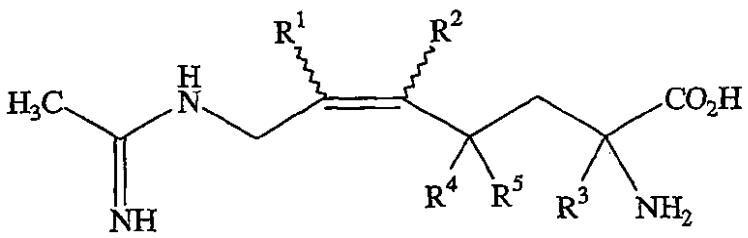
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成20年10月30日(2008.10.30)

【公表番号】特表2004-509099(P2004-509099A)
【公表日】平成16年3月25日(2004.3.25)
【年通号数】公開・登録公報2004-012
【出願番号】特願2002-526762(P2002-526762)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｃ 257/14 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/198 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 1/16 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 19/08 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 21/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/28 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 27/06 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 29/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)
Ｃ０７Ｃ 237/16 (2006.01)
Ｃ０７Ｃ 259/14 (2006.01)
Ｃ０７Ｃ 271/22 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 265/32 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 271/06 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 413/06 (2006.01)
Ｃ０７Ｆ 7/18 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｃ 257/14
Ａ６１Ｋ 31/198
Ａ６１Ｐ 1/02
Ａ６１Ｐ 1/04
Ａ６１Ｐ 1/16
Ａ６１Ｐ 3/10
Ａ６１Ｐ 9/00
Ａ６１Ｐ 9/10

Ａ６１Ｐ　11/00
Ａ６１Ｐ　11/06
Ａ６１Ｐ　17/02
Ａ６１Ｐ　17/06
Ａ６１Ｐ　19/00
Ａ６１Ｐ　19/02
Ａ６１Ｐ　19/08
Ａ６１Ｐ　21/04
Ａ６１Ｐ　25/04
Ａ６１Ｐ　25/06
Ａ６１Ｐ　25/28
Ａ６１Ｐ　27/02
Ａ６１Ｐ　27/06
Ａ６１Ｐ　29/00
Ａ６１Ｐ　35/00
Ａ６１Ｐ　37/00
Ａ６１Ｐ　43/00　　１１１
Ｃ０７Ｃ 237/16
Ｃ０７Ｃ 259/14
Ｃ０７Ｃ 271/22
Ｃ０７Ｄ 265/32
Ｃ０７Ｄ 271/06
Ｃ０７Ｄ 413/06
Ｃ０７Ｆ　7/18　　Ｕ

【手続補正書】
【提出日】平成20年9月10日(2008.9.10)
【手続補正１】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】特許請求の範囲
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項1】
式VIIの化合物又は薬剤学的に受容できるその塩：
【化１】



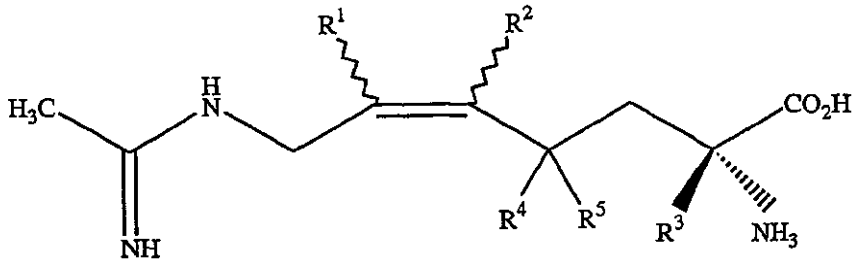
VII

(式中：
R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキル

はハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^4は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
そしてR^5はハロ及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く、
ここでアルコキシはC_1-C_{10}アルコキシである)。

【請求項２】　式VIIIの化合物又は薬剤学的に受容できるその塩である請求項１記載の化合物：

【化２】

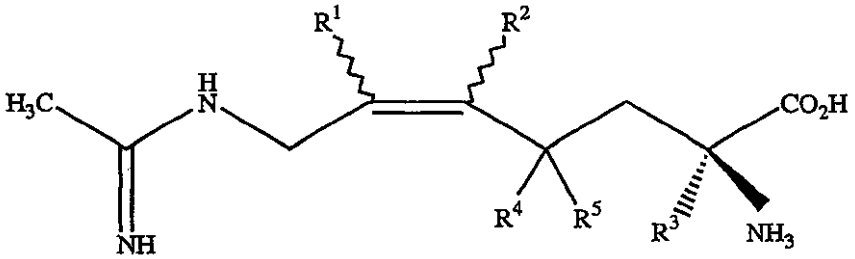


VIII

(式中：
R^1、R^2、R^3、R^4およびR^5は請求項１で定義した通りである)。

【請求項３】　式IXの化合物又は薬剤学的に受容できるその塩である請求項１記載の化合物：

【化３】



IX

(式中：
R^1、R^2、R^3、R^4およびR^5は請求項１で定義した通りである)。

【請求項４】　R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^4は水素、ハロ及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルは

ハロ又はアルコキシにより置換されていても良く；
そしてR^5はハロ及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良い、
請求項１－３のいずれかに記載の化合物。

【請求項５】　R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^4は水素及びハロからなるグループから選択され；
そしてR^5はハロ及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良い、
請求項１－３のいずれかに記載の化合物。

【請求項６】　R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^4は水素、ハロ及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く；
そしてR^5はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良い、
請求項１－３のいずれかに記載の化合物。

【請求項７】　R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^4は水素、ハロ及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていてもよく；そして
R^5はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルは1以上のハロにより置換されていても良い、
請求項６記載の化合物。

【請求項８】　R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；

R^4はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
そしてR^5はハロである、
請求項４記載の化合物。

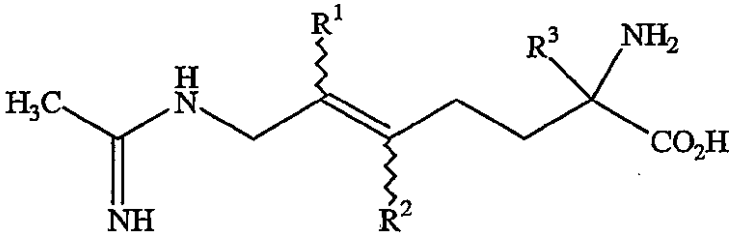
【請求項９】 R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^4はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
そしてR^5はフッ素である、
請求項８記載の化合物。

【請求項１０】 R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^4は水素、ハロ及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く；
そしてR^5はハロにより置換されたC_1-C_5アルキルである、
請求項９記載の化合物。

【請求項１１】 R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^4は水素、ハロ及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く；
そしてR^5はCH_2Fである、
請求項１０記載の化合物。

【請求項１２】 R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^4は水素であり；
そしてR^5はCH_2Fである、

請求項１１記載の化合物。
【請求項１３】 R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^4はハロであり；
そしてR^5はハロである、
請求項５記載の化合物。
【請求項１４】 R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^4は水素であり；
そしてR^5はハロである、
請求項５記載の化合物。
【請求項１５】 R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^2は水素、ハロ、又はC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^4はフッ素であり；
そしてR^5はフッ素である、
請求項５記載の化合物。
【請求項１６】 R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^4は水素であり；
そしてR^5はメチルである、
請求項７記載の化合物。
【請求項１７】 式Iの化合物又は薬剤学的に受容できるその塩：
【化４】

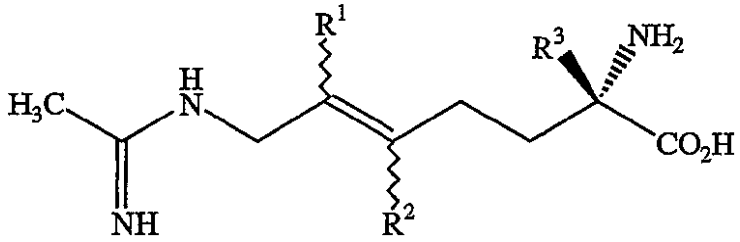


I

(式中：
R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
そしてR^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く、
ここでアルコキシはC_1-C_{10}アルコキシである)。

【請求項１８】　式IIIの化合物又は薬剤学的に受容できるその塩である請求項１７記載の化合物：

【化５】

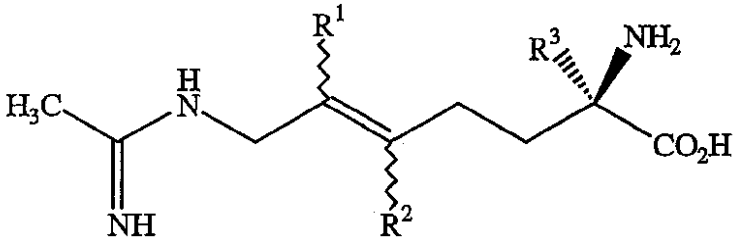


III

(式中：
R^1、R^2およびR^3は請求項１７で定義した通りである)。

【請求項１９】　式Vの化合物又は薬剤学的に受容できるその塩である請求項１７記載の化合物：

【化６】

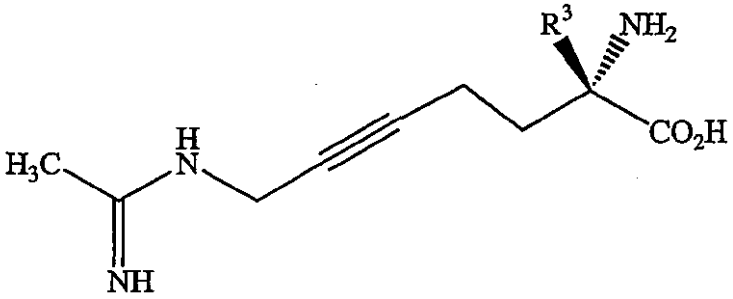


V

(式中：
R^1、R^2およびR^3は請求項１７で定義した通りである)。
【請求項２０】　化合物がZ異性体である請求項１７－１９のいずれかに記載の化合物。
【請求項２１】　化合物がE異性体である請求項１７－１９のいずれかに記載の化合物。
【請求項２２】　R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^2は水素、ハロ及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
そしてR^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良い、
請求項２０または２１に記載の化合物。
【請求項２３】　R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_3アルキルからなるグループから選択され；前記C_1-C_3アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良く；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され；
そしてR^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良い、
請求項２２に記載の化合物。
【請求項２４】　R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_3アルキルからなるグループから選択され；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_3アルキルからなるグループから選択され；
そしてR^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはフッ素又はアルコキシにより置換されていても良い、
請求項２３に記載の化合物。
【請求項２５】　R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_3アルキルからなるグループから選択され；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_3アルキルからなるグループから選択され；
そしてR^3はフッ素によって置換されていてもよいC_1-C_3アルキルである、
請求項２２に記載の化合物。
【請求項２６】　R^1は水素、ハロ、及びC_1-C_3アルキルからなるグループから選択され；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_3アルキルからなるグループから選択され；
そしてR^3はC_1-C_3アルキルである、
請求項２２に記載の化合物。

【請求項２７】 R^1は水素であり；
R^2は水素、ハロ、及びC_1-C_3アルキルからなるグループから選択され；
そしてR^3はC_1-C_3アルキルである、
請求項２２に記載の化合物。
【請求項２８】 R^1は水素であり；
R^2は水素及びハロからなるグループから選択され；
そしてR^3はC_1-C_3アルキルである、
請求項２７記載の化合物。
【請求項２９】 R^1は水素であり；
R^2は水素及びフッ素からなるグループから選択され；
そしてR^3はC_1-C_3アルキルである、
請求項２８記載の化合物。
【請求項３０】 R^1は水素であり；
R^2は水素及びフッ素からなるグループから選択され；
そしてR^3はメチルである、
請求項２９記載の化合物)。
【請求項３１】 R^1は水素であり；
R^2は水素であり；
そしてR^3はメチルである、
請求項３０記載の化合物。
【請求項３２】 R^1は水素であり；
R^2はフッ素であり；
そしてR^3はメチルである、
請求項３０記載の化合物。
【請求項３３】 R^1はハロであり；
R^2は水素、ハロ及びC_1-C_3アルキルからなるグループから選択され；
そしてR^3はC_1-C_3アルキルである、
請求項２２記載の化合物。
【請求項３４】 R^1はハロであり；
R^2はハロであり；
そしてR^3はC_1-C_3アルキルである、
請求項３３記載の化合物。
【請求項３５】 R^1はフッ素であり；
R^2はフッ素であり；
そしてR^3はメチルである、
請求項３４記載の化合物。
【請求項３６】 R^1はフッ素であり；
R^2は水素及びC_1-C_3アルキルからなるグループから選択され；
そしてR^3はメチルである、
請求項３２記載の化合物。
【請求項３７】 R^1はフッ素であり；
R^2は水素であり；
そしてR^3はメチルである、
請求項３６記載の化合物。
【請求項３８】 R^1はメチルであり；
R^2は水素であり；
そしてR^3はメチルである、
請求項２２記載の化合物。
【請求項３９】 R^1は水素であり；
R^2はメチルであり；

そしてR^3はメチルである、
請求項２２記載の化合物。
【請求項４０】 R^1はメチルであり；
R^2はメチル；
そしてR^3はメチルである、
請求項２２記載の化合物。
【請求項４１】 R^1は水素、ハロ及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはアルコキシ又は1以上のフッ素により置換されていても良く；
R^2は水素、ハロ及びC_1-C_5アルキルからなるグループから選択され、前記C_1-C_5アルキルはアルコキシ又は1以上のフッ素で置換されていても良く；
そしてR^3は1以上のアルコキシ又はハロにより置換されていても良いメチルである、
請求項２２記載の化合物。
【請求項４２】 R^1は水素及びフッ素からなるグループから選択され；
R^2は1以上のハロにより置換されたC_1-C_3アルキルであり；
そしてR^3はメチルである、
請求項４１記載の化合物。
【請求項４３】 R^1は水素であり；
R^2はCH_2Fであり；
そしてR^3はメチルである、
請求項４２記載の化合物。
【請求項４４】 R^1はCH_2Fであり；
R^2は水素であり；
そしてR^3はメチルである、
請求項４１記載の化合物。
【請求項４５】 R^1は水素であり；
R^2は水素であり；
そしてR^3はCH_2Fである、
請求項４１記載の化合物。
【請求項４６】 R^1は水素であり；
R^2はメトキシメチルであり；
そしてR^3はメチルである、
請求項４１記載の化合物。
【請求項４７】 R^1はメトキシメチルであり；
R^2は水素であり；
そしてR^3はメチルである、
請求項４１記載の化合物。
【請求項４８】 R^1は水素であり；
R^2は水素であり；
そしてR^3はメトキシメチルである、
請求項４１記載の化合物。
【請求項４９】 式IVの化合物又は薬剤学的に受容できるその塩：
【化７】

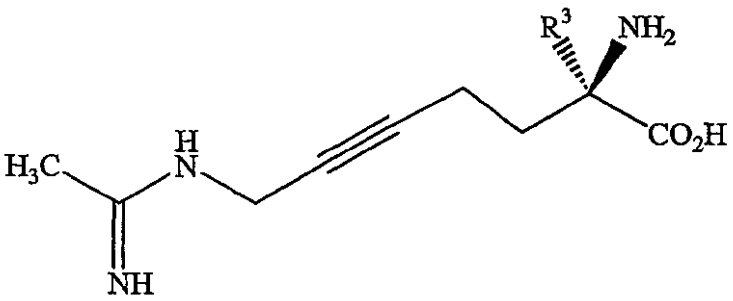


IV

(式中：
R^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良い)。

【請求項５０】　式VIの化合物又は薬剤学的に受容できるその塩：

【化８】



VI

(式中：
R^3はC_1-C_5アルキルであり、前記C_1-C_5アルキルはハロ又はアルコキシにより置換されていても良く、前記アルコキシは1以上のハロにより置換されていても良い)。

【請求項５１】　R^3は1以上のハロにより置換されたC_1-C_5アルキルである、請求項４９または５０に記載の化合物。

【請求項５２】　R^3は1以上のフッ素により置換されたC_1-C_5アルキルである、請求項５１記載の化合物。

【請求項５３】　R^3は1以上のハロにより置換されたメチルである、請求項５１記載の化合物。

【請求項５４】　R^3は1以上のフッ素により置換されたメチルである、請求項５３記載の化合物。

【請求項５５】　R^3はCH_2Fである、請求項５３記載の化合物。

【請求項５６】　R^3はアルコキシにより置換されたC_1-C_5アルキルである、請求項５１記載の化合物。

【請求項５７】　R^3はメトキシメチルである、請求項５６記載の化合物。

【請求項５８】　R^3はC_1-C_5アルキルである、請求項４９または５０記載の化合物。

【請求項５９】　R^3はメチルである、請求項５８記載の化合物。

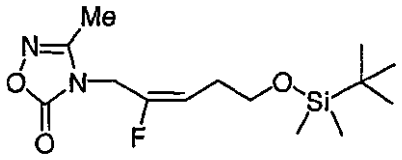
【請求項６０】　以下の化合物からなるグループから選択される化合物：
(2S, 5E)-2-アミノ-2-メチル-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；

(2R, 5E)-2-アミノ-2-メチル-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2R/S, 5E)-2-アミノ-2-メチル-6-フルオロ　-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2R/S, 5E)-2-アミノ-2-メチル-5-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2R/S, 5Z)-2-アミノ-2-メチル-5-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2R, 5E)-2-アミノ-2-メチル-5-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2S, 5E)-2-アミノ-2-メチル-5-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2S, 5Z)-2-アミノ-2-メチル-5, 6-ジフルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2R, 5Z)-2-アミノ-2-メチル-5, 6-ジフルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2R/S, 5Z)-2-アミノ-2-メチル-5, 6-ジフルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2S, 5Z)-2-アミノ-2-メチル-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2S, 5Z)-2-アミノ-2-メチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2S, 5Z)-2-アミノ-2-メチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2R, 5Z)-2-アミノ-2-メチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2R/S, 5E)-2-アミノ-2-メチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2R/S)-2-アミノ-2-メチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプチン酸；
(2S, 5E)-2-アミノ-2-エチル-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2S, 5E)-2-アミノ-2-メトキシメチル-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2S, 5E)-2-アミノ-2-フルオロメチル-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2S, 5E)-2-アミノ-2, 5-ジメチル-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2S, 5Z)-2-アミノ-5-フルオロメチル-2-メチル-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2S, 5E)-2-アミノ-2, 6-ジメチル-5-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2S, 5Z)-2-アミノ-6-フルオロメチル-2-メチル-5-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2S, 5Z)-2-アミノ-2-エチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2S, 5Z)-2-アミノ-2-メトキシメチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2S, 5Z)-2-アミノ-2-フルオロメチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2S, 5Z)-2-アミノ-2, 5-ジメチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2S, 5E)-2-アミノ-5-フルオロメチル-2-メチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2S, 5Z)-2-アミノ-2, 6-ジメチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸；
(2S, 5E)-2-アミノ-6-フルオロメチル-2-メチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5ヘプテン酸；
(2S)-2-アミノ-2-メチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプチン酸；
(2S, 5E)-2-アミノ-2-メチル-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2R, 5E)-2-アミノ-2-メチル-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2R/S, 5E)-2-アミノ-2-メチル-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；

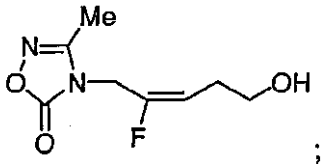
(2R/S, 5E)-2-アミノ-2-メチル-5-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2R/S, 5Z)-2-アミノ-2-メチル-5-フルオロ　-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2R, 5E)-2-アミノ-2-メチル-5-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2S, 5E)-2-アミノ-2-メチル-5-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2S, 5Z)-2-アミノ-2-メチル-5, 6-ジフルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5ヘプテン酸二塩酸塩；
(2R, 5Z)-2-アミノ-2-メチル-5, 6-ジフルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2R/S, 5Z)-2-アミノ-2-メチル-5, 6-ジフルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプチン酸二塩酸塩；
(2S, 5Z)-2-アミノ-2-メチル-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2S, 5Z)-2-アミノ-2-メチル-7-[(1-イミノエチル) アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2S, 5Z)-2-アミノ-2-メチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2R, 5Z)-2-アミノ-2-メチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2R/S, 5E)-2-アミノ-2-メチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2R/S)-2-アミノ-2-メチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプチン酸二塩酸塩；
(2S, 5E)-2-アミノ-2-エチル-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2S, 5E)-2-アミノ-2-メトキシメチル-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2S, 5E)-2-アミノ-2-フルオロメチル-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2S, 5E)-2-アミノ-2, 5-ジメチル-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2S, 5Z)-2-アミノ-5-フルオロメチル-2-メチル-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2S, 5E)-2-アミノ-2, 6-ジメチル-5-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2S, 5Z)-2-アミノ-6-フルオロメチル-2-メチル-5-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2S, 5Z)-2-アミノ-2-エチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2S, 5Z)-2-アミノ-2-メトキシメチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(25, 5Z)-2-アミノ-2-フルオロメチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2S, 5Z)-2-アミノ-2, 5-ジメチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2S, 5E)-2-アミノ-5-フルオロメチル-2-メチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2S, 5Z)-2-アミノ-2, 6-ジメチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；
(2S, 5E)-2-アミノ-6-フルオロメチル-2-メチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプテン酸二塩酸塩；及び、
(2S)-2-アミノ-2-メチル-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-5-ヘプチン酸二塩酸塩。

【請求項６１】　請求項６０記載の少なくとも１の化合物を含む医薬組成物。

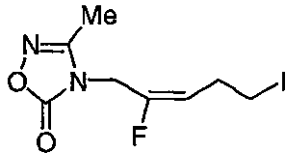
【請求項６２】以下から選択される新規中間体化合物：
【化９】



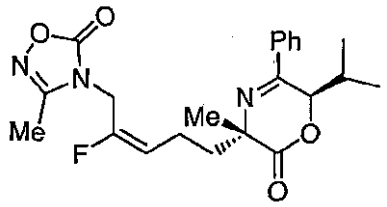
;



;

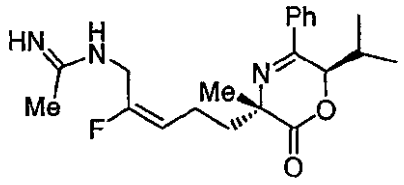


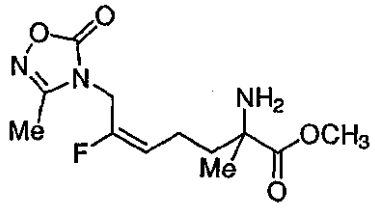
;

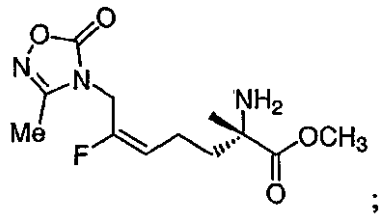


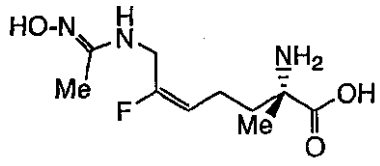
;

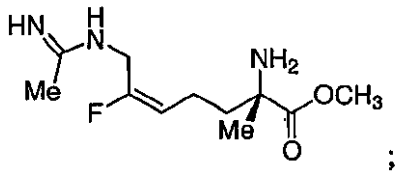
【化１０】

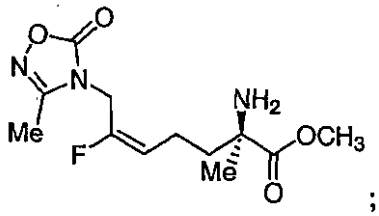

HN
H
N
Me
F
Ph
N
Me
O
O
;


O
O
N
N
Me
F
NH2
OCH3
Me
O
;

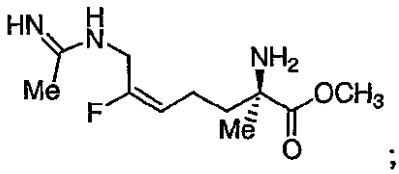

O
O
N
N
Me
F
NH2
OCH3
O
;

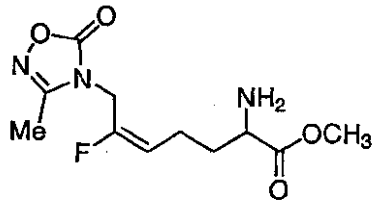

HO-N
H
N
Me
F
NH2
OH
Me
O
;

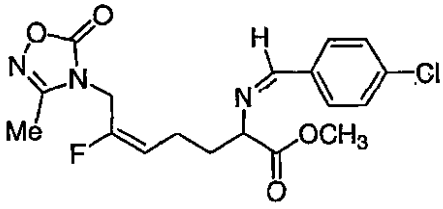

HN
H
N
Me
F
NH2
OCH3
Me
O
;

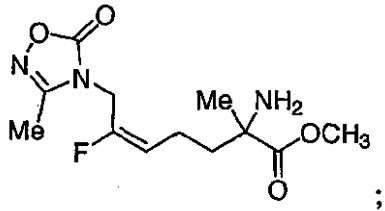

O
O
N
N
Me
F
NH2
OCH3
Me
O
;

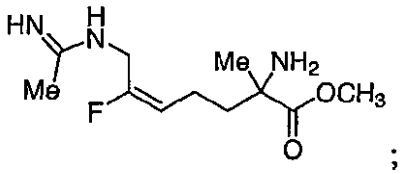
【化１１】

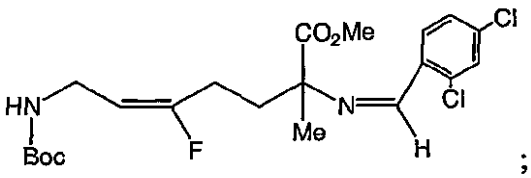

;


;

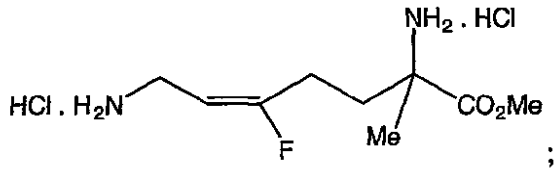

;

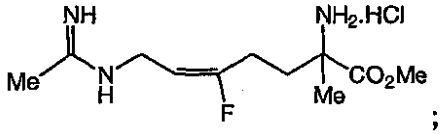

;

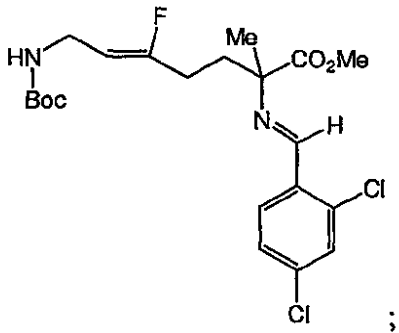

;

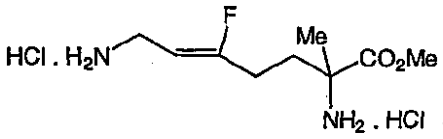

;

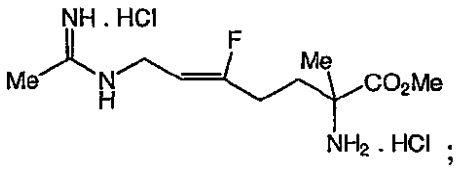
【化１２】

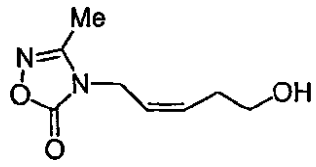

NH2 . HCl
HCl . H2N
CO2Me
F
Me
;


NH
NH2.HCl
Me
N
H
CO2Me
F
Me
;

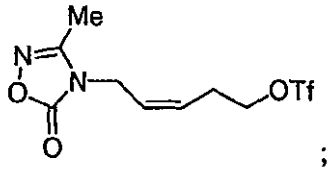

F
HN
Boc
Me
CO2Me
N
H
Cl
Cl
;

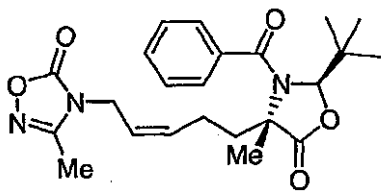

F
HCl . H2N
Me
CO2Me
NH2 . HCl
;

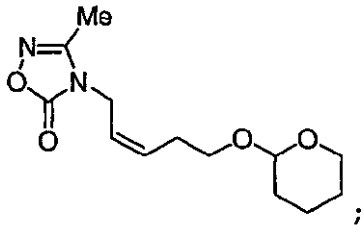

NH . HCl
F
Me
Me
N
H
CO2Me
NH2 . HCl
;

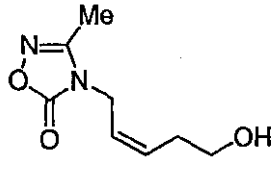

Me
N
O
N
OH
O
;

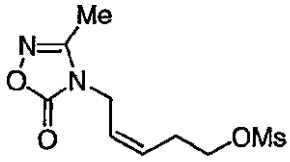
【化１３】

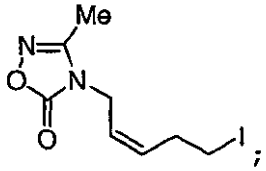

Me
N
O
N
OTf
O
;

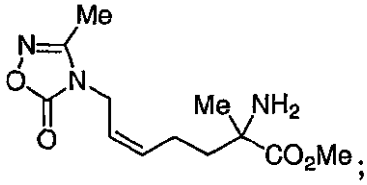

O
O
N
O
N
Me
O
N
O
Me
O
;


Me
N
O
N
O
O
O
;

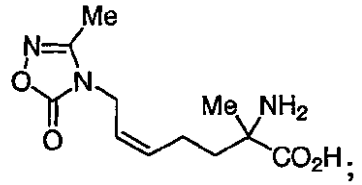

Me
N
O
N
O
OH
;

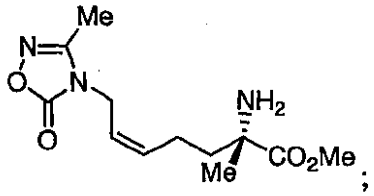

Me
N
O
N
O
OMs
;

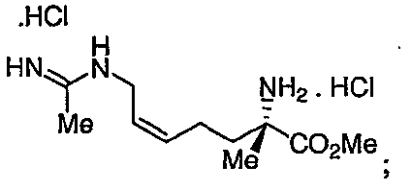

Me
N
O
N
O
I
;

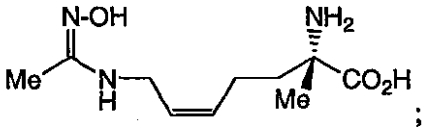

Me
N
O
N
O
Me
NH2
CO2Me
;

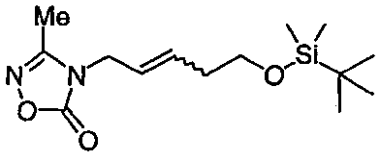
【化１４】

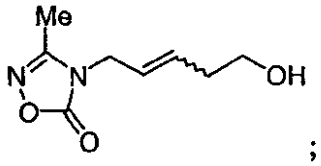

;


;

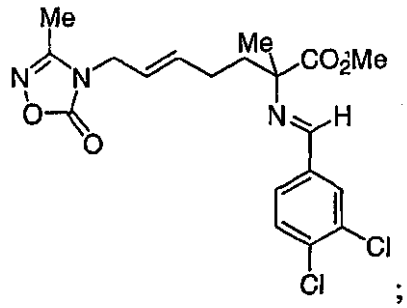

;


;

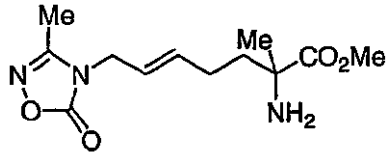

;


;

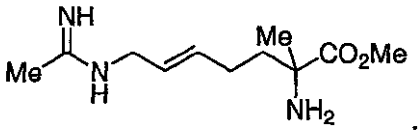
【化１５】



;



;及び



.

【請求項６３】　以下の化合物より選択される新規中間体化合物：
4-[(2E)-5-[[(1，1-ジメチルエチル)ジメチルシリル]オキシ]-2-フルオロ-2-ペンテニル]-3メチル-1，2，4-オキサジアゾール-5(4H)-オン；
4-[(2E)-2-フルオロ-5-ヒドロキシ-2-ペンテニル]-3-メチル-1，2，4-オキサジアゾール-5(4H)-オン；
4-[(2E)-2-フルオロ-5-ヨード-2-ペンテニル]-3-メチル-1，2，4-オキサジアゾール-5(4H)-オン；
(3S，6R)-3-[(3E)-4-フルオロ-5-(3-メチル-5-オキソ-1，2，4-オキサジアゾール-4(5H)-イル)-3-ペンテニル]-3，6-ジヒドロ-3-メチル-6-(1-メチルエチル)-5-フェニル-2H-1，4-オキサジン-2-オン；
N-[(2E)-5-[(3S，6R)-3，6-ジヒドロ-3-メチル-6-(1-メチルエチル)-2-オキソ-5-フェニル-2H-1，4-オキサジン-3-イル]-2-フルオロ-2-ペンテニル]エタンイミドアミド；
(5E)-2-アミノ-6-フルオロ-2-メチル-7-(3-メチル-5-オキソ-1，2，4-オキサジアゾール-4(5H)-イル)-5-ヘプテン酸メチルエステル；
(2S，5E)-2-アミノ-6-フルオロ-2-メチル-7-(3-メチル-5-オキソ-1，2，4-オキサジアゾール-4-(5H)-イル)-5-ヘプテン酸メチルエステル；
(2S，5E)-2-アミノ-6-フルオロ-7-[[(1E)-1-(ヒドロキシイミノ)エチル]アミノ]-2-メチル-5-ヘプテン酸；
(2S，5E)-2-アミノ-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-2-メチル-5-ヘプテン酸メチルエステル；
(2R，5E)-2-アミノ-6-フルオロ-2-メチル-7-[(3-メチル-5-オキソ-1，2，4-オキサジアゾール-4(5H)-イル)-5-ヘプテン酸メチルエステル；
(2R，5E)-2-アミノ-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-2-メチル-5-ヘプテン酸エチルエステル；
(5E)-2-アミノ-6-フルオロ-7-(3-メチル-5-オキソ-1，2，4-オキサジアゾール-4(5H)-イル)-5-ヘプテン酸メチルエステル；

(5E)-2-[[(1Z)-(4-クロロフェニル)メチリデン]アミノ]-6-フルオロ-7-(3-メチル-5-オキソ-1，2，4-オキサジアゾール-4 (5H)-イル)-5-ヘプテン酸メチルエステル；
(5E)-2-アミノ-6-フルオロ-2-メチル-7-(3-メチル-5-オキソ-1，2，4-オキサジアゾール-4-(5H)-イル)-5-ヘプテン酸メチルエステル；
(5E)-2-アミノ-6-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-2-メチル-5-ヘプテン酸メチルエステル；
(5E)-7-[(tert-ブトキシカルボニル)アミノ]-2-{[(1Z)-(2，4-ジクロロフェニル)メチリデン]アミノ}-5-フルオロ-2-メチルヘプト-5-エン酸メチル；
(5E)-2，7-ジアミノ-5-フルオロ-2-メチル-5-ヘプテン酸メチルエステル二塩酸塩；
(5E)-2-アミノ-5-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-2-メチル-5-ヘプテン酸メチルエステル一塩酸塩；
(5Z)-2[[(1E)-(2，4-ジクロロフェニル)メチリデン]アミノ]-7-[[(1，1ジメチルエトキシ)カルボニル]アミノ]-5-フルオロ-2-メチル-5-ヘプテン酸メチルエステル；
(5Z)-2，7-ジアミノ-5-フルオロ-2-メチル-5-ヘプテン酸メチルエステル二塩酸塩；
(5Z)-2-アミノ-5-フルオロ-7-[(1-イミノエチル)アミノ]-2-メチル-5-ヘプテン酸メチルエステル二塩酸塩；
4-[(2Z)-5-ヒドロキシ-2-ペンテニル]-3-メチル-1，2，4-オキサジアゾール-5(4H)-オン；
トリフルオロ酢酸(3Z)-5-(3-メチル-5-オキソ-1，2，4-オキサジアゾール-4(5H)-イル)-3-ペンテニルエステル；
4-[(2Z)-5-[(2R，4S)-3-ベンゾイル-2-(1，1-ジメチルエチル)-4-メチル-5-オキソ-4-オキサゾリジニル]-2-ペンテニル]-3-メチル-1，2，4-オキサジアゾール-5(4H)-オン；
3-メチル-4-[5-(テトラヒドロ-ピラン-2-イルオキシ)-ペント-2-エニル]-4H-[1，2，4]オキサジアゾール-5-オン；
4-(5-ヒドロキシ-ペント-2-エニル)-3-メチル-4H-[1，2，4]オキサジアゾール-5-オン；
メタンスルホン酸5-(3-メチル-5-オキソ-[1，2，4]オキサジアゾール-4-イル)-ペント-3-エニルエステル；
4-(5-ヨード-ペント-2-エニル)-3-メチル-4H-[1，2，4]オキサジアゾール-5-オン；
Rac-2-アミノ-2-メチル-7-(3-メチル-5-オキソ-[1，2，4]オキサジアゾール-4-イル)-ヘプト-5-エン酸メチルエステル；
Rac-2-アミノ-2-メチル-7-(3-メチル-5-オキソ-[1，2，4]オキサジアゾール-4-イル)-ヘプト-5-エン酸；
(2S，5Z)-2-アミノ-2-メチル-7-(3-メチル-5-オキソ-[1，2，4]オキサジアゾール-4-イル)-ヘプト-5-エン酸メチルエステル；
(2S，5Z)-7-アセトイミドイルアミノ-2-アミノ-2-メチル-ヘプト-5-エン酸メチルエステル二塩酸塩水和物；
(2S，5Z)-2-アミノ-7-[[(1E)-1-(ヒドロキシイミノ)エチル]アミノ]-2-メチル-5-ヘプテン酸；
4-[(2E)-5-[[(1，1-ジメチルエチル)ジメチルシリル]オキシ]-2-ペンテニル]-3-メチル-1，2，4-オキサジアゾール-5 (4H)-オン；
4-[(2E)-5-ヒドロキシ-2-ペンテニル]-3-メチル-2,4-オキサジアゾール-5-(4H)-オン；
(5E)-2-[[(1E)-(3，4-ジクロロフェニル)メチリデン]アミノ]-2-メチル-7-(3-メチル-5-オキソ-1，2，4-オキサジアゾール-4(5H)-イル)-5-ヘプテン酸メチルエステル；
(5E)-2-アミノ-2-メチル-7-(3-メチル-5-オキソ-1，2，4-オキサジアゾール-4(5H)-イル)-5-ヘプテン酸メチルエステル；及び、
(5E)-2-アミノ-7-(エタンイミドイルアミノ)-2-メチルヘプト-5-エン酸メチル。