

【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17年6月2日(2005.6.2)

【公表番号】特表2003-535860(P2003-535860A)  
 【公表日】平成15年12月2日(2003.12.2)  
 【出願番号】特願2002-501891(P2002-501891)  
 【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 413/10  
 A 6 1 K 31/4439  
 A 6 1 K 31/506  
 A 6 1 K 31/5377  
 A 6 1 K 31/551  
 A 6 1 P 31/04  
 C 0 7 D 413/14  
 // C 0 7 B 61/00

【F I】

C 0 7 D 413/10  
 A 6 1 K 31/4439  
 A 6 1 K 31/506  
 A 6 1 K 31/5377  
 A 6 1 K 31/551  
 A 6 1 P 31/04  
 C 0 7 D 413/14  
 C 0 7 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成15年8月15日(2003.8.15)

【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

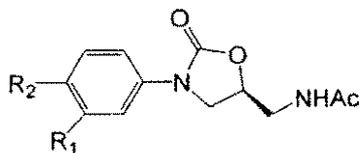
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

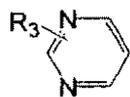
下記の化学式1で表示されるオキサゾリジノン誘導体及び医薬的に許容されるその塩：

【化1】

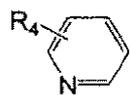


(上記式中、R<sub>1</sub>は、H、F、ClまたはCF<sub>3</sub>であり、  
 R<sub>2</sub>は、

## 【化 2】



、または



であり、

ここで、 $R_3$ は、アミノ基、 $R_5$ が置換または置換されていないピペラジニル基であり、この時  $R_5$ は、

- (a) 水素、
  - (b) トリフェニルメチル基、
  - (c) 置換または置換されていないアセチル基、ここで当該置換されたアセチル基は、ベンジルオキシアセチル基、アセトキシアセチル基、ヒドロキシアセチル基、 $C_1 \sim C_3$ のアルキルアミノアセトキシアセチル基、ハロゲンが置換されたアセチル基、モルホリ-4-イルアセチル基、イミダゾール-1-イルカーボニルオキシアセチル基、 $C_1 \sim C_3$ のアルコキシカーボニルメチルアミノアセチル基、 $C_1 \sim C_3$ のアルコキシアセチル基、*t*-ブチルアセチル基、 $C_1 \sim C_3$ のアルコキシ基で置換されたまたは置換されていないフェニルアセチル基または $C_1 \sim C_3$ のアルコキシオキソアセチル基である、
  - (d) 置換または置換されていないベンゾイル基、ここで当該置換されたベンゾイル基は、 $C_1 \sim C_4$ のアルコキシベンゾイル基、トリハロメチルベンゾイル基またはニトロベンゾイル基である、
  - (e) 置換または置換されていないカーボニル基、ここで上記の置換されたカーボニル基は、 $C_1 \sim C_4$ のハロアルキルカーボニル基、フェノキシカーボニル基またはベンジルオキシカーボニル基である、
  - (f)  $C_1 \sim C_3$ のアルコキシフェニル基、
  - (g)  $C_1 \sim C_3$ のアルキル基が置換または置換されていないアクリロイル基、
  - (h) ニコチノイル基、
  - (i) ピバロイル基、
  - (g) クロトニル基、または、
  - (k) *n*-パレリル基
- であり、

ここで、 $R_4$ は、アジド、 $-(C=O)_1-R_6$ 、 $-NR_7R_8$ 、 $-(CH_2)_m-R_9$ 、または $-OR_{10}$ 、であり、ここで $R_6$ は、 $C_1 \sim C_3$ のアルコキシ、アミノ、 $C_1 \sim C_3$ のアルキルアミノまたは $C_1 \sim C_3$ のヒドロキシアルキルアミノ基であり、 $l$ は、1~2の整数であり、 $R_7$ と $R_8$ はお互いに同じかまたは異なり、

(b) 一つまたはそれ以上のフェニル基で置換された $C_1 \sim C_4$ のアルキル基、 $C_1 \sim C_3$ のアルキルアミノ基で置換された $C_1 \sim C_4$ のアルケニル基、

(c) 置換または置換されていないアセチル基、ここで当該置換されたアセチル基はアセトキシアセチル、ヒドロキシアセチル、 $C_1 \sim C_3$ のアルキルアミノアセトキシアセチル、 $C_1 \sim C_3$ のアルコキシアセチル、アミノアセチル、アジドアセチル、アセチルアミノアセチル、 $C_1 \sim C_3$ のアルキルアミノアセチル、アミノプロピオニルまたはヒドロキシプロピオニル基である、または、

- (d) ニコチノイル基

であり、

$R_9$ は、アジド、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_3$ のアルキルアミノアセトキシ、アセチルチオ、メルカプト、シアノ、ハロゲン元素、または5-または6-ヘテロ環であり、 $m$ は、1ないし4の整数であり、

$R_{10}$ は、アセチル、アルコキシアシルまたはメタンスルホニル基である。

また $R_4$ は、

(a) 炭素、窒素、または酸素が一つ以上含まれている5員環または6員環のヘテロ環である、

(b) 炭素、少なくとも1個の窒素または酸素で構成されている5員環であって、環(ring)を構成するどれか一つの炭素上に二個の水素で飽和されているか、または酸素(ケトン)、窒素(イミノ)または硫黄(チオケトン)との二重結合で構成されているヘテロ環(heterocyclic ring)である、

(c) 炭素、窒素、酸素または硫黄で構成されている5員環または6員環のヘテロ芳香環(heteroaromatic ring)である、

である)。

【請求項2】

3) (S)-[N-3-(4-(2-アミノピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

4) (S)-[N-3-(4-(2-(4-トリフェニルメチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

5) (S)-[N-3-(4-(2-ピペラジン-1-イルピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

6) (S)-[N-3-(4-(2-(4-アセチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

7) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ベンジルオキシアセチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

8) (S)-[N-3-(4-(2-(4-アセトキシアセチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

9) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ヒドロキシアセチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

10) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ジメチルアミノアセトキシアセチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

11) (S)-[N-3-(4-(2-(4-プロモアセチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

12) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ホルリン-4-イルアセチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

13) (S)-[N-3-(4-(2-(4-イミダゾール-1-イルカーボニルオキシアセチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

14) (S)-[N-3-(4-(2-(4-クロロアセチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

15) (S)-[N-3-(4-(2-(4-メトキシカーボニルメチルアミノアセチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

16) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(4-メトキシフェニルピペラジン-4-イル)アセチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

17) (S)-[N-3-(4-(2-(4-メトキシアセチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

18) (S)-[N-3-(4-(2-(4-アクリロイルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオ

- ロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 19) (S)-[N-3-(4-(2-(4-エトキシオキソアセチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 20) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ニコチノイルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 21) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ピパロイルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 22) (S)-[N-3-(4-(2-(4-t-ブチルアセチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 23) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(2,5-ジメトキシフェニル)アセチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 24) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(3,3-ジメチルアクリロイル)ピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 25) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(2,6-ジメトキシベンゾイル)ピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 26) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(2-トリフルオロメチルベンゾイル)ピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 27) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(4-トリフルオロメチルベンゾイル)ピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 28) (S)-[N-3-(4-(2-(4-フェニルアセチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 29) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(3,5-ジニトロベンゾイル)ピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 30) (S)-[N-3-(4-(2-(4-クロトニルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 31) (S)-[N-3-(4-(2-(4-トリクロロアセチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 32) (S)-[N-3-(4-(2-(4-n-バレリルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 33) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(1-プロモエチルカーボニル)ピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 34) (S)-[N-3-(4-(2-(4-フェノキシカーボニルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 35) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ベンジルオキシカーボニルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 38) (S)-[N-3-(4-(3-メトキシカルボニルピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 39) (S)-[N-3-(4-(2-アセチルアミノピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 40) (S)-[N-3-(4-(2-アセトキシアセチルアミノピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 41) (S)-[N-3-(4-(2-ヒドロキシアセチルアミノピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 42) (S)-[N-3-(4-(2-イミダゾール-1-イル-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 43) (S)-[N-3-(4-(2-モルホリン-4-イル-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 44) (S)-[N-3-(4-(2-トリフェニルメチルアミノピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 46) (S)-[N-3-(4-(2-メトキシアセチルアミノピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-

- オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 47) (S)-[N-3-(4-(2-(4-トリフェニルメチルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 48) (S)-[N-3-(4-(2-トリフェニルメチルアミノピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 49) (S)-[N-3-(4-(2-アジドピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 50) (S)-[N-3-(4-(2-ヒドロキシメチルピリジン-4-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 51) (S)-[N-3-(4-(2-メトキシカーボニルピリジン-4-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 52) (S)-[N-3-(4-(2-ジメチルアミノカーボニルピリジン-4-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 54) (S)-[N-3-(4-(N-2-ジメチルアミノアセトキシアセチルアミノピリジン-4-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 57) (S)-[N-3-(4-(2-ヒドロキシアセチルアミノピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 58) (S)-[N-3-(4-(2-ヒドロキシアセチルアミノピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミドヒドロキシプロピルメチルセルロース (HPMC, hydroxypropylmethylcellulose)、
- 59) (S)-[N-3-(4-(2-アセトキシピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 60) (S)-[N-3-(4-(2-メトキシメチルオキシピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 61) (S)-[N-3-(4-(2-メタンスルホニルオキシピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 62) (S)-[N-3-(4-(2-アミノカーボニルピリジン-4-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 63) (S)-[N-3-(4-(2-ジメチルアミノアセトキシメチルピリジン-4-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 64) (S)-[N-3-(4-(2-(2-ヒドロキシエチル)アミノカーボニルピリジン-4-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 65) (S)-[N-3-(4-(2-N,N-ジ(2-ヒドロキシエチル)アミノカーボニルピリジン-4-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 66) (S)-[N-3-(4-(2-ピペラジン-1-イルピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 67) (S)-[N-3-(4-(2-(4-アセトキシアセチルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 68) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ベンジルオキシアセチルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 69) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ヒドロキシアセチルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 70) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ジメチルアミノアセトキシアセチルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 71) (S)-[N-3-(4-(2-(4-クロロアセチルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 72) (S)-[N-3-(4-(2-(4-アセチルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 73) (S)-[N-3-(4-(2-(4-メトキシアセチルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

- 74) (S)-[N-3-(4-(2-(4-モルホリニルアセチルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 75) (S)-[N-3-(4-(2-(4-メトキシカーボニルメチルアミノアセチルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 76) (S)-[N-3-(4-(2-(4-エトキシカーボニルピペリジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 77) (S)-[N-3-(4-(2-アジドメチルピリジン-4-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 78) (S)-[N-3-(4-(2-イミダゾール-1-イル)メチルピリジン-4-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 79) (S)-[N-3-(4-(2-モルホリン-4-イル)メチルピリジン-4-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 80) (S)-[N-3-(4-(2-アセチルチオメチルピリジン-4-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 81) (S)-[N-3-(4-(2-メルカプトメチルピリジン-4-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 82) (S)-[N-3-(4-(2-(4-メタンスルホニルオキシアセチルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 83) (S)-[N-3-(4-(2-(4-アクリロイルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 84) (S)-[N-3-(4-(2-(4-エトキシオキソアセチルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 85) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ニコチノイルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 86) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ピバロイルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 87) (S)-[N-3-(4-(2-(4-テトラブチルアセチルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 88) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ニコチノイルオキシアセチルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 89) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(2,5-ジメトキシフェニルアセチル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 90) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(3,3-ジメチルアクリロイル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 91) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(2,6-ジメトキシベンゾイル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 92) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(2-トリフルオロメチル)ベンゾイル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 93) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(4-トリフルオロメチル)ベンゾイル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 94) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ベンジルカーボニルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 95) (S)-[N-3-(4-(2-(4-クロトニルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 96) (S)-[N-3-(4-(2-(4-トリフルオロメチルカーボニルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 97) (S)-[N-3-(4-(2-(4-n-パレリルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 98) (S)-[N-3-(4-(2-(4-フェニルオキシカーボニルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル)

- 3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
99) (S)-[N-3-(4-(2-(4-アシルオキシカーボニルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
100) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(1-クロロエチル)オキシカーボニルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
101) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(4-ニトロベンジル)オキシカーボニルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
102) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ベンジルオキシカーボニルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
103) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(9-フルオレニルメチルオキシカーボニル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
104) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(2-ピリミジニル)ピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
105) (S)-[N-3-(4-(2-(4-メトキシカーボニルメチルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
106) (S)-[N-3-(4-(2-フルオロメチルピリジン-4-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
107) (S)-[N-3-(4-(2-シアノメチルピリジン-4-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
109) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(2-ヒドロキシ)エチルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
110) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(2-アセトキシ)エチルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
111) (S)-[N-3-(4-(2-(4-メトキシカーボニルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
112) (S)-[N-3-(4-(2-(4-(2-メタンスルホニルオキシ)エチルピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
113) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ヒドロキシメチル)イミダゾール-1-イル)ピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
114) (S)-[N-3-(4-(2-アミノアセチルアミノピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
115) (S)-[N-3-(4-(2-(4-シアノピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
116) (S)-[N-3-(4-(2-(4-カルボキシアミドオキシムピペラジン-1-イル)ピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
117) (S)-[N-3-(4-(2-(4-オキソピペリジン-1-イル)ピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
118) (S)-[N-3-(4-(2-アジドアセチルアミノピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
119) (S)-[N-3-(4-(2-(1,2,3,4,6,7-ヘキサヒドロ-5-オキソ-1,4-ジアゼパン-1-イル))-ピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
120) (S)-[N-3-(4-(2-N-(ジメチルアミノメチレン)アミノピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
121) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ヒドロキシイミノピペリジン-1-イル)ピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、  
122) (S)-[N-3-(4-(2-(4-メタンスルホニルオキシイミノピペリジン-1-イル)ピリジン-5-イル))-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

- 123) (S)-[N-3-(4-(2-(4-メチルイミノピペリジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 124) (S)-[N-3-(4-(2-(4-メトキシカーボニルヒドラジノピペリジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 125) (S)-[N-3-(4-(2-N-(L-アラニル)アミノピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 126) (S)-[N-3-(4-(2-アセチルアミノアセチルアミノピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 127) (S)-[N-3-(4-(2-ジメチルアミノアセチルアミノピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 128) (S)-[N-3-(4-(2-ニコチノイルアミノピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 129) (S)-[N-3-(4-(2-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 130) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 131) (S)-[N-3-(4-(2-N,N-(ヒドロキシアセチル)メチルアミノピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 132) (S)-[N-3-(4-(2-(4-メチルイミダゾール-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 133) (S)-[N-3-(4-(2-(2-ヒドロキシプロピオニル)アミノピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 134) (S)-[N-3-(4-(2-(3-アミノ-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 135) (S)-[N-3-(4-(2-(4-エトキシカーボニルイミダゾール-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 136) (S)-[N-3-(4-(2-(1-テトラゾリル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 137) (S)-[N-3-(4-(2-(5-メチル-(1,3,4)-オキサジアゾール-2-イル)-ピリジン-5-イル)ピリジニル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 138) (S)-[N-3-(4-(2-(5-メチル-(1,2,4)-オキサジアゾール-3-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 139) (S)-[N-3-(4-(2-(1-メチル-5-テトラゾリル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 140) (S)-[N-3-(4-(2-(2-メチル-5-テトラゾリル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 141) (S)-[N-3-(4-(2-(4-エトキシカルボニル-(1,2,3)-トリアゾール-1-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 142) (S)-[N-3-(4-(2-(3-ピロリニル)-5-ピリジニル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 143) (S)-[N-3-(4-(2-(2-オキソ-(1,3)-オキサゾリジン-3-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 144) (S)-[N-3-(4-(2-((1,3)-オキサゾール-5-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 145) (S)-[N-3-(4-(2-((1,2,4)-オキサジアゾール-3-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 146) (S)-[N-3-(4-(2-((1,2,3)-トリアゾール-1-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、
- 147) (S)-[N-3-(4-(2-(3-メチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-(1,3,4)-トリアゾール-1-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトア

ミド、

148) (S)-[N-3-(4-(2-(2-オキソ-(1,3)-イミダゾリジン-1-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

149) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

150) (S)-[N-3-(4-(2-(2-オキソ-(2,3)-ジヒドロ-(1,3,4)-トリアゾール-1-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

151) (S)-[N-3-(4-(2-(5-ヒドロキシメチル-(1,2,4)-オキサジアゾール-3-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

152) (S)-[N-3-(4-(2-(5-テトラゾリル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

153) (S)-[N-3-(4-(2-(5-メトキシメチル-(1,2,4)-オキサジアゾール-3-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

154) (S)-[N-3-(4-(2-(5-トリクロロメチル-(1,2,4)-オキサジアゾール-3-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

155) (S)-[N-3-(4-(2-(5-ジメチルアミノ-(1,2,4)-オキサジアゾール-3-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

156) (S)-[N-3-(4-(2-(5-アミノ-(1,2,4)-オキサジアゾール-3-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

157) (S)-[N-3-(4-(2-(4-アセチルアミノ-1-ピペリジン-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

158) (S)-[N-3-(4-(2-(4-アセチルオキシメチルカルボニルアミノ-ピペリジン-1-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

159) (S)-[N-3-(4-(2-(4-ヒドロキシメチルカルボニルアミノ-ピペリジン-1-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド  
または、

160) (S)-[N-3-(4-(2-(3,4-ジヒドロキシ-ピロリジン-1-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド

から成る群れから選ばれる、請求項 1 に記載のオキサゾリジノン誘導体。

【請求項 3】

(S)-[N-3-(4-(2-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

(S)-[N-3-(4-(2-(5-メチル-(1,3,4)-オキサジアゾール-2-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

(S)-[N-3-(4-(2-(5-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、

(S)-[N-3-(4-(2-(1-メチル-5-テトラゾリル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド、または

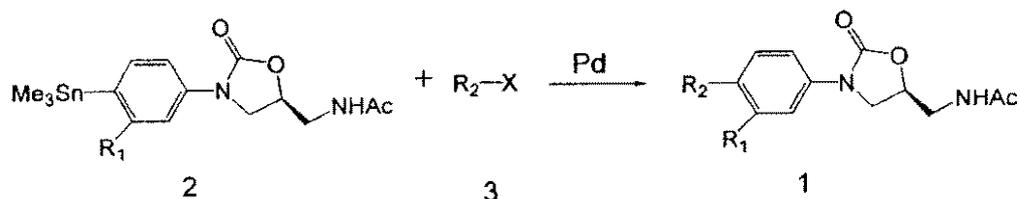
(S)-[N-3-(4-(2-(オキソ-1,3--オキサゾリジン-1-イル)-ピリジン-5-イル)-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-5-オキサゾリジニル]メチルアセトアミド

から成る群れから選ばれる、請求項 1 に記載のオキサゾリジノン誘導体。

【請求項 4】

トリメチルスタンニルオキサゾリジノン誘導体 2 をピリジンまたはピリミジン誘導体 3 とパラジウム触媒下で反応させ製造されることを特徴とする請求項 1 の化学式 1 で表示されるオキサゾリジノン誘導体の製造方法：

## 【化3】



スキーム 1

(上記式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 及びXは、上記で定義したものと同様である。)

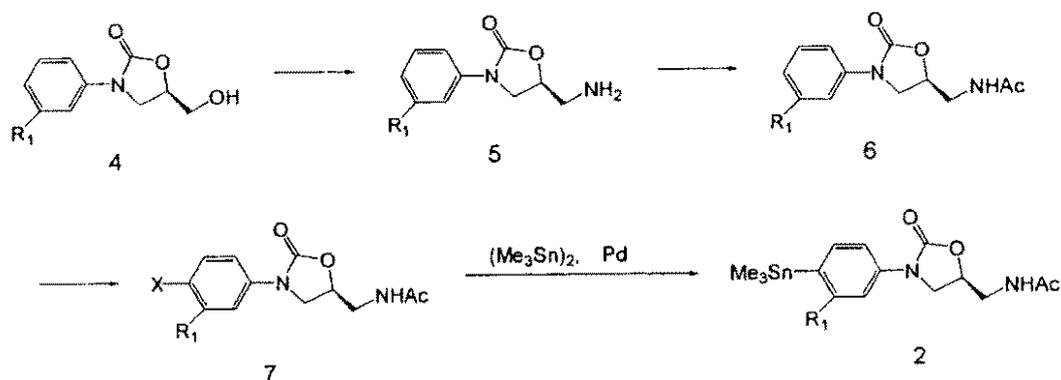
## 【請求項5】

上記の化学式2の化合物が、

- ヒドロキシメチルオキサゾリジノン誘導体4のヒドロキシ基をアミン基に変換させアミン化合物5を製造し(工程1)、
- 上記のアミン化合物5を無水酢酸と反応してアセチル化合物6を製造し(工程2)、
- 上記のアセチル化合物6をハロゲン化反応させハロゲン化合物7を製造し(工程3)、
- 上記のハロゲン化合物8をパラジウム触媒下でスタンニル化させ製造される(工程4)

ことを特徴とする請求項4に記載のオキサゾリジノン誘導体の製造方法：

## 【化4】



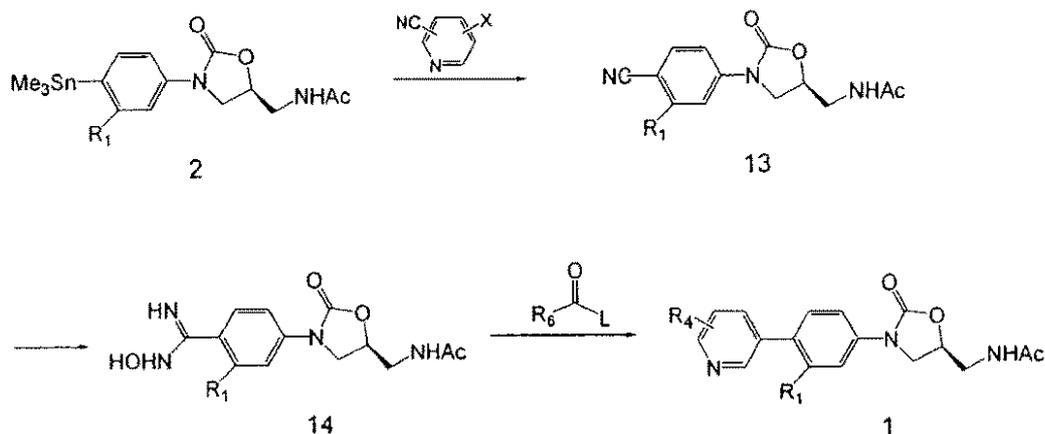
スキーム 2

(上記式中、 $R_1$ は化学式1で定義したものと同様で、Xはハロゲン元素である。)

## 【請求項6】

トリメチルスタンニルオキサゾリジノン誘導体2及びシアノピリジジン誘導体と反応させ化学式13の化合物を製造し、ヒドロキシルアミンでイミン化して化学式14の化合物を製造し、上記の化学式14の化合物とカルボキシル酸誘導体を反応させ製造することを特徴とする請求項1に記載のオキサゾリジノン誘導体の製造方法：

## 【化5】



(上記式中、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_6$ 及び $X$ は、上記で定義したものと同様に、 $L$ は通常的な離脱基である。)

## 【請求項7】

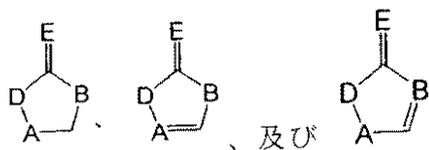
請求項1のオキサゾリジノン誘導体化合物及びこれらの薬学的に許容されるその塩を有効成分に含む抗生剤用医薬組成物。

## 【請求項8】

上記 $R_4$ が、

- a) 窒素または酸素原子を単独または2個以上含むか、または窒素または酸素を各々一つ以上含む5員環または6員環のヘテロ環化合物、
- b)

## 【化6】



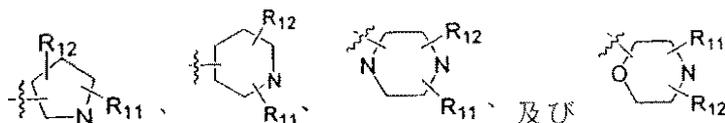
からなる群れから選ばれる5員環のヘテロ環化合物、(ここで $A$ 、 $B$ 、 $D$ は炭素、酸素、または窒素であり、同じかまたは異なり、 $E$ は水素2個、酸素、硫黄または窒素である)、および

- c) 窒素または酸素が1個または2個ずつだけからなる環、または酸素と窒素を各々1個以上含む5員環または6員環のヘテロ芳香環化合物からなる群れから選ばれる環化合物であることを特徴とする、請求項1記載のオキサゾリジノン誘導体および医薬的に許容されるその塩。

## 【請求項9】

上記 a) の5員環または6員環のヘテロ環化合物が、

## 【化7】



からなる群れから選択される環化合物であることを特徴とする、請求項8記載のオキサゾリジノン誘導体および医薬的に許容されるその塩

(ここで、 $R_{11}$ と $R_{12}$ はお互いに同じかまたは異なり、

(i) 水素、F、Cl、BrまたはI、

(ii) 一つまたはそれ以上の置換基で置換されたまたは置換されていない $C_1 \sim C_4$ アルキル基、ここで当該置換されたアルキル基は、ヒドロキシアルキル、アルコキシカーボニルアルキル、トリハロアルキル、アセトキシアルキル、アルキルアミノアルキル、アルコキシアルキルまたはメタンスルホニルオキシアルキル基である、

(iii) 置換または置換されていないアセチル基、ここで当該置換されたアセチル基は、アセトキシアセチル、ヒドロキシアセチル、 $C_1 \sim C_3$ のアルキルアミノアセトキシアセチル、 $C_1 \sim C_3$ のアルコキシアセチル、アミノアセチル、アジドアセチル、アセチルアミノアセチル、 $C_1 \sim C_3$ のアルキルアミノアセチル、アミノプロピオニルまたはヒドロキシプロピオニル基である、

(iv) アジド、ヒドロキシ、メルカプト、シアノ、ケトン、アミノ

(v) 置換または置換されていないイミノ基、ここで当該置換されたイミノ基はヒドロキシイミノ、アルキルイミノ、アルコキシイミノまたはメタンスルホニルオキシイミノ基である、

(vi) アルコキシカーボニル基で置換または置換されていないヒドラジノ、

(vii)  $-OR_{13}$ 、ここで  $R_{13}$ は水素、 $C_1 \sim C_3$ のアルキル、アセチル、アルコキシアルキル、ヒドロキシアセチルまたはメタンスルホニル基である、

(viii)  $-NR_{14}R_{15}$ 、ここで  $R_{14}$ と $R_{15}$ は各々水素、 $C_1 \sim C_4$ のアルキル、アセチル、アルコキシアルキル、ヒドロキシアセチルまたはメタンスルホニル基である、

(ix)  $-(C=O)-(R_{16})_n-$ 、

ここで  $R_{16}$ は、

1)  $C_1 \sim C_6$ のアルキル、 $C_1 \sim C_3$ のアルキル基で置換または置換されていないアルケニル

2) アルコキシカーボニル、

3) アセトキシメチル、ベンジルオキシメチル、ヒドロキシメチル、 $C_1 \sim C_3$ のアルキルアミノアセトキシメチル、ハロメチル、 $C_1 \sim C_3$ のアルコキシメチル、モルホリニルメチル、 $C_1 \sim C_3$ のアルコキシカーボニルメチルアミノメチル、メタンスルホニルオキシメチル、 $C_1 \sim C_3$ のアルコシオキシメチル、ニコチノイルオキシメチル、 $C_1 \sim C_3$ のアルコキシフェニルメチル、ベンジルまたはトリハロメチル基であり、

4)  $C_1 \sim C_3$ のアルコキシ、フェニルオキシ、アリルオキシ、 $C_1 \sim C_3$ のハロアルキルオキシ、ニトロ基で置換または置換されていないベンジルオキシまたは9-フルオレニルメチルオキシ、

5) ニコチノイルメチル基、または、

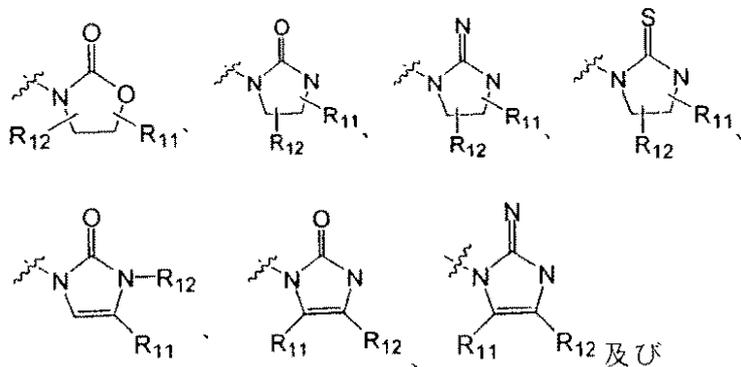
6) 5-または6-ヘテロ環

である。 )。

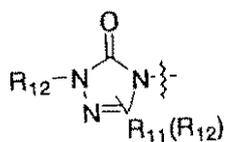
## 【請求項10】

上記b)の5員環のヘテロ環化合物が、

## 【化8】



## 【化9】

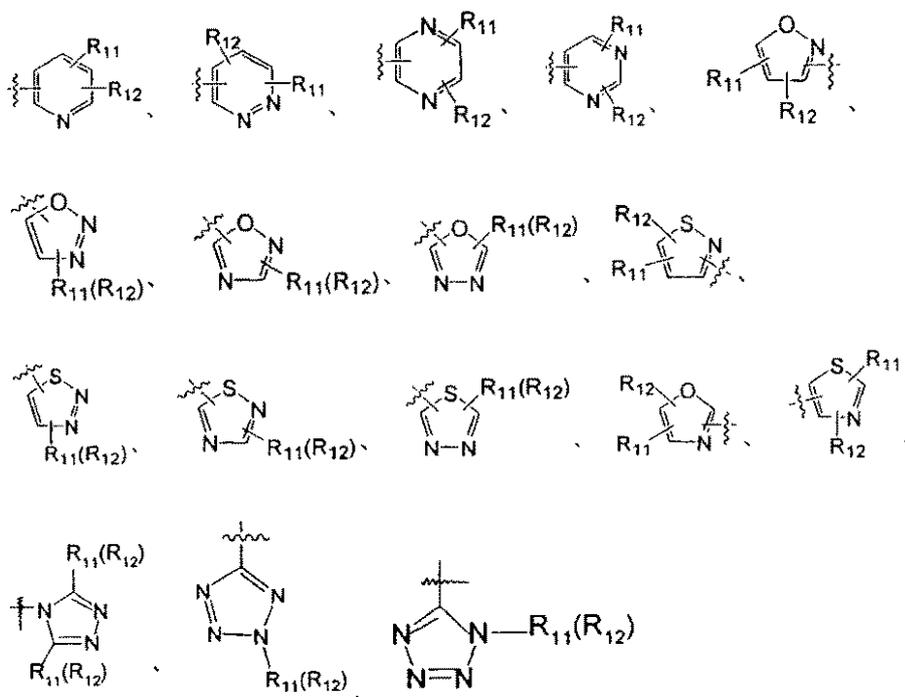


からなる群れから選択される環化合物であることを特徴とする、請求項8記載のオキサゾリジノン誘導体および医薬的に許容されるその塩（上記式中、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$  は、上記で定義したものと同様である。）。

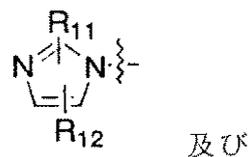
## 【請求項11】

上記 $R_4$ が、

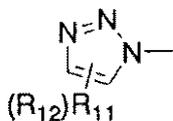
## 【化 1 0】



## 【化 1 1】



## 【化 1 2】



からなる群れから選ばれる5員環または6員環のヘテロ芳香環化合物であることを特徴とする、請求項1記載のオキサゾリジノン誘導体および医薬的に許容されるその塩（上記式中、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$ は、上記で定義したものと同様である。）。

**【請求項 1 2】**

上記Lが、ハロゲン基またはメチルカルボニルオキシ基であることを特徴とする、請求項6記載のオキサゾリジノン誘導体の製造方法。