

【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9月28日 (2017.9.28)

【公表番号】特表2016-535758(P2016-535758A)

【公表日】平成28年11月17日 (2016.11.17)

【年通号数】公開・登録公報2016-064

【出願番号】特願2016-534884(P2016-534884)

【国際特許分類】

C 0 7 C 259/06 (2006.01)

C 0 7 D 231/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/166 (2006.01)

A 6 1 K 31/165 (2006.01)

A 6 1 K 31/16 (2006.01)

A 6 1 K 31/495 (2006.01)

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

A 6 1 K 31/5375 (2006.01)

A 6 1 K 31/4412 (2006.01)

C 0 7 C 317/28 (2006.01)

C 1 2 Q 1/44 (2006.01)

C 1 2 N 15/09 (2006.01)

C 1 2 N 9/18 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 259/06

C 0 7 D 231/12 C S P A

A 6 1 P 31/04 Z N A

A 6 1 K 31/166

A 6 1 K 31/165

A 6 1 K 31/16

A 6 1 K 31/495

A 6 1 K 31/445

A 6 1 K 31/5375

A 6 1 K 31/4412

C 0 7 C 317/28

C 1 2 Q 1/44

C 1 2 N 15/00 A

C 1 2 N 9/18

【手続補正書】

【提出日】平成29年8月18日 (2017.8.18)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

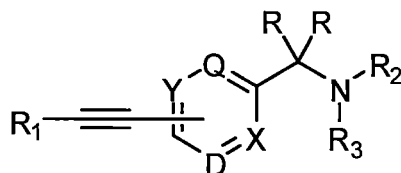
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式：

【化 1】



の化合物、又は、その医薬的に許容される塩であって、ここで、

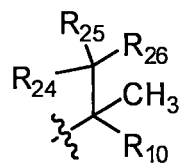
Q、Y、D、及びXは、独立してCH又は窒素を表わし、ただし、Q、Y、D、及びXの少なくとも2つはCHであり；

各Rは、独立して水素又はC₁～C₆アルキルであるか、又は2つのR基は=Oを形成し；

R₁は、-C(C₁～C₆アルキル)₂-R₄、R₆で任意に置換されたアリール、R₆で任意に置換されたヘテロアリール、又はR₆で任意に置換されたヘテロシクリルであり；

R₂は、

【化 2】



であり；

R₃は、水素又はC₁～C₆アルキルであり；

R₄は、R₇で任意に置換されたC₁～C₆アルキル、R₈で任意に置換されたアリール、R₈で任意に置換されたヘテロアリール、又はR₈で任意に置換されたヘテロシクリルであり；

各R₅は、独立して水素又はC₁～C₆アルキルであり；

各R₆は、ハロゲン、-NO₂、-CN、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、-NH₂、-NH(C₁～C₆アルキル)、-N(C₁～C₆アルキル)₂、-OH、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、アリール、アリール(C₁～C₆アルキル)、ヘテロアリール、ヘテロアリール(C₁～C₆アルキル)、ヘテロシクリル、及びヘテロシクリル(C₁～C₆アルキル)からなる群から独立して選択され、ここで、各アルキル、アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリル部分は、1つ以上のR₁₂で任意に置換され；

各R₇は、ハロゲン、-NH₂、-NH(C₁～C₆アルキル)、-N(C₁～C₆アルキル)₂、-OH、C₁～C₆アルコキシ、及びC₁～C₆ハロアルコキシからなる群から独立して選択され；

各R₈は、ハロゲン、-NO₂、-CN、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、-NH₂、-NH(C₁～C₆アルキル)、-N(C₁～C₆アルキル)₂、-OH、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、-SH、-S(C₁～C₆アルキル)、オキシ、ヒドロキシ(C₁～C₆アルキル)、アルコキシ(C₁～C₆アルキル)、アミノ(C₁～C₆アルキル)、-CH₂-NH(C₁～C₆アルキル)、-CH₂-N(C₁～C₆アルキル)₂、-CONH₂、-CON(C₁～C₆アルキル)、-CON(C₁～C₆アルキル)₂、-CONH-OH、-CONH-NH₂、-COH、-CO₂H、-CO₂(C₁～C₆アルキル)、-OCO(C₁～C₆アルキル)、-NHCO(C₁～C₆アルコキシ)、-NHCO(C₁～C₆アルキル)、-NHCONH₂、-NHCONH(C₁～C₆アルキル)、-NHC(

= NH)NH₂、-NH-S(O)₀₋₂-(C₁~C₆アルキル)、-NH-S(O)₀₋₂-アリール、-NH-S(O)₀₋₂-ヘテロアリール、アリール(C₁~C₆アルキル)、ヘテロアリール(C₁~C₆アルキル)、ヘテロシクリル(C₁~C₆アルキル)、-CH₂-NHCONH₂、-CH₂NHCONH(C₁~C₆アルキル)、及び-CH₂-OCO(C₁~C₆アルキル)からなる群から独立して選択され；

R₁₀は、-CONH₂、-CON(C₁~C₆アルキル)、-CON(C₁~C₆アルキル)₂、-CONH-OH、-CONH-NH₂、-CO₂H、又は-CO₂(C₁~C₆アルキル)であり；

各 R₁₂は、ハロゲン、-NO₂、-CN、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、-NH₂、-NH(C₁~C₆アルキル)、-N(C₁~C₆アルキル)₂、-OH、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、-SH、-S(C₁~C₆アルキル)、オキソ、ヒドロキシ(C₁~C₆アルキル)、アルコキシ(C₁~C₆アルキル)、アミノ(C₁~C₆アルキル)、-CONH₂、-CON(C₁~C₆アルキル)、-CON(C₁~C₆アルキル)₂、-CONH-OH、-CONH-NH₂、-COH、-CO₂H、-CO₂(C₁~C₆アルキル)、-OCO(C₁~C₆アルキル)、-NHCO(C₁~C₆アルコキシ)、-NHCO(C₁~C₆アルキル)、-NHCONH₂、-NHCONH(C₁~C₆アルキル)、-NHC(=NH)NH₂、-NH-S(O)₀₋₂-(C₁~C₆アルキル)、-NH-S(O)₀₋₂-アリール、及び-NH-S(O)₀₋₂-ヘテロアリールからなる群から独立して選択され、

R₂₄が、水素、ハロゲン、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、-NH₂、-NH(C₁~C₆アルキル)、-N(C₁~C₆アルキル)₂、-OH、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、-SH、-S(C₁~C₆アルキル)、ヒドロキシ(C₁~C₆アルキル)、アルコキシ(C₁~C₆アルキル)、アミノ(C₁~C₆アルキル)、-NHCO(C₁~C₆アルキル)、-NHCONH₂、-NHCONH(C₁~C₆アルキル)、-OCO(C₁~C₆アルキル)、及び-NHCO(C₁~C₆アルコキシ)からなる群から選択され；

R₂₅が、水素、ハロゲン、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、-NH₂、-NH(C₁~C₆アルキル)、-N(C₁~C₆アルキル)₂、-OH、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、-SH、-S(C₁~C₆アルキル)、ヒドロキシ(C₁~C₆アルキル)、アルコキシ(C₁~C₆アルキル)、及びアミノ(C₁~C₆アルキル)からなる群から選択され；

R₂₆が、C₁~C₆アルキル又はC₁~C₆ハロアルキルである、上記化合物又はその医薬的に許容される塩。

【請求項 2】

R₂₆がC₁ハロアルキルであるか、R₂₆が-CH₂F、-CHF₂、又は-CF₃であるか、R₂₆が-CHF₂であるか、R₂₆がC₁~C₆アルキルであるか、あるいは、R₂₆がメチルである、請求項 1 に記載の化合物。

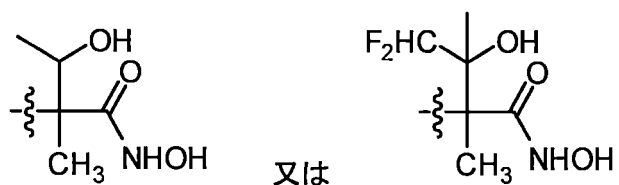
【請求項 3】

R₂₅が水素、ハロゲン、C₁~C₆アルキル、又はC₁~C₆ハロアルキルであるか、R₂₅が水素又はC₁~C₆アルキルであるか、R₂₅が水素であるか。R₂₅がC₁~C₆アルキルであるか、あるいは、R₂₅がメチルである、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R₂が、式：

【化 3】



である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

R 基が = O を形成する、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

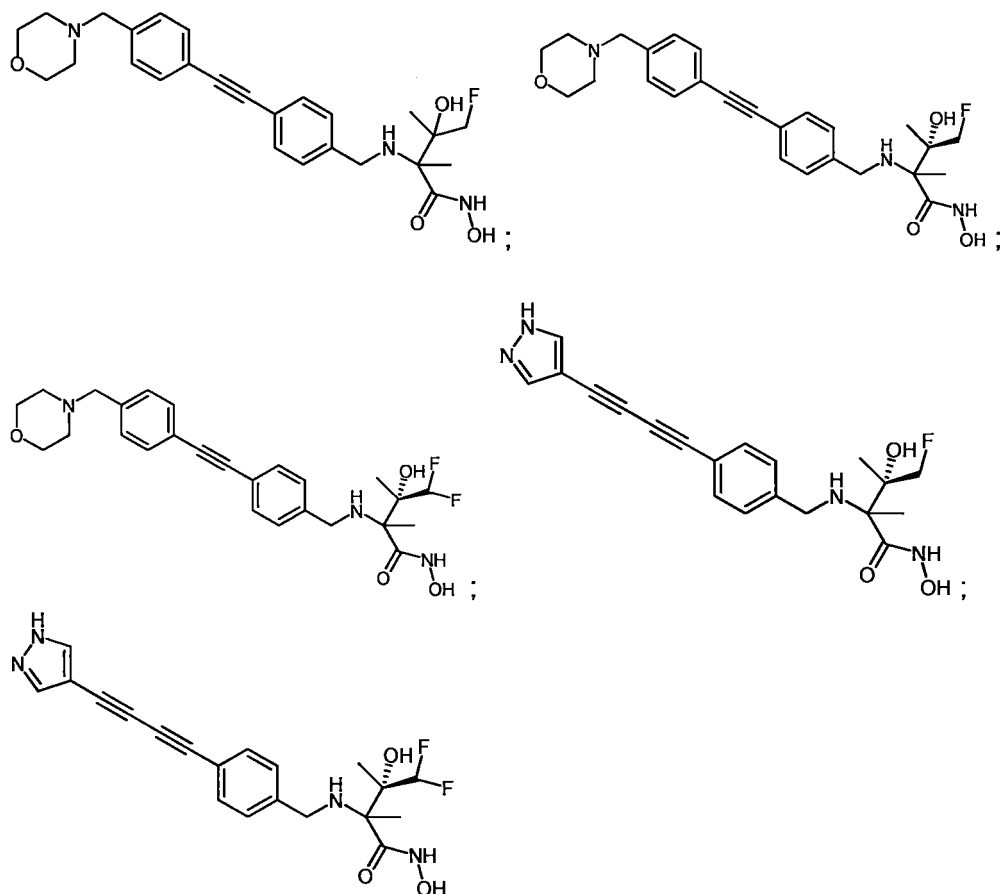
【請求項 6】

R₁ が - C - C - R₄ である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7】

4 - ((4 - アミノフェニル) ブタ - 1 , 3 - ジイニル) - N - (3 - ヒドロキシ - 1 - (ヒドロキシアミノ) - 2 - メチル - 1 - オキソブタン - 2 - イル) ベンズアミド ; N - (4 , 4 - ジフルオロ - 3 - ヒドロキシ - 1 - (ヒドロキシアミノ) - 2 , 3 - ジメチル - 1 - オキソブタン - 2 - イル) - 4 - ((4 - (モルホリノメチル) フェニル) エチニル) ベンズアミド、

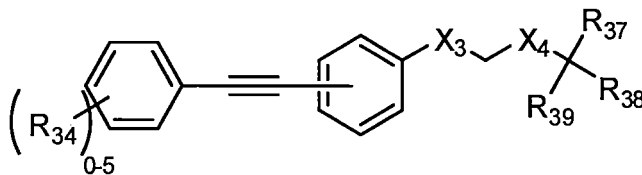
【化 4】



である、請求項 1 に記載の化合物、又はその医薬的に許容される塩。

【請求項 8】

式：
【化 5】



の化合物、又は、その医薬的に許容される塩であって、ここで、

X_3 は、 $-CH_2-$ 、 $-(CH_2)_2-$ 、 $-(CH_2)_3-$ 、 $-C(O)NH_2-$ 、又は $-C(O)NH_2-CH_2-$ を表わし；

X_4 は、 CH 又は NR_{33} を表わし；

R_{33} は、水素又は $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

各 R_{34} は、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-SH$ 、 $-S(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、オキソ、ヒドロキシ ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、アルコキシ ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、アミノ ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-CONH_2$ 、 $-CON(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-CON(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、 $-CONH-OH$ 、 $-CONH-NH_2$ 、 $-COH$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-NHCO(C_1 \sim C_6 \text{ アルコキシ})$ 、 $-NHCO(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-NHCONH_2$ 、 $-NHCONH(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-NHC(=NH)NH_2$ 、 $-NH-S(O)_{0-2}(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-NH-S(O)_{0-2}$ -アリール、 $-NH-S(O)_{0-2}$ -ヘテロアリール、アリール ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、ヘテロアリール、ヘテロアリール ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、ヘテロシクリル、及びヘテロシクリル ($C_1 \sim C_6$ アルキル) からなる群から独立して選択され、ここで、各アルキル、アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリル部分は、1つ以上の R_{35} で任意に置換され；

R_{37} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $-S(O)_2-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ であり、ここで、各アルキル部分は1つ以上の R_{35} で任意に置換され；

R_{38} は、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、オキソ、 $-CONH_2$ 、 $-CON(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-CON(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、 $-CONH-OH$ 、 $-CONH-NH_2$ 、 $-CO_2H$ 、及び $-CO_2(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ からなる群から独立して選択され；

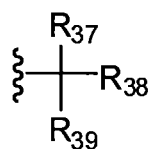
R_{39} は、水素又は $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

各 R_{35} は、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-SH$ 、 $-S(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、オキソ、ヒドロキシ ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、アルコキシ ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、アミノ ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-CONH_2$ 、 $-CON(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-CON(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})_2$ 、 $-CONH-OH$ 、 $-CONH-NH_2$ 、 $-COH$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-NHCO(C_1 \sim C_6 \text{ アルコキシ})$ 、 $-NHCO(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-NHCONH_2$ 、 $-NHCONH(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-NHC(=NH)NH_2$ 、 $-NH-S(O)_{0-2}(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-NH-S(O)_{0-2}$ -アリール、及び $-NH-S(O)_{0-2}$ -ヘテロアリールからなる群から独立して選択される、上記化合物又はその医薬的に許容される塩。

【請求項 9】

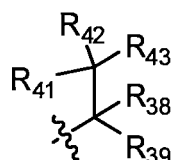
請求項 8 に記載の化合物であって、

【化 6】



部分が、式：

【化 7】



であり、ここで

R_{41} が、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})_2$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-SH$ 、 $-S(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、ヒドロキシ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、アルコキシ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、アミノ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-NHCO(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-NHCONH_2$ 、 $-NHCONH(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、及び $-NHCO(C_1 \sim C_6 \text{アルコキシ})$ からなる群から選択され；

R_{42} が、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})_2$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-SH$ 、 $-S(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、ヒドロキシ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、アルコキシ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、及びアミノ($C_1 \sim C_6$ アルキル)からなる群から選択され；

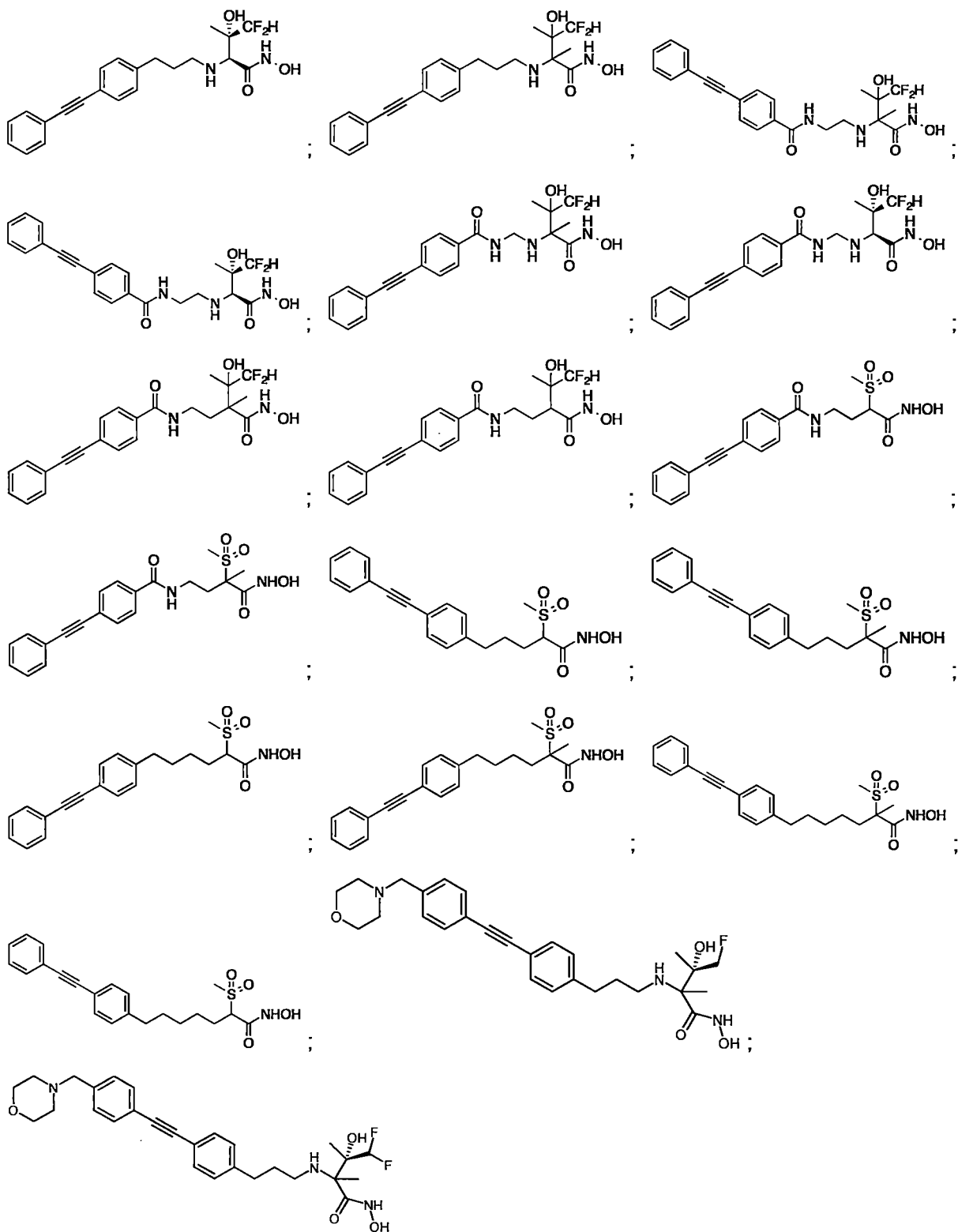
R_{43} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであり；

R_{36} が、 $-CONH_2$ 、 $-CON(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-CON(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})_2$ 、 $-CONH-OH$ 、 $-CONH-NH_2$ 、 $-CO_2H$ 、又は $-CO_2(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ であり；

R_{38} が、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである、上記化合物。

【請求項 10】

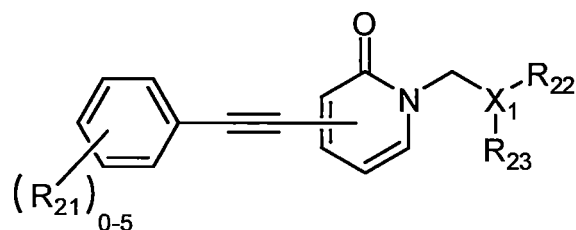
【化 8】



である請求項 8 に記載の化合物、又はその医薬的に許容される塩。

【請求項 11】

【化 9】



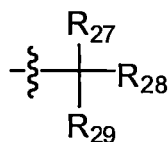
の化合物、又はその医薬的に許容される塩であって、ここで、

X_1 はCH又はNを表わし、

各 R_{21} は、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})_2$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、及び $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシからなる群から独立して選択され；

R_{22} は、

【化 10】



であり；

R_{23} は、水素又は $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

R_{27} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $-S(O)_2-(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ であり、ここで、各アルキルは、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})_2$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-SH$ 、 $-S(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、オキソ、ヒドロキシ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、アルコキシ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、アミノ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-CONH_2$ 、 $-CON(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-CON(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})_2$ 、 $-CONH-OH$ 、 $-CONH-NH_2$ 、 $-COH$ 、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-OCO(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-NHCO(C_1 \sim C_6 \text{アルコキシ})$ 、 $-NHCO(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-NHCONH_2$ 、 $-NHCONH(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-NHC(=NH)NH_2$ 、 $-NH-S(O)_{0-2}-(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-NH-S(O)_{0-2}$ -アリール、及び $-NH-S(O)_{0-2}$ -ヘテロアリールからなる群から独立して選択される1つ以上の基で任意に置換され；

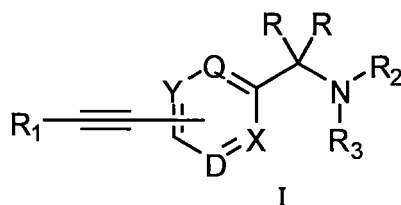
R_{28} は、ハロゲン、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-N(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})_2$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、オキソ、 $-CONH_2$ 、 $-CON(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $-CON(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})_2$ 、 $-CONH-OH$ 、 $-CONH-NH_2$ 、 $-CO_2H$ 、及び $-CO_2(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ からなる群から独立して選択され；

R_{29} は、水素又は $C_1 \sim C_6$ アルキルである、上記化合物、又はその医薬的に許容される塩。

【請求項 12】

式：

【化 1 1】



の化合物、又はその医薬的に許容される塩であって、ここで、

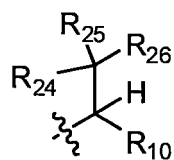
Q、Y、D、及びXは、独立してCH又は窒素を表わし、ただし、Q、Y、D、及びXの少なくとも2つはCHであり；

各Rは、独立して水素又はC₁～C₆アルキルであるか、又は2つのR基は=Oを形成し；

R₁は-C≡C-R₄、又はR₆で任意に置換されたアリールであり；

R₂は、

【化 1 2】



であり；

R₃は、水素又はC₁～C₆アルキルであり；

R₄は、1つ以上のR₁₂で任意に置換されたヘテロシクリル(C₁～C₆アルキル)であり；

各R₅は、独立して水素又はC₁～C₆アルキルであり；

各R₆は、アリール、アリール(C₁～C₆アルキル)、ヘテロアリール、ヘテロアリール(C₁～C₆アルキル)、ヘテロシクリル、及びヘテロシクリル(C₁～C₆アルキル)からなる群から独立して選択され、ここで、各アルキル、アリール、ヘテロアリール、又はヘテロシクリル部分は、1つ以上のR₁₂で任意に置換され；

R₁₀は、-CONH₂、-CON(C₁～C₆アルキル)、-CON(C₁～C₆アルキル)₂、-CONH-OH、-CONH-NH₂、-CO₂H、又は-CO₂(C₁～C₆アルキル)であり；

各R₁₂は、ハロゲン、-NO₂、-CN、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、-NH₂、-NH(C₁～C₆アルキル)、-N(C₁～C₆アルキル)₂、-OH、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、-SH、-S(C₁～C₆アルキル)、オキソ、ヒドロキシ(C₁～C₆アルキル)、アルコキシ(C₁～C₆アルキル)、アミノ(C₁～C₆アルキル)、-CONH₂、-CON(C₁～C₆アルキル)、-CON(C₁～C₆アルキル)₂、-CONH-OH、-CONH-NH₂、-COH、-CO₂H、-CO₂(C₁～C₆アルキル)、-OCO(C₁～C₆アルキル)、-NHCO(C₁～C₆アルコキシ)、-NHCO(C₁～C₆アルキル)、-NHCONH₂、-NHCONH(C₁～C₆アルキル)、-NHC(=NH)NH₂、-NH-S(O)₀₋₂-(C₁～C₆アルキル)、-NH-S(O)₀₋₂-アリール、及び-NH-S(O)₀₋₂-ヘテロアリールからなる群から独立して選択され；

R₂₄は、水素、ハロゲン、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、-NH₂、-NH(C₁～C₆アルキル)、-N(C₁～C₆アルキル)₂、-OH、C₁～C₆アルコキシ、

$C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-SH$ 、 $-S(C_1 \sim C_6$ アルキル)、ヒドロキシ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、アルコキシ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、アミノ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-NHCO$ ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-NHCONH_2$ 、 $-NHCONH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-OCO(C_1 \sim C_6$ アルキル)、及び $-NHCO(C_1 \sim C_6$ アルコキシ)からなる群から選択され；

R_{25} は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $-N(C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$ 、 $-OH$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $-SH$ 、 $-S(C_1 \sim C_6$ アルキル)、ヒドロキシ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、アルコキシ($C_1 \sim C_6$ アルキル)、及びアミノ($C_1 \sim C_6$ アルキル)からなる群から選択され；

R_{26} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであり；

ただし、この化合物は、

$N-(4,4\text{-ジフルオロ}-3\text{-ヒドロキシ}-1\text{-(ヒドロキシアミノ)}-3\text{-メチル}-1\text{-オキソブタン}-2\text{-イル})-4\text{-(4-(モルホリノメチル)フェニル)エチニル}$ ベンズアミド；

$N-(4,4\text{-ジフルオロ}-1\text{-(ヒドロキシアミノ)}-3\text{-メトキシ}-3\text{-メチル}-1\text{-オキソブタン}-2\text{-イル})-4\text{-(4-(モルホリノメチル)フェニル)エチニル}$ ベンズアミド；

$N-(3\text{-アミノ}-4,4\text{-ジフルオロ}-1\text{-(ヒドロキシアミノ)}-3\text{-メチル}-1\text{-オキソブタン}-2\text{-イル})-4\text{-(4-(モルホリノメチル)フェニル)エチニル}$ ベンズアミド；

$N-(3\text{-アセトアミド}-4,4\text{-ジフルオロ}-1\text{-(ヒドロキシアミノ)}-3\text{-メチル}-1\text{-オキソブタン}-2\text{-イル})-4\text{-(4-(モルホリノメチル)フェニル)エチニル}$ ベンズアミド；及び

$N-(4,4\text{-ジフルオロ}-1\text{-(ヒドロキシアミノ)}-3\text{-メチル}-3\text{-(3-メチルウレイド)}-1\text{-オキソブタン}-2\text{-イル})-4\text{-(4-(モルホリノメチル)フェニル)エチニル}$ ベンズアミド、ではない、上記化合物、又はその医薬的に許容される塩。

【請求項 13】

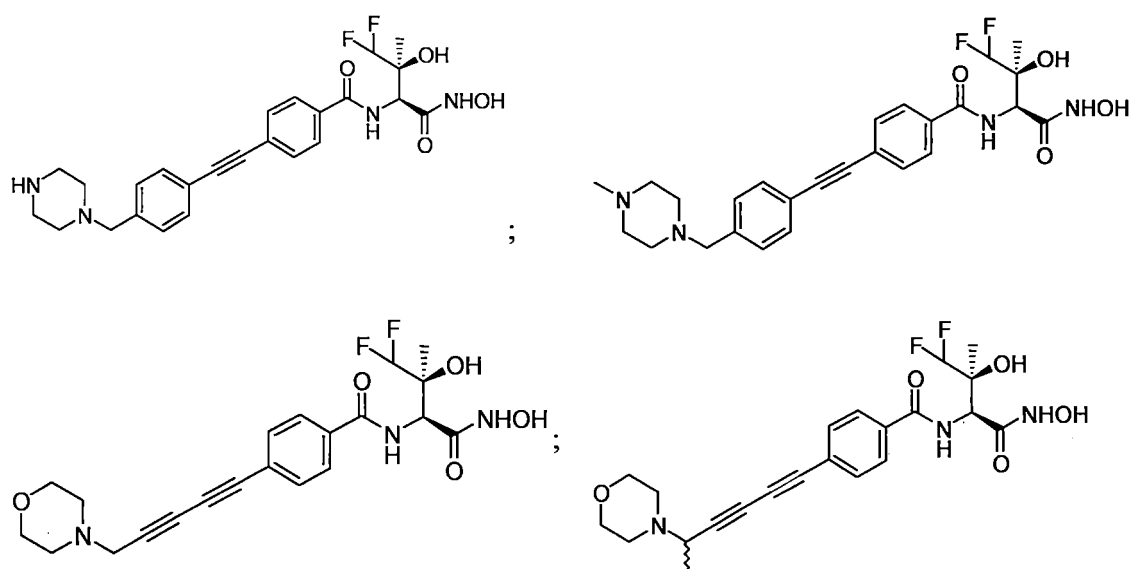
R_{26} が C_1 ハロアルキルであるか、 R_{26} が $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、又は $-CF_3$ であるか、 R_{26} が $-CHF_2$ であるか、 R_{26} が $C_1 \sim C_6$ アルキルであるか、あるいは、 R_{26} がメチルである、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 14】

R_{25} が水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであるか、 R_{25} が水素又は $C_1 \sim C_6$ アルキルであるか、 R_{25} が水素であるか、 R_{25} が $C_1 \sim C_6$ アルキルであるか、あるいは、 R_{25} がメチルである、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 15】

【化 1 3】



である、請求項 1 2 に記載の化合物、又はその医薬的に許容される塩。

【請求項 1 6】

請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の化合物と、医薬的に許容される担体、溶媒、補助剤、又は希釈剤とを含む医薬組成物。

【請求項 1 7】

請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の 1 つ以上の化合物の有効量を含むグラム陰性細菌感染症を治療するための医薬組成物であって、かかる治療の必要な対象に投与される、医薬組成物。

【請求項 1 8】

グラム陰性細菌は、緑膿菌 (*Pseudomonas aeruginosa*)、ステノトロホモナス・マルトフィリア (*Stenotrophomonas maltophilia*)、バークホルデリア・セパシア (*Burkholderia cepacia*)、アルカリゲネス・キシロースオキシダンス (*Alcaligenes xylosoxidans*)、アシネトバクター (*Acinetobacter*)、腸内細菌科 (*Enterobacteriaceae*)、ヘモフィルス (*Haemophilus*)、ナイセリア種 (*Neisseria species*)、野兔病菌 (*Francisella tularensis*)、ペスト菌 (*Yersinia pestis*)、バークホルデリア痘菌 (*Burkholderia pseudomallei*)、バークホルデリア・マレイ (*Burkholderia mallei*)、リケッチア・プロワツェキイ (*Rickettsia prowazekii*)、Q 熱リケッチア (*Coxiella burnetii*)、カンピロバクター・ジェジュニ (*Campylobacter jejuni*)、赤痢菌 (*Shigella*)、モラクセラ・カタラーリス (*Moraxella catarrhalis*)、又はクラミジア・トラコマチス (*Chlamydia trachomatis*) である、請求項 1 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

腸内細菌は、セラチア (*Serratia*)、プロテウス (*Proteus*)、クレブシエラ (*Klebsiella*)、エンテロバクター (*Enterobacter*)、シトロバクター (*Citrobacter*)、サルモネラ (*Salmonella*)、プロビデンシア (*Providencia*)、モルガネラ (*Morganella*)、セデセア (*Cedecea*)、エドワードシエラ (*Edwardsiella*)、大腸菌 (*Escherichia coli*)、エンテロバクター・クロアカエ (*Enterobacter cloacae*)、及びエンテロバクター・アエロゲネス (*Enterobacter aerogenes*) からなる群から選択される、請求項 1 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 0】

請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の 1 つ以上の化合物の有効量を含むグラム陰性細菌中のデアセチラーゼ酵素を阻害するための医薬組成物であって、グラム陰性細菌感染症

の治療に必要な対象に投与される、医薬組成物。

【請求項 2 1】

デアセチラーゼ酵素はLpxCである、請求項2 0に記載の医薬組成物。