

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成30年4月12日 (2018.4.12)

【公表番号】特表2017-508746(P2017-508746A)

【公表日】平成29年3月30日 (2017.3.30)

【年通号数】公開・登録公報2017-013

【出願番号】特願2016-555488(P2016-555488)

【国際特許分類】

C 07 D 487/04 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

A 61 K 31/4188 (2006.01)

A 61 K 31/4439 (2006.01)

A 61 K 31/5377 (2006.01)

A 61 K 31/675 (2006.01)

A 61 K 31/427 (2006.01)

A 61 K 31/454 (2006.01)

C 07 F 9/6561 (2006.01)

【F I】

C 07 D 487/04 1 3 8

A 61 P 31/04

A 61 K 31/4188

A 61 K 31/4439

A 61 K 31/5377

A 61 K 31/675

A 61 K 31/427

A 61 K 31/454

C 07 F 9/6561 C S P Z

【手続補正書】

【提出日】平成30年3月1日 (2018.3.1)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

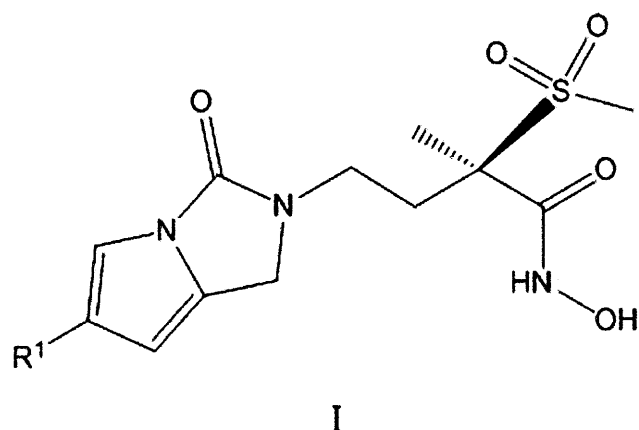
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物又はその化合物の塩：

【化 1】

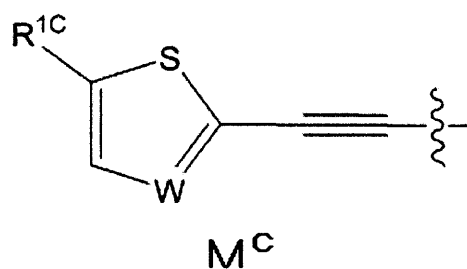
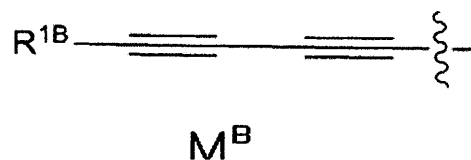
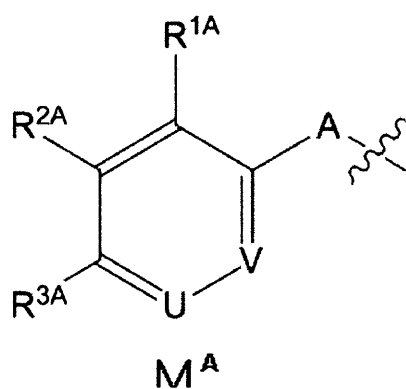


式中、

R^1 は、基 M を表し；

M は、下記の基 M^A 、 M^B 及び M^C の 1 つである；

【化 2】



(式中、A は結合、 $CH=CH$ 又は $C-C$ を表し；

U は N 又は CH を表し；

V は N 又は CH を表し；

W は N 又は CH を表し；

R^{1A} は H 又はハロゲンを表し；

R^{2A} は、H、 $(C_1 - C_3)$ アルコキシ又はハロゲンを表し；

R^{3A} は、H、ハロゲン、 $(C_1 - C_3)$ アルコキシ、ヒドロキシ $(C_2 - C_4)$ アルコキシ、ジヒドロキシ $(C_3 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_3)$ アルコキシ $(C_1 - C_3)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_3)$ チオアルコキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル、アミノ、ヒドロキシ $(C_1 - C_4)$ アルキル、1, 2 - ジヒドロキシエチル、1 - ヒドロキシ - 2, 2 - ジフルオロエチル、 $(C_1 - C_3)$ アルコキシ $(C_1 - C_4)$ アルキル、2 - ヒドロキシ - 1 - オキシエチル、 $[(C_1 - C_4)$ アルコキシ] カルボニル、メチルスルホンアミドメチル、3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル、2 - ヒドロキシアセタミド、(カルバモイルオキシ) メチル、1 - アミノシクロプロピル

、 1 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、 1 - (((ジメチルグリシル) オキシ) メチル) シクロプロピル、 1 - アミノメチル - シクロプロパ - 1 - イル、 1 - (カルバモイルオキシ) メチル - シクロプロパ - 1 - イル、 1 - (モルフォリン - 4 - イル) メチルシクロプロパ - 1 - イル、 トランス - 2 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、 1 - (ヒドロキシメチル) - シクロブタ - 1 - イル、 1 - (2 - ヒドロキシアセチル) アゼチジン - 3 - イル、 (1 - tert - ブチルオキシカルボニル) - 3 - ヒドロキシアゼチジン - 3 - イル、 3 - ヒドロキシオキセタン - 3 - イル、 3 - (ヒドロキシ(C₁ - C₃) アルキル) オキセタン - 3 - イル、 3 - アミノオキセタン - 3 - イル、 3 - ヒドロキシチエタン - 3 - イル、 4 - アミノピペリジン - 1 - イル、 モルフォリン - 4 - イル (C₂ - C₃) アルコキシ、 [4 - N - (C₁ - C₃) アルキルピペラジン - 1 - イル] (C₁ - C₃) アルキル、 モルフォリン - 4 - イル - (C₁ - C₂) アルキル、 [1, 2, 3] トリアゾール - 2 - イル、 3 - [ヒドロキシ(C₂ - C₃) アルキル] - 2 - オキソ - イミダゾリジン - 1 - イル、 (1s, 3r) - (1 - ヒドロキシ - 3 - (ヒドロキシメチル) シクロブチル) メチル、 (4 - ヒドロキシピペリジニル) メチル又は (4 - アミノピペリジニル) メチルを表し；

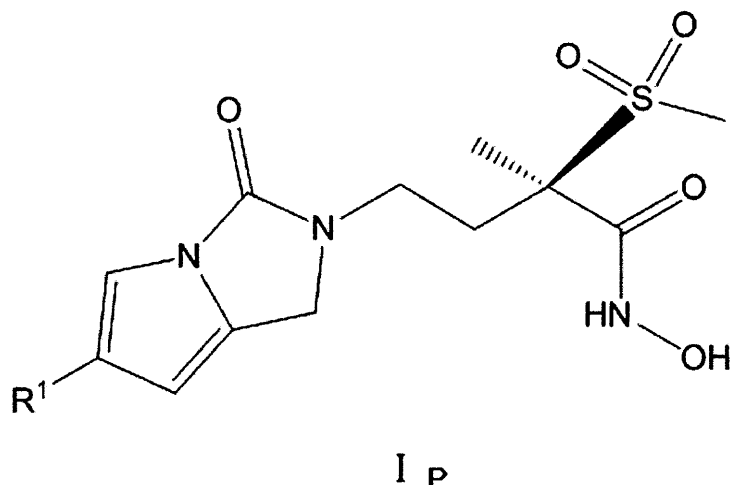
R^{1B} は、 3 - ヒドロキシオキセタン - 3 - イル、 3 - ヒドロキシチエタン - 3 - イル、 3 - (ヒドロキシ(C₁ - C₃) アルキル) オキセタン - 3 - イル、 ヒドロキシ(C₁ - C₃) アルキル、 1, 2 - ジヒドロキシエチル、 アミノ(C₁ - C₃) アルキル、 (ジメチルアミノ) メチル、 メチルスルホンアミドメチル、 1 - アミノシクロプロピル、 1 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、 1 - (カルバモイルオキシ) メチル - シクロプロパ - 1 - イル、 1 - (((ジメチルグリシル) オキシ) メチル) シクロプロパ - 1 - イル、 1 - ((ホスフォノオキシ) メチル) - シクロプロパ - 1 - イル、 1 - (((ホスフォノオキシ) メトキシ) カルボニル) オキシメチル) シクロプロパ - 1 - イル、 1 - ((((ホスフォノオキシ) メトキシ) カルボニル) アミノ) - シクロプロパ - 1 - イル、 トランス - 2 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、 1 - フルオロ - 2 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、 2 - フルオロ - 2 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、 1 - メチル - 2 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、 2 - ヒドロキシメチル - 2 - メチルシクロプロパ - 1 - イル、 (1R*, 2S*, 3s*) - 1, 2 - ビス - (ヒドロキシメチル) - シクロプロパ - 3 - イル、 1 - (ヒドロキシメチル) シクロブタ - 1 - イル、 3 - アミノオキセタン - 3 - イル、 3 - (ヒドロキシ(C₁ - C₃) アルキル) オキセタン - 3 - イル、 1 - (2 - ヒドロキシアセチル) - アゼチジン - 3 - イル、 トランス - (cis - 3, 4 - ジヒドロキシ) - シクロペンタ - 1 - イル、 3 - ヒドロキシメチル - ビシクロ[1, 1, 1] ペンタン - 1 - イル、 4 - ヒドロキシ - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 4 - イル、 5 - アミノ - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル、 3 - ヒドロキシオキセタン - 3 - イルメチル、 1 - シクロブチル - 2 - ヒドロキシエチル又は 1 - (オキセタン - 3 - イル) - アゼチジン - 3 - イルを表し；

R^{1C} は、 1 - アミノシクロプロピル又はヒドロキシ(C₁ - C₃) アルキルを表す。)

【請求項 2】

式 I_p の化合物でもある、請求項 1 に記載の式 I の化合物又はその化合物の塩；

【化 3】

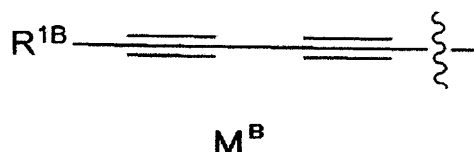
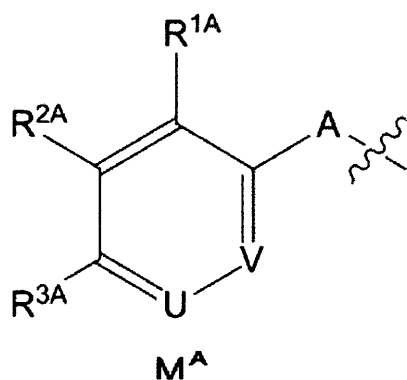


式中、

R^1 は、基 M を表し；

M は、下記の基 M^A 及び M^B の 1 つである；

【化 4】



(式中、 A は、結合、 $CH=CH$ 又は $C-C$ を表し；

U は NC 又は H を表し；

V は N 又は CH を表し；

R^{1A} は、 H 又はハロゲンを表し；

R^{2A} は、 H 、 $(C_1 - C_3)$ アルコキシ又はハロゲンを表し；

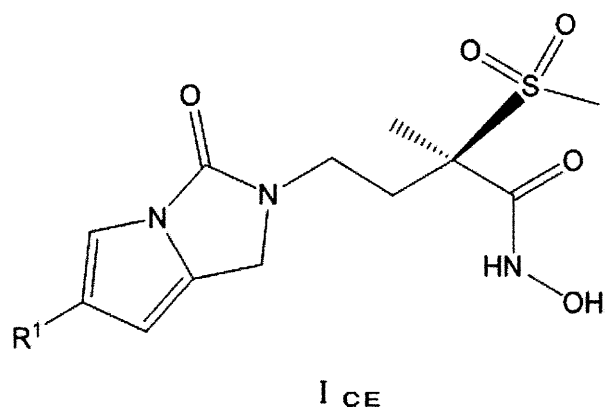
R^{3A} は、 H 、 $(C_1 - C_3)$ アルコキシ、ヒドロキシ $(C_2 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_3)$ アルコキシ $(C_1 - C_3)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_3)$ チオアルコキシ、トリフルオロメトキシ、アミノ、ヒドロキシ $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_3)$ アルコキシ $(C_1 - C_4)$ アルキル、3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル、2 - ヒドロキシアセタミド、(カルバモイルオキシ)メチル、1 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、1 - アミノメチル - シクロプロパ - 1 - イル、1 - (カルバモイルオキシ)メチル - シクロプロパ - 1 - イル、1 - (モルフォリン - 4 - イル)メチルシクロプロパ - 1 - イル、トランス - 2 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、1, 2 - ジヒドロキシエチル、3 - ヒドロキシオキセタン - 3 - イル、3 - (ヒドロキシ $(C_1 - C_3)$ アルキル)オキセタン - 3 - イル、3 - アミノオキセタン - 3 - イル、3 - ヒドロキシチエタン - 3 - イル、モルフォリン - 4 - イル $(C_2 - C_3)$ アルコキシ、[4 - N - $(C_1 - C_3)$ アルキルピペラジン - 1 - イル] $(C_1 - C_3)$ アルキル、モルフォリン - 4 - イル - $(C_1 - C_2)$ アルキル、[1, 2, 3] トリアゾール - 2 - イル又は 3 - [ヒドロキシ $(C_2 - C_3)$ アルキル] - 2 - オキソ - イミダゾリジン - 1 - イルを表し；

R^{1B} は、3 - ヒドロキシオキセタン - 3 - イル、3 - ヒドロキシチエタン - 3 - イル、3 - (ヒドロキシ ($C_1 - C_3$) アルキル) オキセタン - 3 - イル、ヒドロキシ ($C_1 - C_3$) アルキル、1, 2 - ジヒドロキシエチル、アミノ ($C_1 - C_3$) アルキル、1 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、トランス - 2 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、トランス - (*cis* - 3, 4 - ジヒドロキシ) - シクロペンタ - 1 - イル又は 3 - ヒドロキシメチルビスシクロ [1, 1, 1] ペンタン - 1 - イルを表す。)。

【請求項 3】

式 I_{CE} の化合物である、請求項 1 に記載の式 I の化合物又はその化合物の塩：

【化 5】

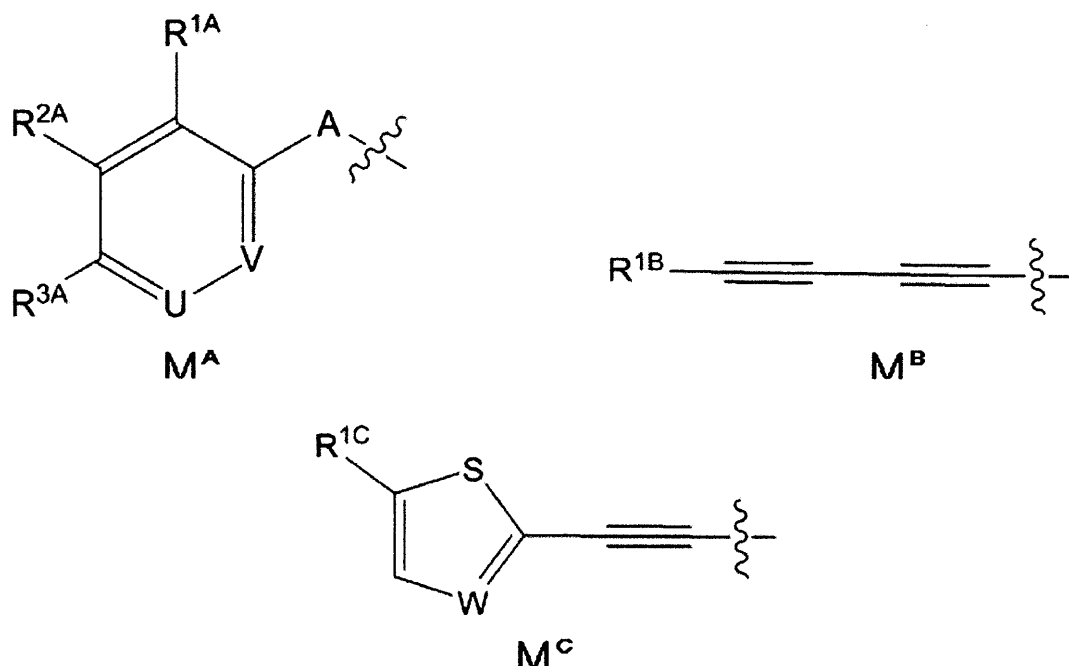


式中、

R^1 は、基 M を表し；

M は、下記の基 M^A 、 M^B 及び M^C の 1 つである：

【化 6】



(式中、A は結合、 $CH = CH$ 又は $C - C$ を表し；

U は CH 又は N を表し；

V は CH 又は N を表し；

W は CH 又は N を表し；

R^{1A} は H 又はハロゲンを表し；

R^{2A} は、H、($C_1 - C_3$) アルコキシ又はハロゲンを表し；

R^{3A} は、H、ハロゲン、($C_1 - C_3$) アルコキシ、ヒドロキシ ($C_2 - C_4$) アルコ

キシ、ジヒドロキシ ($C_3 - C_4$) アルコキシ、($C_1 - C_3$) アルコキシ ($C_1 - C_3$) アルコキシ、トリフルオロメチル、ヒドロキシ ($C_1 - C_4$) アルキル、1, 2 - ジヒドロキシエチル、1 - ヒドロキシ - 2, 2 - ジフルオロエチル、($C_1 - C_3$) アルコキシ ($C_1 - C_4$) アルキル、2 - ヒドロキシ - 1 - オキシエチル、[($C_1 - C_4$) アルコキシ] カルボニル、メチルスルホンアミドメチル、3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イン - 1 - イル、2 - ヒドロキシアセタミド、(カルバモイルオキシ) メチル、1 - アミノシクロプロピル、1 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、1 - ((ジメチルグリシル) オキシ) メチル - シクロプロピル、1 - アミノメチル - シクロプロパ - 1 - イル、1 - (カルバモイルオキシ) メチル - シクロプロパ - 1 - イル、1 - (モルフォリン - 4 - イル) メチル - シクロプロパ - 1 - イル、トランス - 2 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、1 - (ヒドロキシメチル) - シクロブタ - 1 - イル、1 - (2 - ヒドロキシアセチル) アゼチジン - 3 - イル、(1 - tert - ブチルオキシカルボニル) - 3 - ヒドロキシアゼチジン - 3 - イル、3 - ヒドロキシオキセタン - 3 - イル、3 - (ヒドロキシ ($C_1 - C_3$) アルキル) オキセタン - 3 - イル、3 - アミノオキセタン - 3 - イル、4 - アミノピペリジン - 1 - イル、[4 - N - ($C_1 - C_3$) アルキルピペラジン - 1 - イル] ($C_1 - C_3$) アルキル、モルフォリン - 4 - イル - ($C_1 - C_2$) アルキル、3 - [ヒドロキシ ($C_2 - C_3$) アルキル] - 2 - オキシ - イミダゾリジン - 1 - イル、(1s, 3r) - (1 - ヒドロキシ - 3 - (ヒドロキシメチル) シクロブチル) メチル、(4 - ヒドロキシピペリジニル) メチル又は (4 - アミノピペリジニル) メチルを表し；

R^{1B} は、3 - ヒドロキシオキセタン - 3 - イル、ヒドロキシ ($C_1 - C_3$) アルキル、1, 2 - ジヒドロキシエチル、アミノ ($C_1 - C_3$) アルキル、(ジメチルアミノ) メチル、メチルスルホンアミドメチル、1 - アミノシクロプロピル、1 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、1 - (カルバモイルオキシ) メチル - シクロプロパ - 1 - イル、1 - ((ジメチルグリシル) オキシ) メチル - シクロプロパ - 1 - イル、1 - ((ホスフォノオキシ) メチル) - シクロプロパ - 1 - イル、1 - (((ホスフォノオキシ) メトキシ) カルボニル) オキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、1 - (((ホスフォノオキシ) メトキシ) カルボニル) アミノ - シクロプロパ - 1 - イル、トランス - 2 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、1 - フルオロ - 2 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、2 - フルオロ - 2 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、1 - メチル - 2 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、2 - ヒドロキシメチル - 2 - メチルシクロプロパ - 1 - イル、(1R*, 2S*, 3S*) - 1, 2 - ビス - (ヒドロキシメチル) - シクロプロパ - 3 - イル、1 - (ヒドロキシメチル) シクロブタ - 1 - イル、3 - アミノオキセタン - 3 - イル、3 - (ヒドロキシ ($C_1 - C_3$) アルキル) オキセタン - 3 - イル、1 - (2 - ヒドロキシ - アセチル) アゼチジン - 3 - イル、トランス - (cis - 3, 4 - ジヒドロキシ) - シクロペンタ - 1 - イル、3 - ヒドロキシメチルピシクロ [1, 1, 1] ペンタン - 1 - イル、4 - ヒドロキシ - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 4 - イル、5 - アミノ - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル、3 - ヒドロキシオキセタン - 3 - イルメチル、1 - シクロブチル - 2 - ヒドロキシエチル又は 1 - (オキセタン - 3 - イル) - アゼチジン - 3 - イルを表し；

R^{1C} は、1 - アミノシクロプロピル又はヒドロキシ ($C_1 - C_3$) アルキルを表す。)

【請求項 4】

R^1 が基 M^A を表す；請求項 1 ~ 3 の 1 項に記載の式 I の化合物又はその化合物の塩。

【請求項 5】

A が結合を表す；請求項 4 に記載の式 I の化合物又はその化合物の塩。

【請求項 6】

A が C を表す；請求項 4 に記載の式 I の化合物又はその化合物の塩。

【請求項 7】

U が CH を表し、V が CH を表し、 R^{1A} が H 又はフッ素を表し、 R^{2A} が H 又はフッ素

を表し、 R^3A が、ヒドロキシ ($C_2 - C_4$) アルコキシ、ヒドロキシ ($C_1 - C_4$) アルキル、1, 2 - ジヒドロキシエチル、1 - ヒドロキシ - 2, 2 - ジフルオロエチル、メチルスルホンアミドメチル、2 - ヒドロキシアセタミド、(カルバモイルオキシ)メチル、1 - アミノシクロプロピル、1 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、1 - (カルバモイルオキシ)メチル - シクロプロパ - 1 - イル、トランス - 2 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、1 - (ヒドロキシメチル) - シクロブタ - 1 - イル、3 - ヒドロキシオキセタン - 3 - イル、モルフォリン - 4 - イルメチル又は (4 - ヒドロキシピペリジニル)メチルを表す；請求項 6 に記載の式 I の化合物又はその化合物の塩。

【請求項 8】

R^1 が基 M^B を表す；請求項 1 ~ 3 の 1 項に記載の式 I の化合物又はその化合物の塩。

【請求項 9】

R^1B が、アミノ ($C_1 - C_3$) アルキル、1 - アミノシクロプロピル、1 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、トランス - 2 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、1 - フルオロ - 2 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、2 - フルオロ - 2 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、1 - メチル - 2 - ヒドロキシメチル - シクロプロパ - 1 - イル、2 - ヒドロキシメチル - 2 - メチルシクロプロパ - 1 - イル、1 - (2 - ヒドロキシアセチル) - アゼチジン - 3 - イル、トランス - (cis - 3, 4 - ジヒドロキシ) - シクロペンタ - 1 - イル、3 - ヒドロキシメチルビスクロ [1, 1, 1] ペンタン - 1 - イル、5 - アミノ - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル又は 1 - (オキセタン - 3 - イル) - アゼチジン - 3 - イルを表す；請求項 8 に記載の式 I の化合物又はその化合物の塩。

【請求項 10】

R^1 が基 M^C を表す；請求項 1 ~ 3 の 1 項に記載の式 I の化合物又はその化合物の塩。

【請求項 11】

下記から選択される、請求項 1 に記載の式 I の化合物又はその化合物の塩：

(R) - 4 - (6 - (2 - フルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド；

(R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((4 - (3 - ヒドロキシオキセタン - 3 - イル)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド；

(R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((4 - (ヒドロキシメチル)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド；

(R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((3 - ヒドロキシオキセタン - 3 - イル)ブタ - 1, 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド；

(R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((4 - ((1 R, 2 R) - 2 - (ヒドロキシメチル)シクロプロピル)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド；

(R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((4 - ((1 S, 2 S) - 2 - (ヒドロキシメチル)シクロプロピル)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド；

(R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((4 - (1 - (ヒドロキシメチル)シクロプロピル)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド；

(R) - 4 - (6 - ((4 - (1 - (アミノメチル)シクロプロピル)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N

- ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((4 - (1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロパン - 2 - イル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((4 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - ((S) - 5 , 6 - ジヒドロキシヘキサ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (5 - ((1 S , 2 S) - 2 - (ヒドロキシメチル) シクロプロピル) ペンタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((4 - ((R) - 1 - ヒドロキシエチル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((4 - ((S) - 1 - ヒドロキシエチル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((1 - (ヒドロキシメチル) シクロプロピル) ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((4 - (2 - ヒドロキシエチル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - ((4 - ((R) - 1 , 2 - ジヒドロキシエチル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - ((4 - ((S) - 1 , 2 - ジヒドロキシエチル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - ((2 - フルオロ - 4 - (1 - (ヒドロキシメチル) シクロプロピル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((4 - (3 - (2 - ヒドロキシエチル) - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - ((3 - フルオロ - 4 - (2 - ヒドロキシアセタミド) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((4 - (2 - ヒドロキシエトキシ) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((6 - (1 - (ヒドロキシメチル) シクロプロピル) ピリジン - 3 - イル) エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((5 - (1 - (ヒドロキシメチル) シクロプロピル

ル)ピリジン - 2 - イル)エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダ
 ゴール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) - 4 - (6 - ((4 -
 (モルフォリノメチル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c
] イミダゴール - 2 (3 H) - イル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) - 4 - (6 - ((4 -
 (1 - (モルフォリノメチル) シクロプロピル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1
 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゴール - 2 (3 H) - イル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (((1 R , 2 R) - 2 - (ヒドロキシメチル) シ
 クロプロピル) ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2
 - c] イミダゴール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタ
 ンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - (2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロ
 ロ [1 , 2 - c] イミダゴール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2
 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - (E) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (4 - (ヒドロキシメチル) スチリル) -
 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゴール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチ
 ル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
(R) - 4 - (6 - (5 - アミノ - 5 - メチルヘキサ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3
- オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゴール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロ
キシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - 4 - ((2 - (4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - メチル - 3 - (メチルスルホニ
 ル) - 4 - オキソブチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c
] イミダゴール - 6 - イル) エチニル) ベンジル カーバメート ;
 (R) - 4 - (6 - (((1 S , 3 R , 4 S) - 3 , 4 - ジヒドロキシシクロペンチル)
 ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾ
 ール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブ
 タンアミド ;
 (R) - (1 - (4 - ((2 - (4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - メチル - 3 - (メチル
 スルホニル) - 4 - オキソブチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [1
 , 2 - c] イミダゴール - 6 - イル) エチニル) フェニル) シクロプロピル) メチル カ
 ーバメート ;
 (R) - (1 - ((2 - (4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - メチル - 3 - (メチルスルホ
 ニル) - 4 - オキソブチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [1 , 2 -
 c] イミダゴール - 6 - イル) ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) シクロプロピル) メチ
 ル カーバメート ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (((1 R , 2 R) - 2 - (ヒドロキシメチル) -
 1 - メチルシクロプロピル) ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピ
 ロロ [1 , 2 - c] イミダゴール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスル
 ホニル) ブタンアミド ;
 (R) - (1 - (4 - ((2 - (4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - メチル - 3 - (メチル
 スルホニル) - 4 - オキソブチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [1
 , 2 - c] イミダゴール - 6 - イル) エチニル) フェニル) シクロプロピル) メチル ジ
 メチルグリシネート ;
 (R) - 4 - (6 - ((1 - アミノシクロプロピル) ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル)
 - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゴール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒ
 ドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - ((3 - アミノオキセタン - 3 - イル) ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 -
 イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゴール - 2 (3 H) - イル) -
 N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;

(R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((4 - (1 - (ヒドロキシメチル) シクロブチル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;

(R) - 4 - (6 - (2 - フルオロ - 4 - (2 - ヒドロキシエトキシ) フェニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;

(R) - 4 - (6 - (((2 R , 3 S) - 2 , 3 - ビス (ヒドロキシメチル) シクロプロピル) ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;

(R) - 4 - (6 - (4 - ((R) - 2 , 3 - ジヒドロキシプロボキシ) - 2 - フルオロフェニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;

(R) - 4 - (6 - ((4 - (1 , 1 - ジフルオロ - 2 - ヒドロキシエチル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;

(R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((4 - (2 - ヒドロキシアセチル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;

(R) - 4 - (6 - (5 - (ジメチルアミノ) ペンタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;

メチル (R) - 3 - フルオロ - 4 - (2 - (4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - メチル - 3 - (メチルスルホニル) - 4 - オキソブチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 6 - イル) ベンゾエート ;

(R) - 4 - (6 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;

(R) - 4 - (6 - (2 - クロロ - 4 - エトキシフェニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;

(R) - (1 - ((2 - (4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - メチル - 3 - (メチルスルホニル) - 4 - オキソブチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 6 - イル) ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) シクロプロピル) メチル ジメチルグリシネート ;

リン酸二水素 (R) - (1 - ((2 - (4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - メチル - 3 - (メチルスルホニル) - 4 - オキソブチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 6 - イル) ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) シクロプロピル) メチル ;

(R) - 4 - (6 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;

(R) - 4 - (6 - (2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;

(R) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) - 4 - (3 - オキソ - 6 - (2 , 3 , 4 - トリフルオロフェニル) - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) ブタンアミド ;

(R) - 4 - (6 - (2 , 3 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチ

ル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;

(R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((1 - (ヒドロキシメチル) シクロブチル) ブタ
- 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール
- 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;

((R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((3 - (ヒドロキシメチル) オキセタン - 3 -
イル) ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イ
ミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド
;

(R) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 4 - (6 - (5 - (メチルスルホンアミド)ペン
タ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾー
ル - 2 (3 H) - イル) - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;

tert - ブチル (R) - 3 - ヒドロキシ - 3 - (4 - ((2 - (4 - (ヒドロキシア
ミノ) - 3 - メチル - 3 - (メチルスルホニル) - 4 - オキソブチル) - 3 - オキソ - 2
, 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 6 - イル) エチニル) フェ
ニル) アゼチジン - 1 - カルボキシレート ;

(2 R) - 4 - (6 - (5 - シクロブチル - 6 - ヒドロキシヘキサ - 1 , 3 - ジイン - 1
- イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル)
- N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;

(R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (((1 R , 2 S) - 2 - (ヒドロキシメチル) -
2 - メチルシクロプロピル) ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピ
ロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスル
ホニル)ブタンアミド ;

(R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((1 - (2 - ヒドロキシアセチル) アゼチジン -
3 - イル) ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c
] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンア
ミド ;

(R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (5 - (3 - ヒドロキシオキセタン - 3 - イル) ペ
ンタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾ
ール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;

(R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((4 - ヒドロキシテトラヒドロ - 2 H - ピラン -
4 - イル) ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c
] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンア
ミド ;

(R) - 4 - (6 - (((2 S , 5 R) - 5 - アミノテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 -
イル) ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イ
ミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホ
ニル)ブタンアミド ;

(R) - 4 - (6 - (((1 R , 2 R) - 1 - フルオロ - 2 - (ヒドロキシメチル) シク
ロプロピル) ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 -
c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルス
ルホニル)ブタンアミド ;

(R) - 4 - (6 - (((1 S , 2 S) - 1 - フルオロ - 2 - (ヒドロキシメチル) シク
ロプロピル) ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 -
c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルス
ルホニル)ブタンアミド ;

(R) - 4 - (6 - ((5 - (1 - アミノシクロプロピル) チオフェン - 2 - イル) エチ
ニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) -
N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;

(R) - 4 - (6 - ((4 - (3 - アミノオキセタン - 3 - イル) フェニル) エチニル)
- 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒ

ドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (4 - (3 - (ヒドロキシメチル)オキセタン - 3 - イル)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (4 - (2 - ヒドロキシアセタミド)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - (4 - (1 - アミノシクロプロピル)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (5 - (1s, 3R) - 1 - ヒドロキシ - 3 - (ヒドロキシメチル)シクロブチル)ペンタ - 1, 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (ホスフォノオキシ)メチル (R) - (1 - (2 - (4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - メチル - 3 - (メチルスルホニル) - 4 - オキソブチル) - 3 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 6 - イル)ブタ - 1, 3 - ジイン - 1 - イル)シクロプロピル)カーバメート ;
 炭酸 (R) - (1 - (2 - (4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - メチル - 3 - (メチルスルホニル) - 4 - オキソブチル) - 3 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 6 - イル)ブタ - 1, 3 - ジイン - 1 - イル)シクロプロピル)メチル ((ホスフォノオキシ)メチル) ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (2 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル)チアゾール - 5 - イル)エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - (4 - (4 - アミノピペリジン - 1 - イル)メチル)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - ((1R, 2R) - 2 - フルオロ - 2 - (ヒドロキシメチル)シクロプロピル)ブタ - 1, 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - ((1S, 2S) - 2 - フルオロ - 2 - (ヒドロキシメチル)シクロプロピル)ブタ - 1, 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (4 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル)メチル)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - (4 - (4 - アミノピペリジン - 1 - イル)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 4 - (6 - (4 - (メチルスルホンアミドメチル)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) - 4 - (6 - ((1 - (オキセタン - 3 - イル)アゼチジン - 3 - イル)ブタ - 1, 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル)ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (4 - (3 - ヒドロキシアセタン - 3 - イル)フ

エニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル)
 - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - ((4 - (2 - エトキシプロパン - 2 - イル) フェニル) エチニル)
 - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒ
 ドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - ((2 - フルオロ - 4 - (ヒドロキシメチル) フェニル) エチニル)
 - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒ
 ドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (4 - (3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブタ - 1 - イ
 ン - 1 - イル) フェニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2
 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (5 - ヒドロキシ - 5 - メチルヘキサ - 1 , 3 - ジ
 イン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H)
 - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 4 - (6 - ((4 - ((4 - メチルピペラジン -
 1 - イル) メチル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イ
 ミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (4 - (2 - ヒドロキシエトキシ) フェニル) - 3
 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル
 - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (4 - (2 - メトキシエトキシ) フェニル) - 3 -
 オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル -
 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - (2 - フルオロ - 4 - メチルフェニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ
 [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 -
 (メチルスルホニル) ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - (3 - フルオロ - 4 - イソプロポキシフェニル) - 3 - オキソ - 1 H
 - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチ
 ル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド。

【請求項 1 2】

医薬としての、請求項 1 ~ 1 1 の 1 項に定義する式 I の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 3】

有効成分としての請求項 1 ~ 1 1 の 1 項に定義する式 I の化合物又はその薬学的に許容される塩と、少なくとも 1 種の治療上不活性な賦形剤とを含む医薬組成物。

【請求項 1 4】

細菌感染症の予防又は治療のための、請求項 1 ~ 1 1 の 1 項に定義する式 I の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 5】

グラム陰性菌感染症の予防又は治療のための、請求項 1 4 に記載の化合物又は薬学的に許容される塩。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 7 8

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 7 8】

3 6) 特に好ましい化合物は、態様 1) 又は 2) に定義する式 I の下記の化合物である：

(R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((4 - (2 - ヒドロキシエチル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) -

2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - (4 - (R) - 1, 2 - ジヒドロキシエチル)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - (4 - (S) - 1, 2 - ジヒドロキシエチル)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - (2 - フルオロ - 4 - (1 - (ヒドロキシメチル)シクロプロピル)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (4 - (3 - (2 - ヒドロキシエチル) - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - (3 - フルオロ - 4 - (2 - ヒドロキシアセタミド)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (4 - (2 - ヒドロキシエトキシ)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (6 - (1 - (ヒドロキシメチル)シクロプロピル)ピリジン - 3 - イル)エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (5 - (1 - (ヒドロキシメチル)シクロプロピル)ピリジン - 2 - イル)エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) - 4 - (6 - (4 - (モルフォリノメチル)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル)ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) - 4 - (6 - (4 - (1 - (モルフォリノメチル)シクロプロピル)フェニル)エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル)ブタンアミド ;
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - ((1R, 2R) - 2 - (ヒドロキシメチル)シクロプロピル)ブタ - 1, 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - (2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - (E) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (4 - (ヒドロキシメチル)スチリル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - 4 - (6 - (5 - アミノ - 5 - メチルヘキサ - 1, 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 2 (3H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル)ブタンアミド ;
 (R) - 4 - ((2 - (4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - メチル - 3 - (メチルスルホニル) - 4 - オキソブチル) - 3 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1H - ピロロ [1, 2 - c] イミダゾール - 6 - イル)エチニル)ベンジル カーバメート ;
 (R) - 4 - (6 - ((1S, 3R, 4S) - 3, 4 - ジヒドロキシシクロペンチル)

ブタ - 1 , 3 - ジエン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;

(R) - (1 - (4 - ((2 - (4 - (ヒドロキシアミノ) - 3 - メチル - 3 - (メチルスルホニル) - 4 - オキソブチル) - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 6 - イル) エチニル) フェニル) シクロプロピル) メチル カーバメート ;

及びその塩 (特に、薬学的に許容される塩) 。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0356

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0356】

参照実施例 30 : (R) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (4 - (3 - (ヒドロキシメチル) ビシクロ [1 . 1 . 1] ペンタン - 1 - イル) シクロブタ - 1 , 3 - ジエン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1 H - ピロロ [1 , 2 - c] イミダゾール - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチル - 2 - (メチルスルフォニル) ブタンアミド ;

製造 H の化合物 (0 . 08 g ; 0 . 189 mmol) 及び製造 Y の化合物 (0 . 087 g ; 0 . 189 mmol ; 市販) を出発物質として、順次、実施例 12、工程 12 . i (収率 31%)、実施例 15、工程 15 . ii (収率 16%)、及び手順 D (収率 10%) と同様に進めて、表題化合物を、分取用 HPLC (方法 1) による精製の後に、黄色の固体 (0 . 003 g) として得た。¹H NMR (500 MHz、d₆-DMSO) : 10 . 56 - 11 . 42 (br . s、1 H) ; 9 . 07 - 9 . 26 (br . s、1 H) ; 7 . 56 (s、1 H) ; 6 . 24 - 6 . 26 (m、1 H) ; 4 . 58 (t、J = 5 . 6 Hz、1 H) ; 4 . 43 (s、2 H) ; 3 . 45 - 3 . 53 (m、1 H) ; 3 . 37 - 3 . 43 (m、1 H) ; 3 . 30 - 3 . 35 (重複 m、2 H) ; 3 . 06 (s、3 H) ; 2 . 50 - 2 . 61 (重複 m、1 H) ; 1 . 91 - 1 . 99 (m、7 H) ; 1 . 52 (s、3 H) 。 MS (ESI、m/z) : 459 . 98 [M + H⁺] (C₂₂H₂₅N₃O₆S) ; t_R = 0 . 70 min。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0428

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0428】

【表 2】

実施例 番号	E. coli ATCC25922 に対するMIC	P. aeruginosa ATCC27853に対す るMIC	K. Pneumoniae A-651 に対するMIC
25	0.125	1	0.25
26	1	4	1
27	≤ 0.063	0.5	0.25
28	≤ 0.063	1	0.25
29	0.25	2	0.5
RE30	0.125	0.5	0.25
31	1	1	1
32	≤ 0.063	0.5	0.25
33	0.5	1	0.5
34	0.125	16	1
35	0.25	2	0.5
36	0.125	0.5	0.25
37	0.5	4	1
38	0.25	1	0.25
39	2	4	4
40	≤ 0.063	1	0.25
41	1	4	2
42	8	4	8
43	8	8	16
44	≤ 0.063	1	0.25
45	0.25	4	1
46	1	4	2
47	≤ 0.063	8	0.25
48	≤ 0.063	1	0.25
49	≤ 0.063	4	0.125
52	≤ 0.063	2	≤ 0.063
53	0.25	8	0.25
54	0.125	1	1
55	0.125	4	1
56	0.25	2	1
57	1	4	2
58	4	4	8
59	1	8	1
60	0.5	4	1
61	0.25	0.25	0.25