

【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

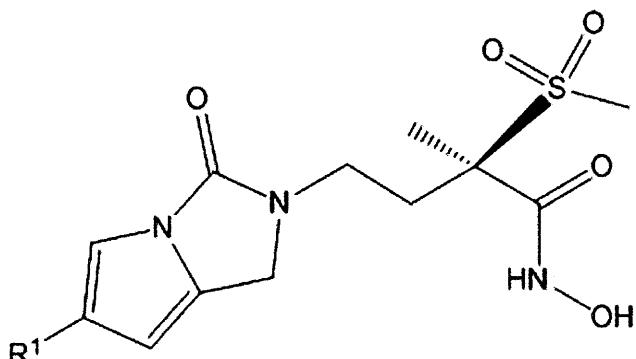
【補正の内容】

【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】

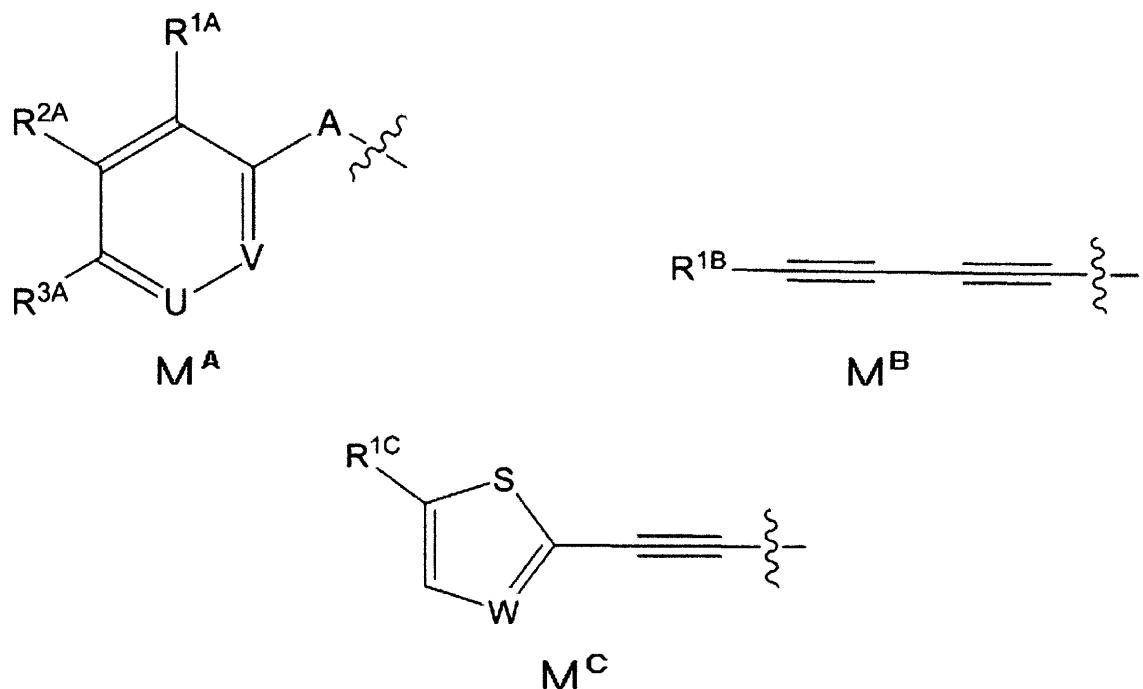


I

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-オキソエチル、[( $C_1 - C_4$ )アルコキシ]カルボニル、メチルスルホニアミドメチル、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<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)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(C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)アルコキシ、[4-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキルピペラジン-1-イル](C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキル、モルフォリン-4-イル-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)アルキル、[1,2,3]トリアゾール-2-イル、3-[ヒドロキシ(C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)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；

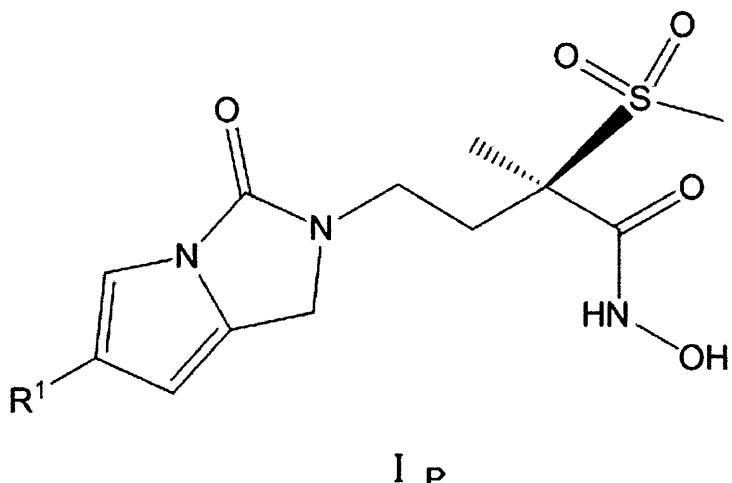
R<sup>1B</sup>は、3-ヒドロキシオキセタン-3-イル、3-ヒドロキシチエタン-3-イル、3-(ヒドロキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキル)オキセタン-3-イル、ヒドロキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキル、1,2-ジヒドロキシエチル、アミノ(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキル、(ジメチルアミノ)メチル、メチルスルホンアミドメチル、1-アミノシクロプロピル、1-ヒドロキシメチル-シクロプロパ-1-イル、1-(カルバモイルオキシ)メチル-シクロプロパ-1-イル、1-((ジメチルグリシル)オキシ)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<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)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<sup>1C</sup>は、1-アミノシクロプロピル又はヒドロキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキルを表す。)。

### 【請求項2】

式I<sub>p</sub>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：

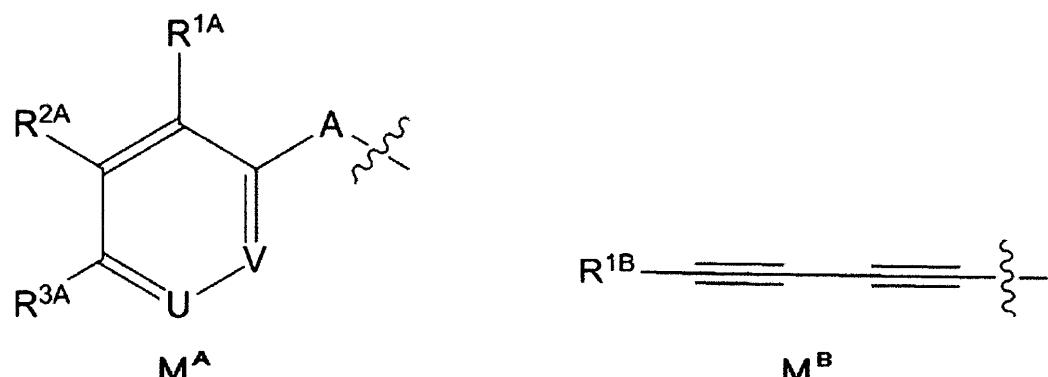
【化3】



式中、

R<sup>1</sup>は、基Mを表し；Mは、下記の基M<sup>A</sup>及びM<sup>B</sup>の1つである：

【化4】



(式中、Aは、結合、C H = C H又はC Cを表し；

UはN C又はHを表し；

VはN又はC Hを表し；

R<sup>1A</sup>は、H又はハロゲンを表し；R<sup>2A</sup>は、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルコキシ又はハロゲンを表し；

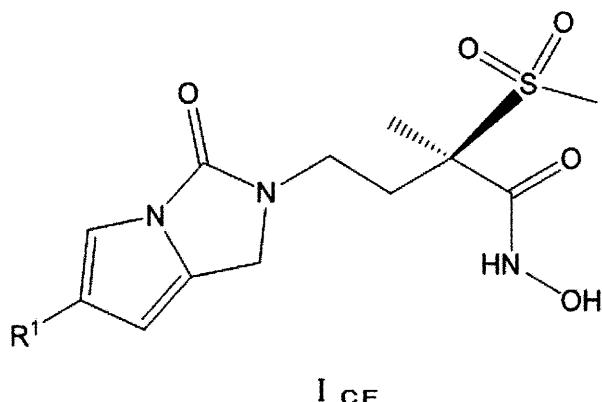
R<sup>3A</sup>は、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルコキシ、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)チオアルコキシ、トリフルオロメトキシ、アミノ、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)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<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)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 - ヒドロキシエタン - 3 - イル、モルフォリン - 4 - イル(C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub>)アルコキシ、[4 - N - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキルピペラジン - 1 - イル](C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキル、モルフォリン - 4 - イル - (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>)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<sub>2</sub> - C<sub>3</sub>)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シクロ[1,1,1]ペンタン-1-イルを表す。)。

## 【請求項3】

式I<sub>CE</sub>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】

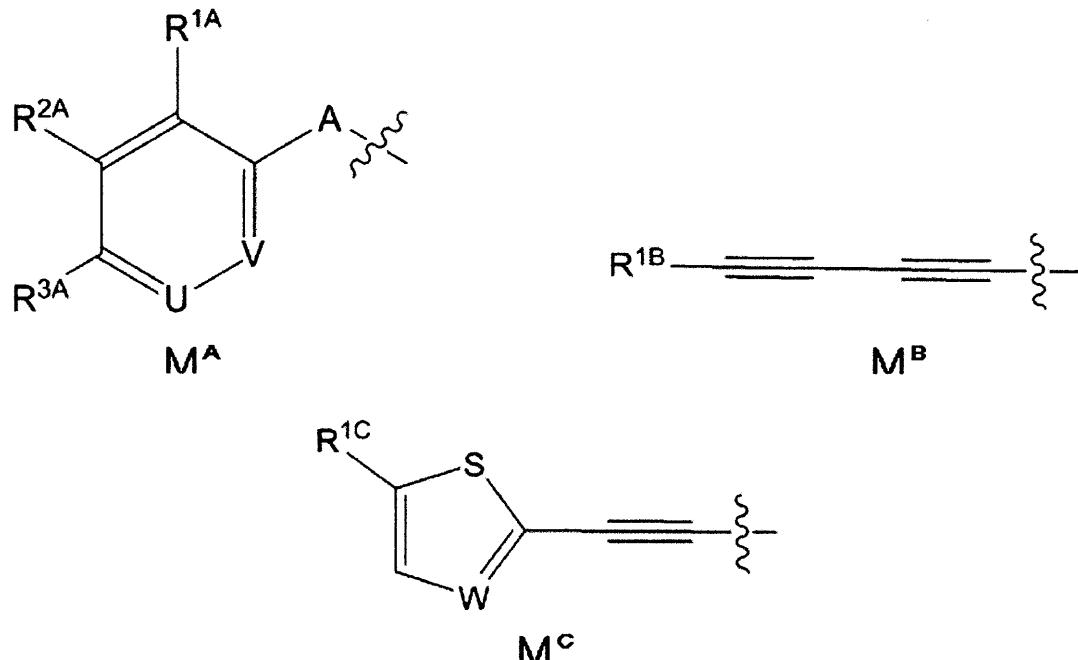
I<sub>CE</sub>

式中、

$R^1$  は、基Mを表し；

Mは、下記の基M<sup>A</sup>、M<sup>B</sup>及びM<sup>C</sup>の1つである：

## 【化6】



(式中、Aは結合、C H = C H又はC Cを表し；

UはC H又はNを表し；

VはC H又はNを表し；

WはC H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-オキソエチル、[ (  $C_1 - C_4$  )アルコキシ]カルボニル、メチルスルホニアミドメチル、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-ヒドロキシアセチジン-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；

$R^1^B$ 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、メチルスルホニアミドメチル、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；

$R^1^C$ 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<sup>A</sup>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-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、 $R^1^A$ がH又はフッ素を表し、 $R^2^A$ がH又はフッ素

を表し、R<sup>3 A</sup>が、ヒドロキシ(C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ、ヒドロキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)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、メチルスルホニアミドメチル、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<sup>1</sup>が基M<sup>B</sup>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<sup>1 B</sup>が、アミノ(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)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シクロ[1,1,1]ペンタン-1-イル、5-アミノ-テトラヒドロ-2H-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<sup>1</sup>が基M<sup>C</sup>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-1H-ピロ口[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-(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-1H-ピロ口[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-(ヒドロキシメチル)フェニル)エチニル)-3-オキソ-1H-ピロ口[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-(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-1H-ピロ口[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-(1R,2R)-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-1H-ピロ口[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-(1S,2S)-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-1H-ピロ口[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-(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-ピロ口[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-ピロ口[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 - (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 - 1H - ピロ口 [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 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロ口 [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 - ((S) - 5, 6 - ジヒドロキシヘキサ - 1, 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1H - ピロ口 [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, 2S) - 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 - 1H - ピロ口 [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 - ((R) - 1 - ヒドロキシエチル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロ口 [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 - ((S) - 1 - ヒドロキシエチル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロ口 [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 - ((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 - 1H - ピロ口 [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 - ヒドロキシエチル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロ口 [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 - ((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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - 1 H - ピロ口 [ 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 - 2 - ( メチルスルホニル ) - 4 - ( ( 4 - ( モルフォリノメチル ) フェニル ) エチニル ) - 3 - オキソ - 1 H - ピロ口 [ 1 , 2 - c ] イミダゾール - 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 - ピロ口 [ 1 , 2 - c ] イミダゾール - 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 - ピロ口 [ 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 - 3 - メトキシフェニル ) - 3 - オキソ - 1 H - ピロ口 [ 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 ) - ( 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 - ピロ口 [ 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 - アミノ - 5 - メチルヘキサ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル ) - 3 - オキソ - 1 H - ピロ口 [ 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 - ( ( 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 - ピロ口 [ 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 - ( ( 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 ;  
 ( 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 - ピロ口 [ 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 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 - ピロ口 [ 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 ) - ( 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 - ピロ口 [ 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 ジメチルグリシネット ;  
 ( 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 - ピロ口 [ 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 - 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 - ピロ口 [ 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 - ( ヒドロキシメチル ) シクロプロチル ) フェニル ) エチニル ) - 3 - オキソ - 1 H - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ジヒドロキシプロポキシ ) - 2 - フルオロフェニル ) - 3 - オキソ - 1 H - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 ジメチルグリシネット ;  
 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 1 , 2 - c ] イミダゾール - 2 ( 3 H ) - イル ) - N - ヒドロキシ - 2 - メチル

ル - 2 - (メチルスルホニル) ブタンアミド ;  
 (R) - N - ヒドロキシ - 4 - ( ( 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 - 1H - ピロ口 [ 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 - ( ( 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 - 1H - ピロ口 [ 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 - 4 - ( 6 - ( 5 - (メチルスルホニアミド) ペンタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1H - ピロ口 [ 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 ;  
 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 - 1H - ピロ口 [ 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 ;  
 (2R) - 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 - 1H - ピロ口 [ 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 - ( ( ( 1R , 2S ) - 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 - 1H - ピロ口 [ 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 - ( ( 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 - 1H - ピロ口 [ 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 - ( 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 - 1H - ピロ口 [ 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 - ヒドロキシテトラヒドロ - 2H - ピラン - 4 - イル) ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1H - ピロ口 [ 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 - ( ( ( 2S , 5R ) - 5 - アミノテトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) ブタ - 1 , 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1H - ピロ口 [ 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 ) - 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 - 1H - ピロ口 [ 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 ) - 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 - 1H - ピロ口 [ 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 - ( ( 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 - 1H - ピロ口 [ 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 - ( 3 - アミノオキセタン - 3 - イル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロ口 [ 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 - (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 - 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) - 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 - 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 - ((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 - 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 ;  
 (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 - 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) 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 - 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 ((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 - 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 - (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 - 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 - (((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 - 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 - (((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 - 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 - (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 - 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 - (4 - アミノピペリジン - 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) - 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 - (メチルスルホニアミドメチル) 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 - 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 - 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) - N - ヒドロキシ - 4 - (6 - (4 - (3 - ヒドロキシオキセタン - 3 - イル) フ

エニル) - 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 - (2 - エトキシプロパン - 2 - 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) - 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 - 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 - 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 - 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 - ヒドロキシ - 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) - 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 - 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 - 4 - (6 - (4 - (2 - ヒドロキシエトキシ)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) - 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 - 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 - 4 - メチルフェニル) - 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) - 4 - (6 - (3 - フルオロ - 4 - イソプロポキシフェニル) - 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。

#### 【請求項 12】

医薬としての、請求項 1 ~ 11 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 13】

有効成分としての請求項 1 ~ 11 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 14】

細菌感染症の予防又は治療のための、請求項 1 ~ 11 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 15】

グラム陰性菌感染症の予防又は治療のための、請求項 14 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】0078

【補正方法】変更

【補正の内容】

#### 【0078】

36) 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 ) - 4 - ( 6 - ( 2 - フルオロ - 4 - メトキシフェニル ) - 3 - オキソ - 1 H - ピロ  
口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ( ( 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [  
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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [ 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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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) シクロプロビル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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) シクロプロビル) ピリジン - 3 - イル) エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロ口 [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) シクロプロビル) ピリジン - 2 - イル) エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロ口 [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 - ピロ口 [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) シクロプロビル) フェニル) エチニル) - 3 - オキソ - 1H - ピロ口 [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) シクロプロビル) ブタ - 1, 3 - ジイン - 1 - イル) - 3 - オキソ - 1H - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 - ピロ口 [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 . 0 8 g ; 0 . 1 8 9 m m o l ) 及び製造Yの化合物 ( 0 . 0 8 7 g ; 0 . 1 8 9 m m o l ; 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.i ( 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 . 0 0 3 g ) として得た。<sup>1</sup>H NMR ( 5 0 0 M H z , d<sub>6</sub> - D M S O ) : 1 0 . 5 6 - 1 1 . 4 2 ( b r . s , 1 H ) ; 9 . 0 7 - 9 . 2 6 ( b r . s , 1 H ) ; 7 . 5 6 ( s , 1 H ) ; 6 . 2 4 - 6 . 2 6 ( m , 1 H ) ; 4 . 5 8 ( t , J = 5 . 6 H z , 1 H ) ; 4 . 4 3 ( s , 2 H ) ; 3 . 4 5 - 3 . 5 3 ( m , 1 H ) ; 3 . 3 7 - 3 . 4 3 ( m , 1 H ) ; 3 . 3 0 - 3 . 3 5 ( 重複m , 2 H ) ; 3 . 0 6 ( s , 3 H ) ; 2 . 5 0 - 2 . 6 1 ( 重複m , 1 H ) ; 1 . 9 1 - 1 . 9 9 ( m , 7 H ) ; 1 . 5 2 ( s , 3 H ) 。 M S ( E S I , m / z ) : 4 5 9 . 9 8 [ M + H<sup>+</sup> ] ( C<sub>22</sub>H<sub>25</sub>N<sub>3</sub>O<sub>6</sub>S ) ; t<sub>R</sub> = 0 . 7 0 m i n 。

## 【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M I C	P.aeruginosa ATCC27853に対するM I C	K.Pneumoniae A-651に対するM I C
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
RE 30	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