

【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 07 C	259/06	(2006.01)
C 07 D	231/12	(2006.01)
A 61 P	31/04	(2006.01)
A 61 K	31/166	(2006.01)
A 61 K	31/165	(2006.01)
A 61 K	31/16	(2006.01)
A 61 K	31/495	(2006.01)
A 61 K	31/445	(2006.01)
A 61 K	31/5375	(2006.01)
A 61 K	31/4412	(2006.01)
C 07 C	317/28	(2006.01)
C 12 Q	1/44	(2006.01)
C 12 N	15/09	(2006.01)
C 12 N	9/18	(2006.01)

【F I】

C 07 C	259/06	
C 07 D	231/12	C S P A
A 61 P	31/04	Z N A
A 61 K	31/166	
A 61 K	31/165	
A 61 K	31/16	
A 61 K	31/495	
A 61 K	31/445	
A 61 K	31/5375	
A 61 K	31/4412	
C 07 C	317/28	
C 12 Q	1/44	
C 12 N	15/00	A
C 12 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

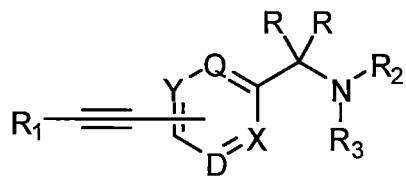
【補正の内容】

【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、

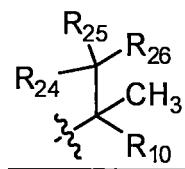
Q、Y、D、及びXは、独立してCH又は窒素を表わし、ただし、Q、Y、D、及びXの少なくとも2つはCHであり；

各Rは、独立して水素又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであるか、又は2つのR基は=Oを形成し；

R<sub>1</sub>は、-C-C-R<sub>4</sub>、R<sub>6</sub>で任意に置換されたアリール、R<sub>6</sub>で任意に置換されたヘテロアリール、又はR<sub>6</sub>で任意に置換されたヘテロシクリルであり；

R<sub>2</sub>は、

## 【化2】



であり；

R<sub>3</sub>は、水素又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであり；

R<sub>4</sub>は、R<sub>7</sub>で任意に置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、R<sub>8</sub>で任意に置換されたアリール、R<sub>8</sub>で任意に置換されたヘテロアリール、又はR<sub>8</sub>で任意に置換されたヘテロシクリルであり；

各R<sub>5</sub>は、独立して水素又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであり；

各R<sub>6</sub>は、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-CN、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-OH、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、アリール、アリール(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、ヘテロアリール、ヘテロアリール(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、ヘテロシクリル、及びヘテロシクリル(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>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<sub>12</sub>で任意に置換され；

各R<sub>7</sub>は、ハロゲン、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-OH、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ、及びC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシからなる群から独立して選択され；

各R<sub>8</sub>は、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-CN、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-OH、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、-SH、-S(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、オキソ、ヒドロキシ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、アルコキシ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、アミノ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-CH<sub>2</sub>-NH(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-CH<sub>2</sub>-N(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-CONH<sub>2</sub>、-CON(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-CON(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-CONH-OH、-CONH-NH<sub>2</sub>、-COH、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-OCO(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-NHC(O(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル))、-NHCONH<sub>2</sub>、-NHCONH(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-NHC(

$= \text{NH}$ )  $\text{NH}_2$ 、 $- \text{NH} - \text{S}(\text{O})_{0-2-} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、 $- \text{NH} - \text{S}(\text{O})_{0-2-} \text{アリール}$ 、 $- \text{NH} - \text{S}(\text{O})_{0-2-} \text{ヘテロアリール}$ 、 $\text{アリール} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、 $\text{ヘテロアリール} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、 $\text{ヘテロシクリル} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、 $- \text{CH}_2 - \text{NHCONH}_2$ 、 $- \text{CH}_2 \text{NHCONH} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、及び $- \text{CH}_2 - \text{OCO} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ からなる群から独立して選択され；

$\text{R}_{10}$ は、 $- \text{CONH}_2$ 、 $- \text{CON} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、 $- \text{CON} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})_2$ 、 $- \text{CONH} - \text{OH}$ 、 $- \text{CONH} - \text{NH}_2$ 、 $- \text{CO}_2\text{H}$ 、又は $- \text{CO}_2 (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ であり；

各  $\text{R}_{12}$  は、ハロゲン、 $- \text{NO}_2$ 、 $- \text{CN}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ハロアルキル}$ 、 $- \text{NH}_2$ 、 $- \text{NH} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、 $- \text{N} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})_2$ 、 $- \text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルコキシ}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ハロアルコキシ}$ 、 $- \text{SH}$ 、 $- \text{S} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、オキソ、ヒドロキシ ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$ )、アルコキシ ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$ )、アミノ ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$ )、 $- \text{CONH}_2$ 、 $- \text{CON} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、 $- \text{CON} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})_2$ 、 $- \text{CONH} - \text{OH}$ 、 $- \text{CONH} - \text{NH}_2$ 、 $- \text{COH}$ 、 $- \text{CO}_2\text{H}$ 、 $- \text{CO}_2 (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、 $- \text{OCO} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、 $- \text{NHCO} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルコキシ})$ 、 $- \text{NHCO} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、 $- \text{NHCO} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})_2$ 、 $- \text{NHCONH}_2$ 、 $- \text{NHCONH} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、 $- \text{NH} - \text{S}(\text{O})_{0-2-} \text{アリール}$ 、及び $- \text{NH} - \text{S}(\text{O})_{0-2-} \text{ヘテロアリール}$ からなる群から独立して選択され、

$\text{R}_{24}$  が、水素、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ハロアルキル}$ 、 $- \text{NH}_2$ 、 $- \text{NH} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、 $- \text{N} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})_2$ 、 $- \text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルコキシ}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ハロアルコキシ}$ 、 $- \text{SH}$ 、 $- \text{S} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、ヒドロキシ ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$ )、アルコキシ ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$ )、アミノ ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$ )、 $- \text{NHCO} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、 $- \text{NHCONH}_2$ 、 $- \text{NHCONH} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、 $- \text{OCO} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、及び $- \text{NHCO} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルコキシ})$  からなる群から選択され；

$\text{R}_{25}$  が、水素、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ハロアルキル}$ 、 $- \text{NH}_2$ 、 $- \text{NH} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、 $- \text{N} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})_2$ 、 $- \text{OH}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルコキシ}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ハロアルコキシ}$ 、 $- \text{SH}$ 、 $- \text{S} (\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、ヒドロキシ ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$ )、アルコキシ ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$ )、及びアミノ ( $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$ ) からなる群から選択され；

$\text{R}_{26}$  が、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$  又は  $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ハロアルキル}$  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】

$\text{R}_{26}$  が  $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ハロアルキル}$  であるか、 $\text{R}_{26}$  が  $- \text{CH}_2\text{F}$ 、 $- \text{CHF}_2$ 、又は  $- \text{CF}_3$  であるか、 $\text{R}_{26}$  が  $- \text{CHF}_2$  であるか、 $\text{R}_{26}$  が  $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$  であるか、あるいは、 $\text{R}_{26}$  がメチルである、請求項 1 に記載の化合物。

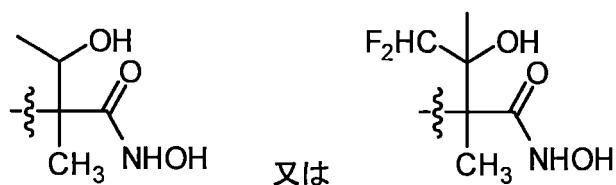
#### 【請求項 3】

$\text{R}_{25}$  が水素、ハロゲン、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$ 、又は  $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ハロアルキル}$  であるか、 $\text{R}_{25}$  が水素又は  $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$  であるか、 $\text{R}_{25}$  が水素であるか。 $\text{R}_{25}$  が  $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$  であるか、あるいは、 $\text{R}_{25}$  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】

$\text{R}_2$  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。

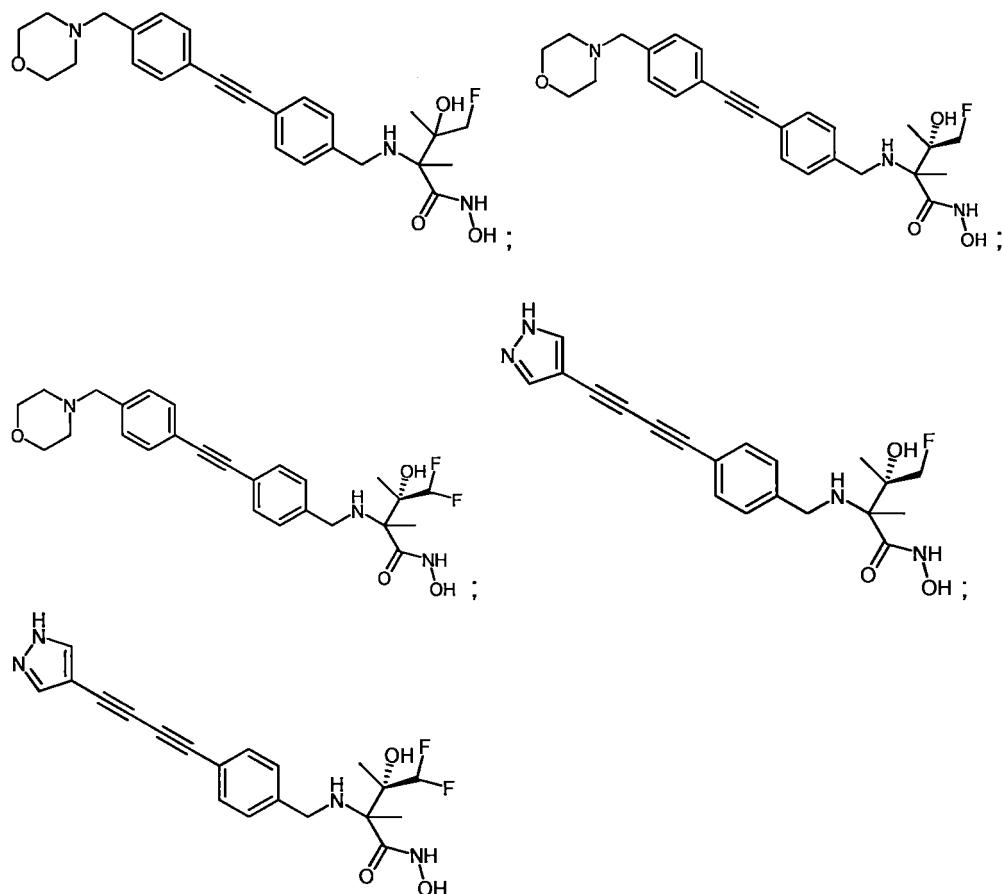
【請求項6】

R<sub>1</sub>が-C-C-R<sub>4</sub>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、

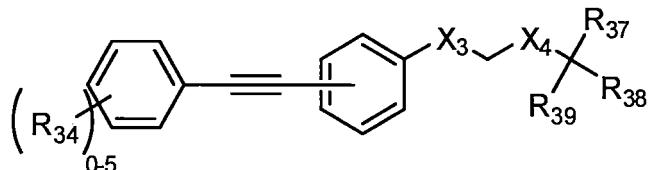
【化4】



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<sub>3</sub>は、-CH<sub>2</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-、-C(O)NH<sub>2</sub>-、又は-C(O)NH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-を表わし；

X<sub>4</sub>は、CH又はNR<sub>33</sub>を表わし；

R<sub>33</sub>は、水素又はC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルであり；

各R<sub>34</sub>は、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-CN、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-OH、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、-SH、-S(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、オキソ、ヒドロキシ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、アルコキシ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、アミノ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-CONH<sub>2</sub>、-CON(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-CON(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-CONH-OH、-CONH-NH<sub>2</sub>、-COH、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-OCO(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-NHC(O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ)、-NHC(O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-NHCONH<sub>2</sub>、-NHCONH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-NHCO(NH)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-NH-S(O)<sub>0-2</sub>-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-NH-S(O)<sub>0-2</sub>-アリール、-NH-S(O)<sub>0-2</sub>-ヘテロアリール、アリール(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、ヘテロアリール、ヘテロアリール(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、ヘテロシクリル、及びヘテロシクリル(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>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<sub>35</sub>で任意に置換され；

R<sub>37</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル又は-S(O)<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)であり、ここで、各アルキル部分は1つ以上のR<sub>35</sub>で任意に置換され；

R<sub>38</sub>は、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-CN、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-OH、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、オキソ、-CONH<sub>2</sub>、-CON(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-CON(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-CONH-OH、-CONH-NH<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>H、及び-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)からなる群から独立して選択され；

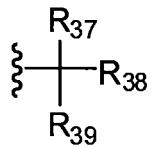
R<sub>39</sub>は、水素又はC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルであり；

各R<sub>35</sub>は、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-CN、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-OH、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、-SH、-S(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、オキソ、ヒドロキシ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、アルコキシ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、アミノ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-CONH<sub>2</sub>、-CON(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-CON(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-CONH-OH、-CONH-NH<sub>2</sub>、-COH、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-OCO(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-NHC(O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ)、-NHC(O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-NHCONH<sub>2</sub>、-NHCONH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-NHCO(NH)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-NH-S(O)<sub>0-2</sub>-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-NH-S(O)<sub>0-2</sub>-アリール、及び-NH-S(O)<sub>0-2</sub>-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】

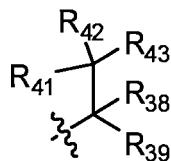
請求項8に記載の化合物であって、

【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、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6$ 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)、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)、 $-O$ CO( $C_1 \sim C_6$ 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；

$R_{42}$ 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、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1 \sim C_6$ 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；

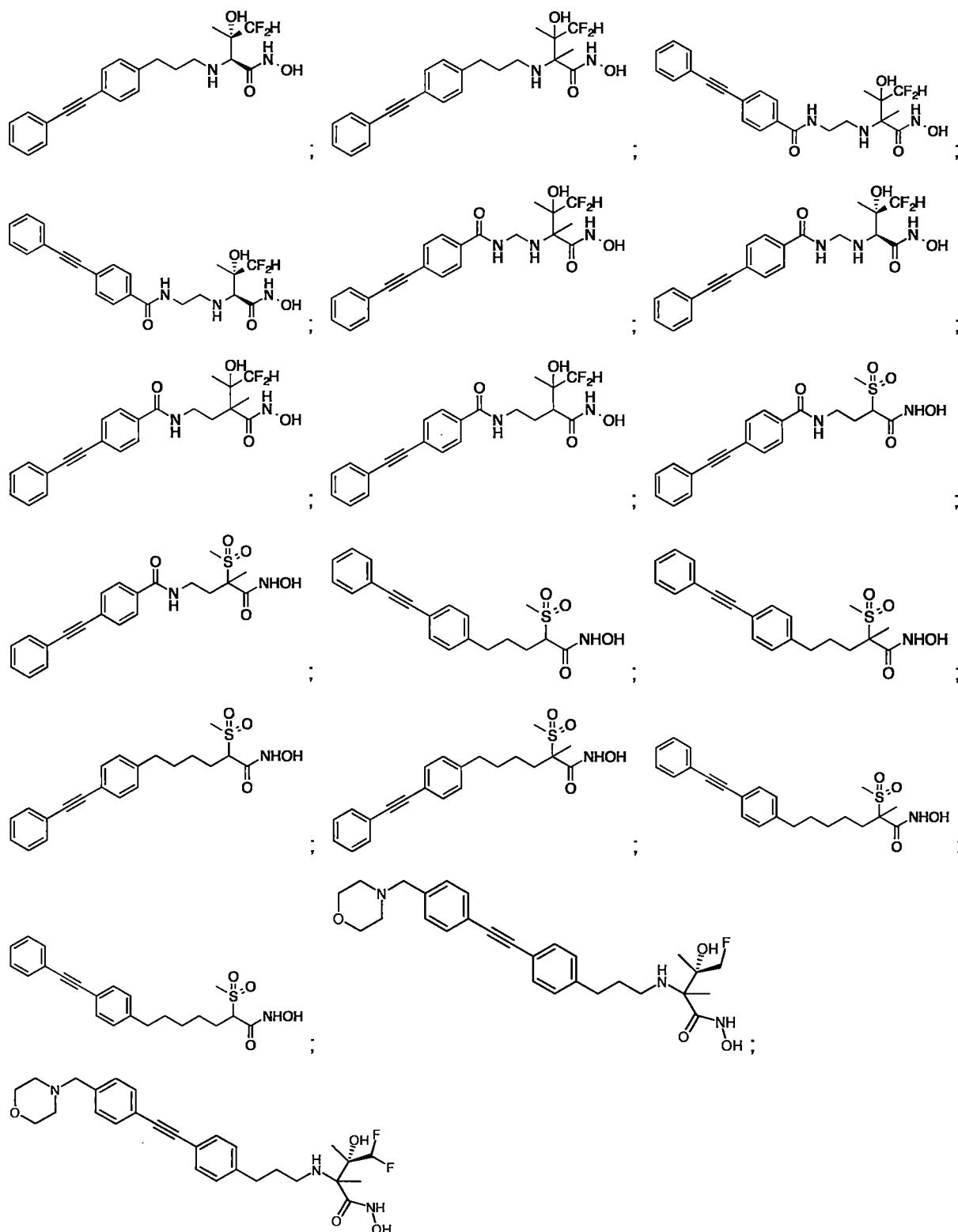
$R_{43}$ が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであり；

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

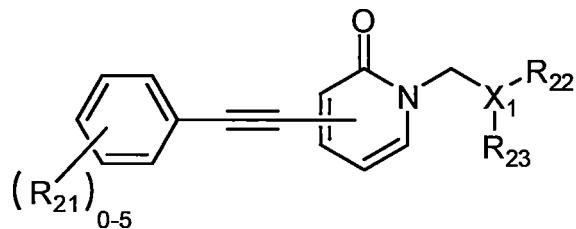
【化 8】



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】



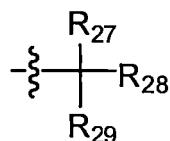
の化合物、又はその医薬的に許容される塩であって、ここで、

X<sub>1</sub>はC H又はNを表わし、

各R<sub>21</sub>は、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-CN、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-OH、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、及びC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシからなる群から独立して選択され；

R<sub>22</sub>は、

【化10】



であり；

R<sub>23</sub>は、水素又はC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキルであり；

R<sub>27</sub>は、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル又は-S(O)<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)であり、ここで、各アルキルは、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-CN、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-OH、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、-SH、-S(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、オキソ、ヒドロキシ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、アルコキシ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、アミノ(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-CONH<sub>2</sub>、-CON(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-CON(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-CONH-OH、-CONH-NH<sub>2</sub>、-COH、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-OCO(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-NHC(O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ)、-NHC(O)(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-NHCONH<sub>2</sub>、-NHCONH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-NHC(=NH)NH<sub>2</sub>、-NH-S(O)<sub>0-2</sub>-(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-NH-S(O)<sub>0-2</sub>-アリール、及び-NH-S(O)<sub>0-2</sub>-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；

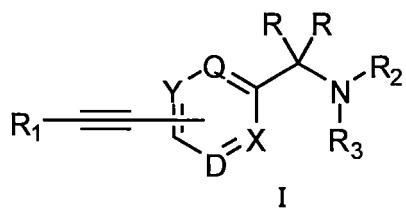
R<sub>28</sub>は、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-CN、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルキル、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-OH、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、オキソ、-CONH<sub>2</sub>、-CON(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)、-CON(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-CONH-OH、-CONH-NH<sub>2</sub>、-COH、及び-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>アルキル)からなる群から独立して選択され；

R<sub>29</sub>は、水素又はC<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>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11】



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、

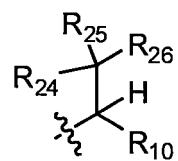
Q、Y、D、及びXは、独立してCH又は窒素を表わし、ただし、Q、Y、D、及びXの少なくとも2つはCHであり；

各Rは、独立して水素又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであるか、又は2つのR基は=Oを形成し；

R<sub>1</sub>は-C-C-R<sub>4</sub>、又はR<sub>6</sub>で任意に置換されたアリールであり；

R<sub>2</sub>は、

## 【化12】



であり；

R<sub>3</sub>は、水素又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであり；

R<sub>4</sub>は、1つ以上のR<sub>12</sub>で任意に置換されたヘテロシクリル(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)であり；

各R<sub>5</sub>は、独立して水素又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであり；

各R<sub>6</sub>は、アリール、アリール(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、ヘテロアリール、ヘテロアリール(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、ヘテロシクリル、及びヘテロシクリル(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>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<sub>12</sub>で任意に置換され；

R<sub>10</sub>は、-CONH<sub>2</sub>、-CON(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-CON(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-CONH-OH、-CONH-NH<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>H、又は-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)であり；

各R<sub>12</sub>は、ハロゲン、-NO<sub>2</sub>、-CN、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-OH、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、-SH、-S(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、オキソ、ヒドロキシ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、アルコキシ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、アミノ(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-CONH<sub>2</sub>、-CON(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-CON(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-CONH-OH、-CONH-NH<sub>2</sub>、-COH、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-OCO(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-NHC(O)(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ)、-NHC(O)(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-NHC(=NH)NH<sub>2</sub>、-NH-S(O)<sub>0.2</sub>-(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-NH-S(O)<sub>0.2</sub>-アリール、及び-NH-S(O)<sub>0.2</sub>-ヘテロアリールからなる群から独立して選択され；

R<sub>24</sub>は、水素、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、-NH<sub>2</sub>、-NH(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-OH、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>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<sub>2</sub>、-NHCONH( $C_1 \sim C_6$ アルキル)、-O<sub>2</sub>( $C_1 \sim C_6$ 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<sub>2</sub>、-NH( $C_1 \sim C_6$ アルキル)、-N( $C_1 \sim C_6$ アルキル)<sub>2</sub>、-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 -ジフルオロ - 3 -ヒドロキシ - 1 - (ヒドロキシアミノ) - 3 -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；

N - (4, 4 -ジフルオロ - 1 - (ヒドロキシアミノ) - 3 -メトキシ - 3 -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；

N - (3 -アミノ - 4, 4 -ジフルオロ - 1 - (ヒドロキシアミノ) - 3 -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；

N - (3 -アセトアミド - 4, 4 -ジフルオロ - 1 - (ヒドロキシアミノ) - 3 -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；及び

N - (4, 4 -ジフルオロ - 1 - (ヒドロキシアミノ) - 3 -メチル - 3 - (3 -メチルウレイド) - 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、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 1 3】

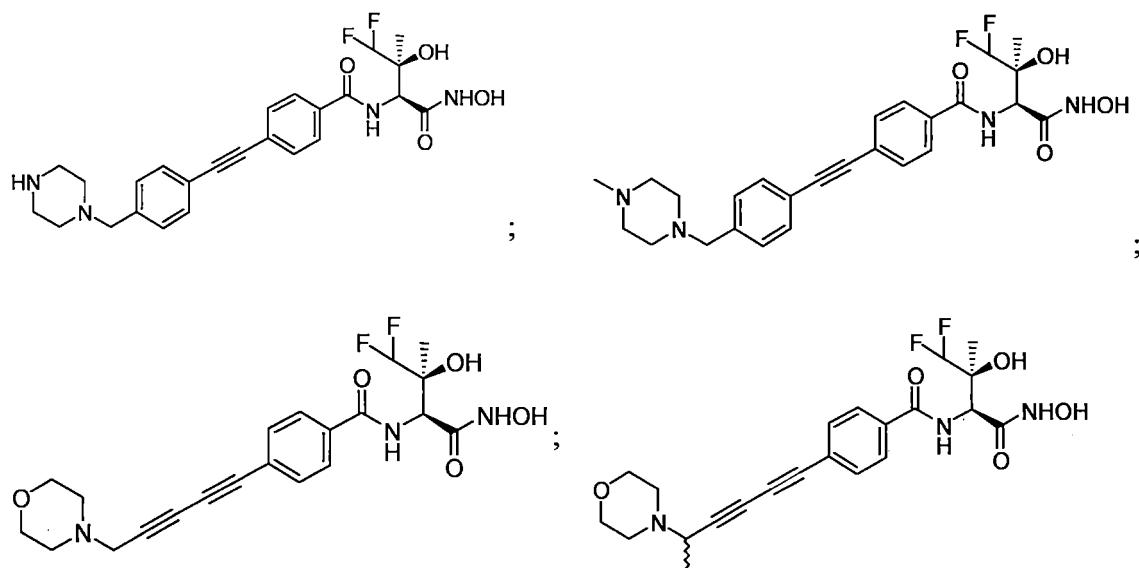
$R_{26}$ が $C_1$ ハロアルキルであるか、 $R_{26}$ が-CH<sub>2</sub>F、-CHF<sub>2</sub>、又は-CF<sub>3</sub>であるか、 $R_{26}$ が-CHF<sub>2</sub>であるか、 $R_{26}$ が $C_1 \sim C_6$ アルキルであるか、あるいは、 $R_{26}$ がメチルである、請求項12に記載の化合物。

【請求項 1 4】

$R_{25}$ 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 1 5】

## 【化13】



である、請求項12に記載の化合物、又はその医薬的に許容される塩。

## 【請求項16】

請求項1～15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17】

請求項1～15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18】

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*)、アシネットバクター (*Acinetobacter*)、腸内細菌科 (*Enterobacteriaceae*)、ヘモフィルス (*Haemophilus*)、ナイセリア種 (*Neisseria species*)、野兎病菌 (*Francisella tularensis*)、ペスト菌 (*Yersinia pestis*)、バークホルデリア疽菌 (*Burkholderia pseudomallei*)、バークホルデリア・マレイ (*Burkholderia mallei*)、リケッチャ・プロワツエキイ (*Rickettsia prowazekii*)、Q熱リケッチャ (*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17に記載の医薬組成物。

## 【請求項19】

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18に記載の医薬組成物。

## 【請求項20】

請求項1～15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

の治療の必要な対象に投与される、医薬組成物。

【請求項 21】

デアセチラーゼ酵素はLpxCである、請求項20に記載の医薬組成物。