

【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】令和1年7月18日(2019.7.18)

【公表番号】特表2018-521021(P2018-521021A)

【公表日】平成30年8月2日(2018.8.2)

【年通号数】公開・登録公報2018-029

【出願番号】特願2017-563348(P2017-563348)

【国際特許分類】

C 0 7 D 205/04 (2006.01)

C 0 7 D 211/26 (2006.01)

A 6 1 K 31/4465 (2006.01)

A 6 1 K 31/397 (2006.01)

C 0 7 D 207/09 (2006.01)

A 6 1 K 31/40 (2006.01)

C 0 7 D 265/30 (2006.01)

A 6 1 K 31/5375 (2006.01)

C 0 7 D 207/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/4025 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/4178 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/427 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/42 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 409/12 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 205/04 C S P

C 0 7 D 211/26

A 6 1 K 31/4465

A 6 1 K 31/397

C 0 7 D 207/09

A 6 1 K 31/40

C 0 7 D 265/30

A 6 1 K 31/5375

C 0 7 D 207/14

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 403/12

A 6 1 K 31/4025

C 0 7 D 401/12

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/4178
 C 0 7 D 417/12
 A 6 1 K 31/427
 C 0 7 D 413/12
 A 6 1 K 31/42
 C 0 7 D 401/14
 A 6 1 K 31/444
 A 6 1 K 45/00
 A 6 1 P 31/04
 A 6 1 P 43/00 1 2 1
 A 6 1 P 43/00 1 0 5
 C 0 7 D 405/12
 C 0 7 D 409/12

【手続補正書】

【提出日】令和1年6月11日(2019.6.11)

【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

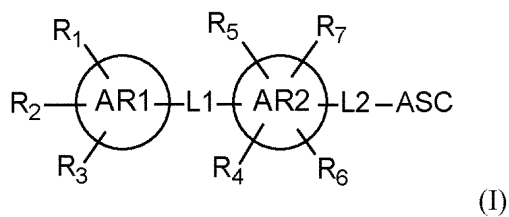
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I

【化1】

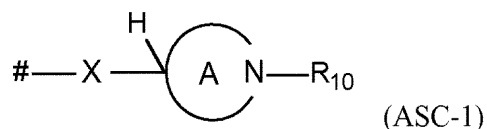


(式中、

ASCは、 $-N(R_8)(R_9)ASC-1$ であり；

ASC-1は、

【化2】



であり、

環Aは、窒素原子に加えて炭素原子を環員として含む4員～6員の飽和環を表し、ここで、環A中の1つの CH_2 部分は、任意に $CH(R_{21})$ に置き換えられており、前記窒素原子に隣接しない環A中の1つの炭素原子は、任意にOに置き換えられており、環Aは、炭素原子を介してXに結合されており；

Xは、結合、 $-CH_2-$ 、又は $-C(=O)-$ を表し；

AR1、AR2は、独立に、フェニル、又はO、S、及びNから選択される1～3つのへ

テロ原子を含む5員～6員のヘテロアリアル環を表し、ここで、AR1は、炭素原子を介してL1に結合されており、AR2は、炭素原子を介してL1及びL2に結合されており；

R₁、R₂、R₃は、独立に、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C1～C6アルキル、C1～C6ハロアルキル、C3～C8シクロアルキル、C1～C6アルコキシ、C1～C6ハロアルコキシ、-C1～C6アルキレン-N(R₁₂)R₁₃、-N(R₁₂)R₁₃、-C(O)OR₁₁、-C(O)N(R₁₂)R₁₃、又は-S(O)OR₁₁を表し；

R₄は、水素、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノ、1～5つのR₁₄で任意に置換されているC1～C6アルキル、1～5つのR₁₄で任意に置換されているC2～C6アルケニル、1～5つのR₁₄で任意に置換されているC2～C6アルキニル、1～5つのR₁₄で任意に置換されているC1～C6アルコキシ、1～5つのR₁₄で任意に置換されているC2～C6アルケニルオキシ、1～5つのR₁₄により任意に置換されているC2～C6アルキニルオキシ、-C(O)OR₁₅、-CHO、-C(O)N(R₁₆)R₁₇、-C1～C6アルキレン-N(R₉)(R₁₆)R₁₇、-O-サイクル-P、又は-O-サイクル-Qを表し；

R₅、R₆、R₇は、独立に、水素、ハロゲン、シアノ、C1～C6アルキル、C1～C6ハロアルキル、C1～C6アルコキシ、又はC1～C6ハロアルコキシを表し；

R₈は、水素、メチル、又はASC-1を表し；

R₉は、メチルであるか、又は存在せず、R₉が存在する場合、それぞれの窒素原子は、正電荷を帯び；

R₁₀は、水素又はメチルを表し；

R₁₁は、各出現で独立に、水素又はC1～C6アルキルを表し；

R₁₂、R₁₃は、各出現で独立に、水素又はC1～C6アルキルを表し；

R₁₄は、各出現で独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C1～C6アルコキシ、C1～C6ハロアルコキシ、C3～C8シクロアルキル、-C(O)OR₁₁、-CHO、-C(O)N(R₁₂)R₁₃、-C1～C6アルキレン-N(R₁₂)R₁₃、サイクル-P、-O-サイクル-P、サイクル-Q、又は-O-サイクル-Qを表し；

サイクル-Pは、各出現で独立に、1～3つのR₁₈で任意に置換されている飽和若しくは部分不飽和のC3～C8炭素環式環、又は環員としての炭素原子と、N(R₉)(R₁₂)及びOから独立に選択される1若しくは2つの環員とを含み、1～3つのR₁₈で任意に置換されている飽和若しくは部分不飽和のC3～C8複素環式環を表し；

サイクル-Qは、各出現で独立に、1～3つのR₁₉で任意に置換されているフェニル、又はO、S、及びNから選択される1～4つのヘテロ原子を含み、1～3つのR₁₉で任意に置換されている5員～6員のヘテロアリアル環を表し；

R₁₅は、各出現で独立に、水素、又は1～5つのR₁₄で任意に置換されているC1～C6アルキルを表し；

R₁₆及びR₁₇は、各出現で独立に、水素、又は1～5つのR₁₄で任意に置換されているC1～C6アルキルを表し；

R₁₈及びR₁₉は、各出現で独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、アミノ、C1～C4アルキル、C1～C4ハロアルキル、C1～C4アルコキシ、C1～C4ハロアルコキシ、又は-CO(O)R₁₁を表し；

R₂₀は、各出現で独立に、水素又はメチルを表し；

R₂₁は、N(R₂₀)₂又はCH₂-N(R₂₀)₂を表し；

L1は、-CH=CH-、-CH₂-O-、-O-CH₂-、-CH₂-O-CH₂-、-CH₂-S-、-S-CH₂-、-CH₂-S(O)-、-CH₂-S(O)₂-、-S(O)-CH₂-、-S(O)₂-CH₂-、-C(CH₃)(CH₃)-、-C(=O)-NH-、-NH-C(=O)-、-CH₂-CH₂-、-CH=CH-CH₂-、-CH₂-NH-C(=O)-、-C(=O)-NH-CH₂-、-S(O)₂-NH-CH₂-、-S(O)₂-NH-、-O-CH₂-CH₂-O-、-O-、-NH-CH₂

-、-CH₂-NH-、-CH₂-CH₂-O-、-NH-C(=O)-CH₂-O-、
又は結合を表し；

L₂は、C₁~C₇アルキレンであって、前記アルキレン中の1つ以上のCH₂部分が、
任意に、独立に-N(R₉)(R₂₀)-、-CH(N(R₉)(R₂₀)(R₂₀))
-、又は-C(=O)-に置き換えられており、L₂内に、隣接するC(=O)部分も、
隣接する-N(R₉)(R₂₀)-部分もなく、L₂の末端部分が-N(R₉)(R₂₀)
-ではない、C₁~C₇アルキレンを表すか、又はL₂は、-O-C₁~C₆アルキレン-
を表すか、又はL₂は、結合を表し、ただし、L₂が結合である場合、Xは-CH₂-
-を表し；

ここで、

L₂がC(=O)である場合、R₈は、ASC-1であり；

L₁が結合である場合、R₁は、Br又はC₂~C₆アルキルであり、且つ/又はR₄は
、O-C₂~C₆アルケニル、O-C₁~C₆アルキレン-サイクル-P₁、若しくはO
-C₁~C₆アルキレン-サイクル-Q₁であり、ここで、サイクル-P₁は、環員とし
ての炭素原子と、N(R₉)(R₁₂)及びOから独立に選択される1若しくは2つの環
員とを含み、1~3つのR₁₈で任意に置換されている飽和若しくは部分不飽和のC₃~
C₈複素環式環を表し、且つサイクル-Q₁は、O、S、及びNから選択される1~4つ
のヘテロ原子を含み、1~3つのR₁₉で任意に置換されている5員~6員のヘテロアリ
ール環を表し；

L₁が-CH₂-O-又は-NH-C(=O)-CH₂-O-であり、L₂が、上で定義
したC₁~C₇アルキレンであり、AR₁及びAR₂がフェニルであり、環Aが6員環で
あり、且つR₈が水素又はメチルである場合、R₁は、Br又はC₂~C₆アルキルであ
り、且つ/又はR₄は、O-C₂~C₆アルケニル、O-C₁~C₆アルキレン-サイク
ル-P₁、若しくはO-C₁~C₆アルキレン-サイクル-Q₁であり；

L₁が-CH₂-O-又は-NH-C(=O)-CH₂-O-であり、L₂が-CH₂-
又は-CH₂-CH₂-であり、AR₁及びAR₂がフェニルであり、環Aが4員又は5
員環であり、XがC(=O)であり、且つR₈が水素又はメチルである場合、R₁は、B
r又はC₂~C₆アルキルであり、且つ/又はR₄は、O-C₂~C₆アルケニル、O-
C₁~C₆アルキレン-サイクル-P₁、若しくはO-C₁~C₆アルキレン-サイク
ル-Q₁であり；

L₁が-O-CH₂-、-CH₂-O-CH₂-、-C(=O)-NH-、-NH-C(=O)-
、-CH₂-NH-C(=O)-、-、-O-CH₂-CH₂-O-、又は-O-で
あり、L₂が-CH₂-であり、AR₁及びAR₂がフェニルであり、XがC(=O)で
あり、且つR₈が水素又はメチルである場合、R₁は、Br又はC₂~C₆アルキルであ
り、且つ/又はR₄は、O-C₂~C₆アルケニル、O-C₁~C₆アルキレン-サイク
ル-P₁、若しくはO-C₁~C₆アルキレン-サイクル-Q₁であり；

L₁が-O-であり、且つAR₁及びAR₂がフェニルである場合、環Aは、4員又は5
員環である)

の化合物であって、

2-ピロリジンメタンアミン，N-[[4-[(4-プロモフェニル)メトキシ]-3-
メトキシフェニル]メチル]-1-メチル-；

2-ピロリジンメタンアミン，N-[[3-プロモ-4-(フェニルメトキシ)フェニル]
メチル]-1-メチル-；

2-ピロリジンメタンアミン，N-[[3-[(2-クロロフェニル)メトキシ]フェニル]
メチル]-1-メチル-；

2-ピロリジンメタンアミン，N-[[3-メトキシ-4-[[3-(トリフルオロメチ
ル)フェニル]メトキシ]フェニル]メチル]-1-メチル-；

2-ピロリジンメタンアミン，N-[[4-[(4-クロロフェニル)メトキシ]-3-
メトキシフェニル]メチル]-1-メチル-；

ベンズアミド，N-(2,4-ジフルオロフェニル)-3-[[メチル(3-ピペリジニ

ルメチル)アミノ]メチル] - ;

2 - フランカルボン酸, 5 - [[4 - [[メチル [(1 - メチル - 2 - ピペリジニル) メチル] アミノ] メチル] フェノキシ] メチル] - ;

3 - ピロリジンメタンアミン, N, 1 - ジメチル - N - [[2 - (2 - ピリジニルメトキシ) フェニル] メチル] - ;

2 - ピロリジンメタンアミン, 1 - メチル - N - [(3 - フェノキシフェニル) メチル] - ;

2 - ピロリジンメタンアミン, N - [[4 - (4 - クロロ - 2 - ニトロフェノキシ) フェニル] メチル] - 1 - メチル - ;

3 - アゼチジンアミン, N - メチル - N - [(3 - フェノキシフェニル) メチル] - ;

3 - ピロリジンアミン, N - メチル - N - [(3 - フェノキシフェニル) メチル] - ;

3 - ピロリジンアミン, 1 - メチル - N - [(3 - フェノキシフェニル) メチル] - ;

2 - ピロリジンメタンアミン, N - [[4 - (4 - プロモフェノキシ) フェニル] メチル] - N - メチル - ;

3 - ピロリジニカルボキサミド, N - [[2 - (3 - メトキシフェノキシ) - 3 - ピリジニル] メチル] - ;

4 - ピペリジニカルボキサミド, N - [[6 - (2, 5 - ジメチルフェノキシ) - 3 - ピリジニル] メチル] - ;

2 - ピロリジニカルボキサミド, N - [[2 - (3, 4 - ジメチルフェノキシ) - 4 - ピリジニル] メチル] - ;

4 - ピペリジンアミン, N - [[5 - プロモ - 2 - (2 - ピリジニルメトキシ) フェニル] メチル] - 1 - メチル -

ではない、式 I の化合物、

又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 2】

A R 1 は、フェニル、ピリジニル、又はチアゾリルを表し、且つ A R 2 は、フェニル、ピリジニル、又はフラニルを表す、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 3】

A R 1 及び A R 2 は、フェニルを表す、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 4】

A R 1 は、ピリジニルを表し、且つ A R 2 は、フェニルを表す、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 5】

A R 1 は、ピリジニルを表し、且つ A R 2 は、ピリジニルを表す、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 6】

A R 1 及び A R 2 は、ピリジニルを表す、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 7】

L 1 は、- C H = C H - を表す、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 8】

L 1 は、- C H ₂ - O - を表す、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 9】

L 1 は、- C (C H ₃) (C H ₃) - を表す、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 10】

L 2 は、C 1 ~ C 7 アルキレンであって、前記アルキレン中の 1 つ以上の C H₂ 部分が任意に、独立に - N (R₉) (R₂₀) -、- C H (N (R₉) (R₂₀) (R₂₀)) -、又は - C (= O) - に置き換えられており、L 2 内に、隣接する C (= O) 部分も、隣接する - N (R₉) (R₂₀) - 部分もなく、L 2 の末端部分が - N (R₉) (R₂₀) - ではない、C 1 ~ C 7 アルキレンを表すか、又は L 2 は、- O - C 1 ~ C 6 アルキレン - を表す、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 1 1】

環 A は、窒素原子に加えて C H₂ 部分のみを環員として含む 4 員 ~ 6 員の飽和環である、請求項 1 ~ 1 0 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 1 2】

X は、C H₂ であり；

L 2 は、C 1 ~ C 7 アルキレンであって、前記アルキレン中の 1 つ以上の C H₂ 部分が任意に、独立に - N (R₉) (R₂₀) -、- C H (N (R₉) (R₂₀) (R₂₀)) -、又は - C (= O) - に置き換えられており、L 2 内に、隣接する C (= O) 部分も、隣接する - N (R₉) (R₂₀) - 部分もなく、L 2 の末端部分が - N (R₉) (R₂₀) - ではなく、ASC に結合されている L 2 の末端部分が - C H₂ - である、C 1 ~ C 7 アルキレンを表すか、又は L 2 は、- O - C 1 ~ C 6 アルキレン - を表す、請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 1 3】

L 2 は、C 1 ~ C 7 アルキレンであって、前記アルキレン中の 1 又は 2 つの C H₂ 部分が任意に、独立に - N (R₉) (R₂₀) - 又は - C (= O) - に置き換えられており、ASC に結合されている L 2 の末端部分が - C H₂ - である、C 1 ~ C 7 アルキレンを表す、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 1 4】

L 2 は、- C H₂ -、- C H₂ - C H₂ -、- C H₂ - C H₂ - C H₂ -、- C H (C H₃) -、- C H₂ - N H - C H₂ - C H₂ -、- C (= O) -、- C (= O) - C H₂ -、- C (= O) - N H - C H₂ - C (= O) -、- C (= O) - N H - C H₂ - C H₂ -、- C H₂ - N⁺ (C H₃)₂ - C H₂ - C (= O) -、- C H₂ - N H - C (= O) - C H₂ -、- C H₂ - N H - C H₂ - C (= O) -、- O - C H₂ - C H₂ -、- O - C H₂ - C H₂ - C H₂ -、又は - O - C H₂ - C H₂ - C H₂ - C H₂ - を表す、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 1 5】

L 2 は、- C H₂ -、- C H₂ - C H₂ -、- C H (C H₃) -、- C H₂ - C H₂ - C H₂ -、- C H₂ - N H - C H₂ - C H₂ -、- C (= O) -、- C (= O) - N H - C H₂ - C H₂ -、- O - C H₂ - C H₂ -、- O - C H₂ - C H₂ - C H₂ -、又は - O - C H₂ - C H₂ - C H₂ - C H₂ - を表す、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

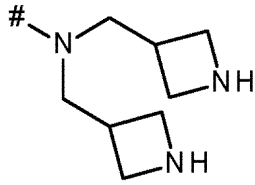
【請求項 1 6】

L 2 は、- O - C H₂ -、- O - C H₂ - C H₂ -、- O - C H₂ - C H₂ - C H₂ -、- O - C H₂ - C H₂ - C H₂ - C H₂ -、又は - O - C H₂ - C H₂ - C H₂ - C H₂ - C H₂ - C H₂ - を表す、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 1 7】

R₈ は、ASC - 1 を表し、その場合、ASC は、ASC - o

【化 3】



(ASC-o)

であつてもよい、請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

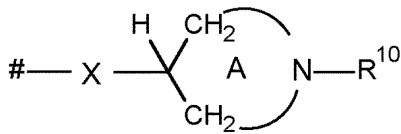
【請求項 18】

L 2 は、 $-C(=O)-$ を表す、請求項 17 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

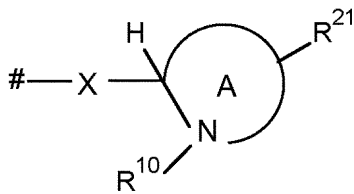
【請求項 19】

ASC - 1 は、ASC - 1 a 又は ASC - 1 b

【化 4】



(ASC-1a)



(ASC-1b)

である、請求項 1 ~ 18 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

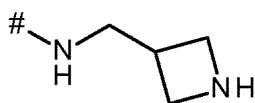
【請求項 20】

環 A は、窒素原子に加えて炭素原子を環員として含む 4 員 ~ 6 員の飽和環を表す、請求項 19 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

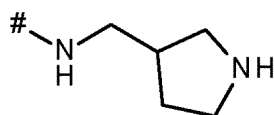
【請求項 21】

ASC - 1 は、環 A が窒素原子に加えて炭素原子を環員として含む 4 員 ~ 5 員の飽和環を表し、且つ X が CH_2 を表す、ASC - 1 a であり、その場合、ASC は、ASC - a 又は ASC - g

【化 5】



(ASC-a)



(ASC-g)

であつてもよい、請求項 20 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 22】

L2 は、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH_2-NH-CH_2-CH_2-$ 、 $-C(=O)-NH-CH_2-CH_2-$ 、 $-O-CH_2-CH_2-$ 、 $-O-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、又は $-O-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$ を表す、請求項 21 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 23】

ASC は、 $-N(R_{8a})ASC-1$ 又は $-N(R_{8b})(R_9)ASC-1$ であり；
環 A は、窒素原子に加えて炭素原子を環員として含む 4 員～5 員の飽和環を表し；

X は、 CH_2 を表し；

L1 は、 $-CH=CH-$ 、 $-CH_2-O-$ 、 $-O-CH_2-$ 、 $-CH_2-O-CH_2-$ 、 $-CH_2-S-$ 、 $-S-CH_2-$ 、 $-CH_2-S(O)-$ 、 $-CH_2-S(O_2)-$ 、 $-S(O)-CH_2-$ 、 $-S(O_2)-CH_2-$ 、 $-C(CH_3)(CH_3)-$ 、 $-C(=O)-NH-$ 、 $-NH-C(=O)-$ 、 $-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH=CH-CH_2-$ 、 $-CH_2-NH-C(=O)-$ 、 $-C(=O)-NH-CH_2-$ 、 $-S(O_2)-NH-CH_2-$ 、 $-S(O_2)-NH-$ 、 $-O-CH_2-CH_2-O-$ 、 $-O-$ 、 $-NH-CH_2-$ 、 $-CH_2-NH-$ 、 $-CH_2-CH_2-O-$ 、又は $-NH-C(=O)-CH_2-O-$ を表し；

R_{8a} は、水素又は ASC-1 を表し；

R_{8b} は、メチル又は ASC-1 を表し；

R_9 は、メチルを表し；且つ

R_{10} は、水素を表す、

請求項 1～22 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 24】

R_4 は、 $O-R_{22}$ を表し、 R_{22} は、 $C_3\sim C_6$ アルキル、 $C_2\sim C_6$ アルケニル、 $C_1\sim C_6$ アルキル-サイクル-P1、 $C_1\sim C_6$ アルキル-サイクル-Q1 である、請求項 1～23 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

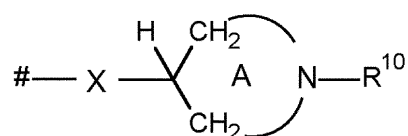
【請求項 25】

R_4 は、 $O-R_{22}$ を表し、 R_{22} は、 $C_2\sim C_6$ アルケニルである、請求項 1～23 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 26】

ASC-1 は、ASC-1a

【化 6】



(ASC-1a)

であり、

環 A は、窒素原子に加えて炭素原子を環員として含む 4 員～5 員の飽和環を表し；

X は、 CH_2 を表し；

AR1 は、フェニル又はピリジニルを表し；

AR₂ は、フェニル又はピリジニルを表し；

R₁ 及び R₂ は、独立に、水素、ハロゲン、シアノ、C₁ ~ C₆ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、C₁ ~ C₆ アルコキシ、C₁ ~ C₆ ハロアルコキシ、-C(O)OR₁₁、又は -C(O)N(R₁₂)R₁₃ を表し；

R₃ は、水素であり；

R₄ は、水素、ハロゲン、シアノ、C₁ ~ C₆ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、又は O-R₂₂ を表し；

R₅、R₆、R₇ は、水素又はハロゲンであり；

R₈ は、水素、メチル、又は ASC-1 を表し；

R₉ は、メチルであるか、又は存在せず；

R₁₀ は、水素を表し；

R₁₁ は、各出現で独立に、水素又は C₁ ~ C₆ アルキルを表し；

R₁₂ 及び R₁₃ は、各出現で独立に、水素又は C₁ ~ C₆ アルキルを表し；

R₁₈ 及び R₁₉ は、各出現で独立に、ハロゲン、シアノ、メチル、ハロメチル、メトキシ、又はハロメトキシを表し；

R₂₂ は、C₁ ~ C₆ アルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、C₂ ~ C₆ ハロアルケニル、C₁ ~ C₆ アルキル-サイクル-P、C₁ ~ C₆ アルキル-サイクル-Q、C₂ ~ C₆ アルケニル-サイクル-P、又は C₂ ~ C₆ アルケニル-サイクル-Q を表し；

サイクル-P は、各出現で独立に、それぞれ 1 ~ 3 つの R₁₈ で任意に置換されている、テトラヒドロフランル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、ジオキサニル、又はモルホリニルを表し；

サイクル-Q は、各出現で独立に、それぞれ 1 ~ 3 つの R₁₉ で任意に置換されている、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、イソチアゾリル、チアゾリル、テトラゾリル、フラニル、又はチオフェニルを表し；

L₁ は、-CH=CH-、-CH₂-O-、又は -C(CH₃)(CH₃)- を表し；

L₂ は、-CH₂-、-CH₂-CH₂-、-CH(CH₃)-、-CH₂-CH₂-CH₂-、-CH₂-NH-CH₂-CH₂-、-C(=O)-、-C(=O)-NH-CH₂-CH₂-、-O-CH₂-、-O-CH₂-CH₂-、-O-CH₂-CH₂-CH₂-、又は -O-CH₂-CH₂-CH₂-CH₂- を表す、

請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

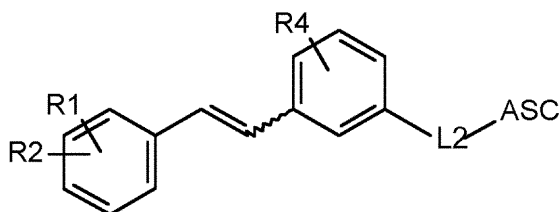
【請求項 27】

R₈ は、ASC-1 を表し、且つ L₂ は、-C(=O)- を表す、請求項 26 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 28】

式 I-20

【化 7】



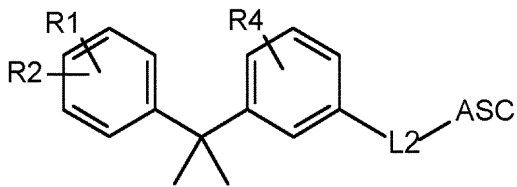
(I-20)

の化合物である請求項 26 若しくは 27 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 29】

式 I - 2 1

【化 8】



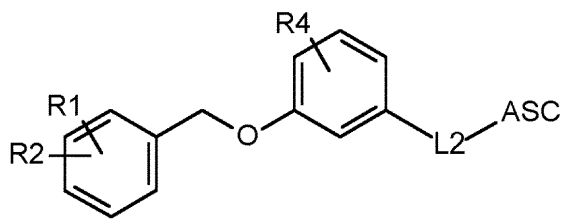
(I-21)

の化合物である請求項 2 6 若しくは 2 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 3 0】

式 I - 2 2

【化 9】



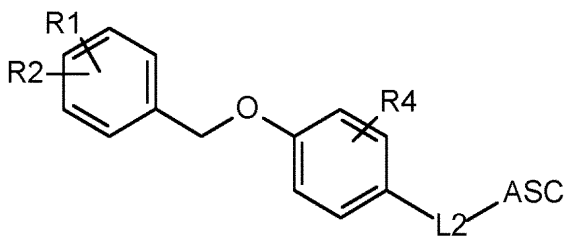
(I-22)

の化合物である請求項 2 6 若しくは 2 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 3 1】

式 I - 2 3

【化 1 0】



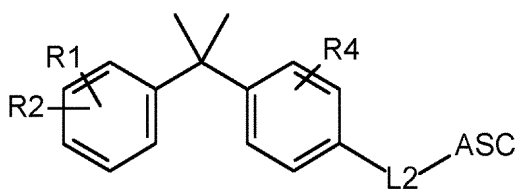
(I-23)

の化合物である請求項 2 6 若しくは 2 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 3 2】

式 I - 2 4

【化 1 1】



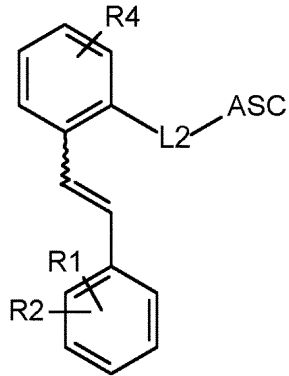
(I-24)

の化合物である請求項 2 6 若しくは 2 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 3 3】

式 I - 2 5

【化 1 2】



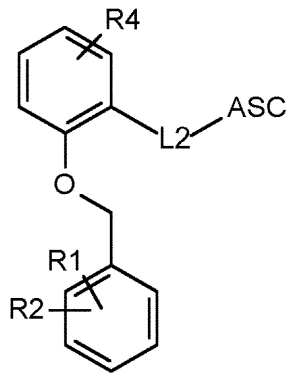
(I-25)

の化合物である請求項 2 6 若しくは 2 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 3 4】

式 I - 2 6

【化 1 3】



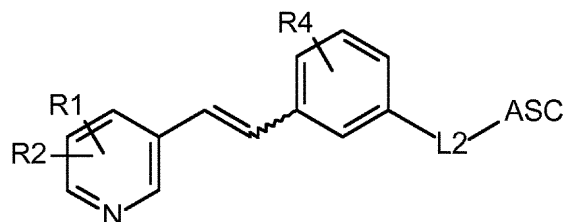
(I-26)

の化合物である請求項 2 6 若しくは 2 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 3 5】

式 I - 2 7

【化 1 4】



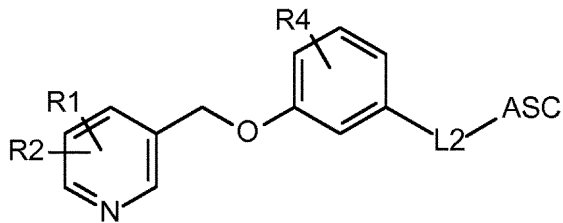
(I-27)

の化合物である請求項 2 6 若しくは 2 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 3 6】

式 I - 2 8

【化 1 5】



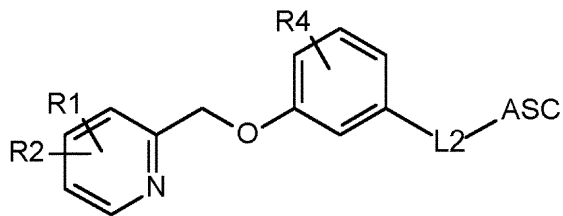
(I-28)

の化合物である請求項 2 6 若しくは 2 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 3 7】

式 I - 2 9

【化 1 6】



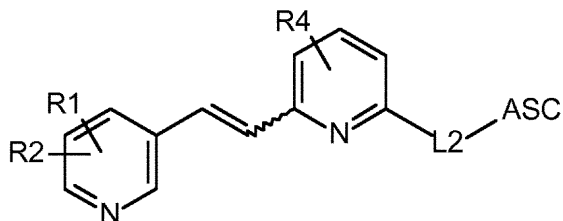
(I-29)

の化合物である請求項 2 6 若しくは 2 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 3 8】

式 I - 3 0

【化 1 7】



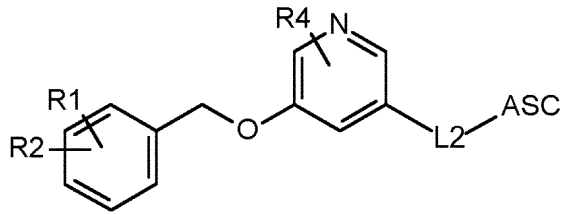
(I-30)

の化合物である請求項 2 6 若しくは 2 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 3 9】

式 I - 3 1

【化 1 8】



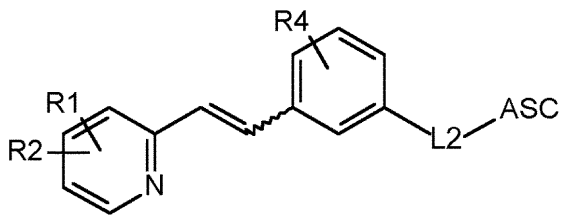
(I-31)

の化合物である請求項 2 6 若しくは 2 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 4 0】

式 I - 3 2

【化 1 9】



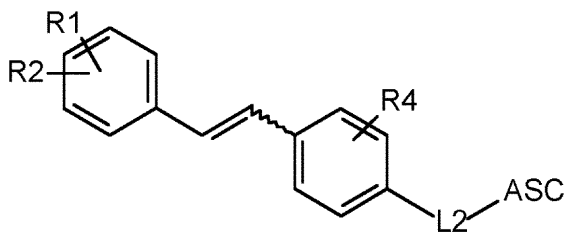
(I-32)

の化合物である請求項 2 6 若しくは 2 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 4 1】

式 I - 3 3

【化 2 0】



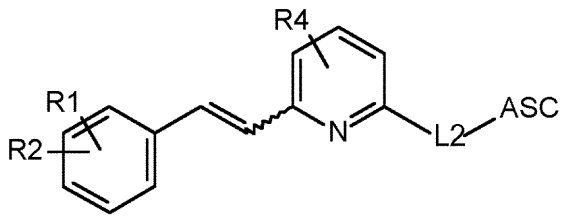
(I-33)

の化合物である請求項 2 6 若しくは 2 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 4 2】

式 I - 3 4

【化 2 1】



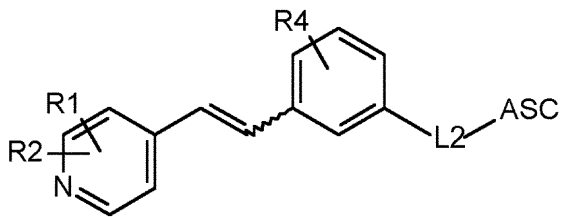
(I-34)

の化合物である請求項 2 6 若しくは 2 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 4 3】

式 I - 3 5

【化 2 2】



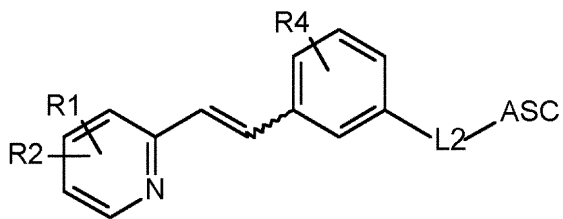
(I-35)

の化合物である請求項 2 6 若しくは 2 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 4 4】

式 I - 3 6

【化 2 3】



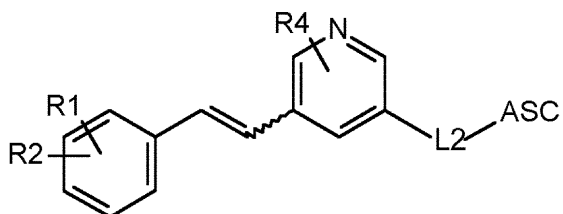
(I-36)

の化合物である請求項 2 6 若しくは 2 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 4 5】

式 I - 3 7

【化 2 4】



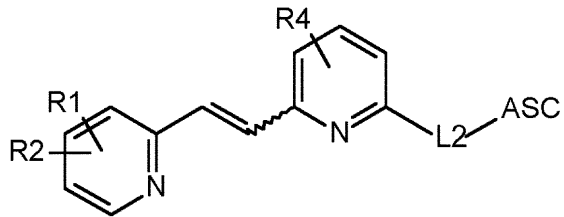
(I-37)

の化合物である請求項 2 6 若しくは 2 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

【請求項 4 6】

式 I - 3 8

【化 2 5】



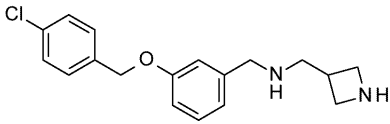
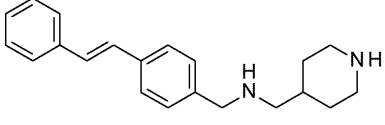
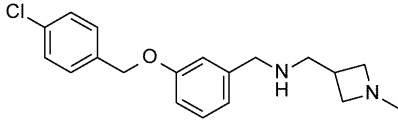
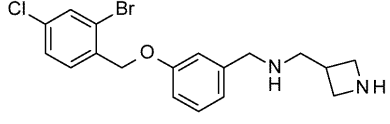
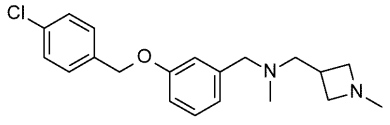
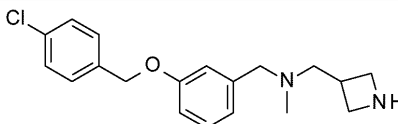
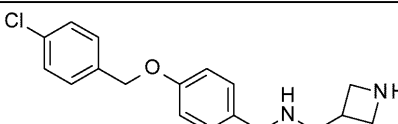
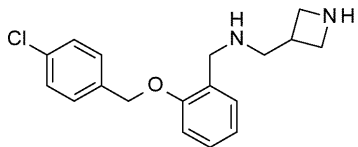
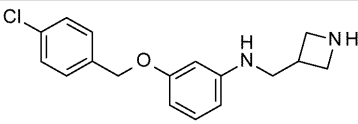
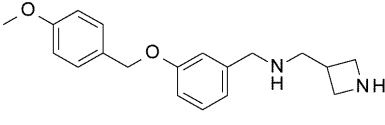
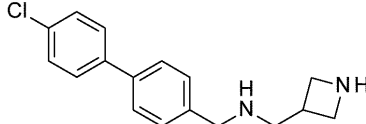
(I-38)

の化合物である請求項 2 6 若しくは 2 7 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物。

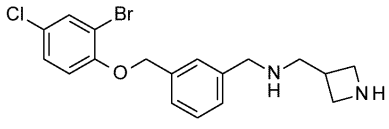
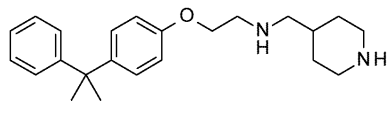
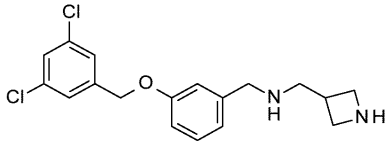
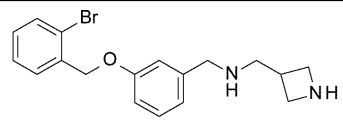
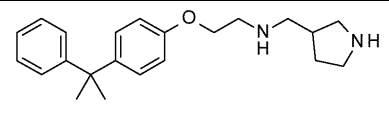
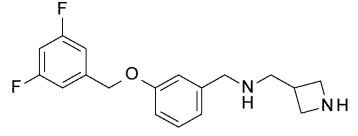
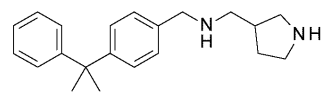
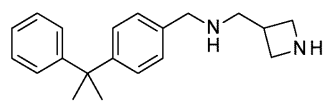
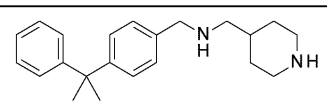
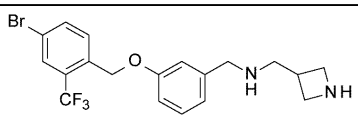
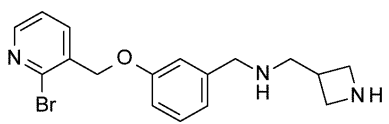
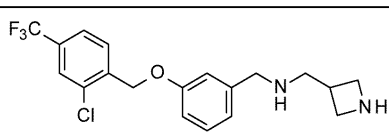
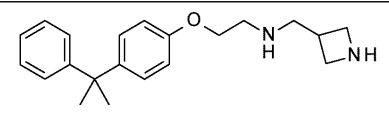
【請求項 4 7】

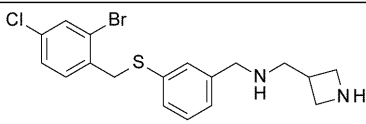
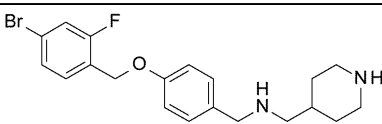
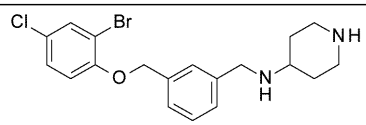
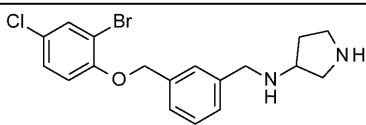
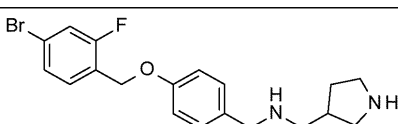
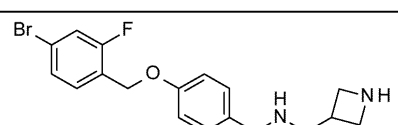
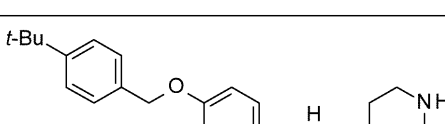
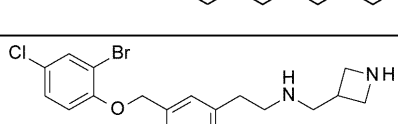
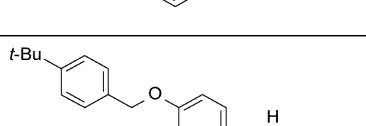
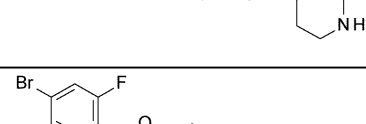
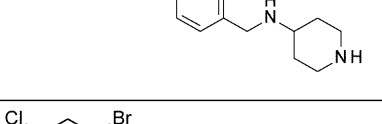
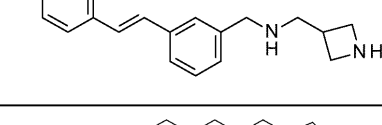
以下の表中の化合物：

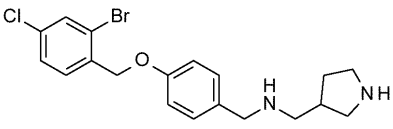
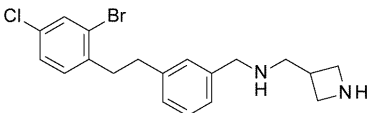
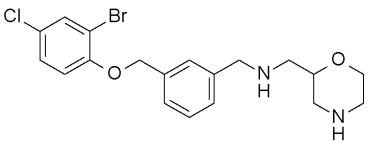
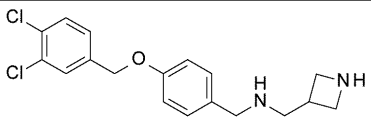
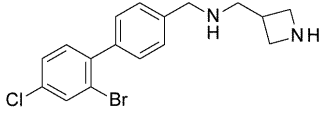
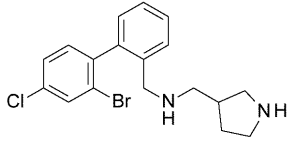
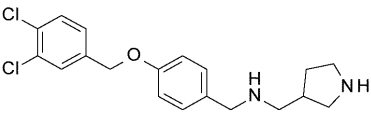
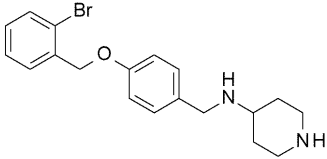
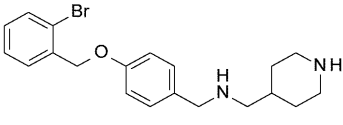
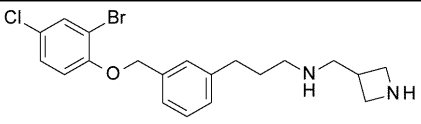
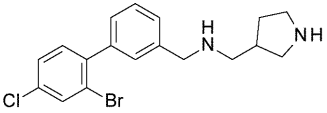
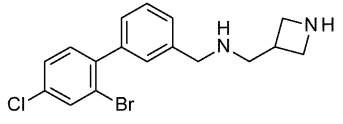
【表 1】

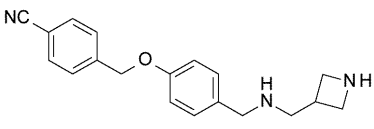
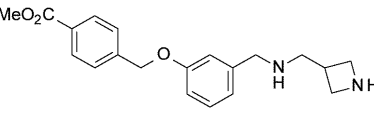
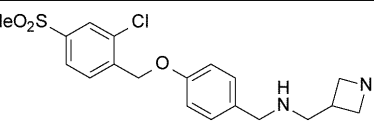
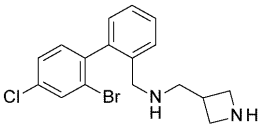
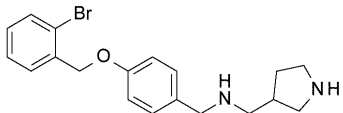
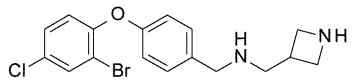
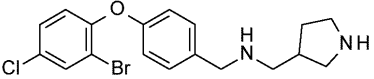
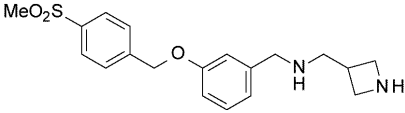
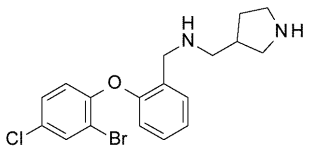
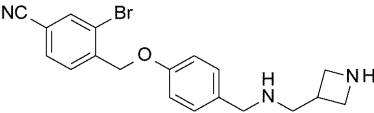
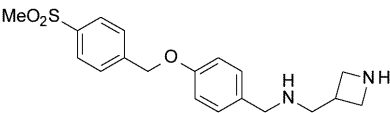
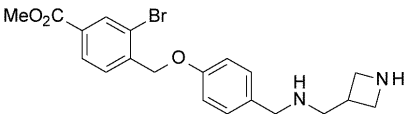
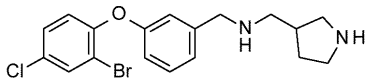
化合物番号	構造式
13	
16	
17	
18	
19	
20	
21	
22	
23	
24	
25	

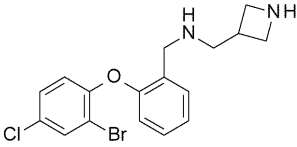
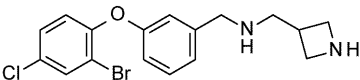
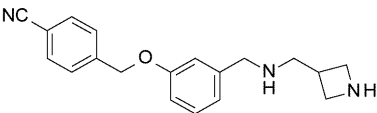
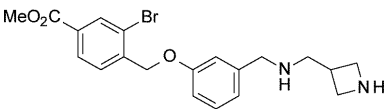
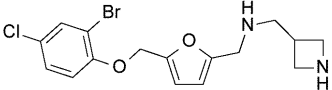
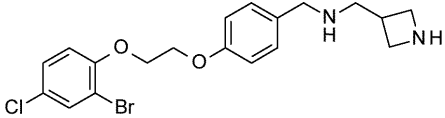
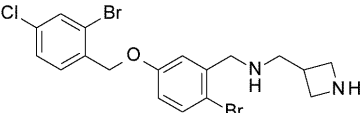
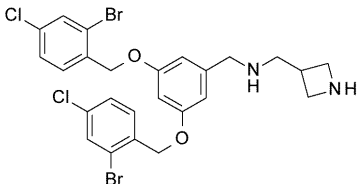
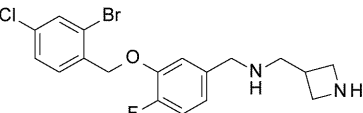
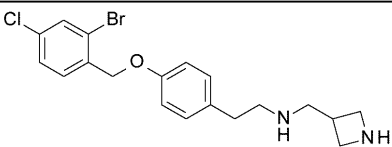
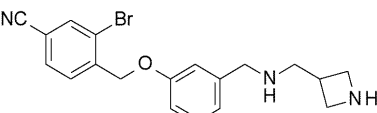
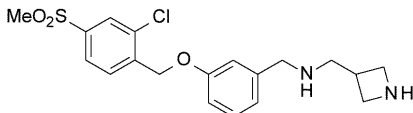
26	
27	
28	
29	
30	
31	
32	
33	
34	
35	
36	
37	

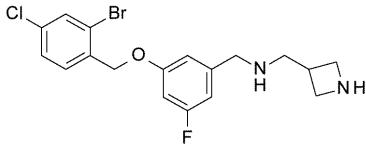
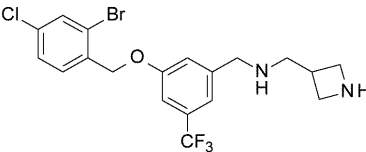
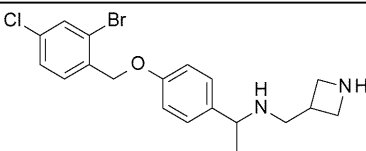
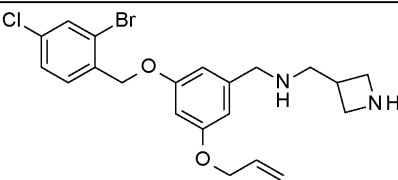
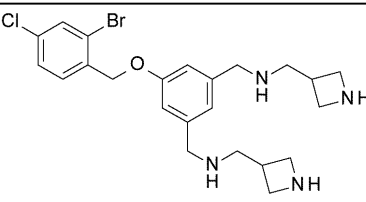
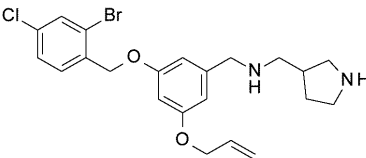
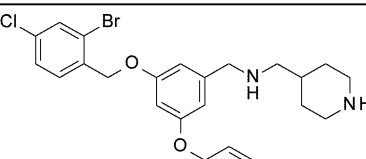
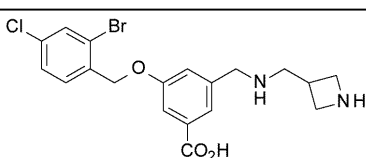
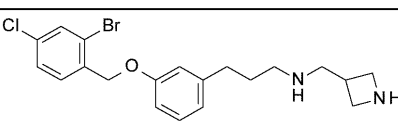
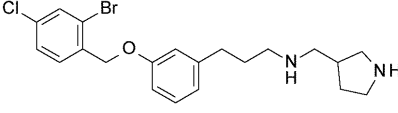
38	
39	
40	
41	
42	
43	
44	
45	
46	
47	
48	
49	
50	

51	
52	
53	
54	
55	
56	
57	
58	
59	
60	
61	
62	

63	
64	
65	
66	
68	
69	
70	
71	
72	
73	
74	
75	

76	
77	
78	
79	
80	
81	
82	
83	
84	
85	
86	
87	
88	

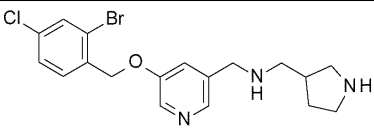
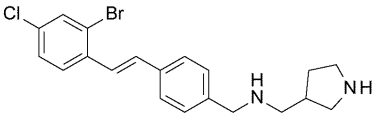
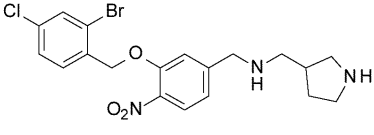
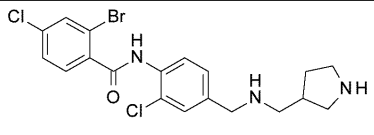
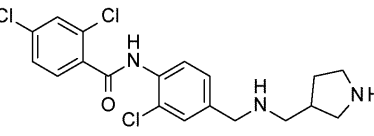
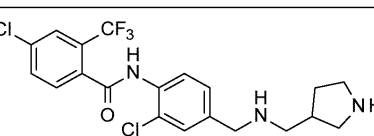
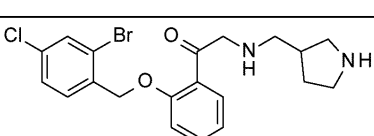
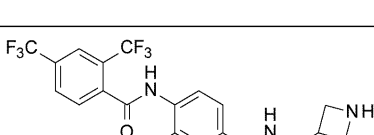
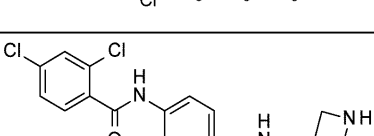
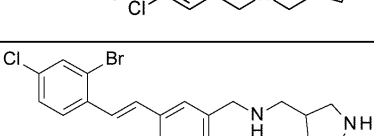
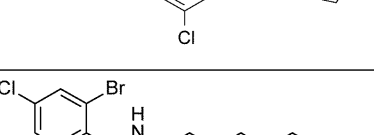
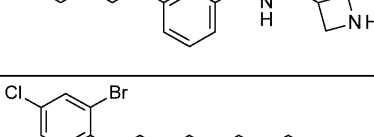
89	
90	
91	
92	
93	
96	
97	
98	
99	
100	
101	
102	

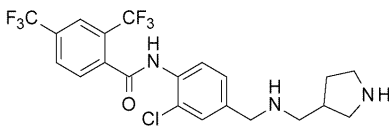
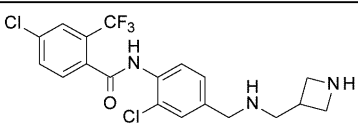
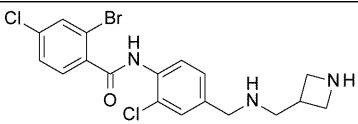
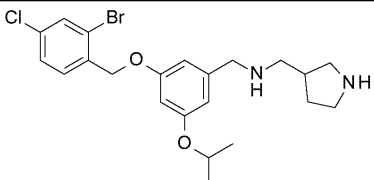
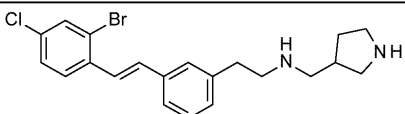
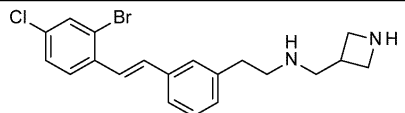
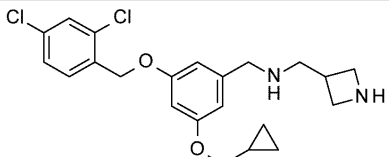
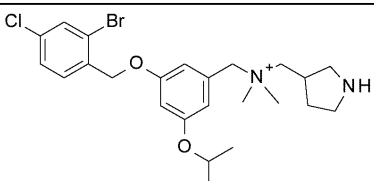
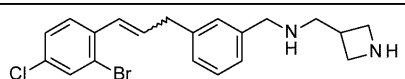
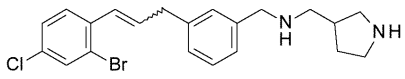
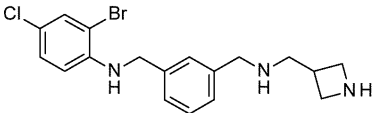
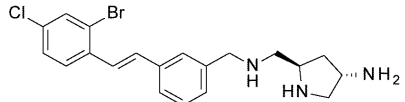
103	 <chem>Clc1cc(Br)ccc1COc2ccc(F)cc2CNCC3NCC3</chem>
104	 <chem>Clc1cc(Br)ccc1COc2ccc(C(F)(F)F)cc2CNCC3NCC3</chem>
105	 <chem>Clc1cc(Br)ccc1COc2ccc(C)cc2CNCC3NCC3</chem>
106	 <chem>Clc1cc(Br)ccc1COc2ccc(OCC=C)cc2CNCC3NCC3</chem>
107	 <chem>Clc1cc(Br)ccc1COc2ccc(CNCC3NCC3)cc2CNCC4NCC4</chem>
108	 <chem>Clc1cc(Br)ccc1COc2ccc(OCC=C)cc2CNCC3NCC3</chem>
109	 <chem>Clc1cc(Br)ccc1COc2ccc(OCC=C)cc2CNCC4NCCN4</chem>
110	 <chem>Clc1cc(Br)ccc1COc2ccc(C(=O)O)cc2CNCC3NCC3</chem>
111	 <chem>Clc1cc(Br)ccc1COc2ccc(CCC)cc2CNCC3NCC3</chem>
112	 <chem>Clc1cc(Br)ccc1COc2ccc(CCC)cc2CNCC3NCC3</chem>

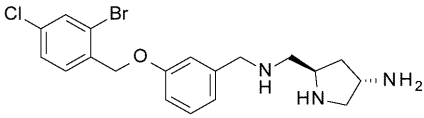
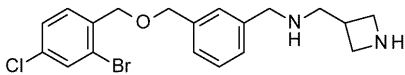
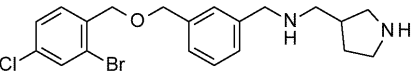
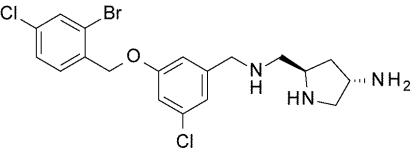
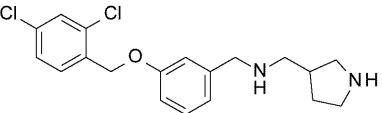
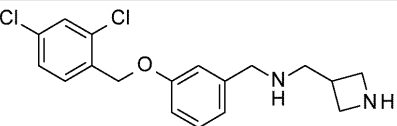
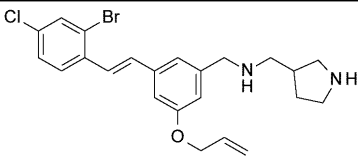
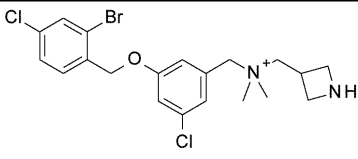
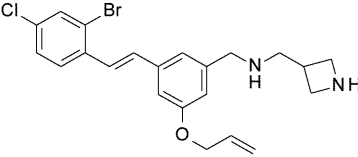
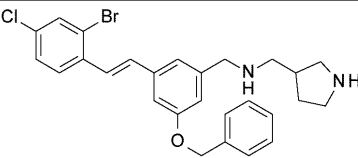
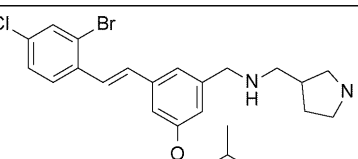
113	
114	
115	
116	
117	
118	
119	
120	
121	
122	
123	

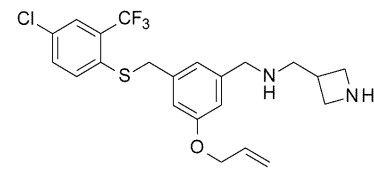
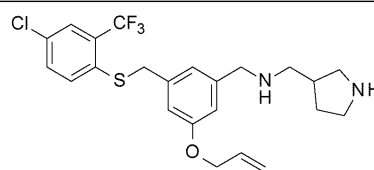
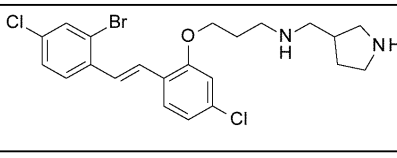
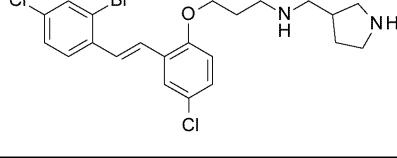
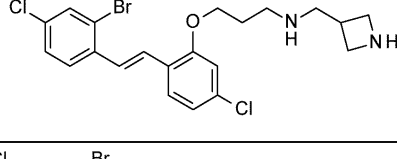
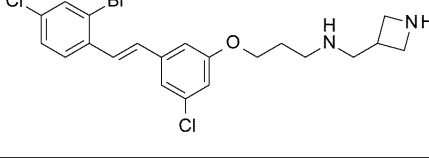
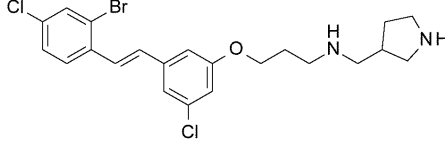
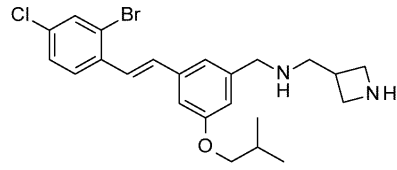
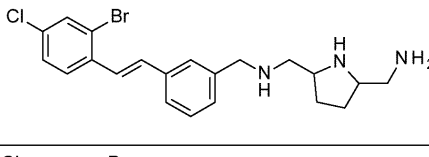
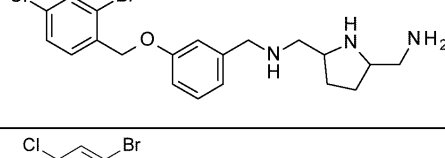
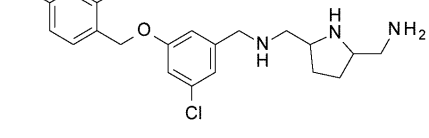
124	<chem>COc1ccc(cc1OCc2ccc(Cl)c(Br)c2)NCc3cc[nH]3</chem>
125	<chem>OC1=CC=C(C=C1OCc2ccc(Cl)c(Br)c2)NCc3cc[nH]3</chem>
126	<chem>OC1=CC=C(C=C1OCc2ccc(Cl)c(Br)c2)OCCNCc3cc[nH]3</chem>
127	<chem>O=Cc1ccc(cc1OCc2ccc(Cl)c(Br)c2)NCc3cc[nH]3</chem>
128	<chem>OCc1ccc(cc1OCc2ccc(Cl)c(Br)c2)NCc3cc[nH]3</chem>
129	<chem>CCOC(=O)/C=C/c1ccc(cc1OCc2ccc(Cl)c(Br)c2)NCc3cc[nH]3</chem>
130	<chem>C1=CC=C(C=C1OCc2ccc(Cl)c(Br)c2)/C=C/c3ccoc3NCc4cc[nH]4</chem>
131	<chem>OC1=CC=C(C=C1OCc2ccc(Cl)c(C(F)(F)F)c2)NCc3cc[nH]3</chem>
132	<chem>OC1=CC=C(C=C1OCc2ccc(Cl)c(C(F)(F)F)c2)NCc3cc[nH]3</chem>
133	<chem>OC1=CC=C(C=C1SCc2ccc(Cl)c(Br)c2)NCc3cc[nH]3</chem>

134	
135	
136	
137	
138	
139	
140	
141	
142	
143	
144	
145	

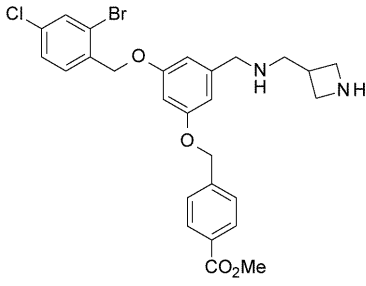
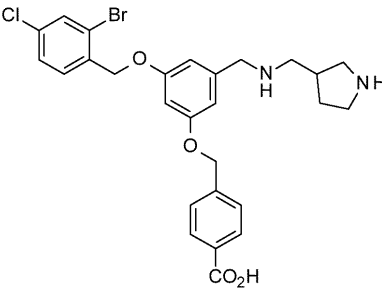
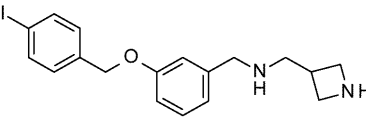
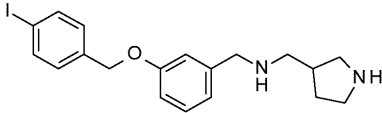
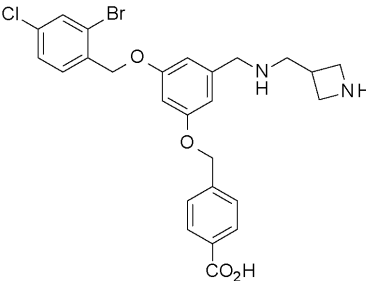
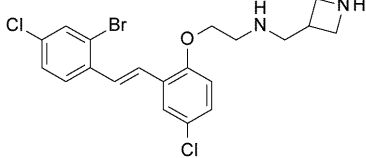
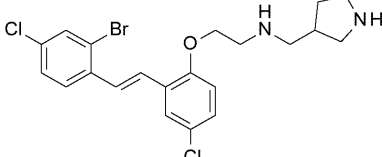
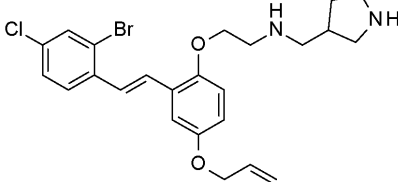
146	
147	
148	
151	
152	
153	
154	
155	
156	
157	
158	
159	

160	
161	
162	
163	
164	
165	
166	
167	
168	
169	
170	
171	

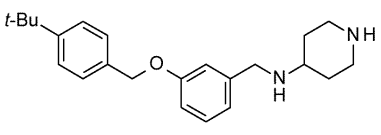
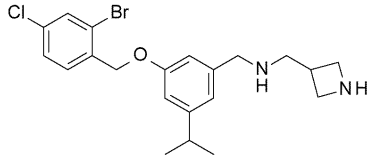
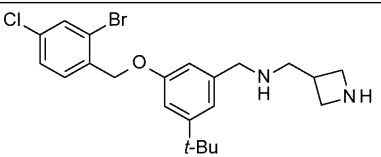
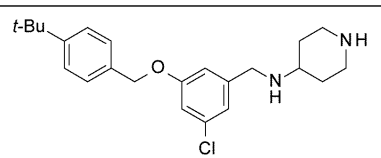
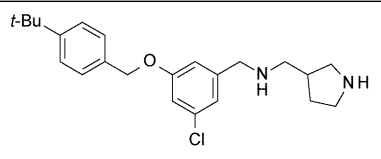
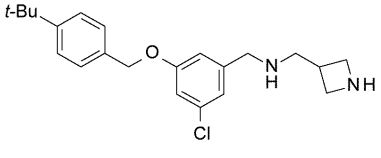
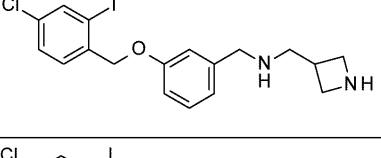
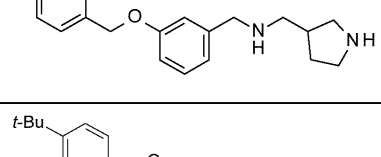
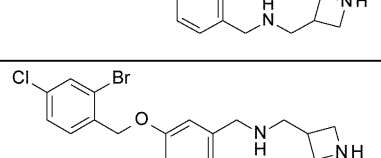
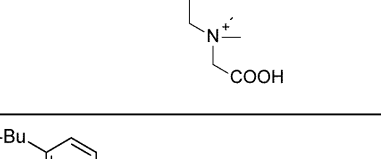
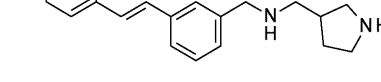
172	
173	
174	
175	
176	
177	
178	
179	
180	
181	
182	

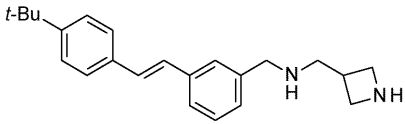
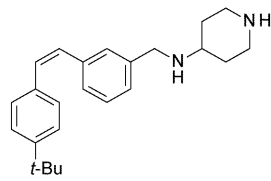
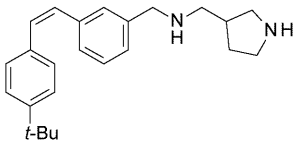
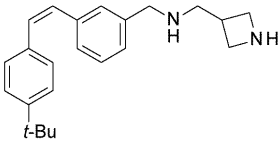
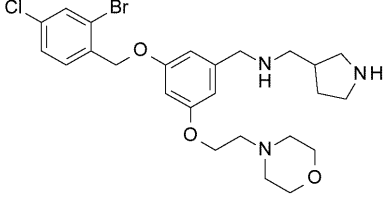
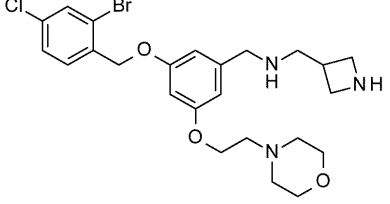
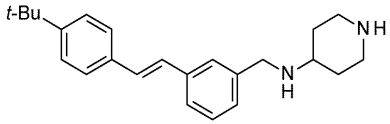
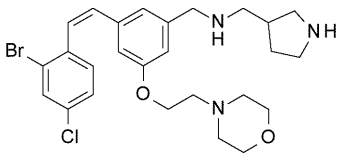
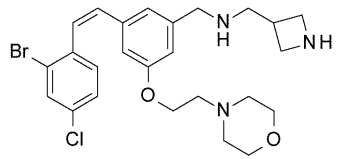
183	
184	
185	
186	
187	
188	
189	
190	
191	
192	
193	

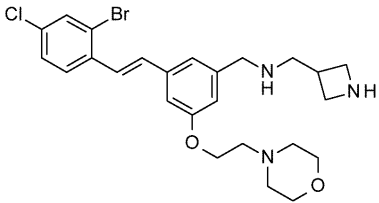
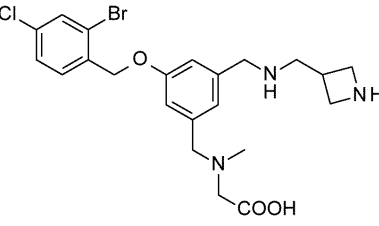
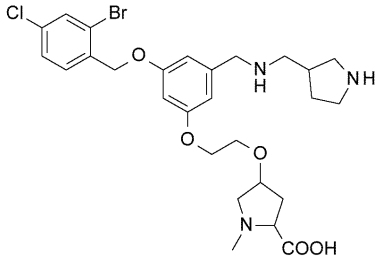
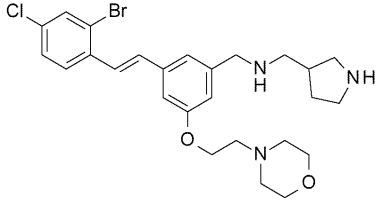
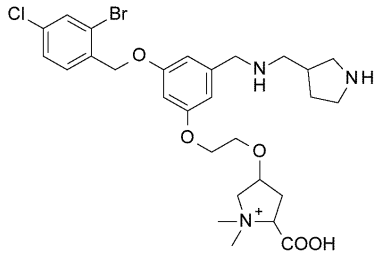
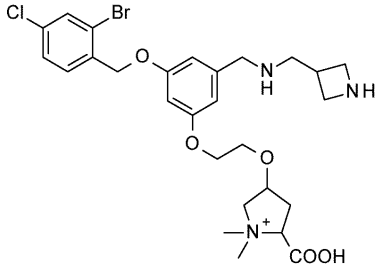
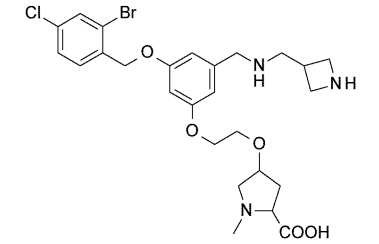
194	
195	
196	
197	
198	
199	
200	
201	
202	
203	

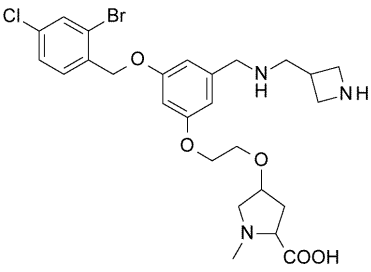
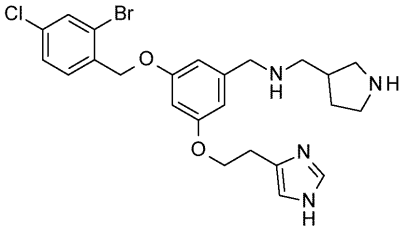
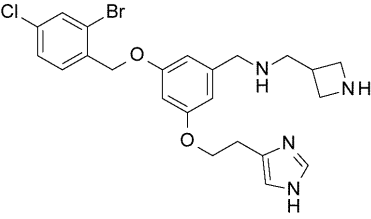
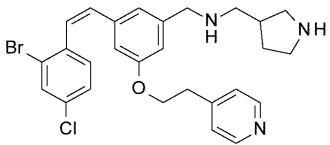
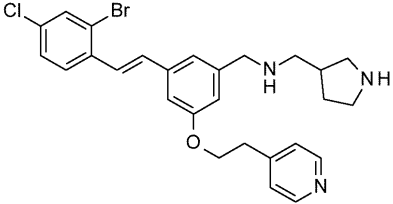
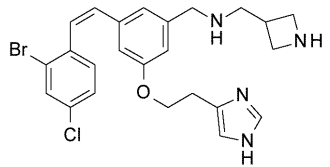
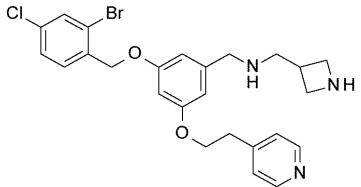
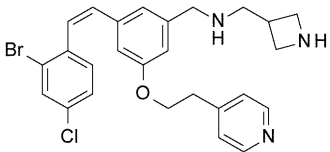
204	
205	
206	
207	
208	
209	
210	
211	

212	
213	
214	
215	
216	
217	
218	
219	
220	
221	
222	

223	
224	
225	
226	
227	
228	
229	
230	
231	
232	
233	

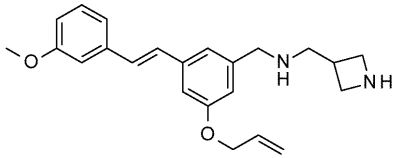
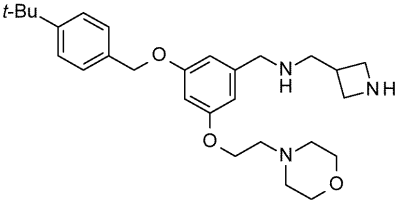
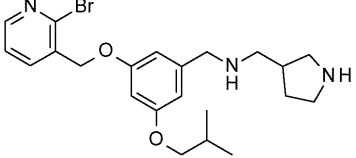
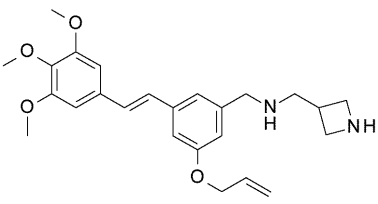
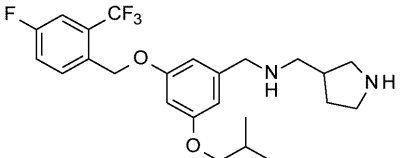
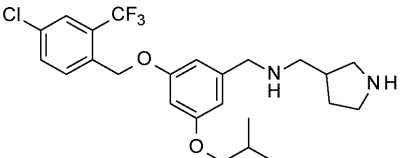
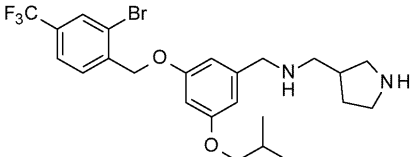
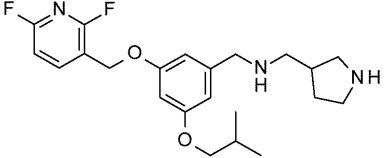
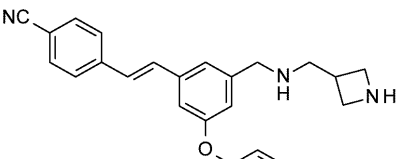
234	
235	
236	
237	
238	
239	
240	
241	
242	

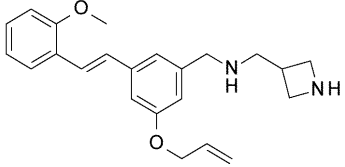
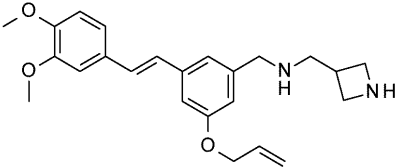
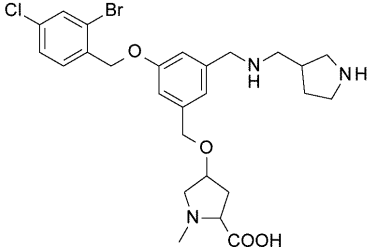
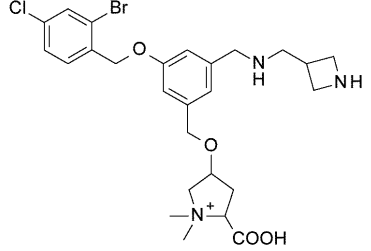
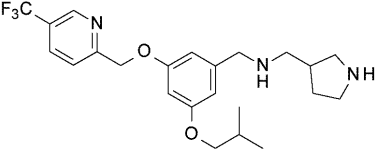
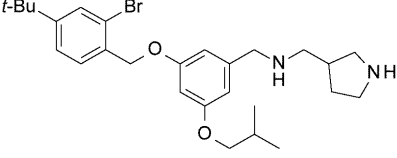
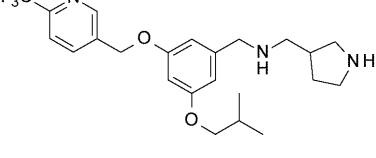
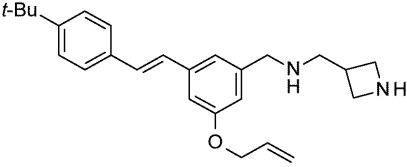
243	
244	
245	
246	
247	
248	
249	

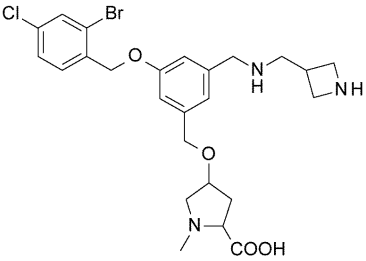
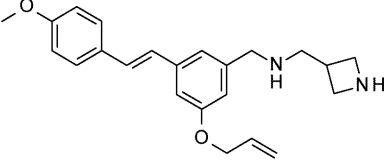
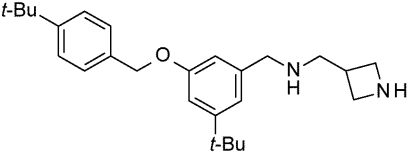
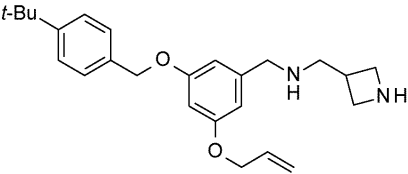
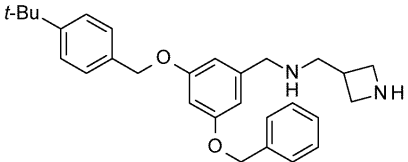
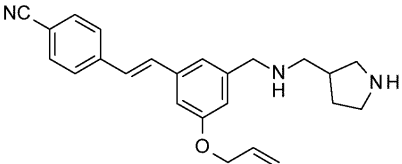
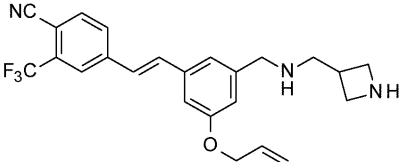
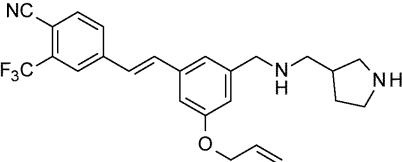
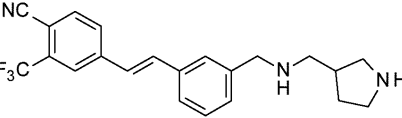
250	
251	
252	
253	
254	
255	
256	
257	

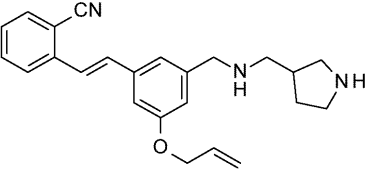
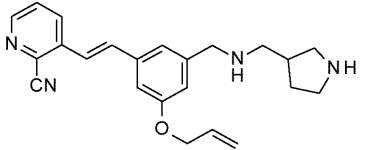
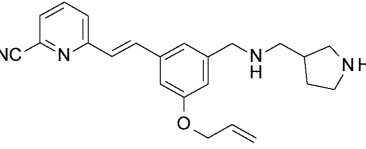
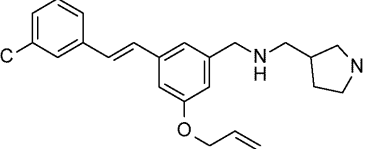
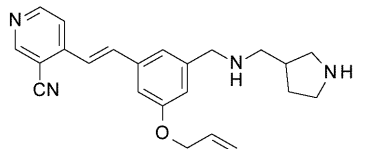
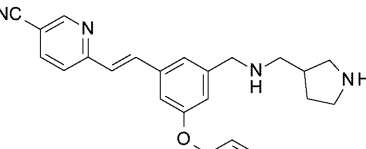
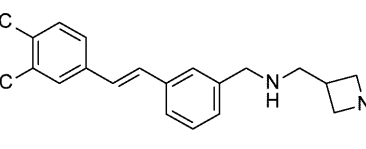
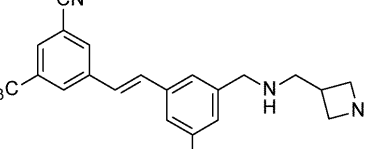
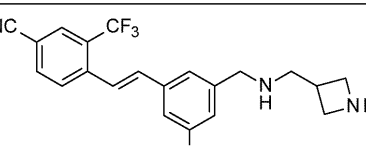
258	 <chem>Clc1cc(Br)ccc1COc2ccc(OCc3ccncc3)cc2CNCC4CCNC4</chem>
259	 <chem>BrC1=CC=C(Cl)C=C1/C=C/c2ccccc2OCc3c[nH]cn3CNCC4CCNC4</chem>
260	 <chem>Clc1cc(Br)ccc1/C=C/c2ccccc2OCc3ccncc3CNCC4CCNC4</chem>
261	 <chem>BrC1=CC=C(Cl)C=C1/C=C/c2ccccc2OCc3c[nH]cn3CNCC4CCNC4</chem>
262	 <chem>BrC1=CC=C(Cl)C=C1/C=C/c2ccccc2OCc3c[nH]cn3CNCC4CCNC4</chem>
263	 <chem>Clc1cc(Br)ccc1COc2ccc(OCc3ccncc3)cc2CNCC4CCNC4</chem>
264	 <chem>FC(F)(F)c1ccc(CO)cc1Oc2ccc(OCc3ccncc3)cc2CNCC4CCNC4</chem>
265	 <chem>FC(F)(F)c1cc(C(F)(F)F)ccc1COc2ccc(OCc3ccncc3)cc2CNCC4CCNC4</chem>

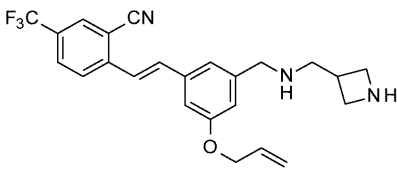
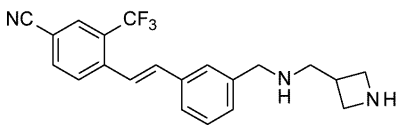
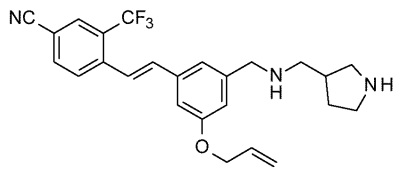
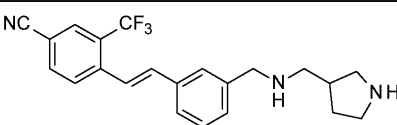
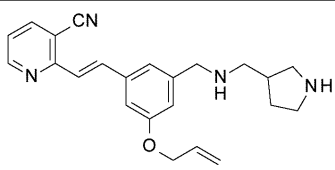
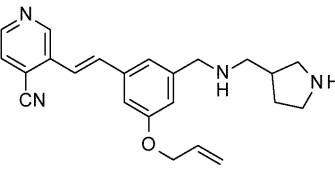
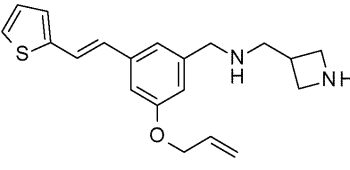
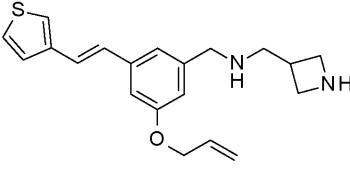
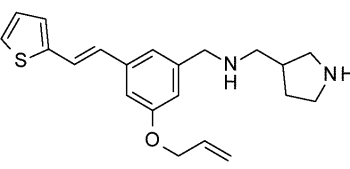
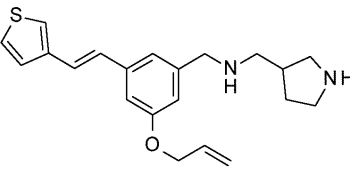
266	
267	
268	
269	
270	
271	
272	
273	
274	
275	

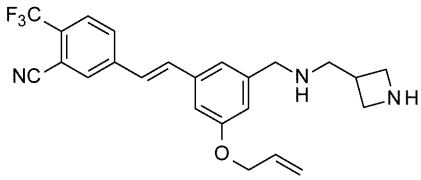
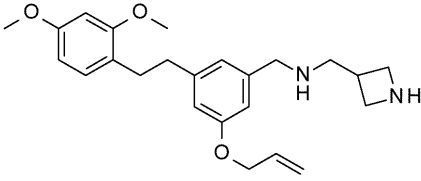
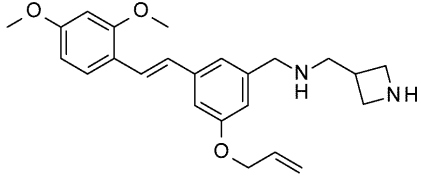
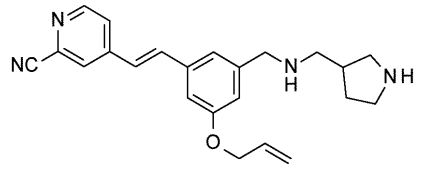
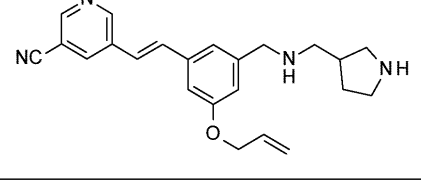
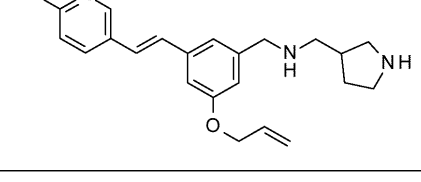
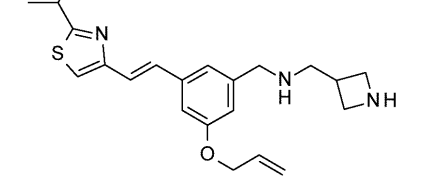
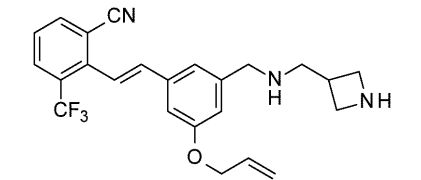
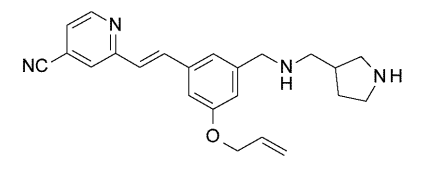
276	
277	
278	
279	
280	
281	
282	
283	
284	

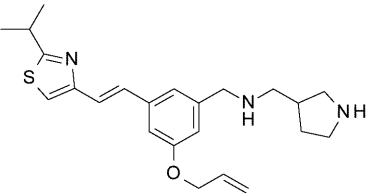
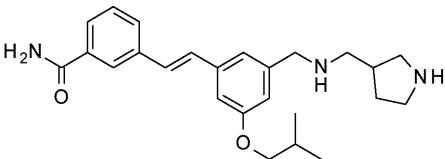
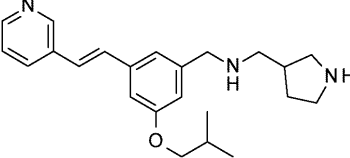
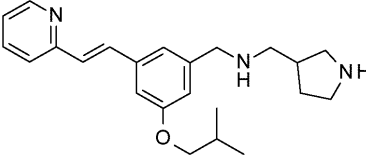
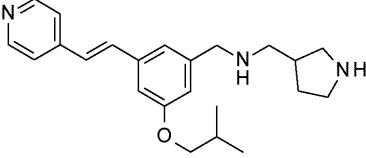
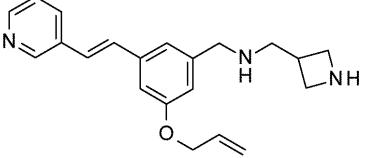
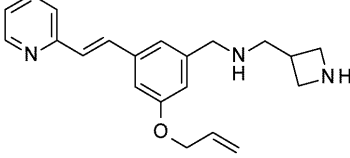
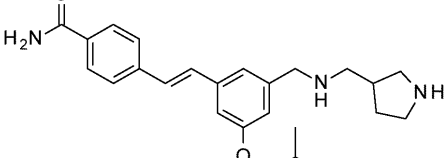
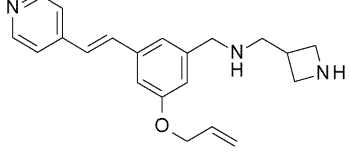
285	
286	
287	
288	
289	
290	
291	
292	

293	
294	
295	
296	
297	
298	
299	
300	
301	

302	
303	
304	
305	
306	
307	
308	
309	
310	

311	
312	
313	
314	
315	
316	
317	
318	
319	
320	

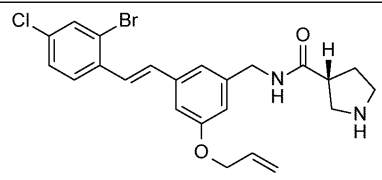
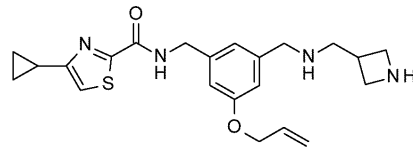
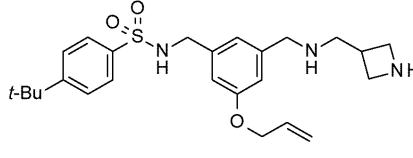
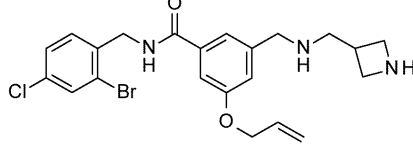
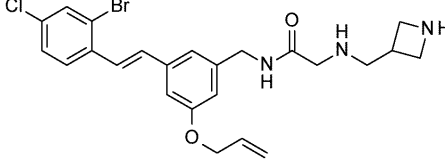
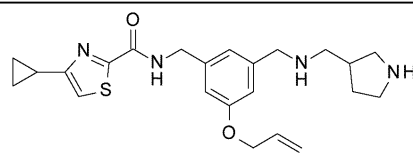
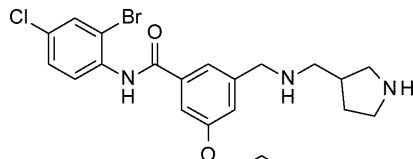
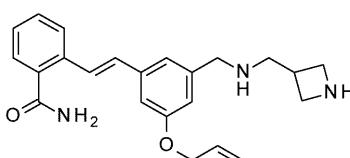
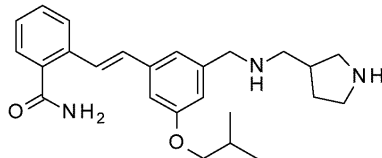
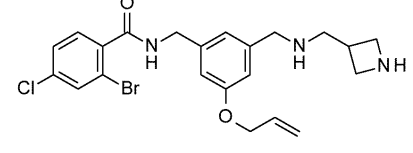
321	 <chem>CCOC(=C)c1ccc(CCNCC2CCNC2)cc1/C=C/c3cc(C#N)c(C(F)(F)F)cc3</chem>
322	 <chem>CCOC(=C)c1ccc(CCNCC2CCNC2)cc1CCCc3cc(OC)c(OC)cc3</chem>
323	 <chem>CCOC(=C)c1ccc(CCNCC2CCNC2)cc1/C=C/c3cc(OC)c(OC)cc3</chem>
324	 <chem>CCOC(=C)c1ccc(CCNCC2CCNC2)cc1/C=C/c3cc(C#N)ncn3</chem>
325	 <chem>CCOC(=C)c1ccc(CCNCC2CCNC2)cc1/C=C/c3cc(C#N)ncn3</chem>
326	 <chem>CCOC(=C)c1ccc(CCNCC2CCNC2)cc1/C=C/c3cc(C#N)ncn3</chem>
327	 <chem>CCOC(=C)c1ccc(CCNCC2CCNC2)cc1/C=C/c3cc(C(C)C)s3</chem>
328	 <chem>CCOC(=C)c1ccc(CCNCC2CCNC2)cc1/C=C/c3cc(C#N)c(C(F)(F)F)cc3</chem>
329	 <chem>CCOC(=C)c1ccc(CCNCC2CCNC2)cc1/C=C/c3cc(C#N)ncn3</chem>

330	
331	
332	
333	
334	
335	
336	
337	
338	

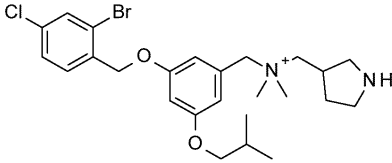
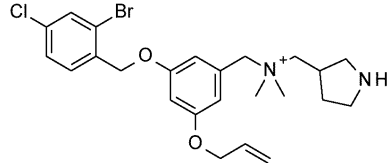
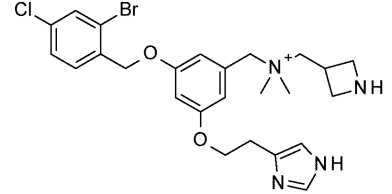
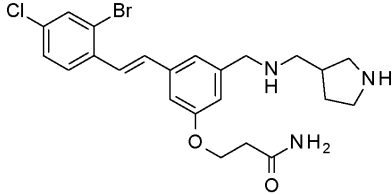
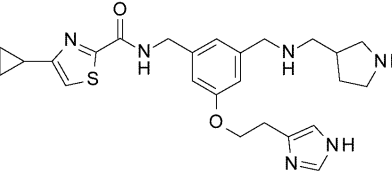
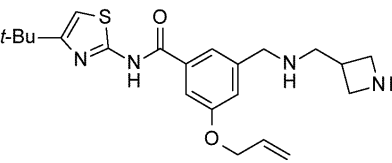
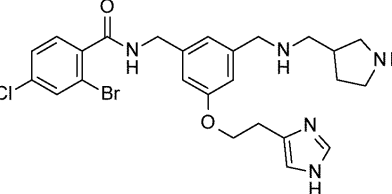
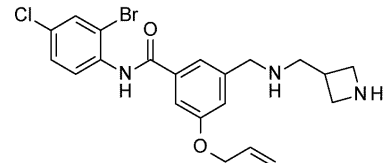
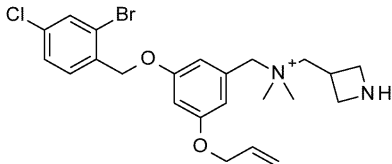
339	<chem>CCOC=Cc1cc(ccc1/C=C/c2ccc(N)cc2)CNCC3CCNC3</chem>
340	<chem>CCOC=Cc1cc(ccc1/C=C/c2ccc(N)cc2)CNCC3CCNC3</chem>
341	<chem>CCOC=Cc1cc(ccc1/C=C/c2cc(Cl)cc(Br)c2)CNCC3CCNC3</chem>
342	<chem>CCOC(=O)Nc1cc(ccc1/C=C/c2cc(Cl)cc(Br)c2)CNCC3CCNC3</chem>
343	<chem>CCOC=Cc1cc(ccc1/C=C/c2cc(Cl)cc(Br)c2)CN[C@@H]3CCNC3</chem>
344	<chem>CCOC=Cc1cc(ccc1/C=C/c2cc(Cl)cc(Br)c2)CNCC3CCNC3</chem>
345	<chem>CCOC=Cc1cc(ccc1/C=C/c2cc(Cl)cc(Br)c2)CNCC3CCNC3</chem>
346	<chem>CCOC=Cc1cc(ccc1/C=C/c2cc(Cl)cc(Br)c2)CNCC3CCNC3</chem>
347	<chem>CCOC=Cc1cc(ccc1/C=C/c2cc(Cl)cc(Br)c2)CNCC3CCNC3</chem>

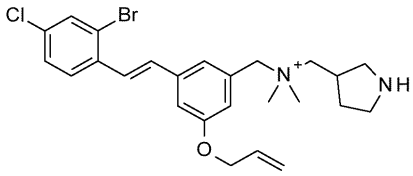
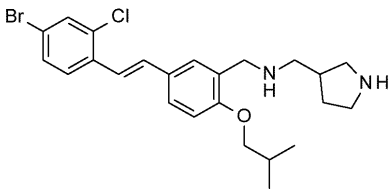
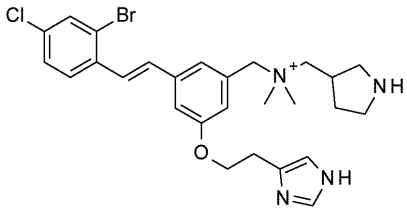
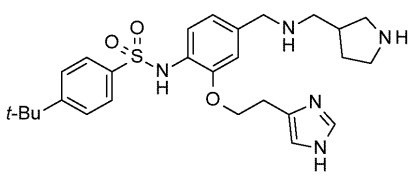
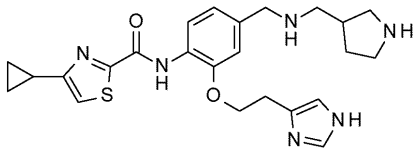
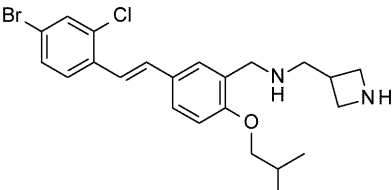
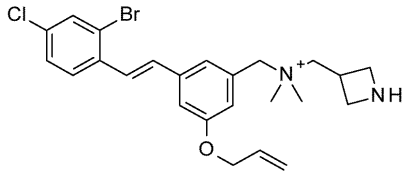
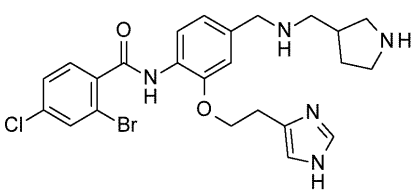
348	<chem>C=CCOC1=CC=C(C=C1)C=Cc2nc(s2)C(F)(F)F</chem>
349	<chem>C=CCOC1=CC=C(C=C1)CN(C)CN2CCNC2</chem>
350	<chem>C=CCOC1=CC=C(C=C1)CN(C)C(=O)N2CCNCC2</chem>
351	<chem>C=CCOC1=CC=C(C=C1)C=Cc2nc(s2)C</chem>
352	<chem>C=CCOC1=CC=C(C=C1)C=Cc2nc(s2)C</chem>
353	<chem>C=CCOC1=CC=C(C=C1)C=Cc2nc(s2)C(C)C</chem>
354	<chem>C=CCOC1=CC=C(C=C1)CN(C)C(=O)N2CCNCC2</chem>
355	<chem>C=CCOC1=CC=C(C=C1)C=Cc2nc(s2)C3CC3</chem>
356	<chem>C=CCOC1=CC=C(C=C1)C=Cc2nc(s2)C3CC3</chem>

357	<chem>CC(C)(C)C1=CC=C(C=C1)C(=O)NCc2ccc(OCC=C)cc2CNCC3CCNC3</chem>
358	<chem>Clc1ccc(NC(=O)Nc2ccc(OCC=C)cc2CNCC3CCNC3)cc1</chem>
359	<chem>CC1=CC=C(C=C1)C(=O)Nc2ccc(OCC=C)cc2CNCC3CCNC3</chem>
360	<chem>Clc1ccc(NC(=O)Nc2ccc(OCC=C)cc2CNCC3CCNC3)cc1</chem>
361	<chem>CC1=CC=C(C=C1)C(=O)Nc2ccc(OCC=C)cc2CNCC3CCNC3</chem>
362	<chem>CC(C)C1=CC=C(C=C1)C(=O)Nc2ccc(OCC=C)cc2CNCC3CCNC3</chem>
363	<chem>FC(F)(F)C1=CC=C(C=C1)C(=O)Nc2ccc(OCC=C)cc2CNCC3CCNC3</chem>
364	<chem>CC(C)(C)C1=CC=C(C=C1)S(=O)(=O)Nc2ccc(OCC=C)cc2CNCC3CCNC3</chem>
365	<chem>Clc1ccc(S(=O)(=O)Nc2ccc(OCC=C)cc2CNCC3CCNC3)cc1Cl</chem>
366	<chem>CC1=CC=C(C=C1)C(=O)Nc2ccc(OCC=C)cc2CNCC3CCNC3</chem>

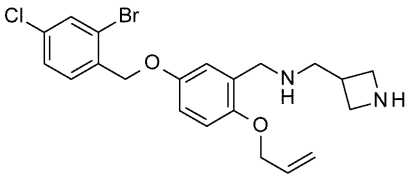
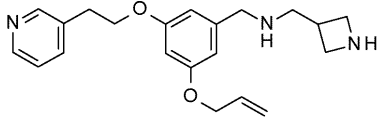
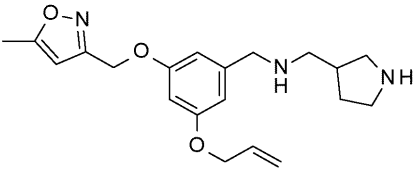
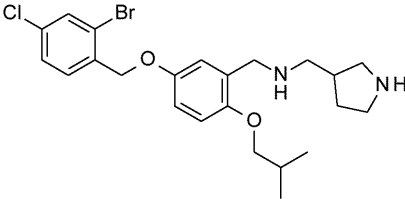
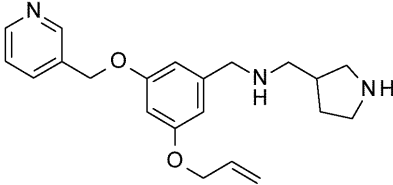
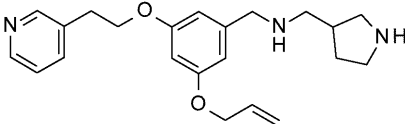
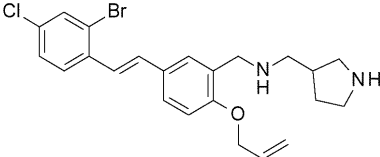
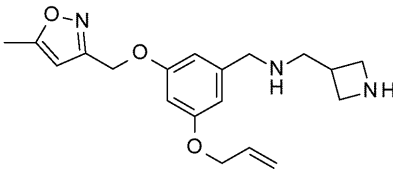
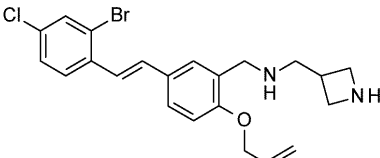
367	
368	
369	
370	
371	
372	
373	
374	
375	
376	

377	<chem>Cc1ccc(cc1)S(=O)(=O)NCc2ccc(OCCc3nn[nH]3)cc2NCNCC4CCNC4</chem>
378	<chem>Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc(Cl)cn2CNCNCC4CCNC4</chem>
379	<chem>Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc(Cl)cn2CNCNCC4CCNC4</chem>
380	<chem>Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc(Cl)c(Br)cn2CNCNCC4CCNC4</chem>
381	<chem>Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc(Cl)c(Br)cn2CNCNCC4CCNC4</chem>
382	<chem>Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc(Cl)c(Br)cn2CNCNCC4CCNC4</chem>
383	<chem>Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc(Cl)cn2CNCNCC4CCNC4</chem>
384	<chem>Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc(Cl)c(Br)cn2CNCNCC4CCNC4</chem>
385	<chem>Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc(Cl)cn2CNCNCC4CCNC4</chem>
386	<chem>Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2cc(Cl)cn2CNCNCC4CCNC4</chem>

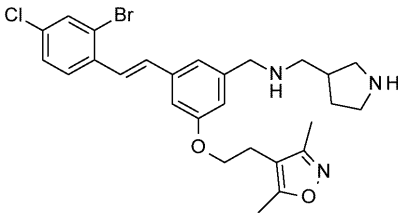
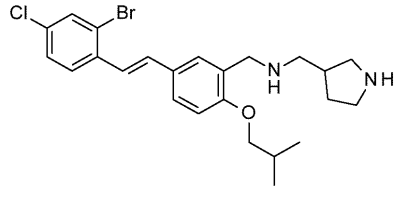
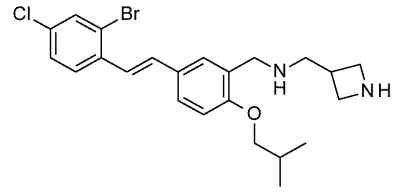
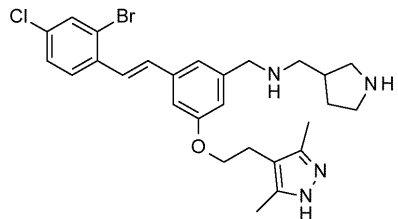
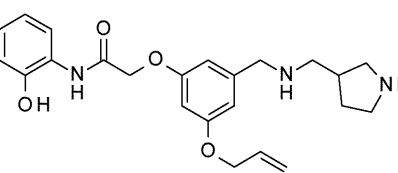
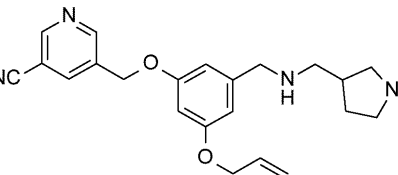
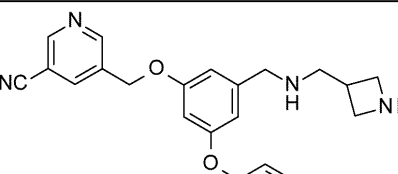
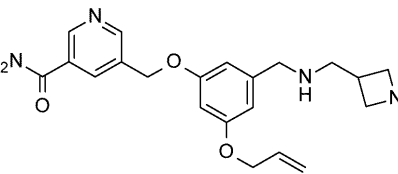
387	
388	
389	
390	
391	
392	
393	
394	
395	

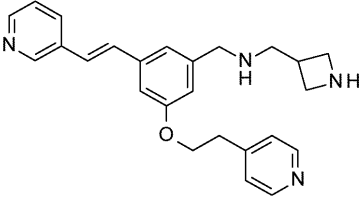
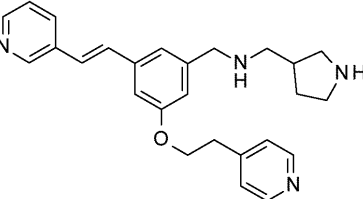
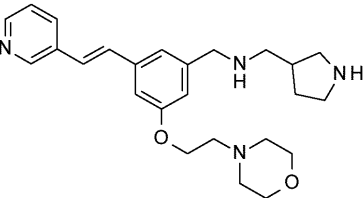
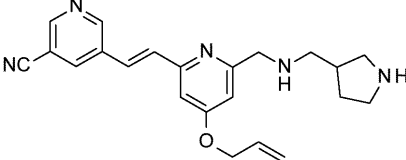
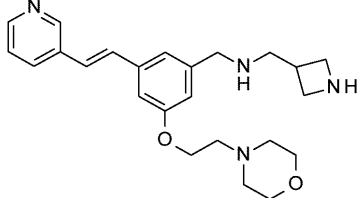
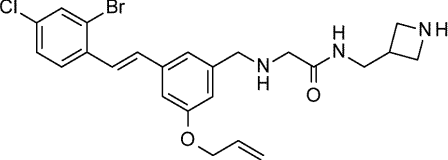
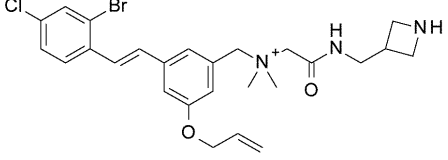
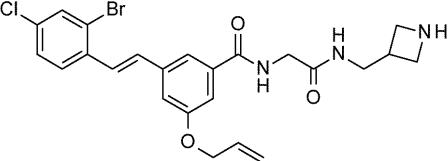
396	
397	
398	
399	
400	
401	
402	
403	

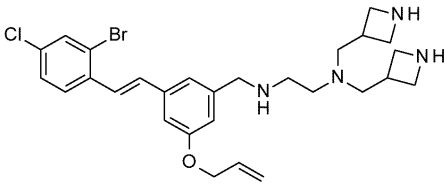
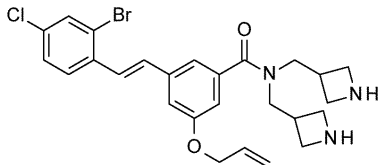
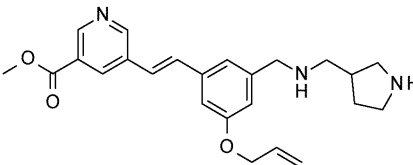
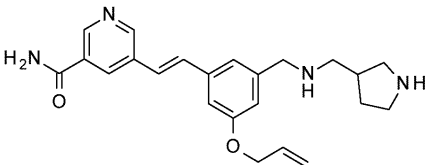
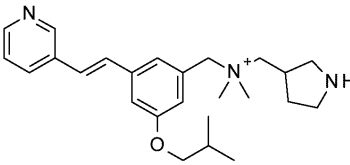
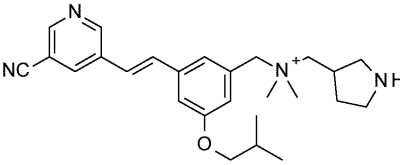
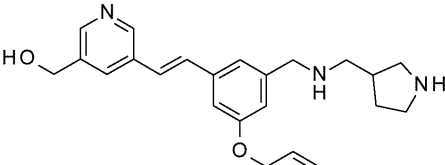
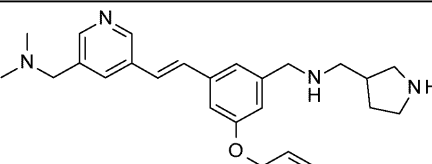
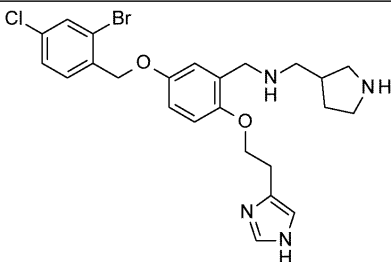
404	
405	
406	
407	
408	
409	
410	
411	
412	

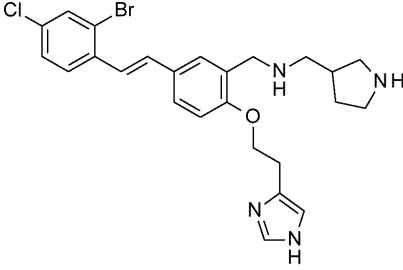
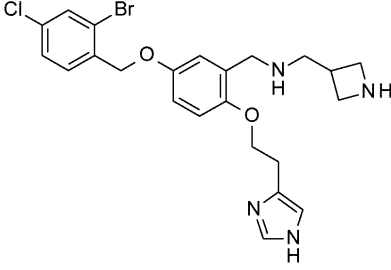
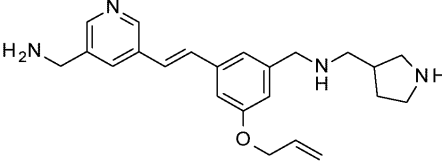
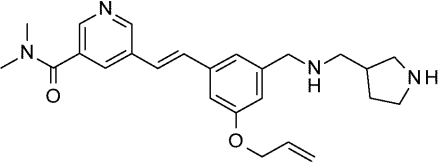
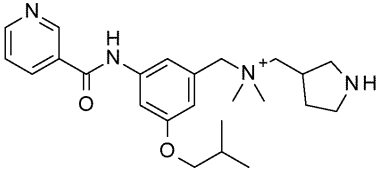
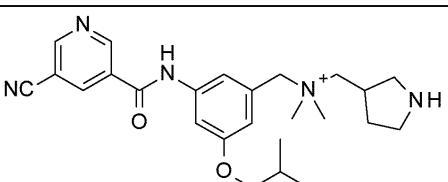
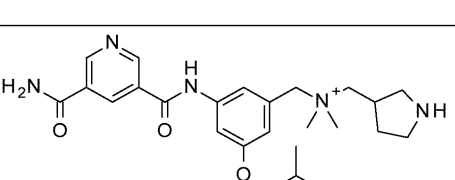
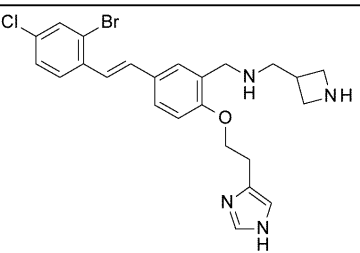
413	
414	
415	
416	
417	
418	
419	
420	
421	

422	
423	
424	
425	
426	
427	
428	
429	

430	
431	
432	
433	
434	
435	
436	
437	

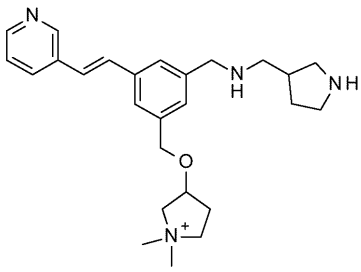
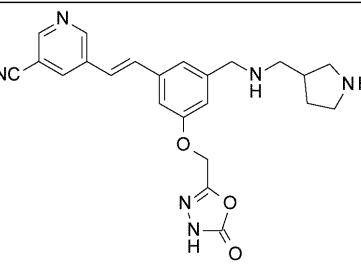
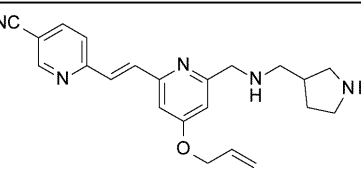
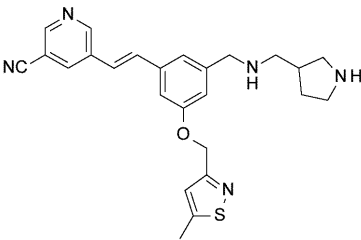
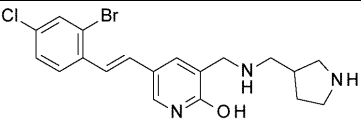
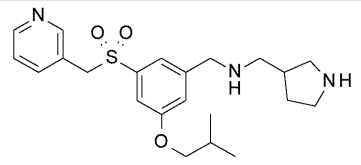
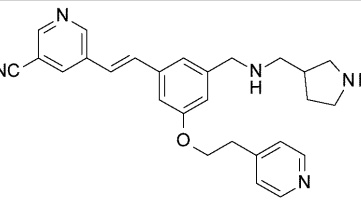
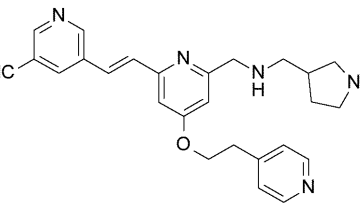
438	
439	
440	
441	
442	
443	
444	
445	

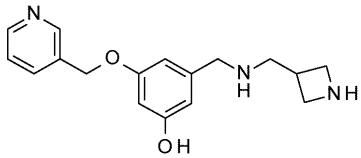
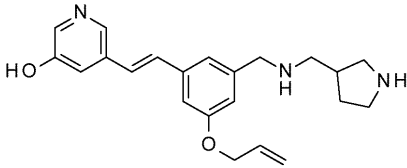
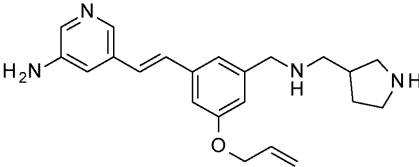
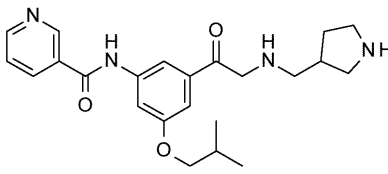
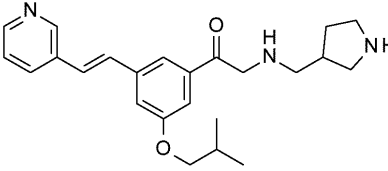
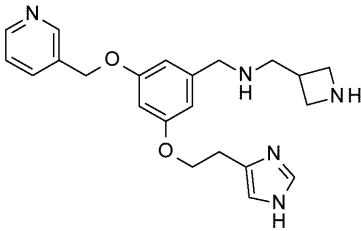
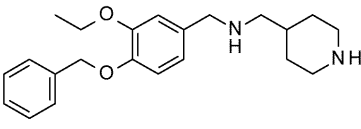
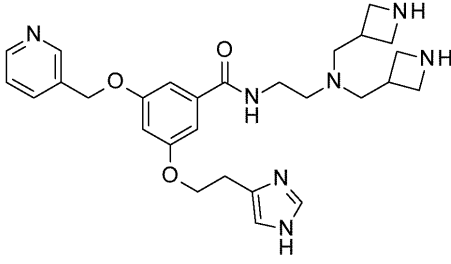
455	
456	
457	
458	
459	
460	
461	
462	
463	

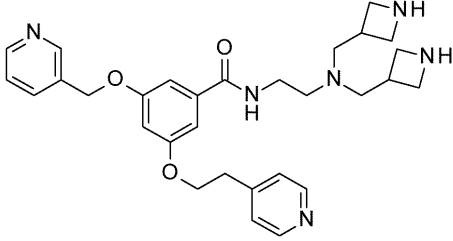
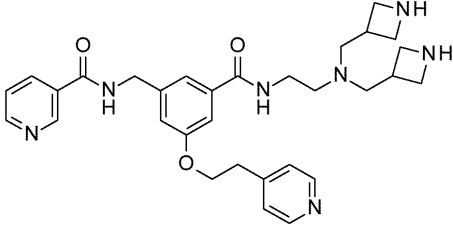
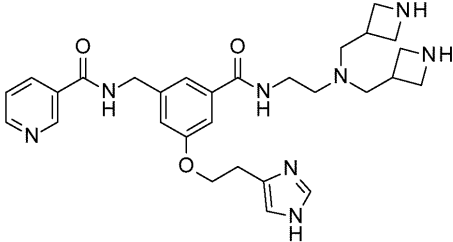
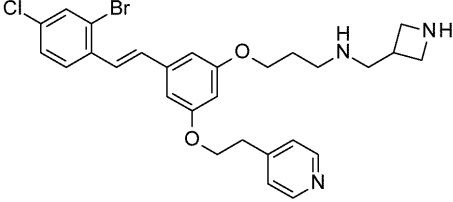
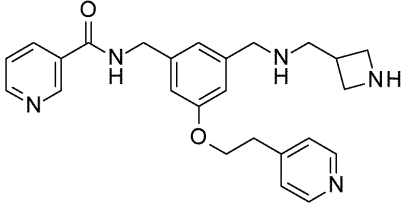
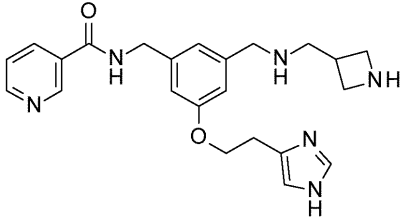
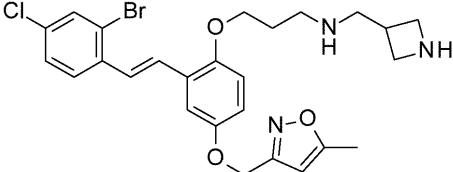
464	
465	
466	
467	
468	
469	
470	
471	

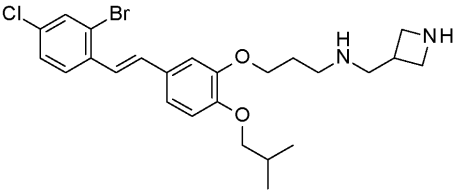
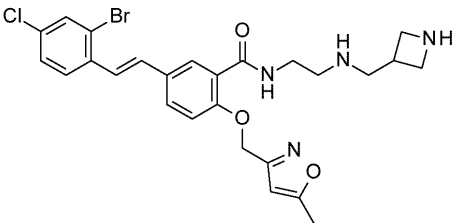
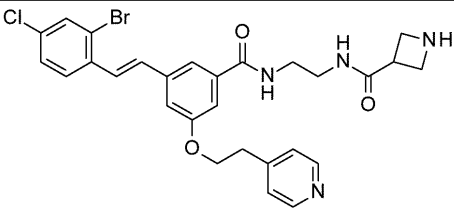
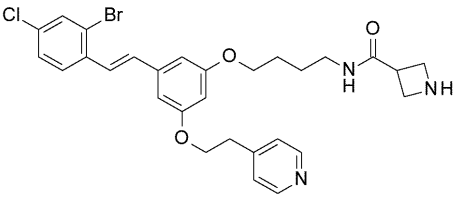
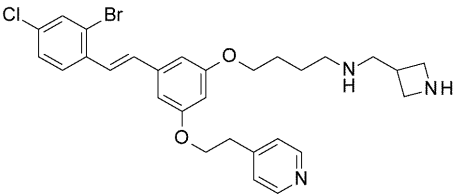
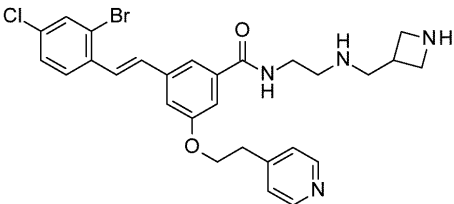
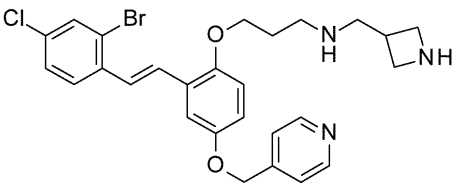
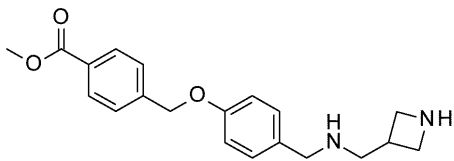
472	
473	
474	
475	
476	
477	
478	
479	
480	

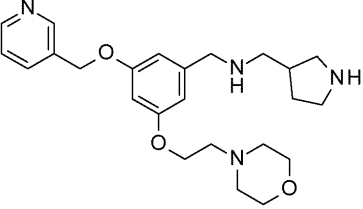
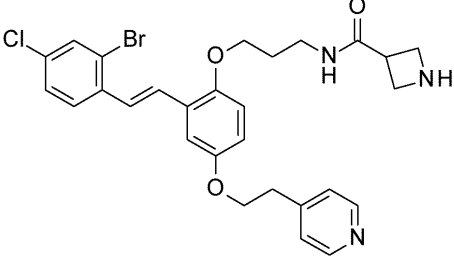
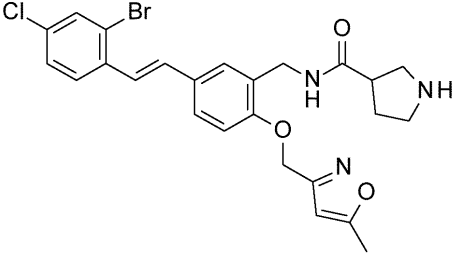
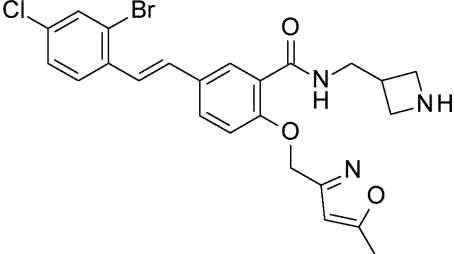
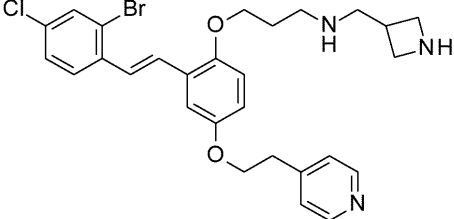
481	
482	
483	
484	
485	
486	
487	
488	
489	

490	
491	
492	
493	
494	
495	
496	
497	

498	 <chem>Cc1ccncc1OCc2ccc(O)cc2CNCCN</chem>
499	 <chem>OC1=CC=C(C=C1)/C=C/c2ccc(OCC=C)cc2CNCCN</chem>
500	 <chem>Nc1ccncc1/C=C/c2ccc(OCC=C)cc2CNCCN</chem>
501	 <chem>CC(C)OCc1ccc(NC(=O)CCNCCN)cc1NC(=O)c2ccncc2</chem>
502	 <chem>CC(C)OCc1ccc(/C=C/c2ccncc2)cc1CNCCN</chem>
503	 <chem>Cc1ccncc1OCc2ccc(CCNCCN)cc2OCCc3c[nH]cn3</chem>
504	 <chem>COc1ccc(CCNCCN)cc1OCc2ccccc2</chem>
505	 <chem>Cc1ccncc1OCc2ccc(CCNCCN3CC4CCNC4CC3)cc2OCCc5c[nH]cn5</chem>

506	
507	
508	
509	
510	
511	
512	

513	
514	
515	
516	
517	
518	
519	
520	

521	
522	
523	
524	
525	

から選択される請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物若しくは水和物。

【請求項 48】

請求項 1 ~ 47 のいずれか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物若しくは水和物を含む、医薬組成物。

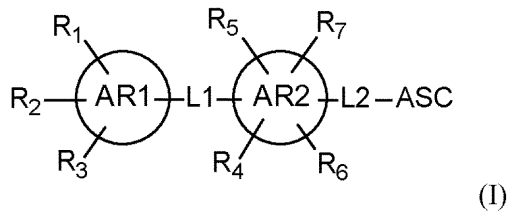
【請求項 49】

微生物感染症を有するか又は微生物感染症にかかりやすい対象を治療するための、請求項 48 に記載の医薬組成物。

【請求項 50】

式 I :

【化 2 6】

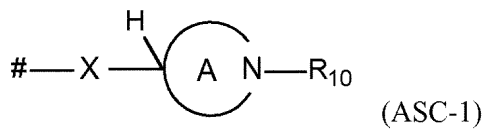


(式中、

ASCは、 $-N(R_8)(R_9)ASC-1$ であり；

ASC-1は、

【化 2 7】



であり、

環 A は、窒素原子に加えて炭素原子を環員として含む 4 員 ~ 6 員の飽和環を表し、ここで、環 A 中の 1 つの CH_2 部分は、任意に $CH(R_{21})$ に置き換えられており、前記窒素原子に隣接しない環 A 中の 1 つの炭素原子は、任意に O に置き換えられており、環 A は、炭素原子を介して X に結合されており；

X は、結合、 $-CH_2-$ 、又は $-C(=O)-$ を表し；

AR1、AR2 は、独立に、フェニル、又は O、S、及び N から選択される 1 ~ 3 つのヘテロ原子を含む 5 員 ~ 6 員のヘテロアリアル環を表し、ここで、AR1 は、炭素原子を介して L1 に結合されており、AR2 は、炭素原子を介して L1 及び L2 に結合されており；

R_1 、 R_2 、 R_3 は、独立に、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C1 ~ C6 アルキル、C1 ~ C6 ハロアルキル、C3 ~ C8 シクロアルキル、C1 ~ C6 アルコキシ、C1 ~ C6 ハロアルコキシ、 $-C1 \sim C6$ アルキレン $-N(R_{12})R_{13}$ 、 $-N(R_{12})R_{13}$ 、 $-C(O)OR_{11}$ 、 $-C(O)N(R_{12})R_{13}$ 、 $-S(O)OR_{11}$ 、又はフェニルを表し；

R_4 は、ヒドロキシル、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノ、1 ~ 5 つの R_{14} で任意に置換されている C1 ~ C6 アルキル、1 ~ 5 つの R_{14} で任意に置換されている C2 ~ C6 アルケニル、1 ~ 5 つの R_{14} で任意に置換されている C2 ~ C6 アルキニル、1 ~ 5 つの R_{14} で任意に置換されている C1 ~ C6 アルコキシ、1 ~ 5 つの R_{14} で任意に置換されている C2 ~ C6 アルケニルオキシ、1 ~ 5 つの R_{14} で任意に置換されている C2 ~ C6 アルキニルオキシ、 $-C(O)OR_{15}$ 、 $-CHO$ 、 $-C(O)N(R_6)R_{17}$ 、 $-C1 \sim C6$ アルキレン $-N(R_9)(R_{16})R_{17}$ 、 $-O$ -サイクル-P、又は $-O$ -サイクル-Q を表し；

R_5 、 R_6 、 R_7 は、独立に、水素、ハロゲン、シアノ、C1 ~ C6 アルキル、C1 ~ C6 ハロアルキル、C1 ~ C6 アルコキシ、又は C1 ~ C6 ハロアルコキシを表し；

R_8 は、水素、メチル、又は ASC-1 を表し；

R_9 は、メチルであるか、又は存在せず、 R_9 が存在する場合、それぞれの窒素原子は、正電荷を帯び；

R_{10} は、水素又はメチルを表し；

R_{11} は、各出現で独立に、水素又は C1 ~ C6 アルキルを表し；

R_{12} 、 R_{13} は、各出現で独立に、水素又は C1 ~ C6 アルキルを表し；

R₁₄ は、各出現で独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、C₁ ~ C₆ アルコキシ、C₁ ~ C₆ ハロアルコキシ、C₃ ~ C₈ シクロアルキル、-C(O)OR₁₁、-CHO、-C(O)N(R₁₂)R₁₃、-C₁ ~ C₆ アルキレン-N(R₁₂)R₁₃、サイクル-P、-O-サイクル-P、サイクル-Q、又は-O-サイクル-Qを表し；

サイクル-Pは、各出現で独立に、1 ~ 3つのR₁₈で任意に置換されている飽和若しくは部分不飽和のC₃ ~ C₈炭素環式環、又は環員としての炭素原子と、N(R₉)(R₁₂) - 及びOから独立に選択される1若しくは2つの環員とを含み、1 ~ 3つのR₁₈で任意に置換されている飽和若しくは部分不飽和のC₃ ~ C₈複素環式環を表し；

サイクル-Qは、各出現で独立に、1 ~ 3つのR₁₉で任意に置換されているフェニル、又はO、S、及びNから選択される1 ~ 4つのヘテロ原子を含み、1 ~ 3つのR₁₉で任意に置換されている5員 ~ 6員のヘテロアリアル環を表し；

R₁₅ は、各出現で独立に、水素、又は1 ~ 5つのR₁₄で任意に置換されているC₁ ~ C₆アルキルを表し；

R₁₆ 及びR₁₇ は、各出現で独立に、水素、又は1 ~ 5つのR₁₄で任意に置換されているC₁ ~ C₆アルキルを表し；

R₁₈ 及びR₁₉ は、各出現で独立に、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、オキソ、アミノ、C₁ ~ C₄アルキル、C₁ ~ C₄ハロアルキル、C₁ ~ C₄アルコキシ、C₁ ~ C₄ハロアルコキシ、又は-CO(O)R₁₁を表し；

R₂₀ は、各出現で独立に、水素又はメチルを表し；

R₂₁ は、N(R₂₀)₂又はCH₂-N(R₂₀)₂を表し；

L₁ は、-CH=CH-、-CH₂-O-、-O-CH₂-、-CH₂-O-CH₂-、-CH₂-S-、-S-CH₂-、-CH₂-S(O)-、-CH₂-S(O₂)-、-S(O)-CH₂-、-S(O₂)-CH₂-、-C(CH₃)(CH₃)-、-C(=O)-NH-、-NH-C(=O)-、-CH₂-CH₂-、-CH=CH-CH₂-、-CH₂-NH-C(=O)-、-C(=O)-NH-CH₂-、-C-C-、-S(O₂)-NH-CH₂-、-S(O₂)-NH-、-O-CH₂-CH₂-O-、-O-、-NH-CH₂-、-CH₂-NH-、-CH₂-CH₂-O-、又は-NH-C(=O)-CH₂-O-、又は結合を表し；

L₂ は、C₁ ~ C₇アルキレンであって、前記アルキレン中の1つ以上のCH₂部分が任意に、独立に-N(R₉)(R₂₀)-、-CH(N(R₉)(R₂₀)(R₂₀))-、又は-C(=O)-に置き換えられており、L₂内に、隣接するC(=O)部分も、隣接する-N(R₉)(R₂₀)-部分もなく、L₂の末端部分が-N(R₉)(R₂₀)-ではない、C₁ ~ C₇アルキレンを表すか、又はL₂は、-O-C₁ ~ C₆アルキレン-を表すか、又はL₂は、結合を表し、ただし、L₂が結合である場合、Xは-CH₂-を表す)

の化合物、又はその薬学的に許容できる塩、溶媒和物、若しくは水和物

を含む、微生物感染症を有するか又は微生物感染症にかかりやすい対象を治療するための医薬組成物。

【請求項51】

抗微生物剤と組み合わせて使用するための、請求項49又は50に記載の医薬組成物。

【請求項52】

抗微生物剤を含む、請求項49 ~ 51のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項53】

前記抗微生物剤は、ミノサイクリンであってもよいテトラサイクリン抗生物質である、請求項51又は52に記載の医薬組成物。

【請求項54】

前記抗微生物剤は、リネゾリドであってもよいオキサゾリジノン抗生物質である、請求項51又は52に記載の医薬組成物。