

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成29年3月2日 (2017.3.2)

【公表番号】特表2016-508487(P2016-508487A)

【公表日】平成28年3月22日 (2016.3.22)

【年通号数】公開・登録公報2016-017

【出願番号】特願2015-555384(P2015-555384)

【国際特許分類】

C 0 7 D 215/14 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 5/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 5/38 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)

A 6 1 P 17/10 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 31/10 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4375 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

C 0 7 D 215/52 (2006.01)

A 6 1 K 31/47 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

A 0 1 N 43/90 (2006.01)

A 0 1 P 3/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 215/14

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 5/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 31/00

A 6 1 P 3/00
A 6 1 P 27/02
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 15/00
A 6 1 P 1/00
A 6 1 P 5/38
A 6 1 P 13/08
A 6 1 P 17/14
A 6 1 P 17/10
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 17/06
A 6 1 P 31/10
A 6 1 P 31/04
A 6 1 P 17/00
C 0 7 D 471/04 1 1 2 Z
A 6 1 K 31/4375
C 0 7 D 401/04
A 6 1 K 31/4709
C 0 7 D 215/52
A 6 1 K 31/47
A 6 1 K 31/5377
C 0 7 D 519/00 3 1 1
A 0 1 N 43/90 1 0 3
A 0 1 P 3/00

【手続補正書】

【提出日】平成29年1月20日(2017.1.20)

【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

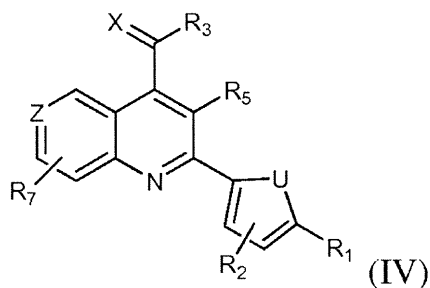
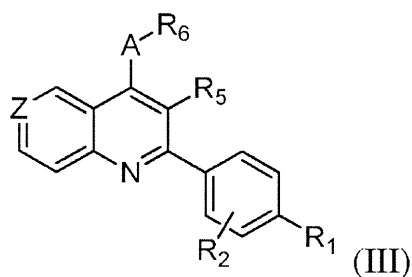
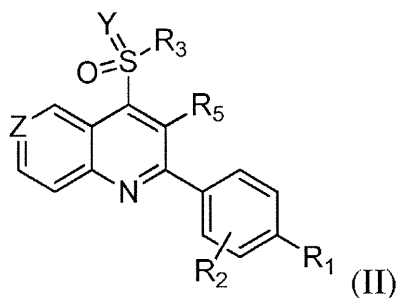
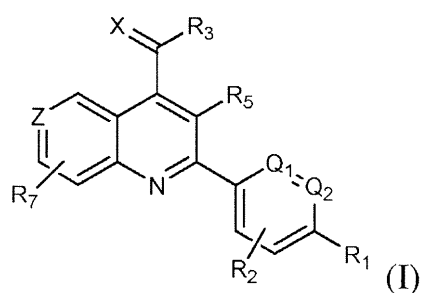
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(Ⅰ)、(Ⅱ)、(Ⅲ)、(Ⅳ)

【化 1】



であって、

式中、

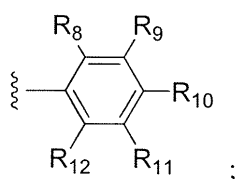
U が O もしくは S であり、

各 X が独立して O ; S ; N R₄ ; もしくは H および R₄ であり、

各 R₁ が独立して、

a)

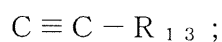
【化 2】



b) アルコキシと任意に置換されるヘテロアリールであって、アルコキシが 1、2、もしくは 3 つの O R₄ と任意に置換されるヘテロアリール ;

c)

【化 3】



d) C (= O) N R₄ R₇ ;

e) N (R₇) C (= O) R₄ ;

f) S O₂ N R₄ R₇ ;

g) N (R₇) S O₂ R₄ ;

h) 水素 ;

i) ヒドロキシ ;

j) 任意に置換されるアルコキシ ;

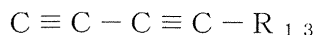
k) S O₂ N H R₄ ;

l) 任意に置換されるアルケニル ;

m) 任意に置換されるアリールアルキル ; もしくは

n)

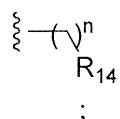
【化 4】



から選択され、

各 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 、および R_{12} が独立して、

- a) H ;
 - b) ヒドロキシアシルアミノ ;
 - c) 1、2、もしくは3つの独立したヘテロシクロアルコキシ、ヘテロシクロアルキルカルボニル、ヒドロキシ、アミノ、 $NHSO_2R_4$ 、 $NHC(=O)R_4$ 、 $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NHNHR_4$ 、もしくは $C(=O)NR_4OH$ と任意に置換されるアルコキシ ;
 - d) ハロゲン ;
 - e) SO_2NHR_{18} ;
 - f) $NHSO_2R_4$;
 - g) $NHC(=O)R_4$;
 - h) $C(=O)NHR_4$;
 - i) 1、2、もしくは3つの独立した $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、もしくは $SO_2NR_4R_7$ と任意に置換される5～6員環の原子を含むヘテロシクロアルキル ;
 - j) 1、2、もしくは3つの独立した
 - (1) $C(=O)OR_{17}$;
 - (2) 1、2、もしくは3つの独立した $C(=O)OR_{17}$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、もしくは $SO_2NR_4R_7$ と任意に置換されるヘテロシクロアルキルカルボニル ;
 - (3) 1、2、もしくは3つの独立した $OC(=O)NHR_4$ 、 $NHC(=O)NHR_4$ 、 $NHSO_2R_4$ 、ヒドロキシ、もしくは $C(=O)NHR_4$ と任意に置換されるアルキル ; もしくは
 - (4) $C(=O)NHR_4$;
 と任意に置換される5～6員環の原子を含むヘテロアリール ;
 - k) シアノ ;
 - l) ヒドロキシ ;
 - m) SO_2R_4 ;
 - n) 1、2、もしくは3つの独立した $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、もしくは $SO_2NR_4R_7$ と任意に置換されるヘテロシクロアルキルカルボニル ;
 - o) 1、2、もしくは3つの独立した $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、もしくは $SO_2NR_4R_7$ と任意に置換されるヘテロシクロアルキルスルホニル ;
 - p)
- 【化 5】



- q) メルカプト ;
- r) チオアルコキシ ;
- s) アルキルアミノ ;
- t) 1、2、もしくは3つの独立したヘテロシクロアルキルカルボニル、ヘテロシクロアルキル、もしくはヘテロシクロアルキルスルホニルと任意に置換されるアルキルであって、それぞれが独立した $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、もしくは $SO_2NR_4R_7$ と任意に置換されるアルキル ;
- u) ジアルキルアミノ ; もしくは

v) 1、2、もしくは3つの独立した $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、もしくは $SO_2NR_4R_7$ と任意に置換される $-O-(CH_2)_n-C(=O)-$ ヘテロシクロアルキル

から選択され、

R_2 が H、アルキル、フルオロアルキル、アルコキシ、フルオロアルコキシ、ハロゲン、アリール、もしくはヘテロアリールであり、

R_3 が $CH(R_4)NHR_4$ 、 $CH(R_4)NH SO_2R_4$ 、 $CH(R_4)SH$ 、 $CH(R_4)OH$ 、 $CH(R_4)CO_2R_4$ 、 $CH(R_4)CONHR_4$ ； $CH(R_4)CONHOH$ ； $CH(R_4)CONHNHR_4$ ； $C(=O)R_4$ 、 CO_2R_4 、 $C(=O)NHR_4$ 、 $C(=O)NHNHR_4$ 、 $C(=S)NHR_4$ 、 $C(=S)NHNHR_4$ 、

【化6】



、 $C(=NH)NH_2$ 、 $NHC(=NH)NH_2$ 、 $N(R_4)OH$ 、 $N(OH)C(=O)R_4$ 、 NHR_4 、 $NHNHR_4$ 、 $NHC(=O)R_4$ 、 $N(R_4)NHC(=O)R_4$ 、 $NHC(=O)NHR_4$ 、 $NHC(=S)NHR_4$ 、 $NHSO_2R_4$ 、 $NHSO_2NHR_4$ ； $NHNHSO_2R_4$ 、 NO_2 、 SO_2NHR_4 （式Iの場合のみ）、 SO_2NHOH （式Iの場合のみ）、 SO_3H （式Iの場合のみ）、 OR_4 、 OSO_2R_4 、 OSO_2NHR_4 、 SR_4 、 $B(OR_4)_2$ 、 $CH_2B(OR_4)_2$ 、 $P(=O)OH$ 、 $P(=O)_2OH$ 、 $Se(=O)OH$ 、 $Se(=O)_2OH$ 、好ましくは1～4ヘテロ原子を備える5員環である複素環、もしくは CH_2 を介して結合する5員複素環であり、

YがOもしくは0であり、

Zが CR_{16} もしくはNであり、

各 R_4 が独立してa) H；b) 1、2、もしくは3つの独立したヒドロキシ、ハロゲン、 $C(=O)OR_2$ 、アミノ、アルキルチオ、もしくは任意に置換されるアリールと任意に置換されるアルキル；c) フルオロアルキル；d) 任意に置換されるアリール；e) 任意に置換したヘテロアリール；もしくはf) 1、2、もしくは3つの独立した $C(=O)OR_2$ 、 $C(=O)NR_2R_7$ 、もしくは $SO_2NR_2R_7$ と任意に置換されるヘテロシクロアルキルであり、

各 R_5 が独立してH、アルキル、フルオロアルキル、ハロゲン、アルコキシ、フルオロアルコキシ、置換型アミノ、アリール、もしくはヘテロアリールであり、

AがO、S、 CH_2 もしくは $N(R_4)$ であり、

Aがまた、 R_6 が0の場合に、以下の：好ましくは1～4つのヘテロ原子を備える5員環である任意に置換される複素環、 $B(OR_4)_2$ 、 $P(=O)OH$ 、 $P(=O)_2OH$ 、 $Se(=O)OH$ 、 $Se(=O)_2OH$ であり、

R_6 が0、 $CH(R_4)CO_2R_4$ 、 $CH(R_4)CONHR_4$ ； $CH(R_4)CONHOH$ ； $CH(R_4)CONHNHR_4$ ； $C(=O)R_4$ 、 CO_2R_4 、 $C(=O)NHR_4$ 、 $C(=O)NR_4OH$ 、 $C(=O)NHNHR_4$ 、 $C(=S)NHR_4$ 、 $C(=S)NR_4OH$ 、 $C(=S)NHNHR_4$ 、

【化7】



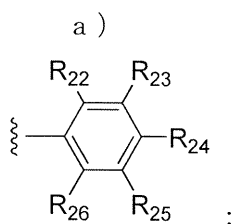
、 $C(=NH)NH_2$ 、 SO_2NHNHR_4 （ただしAはSとすることができない）、 SO_2NHR_4 （ただしAはSとすることができない）、 SO_2NHOH （ただしAはSとすることができない）；好ましくは1～4つのヘテロ原子を備える5員環である複素環、もしくは CH_2 を介して結合した（好ましくは5員環の）複素環であり、

各 R_7 が独立して、H；アルキル；アルコキシ；ヒドロキシ； $C(=O)OR_4$ ； $NHSO_2R_4$ ； $N(アルキル)SO_2R_4$ ； NHR_4 ； $NHC(=O)R_4$ ； $N(アルキル)C(=O)R_4$ ； $C(=O)NR_2R_7$ ； $SO_2NR_2R_7$ ； $C(=O)NR_2$

NHR_4 ; $\text{C}(=\text{O})\text{NR}_{27}\text{OR}_4$; ハロゲン; 任意に置換されるアリール; 任意に置換されるヘテロアリール; 1、2、もしくは3つの独立した OR_4 、 $\text{C}(=\text{O})\text{OR}_4$ 、もしくは NHSO_2R_4 と任意に置換されるヘテロシクロアルキル; もしくは1、2、もしくは3つの独立した OR_4 、 $\text{C}(=\text{O})\text{OR}_4$ 、もしくは NHSO_2R_4 と任意に置換されるヘテロシクロアルキルカルボニルであり、

各 R_{13} が独立して、

【化8】



b) 独立して、

i) OR_4 ;

ii) $\text{NHC}(=\text{O})\text{R}_4$;

iii) $\text{C}(=\text{O})\text{OR}_4$; もしくは

iv) $\text{C}(=\text{O})\text{NHR}_4$

と任意に置換される、1、2、もしくは3つの独立したアルキルと任意に置換されるヘテロシクロアルキル;

c) 1、2、もしくは3つの独立した1) ヘテロシクロアルキルカルボニル、2) $\text{NR}_{27}\text{SO}_2\text{R}_4$ 、3) 1、2、もしくは3つの独立した $\text{C}(=\text{O})\text{OR}_4$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NR}_4\text{R}_7$ 、もしくは $\text{SO}_2\text{NR}_4\text{R}_7$ とそれぞれが任意に置換されるアルキルアミノカルボニル、4) (ヘテロシクロアルキル)アルキル; もしくは5) $\text{NR}_{27}\text{C}(=\text{O})\text{R}_4$; もしくは

d) 1、2、もしくは3つの独立した $\text{C}(=\text{O})\text{OR}_4$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NR}_4\text{R}_7$ 、ヒドロキシアルキル、もしくは $\text{SO}_2\text{NR}_4\text{R}_7$ と任意に置換されるシクロアルキルから選択され、

各 R_{14} が独立してヘテロシクロアルキルカルボニル、ヘテロシクロアルキルスルホニル、もしくはヘテロシクロアルキルから選択され、それぞれが1、2、もしくは3つの独立した $\text{C}(=\text{O})\text{OR}_4$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NR}_4\text{R}_7$ 、もしくは $\text{SO}_2\text{NR}_4\text{R}_7$ と任意に置換され、

各 R_{15} が独立してH; アルキル; フルオロアルキル; アリール; アリールアルキル; もしくはヘテロアリールであり、

各 R_{16} が独立して水素; アルキル; アルコキシ; ヒドロキシ; NHR_4 ; $\text{NHC}(=\text{O})\text{R}_4$; ハロゲン; 任意に置換されるアリール; 任意に置換されるヘテロアリール; 1、2、もしくは3つの独立した $\text{C}(=\text{O})\text{OR}_4$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NR}_4\text{R}_7$ 、もしくは $\text{SO}_2\text{NR}_4\text{R}_7$ と任意に置換されるヘテロシクロアルキル; もしくは NHSO_2R_4 であり、

各 R_{17} が独立してa) H; b) 1、2、もしくは3つの独立したヒドロキシ、ハロゲン、 $\text{C}(=\text{O})\text{OR}_4$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NR}_4\text{R}_7$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}_4\text{R}_7$ 、アミノ、アルキルチオ、もしくは任意に置換されるアリールと任意に置換されるアルキル; c) フルオロアルキル; d) アリール; もしくはe) ヘテロアリールであり、

各 R_{18} が独立してa) H; b) 1、2、もしくは3つの独立したヒドロキシ、ハロゲン、 $\text{C}(=\text{O})\text{OR}_4$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NR}_4\text{R}_7$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}_4\text{R}_7$ 、アミノ、アルキルチオ、もしくは任意に置換されるアリールと任意に置換されるアルキル; c) フルオロアルキル; d) アリール; もしくはe) ヘテロアリールであり、

各 R_{19} が独立してa) H; b) 1、2、もしくは3つの独立したヒドロキシ、ハロゲン、 $\text{C}(=\text{O})\text{OR}_4$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NR}_4\text{R}_7$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}_4\text{R}_7$ 、アミノ、アルキルチ

オ、もしくは任意に置換されるアリールと任意に置換されるアルキル；c)フルオロアルキル；d)アリール；もしくはe)ヘテロアリールであり、

各 R_{20} が独立して a) H；b) 1、2、もしくは3つの独立したヒドロキシ、ハロゲン、 $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、 $SO_2NR_4R_7$ 、アミノ、アルキルチオ、任意に置換されるヘテロアリール、もしくは任意に置換されるアリールと任意に置換されるアルキル；c)フルオロアルキル；d)1、2、もしくは3つの独立した $C(=O)OR_4$ もしくは OR_4 と任意に置換されるアリール；もしくはe)ヘテロアリールであり、

各 R_{21} が独立して a) H；b) 1、2、もしくは3つの独立したヒドロキシ、ハロゲン、 $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、 $SO_2NR_4R_7$ 、アミノ、アルキルチオ、もしくは任意に置換されるアリールと任意に置換されるアルキル；c)フルオロアルキル；d)アリール；もしくはe)ヘテロアリールであり、

各 R_{22} 、 R_{23} 、 R_{24} 、 R_{25} 、および R_{26} が独立して、

i) 水素；ii) $NHC(=O)R_4$ ；iii) $NHSO_2R_4$ ；iv) 1、2、もしくは3つの独立したアルキル、 $CH_2C(=O)OR_{19}$ 、 $CH_2C(=O)NR_4R_7$ 、 OR_4 、 $CH_2SO_2NR_4R_7$ 、 $C(=O)OR_{19}$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、もしくは $SO_2NR_4R_7$ と任意に置換されるヘテロシクロアルキルカルボニル；v) 1、2、もしくは3つの独立した $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、もしくは $SO_2NR_4R_7$ と任意に置換されるヘテロシクロアルキルスルホニル、もしくはアルキル；vi) ハロゲン；vii) 1、2、もしくは3つの独立した $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、もしくは $SO_2NR_4R_7$ と任意に置換されるヘテロシクロアルキルと任意に置換されるアルキル；viii) ヒドロキシアルキルアミノ；ix) $C(=O)NR_{15}R_{20}$ ；x) 1、2、もしくは3つの独立したヒドロキシ、ハロゲン、 $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、 $SO_2NR_4R_7$ 、アミノ、アルキルチオ、もしくは任意に置換されるアリールと任意に置換されるアルコキシ；xi) ハロアルコキシ；xii) ハロアルキル；xiii) ヒドロキシ；xiv) $SO_2NR_4R_{21}$ ；もしくはxv) 1、2、もしくは3つの独立した $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、 $SO_2NR_4R_7$ 、もしくは $CH_2C(=O)OR_4$ と任意に置換されるヘテロシクロアルキルから選択され、

各 R_{27} が独立して a) H；b) 1、2、もしくは3つの独立したヒドロキシ、ハロゲン、アミノ、アルキルチオ、もしくは任意に置換されるアリールと任意に置換されるアルキル；c)フルオロアルキル；d)任意に置換されるアリール；もしくはe)任意に置換されるヘテロアリールであり、

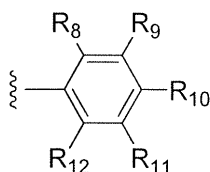
各 n が独立して 0、1、2、3、もしくは4であり、かつ

Q_1 および Q_2 がそれぞれ独立して CH もしくは N である、式 (I)、(II)、(III)、(IV) またはその塩。

【請求項 2】

R_1 が

【化 9】



であり、

各 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 、および R_{12} が独立して、

a) 水素；b) ヒドロキシアルキルアミノ；c) 1、2、もしくは3つの独立したヒドロキシ、 $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NHNHR_4$ 、もしくは $C(=O)NR_4OH$ と任意に置換されるアルコキシ；d) ハロゲン；e) 1、2、もしくは3つの独立した $C(=$

o) OR_4 、 $C(=O)NR_4R_7$ もしくは $SO_2NR_4R_7$ と任意に置換される、5～6員環の原子を含むヘテロシクロアルキル； f) 1、2、もしくは3つの独立した、

i) $C(=O)OR_{17}$ ；もしくは

ii) 1、2、もしくは3つの独立した $C(=O)OR_{17}$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、もしくは $SO_2NR_4R_7$ と任意に置換されるヘテロシクロアルキルカルボニル；もしくは

iii) 1、2、もしくは3つの独立した $OC(=O)NHR_4$ 、 $NHC(=O)NHR_4$ 、 $NHSO_2R_4$ 、ヒドロキシ、もしくは $C(=O)NHR_4$ と任意に置換されるアルキル

と任意に置換されるヘテロアリール；

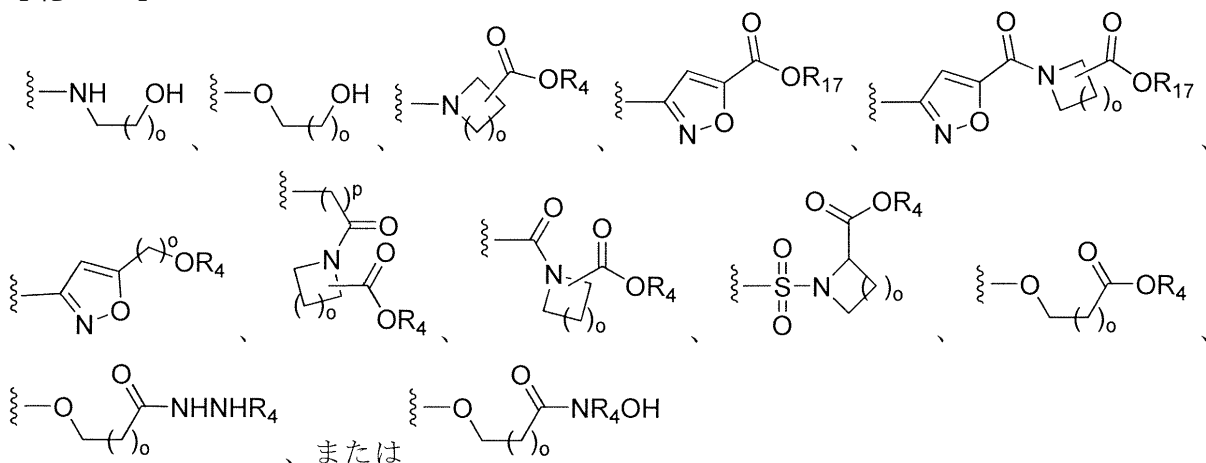
g) 1、2、もしくは3つの独立した $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、もしくは $SO_2NR_4R_7$ と任意に置換される 1、2、もしくは3つのヘテロシクロアルキルカルボニルと任意に置換されるアルキル； h) 1、2、もしくは3つの独立した $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、もしくは $SO_2NR_4R_7$ と任意に置換されるヘテロシクロアルキルカルボニル；または i) 1、2、もしくは3つの独立した $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、もしくは $SO_2NR_4R_7$ と任意に置換されるヘテロシクロアルキルスルホニル

から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

各 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 、および R_{12} が独立してハロゲン、水素、

【化 10】



から選択され、

各 o が独立して 1、2、3、または 4 であり、

各 p が独立して 1、2、3、または 4 である、

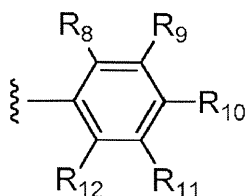
請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

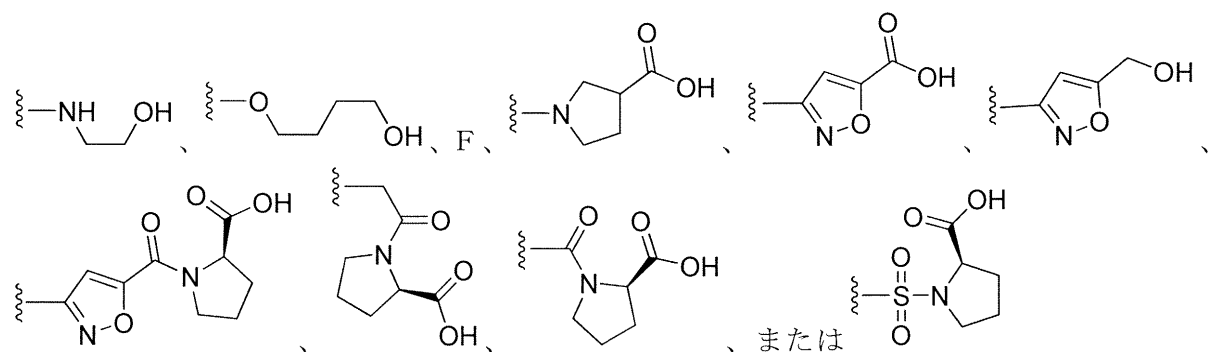
各 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 、および R_{12} が独立して水素、

$\sim\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $\sim\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ 、F、 $\sim\text{N}(\text{CH}_2)_3\text{COOH}$ 、 $\sim\text{C}_5\text{H}_3\text{N}_2\text{O}(\text{COOH})$ 、 $\sim\text{C}_5\text{H}_3\text{N}_2\text{O}(\text{CH}_2\text{OH})$ 、
 $\sim\text{C}_5\text{H}_3\text{N}_2\text{O}(\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{COOH})$ 、 $\sim\text{C}_5\text{H}_3\text{N}_2\text{O}(\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{COOH})$ 、 $\sim\text{C}_5\text{H}_3\text{N}_2\text{O}(\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{COOH})$ 、
 または、 $\sim\text{C}_5\text{H}_3\text{N}_2\text{O}(\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{COOH})$

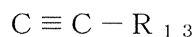
【化 1 2】



【化 1 3】

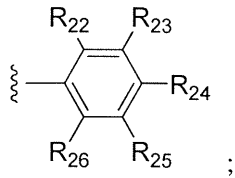


【化 1 4】



a)

【化 1 5】



b) 独立した

i) OR_4 ;

ii) $\text{NHC}(=\text{O})\text{R}_4$;

iii) $\text{C}(=\text{O})\text{OR}_4$; もしくは

iv) $\text{C}(=\text{O})\text{NHR}_4$;

と任意に置換される 1、2、もしくは 3 つの独立したアルキルと置換されるヘテロシクロアルキル ;

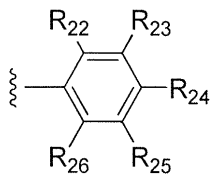
c) 1、2、もしくは 3 つの独立した 1) ヘテロシクロアルキルカルボニル、2) NH_2SO_4 、3) それぞれが 1、2、もしくは 3 つの独立した $\text{C}(=\text{O})\text{OR}_4$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NR}_4\text{R}_7$ 、もしくは $\text{SO}_2\text{NR}_4\text{R}_7$ と任意に置換される、アルキルアミノカルボニル、もしくは 4) (ヘテロシクロアルキル)アルキルと任意に置換されるヘテロアリール ; または

d) 1、2、もしくは 3 つの独立した $\text{C}(=\text{O})\text{OR}_4$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NR}_4\text{R}_7$ 、もしくは $\text{SO}_2\text{NR}_4\text{R}_7$ と任意に置換されるシクロ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 9】

R_{13} が

【化 1 6】



であり、

各 R_{22} 、 R_{23} 、 R_{24} 、 R_{25} および R_{26} 、が独立してハロゲン、水素、

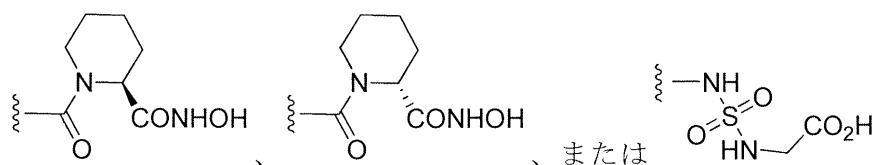
[illegible]

各 M が独立して O、C H₂、または S であり、
各 o が独立して 1、2、3、または 4 であり、
各 p が独立して 1、2、3、または 4 である、

【請求項 10】

R_{22} 、 R_{23} 、 R_{24} 、 R_{25} 、および R_{26} が独立して水素、

[illegible]

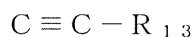


から選択される、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

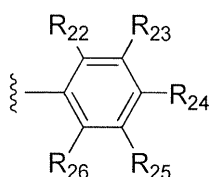
R_3 が $NHNH_2$ であり、 R_1 が

【化 19】



であり、 R_{13} が

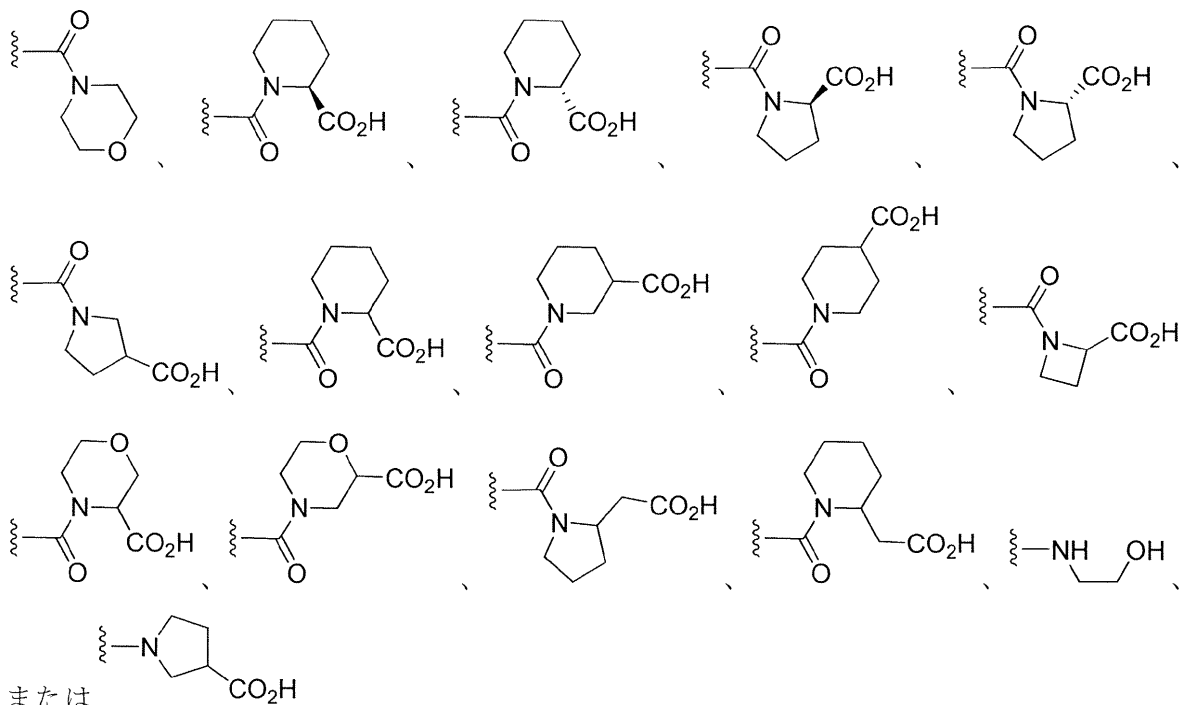
【化 20】



であり、

R_{24} が独立して水素、

【化 21】



から選択され、

R_{22} 、 R_{23} 、 R_{25} 、および R_{26} が独立して水素またはハロゲンである、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 12】

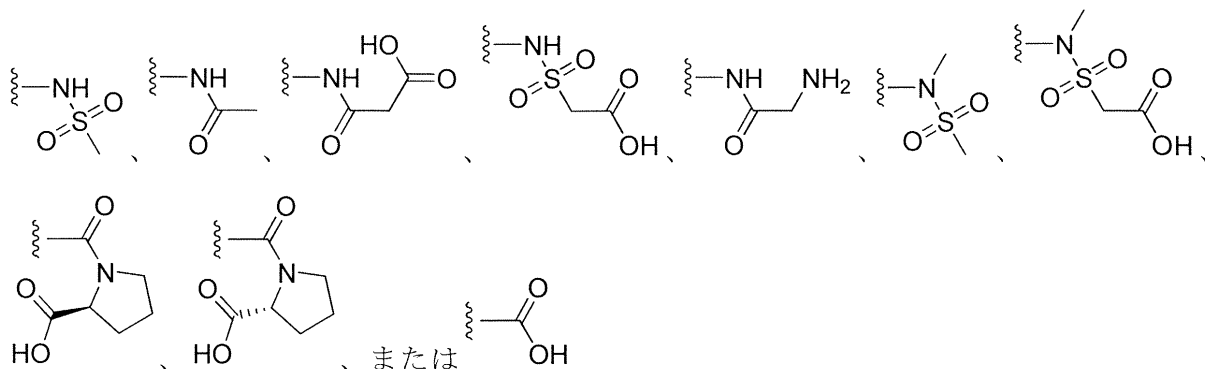
各 R_7 が独立して $C(=O)OR_4$ ； $NHSO_2R_4$ ； $N(\text{アルキル})SO_2R_4$ ； $NHC(=O)R_4$ ； $N(\text{アルキル})C(=O)R_4$ ； $C(=O)NR_{27}R_4$ ； $SO_2NR_{27}R_4$ ； $C(=O)NR_{27}NHR_4$ ； $C(=O)NR_{27}OR_4$ ；または 1、2、もしくは 3 つの独立した OR_4 、 $C(=O)OR_4$ 、もしくは $NHSO_2R_4$ と任意に置

換されるヘテロシクロアルキルカルボニルである、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 1 3】

各 R_7 が独立して

【化 2 2】

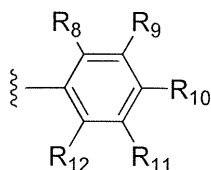


である、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

R_1 が

【化 2 3】



であり、各 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 、および R_{12} が独立して、

a) 水素；b) ヒドロキシアルキルアミノ；c) 1、2、もしくは 3 つの独立したヒドロキシ、 $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NHNHR_4$ 、もしくは $C(=O)NR_4OH$ と任意に置換されるアルコキシ；d) ハロゲン；e) 1、2、もしくは 3 つの独立した $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ もしくは $SO_2NR_4R_7$ と任意に置換される、5 ~ 6 員環の原子を含むヘテロシクロアルキル；f) 1、2、もしくは 3 つの独立した

i) $C(=O)OR_{17}$ ；もしくは

ii) 1、2、もしくは 3 つの独立した $C(=O)OR_{17}$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、もしくは $SO_2NR_4R_7$ と任意に置換されるヘテロシクロアルキルカルボニル；

iii) 1、2、もしくは 3 つの独立した $OC(=O)NHR_4$ 、 $NHC(=O)NHR_4$ 、 $NHSO_2R_4$ 、ヒドロキシ、もしくは $C(=O)NHR_4$ と任意に置換されるアルキル

と任意に置換されるヘテロアリール；

g) $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、もしくは $SO_2NR_4R_7$ と置換される 1、2、もしくは 3 つのヘテロシクロアルキルカルボニルと任意に置換されるアルキル；

h) 1、2、もしくは 3 つの独立した $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、もしくは $SO_2NR_4R_7$ と任意に置換されるヘテロシクロアルキルカルボニル；または i) 1、2、もしくは 3 つの独立した $C(=O)OR_4$ 、 $C(=O)NR_4R_7$ 、もしくは $SO_2NR_4R_7$ と任意に置換されるヘテロシクロアルキルスルホニル

から選択される、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

各 R_7 が独立して

$\sim\text{NH}-\text{SO}_2-$ 、 $\sim\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-$ 、 $\sim\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-\text{COOH}$ 、 $\sim\text{NH}-\text{SO}_2-\text{CH}_2-\text{COOH}$ 、 $\sim\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-\text{NH}_2$ 、 $\sim\text{N}(\text{CH}_3)-\text{SO}_2-$ 、 $\sim\text{N}(\text{CH}_3)-\text{SO}_2-\text{CH}_2-\text{COOH}$ 、
 $\sim\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{CH}_2)_4-\text{CH}(\text{COOH})-$ 、 $\sim\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{CH}_2)_4-\text{CH}_2-\text{COOH}$ 、または $\sim\text{COOH}$

各 R_8 、 R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 、および R_{12} が独立して水素、

$\sim\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $\sim\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ 、F、

$\sim\text{N}(\text{Cyclopentyl})\text{COOH}$ 、 $\sim\text{C}_5\text{H}_3\text{NOCH}_2\text{OH}$ 、 $\sim\text{C}_5\text{H}_3\text{NOCOOH}$ 、

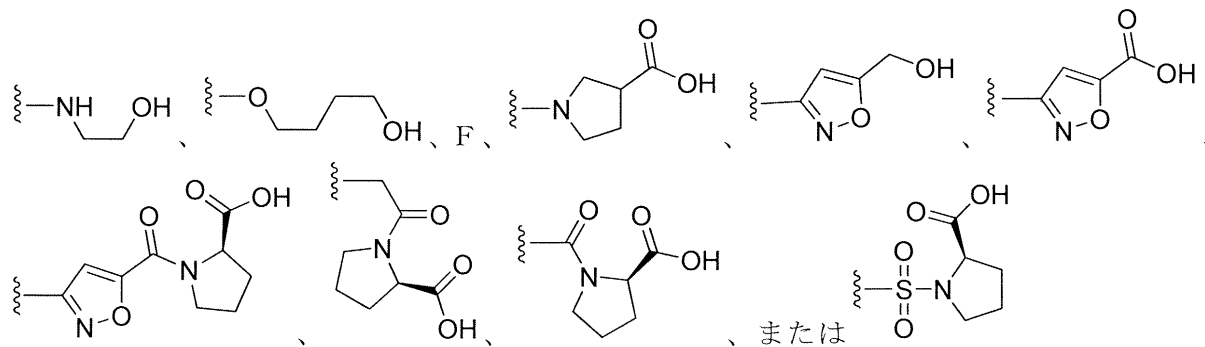
$\sim\text{C}_5\text{H}_3\text{NOCOC(O)N}(\text{Cyclopentyl})\text{COOH}$ 、 $\sim\text{C}_5\text{H}_3\text{NOCOC(O)N}(\text{Cyclopentyl})\text{COOH}$ 、 $\sim\text{C}_5\text{H}_3\text{NOCOC(O)N}(\text{Cyclopentyl})\text{COOH}$ 、または

$\sim\text{SO}_2\text{N}(\text{Cyclopentyl})\text{COOH}$

R₃ が NHNH₂ であり、R₁ が

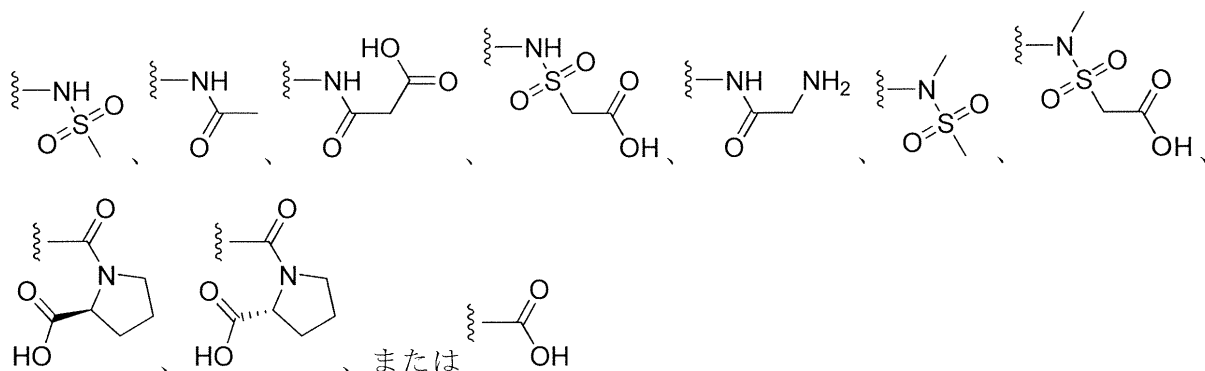
Chemical structure of a benzene ring with substituents R_8 , R_9 , R_{10} , R_{11} , and R_{12} . A wavy line is attached to the ring at the 6 o'clock position.

【化 2 7】



から選択され、 R_8 、 R_9 、 R_{11} 、および R_{12} がそれぞれHであり、各 R_7 が独立して

【化 2 8】

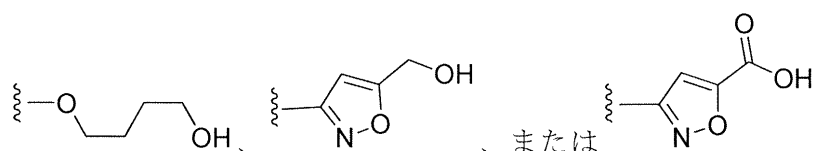


である、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 1 7】

R₁₀ が

【化 2 9】

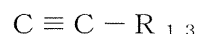


から選択される、請求項 1 6 に記載の化合物。

【請求項 1 8】

R₁ が

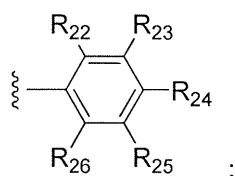
【化 3 0】



であり、R₁₃ が独立して、

a)

【化 3 1】



b) 独立した、

i) OR₄ ;

ii) NHC(=O)R₄ ;

iii) C(=O)OR₄ ; もしくは

iv) C(=O)NHR₄ ;

と任意に置換される 1、2、もしくは 3 つの独立したアルキルと任意に置換されるヘテロシクロアルキル ;

c) 1、2、もしくは 3 つの独立した 1) ヘテロシクロアルキルカルボニル、2) NH₂SO₄、3) それぞれが 1、2、もしくは 3 つの独立した C(=O)OR₄、C(=O)NR₄R₇、もしくは SO₂NR₄R₇ と任意に置換される、アルキルアミノカルボニル、もしくは 4) (ヘテロシクロアルキル)アルキル ; または

d) 1、2、もしくは 3 つの独立した C(=O)OR₄、C(=O)NR₄R₇、もしくは SO₂NR₄R₇ と任意に置換されるシクロアルキル

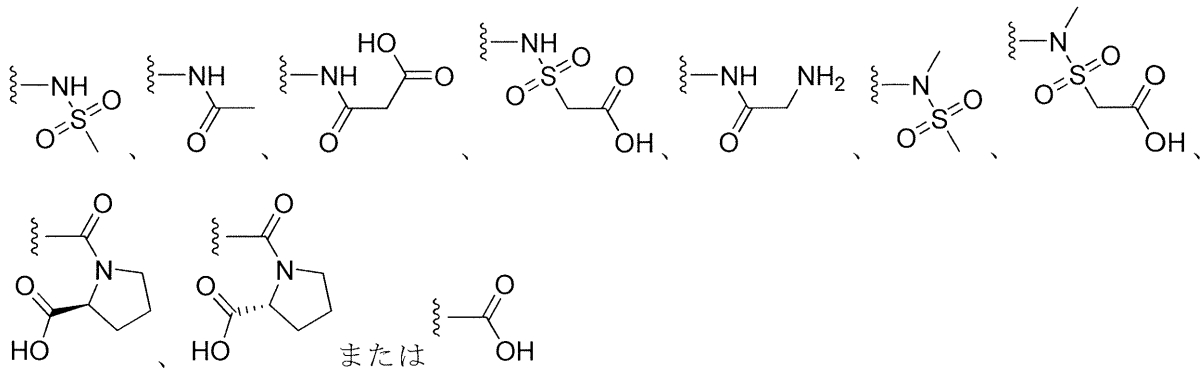
から選択される、

請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 19】

R₇ が独立して

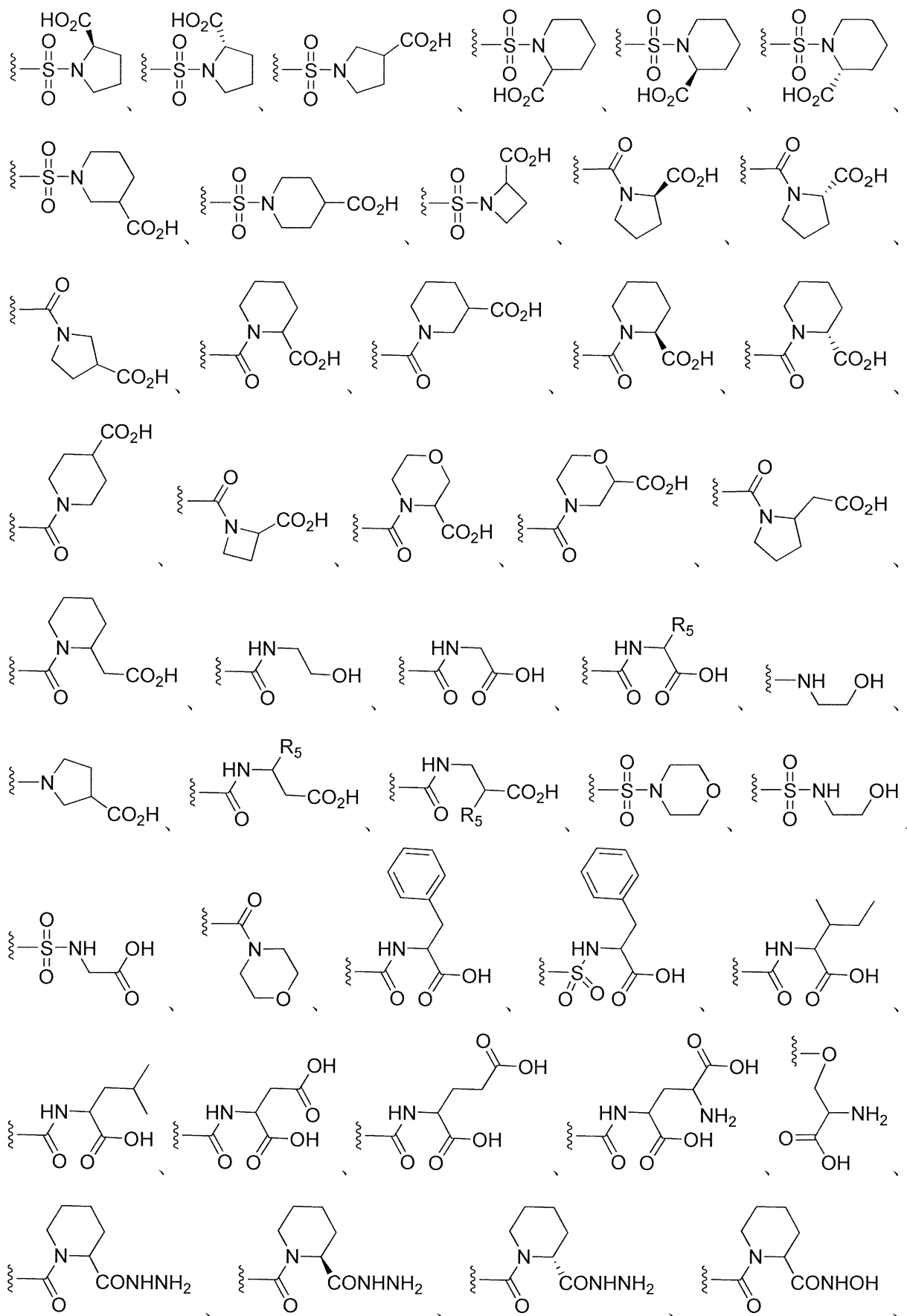
【化 32】

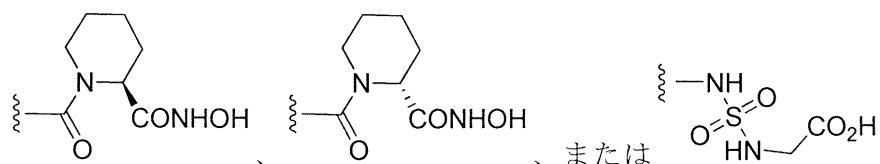


であり、

各 R₂₂、R₂₃、R₂₄、R₂₅、および R₂₆ が独立して水素、ハロ、

【化 3 3】



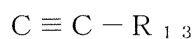


から選択される、請求項 18 に記載の化合物。

【請求項 20】

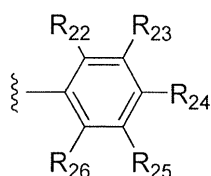
R_3 が $NHNH_2$ であり、 R_1 が

【化 34】



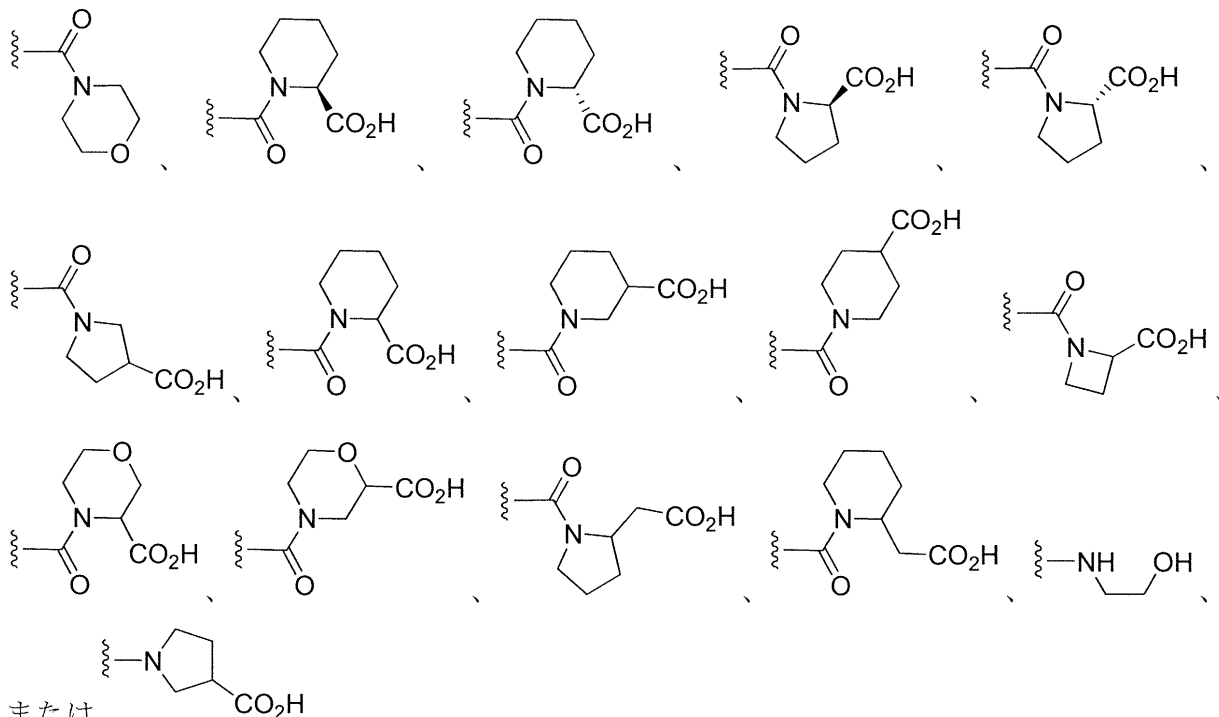
であり、 R_{13} が

【化 35】



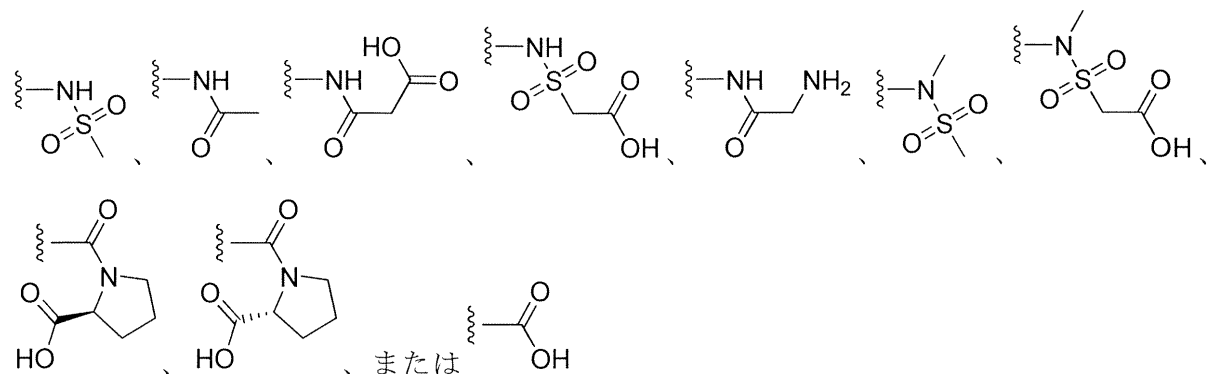
であり、 R_{24} が独立して水素、

【化 36】



から選択され、 R_{22} 、 R_{23} 、 R_{25} 、および R_{26} がそれぞれ独立して水素またはハロゲンであり、各 R_7 が独立して

【化 3 7】

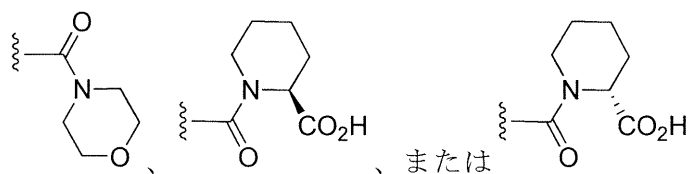


である、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 2 1】

R_{24} が独立して

【化 3 8】



から選択される、請求項 2 0 に記載の化合物。

【請求項 2 2】

A が好ましくは 1 4 ヘテロ原子を備える 5 員環である任意に置換される複素環であり、 R_6 が 0 である、請求項 1 に記載の式 (I I I) の化合物。

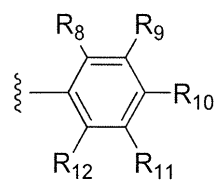
【請求項 2 3】

A が 5 - メチルイミダゾリジニル - 2 , 4 - ジオン、2 - チオキソイミダゾリジン - 4 - オン、またはイミダゾリジン - 2 , 4 - ジオンである、請求項 2 2 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

A が 2 - チオキソイミダゾリジン - 4 - オンであり、 R_1 が

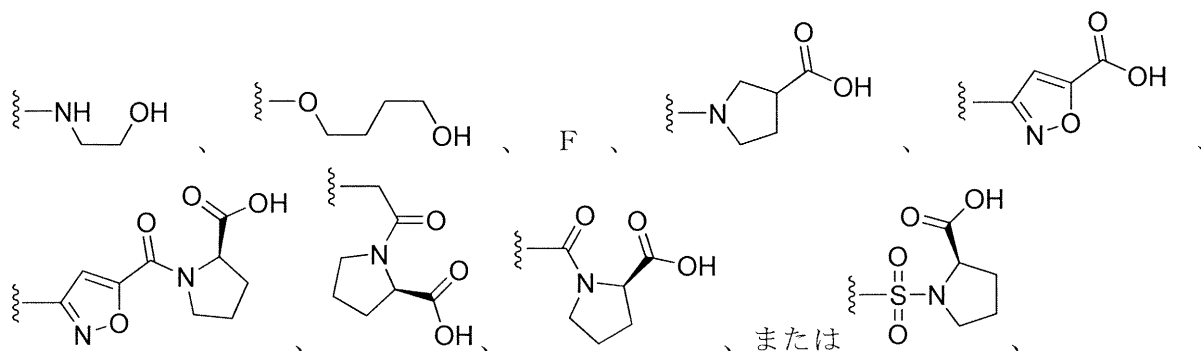
【化 3 9】



であり、

R_{10} が

【化 4 0】

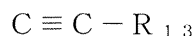


から選択され、

R_8 、 R_9 、 R_{11} 、および R_{12} がそれぞれ H である、
請求項 23 に記載の化合物。

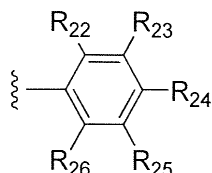
【請求項 25】

A が 2 - チオソイミダゾリジン - 4 - オンであり、 R_1 が
【化 41】



であり、 R_{13} が

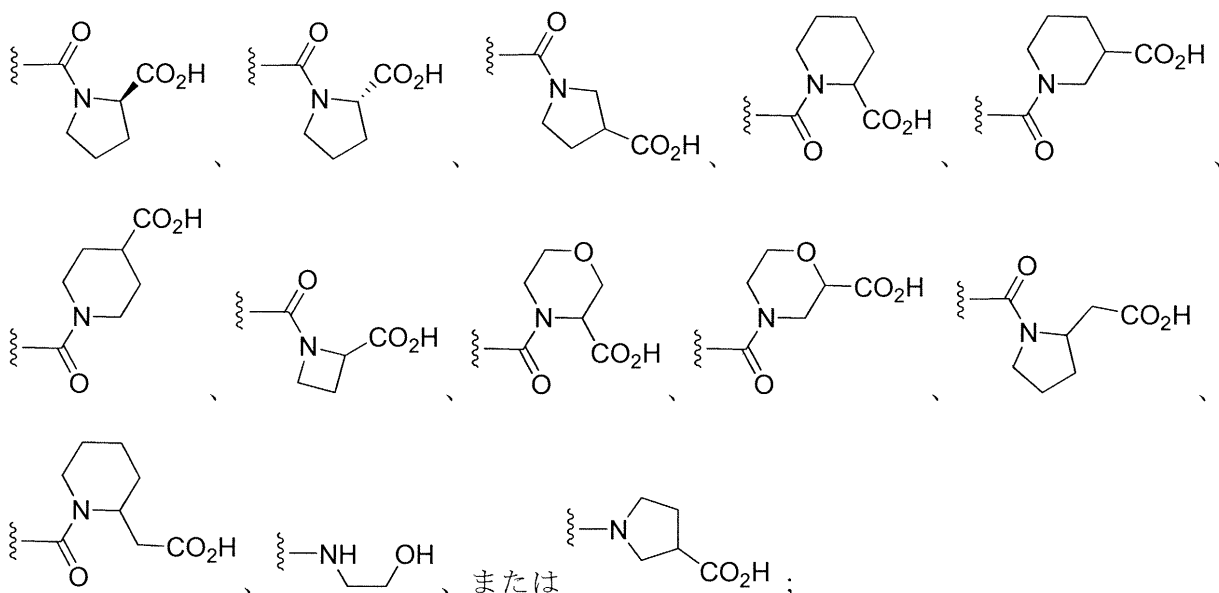
【化 42】



であり、

R_{24} が独立して水素、

【化 43】



から選択され、 R_{22} 、 R_{23} 、 R_{25} 、および R_{26} が独立して水素またはハロゲンである、

請求項 23 に記載の化合物。

【請求項 26】

5 - (2 - (4' - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) - [1, 1' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1, 6 - ナフチリジン - 4 - イル) - 5 - メチルイミダゾリジン - 2, 4 - ジオン (1) ;

1 - ヒドロキシ - 3 - (2 - (4' - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) - [1, 1' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1, 6 - ナフチリジン - 4 - イル) ウレア (2) ;

2 - (4' - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) - [1, 1' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1, 6 - ナフチリジン - 4 - カルボン酸 (3) ;

2 - (4' - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) - [1, 1' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1, 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (4) ;

N (2 - ((4' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1, 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1, 1' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) エチル) イソブチルアミド (5)

;

N (2 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) エチル) メタンスルホンアミド (6) ;

2 - (4 ' - (5 - (ヒドロキシメチル) イソキサゾール - 3 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (7) ;

3 - (2 - (4 ' - (4 - ((テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) オキシ) ブトキシ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - イル) イミダゾリジン - 2 , 4 - ジオン (8) ;

3 - (2 - (4 ' - (4 - ヒドロキシブトキシ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - イル) イミダゾリジン - 2 , 4 - ジオン (9) ;

3 - (2 - (4 ' - (4 - ((テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) オキシ) ブトキシ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - イル) - 2 - チオキソイミダゾリジン - 4 - オン (10) ;

3 - (2 - (4 ' - (4 - ヒドロキシブトキシ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - イル) - 2 - チオキソイミダゾリジン - 4 - オン (11) ;

3 - (2 - (4 ' - (4 - ヒドロキシブトキシ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) キノリン - 4 - イル) イミダゾリジン - 2 , 4 - ジオン (12) ;

2 - (4 ' - (3 - アミノプロボキシ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (13) ;

N (3 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) プロピル) メタンスルホンアミド (14) ;

N (3 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) プロピル) アセトアミド (15) ;

N (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 2 - (4 ' - (4 - ヒドロキシブトキシ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) キノリン - 7 - イル) メタンスルホンアミド (16) ;

N ' - (2 - (4 ' - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボニル) メタンスルホノヒドラジド (17) ;

N - ヒドロキシ - 2 - (2 - (4 ' - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) キノリン - 4 - イル) アセトアミド (18) ;

1 - (2 - (4 ' - フルオロ - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - イル) イミダゾリジン - 2 - オン (19) ;

1 - (2 - (4 ' - フルオロ - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - イル) イミダゾリジン - 2 , 4 - ジオン (20) ;

5 - (2 - (4 ' - フルオロ - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - イル) - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - アミン (21) ;

4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - N - メチル - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - スルホンアミド (22) ;

N (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) メタンスルホンアミド (23) ;

N (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) アセトアミド (24) ;

4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - N - メチル - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - カルボキサミド (25) ;

1 - (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) -

[1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) ピロリジン - 3 - カルボン酸 (2 6) ;

2 - (4 ' - (2 - モルフォリノ - 2 - オキシエチル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (2 7) ;

2 - (4 ' - (2 - モルフォリノ - 2 - オキシエトキシ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (2 8) ;

2 - (4 ' - ((モルフォリノスルホニル) メチル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (2 9) ;

3 - (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) イソキサゾール - 5 - カルボン酸 (3 0) ;

(R) - 1 - (3 - (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) イソキサゾール - 5 - カルボニル) ピロリジン - 2 - カルボン酸 (3 1) ;

(3 - (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) イソキサゾール - 5 - イル) メチル メチルカルバマート (3 2) ;

1 - ((3 - (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) イソキサゾール - 5 - イル) メチル) - 3 - メチルウレア (3 3) ;

N ((3 - (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) イソキサゾール - 5 - イル) メチル) アセトアミド (3 4) ;

N ((3 - (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) イソキサゾール - 5 - イル) メチル) メタンスルホンアミド (3 5) ;

(R) - 1 - (3 - (4 ' - (4 - (ヒドロキシ (メチル) カルバモイル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) イソキサゾール - 5 - カルボニル) ピロリジン - 2 - カルボン酸 (3 6) ;

N (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 2 - (4 ' - (4 - ヒドロキシブトキシ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) キノリン - 6 - イル) メタンスルホンアミド (3 7) ;

2 - (4 ' - シアノ - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) キノリン - 4 - カルボヒドラジド (3 8) ;

2 - (4 ' - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 3 - メチル - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (3 9) ;

N ' - (2 - (4 ' - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 3 - メチル - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボニル) メタンスルホヒドラジド (4 0) ;

N (2 - (4 ' - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - イル) ヒドラジンカルボキサミド (4 1) ;

2 - (4 ' - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) キノリン - 4 - カルボン酸 (4 2) ;

2 - (4 ' - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) キノリン - 4 - カルボヒドラジド (4 3) ;

2 - (4 ' - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 3 - メトキシ 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (4 4) ;

2 - (4 ' - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 3 - メトキシ 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボン酸 (4 5) ;

2 - (4 ' - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 3 - メチル - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボン酸 (4 6) ;

2 - (4 ' - シアノ - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) キノリン - 4 - カルボン

酸 (4 7) ;

2 - (2 - (4 ' - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) キノリン - 4 - イル) アセトヒドラジド (4 8) ;

N - ヒドロキシ - 2 - (4 ' - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - N - メチル - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボキサミド (4 9) ;

2 - (4 ' - フルオロ - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン 6 - オキシド (5 0) ;

4 - (ヒドラジンカルボニル) - 2 - (4 ' - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン 6 - オキシド (5 1) ;

3 - (2 - (4 ' - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) キノリン - 4 - イル) イミダゾリジン - 2 , 4 - ジオン (5 2) ;

2 - (4 ' - (4 - ヒドロキシプトキシ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (5 3) ;

2 - (4 ' - シアノ - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (5 4) ;

2 - (5 - (4 - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (5 5) ;

2 - (6 - (4 - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) フェニル) ピリジン - 3 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (5 6) ;

2 - (4 - (ピリジン - 3 - イル) フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (5 7) ;

2 - (4 - (ピリジン - 2 - イル) フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (5 8) ;

2 - (4 - (ピリジン - 4 - イル) フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (5 9) ;

2 - (4 - (1 H - ピラゾール - 3 - イル) フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (6 0) ;

2 - (4 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (6 1) ;

2 - (4 - (オキサゾール - 2 - イル) フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (6 2) ;

2 - (4 - (オキサゾール - 5 - イル) フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (6 3) ;

2 - ([1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (6 4) ;

2 - (4 ' - フルオロ - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (6 5) ;

2 - (4 ' - (モルフォリノメチル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (6 6) ;

2 - (4 - (5 - (4 - ヒドロキシプトキシ) ピリジン - 2 - イル) フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (6 7) ;

2 - (2 ' - ヒドロキシ - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (6 8) ;

2 - (4 - (チアゾール - 2 - イル) フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (6 9) ;

3 - (2 - (4 ' - フルオロ - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - イル) イミダゾリジン - 2 , 4 - ジオン (7 0) ;

3 - (2 - (4 ' - フルオロ - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフ

チリジン - 4 - イル) - 2 - チオキソイミダゾリジン - 4 - オン (7 1) ;
 2 - (4 ' - (メチルスルホニル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6
 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (7 2) ;
 4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - N (2
 - ヒドロキシエチル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - スルホンアミド (7 3) ;
 4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - N (3
 - ヒドロキシプロピル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - スルホンアミド (7 4) ;
 3 - (2 - (4 - (5 - (4 - ヒドロキシブトキシ) ピリジン - 2 - イル) フェニル)
 - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - イル) - 2 - チオキソイミダゾリジン - 4 - オン (7 5)
 ;
 4 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル)
 - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) ブタン酸 (7 6) ;
 2 - (4 ' - (4 - ヒドラジニル 4 - オキソブトキシ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] -
 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (7 7) ;
 4 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル)
 - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) - N - ヒドロキシブタンアミド (7 8
) ;
 4 - ((4 ' - (4 - (2 , 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル) - 1 , 6 - ナフ
 チリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) - N - ヒドロキ
 シブタンアミド (7 9) ;
 4 - ((4 ' - (4 - (2 , 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル) - 1 , 6 - ナフ
 チリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) ブタン酸 (8 0
) ;
 エチル 4 - ((4 ' - (4 - (2 , 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル) - 1 ,
 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) ブタノ
 アート (8 1) ;
 N - ヒドロキシ - 4 - ((4 ' - (4 - (5 - オキソ - 2 - チオキソイミダゾリジン -
 1 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル
) オキシ) ブタンアミド (8 2) ;
 4 - ((4 ' - (4 - (5 - オキソ - 2 - チオキソイミダゾリジン - 1 - イル) - 1 ,
 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) ブタン
 酸 (8 3) ;
 エチル 4 - ((4 ' - (4 - (5 - オキソ - 2 - チオキソイミダゾリジン - 1 - イル
) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ
) ブタノアート (8 4) ;
 2 - (4 ' - (2 - アミノエトキシ) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 ,
 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (8 5) ;
 N (2 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
 ル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) エチル) アセトアミド (8 6) ;
 (R) - 1 - (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 -
 イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) ピロリジン - 2 - カルボン酸 (8 7) ;
 (S) - 1 - (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 -
 イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) ピロリジン - 2 - カルボン酸 (8 8) ;
 1 - (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) -
 [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) ピペリジン - 3 - カルボン酸 (8 9) ;
 1 - (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) -
 [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) ピペリジン - 4 - カルボン酸 (9 0) ;
 N (3 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
 ル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) プロピル) プロピオンアミド (9
 1) ;

N (3 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) プロピル) イソブチルアミド (9 2) ;

2 , 2 , 2 - トリフルオロ - N - (3 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) プロピル) アセトアミド (9 3) ;

N (3 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) プロピル) エタンスルホンアミド (9 4) ;

N (3 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) プロピル) プロパン - 2 - スルホンアミド (9 5) ;

1 , 1 , 1 - トリフルオロ N (3 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) プロピル) メタンスルホンアミド (9 6) ;

N (2 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) エチル) プロピオンアミド (9 7) ;

2 , 2 , 2 - トリフルオロ N (2 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) エチル) アセトアミド (9 8) ;

N (2 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) エチル) エタンスルホンアミド (9 9) ;

N (2 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) エチル) プロパン - 2 - スルホンアミド (1 0 0) ;

1 , 1 , 1 - トリフルオロ - N - (2 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) エチル) メタンスルホンアミド (1 0 1) ;

2 - (3 ' , 4 ' - ジヒドロキシ [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (1 0 2) ;

(R) - 1 - (2 - (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) アセチル) ピロリジン - 2 - カルボン酸 (1 0 3) ;

(R) - 1 - (2 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) オキシ) アセチル) ピロリジン - 2 - カルボン酸 (1 0 4) ;

(R) - 1 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) メチル) スルホニル) ピロリジン - 2 - カルボン酸 (1 0 5) ;

2 - (4 ' - (モルフォリン - 4 - カルボニル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (1 0 6) ;

(R) - 1 - (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - カルボニル) ピロリジン - 2 - カルボン酸 (1 0 7) ;

1 - (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - カルボニル) ピペリジン - 3 - カルボン酸 (1 0 8) ;

2 - (4 ' - (5 - (モルフォリン - 4 - カルボニル) イソキサゾール - 3 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド

(1 0 9) ;

2 - (4 ' - (モルフォリノスルホニル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (1 1 0) ;

(R) - 1 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) スルホニル) ピロリジン - 2 - カルボン酸 (1 1 1) ;

1 - ((4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) スルホニル) ピペリジン - 3 - カルボン酸 (1 1 2) ;

3 - (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) - N - メチルイソキサゾール - 5 - カルボキサミド (1 1 3) ;

1 - (3 - (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) イソキサゾール - 5 - カルボニル) ピペリジン - 3 - カルボン酸 (1 1 4) ;

1 - (3 - (4 ' - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) - [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル) イソキサゾール - 5 - カルボニル) ピペリジン - 2 - カルボン酸 (1 1 5) ;

N (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) フェニル) アセトアミド (1 1 6) ;

N (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) フェニル) メタンスルホンアミド (1 1 7) ;

2 - (4 - ((4 - (モルフォリン - 4 - カルボニル) フェニル) エチニル) フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (1 1 8) ;

(R) - 1 - ((4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) フェニル) スルホニル) ピロリジン - 2 - カルボン酸 (1 1 9) ;

2 - (4 - ((1 - (2 - ヒドロキシエチル) - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロピリジン - 4 - イル) エチニル) フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (1 2 0) ;

N - (2 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) - 2 - オキソピリジン 1 (2 H) - イル) エチル) アセトアミド (1 2 1) ;

1 - (3 - フルオロ - 4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) ベンゾイル) ピペリジン - 2 - カルボン酸 (1 2 2) ;

1 - (4 - ((2 - フルオロ - 4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) ベンゾイル) ピペリジン - 2 - カルボン酸 (1 2 3) ;

2 - (4 - ((4 - (モルフォリノメチル) フェニル) エチニル) フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (1 2 4) ;

2 - (4 - ((4 - ((2 - ヒドロキシエチル) アミノ) フェニル) エチニル) フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (1 2 5) ;

2 - (4 - (ピリジン - 3 - イルエチニル) フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (1 2 6) ;

3 - (2 - (4 - ((4 - (モルフォリノメチル) フェニル) エチニル) フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - イル) - 2 - チオキソイミダゾリジン - 4 - オン (1 2 7) ;

4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) - N - メチルベンズアミド (1 2 8) ;

4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) - N - メチルベンゼンスルホンアミド (1 2 9) ;

(S) - 1 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) ベンゾイル) ピロリジン - 2 - カルボン酸 (1 3 0) ;

(R) - 1 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) ベンゾイル) ピロリジン - 2 - カルボン酸 (1 3 1) ;

1 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) ベンゾイル) ピペリジン - 3 - カルボン酸 (1 3 2) ;

(-) - 1 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) ベンゾイル) ピペリジン - 3 - カルボン酸 (1 3 3) ;

(+) - 1 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) ベンゾイル) ピペリジン - 3 - カルボン酸 (1 3 4) ;

1 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) ベンゾイル) ピロリジン - 3 - カルボン酸 (1 3 5) ;

1 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) ベンゾイル) ピペリジン - 4 - カルボン酸 (1 3 6) ;

2 - (4 - ((4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - カルボニル) フェニル) エチニル) フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (1 3 7) ;

4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) - N (2 - ヒドロキシエチル) ベンズアミド (1 3 8) ;

4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) - N (3 - ヒドロキシプロピル) ベンズアミド (1 3 9) ;

2 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) ベンズアミド) 酢酸 (1 4 0) ;

(S) - 1 - ((4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) フェニル) スルホニル) ピロリジン - 2 - カルボン酸 (1 4 1) ;

1 - ((4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) フェニル) スルホニル) ピペリジン - 3 - カルボン酸 (1 4 2) ;

1 - ((4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) フェニル) スルホニル) ピロリジン - 3 - カルボン酸 (1 4 3) ;

1 - ((4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) フェニル) スルホニル) ピペリジン - 4 - カルボン酸 (1 4 4) ;

2 - (4 - ((4 - (モルフォリノスルホニル) フェニル) エチニル) フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (1 4 5) ;

2 - (4 - ((4 - ((4 - メチルピペラジン - 1 - イル) スルホニル) フェニル) エチニル) フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (1 4 6) ;

4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) - N - (2 - ヒドロキシエチル) ベンゼンスルホンアミド (1 4 7) ;

4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) - N - (3 - ヒドロキシプロピル) ベンゼンスルホンアミド (1 4 8) ;

2 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) フェニルスルホンアミド) 酢酸 (1 4 9) ;

N - (2 - アミノエチル) - 4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 -
ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) ベンズアミド (1 5 0) ;

N - (2 - アミノエチル) - 4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 -
ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) ベンゼンスルホンアミド (1 5 1) ;

(R) - 1 - ((4 - ((4 - (4 - (5 - オキソ - 2 - チオキソイミダゾリジン - 1
- イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) フェニル) スルホニ
ル) ピロリジン - 2 - カルボン酸 (1 5 2) ;

(R) - 1 - ((4 - ((4 - (4 - (2 , 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル)
- 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) フェニル) スルホニル) ピロ
リジン - 2 - カルボン酸 (1 5 3) ;

1 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) ベンゾイル) アゼチジン - 2 - カルボン酸 (1 5 4) ;

1 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) ベンゾイル) ピペリジン - 2 - カルボン酸 (1 5 5) ;

(-) - 1 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン
- 2 - イル) フェニル) エチニル) ベンゾイル) ピペリジン - 2 - カルボン酸 (1 5 6)
;

(+) - 1 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン
- 2 - イル) フェニル) エチニル) ベンゾイル) ピペリジン - 2 - カルボン酸 (1 5 7)
;

1 - ((4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 -
イル) フェニル) エチニル) フェニル) スルホニル) アゼチジン - 2 - カルボン酸 (1 5
8) ;

1 - ((4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 -
イル) フェニル) エチニル) フェニル) スルホニル) ピペリジン - 2 - カルボン酸 (1 5
9) ;

4 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) ベンゾイル) モルフォリン - 3 - カルボン酸 (1 6 0) ;

4 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) ベンゾイル) モルフォリン - 2 - カルボン酸 (1 6 1) ;

2 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) - 2 - オキソピリジン 1 (2 H) - イル) 酢酸 (1 6 2) ;

2 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) - 2 - オキソピリジン - 1 (2 H) - イル) - N - メチルアセ
トアミド (1 6 3) ;

1 - (5 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) チオフエン - 2 - カルボニル) ピペリジン - 3 - カルボン酸 (1
6 4) ;

1 - (5 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) チオフエン - 2 - カルボニル) ピペリジン - 2 - カルボン酸 (1
6 5) ;

1 - (5 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) フラン - 2 - カルボニル) ピペリジン - 2 - カルボン酸 (1 6
6) ;

1 - (5 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) フラン - 2 - カルボニル) ピペリジン - 3 - カルボン酸 (1 6
7) ;

1 - (5 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ

ル)フェニル)エチニル)ピコリノイル)ピペリジン-2-カルボン酸(168);

1-(2-フルオロ-4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)ベンゾイル)ピペリジン-2-カルボン酸(169);

2-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)ベンズアミド)プロパン酸(170);

2-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)ベンズアミド)-3-メチルブタン酸(171);

2-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)ベンズアミド)-3-メチルペンタン酸(172);

2-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)ベンズアミド)-4-メチルペンタン酸(173);

2-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)ベンズアミド)コハク酸(174);

2-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)ベンズアミド)ペンタン二酸(175);

2-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)ベンズアミド)-3-ヒドロキシプロパン酸(176);

2-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)ベンズアミド)-3-ヒドロキシブタン酸(177);

2-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)ベンズアミド)-4-(メチルチオ)ブタン酸(178);

2-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)ベンズアミド)-3-フェニルプロパン酸(179);

2-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)ベンズアミド)-3-(4-ヒドロキシフェニル)プロパン酸(180);

4-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)ベンゾイル)チオモルフォリン-3-カルボン酸(181);

2-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)ベンズアミド)-2-メチルプロパン酸(182);

N-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)フェニル)エタンスルホンアミド(183);

N-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)フェニル)プロパン-2-スルホンアミド(184);

1,1,1-トリフルオロN-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)フェニル)メタンスルホンアミド(185);

2-(N(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)フェニル)スルファモイル)酢酸(186);

2-(1-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)ベンゾイル)ピロリジン-2-イル)酢酸(187);

2-(1-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)ベンゾイル)ピペリジン-2-イル)酢酸(188);

2-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)-N-メチルベンズアミド)酢酸(189);

2-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)-N-メチルベンズアミド)プロパン酸(190);

3-(4-(4-(4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル)フェニル)エチニル)ベンズアミド)プロパン酸(191);

3 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) - N - メチルベンズアミド) プロパン酸 (1 9 2) ;

3 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) ベンズアミド) - 2 - メチルプロパン酸 (1 9 3) ;

3 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) ベンズアミド) ブタン酸 (1 9 4) ;

3 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) - N - メチルベンズアミド) - 2 - メチルプロパン酸 (1 9 5
) ;

3 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) - N - メチルベンズアミド) ブタン酸 (1 9 6) ;

3 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) ベンズアミド) - 2 - フェニルプロパン酸 (1 9 7) ;

3 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) ベンズアミド) - 3 - フェニルプロパン酸 (1 9 8) ;

5 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) ベンズアミド) - 2 - ヒドロキシ安息香酸 (1 9 9) ;

3 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) ベンズアミド) 安息香酸 (2 0 0) ;

2 - (4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イ
ル) フェニル) エチニル) ベンズアミド) マロン酸 (2 0 1) ; または

(S) - 1 - (3 - クロロ - 4 - ((4 - (4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 -
ナフチリジン - 2 - イル) フェニル) エチニル) ベンゾイル) ピペリジン - 2 - カルボン
酸 (2 0 2) ;

2 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2
- イル] フェニル } エチニル) ベンズアミド] 安息香酸 (2 0 3) ;

1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2
- イル] フェニル } エチニル) - 3 - メトキシベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸
(2 0 4) ;

1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2
- イル] フェニル } エチニル) - 3 - ヒドロキシベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン
酸 (2 0 5) ;

1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2
- イル] フェニル } エチニル) - 3 - (トリフルオロメチル) ベンゾイル] ピペリジン -
2 - カルボン酸 (2 0 6) ;

1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2
- イル] フェニル } エチニル) ベンゾイル] - 4 - ヒドロキシピペリジン - 3 - カルボン
酸 (2 0 7) ;

(2 R) - 1 - [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) -
1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 -
カルボン酸 (2 0 8) ;

(2 S) - 1 - [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) -
1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 -
カルボン酸 (2 0 9) ;

1 - [2 , 5 - ジフルオロ 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6
- ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボ
ン酸 (2 1 0) ;

2 - (4 - { 2 - [4 - (2 - オキソ - 1 , 3 - オキサゾリジン - 5 - イル) フェニル
] エチニル } フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (2 1 1) ;

1 - [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフ

チリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (2 1 2) ;

2 - { 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] - N - メチルホルムアミド } - 3 - フェニルプロパン酸 (2 1 3) ;

2 - { [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] ホルムアミド } - 3 - フェニルプロパン酸 (2 1 4) ;

4 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンズアミド] - 2 - ヒドロキシ安息香酸 (2 1 5) ;

2 - { 1 - [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] - N - メチルホルムアミド } - 3 - フェニルプロパン酸 (2 1 6) ;

2 - { 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] - N - メチルホルムアミド } - 3 - メチルペンタン酸 (2 1 7) ;

1 - [2 , 3 - ジフルオロ 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (2 1 8) ;

2 - { 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] - N - メチルホルムアミド } - 4 - メチルペンタン酸 (2 1 9) ;

2 - { [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] ホルムアミド } - 3 - メチルペンタン酸 (2 2 0) ;

2 - { 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] - N - メチルホルムアミド } - 3 - メチルブタン酸 (2 2 1) ;

2 - { 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] - N - メチルホルムアミド } ペンタン二酸 (2 2 2) ;

N - ヒドロキシ - N - メチル - 2 - (4 - { 4 - [5 - (モルフォリン - 4 - カルボニル) - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] フェニル } フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボキサミド (2 2 3) ;

2 - { 1 - [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] - N - メチルホルムアミド } - 3 - メチルペンタン酸 (2 2 4) ;

2 - { 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] - N - メチルホルムアミド } ブタン二酸 (2 2 5) ;

1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) - 2 - メトキシベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (2 2 6) ;

1 - [2 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (2 2 7) ;

1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) - 2 - (トリフルオロメチル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (2 2 8) ;

1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2

- イル] フェニル} エチニル) - 2 - ヒドロキシベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (2 2 9) ;

1 - [6 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル} エチニル) ピリジン - 3 - カルボニル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (2 3 0) ;

N - ヒドロキシ - 2 - (4 - { 4 - [5 - (メタンスルホンアミドメチル) - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] フェニル} フェニル) - N - メチル - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボキサミド (2 3 1) ;

2 - { [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル} エチニル) フェニル] ホルムアミド } - 3 - フェニルプロパン酸 (2 3 2) ;

2 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル} エチニル) ベンゼンスルホンアミド] - 3 - フェニルプロパン酸 (2 3 3) ;

2 - [N - メチル 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル} エチニル) ベンゼンスルホンアミド] - 3 - フェニルプロパン酸 (2 3 4) ;

1 - [3 , 5 - ジフルオロ 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル} エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (2 3 5) ;

2 - { [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル} エチニル) フェニル] ホルムアミド } - 3 - メチルペンタン酸 (2 3 6) ;

2 - { N - エチル - 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル} エチニル) フェニル] ホルムアミド } 酢酸 (2 3 7) ;

2 - { 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル} エチニル) フェニル] - N - プロピルホルムアミド } 酢酸 (2 3 8) ;

2 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル} エチニル) ベンゼンスルホンアミド] - 3 - メチルペンタン酸 (2 3 9) ;

3 - メチル - 2 - [N - メチル 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル} エチニル) ベンゼンスルホンアミド] ペンタン酸 (2 4 0) ;

2 - { N - ベンジル - 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル} エチニル) フェニル] ホルムアミド } 酢酸 (2 4 1) ;

N - ヒドロキシ - N - メチル - 2 - { 4 - [2 - (6 - トリフルオロメタンスルホンアミドピリジン - 3 - イル) エチニル] フェニル } - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボキサミド (2 4 2) ;

2 - { 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル} エチニル) フェニル] - N (プロパン - 2 - イル) ホルムアミド } 酢酸 (2 4 3) ;

2 - { 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル} エチニル) フェニル] - N (2 - メチルプロピル) ホルムアミド } 酢酸 (2 4 4) ;

N - ヒドロキシ - N - メチル - 2 - { 4 - [2 - (4 - トリフルオロメタンスルホンアミドフェニル) エチニル] フェニル } - 1 , 6 - ナフチリジン - 4 - カルボキサミド (2 4 5) ;

2 - [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゼンスルホンアミド] - 3 - メチルペンタン酸 (2 4 6) ;

2 - { N - ベンジル - 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] ホルムアミド } - 3 - フェニルプロパン酸 (2 4 7) ;

3 - メチル - 2 - [N - メチル 3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゼンスルホンアミド] ペンタン酸 (2 4 8) ;

(2 R) - 1 - [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゼンスルホニル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (2 4 9) ;

(2 S) - 1 - [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゼンスルホニル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (2 5 0) ;

2 - [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゼンスルホンアミド] - 3 - フェニルプロパン酸 (2 5 1) ;

2 - [N - メチル 3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゼンスルホンアミド] - 3 - フェニルプロパン酸 (2 5 2) ;

1 - [4 - (2 - { 5 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] ピリジン - 2 - イル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (2 5 3) ;

1 - [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 2 - フルオロ - 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (2 5 4) ;

2 - { N - エチル - 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] ホルムアミド } - 3 - フェニルプロパン酸 (2 5 5) ;

2 - { 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] - N (プロパン - 2 - イル) ホルムアミド } - 3 - フェニルプロパン酸 (2 5 6) ;

1 - { 3 - フルオロ - 4 - [2 - (4 - { 4 - [ヒドロキシ (メチル) カルバモイル] - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル) エチニル] ベンゾイル } ピペリジン - 2 - カルボン酸 (2 5 7) ;

(2 R) - 1 - { [5 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ピリジン - 2 - イル] メチル } ピロリジン - 2 - カルボン酸 (2 5 8) ;

2 - { 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] - N - (2 - メチルプロピル) ホルムアミド } - 3 - フェニルプロパン酸 (2 5 9) ;

(2 R) - 1 - [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゼンスルホニル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (2 6 0) ;

(2 S) - 1 - [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゼンスルホニル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (2 6 1) ;

2 - アミノ - 3 - { [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] ホルムアミド } プ

ロパン酸 (2 6 2) ;

2 - { 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] - N - プロピルホルムアミド } - 3 - フェニルプロパン酸 (2 6 3) ;

1 - [4 - (2 - { 2 - クロロ - 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (2 6 4) ;

1 - [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 3 - カルボン酸 (2 6 5) ;

(2 R) - 1 - [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゾイル] ピロリジン - 2 - カルボン酸 (2 6 6) ;

1 - [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 3 - カルボン酸 (2 6 7) ;

(2 R) - 1 - [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゾイル] ピロリジン - 2 - カルボン酸 (2 6 8) ;

1 - [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゼンスルホニル] ピペリジン - 3 - カルボン酸 (2 6 9) ;

(2 R) - 1 - [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゼンスルホニル] ピロリジン - 2 - カルボン酸 (2 7 0) ;

2 - { 1 - [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] - N - (2 - メチルプロピル) ホルムアミド } 酢酸 (2 7 1) ;

2 - { 1 - [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] - N (2 - メチルプロピル) ホルムアミド } 酢酸 (2 7 2) ;

2 - [N - (2 - メチルプロピル) 3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゼンスルホンアミド] 酢酸 (2 7 3) ;

2 - [N - (2 - メチルプロピル) 3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゼンスルホンアミド] 酢酸 (2 7 4) ;

1 - [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゼンスルホニル] ピペリジン - 3 - カルボン酸 (2 7 5) ;

(2 R) - 1 - [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゼンスルホニル] ピロリジン - 2 - カルボン酸 (2 7 6) ;

2 - アミノ - 3 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェノキシ] プロパン酸 (2 7 7) ;

1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] - 2 - メトキシフェニル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (2 7 8) ;

2 - { 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) フェニル] - N - (2 - メチルプロピル) ホルムア

ミド}プロパン酸(279);

1-[4-(2-{4-[4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル]-2-ヒドロキシフェニル}エチニル)ベンゾイル]ピペリジン-2-カルボン酸(280);

2-[4-(2-{4-[(2S)-2-カルボキシピペリジン-1-カルボニル]-2-クロロフェニル}エチニル)フェニル]-1,6-ナフチリジン-4-カルボン酸(281);

2-{1-[3-フルオロ-4-(2-{4-[4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル]フェニル}エチニル)フェニル]-N(2-メチルプロピル)ホルムアミド}プロパン酸(282);

2-アミノ-3-{1-[3-クロロ-4-(2-{4-[4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル]フェニル}エチニル)フェニル]-N-メチルホルムアミド}プロパン酸(283);

2-{1-[3-クロロ-4-(2-{4-[4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル]フェニル}エチニル)フェニル]-N-(2-メチルプロピル)ホルムアミド}プロパン酸(284);

2-{1-[4-(2-{4-[4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル]フェニル}エチニル)フェニル]-N(2-メチルプロピル)ホルムアミド}-3-ヒドロキシプロパン酸(285);

2-[4-(2-{2-クロロ-4-[(2S)-2-(ヒドラジンカルボニル)ピペリジン-1-カルボニル]フェニル}エチニル)フェニル]-1,6-ナフチリジン-4-カルボヒドラジド(286);

2-[4-(2-{2-クロロ-4-[(2S)-2-(ヒドラジンカルボニル)ピペリジン-1-カルボニル]フェニル}エチニル)フェニル]-1,6-ナフチリジン-4-カルボン酸(287);

(2S)-1-[3-クロロ-4-(2-{4-[4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル]フェニル}エチニル)ベンゾイル]-N-ヒドロキシピペリジン-2-カルボキサミド(288);

2-{[4-(2-{4-[4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル]フェニル}エチニル)フェニル]ホルムアミド}-3-(1H-イミダゾール-4-イル)プロパン酸(289);

2-{1-[4-(2-{4-[4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル]フェニル}エチニル)フェニル]-N-(2-メチルプロピル)ホルムアミド}-3-(4-ヒドロキシフェニル)プロパン酸(290);

メチル 2-{[4-(2-{4-[4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル]フェニル}エチニル)フェニル]ホルムアミド}-3-(1H-イミダゾール-4-イル)プロパノエート(291);

2-{1-[3-フルオロ-4-(2-{4-[4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル]フェニル}エチニル)フェニル]-N-(2-メチルプロピル)ホルムアミド}-3-ヒドロキシプロパン酸(292);

2-{1-[3-フルオロ-4-(2-{4-[4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル]フェニル}エチニル)フェニル]-N-(2-メチルプロピル)ホルムアミド}-3-ヒドロキシプロパン酸(293);

2-{1-[3-フルオロ-4-(2-{4-[4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル]フェニル}エチニル)フェニル]-N-(2-メチルプロピル)ホルムアミド}-3-ヒドロキシプロパン酸(294);

メチル 2-{[3-クロロ-4-(2-{4-[4-(ヒドラジンカルボニル)-1,6-ナフチリジン-2-イル]フェニル}エチニル)フェニル]ホルムアミド}-3-(1H-イミダゾール-4-イル)プロパノエート(295);

メチル 2-{[3-フルオロ-4-(2-{4-[4-(ヒドラジンカルボニル)-

1, 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル } フェニル } ホルムアミド } - 3 - (1 H - イミダゾール - 4 - イル) プロパノエート (296) ;

3 - アミノ - 2 - { [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1, 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル) フェニル } ホルムアミド } プロパン酸 (297) ;

3 - アミノ - 2 - { [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1, 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル) フェニル } ホルムアミド } プロパン酸 (298) ;

3 - アミノ - 2 - { [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1, 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル) フェニル } ホルムアミド } プロパン酸 (299) ;

(2 S) - 1 - [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [7 - クロロ - 4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1, 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (300) ;

3 - アミノ - 2 - { 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1, 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル) フェニル] - N - (2 - メチルプロピル) ホルムアミド } プロパン酸 (301) ;

3 - アミノ - 2 - { 1 - [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1, 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル) フェニル] - N - (2 - メチルプロピル) ホルムアミド } プロパン酸 (302) ;

3 - アミノ - 2 - { 1 - [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1, 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル) フェニル] - N - (2 - メチルプロピル) ホルムアミド } プロパン酸 (303) ;

2 - { 4 - [2 - (4 - { 1, 3 - ジオキソ - オクタヒドロイミダゾリジノ [1, 5 - a] ピリジン - 2 - イル } フェニル) エチニル } フェニル } - 1, 6 - ナフチリジン - 4 - カルボヒドラジド (304) ;

3 - アミノ - 2 - { 1 - [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1, 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル) フェニル] - N - メチルホルムアミド } プロパン酸 (305) ;

(2 S) - 1 - [4 - (2 - { 4 - [7 - アミノ - 4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1, 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル) - 3 - クロロベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (306) ;

3 - アミノ - 2 - { 1 - [3 - フルオロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1, 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル) フェニル] - N - メチルホルムアミド } プロパン酸 (307) ;

1 - [4 - (2 - { 5 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1, 6 - ナフチリジン - 2 - イル] チオフエン - 2 - イル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (308) ;

(2 S) - 1 - [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 7 - メタンスルホンアミド - 1, 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (309) ;

(2 S) - 1 - [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 7 - メトキシ - 1, 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (310) ;

2 - (4 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1, 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } ブタ - 1, 3 - ジイン - 1 - イル) シクロプロパン - 1 - カルボン酸 (311) ;

(2 S) - 1 - [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [7 - アセトアミド - 4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1, 6 - ナフチリジン - 2 - イル] フェニル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (312) ;

(2S) - 1 - [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 7 - (モルフォリン - 4 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (3 1 3) ;

1 - [2 - (4 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) シクロプロパンカルボニル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (3 1 4) ;

(2S) - 1 - [4 - (2 - { 4 - [7 - (2 - カルボキシアセトアミド) - 4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル) - 3 - クロロベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (3 1 5) ;

(2S) - 1 - [4 - (2 - { 4 - [7 - カルボキシメタンスルホンアミド - 4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル) - 3 - クロロベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (3 1 6) ;

1 - { [4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル) フェニル] カルバモイル } ピペリジン - 2 - カルボン酸 (3 1 7) ;

(2S) - 1 - [3 - クロロ - 4 - (2 - { 4 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 7 - (3 - メトキシピロリジン - 1 - イル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル) ベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (3 1 8) ;

4 - (ヒドラジンカルボニル) - 2 - { 4 - [4 - (4 - ヒドロキシブトキシ) フェニル] フェニル } - 1 , 6 - ナフチリジン - 7 - カルボン酸 (3 1 9) ;

N - [2 - (4 - { 2 - [2 - クロロ - 4 - (モルフォリン - 4 - カルボニル) フェニル] エチニル } フェニル) - 4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 7 - イル] メタンスルホンアミド (3 2 0) ;

(2S) - 1 - [4 - (2 - { 4 - [7 - (2 - アミノアセトアミド) - 4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 2 - イル } フェニル } エチニル) - 3 - クロロベンゾイル] ピペリジン - 2 - カルボン酸 (3 2 1) ;

2 - { [2 - (4 - { 2 - [2 - クロロ - 4 - (モルフォリン - 4 - カルボニル) フェニル] エチニル } フェニル) - 4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 7 - イル] スルファモイル } 酢酸 (3 2 2) ;

(2R) - 1 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 2 - { 4 - [4 - (4 - ヒドロキシブトキシ) フェニル] フェニル } - 1 , 6 - ナフチリジン - 7 - カルボニル] ピロリジン - 2 - カルボン酸 (3 2 3) ;

(2S) - 1 - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 2 - { 4 - [4 - (4 - ヒドロキシブトキシ) フェニル] フェニル } - 1 , 6 - ナフチリジン - 7 - カルボニル] ピロリジン - 2 - カルボン酸 (3 2 4) ;

N - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 2 - { 4 - [4 - (4 - ヒドロキシブトキシ) フェニル] フェニル } - 1 , 6 - ナフチリジン - 7 - イル] メタンスルホンアミド (3 2 5) ;

2 - { [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 2 - { 4 - [4 - (4 - ヒドロキシブトキシ) フェニル] フェニル } - 1 , 6 - ナフチリジン - 7 - イル] スルファモイル } 酢酸 (3 2 6) ;

N - [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 2 - (4 - { 4 - [5 - (ヒドロキシメチル) - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] フェニル } フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 7 - イル] メタンスルホンアミド (3 2 7) ;

2 - { [4 - (ヒドラジンカルボニル) - 2 - (4 - { 4 - [5 - (ヒドロキシメチル) - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] フェニル } フェニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 7 - イル] スルファモイル } 酢酸 (3 2 8) ;

N - [2 - (4 - { 2 - [2 - クロロ - 4 - (モルフォリン - 4 - カルボニル) フェニル] エチニル } フェニル) - 4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 7 - イル] - N - メチルメタンスルホンアミド (3 2 9) ; または

2 - { [2 - (4 - { 2 - [2 - クロロ - 4 - (モルフォリン - 4 - カルボニル) フェニル] エチニル } フェニル) - 4 - (ヒドラジンカルボニル) - 1 , 6 - ナフチリジン - 7 - イル] (メチル) スルファモイル } 酢酸 (3 3 0)

である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 7】

前記化合物が、以下の種類の化学的な相互作用または金属への結合：シグマ結合、共有結合、配位共有結合、イオン結合、結合、結合、または逆結合相互作用のうちの 1 つ以上の形成により金属酵素に対する親和性を得る、請求項 1 ~ 2 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 8】

前記化合物が金属に結合する、請求項 1 ~ 2 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 9】

前記化合物が鉄、亜鉛、ヘム鉄、マンガン、マグネシウム、鉄、硫化鉄のクラスター、ニッケル、モリブデン、または銅に結合する、請求項 1 ~ 2 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 3 0】

前記化合物がシトクロム p 4 5 0 ファミリー、ヒストンデアセチラーゼ、マトリックスメタロプロテアーゼ、ホスホジエステラーゼ、シクロオキシゲナーゼ、炭酸脱水酵素、一酸化窒素シンターゼ、および L p x C から選択される酵素クラスを阻害する、請求項 1 ~ 2 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 3 1】

前記化合物が、1 - デオキシ - d - キシルロース - 5 - リン酸レダクトイソメラーゼ (D X R)、1 7 - ヒドロキシラーゼ / 1 7 , 2 0 - リアーゼ (C Y P 1 7)、アルドステロンシンターゼ (C Y P 1 1 B 2)、アミノペプチダーゼ p、炭疽菌致死因子、アルギナーゼ、ラクタマーゼ、シトクロム P 4 5 0 2 A 6、D - a l a D - a l a リガーゼ、ドーパミン ヒドロキシラーゼ、エンドセリン変換酵素 - 1、グルタミン酸カルボキシペプチダーゼ I I、グルタミニルシクラーゼ、グリオキサラーゼ、ヘムオキシゲナーゼ、H P V / H S V E 1 ヘリカーゼ、インドールアミン 2 , 3 - ジオキシゲナーゼ、ロイコトリエン A 4 ヒドロラーゼ、メチオニンアミノペプチダーゼ 2、ペプチドデフォルミラーゼ、ホスホジエステラーゼ V I I、リラキサーゼ (r e l a x a s e)、レチノイン酸ヒドロキシラーゼ (C Y P 2 6)、T N F - 変換酵素 (T A C E)、UDP - (3 - O - (R - 3 - ヒドロキシミリスチル)) - N - アセチルグルコサミンデアセチラーゼ (L p x C)、血管接着タンパク質 - 1 (V A P - 1)、およびビタミン D ヒドロキシラーゼ (C Y P 2 4) から選択される酵素を阻害する、請求項 1 ~ 2 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 3 2】

前記化合物が 4 - ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ、5 - リボキシゲナーゼ、アデノシンデアミナーゼ、アルコールデヒドロゲナーゼ、アミノペプチダーゼ n、アンジオテンシン変換酵素、アロマターゼ (C Y P 1 9)、カルシニューリン、カルバモイルリン酸シンターゼ、炭酸脱水酵素ファミリー、カテコール - o - メチルトランスフェラーゼ、シクロオキシゲナーゼファミリー、ジヒドロピリミジンデヒドロゲナーゼ - 1、DNA ポリメラーゼ、ファルネシルジホスフェートシンターゼ、ファルネシルトランスフェラーゼ、フマル酸レダクターゼ、G A B A アミノトランスフェラーゼ、H I F - プロリルヒドロキシラーゼ、ヒストンデアセチラーゼファミリー、H I V インテグラーゼ、H I V - 1 逆転写酵素、イソロイシン t R N A リガーゼ、ラノステロールデメチラーゼ (C Y P 5 1)、マトリックスメタロプロテアーゼファミリー、メチオニンアミノペプチダーゼ、中性エンドペプチダーゼ、一酸化窒素シンターゼファミリー、ホスホジエステラーゼ I I I、ホスホジエステラーゼ I V、ホスホジエステラーゼ V、ピルビン酸フェレドキシンオキシドレダクターゼ、腎臓のペプチターゼ、リボヌクレオシドニリン酸レダクターゼ、トロンボキサンシンターゼ (C Y P 5 a)、甲状腺ペルオキシダーゼ、チロシナ

ーゼ、ウレアーゼ、およびキサンチンオキシダーゼから選択される酵素を阻害する、請求項 1 ~ 26 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 33】

前記化合物が金属に結合すると同定される、請求項 1 ~ 26 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 34】

前記化合物が鉄、亜鉛、ヘム鉄、マンガン、マグネシウム、硫化鉄のクラスター、ニッケル、モリブデン、または銅に結合すると同定される、請求項 1 ~ 26 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 35】

前記化合物がシトクロム p 450 ファミリー、ヒストンデアセチラーゼ、マトリックスメタロプロテアーゼ、ホスホジエステラーゼ (phosphodiesterases)、シクロオキシゲナーゼ、炭酸脱水酵素、および一酸化窒素シンターゼから選択される酵素クラスを阻害すると同定される、請求項 1 ~ 26 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 36】

前記化合物が 4 - ヒドロキシフェニルピルビン酸 ジオキシゲナーゼ、5 - リボキシゲナーゼ、アデノシンデアミナーゼ、アルコールデヒドロゲナーゼ、アミノペプチダーゼ n、アンジオテンシン変換酵素、アロマターゼ (CYP19)、カルシニューリン、カルバモイルリン酸シンターゼ、炭酸脱水酵素ファミリー、カテコール - o - メチルトランスフェラーゼ、シクロオキシゲナーゼファミリー、ジヒドロピリミジンデヒドロゲナーゼ - 1、DNA ポリメラーゼ、ファルネシルジホスフェートシンターゼ、ファルネシルトランスフェラーゼ、フマル酸レダクターゼ、GABA アミノトランスフェラーゼ、HIF - プロリルヒドロキシラーゼ、ヒストンデアセチラーゼファミリー、HIV インテグラーゼ、HIV - 1 逆転写酵素、イソロイシン tRNA リガーゼ、ラノステロールデメチラーゼ (CYP51)、マトリックスメタロプロテアーゼファミリー、メチオニンアミノペプチダーゼ、中性エンドペプチダーゼ、一酸化窒素シンターゼファミリー、ホスホジエステラーゼ III、ホスホジエステラーゼ IV、ホスホジエステラーゼ V、ピルビン酸フェレドキシンオキシドレダクターゼ、腎臓のペプチターゼ、リボヌクレオシドニリン酸レダクターゼ、トロンボキサンシンターゼ (CYP5a)、甲状腺ペルオキシダーゼ、チロシナーゼ、ウレアーゼ、およびキサンチンオキシダーゼから選択される酵素を阻害すると同定される、請求項 1 ~ 26 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 37】

前記化合物が L p x C の阻害剤と同定される、請求項 1 ~ 26 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 38】

前記化合物が標的酵素に対する活性範囲およびオフターゲット酵素に対する活性範囲を有すると同定され (たとえば L p x C IC50 < 1.0 μM かつ CYP3A4 に対し IC50 > 3.0 μM ; L p x C IC50 < 0.5 μM かつ CYP3A4 に対し IC50 > 1.0 μM ; L p x C IC50 < 0.24 μM かつ CYP3A4 に対し IC50 > 3.5 μM ; L p x C IC50 < XX μM かつ CYP3A4 に対し IC50 > YY μM であり、それぞれの場合 XX が独立した数であり ; それぞれの場合 YY が独立した数であり ; 特定の態様では XX が YY より少ない数である)、特定の態様では、たとえば、XX が YY より 2 倍、5 倍、10 倍、50 倍、100 倍、または 1000 倍少ない、請求項 1 ~ 26 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 39】

金属酵素の活性を阻害する方法であって、金属酵素と請求項 1 ~ 26 のいずれか 1 項に記載の化合物を接触させることを含む方法。

【請求項 40】

前記接触が in vivo である、請求項 39 に記載の方法。

【請求項 41】

前記接触が *in vitro* である、請求項 39 に記載の方法。

【請求項 42】

前記金属酵素が鉄、亜鉛、ヘム鉄、マンガン、マグネシウム、硫化鉄クラスター、ニッケル、モリブデン、または銅である金属原子を含む、請求項 39 に記載の方法。

【請求項 43】

前記金属酵素がシトクロム P450 ファミリー、ヒストンデアセチラーゼ、マトリックスメタロプロテアーゼ、ホスホジエステラーゼ、シクロオキシゲナーゼ、炭酸脱水酵素、および一酸化窒素シンターゼから選択される酵素クラスのメンバーであり；前記金属酵素がアロマターゼ (CYP19)、シクロオキシゲナーゼ、ラノステロールデメチラーゼ (CYP51)、一酸化窒素シンターゼ、トロンボキサンシンターゼ (CYP5a)、甲状腺ペルオキシダーゼ、17 - ヒドロキシラーゼ / 17, 20 - リアーゼ (CYP17)、アルドステロンシンターゼ (CYP11B2)、シトクロム P450 2A6、ヘムオキシゲナーゼ、インドールアミン 2, 3 - ジオキシゲナーゼ、レチノイン酸ヒドロキシラーゼ (CYP26)、またはビタミン D ヒドロキシラーゼ (CYP24) である、請求項 39 に記載の方法。

【請求項 44】

前記金属酵素が Lp x C である、請求項 39 に記載の方法。

【請求項 45】

前記金属酵素が 4 - ヒドロキシフェニルビルビン酸ジオキシゲナーゼ、5 - リボキシゲナーゼ、アデノシンデアミナーゼ、アルコールデヒドロゲナーゼ、アミノペプチダーゼ n、アンジオテンシン変換酵素、アロマターゼ (CYP19)、カルシニューリン、カルバモイルリン酸シンターゼ、炭酸脱水酵素ファミリー、カテコール - o - メチルトランスフェラーゼ、シクロオキシゲナーゼファミリー、ジヒドロピリミジンデヒドロゲナーゼ - 1、DNA ポリメラーゼ、ファルネシルジホスフェートシンターゼ、ファルネシルトランスフェラーゼ、フマル酸レダクターゼ、GABA アミノトランスフェラーゼ、HIF - プロリルヒドロキシラーゼ、ヒストンデアセチラーゼファミリー、HIV インテグラーゼ、HIV - 1 逆転写酵素、イソロイシン tRNA リガーゼ、ラノステロールデメチラーゼ (CYP51)、マトリックスメタロプロテアーゼファミリー、メチオニンアミノペプチダーゼ、中性エンドペプチダーゼ、一酸化窒素シンターゼファミリー、ホスホジエステラーゼ III、ホスホジエステラーゼ IV、ホスホジエステラーゼ V、ビルビン酸フェレドキシンオキシドレダクターゼ、腎臓のペプチターゼ、リボヌクレオシドニリン酸レダクターゼ、トロンボキサンシンターゼ (CYP5a)、甲状腺ペルオキシダーゼ、チロシナーゼ、ウレアーゼ、およびキサンチンオキシダーゼである、請求項 39 に記載の方法。

【請求項 46】

前記金属酵素が 1 - デオキシ - d - キシルロース - 5 - リン酸レダクトイソメラーゼ (DXR)、17 - ヒドロキシラーゼ / 17, 20 - リアーゼ (CYP17)、アルドステロンシンターゼ (CYP11B2)、アミノペプチダーゼ p、炭疽菌致死因子、アルギナーゼ、ラクタマーゼ、シトクロム P450 2A6、D - ala D - ala リガーゼ、ドーパミン ヒドロキシラーゼ、エンドセリン変換酵素 - 1、グルタミン酸カルボキシペプチダーゼ II、グルタミニルシクラーゼ、グリオキサラーゼ、ヘムオキシゲナーゼ、HPV / HSV E1 ヘリカーゼ、インドールアミン 2, 3 - ジオキシゲナーゼ、ロイコトリエン A4 ヒドロラーゼ、メチオニンアミノペプチダーゼ 2、ペプチドデフォルミラーゼ、ホスホジエステラーゼ VII、リラキサーゼ (relaxase)、レチノイン酸ヒドロキシラーゼ (CYP26)、TNF - 変換酵素 (TACE)、UDP - (3 - O - (R - 3 - ヒドロキシミリストイル)) - N - アセチルグルコサミンデアセチラーゼ (Lp x C)、血管接着タンパク質 - 1 (VAP - 1)、またはビタミン D ヒドロキシラーゼ (CYP24) である、請求項 39 に記載の方法。

【請求項 47】

前記化合物を対象に投与することをさらに含む、請求項 39 に記載の方法。

【請求項 48】

対象において金属酵素活性を調節する方法であって、金属酵素活性を調節するために十分な量および条件下で請求項 1 に記載の化合物と前記対象を接触させることを含む方法。

【請求項 49】

金属酵素関連障害または疾患に罹患するかまたは罹患する疑いのある対象を処置する方法であって、請求項 1 に記載の化合物の有効量を前記対象に投与することを含む方法。

【請求項 50】

金属酵素関連障害または疾患を罹患するかまたは罹患する疑いのある対象を処置する方法であって、前記対象が金属酵素関連障害または疾患の処置が必要と同定されており、請求項 1 に記載の化合物の有効量を、その必要がある前記対象に投与することにより、前記対象の前記障害を処置することを含む方法。

【請求項 51】

金属酵素媒介障害または疾患を罹患するかまたは罹患する疑いのある対象を処置する方法であって、前記対象が金属酵素媒介障害または疾患の処置が必要と同定されており、請求項 1 に記載の化合物の有効量を、その必要がある前記対象に投与することにより、前記対象における前記金属酵素活性を調節（たとえば、ダウンレギュレート、阻害）することを含む方法。

【請求項 52】

前記疾患または障害が 4 - ヒドロキシフェニルピルビン酸 ジオキシゲナーゼ、5 - リボキシゲナーゼ、アデノシンデアミナーゼ、アルコールデヒドロゲナーゼ、アミノペプチダーゼ n、アンジオテンシン変換酵素、アロマトラーゼ (CYP19)、カルシニューリン、カルバモイルリン酸シンターゼ、炭酸脱水酵素ファミリー、カテコール - o - メチルトランスフェラーゼ、シクロオキシゲナーゼファミリー、ジヒドロピリミジンデヒドロゲナーゼ - 1、DNA ポリメラーゼ、ファルネシルジホスフェートシンターゼ、ファルネシルトランスフェラーゼ、フマル酸レダクターゼ、GABA アミノトランスフェラーゼ、HIF - プロリルヒドロキシラーゼ、ヒストンデアセチラーゼファミリー、HIV インテグラーゼ、HIV - 1 逆転写酵素、イソロイシン tRNA リガーゼ、ラノステロールデメチラーゼ (CYP51)、マトリックスメタロプロテアーゼファミリー、メチオニンアミノペプチダーゼ、中性エンドペプチダーゼ、一酸化窒素シンターゼファミリー、ホスホジエステラーゼ III、ホスホジエステラーゼ IV、ホスホジエステラーゼ V、ピルビン酸フェレドキシンオキシドレダクターゼ、腎臓のペプチダーゼ、リボヌクレオシドニリン酸レダクターゼ、トロンボキサンシンターゼ (CYP5a)、甲状腺ペルオキシダーゼ、チロシナーゼ、ウレアーゼ、またはキサンチンオキシダーゼのいずれかにより媒介される、請求項 51 に記載の方法。

【請求項 53】

前記疾患または障害が 1 - デオキシ - d - キシルロース - 5 - リン酸レダクトイソメラーゼ (DXR)、17 - ヒドロキシラーゼ / 17, 20 - リアーゼ (CYP17)、アルドステロンシンターゼ (CYP11B2)、アミノペプチダーゼ p、炭疽菌致死因子、アルギナーゼ、ラクタマーゼ、シトクロム P450 2A6、D - ala D - ala リガーゼ、ドーパミン ヒドロキシラーゼ、エンドセリン変換酵素 - 1、グルタミン酸カルボキシペプチダーゼ II、グルタミニルシクラーゼ、グリオキサラーゼ、ヘムオキシゲナーゼ、HPV / HSV E1 ヘリカーゼ、インドールアミン 2, 3 - ジオキシゲナーゼ、ロイコトリエン A4 ヒドロラーゼ、メチオニンアミノペプチダーゼ 2、ペプチドデフォルミラーゼ、ホスホジエステラーゼ VII、リラキサール (relaxase)、レチノイン酸ヒドロキシラーゼ (CYP26)、TNF - 変換酵素 (TACE)、UDP - (3 - O - (R - 3 - ヒドロキシミリストイル)) - N - アセチルグルコサミンデアセチラーゼ (LpxC)、血管接着タンパク質 - 1 (VAP - 1)、またはビタミン D ヒドロキシラーゼ (CYP24) のいずれかにより媒介される、請求項 51 に記載の方法。

【請求項 54】

前記疾患または障害が癌、心血管疾患、内分泌疾患、炎症性疾患、感染性疾患、遺伝性疾患 (gynecologic disease)、代謝疾患、眼疾患 (ophthalmol

o g i c d i s e a s e)、中枢神経系 (C N S) 疾患、泌尿器疾患、または胃腸疾患である、請求項 5 1 に記載の方法。

【請求項 5 5】

前記疾患または障害が前立腺癌、乳癌、アンドロゲン依存性癌、エストロゲン依存性癌、副腎皮質過形成症、前立腺肥大、男性化症、多毛症、男性型脱毛症、思春期早発症、子宮内膜症、子宮筋腫、子宮癌、乳腺症、多嚢胞性卵巣症候群、不妊症、にきび、機能的卵巣アンドロゲン過剰症、慢性排卵障害を伴うアンドロゲン過剰症、高アンドロゲン血症、早発性副腎皮質微候発現、副腎性もしくはアンドロゲンの過剰 (a d r e n a l o r r o g e n e x c e s s)、子宮頸線維症、炎症性腸疾患、乾癬、全身性真菌症、爪真菌症、全身性細菌感染症、皮膚構造細菌感染症、グラム陰性菌感染症、または心血管疾患である、請求項 5 1 に記載の方法。

【請求項 5 6】

請求項 1 に記載の化合物および農業的に許容可能なキャリアーを含む組成物。

【請求項 5 7】

植物の内部または表面で金属酵素媒介型疾患または障害を処置または予防する方法であって、前記植物または種と請求項 1 に記載の化合物を接触させることを含む方法。

【請求項 5 8】

植物の微生物における金属酵素活性を阻害する方法であって、前記植物または種と請求項 1 ~ 3 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を接触させることを含む方法。

【請求項 5 9】

植物の内部または表面で真菌疾患または障害を処置または予防する方法であって、前記植物または種と請求項 1 ~ 3 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を接触させることを含む方法。

【請求項 6 0】

植物の内部または表面で真菌の増殖を処置または予防する方法であって、前記植物または種と請求項 1 ~ 3 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を接触させることを含む方法。

【請求項 6 1】

植物の内部または表面で微生物を阻害する方法であって、前記植物または種と請求項 1 ~ 3 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を接触させることを含む方法。

【請求項 6 2】

エポキシコナゾール (e p o x y c o n a z o l e)、テブコナゾール、フルキンコナゾール、フルトリアホル、メトコナゾール、ミクロブタニル、シプロコナゾール (c y c p r o c o n a z o l e)、プロチオコナゾールおよびプロビコナゾールから選択されるアゾール殺真菌剤をさらに含む、請求項 5 6 に記載の組成物。

【請求項 6 3】

トリフロキシストロビン、ピラクロストロビン、オリサストロビン、フルオキサストロビン (f l u o x a s t r o b i n) およびアゾキシストロビンの群由来のストロビルリン殺真菌剤をさらに含む、請求項 5 6 に記載の組成物。

【請求項 6 4】

請求項 1 に記載の化合物および薬学的に許容可能なキャリアーを含む組成物。

【請求項 6 5】

追加的な治療剤をさらに含む、請求項 6 4 に記載の組成物。

【請求項 6 6】

抗癌剤、抗真菌剤、心血管治療薬、抗炎症剤、化学療法剤、血管新生阻害剤、細胞傷害性薬物、抗増殖剤、代謝疾患薬剤、眼疾患薬剤 (o p t h a l m o l o g i c d i s e a s e a g e n t)、中枢神経系 (C N S) 疾患薬剤、泌尿器疾患薬剤、または胃腸疾患薬剤である追加的な治療剤をさらに含む、請求項 6 4 に記載の組成物。