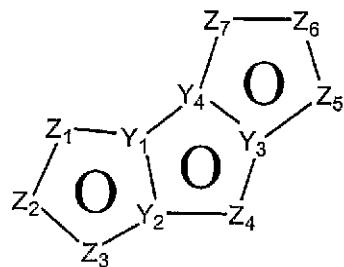
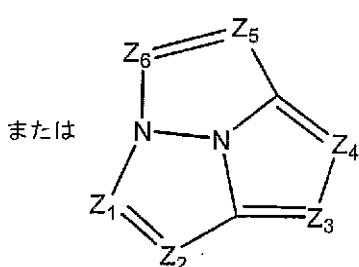


前記三環系ヘテロアリール基が以下の化学式 1 - A 又は 1 - B :

【化 2】



1-A



1-B

(式中 :

Z_1 、 Z_2 、 Z_3 、 Z_4 、 Z_5 、 Z_6 及び Z_7 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N - R_1$ であるが、但し、 Z_1 ~ Z_7 の 1 つは、分子の残りが結合する炭素原子であり； R_1 は、 H 、場合により置換されるアルキル、場合により置換されるアリール、場合により置換されるヘテロアリール又は単環式飽和複素環、場合により置換されるシクロアルキル、場合により置換されるアルケニル、二重結合及び三重結合の何れも N に直接結合する炭素原子に存在しないという条件の下で場合により置換されるアルキニル、場合により置換されるペルフルオロアルキル、 $-S(O)_p$ (式中 p は 2 である) で場合により置換されるアルキル又はアリール、場合により置換される $-C=O$ ヘテロアリール、場合により置換される $-C=O$ アリール、場合により置換される $-C=O$ アルキル、場合により置換される $-C=O$ シクロアルキル、場合により置換される $-C=O$ 单環式又は二環式飽和複素環、場合により置換される $C_1 - C_6$ アルキルアリール、場合により置換される $C_1 - C_6$ アルキルヘテロアリール、場合により置換されるアリール $-C_1 - C_6$ アルキル、場合により置換される $-C_1 - C_6$ アルキル单環式又は二環式飽和複素環、場合により置換される 8 ~ 16 個の炭素原子からなるアリールアルケニル、 $-CONR_6R_7$ 、 $-SO_2NR_6R_7$ 、場合により置換されるアリールアルキル、場合により置換される $-$ アルキル $-O$ $-$ アルキル $-$ アリール、場合により置換される $-$ アルキル $-O$ $-$ アルキル $-$ ヘテロアリール、場合により置換されるアリールオキシアルキル、場合により置換されるヘテロアリールオキシアルキル、場合により置換されるアリールオキシヘテロアリール、場合により置換される $C_1 - C_6$ アルキルアリールオキシアリール、場合により置換される $C_1 - C_6$ アルキルアリールオキシヘテロアリール、場合により置換されるアルキルアリールオキシアルキルアミン、場合により置換されるアルコキシカルボニル、場合により置換されるアリールオキシカルボニル、または場合により置換されるヘテロアリールオキシカルボニルであり；

R_2 は、水素、場合により置換される $C_1 - C_6$ アルキル、場合により置換される $C_2 - C_6$ アルケニル、場合により置換される $C_2 - C_6$ アルキニル、ハロゲン、シアノ、 $N - R_6R_7$ 、場合により置換される $C_1 - C_6$ アルコキシ、ヒドロキシ、場合により置換されるアリール、場合により置換されるヘテロアリール、 $COOR_6$ 、場合により置換されるアルキルアリールオキシアルキルアミン、場合により置換されるアリールオキシ、場合により置換されるヘテロアリールオキシ、場合により置換される $C_3 - C_6$ アルケニルオキシ、場合により置換される $C_3 - C_6$ アルキニルオキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルアミノ $-C_1 - C_6$ アルコキシ、アルキレンジオキシ、場合により置換されるアリールオキシ $-C_1 - C_6$ アルキルアミン、 $C_1 - C_6$ ペルフルオロアルキル、 $S(O)_q$ $-$ で場合により置換される $C_1 - C_6$ アルキル、 $S(O)_q$ $-$ (式中 q は 0、1 又は 2 である) で場合により置換されるアリール、 $CONR_6R_7$ 、グアニジノ又は環状グアニジノ、場合により置換されるアルキルアリール、場合により置換されるアリールアルキル、場合により置換される $C_1 - C_6$ アルキルヘテロアリール、場合により置換されるヘテロアリール $-C$

1 - C 6 アルキル、場合により置換される C 1 - C 6 アルキル単環式又は二環式飽和複素環、8 ~ 16 個の炭素原子からなる場合により置換されるアリールアルケニル、SO₂NR₆R₇、場合により置換されるアリールアルキルオキシアルキル、場合により置換されるアリールオキシアルキル、場合により置換されるヘテロアリールオキシアルキル、場合により置換されるアリールオキシアリール、場合により置換されるアリールオキシヘテロアリール、場合により置換されるヘテロアリールオキシアリール、場合により置換される C 1 - C 6 アルキルアリールオキシアリール、場合により置換される C 1 - C 6 アルキルアリールオキシヘテロアリール、場合により置換されるアリールオキシアルキル、場合により置換されるヘテロアリールオキシアルキル、又は場合により置換されるアルキルアリールオキシアルキルアミンであり；

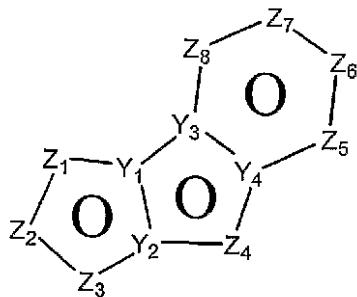
R₆ 及び R₇ は独立して H、場合により置換される C 1 - C 6 アルキル、場合により置換されるアリール、場合により置換されるヘテロアリール、場合により置換される C 1 - C 6 アルキルアリール、場合により置換されるアリールアルキル、場合により置換されるヘテロアリールアルキル、場合により置換される C 1 - C 6 アルキルヘテロアリールであるか、R₆ 及び R₇ は、それらが結合する窒素と一緒になって、R₆ 及び R₇ が結合する窒素の他に、場合により N - R₁、O、S(O)n (式中 n = 0 - 2) から選択される 1 個又は 2 個の追加のヘテロ原子を有する 3 ~ 7 員飽和環系を形成する場合があり；

Y₁、Y₂、Y₃ 及び Y₄ は独立して C 又は N である場合がある)
を有する、請求項 1 に記載の 使用。

【請求項 3】

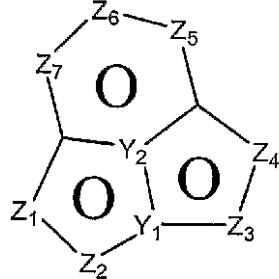
前記三環系ヘテロアリール基が

【化 3】



2-A

または



2-B

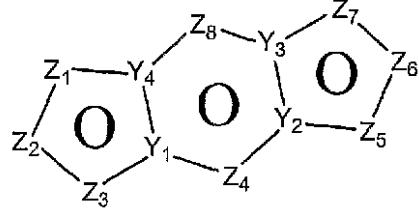
(式中、Z₁、Z₂、Z₃、Z₄、Z₅、Z₆、Z₇ 及び Z₈ は独立して、CR₂、N、O、S 又は N - R₁ であるが、但し、Z₁ ~ Z₈ の 1 つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；R₁、R₂、R₆、R₇、Y₁、Y₂、Y₃ 及び Y₄ は請求項 2 に定義された通りである)

である、請求項 1 に記載の 使用。

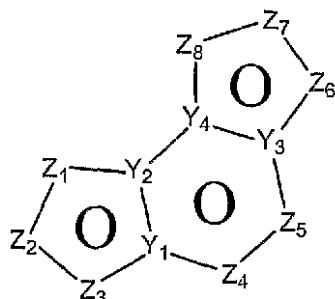
【請求項 4】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化4】



3-A



3-B

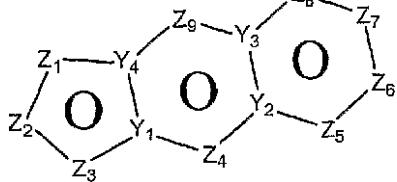
(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 、 Z_4 、 Z_5 、 Z_6 、 Z_7 及び Z_8 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N - R_1$ であるが、但し、 Z_1 ~ Z_8 の 1 つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし； R_1 、 R_2 、 R_6 、 R_7 、 Y_1 、 Y_2 、 Y_3 及び Y_4 は請求項 2 に定義された通りである)

である、請求項 1 に記載の使用。

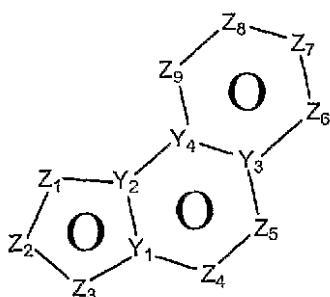
【請求項 5】

前記三環系ヘテロアリール基が

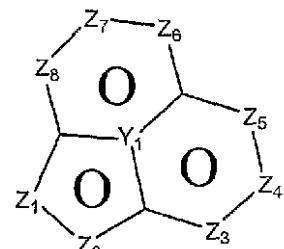
【化5】



4-A



4-B



4-C

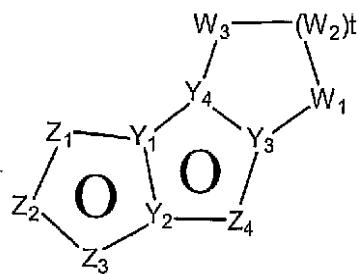
(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 、 Z_4 、 Z_5 、 Z_6 、 Z_7 、 Z_8 及び Z_9 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N - R_1$ であるが、但し、 Z_1 ~ Z_9 の 1 つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし； R_1 、 R_2 、 R_6 、 R_7 、 Y_1 、 Y_2 、 Y_3 及び Y_4 は請求項 2 に定義された通りである)

である、請求項 1 に記載の使用。

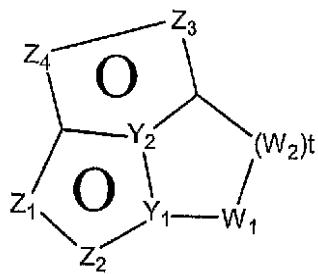
【請求項 6】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化6】



5-A



5-B

(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 及び Z_4 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N - R_1$ であるが、但し、 Z_1 ~ Z_4 の 1 つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；

W_1 、 W_2 及び W_3 は独立して、 CR_4R_4 、 $S(O)r$ (式中 $r = 0 \sim 2$)、 O 又は $N - R_1$ であるが、但し、 $S - S$ 、 $S - O$ 又は $O - O$ 結合の形成により飽和環が形成され得ないことを条件とし； R_1 、 R_2 、 R_6 、 R_7 、 Y_1 、 Y_2 、 Y_3 及び Y_4 は請求項 2 に定義された通りであり；

R_4 は、 H 、場合により置換される $C1 - C6$ アルキル、 OH (但し、両方の R_4 が O H でないことを条件とする)、 $C1 - C6$ アルコキシ、 $-S - C1 - C6$ アルキル、 CO OR_6 、 $-NR_6R_7$ 、 $-CONR_6R_7$ であるか、 R_4R_4 は共に $=O$ である場合もあれば、それらが結合する炭素と一緒にになって、 N 、 O 、 $S(O)n$ (式中 $n = 0 \sim 2$)、 $N - R_1$ から選択されるヘテロ原子の存在下又は非存在下で 5 ~ 8 員スピロ系を形成する場合もあり；

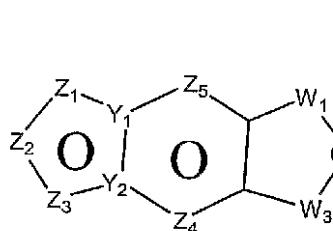
t は 1 ~ 3 である)

である、請求項 1 に記載の 使用。

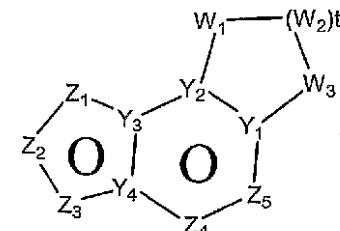
【請求項 7】

前記三環系ヘテロアリール基が

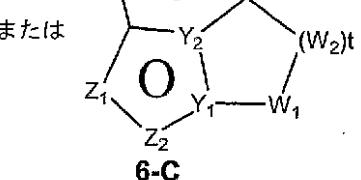
【化7】



6-A



6-B



6-C

(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 、 Z_4 及び Z_5 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N - R_1$ であるが、但し、 Z_1 ~ Z_5 の 1 つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；

Y_1 及び Y_2 は独立して C 又は N であり；

W_1 、 W_2 及び W_3 は独立して、 CR_4R_4 、 $S(O)r$ (式中 $r = 0 \sim 2$)、 O 又は $N - R_1$ であるが、但し、 $S - S$ 、 $S - O$ 又は $O - O$ 結合の形成により飽和環が形成され得ないことを条件とし； R_1 、 R_2 、 R_6 及び R_7 は請求項 2 に定義された通りであり；

R_4 は、 H 、場合により置換される $C1 - C6$ アルキル、 OH (但し、両方の R_4 が O H でないことを条件とする)、 $C1 - C6$ アルコキシ、 $-S - C1 - C6$ アルキル、 CO OR_6 、 $-NR_6R_7$ 、 $-CONR_6R_7$ であるか、 R_4R_4 は共に $=O$ である場合もあれば、それらが結合する炭素と一緒にになって、 N 、 O 、 $S(O)n$ (式中 $n = 0 \sim 2$)、 $N - R_1$ から選択されるヘテロ原子の存在下又は非存在下で 5 ~ 8 員スピロ系を形成する場合もあり；

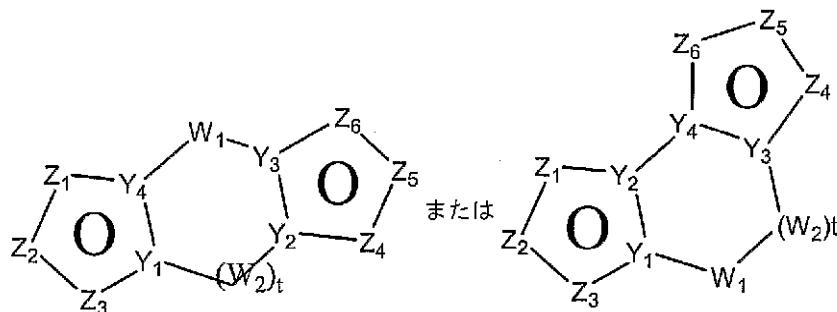
t は 1 ~ 3 である)

である、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 8】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化 8】



7-A

7-B

(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 、 Z_4 、 Z_5 及び Z_6 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N - R_1$ であるが、但し、 Z_1 ~ Z_6 の 1 つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；

W_1 及び W_2 は独立して、 CR_4R_4 、 $S(O)r$ (式中 $r = 0 \sim 2$)、 O 又は $N - R_1$ であるが、但し、 $S - S$ 、 $S - O$ 又は $O - O$ 結合の形成により飽和環が形成され得ないことを条件とし；

R_1 、 R_2 、 R_6 、 R_7 、 Y_1 、 Y_2 、 Y_3 及び Y_4 は請求項 2 に定義された通りであり；

R_4 は、 H 、場合により置換される $C_1 - C_6$ アルキル、 OH (但し、両方の R_4 が O H でないことを条件とする)、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $-S - C_1 - C_6$ アルキル、 CO OR_6 、 $-NR_6R_7$ 、 $-CONR_6R_7$ であるか、 R_4R_4 は共に $=O$ である場合もあれば、それらが結合する炭素と一緒にになって、 N 、 O 、 $S(O)n$ (式中 $n = 0 \sim 2$)、 $N - R_1$ から選択されるヘテロ原子の存在下又は非存在下で 5 ~ 8 員スピロ系を形成する場合もあり；

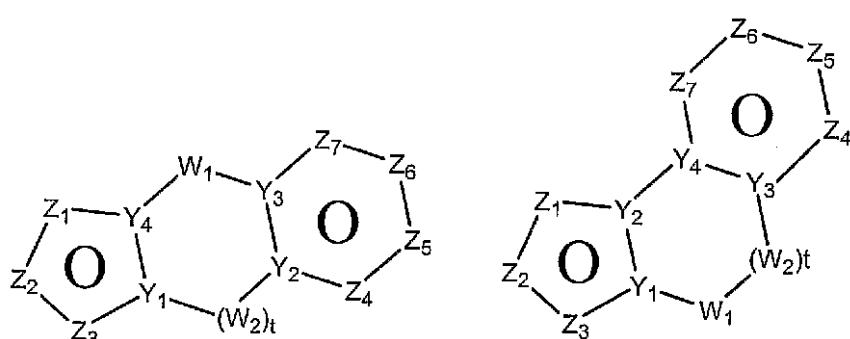
t は 1 ~ 3 である)

である、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 9】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化 9】



8-A

8-B

(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 、 Z_4 、 Z_5 、 Z_6 及び Z_7 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N - R_1$ であるが、但し、 Z_1 ~ Z_7 の 1 つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；

W_1 及び W_2 は独立して、 CR_4R_4 、 $S(O)r$ (式中 $r = 0 \sim 2$)、 O 又は $N - R_1$ であるが、但し、 $S - S$ 、 $S - O$ 又は $O - O$ 結合の形成により飽和環が形成され得ない

ことを条件とし；

R_1 、 R_2 、 R_6 、 R_7 、 Y_1 、 Y_2 、 Y_3 及び Y_4 は請求項2に定義された通りであるか；

又は場合により R_4 は、H、場合により置換されるC1-C6アルキル、OH（但し、両方の R_4 がOHでないことを条件とする）、C1-C6アルコキシ、-S-C1-C6アルキル、COOR₆、-N₆R₇、-CONR₆R₇であるか、 R_4 R_4 は共に=Oである場合もあれば、それらが結合する炭素と一緒にになって、N、O、S(O)_n（式中n=0~2）、N-R₁から選択されるヘテロ原子の存在下又は非存在下で5~8員スピロ系を形成する場合もあり；

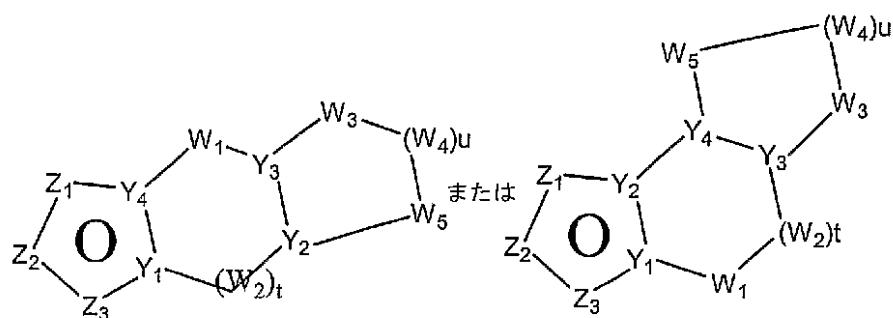
t は0~3である）

である、請求項1に記載の使用。

【請求項10】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化10】



9-A

9-B

（式中、 Z_1 、 Z_2 及び Z_3 は独立して、CR₂、N、O、S又はN-R₁であるが、但し、 Z_1 ~ Z_3 の1つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；

Y_1 及び Y_4 は独立してC又はNであり；

Y_2 及び Y_3 は独立してCH又はNであり；

W_1 、 W_2 、 W_3 、 W_4 及び W_5 は独立して、CR₄R₄、S(O)_r（式中r=0~2）、O又はN-R₁であるが、但し、S-S、S-O又はO-O結合の形成により飽和環が形成され得ないことを条件とし；

R_1 、 R_2 、 R_6 及び R_7 は請求項2に定義された通りであり；

R_4 は、H、場合により置換されるC1-C6アルキル、OH（但し、両方の R_4 がOHでないことを条件とする）、C1-C6アルコキシ、-S-C1-C6アルキル、COOR₆、-N₆R₇、-CONR₆R₇であるか、 R_4 R_4 は共に=Oである場合もあれば、それらが結合する炭素と一緒にになって、N、O、S(O)_n（式中n=0~2）、N-R₁から選択されるヘテロ原子の存在下又は非存在下で5~8員スピロ系を形成する場合もあり；

t は0~2であり；

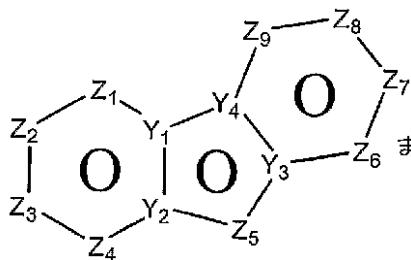
u は1~3である）

である、請求項1に記載の使用。

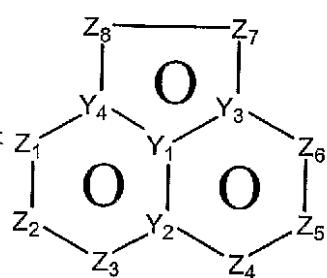
【請求項11】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化11】



10-A



10-B

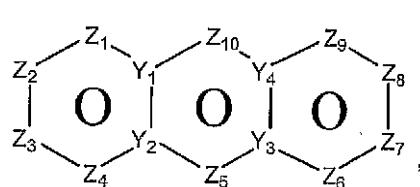
(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 、 Z_4 、 Z_5 、 Z_6 、 Z_7 、 Z_8 及び Z_9 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N-R_1$ であるが、但し、 Z_1 ～ Z_9 の1つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし； R_1 、 R_2 、 R_6 、 R_7 、 Y_1 、 Y_2 、 Y_3 及び Y_4 は請求項2に定義された通りである)

である、請求項1に記載の使用。

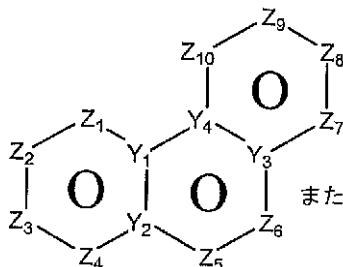
【請求項12】

前記三環系ヘテロアリール基が

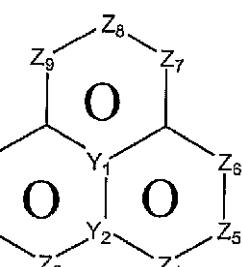
【化12】



11-A



11-B



11-C

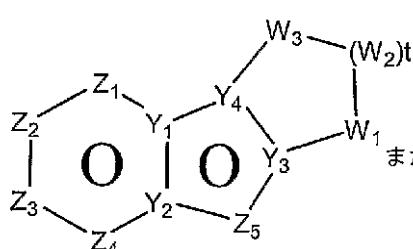
(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 、 Z_4 、 Z_5 、 Z_6 、 Z_7 、 Z_8 、 Z_9 及び Z_{10} は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N-R_1$ であるが、但し、 Z_1 ～ Z_{10} の1つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし； R_1 、 R_2 、 R_6 、 R_7 、 Y_1 、 Y_2 、 Y_3 及び Y_4 は請求項2に定義された通りである)

である、請求項1に記載の使用。

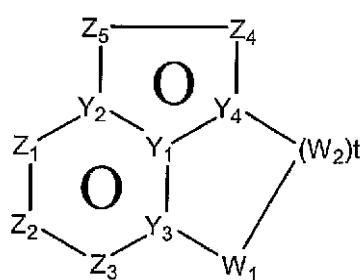
【請求項13】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化13】



12-A



12-B

(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 、 Z_4 及び Z_5 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N-R_1$ であるが、但し、 Z_1 ～ Z_5 の1つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；

W_1 、 W_2 、 W_3 は独立して、 CR_4 、 R_4 、 O 、 $N-R_1$ 、又は $S=(O)_r$ （式中 r

= 0 ~ 2) であるが、但し、S - S、S - O 又はO - O 結合の形成により飽和環が形成され得ないことを条件とし；

R₁、R₂、R₆、R₇、Y₁、Y₂、Y₃ 及びY₄ は請求項 2 に定義された通りであり；

R₄ は、H、場合により置換されるC₁ - C₆ アルキル、OH (但し、両方のR₄ がOHでないことを条件とする)、C₁ - C₆ アルコキシ、-S - C₁ - C₆ アルキル、CO OR₆、-N R₆ R₇、-CON R₆ R₇ であるか、R₄ R₄ は共に=O である場合もあれば、それらが結合する炭素と一緒にになって、N、O、S(O)_n (式中n = 0 ~ 2)、N - R₁ から選択されるヘテロ原子の存在下又は非存在下で5 ~ 8員スピロ系を形成する場合もあり；

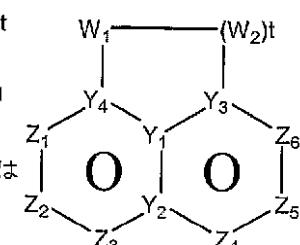
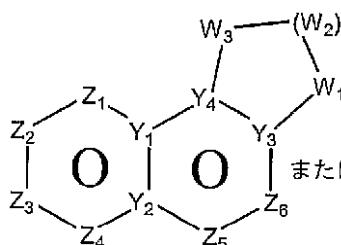
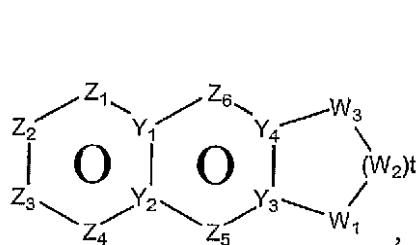
t は1 ~ 4 である)

である、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 1 4】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化 1 4】



13-A

13-B

13-C

(式中、Z₁、Z₂、Z₃、Z₄、Z₅ 及びZ₆ は独立して、CR₂、N、O、S 又はN - R₁ であるが、但し、Z₁ ~ Z₆ の1つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；

W₁、W₂ 及びW₃ は独立して、CR₄ R₄、S(O)_r (式中r = 0 ~ 2)、O 又はN - R₁ であるが、但し、S - S、S - O 又はO - O 結合の形成により飽和環が形成され得ないことを条件とし；

R₁、R₂、R₆、R₇、Y₁、Y₂、Y₃ 及びY₄ は請求項 2 に定義された通りであり；

R₄ は、H、場合により置換されるC₁ - C₆ アルキル、OH (但し、両方のR₄ がOHでないことを条件とする)、C₁ - C₆ アルコキシ、-S - C₁ - C₆ アルキル、CO OR₆、-N R₆ R₇、-CON R₆ R₇ であるか、R₄ R₄ は共に=O である場合もあれば、それらが結合する炭素と一緒にになって、N、O、S(O)_n (式中n = 0 ~ 2)、N - R₁ から選択されるヘテロ原子の存在下又は非存在下で5 ~ 8員スピロ系を形成する場合もあり；

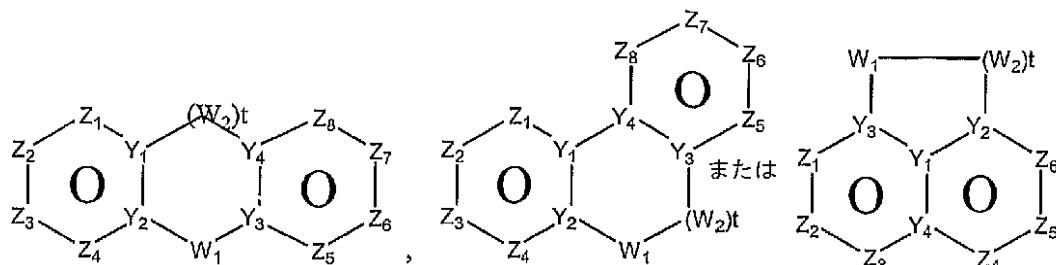
t は1 ~ 3 である)

である、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 1 5】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化15】



14-A

14-B

14-C

(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 、 Z_4 、 Z_5 、 Z_6 、 Z_7 及び Z_8 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N - R_1$ であるが、但し、 Z_1 ~ Z_8 の 1 つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；

W_1 及び W_2 は独立して、 CR_4R_4 、 $S(O)r$ (式中 $r = 0 \sim 2$)、 O 又は $N - R_1$ であるが、但し、 $S - S$ 、 $S - O$ 又は $O - O$ 結合の形成により飽和環が形成され得ないことを条件とし；

R_1 、 R_2 、 R_6 、 R_7 、 Y_1 、 Y_2 、 Y_3 及び Y_4 は請求項 2 に定義された通りであり；

R_4 は、 H 、場合により置換される $C_1 - C_6$ アルキル、 OH (但し、両方の R_4 が OH でないことを条件とする)、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $-S - C_1 - C_6$ アルキル、 COO R_6 、 $-NR_6R_7$ 、 $-CONR_6R_7$ であるが、 R_4R_4 は共に $=O$ である場合もあれば、それらが結合する炭素と一緒にになって、 N 、 O 、 $S(O)n$ (式中 $n = 0 \sim 2$)、 $N - R_1$ から選択されるヘテロ原子の存在下又は非存在下で 5 ~ 8 員スピロ系を形成する場合もあり；

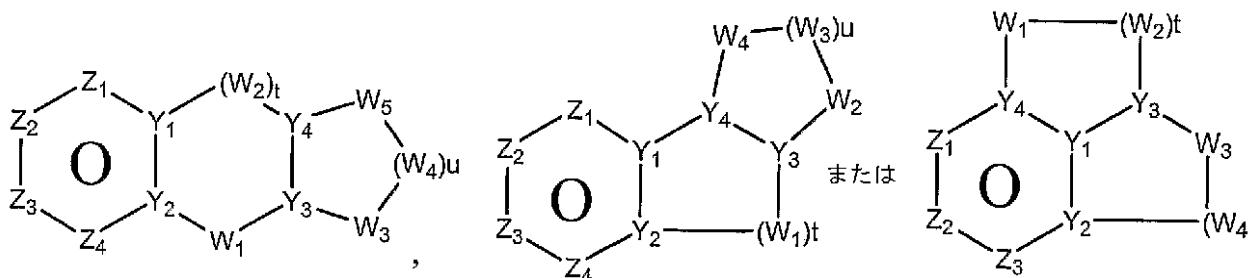
t は 1 ~ 2 である)

である、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 16】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化16】



15-A

15-B

15-C

(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 及び Z_4 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N - R_1$ であるが、但し、 Z_1 ~ Z_4 の 1 つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；

W_1 、 W_2 、 W_3 、 W_4 及び W_5 は独立して、 CR_4R_4 、 $S(O)r$ (式中 $r = 0 \sim 2$)、 O 又は $N - R_1$ であるが、但し、 $S - S$ 、 $S - O$ 又は $O - O$ 結合の形成により飽和環が形成され得ないことを条件とし；

R_1 、 R_2 、 R_6 、 R_7 、 Y_1 、 Y_2 、 Y_3 及び Y_4 は請求項 2 に定義された通りであり；

R_4 は、 H 、場合により置換される $C_1 - C_6$ アルキル、 OH (但し、両方の R_4 が OH でないことを条件とする)、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $-S - C_1 - C_6$ アルキル、 CO

OR_6 、 $-NR_6R_7$ 、 $-CONR_6R_7$ であるか、 R_4R_4 は共に $=O$ である場合もあれば、それらが結合する炭素と一緒にになって、N、O、S(O)n(式中n=0~2)、N-R₁から選択されるヘテロ原子の存在下又は非存在下で5~8員スピロ系を形成する場合もあり；

tは1~3であり；

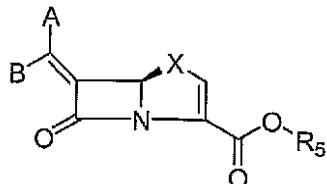
uは1~3である)

である、請求項1に記載の使用。

【請求項17】

前記化合物が以下の化学式：

【化17】



を有する、請求項1~16の何れか1項に記載の使用。

【請求項18】

XがSである、請求項1~17の何れか1項に記載の使用。

【請求項19】

前記化合物が、

(5R,6Z)-6-[(イミダゾ[2,1-b][1,3]ベンゾチアゾール-2-イルメチレン)-7-オキソ-4-チア-1-アザビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2-エン-2-カルボン酸；

(5R,6Z)-6-[(7-メトキシイミダゾ[2,1-b][1,3]ベンゾチアゾール-2-イルメチレン)-7-オキソ-4-チア-1-アザビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2-エン-2-カルボン酸；

(5R,6Z)-6-[(7-クロロイミダゾ[2,1-b][1,3]ベンゾチアゾール-2-イルメチレン)-7-オキソ-4-チア-1-アザビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2-エン-2-カルボン酸；

(5R,6Z)-6-[(1,2-a)キノリン-2-イルメチレン-7-オキソ-4-チア-1-アザビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2-エン-2-カルボン酸；

(5R,6Z)-6-[(6,7-ジヒドロ-5H-シクロヘキサ[1-b]イミダゾ[2,1-b][1,3]チアゾール-2-イルメチレン)-7-オキソ-4-チア-1-アザビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2-エン-2-カルボン酸；

(5R,6Z)-6-[(イミダゾ[1,2-a]キノキサリン-2-イルメチレン)-7-オキソ-4-チア-1-アザビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2-エン-2-カルボン酸、ナトリウム塩；

(5R,6Z)-6-[(7-メチルイミダゾ[2,1-b][1,3]ベンゾチアゾール-2-イルメチレン)-7-オキソ-4-チア-1-アザビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2-エン-2-カルボン酸；

(5R,6Z)-6-[(4,5,6,7-テトラヒドロ-1,3a,3b,8-テトラアザ-シクロヘキサ[a]インデン-2-イルメチレン)-7-オキソ-4-チア-1-アザビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2-エン-2-カルボン酸ナトリウム塩；

(5R,6E)-6-[(10-ベンジル-11-オキソ-10,11-ジヒドロジベンゾ[b,f][1,4]オキサゼピン-8-イル)メチレン]-7-オキソ-4-チア-1-アザビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2-エン-2-カルボン酸；

6-[(5-エトキシ-7,8-ジヒドロ-6H-3,4,8b-トリアザ-as-インダセン-2-イルメチレン)-7-オキソ-4-チア-1-アザビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2-エン-2-カルボン酸；

(5R, 6E & Z) - 7 - オキソ - 6 - (4H, 10H - ピラゾロ[5, 1 - c] [1, 4] ベンゾキサゼピン - 2 - イルメチレン) - 4 - チア - 1 - アザビシクロ[3.2.0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩；

(5R, 6Z) - 6 - (5H - イミダゾ[2, 1 - a] イソインドール - 2 - イルメチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ[3.2.0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸ナトリウム塩；

(5R, 6Z) - 6 - [(5 - メチルイミダゾ[2, 1 - b] [1, 3] ベンゾチアゾール - 2 - イルメチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ[3.2.0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸；

(5R, 6Z) - 6 - [(7 - フルオロイミダゾ[2, 1 - b] [1, 3] ベンゾチアゾール - 2 - イルメチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ[3.2.0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸；

(5R, 6Z) - 6 - (5, 8 - ジヒドロ - 6H - イミダゾ[2, 1 - b] ピラノ[4, 3 - d] [1, 3] チアゾール - 2 - イルメチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ[3.2.0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸；

(5R, 6Z) - 6 - (イミダゾ[2, 1 - b] ベンゾチアゾール - 7 - イルメチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ[3.2.0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸；

(5R, 6Z) - オキソ - 6 - ([1, 3] チアゾロ[3, 2 - a] ベンズイミダゾール - 2 - イルメチレン) - 4 - チア - 1 - アザビシクロ[3.2.0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸；

(5R, 6Z) - 6 - (7, 8 - ジヒドロ - 6H - シクロペンタ[3, 4] ピラゾロ[5, 1 - b] [1, 3] チアゾール - 2 - イルメチレン) - 7 - オキソ - 6 - 4 - チア - 1 - アザビシクロ[3.2.0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸；

(5R, 6Z) - 7 - オキソ - 6 - (5, 6, 7, 8 - テトラヒドロイミダゾ[2, 1 - b] [1, 3] ベンゾチアゾール - 2 - イルメチレン) - 4 - チア - 1 - アザビシクロ[3.2.0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸；

(5R, 6Z) - 8 - [(9 - メチル - 9H - イミダゾ[1, 2 - a] ベンズイミダゾール - 2 - イル) メチレン] - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ[3.2.0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸；

(5R, 6Z) - 7 - オキソ - 6 - (4H - チエノ[2', 3' : 4, 5] チオピラノ[2, 3 - b] ピリジン - 2 - イルメチレン) - 4 - チア - 1 - アザビシクロ[3.2.0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸(ナトリウム塩)；

(5R, 6Z) - 7 - オキソ - 6 - (4H - チエノ[2', 3' : 4, 5] チオピラノ[2, 3 - b] ピリジン - 2 - イルメチレン) - 4 - チア - 1 - アザビシクロ[3.2.0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸(ナトリウム塩)；

(5R, 6Z) - 6 - [(5 - メチル - 7, 8 - ジヒドロ - 6H - シクロペンタ[e] [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリミジン - 2 - イル) メチレン] - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ[3.2.0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩；

(5R, 6Z) - 6 - {[7 - (エトキシカルボニル) - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロピリド[3, 4 - e] [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] ピリミジン - 2 - イル] メチレン} - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ[3.2.0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩；

(5R, 6Z) - 6 - (8', 9' - ジヒドロ - 6' H - スピロ[1, 3 - ジオキソラン - 2, 7' - [1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] キナゾリン] - 2' - イルメチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ[3.2.0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩；

(5R, 6Z) - 6 - [(5 - メチル - 6, 7, 8, 9 - テトラヒドロ[1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5 - a] キナゾリン - 2 - イル) メチレン] - 7 - オキソ - 4 - チア -

1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩 ;
 (5 R , 6 Z) - 6 - [(5 - メトキシ - 7 , 8 - ジヒドロ - 6 H - シクロペンタ [e] イミダゾ [1 , 2 - a] ピリミジン - 2 - イル) メチレン] - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩 ;
 (5 R , 6 Z) - 6 - ({ 5 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] 7 , 8 - ジヒドロ - 6 H - シクロペンタ [e] イミダゾ [1 , 2 - a] ピリミジン - 2 - イル } メチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩 ;
 (5 R , 6 Z) - 6 - (2 , 3 - ジヒドロ [1 , 3] チアゾロ [3 , 2 - a] ベンズイミダゾール - 6 - イルメチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩 ;
 (5 R , 6 Z) - 6 - (3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - [1 , 3] チアジノ [3 , 2 - a] ベンズイミダゾール - 7 - イルメチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩 ;
 (5 R , 6 Z) - 7 - オキソ - 6 - ([1 , 3] チアゾロ [3 , 2 - a] ベンズイミダゾール - 6 - イルメチレン) - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩 ;
 (5 R , 6 Z) - 6 - (7 , 8 - ジヒドロ - 5 H - ピラノ [4 , 3 - d] ピラゾロ [5 , 1 - b] [1 , 3] オキサゾール - 2 - イルメチレン) 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩 ;
 (5 R , 6 Z) - 7 - オキソ - 6 - (5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロピラゾロ [5 , 1 - b] [1 , 3] ベンズオキサゾール - 2 - イルメチレン) - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩 ; 及び
 (5 R , 6 Z) - 6 - { [6 - (エトキシカルボニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロピラゾロ [5 ' , 1 ' : 2 , 3] [1 , 3] オキサゾロ [5 , 4 - c] ピリジン - 2 - イル] メチレン } - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の 使用。

【請求項 2 0】

処置を必要とする患者における細菌性感染症又は細菌性疾患を処置する 医薬の製造のための化合物の使用であって、該化合物が、請求項 1 ~ 19 の何れか 1 項で請求される化学式 I の化合物又はその薬学的に許容される塩若しくは *in vivo* で加水分解可能な工ステルを含む、使用。

【請求項 2 1】

前記化合物が ラクタム抗生物質と同時投与される、請求項 2 0 に記載の 使用。

【請求項 2 2】

ラクタム抗生物質 対 前記化合物の比率が約 1 : 1 ~ 約 1 0 0 : 1 である、請求項 2 1 に記載の 使用。

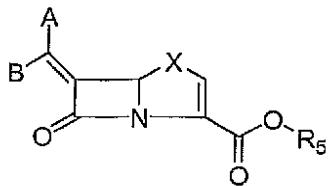
【請求項 2 3】

前記 ラクタム抗生物質 対 前記化合物の比率が 1 0 : 1 未満である、請求項 2 2 に記載の 使用。

【請求項 2 4】

細菌感染症の処置においてクラス D 酵素を阻害する ための組成物であって、以下の化学式 I の化合物 :

【化1】



|

(式中:

A及びBの一方は水素を示し、もう一方は場合により置換される縮合三環系ヘテロアリール基を示し;

XはS又はOであり;

R₅は、H、C1-C6アルキル、C5-C6シクロアルキル、またはCH₃OCO C1-C6アルキルであり;

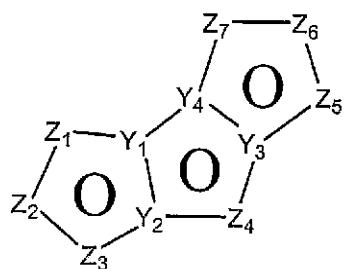
R₃は、水素、C1-C6アルキル、C5-C6シクロアルキル、場合により置換されるアリール、又は場合により置換されるヘテロアリールである);

又はその薬学的に許容される塩若しくはin vivoで加水分解可能なエステルを含む、組成物。

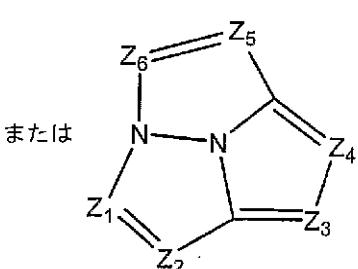
【請求項25】

前記三環系ヘテロアリール基が以下の化学式1-A又は1-B:

【化2】



1-A



1-B

(式中:

Z₁、Z₂、Z₃、Z₄、Z₅、Z₆及びZ₇は独立して、CR₂、N、O、S又はN-R₁であるが、但し、Z₁~Z₇の1つは、分子の残りが結合する炭素原子であり;

R₁は、H、場合により置換されるアルキル、場合により置換されるアリール、場合により置換されるヘテロアリール又は単環式若しくは二環式飽和複素環、場合により置換されるシクロアルキル、場合により置換されるアルケニル、二重結合及び三重結合の何れもNに直接結合する炭素原子に存在しないという条件の下で場合により置換されるアルケニル、場合により置換されるペルフルオロアルキル、-S(O)_p(式中pは2である)で場合により置換されるアルキル又はアリール、場合により置換される-C=Oヘテロアリール、場合により置換される-C=Oアリール、場合により置換される-C=Oアルキル、場合により置換される-C=Oシクロアルキル、場合により置換される-C=O単環式又は二環式飽和複素環、場合により置換されるC1-C6アルキルアリール、場合により置換されるC1-C6アルキルヘテロアリール、場合により置換されるアリール-C1-C6アルキル、場合により置換されるヘテロアリール-C1-C6アルキル、場合により置換されるC1-C6アルキル单環式又は二環式飽和複素環、場合により置換される8~16個の炭素原子からなるアリールアルケニル、-CONR₆R₇、-SO₂NR₆R₇、場合により置換されるアリールアルキル、場合により置換される-アルキル-O-アルキル-アリール、場合により置換される-アルキル-O-アルキル-ヘテロアリール、場

合により置換されるアリールオキシアルキル、場合により置換されるヘテロアリールオキシアルキル、場合により置換されるアリールオキシアリール、場合により置換されるアリールオキシヘテロアリール、場合により置換されるC1-C6アルキルアリールオキシアリール、場合により置換されるC1-C6アルキルアリールオキシヘテロアリール、場合により置換されるアルキルアリールオキシアルキルアミン、場合により置換されるアルコキシカルボニル、場合により置換されるアリールオキシカルボニル、または場合により置換されるヘテロアリールオキシカルボニルであり；

R₂は、水素、場合により置換されるC1-C6アルキル、場合により置換されるC2-C6アルケニル、場合により置換されるC2-C6アルキニル、ハロゲン、シアノ、N-R₆R₇、場合により置換されるC1-C6アルコキシ、ヒドロキシ、場合により置換されるアリール、場合により置換されるヘテロアリール、COOR₆、場合により置換されるアルキルアリールオキシアルキルアミン、場合により置換されるアリールオキシ、場合により置換されるヘテロアリールオキシ、場合により置換されるC3-C6アルケニルオキシ、場合により置換されるC3-C6アルキニルオキシ、C1-C6アルキルアミノ-C1-C6アルコキシ、アルキレンジオキシ、場合により置換されるアリールオキシ-C1-C6アルキルアミン、C1-C6ペルフルオロアルキル、S(O)_q-で場合により置換されるC1-C6アルキル、S(O)_q-（式中qは0、1又は2である）で場合により置換されるアリール、CONR₆R₇、グアニジノ又は環状グアニジノ、場合により置換されるアルキルアリール、場合により置換されるアリールアルキル、場合により置換されるC1-C6アルキルヘテロアリール、場合により置換されるヘテロアリール-C1-C6アルキル、場合により置換されるC1-C6アルキル単環式又は二環式飽和複素環、8~16個の炭素原子からなる場合により置換されるアリールアルケニル、SO₂NR₆R₇、場合により置換されるアリールアルキルオキシアルキル、場合により置換されるアリールオキシアルキル、場合により置換されるヘテロアリールオキシアルキル、場合により置換されるアリールオキシアリール、場合により置換されるアリールオキシヘテロアリール、場合により置換されるヘテロアリールオキシアリール、場合により置換されるC1-C6アルキルアリールオキシヘテロアリール、場合により置換されるアリールオキシアルキル、場合により置換されるヘテロアリールオキシアルキル、又は場合により置換されるアルキルアリールオキシアルキルアミンであり；

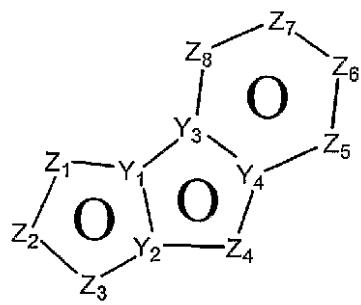
R₆及びR₇は独立してH、場合により置換されるC1-C6アルキル、場合により置換されるアリール、場合により置換されるヘテロアリール、場合により置換されるC1-C6アルキルアリール、場合により置換されるアリールアルキル、場合により置換されるヘテロアリールアルキル、場合により置換されるC1-C6アルキルヘテロアリールであるか、R₆及びR₇は、それらが結合する窒素と一緒にになって、R₆及びR₇が結合する窒素の他に、場合によりN-R₁、O、S(O)_n（式中n=0-2）から選択される1個又は2個の追加のヘテロ原子を有する3~7員飽和環系を形成する場合があり；

Y₁、Y₂、Y₃及びY₄は独立してC又はNである場合がある）
を有する、請求項2-4に記載の組成物。

【請求項2-6】

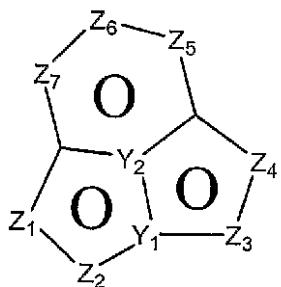
前記三環系ヘテロアリール基が

【化3】



2-A

または



2-B

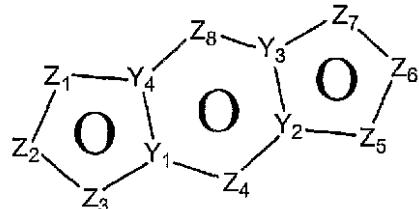
(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 、 Z_4 、 Z_5 、 Z_6 、 Z_7 及び Z_8 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N - R_1$ であるが、但し、 Z_1 ~ Z_8 の 1 つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし； R_1 、 R_2 、 R_6 、 R_7 、 Y_1 、 Y_2 、 Y_3 及び Y_4 は請求項 2 に定義された通りである)

である、請求項 2-4 に記載の組成物。

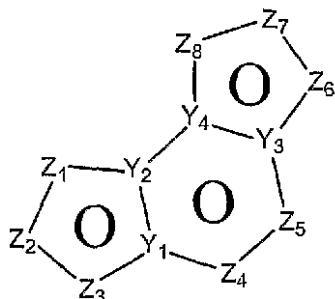
【請求項 2-7】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化4】



3-A



3-B

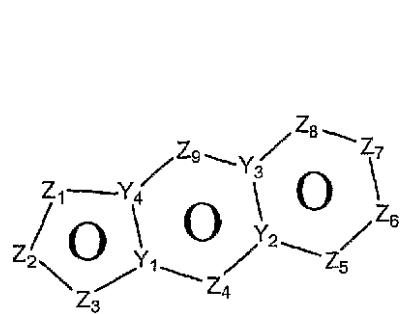
(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 、 Z_4 、 Z_5 、 Z_6 、 Z_7 及び Z_8 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N - R_1$ であるが、但し、 Z_1 ~ Z_8 の 1 つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし； R_1 、 R_2 、 R_6 、 R_7 、 Y_1 、 Y_2 、 Y_3 及び Y_4 は請求項 2 に定義された通りである)

である、請求項 2-5 に記載の組成物。

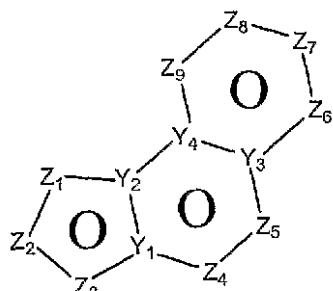
【請求項 2-8】

前記三環系ヘテロアリール基が

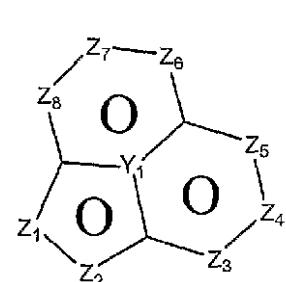
【化5】



4-A



4-B



4-C

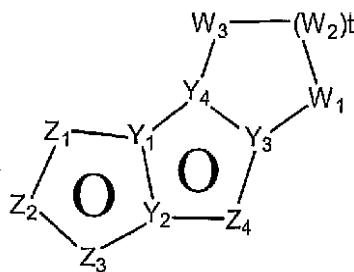
(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 、 Z_4 、 Z_5 、 Z_6 、 Z_7 、 Z_8 及び Z_9 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N - R_1$ であるが、但し、 Z_1 ～ Z_9 の1つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし； R_1 、 R_2 、 R_6 、 R_7 、 Y_1 、 Y_2 、 Y_3 及び Y_4 は請求項2に定義された通りである)

である、請求項24に記載の組成物。

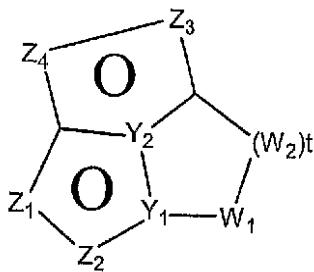
【請求項29】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化6】



5-A



5-B

(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 及び Z_4 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N - R_1$ であるが、但し、 Z_1 ～ Z_4 の1つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；

W_1 、 W_2 及び W_3 は独立して、 CR_4R_4 、 $S(O)r$ （式中 $r = 0 \sim 2$ ）、 O 又は $N - R_1$ であるが、但し、 $S - S$ 、 $S - O$ 又は $O - O$ 結合の形成により飽和環が形成され得ないことを条件とし； R_1 、 R_2 、 R_6 、 R_7 、 Y_1 、 Y_2 、 Y_3 及び Y_4 は請求項2に定義された通りであり；

R_4 は、 H 、場合により置換される $C1 - C6$ アルキル、 OH （但し、両方の R_4 が O でないことを条件とする）、 $C1 - C6$ アルコキシ、 $-S - C1 - C6$ アルキル、 CO 、 OR_6 、 $-NR_6R_7$ 、 $-CONR_6R_7$ であるか、 R_4R_4 は共に $=O$ である場合もあれば、それらが結合する炭素と一緒にになって、 N 、 O 、 $S(O)n$ （式中 $n = 0 \sim 2$ ）、 $N - R_1$ から選択されるヘテロ原子の存在下又は非存在下で5～8員スピロ系を形成する場合もあり；

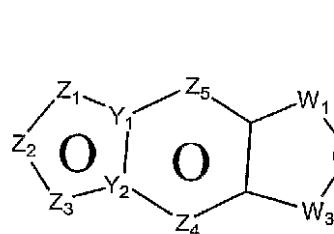
t は1～3である）

である、請求項24に記載の組成物。

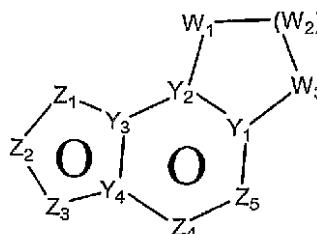
【請求項30】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化7】

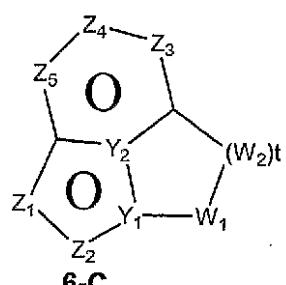


6-A



6-B

または



6-C

(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 、 Z_4 及び Z_5 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N - R_1$ であるが、但し、 Z_1 ~ Z_5 の 1 つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；

Y_1 及び Y_2 は独立して C 又は N であり；

W_1 、 W_2 及び W_3 は独立して、 CR_4R_4 、 $S(O)r$ (式中 $r = 0 \sim 2$)、 O 又は $N - R_1$ であるが、但し、 $S - S$ 、 $S - O$ 又は $O - O$ 結合の形成により飽和環が形成され得ないことを条件とし； R_1 、 R_2 、 R_6 及び R_7 は請求項 2 に定義された通りであり；

R_4 は、 H 、場合により置換される $C_1 - C_6$ アルキル、 OH (但し、両方の R_4 が OH でないことを条件とする)、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $-S - C_1 - C_6$ アルキル、 CO OR_6 、 $-NR_6R_7$ 、 $-CONR_6R_7$ であるか、 R_4R_4 は共に $=O$ である場合もあれば、それらが結合する炭素と一緒にになって、 N 、 O 、 $S(O)n$ (式中 $n = 0 \sim 2$)、 $N - R_1$ から選択されるヘテロ原子の存在下又は非存在下で 5 ~ 8 員スピロ系を形成する場合もあり；

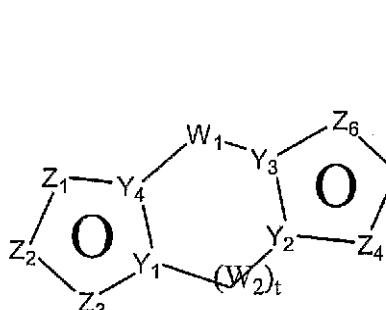
t は 1 ~ 3 である)

である、請求項 2-4 に記載の組成物。

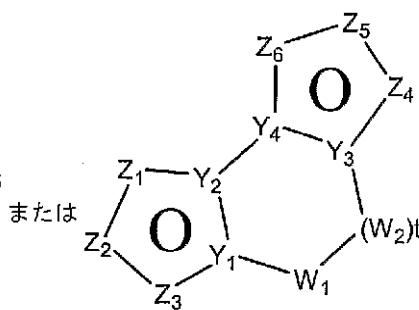
【請求項 3-1】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化8】



7-A



7-B

(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 、 Z_4 、 Z_5 及び Z_6 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N - R_1$ であるが、但し、 Z_1 ~ Z_6 の 1 つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；

W_1 及び W_2 は独立して、 CR_4R_4 、 $S(O)r$ (式中 $r = 0 \sim 2$)、 O 又は $N - R_1$ であるが、但し、 $S - S$ 、 $S - O$ 又は $O - O$ 結合の形成により飽和環が形成され得ないことを条件とし；

R_1 、 R_2 、 R_6 、 R_7 、 Y_1 、 Y_2 、 Y_3 及び Y_4 は請求項 2 に定義された通りであり；

R_4 は、 H 、場合により置換される $C_1 - C_6$ アルキル、 OH (但し、両方の R_4 が OH でないことを条件とする)、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $-S - C_1 - C_6$ アルキル、 CO OR_6 、 $-NR_6R_7$ 、 $-CONR_6R_7$ であるか、 R_4R_4 は共に $=O$ である場合もあれば、それらが結合する炭素と一緒にになって、 N 、 O 、 $S(O)n$ (式中 $n = 0 \sim 2$)、

N - R₁ から選択されるヘテロ原子の存在下又は非存在下で 5 ~ 8 員スピロ系を形成する場合もあり；

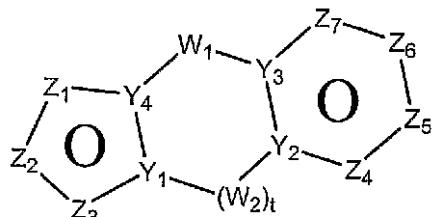
t は 1 ~ 3 である)

である、請求項 2-4 に記載の組成物。

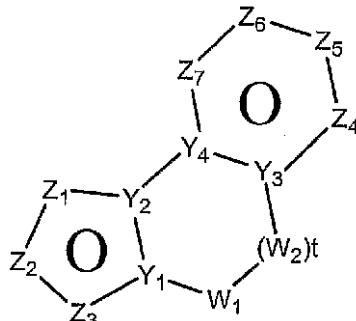
【請求項 3-2】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化 9】



8-A



8-B

(式中、Z₁、Z₂、Z₃、Z₄、Z₅、Z₆ 及び Z₇ は独立して、C R₂、N、O、S 又は N - R₁ であるが、但し、Z₁ ~ Z₇ の 1 つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；

W₁ 及び W₂ は独立して、C R₄ R₄、S(O)r (式中 r = 0 ~ 2)、O 又は N - R₁ であるが、但し、S - S、S - O 又は O - O 結合の形成により飽和環が形成され得ないことを条件とし；

R₁、R₂、R₆、R₇、Y₁、Y₂、Y₃ 及び Y₄ は請求項 2 に定義された通りであるか；

又は場合により R₄ は、H、場合により置換される C₁ - C₆ アルキル、O H (但し、両方の R₄ が O H でないことを条件とする)、C₁ - C₆ アルコキシ、- S - C₁ - C₆ アルキル、C O O R₆、- N R₆ R₇、- C O N R₆ R₇ であるか、R₄ R₄ は共に = O である場合もあれば、それらが結合する炭素と一緒にになって、N、O、S(O)n (式中 n = 0 ~ 2)、N - R₁ から選択されるヘテロ原子の存在下又は非存在下で 5 ~ 8 員スピロ系を形成する場合もあり；

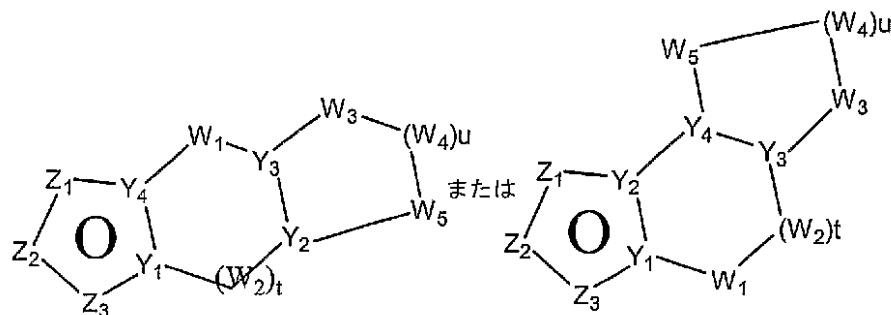
t は 0 ~ 3 である)

である、請求項 2-4 に記載の組成物。

【請求項 3-3】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化 10】



9-A

9-B

(式中、Z₁、Z₂ 及び Z₃ は独立して、C R₂、N、O、S 又は N - R₁ であるが、但し、Z₁ ~ Z₃ の 1 つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；

Y₁ 及び Y₄ は独立して C 又は N であり；

Y₂ 及び Y₃ は独立して C H 又は N であり；

W₁、W₂、W₃、W₄ 及び W₅ は独立して、C R₄ R₄、S (O) r (式中 r = 0 ~ 2)、O 又は N - R₁ であるが、但し、S - S、S - O 又は O - O 結合の形成により飽和環が形成され得ないことを条件とし；

R₁、R₂、R₆ 及び R₇ は請求項 2 に定義された通りであり；

R₄ は、H、場合により置換される C₁ - C₆ アルキル、OH (但し、両方の R₄ が O H でないことを条件とする)、C₁ - C₆ アルコキシ、- S - C₁ - C₆ アルキル、CO OR₆、- N R₆ R₇、- CON R₆ R₇ であるか、R₄ R₄ は共に = O である場合もあれば、それらが結合する炭素と一緒にになって、N、O、S (O) n (式中 n = 0 ~ 2)、N - R₁ から選択されるヘテロ原子の存在下又は非存在下で 5 ~ 8 員スピロ系を形成する場合もあり；

t は 0 ~ 2 であり；

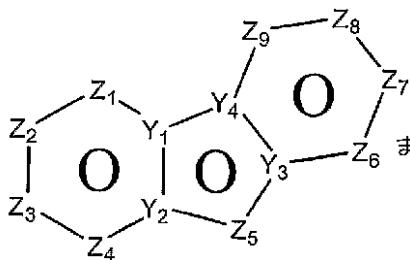
u は 1 ~ 3 である)

である、請求項 2 に記載の組成物。

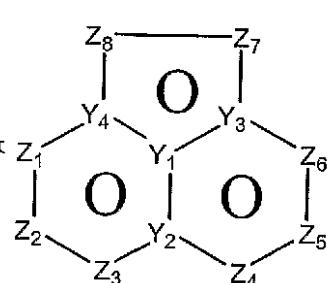
【請求項 3 4】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化 1 1】



10-A



10-B

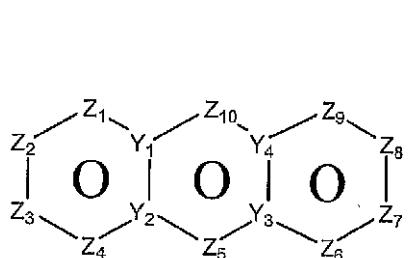
(式中、Z₁、Z₂、Z₃、Z₄、Z₅、Z₆、Z₇、Z₈ 及び Z₉ は独立して、C R₂、N、O、S 又は N - R₁ であるが、但し、Z₁ ~ Z₉ の 1 つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；R₁、R₂、R₆、R₇、Y₁、Y₂、Y₃ 及び Y₄ は請求項 2 に定義された通りである)

である、請求項 2 に記載の組成物。

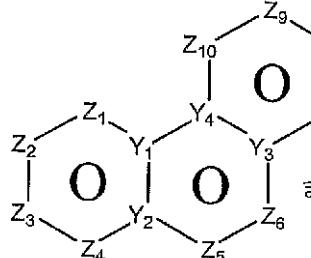
【請求項 3 5】

前記三環系ヘテロアリール基が

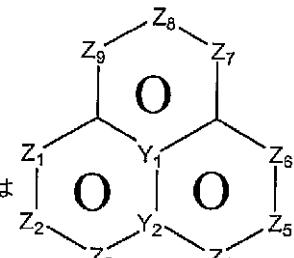
【化 1 2】



11-A



11-B



11-C

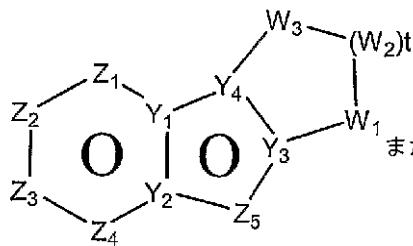
(式中、Z₁、Z₂、Z₃、Z₄、Z₅、Z₆、Z₇、Z₈、Z₉ 及び Z₁₀ は独立して、C R₂、N、O、S 又は N - R₁ であるが、但し、Z₁ ~ Z₁₀ の 1 つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；R₁、R₂、R₆、R₇、Y₁、Y₂、Y₃ 及び Y₄ は請求項 2 に定義された通りである)

である、請求項2-4に記載の組成物。

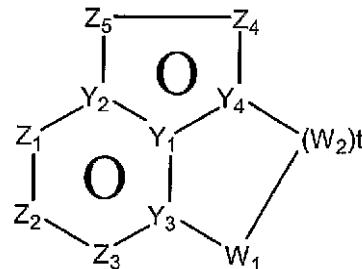
【請求項3-6】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化1-3】



12-A



12-B

(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 、 Z_4 及び Z_5 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N - R_1$ であるが、但し、 Z_1 ～ Z_5 の1つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；

W_1 、 W_2 、 W_3 は独立して、 CR_4R_4 、 O 、 $N - R_1$ 、又は $S = (O)_r$ （式中 $r = 0 \sim 2$ ）であるが、但し、 $S - S$ 、 $S - O$ 又は $O - O$ 結合の形成により飽和環が形成され得ないことを条件とし；

R_1 、 R_2 、 R_6 、 R_7 、 Y_1 、 Y_2 、 Y_3 及び Y_4 は請求項2に定義された通りであり；

R_4 は、 H 、場合により置換される $C1 - C6$ アルキル、 OH （但し、両方の R_4 が O でないことを条件とする）、 $C1 - C6$ アルコキシ、 $-S - C1 - C6$ アルキル、 CO 、 OR_6 、 $-NR_6R_7$ 、 $-CONR_6R_7$ であるか、 R_4R_4 は共に $=O$ である場合もあれば、それらが結合する炭素と一緒にになって、 N 、 O 、 $S(O)n$ （式中 $n = 0 \sim 2$ ）、 $N - R_1$ から選択されるヘテロ原子の存在下又は非存在下で5～8員スピロ系を形成する場合もあり；

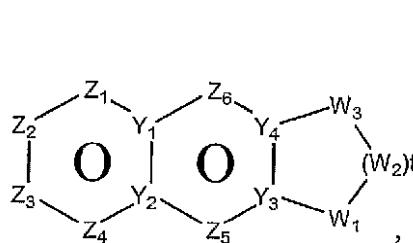
t は1～4である）

である、請求項2-4に記載の組成物。

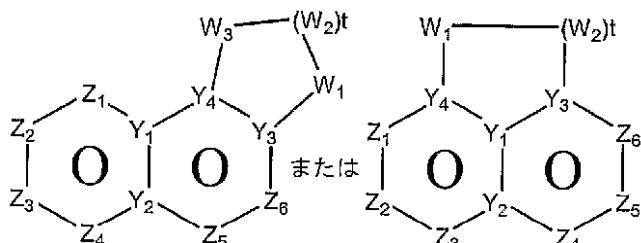
【請求項3-7】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化1-4】



13-A



13-B

13-C

(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 、 Z_4 、 Z_5 及び Z_6 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N - R_1$ であるが、但し、 Z_1 ～ Z_6 の1つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；

W_1 、 W_2 及び W_3 は独立して、 CR_4R_4 、 $S(O)r$ （式中 $r = 0 \sim 2$ ）、 O 又は $N - R_1$ であるが、但し、 $S - S$ 、 $S - O$ 又は $O - O$ 結合の形成により飽和環が形成され得ないことを条件とし；

R_1 、 R_2 、 R_6 、 R_7 、 Y_1 、 Y_2 、 Y_3 及び Y_4 は請求項2に定義された通りであり；

R_4 は、 H 、場合により置換される $C1 - C6$ アルキル、 OH （但し、両方の R_4 が O

Hでないことを条件とする)、C1-C6アルコキシ、-S-C1-C6アルキル、COOR₆、-NRR₇、-CONRR₇であるか、R₄R₄は共に=Oである場合もあれば、それらが結合する炭素と一緒にになって、N、O、S(O)n(式中n=0~2)、N-R₁から選択されるヘテロ原子の存在下又は非存在下で5~8員スピロ系を形成する場合もあり;

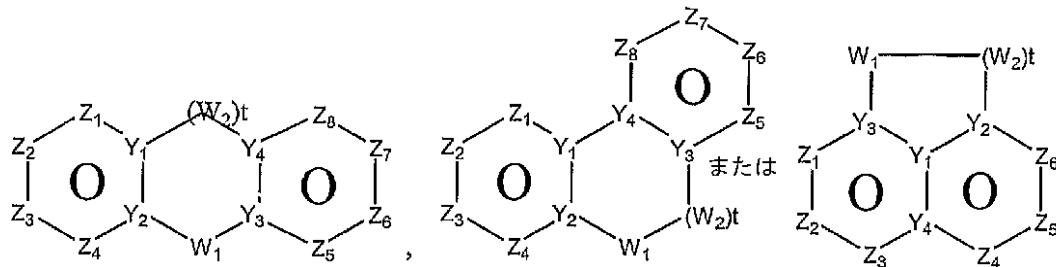
tは1~3である)

である、請求項24に記載の組成物。

【請求項38】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化15】



14-A

14-B

14-C

(式中、Z₁、Z₂、Z₃、Z₄、Z₅、Z₆、Z₇及びZ₈は独立して、CR₂、N、O、S又はN-R₁であるが、但し、Z₁~Z₈の1つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし;

W₁及びW₂は独立して、CR₄R₄、S(O)r(式中r=0~2)、O又はN-R₁であるが、但し、S-S、S-O又はO-O結合の形成により飽和環が形成され得ないことを条件とし;

R₁、R₂、R₆、R₇、Y₁、Y₂、Y₃及びY₄は請求項2に定義された通りであり;

R₄は、H、場合により置換されるC1-C6アルキル、OH(但し、両方のR₄がOHでないことを条件とする)、C1-C6アルコキシ、-S-C1-C6アルキル、COOR₆、-NRR₇、-CONRR₇であるか、R₄R₄は共に=Oである場合もあれば、それらが結合する炭素と一緒にになって、N、O、S(O)n(式中n=0~2)、N-R₁から選択されるヘテロ原子の存在下又は非存在下で5~8員スピロ系を形成する場合もあり;

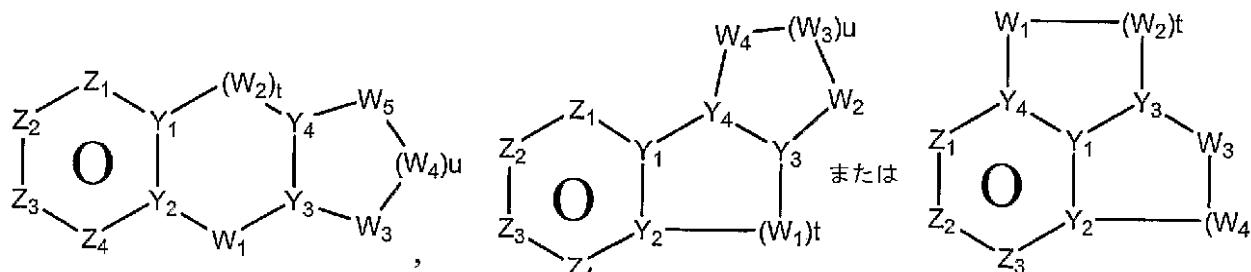
tは1~2である)

である、請求項24に記載の組成物。

【請求項39】

前記三環系ヘテロアリール基が

【化16】



15-A

15-B

15-C

(式中、 Z_1 、 Z_2 、 Z_3 及び Z_4 は独立して、 CR_2 、 N 、 O 、 S 又は $N - R_1$ であるが、但し、 Z_1 ～ Z_4 の1つは、分子の残りが結合する炭素原子であることを条件とし；

W_1 、 W_2 、 W_3 、 W_4 及び W_5 は独立して、 CR_4R_4 、 $S(O)r$ (式中 $r = 0$ ～ 2)、 O 又は $N - R_1$ であるが、但し、 $S - S$ 、 $S - O$ 又は $O - O$ 結合の形成により飽和環が形成され得ないことを条件とし；

R_1 、 R_2 、 R_6 、 R_7 、 Y_1 、 Y_2 、 Y_3 及び Y_4 は請求項2に定義された通りであり；

R_4 は、 H 、場合により置換される $C1 - C6$ アルキル、 OH (但し、両方の R_4 が O でないことを条件とする)、 $C1 - C6$ アルコキシ、 $-S - C1 - C6$ アルキル、 CO 、 OR_6 、 $-NR_6R_7$ 、 $-CONR_6R_7$ であるか、 R_4R_4 は共に $=O$ である場合もあれば、それらが結合する炭素と一緒にになって、 N 、 O 、 $S(O)n$ (式中 $n = 0$ ～ 2)、 $N - R_1$ から選択されるヘテロ原子の存在下又は非存在下で 5 ～ 8 員スピロ系を形成する場合もあり；

t は 1 ～ 3 であり；

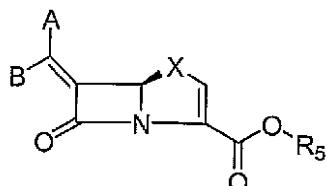
u は 1 ～ 3 である)

である、請求項2～4に記載の組成物。

【請求項40】

前記化合物が以下の化学式：

【化17】



を有する、請求項2～4の何れか1項に記載の組成物。

【請求項41】

X が S である、請求項2～4の何れか1項に記載の組成物。

【請求項42】

前記化合物が、

(5R,6Z)-6-[(イミダゾ[2,1-b][1,3]ベンゾチアゾール-2-イルメチレン)-7-オキソ-4-チア-1-アザビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2-エン-2-カルボン酸；

(5R,6Z)-6-[(7-メトキシイミダゾ[2,1-b][1,3]ベンゾチアゾール-2-イルメチレン)-7-オキソ-4-チア-1-アザビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2-エン-2-カルボン酸；

(5R,6Z)-6-[(7-クロロイミダゾ[2,1-b][1,3]ベンゾチアゾール-2-イルメチレン)-7-オキソ-4-チア-1-アザビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2-エン-2-カルボン酸；

(5R,6Z)-6-イミダゾ[1,2-a]キノリン-2-イルメチレン-7-オキソ-4-チア-1-アザビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2-エン-2-カルボン酸；

(5R,6Z)-6-[(6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]イミダゾ[2,1-b][1,3]チアゾール-2-イルメチレン)-7-オキソ-4-チア-1-アザビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2-エン-2-カルボン酸；

(5R,6Z)-6-[(イミダゾ[1,2-a]キノキサリン-2-イルメチレン)-7-オキソ-4-チア-1-アザビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2-エン-2-カルボン酸、ナトリウム塩；

(5R,6Z)-6-[(7-メチルイミダゾ[2,1-b][1,3]ベンゾチアゾール-2-イルメチレン)-7-オキソ-4-チア-1-アザビシクロ[3.2.0]ヘプタ-2-エン-2-カルボン酸；

(5 R , 6 Z) - 6 - (4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 , 3 a , 3 b , 8 - テトラアザ - シクロペンタ [a] インデン - 2 - イルメチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸ナトリウム塩 ;

(5 R , 6 E) - 6 - [(10 - ベンジル - 1 1 - オキソ - 1 0 , 1 1 - ジヒドロジベンゾ [b , f] [1 , 4] オキサゼピン - 8 - イル) メチレン] - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸 ;

6 - (5 - エトキシ - 7 , 8 - ジヒドロ - 6 H - 3 , 4 , 8 b - トリアザ - a s - インダセン - 2 - イルメチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸 ;

(5 R , 6 E & Z) - 7 - オキソ - 6 - (4 H , 1 0 H - ピラゾロ [5 , 1 - c] [1 , 4] ベンゾキサゼピン - 2 - イルメチレン) - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩 ;

(5 R , 6 Z) - 6 - (5 H - イミダゾ [2 , 1 - a] イソインドール - 2 - イルメチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸ナトリウム塩 ;

(5 R , 6 Z) - 6 - [(5 - メチルイミダゾ [2 , 1 - b] [1 , 3] ベンゾチアゾール - 2 - イルメチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸 ;

(5 R , 6 Z) - 6 - [(7 - フルオロイミダゾ [2 , 1 - b] [1 , 3] ベンゾチアゾール - 2 - イルメチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸 ;

(5 R , 6 Z) - 6 - (5 , 8 - ジヒドロ - 6 H - イミダゾ [2 , 1 - b] ピラノ [4 , 3 - d] [1 , 3] チアゾール - 2 - イルメチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸 ;

(5 R , 6 Z) - 6 - (イミダゾ [2 , 1 - b] ベンゾチアゾール - 7 - イルメチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸 ;

(5 R , 6 Z) - オキソ - 6 - ([1 , 3] チアゾロ [3 , 2 - a] ベンズイミダゾール - 2 - イルメチレン) - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸 ;

(5 R , 6 Z) - 6 - (7 , 8 - ジヒドロ - 6 H - シクロペンタ [3 , 4] ピラゾロ [5 , 1 - b] [1 , 3] チアゾール - 2 - イルメチレン) - 7 - オキソ - 6 - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸 ;

(5 R , 6 Z) - 7 - オキソ - 6 - (5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] [1 , 3] ベンゾチアゾール - 2 - イルメチレン) - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸 ;

(5 R , 6 Z) - 8 - [(9 - メチル - 9 H - イミダゾ [1 , 2 - a] ベンズイミダゾール - 2 - イル) メチレン] - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸 ;

(5 R , 6 Z) - 7 - オキソ - 6 - (4 H - チエノ [2 ' , 3 ' : 4 , 5] チオピラノ [2 , 3 - b] ピリジン - 2 - イルメチレン) - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸 (ナトリウム塩) ;

(5 R , 6 Z) - 7 - オキソ - 6 - (4 H - チエノ [2 ' , 3 ' : 4 , 5] チオピラノ [2 , 3 - b] ピリジン - 2 - イルメチレン) - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸 (ナトリウム塩) ;

(5 R , 6 Z) - 6 - [(5 - メチル - 7 , 8 - ジヒドロ - 6 H - シクロペンタ [e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 2 - イル) メチレン] - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩 ;

(5 R , 6 Z) - 6 - { [7 - (エトキシカルボニル) - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒド

ロピリド [3 , 4 - e] [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 2 - イル] メチレン } - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩；

(5 R , 6 Z) - 6 - (8 ' , 9 ' - ジヒドロ - 6 ' H - スピロ [1 , 3 - ジオキソラン - 2 , 7 ' - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] キナゾリン] - 2 ' - イルメチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩；

(5 R , 6 Z) - 6 - [(5 - メチル - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] キナゾリン - 2 - イル) メチレン] - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩；

(5 R , 6 Z) - 6 - [(5 - メトキシ - 7 , 8 - ジヒドロ - 6 H - シクロペンタ [e] イミダゾ [1 , 2 - a] ピリミジン - 2 - イル) メチレン] - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩；

(5 R , 6 Z) - 6 - ({ 5 - [2 - (ベンジルオキシ) エトキシ] 7 , 8 - ジヒドロ - 6 H - シクロペンタ [e] イミダゾ [1 , 2 - a] ピリミジン - 2 - イル } メチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩；

(5 R , 6 Z) - 6 - (2 , 3 - ジヒドロ [1 , 3] チアゾロ [3 , 2 - a] ベンズイミダゾール - 6 - イルメチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩；

(5 R , 6 Z) - 6 - (3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - [1 , 3] チアジノ [3 , 2 - a] ベンズイミダゾール - 7 - イルメチレン) - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩；

(5 R , 6 Z) - 7 - オキソ - 6 - ([1 , 3] チアゾロ [3 , 2 - a] ベンズイミダゾール - 6 - イルメチレン) - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩；

(5 R , 6 Z) - 6 - (7 , 8 - ジヒドロ - 5 H - ピラノ [4 , 3 - d] ピラゾロ [5 , 1 - b] [1 , 3] オキサゾール - 2 - イルメチレン) 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩；

(5 R , 6 Z) - 7 - オキソ - 6 - (5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロピラゾロ [5 , 1 - b] [1 , 3] ベンズオキサゾール - 2 - イルメチレン) - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩；及び

(5 R , 6 Z) - 6 - { [6 - (エトキシカルボニル) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロピラゾロ [5 ' , 1 ' : 2 , 3] [1 , 3] オキサゾロ [5 , 4 - c] ピリジン - 2 - イル] メチレン } - 7 - オキソ - 4 - チア - 1 - アザビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタ - 2 - エン - 2 - カルボン酸、ナトリウム塩

からなる群から選択される、請求項 2 4 に記載の組成物。

【請求項 4 3】

患者における細菌性感染症又は細菌性疾患を処置するための組成物であって、請求項 2 4 ~ 4 2 の何れか 1 項で請求される化学式 I の化合物又はその薬学的に許容される塩若しくは i n v i v o で加水分解可能なエステルの有効量を含む、組成物。

【請求項 4 4】

前記化合物が ラクタム抗生物質と同時投与される、請求項 4 3 に記載の組成物。

【請求項 4 5】

ラクタム抗生物質 対 前記化合物の比率が約 1 : 1 ~ 約 1 0 0 : 1 である、請求項 4 4 に記載の組成物。

【請求項 4 6】

前記 ラクタム抗生物質 対 前記化合物の比率が 1 0 : 1 未満である、請求項 4 5 に記載の組成物。