R_{1\sim 3}$ 、 $-N(R_{1\sim 2})COR_{1\sim 3}$ 、 $-N(R_{1\sim 2})SO_2R_{1\sim 3}$ 、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、 $-COOR_{1\sim 2}$ 、 $-CN$ 、 $-CONR_{1\sim 2}R_{1\sim 3}$ 、 $-SO_2-C_{1\sim 4}$ アルキル、 $-SO_2-O-C_{1\sim 4}$ アルキルおよび $-SO_2-NR_{1\sim 2}R_{1\sim 3}$ 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。

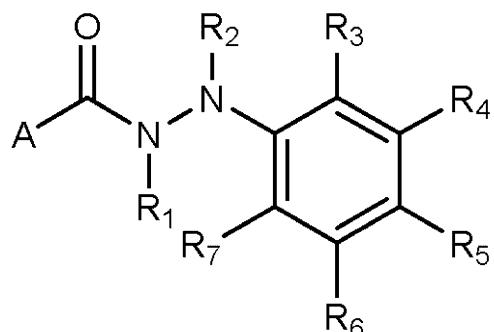
【請求項 19】

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】



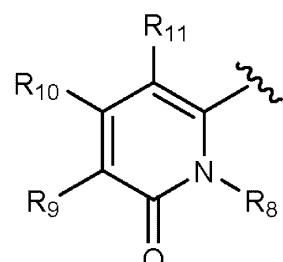
(I)

〔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

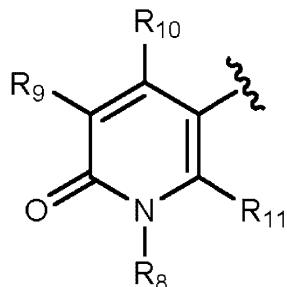
【化 12】



であり；

A_2 は

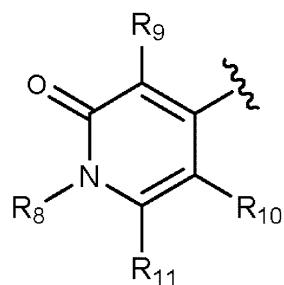
【化13】



であり；

A_3 は

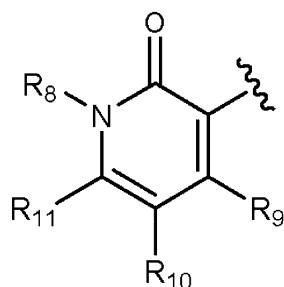
【化14】



であり；

A_4 は

【化15】



であり；

R_1 および R_2 は独立して、水素、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、ハロ $C_{1\sim 4}$ アルキル、ヒドロキシ $C_{1\sim 4}$ アルキルおよび $C_{1\sim 4}$ アルコキシ $C_{1\sim 4}$ アルキルから選択され；

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 および R_7 は独立して、水素、-OH、ハロゲン、 $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{3\sim 6}$ シクロアルキル、-NR_{1~2}R_{1~3}、-N(R_{1~2})COR_{1~3}、-N(R_{1~2})SO₂R_{1~3}、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_{1~2}、-CN、-CO NR_{1~2}R_{1~3}、-SO₂-C_{1~4} アルキル、-SO₂-O-C_{1~4} アルキルおよび-SO₂-NR_{1~2}R_{1~3} 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_{1~4} アルキル-CO NR_{1~2}R_{1~3} 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、-NR₁₂R₁₃、-N(R₁₂)COR₁₃、-N(R₁₂)SO₂R₁₃、ハロC_{1~6}アルキル、ヒドロキシC_{1~6}アルキル、C_{1~4}アルコキシ、C_{1~4}アルコキシC_{1~6}アルキル、-COOR₁₂、-CN、-CONR₁₂R₁₃、-SO₂-C_{1~4}アルキル、-SO₂-O-C_{1~4}アルキルおよび-SO₂-NR₁₂R₁₃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_{1~4}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。

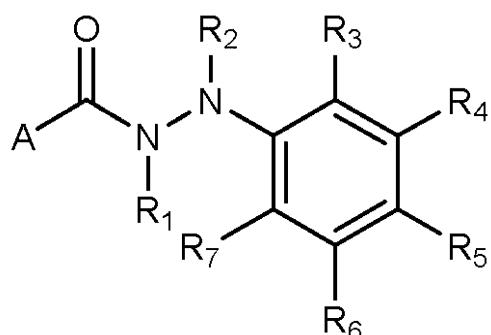
【請求項22】

A、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 、 R_1 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に記載の使用する化合物。

【請求項23】

式(I)の化合物：

【化16】



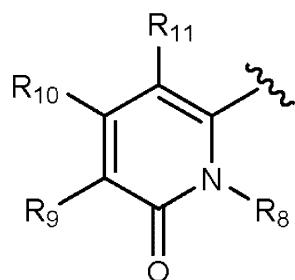
(I)

【式中、

Aは、A₁、A₂、A₃およびA₄から選択されるラジカルであり；

A₁は

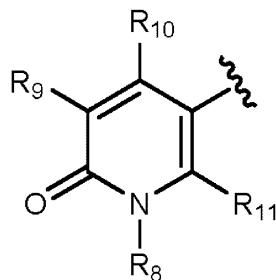
【化17】



であり；

A₂は

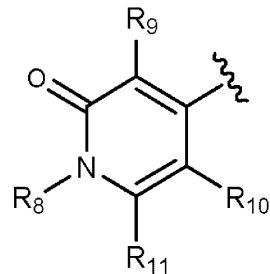
【化18】



であり；

A₃は

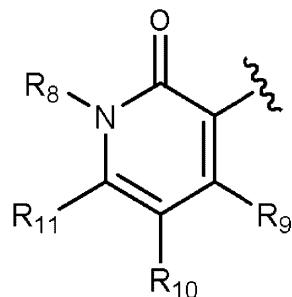
【化19】



であり；

A₄は

【化20】



であり；

R₁およびR₂は独立して、水素、C_{1～4}アルキル、ハロC_{1～4}アルキル、ヒドロキシC_{1～4}アルキルおよびC_{1～4}アルコキシC_{1～4}アルキルから選択され；

R₃、R₄、R₅、R₆およびR₇は独立して、水素、-OH、ハロゲン、C_{1～6}アルキル、C_{3～6}シクロアルキル、-NR₁₂R₁₃、-N(R₁₂)COR₁₃、-N(R₁₂)SO₂R₁₃、ハロC_{1～6}アルキル、ヒドロキシC_{1～6}アルキル、C_{1～4}アルコキシ、C_{1～4}アルコキシC_{1～6}アルキル、-COOR₁₂、-CN、-CO NR₁₂R₁₃、-SO₂-C_{1～4}アルキル、-SO₂-O-C_{1～4}アルキルおよび-SO₂-NR₁₂R₁₃から選択され；

R₈は、C_{1～6}アルキル、C_{2～6}アルケニル、C_{2～6}アルキニル、ハロC_{1～6}アルキル、ヒドロキシC_{1～4}アルキル、C_{1～4}アルコキシ、C_{1～4}アルコキシC_{1～4}アルキル、C_{3～6}シクロアルキルC_{1～4}アルキル、PhC_{1～4}アルキルおよび-C_{1～4}アルキル-CO NR₁₂R₁₃から選択され；

R₉、R₁₀およびR₁₁は独立して、水素、C_{1～6}アルキル、C_{3～6}シクロアルキルC_{0～4}アルキル、-NR₁₂R₁₃、-N(R₁₂)COR₁₃、-N(R₁₂)SO₂R₁₃、ハロC_{1～6}アルキル、ヒドロキシC_{1～6}アルキル、C_{1～4}アルコキ

シ、C₁～₄アルコキシC₁～₆アルキル、-COOR₁₂、-CN、-CONR₁₂R₁₃、-SO₂-C₁～₄アルキル、-SO₂-O-C₁～₄アルキルおよび-SO₂-NR₁₂R₁₃から選択され；

R₁₂およびR₁₃はそれぞれ独立して、水素およびC₁～₄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。

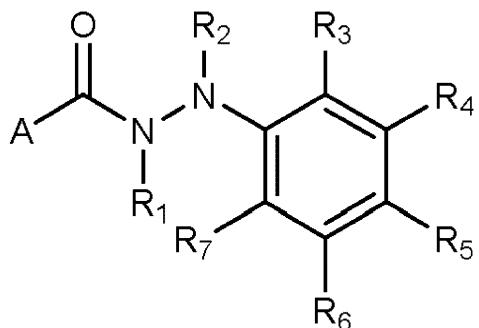
【請求項24】

A、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆、R₇、R₈、R₉、R₁₀、R₁₁、R₁₂およびR₁₃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】



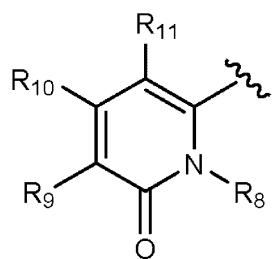
(I)

【式中、

Aは、A₁、A₂、A₃およびA₄から選択されるラジカルであり；

A₁は

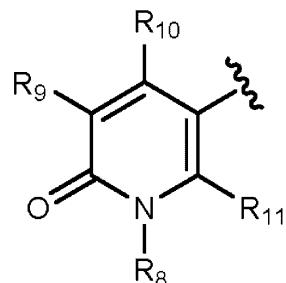
【化22】



であり；

A₂は

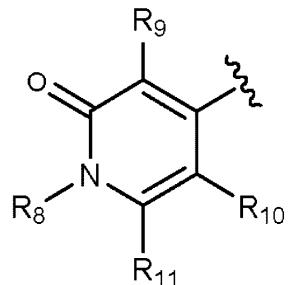
【化23】



であり；

A_3 は

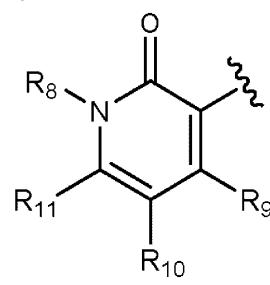
【化 2 4】



であり；

A_4 は

【化 2 5】



であり；

R_1 および R_2 は独立して、水素、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、ハロ $C_{1 \sim 4}$ アルキル、ヒドロキシ $C_{1 \sim 4}$ アルキルおよび $C_{1 \sim 4}$ アルコキシ $C_{1 \sim 4}$ アルキルから選択され；

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 および R_7 は独立して、水素、-OH、ハロゲン、 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{3 \sim 6}$ シクロアルキル、-NR_{1 2}R_{1 3}、-N(R_{1 2})COR_{1 3}、-N(R_{1 2})SO₂R_{1 3}、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_{1 2}、-CN、-CO NR_{1 2}R_{1 3}、-SO₂-C_{1 ~ 4} アルキル、-SO₂-O-C_{1 ~ 4} アルキルおよび-SO₂-NR_{1 2}R_{1 3} 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 ~ 4} アルキル-CO NR_{1 2}R_{1 3} 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_{1 2}R_{1 3}、-N(R_{1 2})COR_{1 3}、-N(R_{1 2})SO₂R_{1 3}、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_{1 2}、-CN、-CONR_{1 2}R_{1 3}、-SO₂-C_{1 ~ 4} アルキル、-SO₂-O-C_{1 ~ 4} アルキルおよび-SO₂-NR_{1 2}R_{1 3} 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。

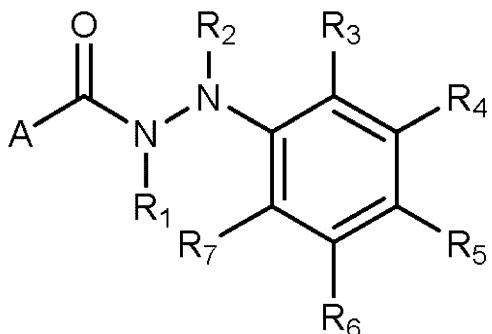
【請求項 27】

A、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆、R₇、R₈、R₉、R₁₀、R₁₁、R₁₂およびR₁₃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】



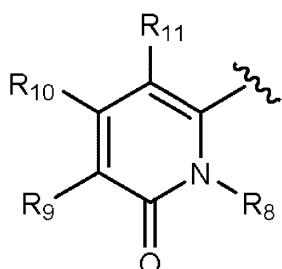
(I)

[式中、

Aは、A₁、A₂、A₃およびA₄から選択されるラジカルであり；

A₁は

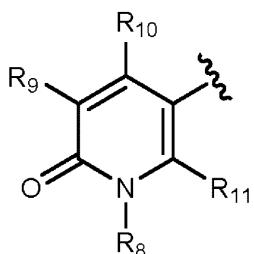
【化27】



であり；

A₂は

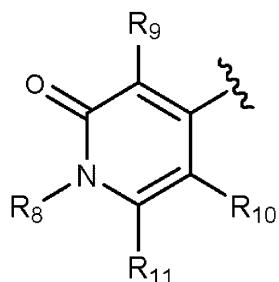
【化28】



であり；

A₃は

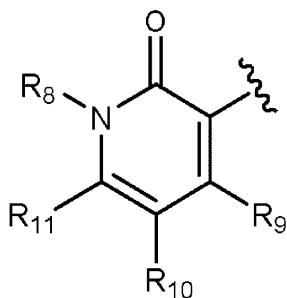
【化29】



であり；

A₄は

【化30】



であり；

R₁およびR₂は独立して、水素、C_{1～4}アルキル、ハロC_{1～4}アルキル、ヒドロキシC_{1～4}アルキルおよびC_{1～4}アルコキシC_{1～4}アルキルから選択され；

R₃、R₄、R₅、R₆およびR₇は独立して、水素、-OH、ハロゲン、C_{1～6}アルキル、C_{3～6}シクロアルキル、-NR₁₂R₁₃、-N(R₁₂)COR₁₃、-N(R₁₂)SO₂R₁₃、ハロC_{1～6}アルキル、ヒドロキシC_{1～6}アルキル、C_{1～4}アルコキシ、C_{1～4}アルコキシC_{1～6}アルキル、-COOR₁₂、-CN、-CO NR₁₂R₁₃、-SO₂-C_{1～4}アルキル、-SO₂-O-C_{1～4}アルキルおよび-SO₂-NR₁₂R₁₃から選択され；

R₈は、C_{1～6}アルキル、C_{2～6}アルケニル、C_{2～6}アルキニル、ハロC_{1～6}アルキル、ヒドロキシC_{1～4}アルキル、C_{1～4}アルコキシ、C_{1～4}アルコキシC_{1～4}アルキル、C_{3～6}シクロアルキルC_{1～4}アルキル、PhC_{1～4}アルキルおよび-C_{1～4}アルキル-CO NR₁₂R₁₃から選択され；

R₉、R₁₀およびR₁₁は独立して、水素、C_{1～6}アルキル、C_{3～6}シクロアルキルC_{0～4}アルキル、-NR₁₂R₁₃、-N(R₁₂)COR₁₃、-N(R₁₂)SO₂R₁₃、ハロC_{1～6}アルキル、ヒドロキシC_{1～6}アルキル、C_{1～4}アルコキシ、C_{1～4}アルコキシC_{1～6}アルキル、-COOR₁₂、-CN、-CONR₁₂R₁₃、-SO₂-C_{1～4}アルキル、-SO₂-O-C_{1～4}アルキルおよび-SO₂-NR₁₂R₁₃から選択され；

R₁₂およびR₁₃はそれぞれ独立して、水素およびC_{1～4}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29】

細菌感染症を治療または予防するための、請求項28に記載の医薬組成物。

【請求項30】

前記細菌感染症がA.バウマニ(A. baumannii)感染症である、請求項29

に記載の医薬組成物。

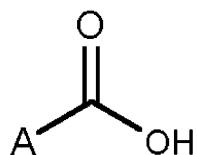
【請求項 3 1】

A、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆、R₇、R₈、R₉、R₁₀、R₁₁、R₁₂およびR₁₃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

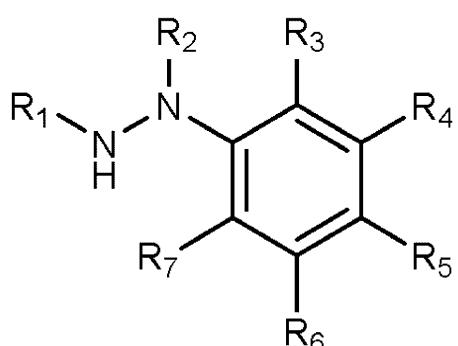
【化3 1】



(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R₁～R₁₃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。