

【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22年1月14日 (2010.1.14)

【公表番号】特表2009-518399(P2009-518399A)

【公表日】平成21年5月7日 (2009.5.7)

【年通号数】公開・登録公報2009-018

【出願番号】特願2008-544384(P2008-544384)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/75 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 498/04 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 471/14 (2006.01)

C 0 7 D 471/20 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/44 (2006.01)

A 6 1 K 31/443 (2006.01)

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

A 6 1 K 31/4375 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

A 6 1 K 31/438 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/5383 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 213/75 C S P

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 498/04 1 1 6

C 0 7 D 471/04 1 1 4 A

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 471/14 1 0 2

C 0 7 D 471/20

C 0 7 D 498/04 1 1 2 T

C 0 7 D 471/04 1 2 1

C 0 7 D 405/14

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 31/02

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/44

A 6 1 K 31/443

A 6 1 K 31/553

A 6 1 K 31/4375

A 6 1 K 31/551

A 6 1 K 31/438
A 6 1 K 31/5377
A 6 1 K 31/496
A 6 1 K 31/5383

【手続補正書】

【提出日】平成21年11月12日(2009.11.12)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

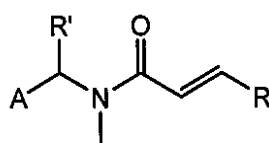
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式 I で表される化合物および薬学的に許容されるそれらの塩。

【化 1】



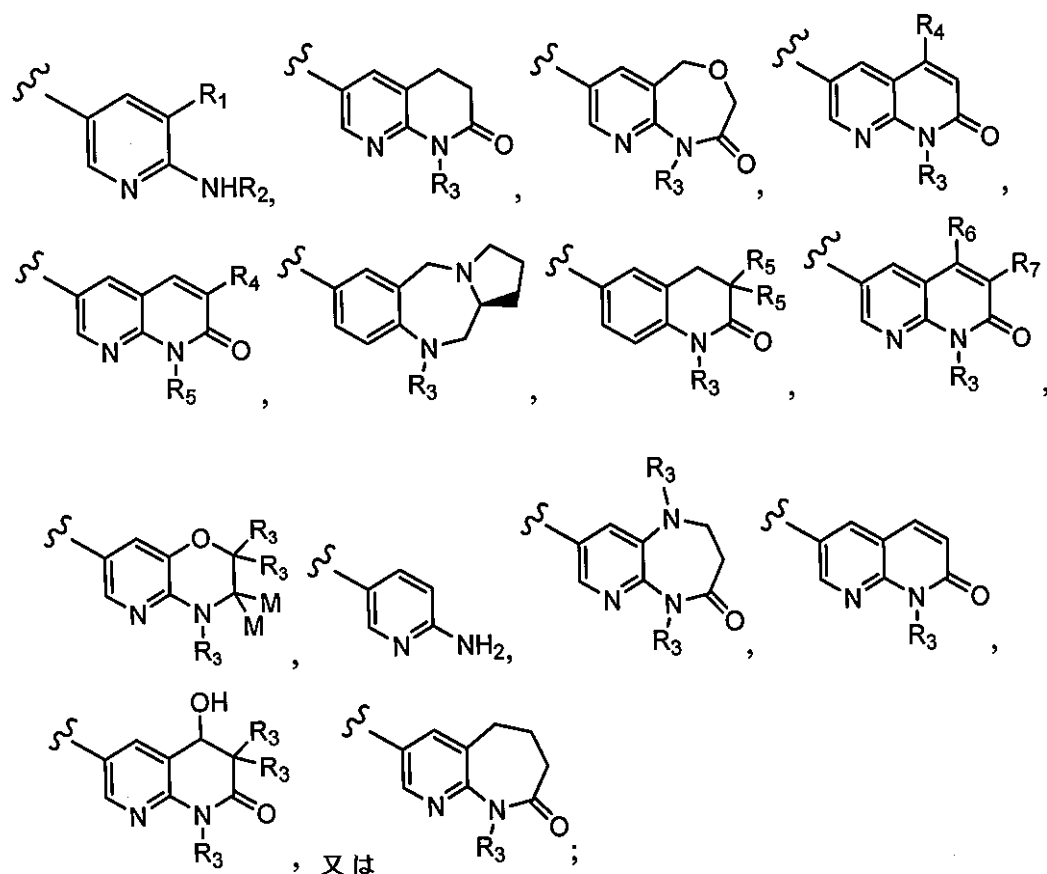
I

式中、それぞれ個別に、

A は、0 ～ 2 個のヘテロ原子を含有する 4 ～ 7 個の原子の単環式環、0 ～ 4 個のヘテロ原子を含有する 8 ～ 12 個の原子の二環式環、または 0 ～ 6 個のヘテロ原子を含有する 8 ～ 12 個の原子の三環式環であって、該環は、それぞれ個別に、脂肪族、芳香族、ヘテロアリール、またはヘテロ環であり、本質的に、該ヘテロ原子は、N、S もしくは O から選択され、そして該環は、任意に C₁ - 4 アルキル、OR^{''}、CN、OCF₃、F、Cl、Br、I から選択される 1 以上の基で置換されていてもよく、R^{''} は、H、アルキル、アラルキル、またはヘテロアラルキルであり；

R は、下記式から選択され、

【化 2】



式中、

R_1 は、OH、または $-O(CH_2)_n-Ar$ であり、 n は 1 乃至 6 の整数であり、 Ar はアリールもしくはヘテロアリールであり；

R_2 は、H、または $-C(O)R_3$ であり；

R_3 は、H、アルキル、またはアリールであり；

R_4 は、OH、または $N(R_3)_2$ であり；

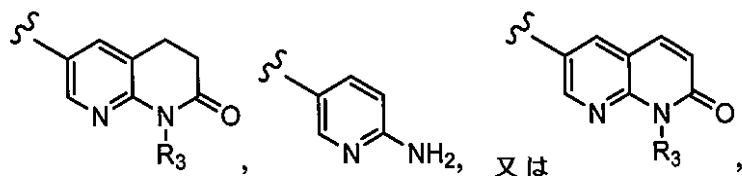
2つの R_5 は一緒になってスピロシクロアルカン、スピロアリール、またはスピロヘテロシクロアルカンを形成し；

R_6 は、H、OH、アルキル、またはアリールであり；

R_7 は、アルキル、アリール、シクロアルカン、またはヘテロシクロアルカンであり；

M は、H または OH、または 2つの M は一緒になってOまたは $N(R_3)$ を形成し、但し、 R が下記式である場合、

【化 3】

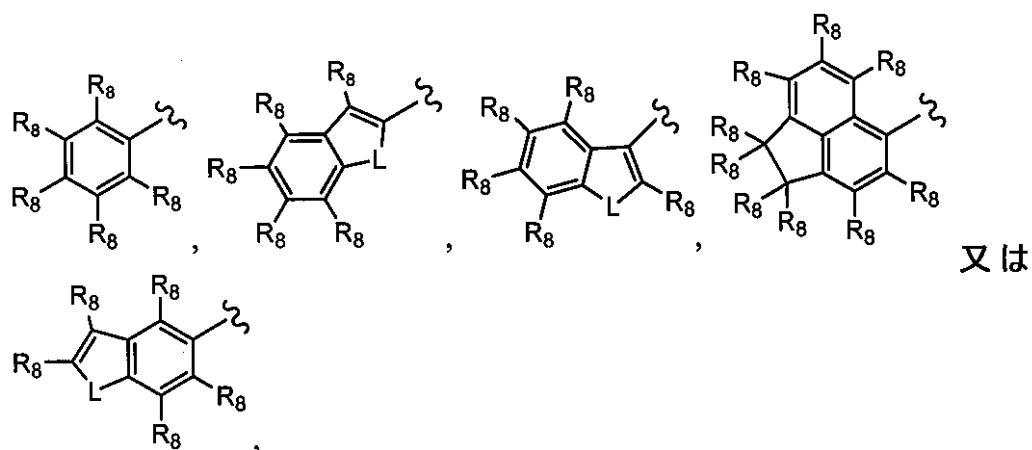


式中、

R' は、 $(R)-Me$ である。

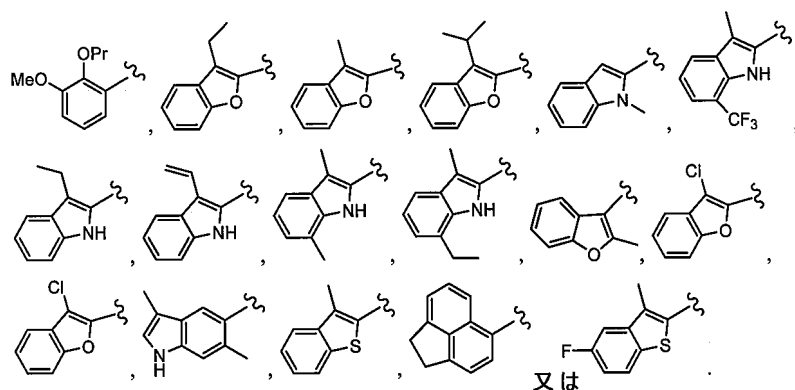
【請求項 2】

【化 4】

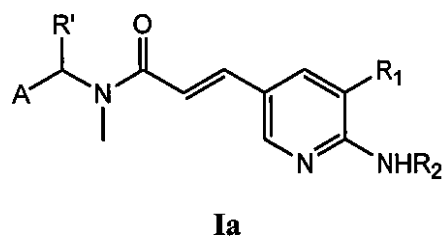


【請求項 3】

【化 5】

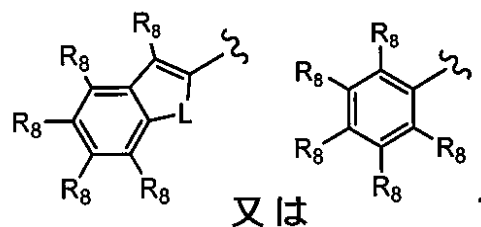


【化 6】



式中、A は、下記から選択される。

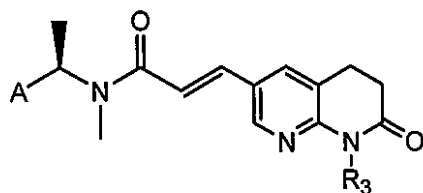
【化 7】



【請求項 5】

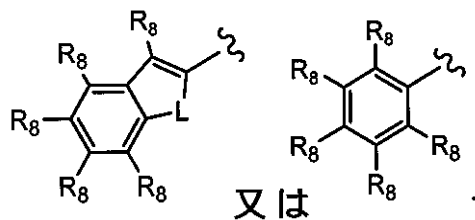
前記化合物が下記式 I b で表される、請求項 2 に記載の化合物。

【化 8】

**Ib**

式中、A は、下記から選択される。

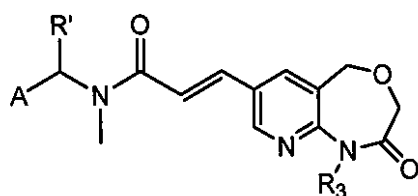
【化 9】



【請求項 6】

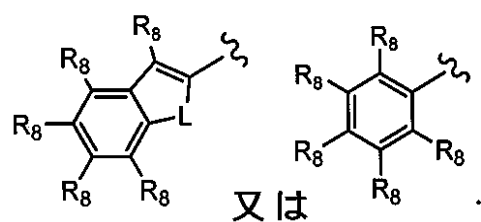
前記化合物が下記式 I c で表される、請求項 2 に記載の化合物。

【化 10】

**Ic**

式中、A は、下記から選択される。

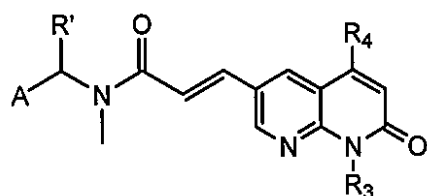
【化 1 1】



【請求項 7】

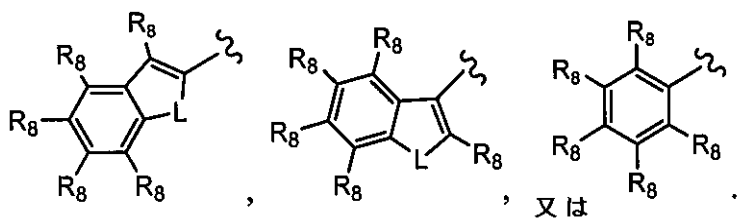
前記化合物が下記式 I d で表される、請求項 2 に記載の化合物。

【化 1 2】

**Id**

式中、A は下記式で表される。

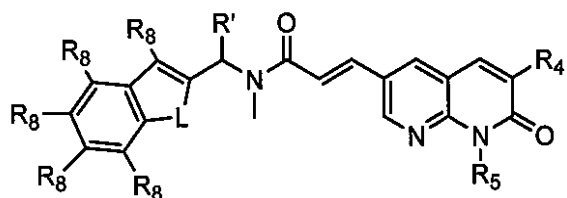
【化 1 3】



【請求項 8】

前記化合物が下記式 I e で表される、請求項 2 に記載の化合物。

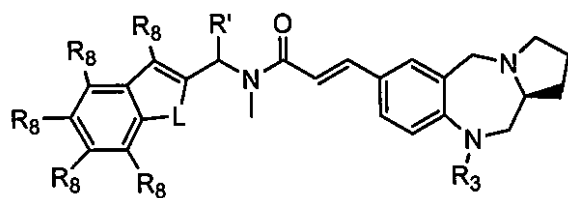
【化 1 4】

**Ie.**

【請求項 9】

前記化合物が下記式 I f で表される、請求項 2 に記載の化合物。

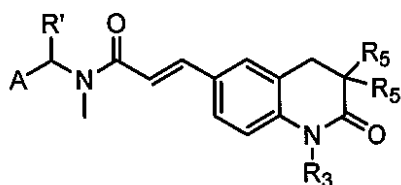
【化 1 5】

**If.**

【請求項 1 0】

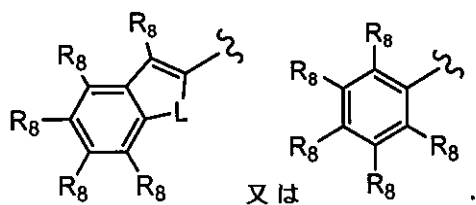
前記化合物が下記式 I g で表される、請求項 2 に記載の化合物。

【化 1 6】

**Ig**

式中、A は下記式で表される。

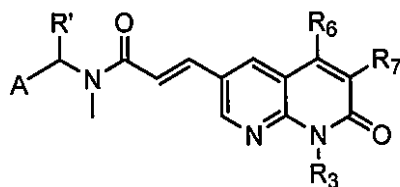
【化 1 7】



【請求項 1 1】

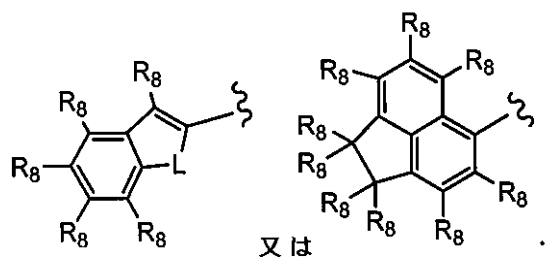
前記化合物が下記式 I h で表される、請求項 2 に記載の化合物。

【化 1 8】

**Ih**

式中、A は下記式で表される。

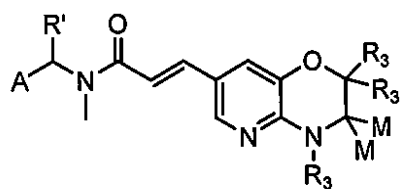
【化 1 9】



【請求項 1 2】

前記化合物が下記式 I i で表される、請求項 2 に記載の化合物。

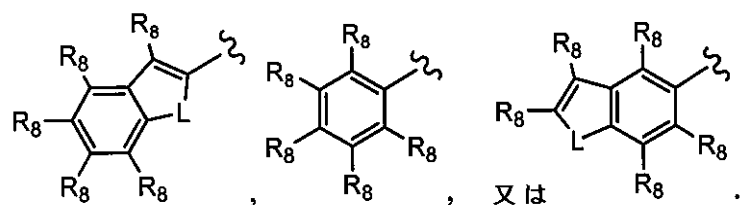
【化 2 0】



Ii

式中、A は下記式で表される。

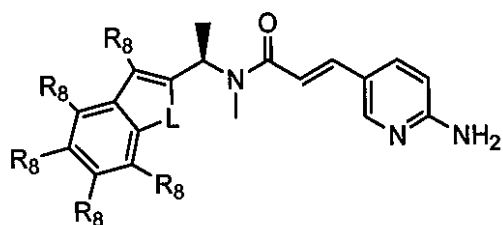
【化 2 1】



【請求項 1 3】

前記化合物が下記式 I j で表される、請求項 2 に記載の化合物。

【化 2 2】

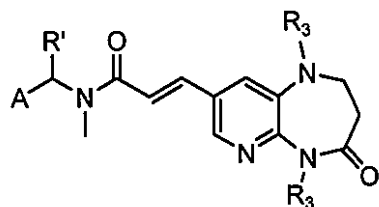


Ij.

【請求項 1 4】

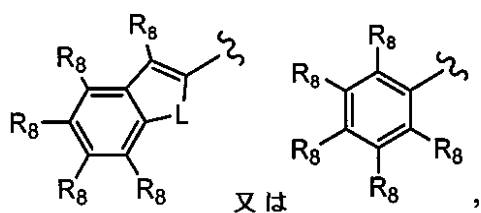
前記化合物が下記式 I k で表される、請求項 2 に記載の化合物。

【化 2 3】

**Ik**

式中、A は下記式で表され、

【化 2 4】



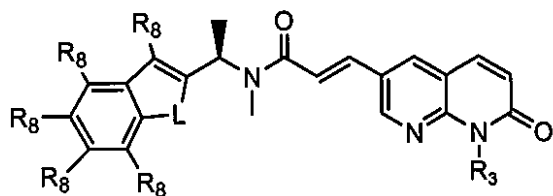
又は

式中、R₈ および L はすでに定義したとおりである。

【請求項 1 5】

前記化合物が下記式 I 1 で表される、請求項 2 に記載の化合物。

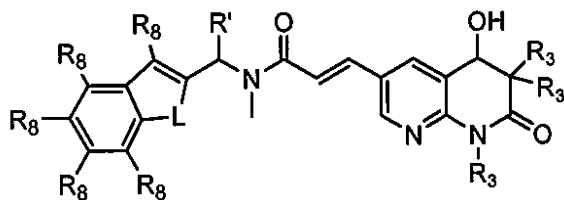
【化 2 5】

**II.**

【請求項 1 6】

前記化合物が下記式 I m で表される、請求項 2 に記載の化合物。

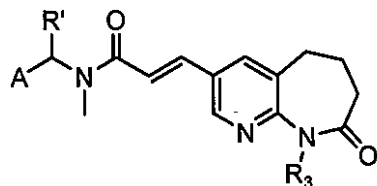
【化 2 6】

**Im.**

【請求項 1 7】

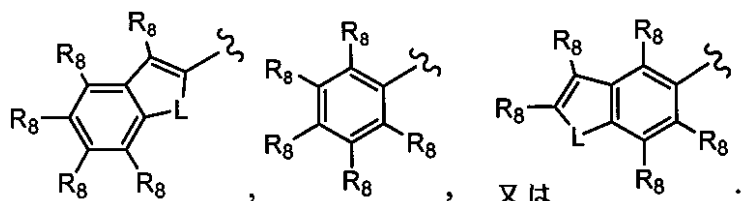
前記化合物が下記式 I n で表される、請求項 2 に記載の化合物。

【化 27】

**In**

式中、A は下記式で表される。

【化 28】



【請求項 18】

前記化合物は、下記から選択される請求項 1 に記載の化合物。

(E) - 3 - [6 - アミノ - 5 - (ピリジン - 2 - イルメトキシ) - ピリジン - 3 - イル] - N - メチル - N - (3 - メチル - ベンゾフラン - 2 - イルメチル) アクリルアミド ;

(E) - 3 - [6 - アミノ - 5 - (ピリジン - 3 - イルメトキシ) - ピリジン - 3 - イル] - N - メチル - N - (3 - メチル - ベンゾフラン - 2 - イルメチル) アクリルアミド ;

(E) - 3 - (6 - アセチルアミノ - 5 - ヒドロキシ - ピリジン - 3 - イル) - N - (3 - メトキシ - 2 - プロポキシ - ベンジル) - N - メチルアクリルアミド塩酸塩 ;

(E) - 3 - (6 - アセチルアミノ - 5 - ヒドロキシ - ピリジン - 3 - イル) - N - メチル - N - (3 - メチル - ベンゾフラン - 2 - イルメチル) アクリルアミド塩酸塩 ;

(E) - 3 - (6 - アミノ - 5 - ベンジルオキシ - ピリジン - 3 - イル) - N - メチル - N - (3 - メチル - ベンゾフラン - 2 - イルメチル) アクリルアミド ;

(E) - N - メチル - N - [1 - (R) - 3 - メチル - ベンゾフラン - 2 - イル] - エチル] - 3 - (7 - オキソ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - [1 , 8] ナフチリジン - 3 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - メチル - N - (3 - メチル - ベンゾフラン - 2 - イルメチル) - 3 - (8 - オキソ - 5 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 6 - オキサ - 1 , 9 - ジアザベンゾシクロヘプテン - 3 - イル) - アクリルアミド ;

(E) - N - (3 - メトキシ - 2 - プロポキシ - ベンジル) - N - 3 - (8 - オキソ - 5 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 6 - オキサ - 1 , 9 - ジアザベンゾシクロヘプテン - 3 - イル) - アクリルアミド ;

(E) - N - メチル - N - [1 - (R) - (3 - メチル - ベンゾ [b] チオフェン - 2 - イル) - エチル] - 3 - (7 - オキソ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - [1 , 8] ナフチリジン - 3 - イル) - アクリルアミド ;

(E) - N - メチル - N - [1 - (3 - メチル - ベンゾ [b] チオフェン - 2 - イル) - エチル] - 3 - (8 - オキソ - 5 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 6 - オキサ - 1 , 9 - ジアザベンゾシクロヘプテン - 3 - イル) - アクリルアミド ;

(E) - 3 - (5 - アミノ - 7 - オキソ - 7 , 8 - ジヒドロ - [1 , 8] ナフチリジン - 3 - イル) - N - メチル - N - (1 - メチル - 1 H - インドール - 2 - イルメチル) -

アクリルアミド塩酸塩；

(E) - 3 - (5 - ヒドロキシ - 7 - オキソ - 7, 8 - ジヒドロ - [1, 8] ナフチリジン - 3 - イル) - N - メチル - N - (1 - メチル - 1 H - インドール - 2 - イルメチル) - アクリルアミド；

(E) - 3 - (5 - ヒドロキシ - 7 - オキソ - 7, 8 - ジヒドロ - [1, 8] ナフチリジン - 3 - イル) - N - メチル - N - (3 - メチル - ベンゾフラン - 2 - イルメチル) - アクリルアミド；

(E) - N - (2 - エトキシ - 3 - メトキシ - ベンジル) - 3 - (5 - ヒドロキシ - 7 - オキソ - 7, 8 - ジヒドロ - [1, 8] ナフチリジン - 3 - イル) - N - メチル - アクリルアミド；

(S, E) - 3 - (3, 4 - シクロペンチル - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロ - 1 H - ピリド [2, 3 - e] [1, 4] - ジアゼピン - 7 - イル) - N - メチル - (E) - N - ((3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル)メチル)アクリルアミドトリフルオロ酢酸塩；

(E) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル)メチル) - 3 - [7 - オキソ - (6 - スピロペリジニル) - 1, 8 - ナフチリジン - 3 - イル]アクリルアミド塩酸塩；

(E) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾチオフェン - 2 - イル)メチル) - 3 - [7 - オキソ - (6 - スピロペリジニル) - 1, 8 - ナフチリジン - 3 - イル]アクリルアミドトリフルオロ酢酸塩；

(E) - N - メチル - N - ((1 - メチル - 1 H - インドール - 2 - イル)メチル) - 3 - [7 - オキソ - (4' - N - Boc - 6 - スピロペリジニル) - 1, 8 - ナフチリジン - 3 - イル]アクリルアミド；

(E) - N - メチル - N - ((1 - メチル - 1 H - インドール - 2 - イル)メチル) - 3 - [7 - オキソ - (4' - 6 - スピロペリジニル) - 1, 8 - ナフチリジン - 3 - イル]アクリルアミドトリフルオロ酢酸塩；

(E) - N - (3 - メトキシ - 2 - プロボキシベンジル) - N - メチル - 3 - [7 - オキソ - (4' - N - Boc - 6 - スピロペリジニル) - 1, 8 - ナフチリジン - 3 - イル]アクリルアミド；

(E) - N - (3 - メトキシ - 2 - プロボキシベンジル) - N - メチル - 3 - [7 - オキソ - (6 - スピロペリジニル) - 1, 8 - ナフチリジン - 3 - イル]アクリルアミド塩酸塩；

(E) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル)メチル) - [7 - オキソ - (6 - 4' - N - メチル - スピロペリジニル) - 1, 8 - ナフチリジン - 3 - イル]アクリルアミド塩酸塩；

(E) - N - (3 - メトキシ - 2 - プロボキシベンジル) - N - メチル - 3 - [7 - オキソ - (4' - N - メチル - 6 - スピロペリジニル) - 1, 8 - ナフチリジン - 3 - イル]アクリルアミド塩酸塩；

(E) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾチオフェン - 2 - イル)メチル) - 3 - [7 - オキソ - (4' - N - メチル - 6 - スピロペリジニル) - 1, 8 - ナフチリジン - 3 - イル]アクリルアミドトリフルオロ酢酸塩；

(E) - 3 - (6, 6 - (4 - N - メチルピペリジン) - 7 - オキソ - 5, 6, 7, 8 - テトラヒドロ - 1, 8 - ナフチリジン - 3 - イル) - N - ((5 - フルオロ - 3 - メチルベンゾ [b] チオフェン - 2 - イル)メチル) - N - メチルアクリルアミド；

(E) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル)メチル) - 3 - (6 - モルホリノ - 7 - オキソ - 7, 8 - ジヒドロ - 1, 8 - ナフチリジン - 3 - イル)アクリルアミド；

(E) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル)メチル) - 3 - (6 - モルホリノ - 7 - オキソ - 7, 8 - ジヒドロ - 1, 8 - ナフチリジン - 3 - イル)アクリルアミド；

(E) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル)メチル) - 3 - (

7 - オキソ - 6 - (ピペラジン - 1 - イル) - 7 , 8 - ジヒドロ - 1 , 8 - ナフチリジン - 3 - イル) アクリルアミド塩酸塩 ;

(E) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル) メチル) - 3 - (7 - オキソ - 6 - (ピペラジン - 1 - イル) - 7 , 8 - ジヒドロ - 1 , 8 - ナフチリジン - 3 - イル) アクリルアミド塩酸塩 ;

(R , E) - N - (1 - (3 - エチルベンゾフラン - 2 - イル) エチル) - N - メチル - 3 - (7 - オキソ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 8 - ナフチリジン - 3 - イル) アクリルアミド ;

(R , E) - 3 - (2 , 2 - ジメチル - 3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) - N - (1 - (3 - エチルベンゾフラン - 2 - イル) エチル) - N - メチルアクリルアミド ;

(R , E) - 3 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) - N - (1 - (3 - エチルベンゾフラン - 2 - イル) エチル) - N - メチルアクリルアミド ;

(E) - 3 - (3 - ヒドロキシ - 2 , 2 - ジメチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル) メチル) アクリルアミドトリフルオロ酢酸塩 ;

(E) - 3 - (5 - ヒドロキシ - 6 - イソプロピル - 7 - オキソ - 7 , 8 - ジヒドロ - 1 , 8 - ナフチリジン - 3 - イル) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル) メチル) アクリルアミド ;

(E) - N - ((1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 5 - イル) メチル) - 3 - (5 - ヒドロキシ - 6 - イソプロピル - 7 - オキソ - 7 , 8 - ジヒドロ - 1 , 8 - ナフチリジン - 3 - イル) - N - メチルアクリルアミド ;

() - 3 - (5 - ヒドロキシ - 6 - エチル - 7 - オキソ - 7 , 8 - ジヒドロ - 1 , 8 - ナフチリジン - 3 - イル) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル) メチル) アクリルアミド ;

(E) - N - ((1 , 2 - ジヒドロアセナフチレン - 5 - イル) メチル) - 3 - (6 - エチル - 5 - ヒドロキシ - 7 - オキソ - 7 , 8 - ジヒドロ - 1 , 8 - ナフチリジン - 3 - イル - N - メチルアクリルアミド ;

(E) - 3 - ((E) - 2 , 2 - ジメチル - 3 - (メチルイミノ) - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル) メチル) アクリルアミド塩酸塩 ;

(E) - 3 - ((E) - 2 , 2 - ジメチル - 3 - (メチルイミノ) - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾ [b] チオフェン - 2 - イル) メチル) アクリルアミド ;

(E) - 3 - (3 - イミノ - 2 , 2 - ジメチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル) メチル) アクリルアミド ;

(E) - N - メチル - N - ((3 - メチル - 1 H - インドール - 2 - イル) メチル) - 3 - (2 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 5 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - e] [1 , 4] オキサゼピン - 7 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - ((1 , 3 - ジメチル - 1 H - インドール - 2 - イル) メチル) - N - メチル - 3 - (2 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - ピリド [2 , 3 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 8 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル) メチル) - 3 - (4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 - ピリド [2 , 3 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 8 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - メチル - N - ((3 - メチル - 1 H - インドール - 2 - イル) メチル) - 3 - (4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - ピリド [2 , 3 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 8 - イル) アクリルアミド ;

(R , E) - N - メチル - N - (1 - (3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル) エチル)

- 3 - (2 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 5 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - e] [1 , 4] オキサゼピン - 7 - イル) アクリルアミド ;

(R , E) - N - メチル - N - (1 - (3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル) エチル) - 3 - (7 - オキソ - 7 , 8 - ジヒドロ - 1 , 8 - ナフチリジン - 3 - イル) アクリルアミド ;

(R , E) - N - メチル - N - (1 - (3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル) エチル) - 3 - (3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) アクリルアミド ;

(R , E) - N - (1 - (3 - メトキシ - 2 - プロポキシフェニル) エチル) - N - メチル - 3 - (7 - オキソ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 8 - ナフチリジン - 3 - イル) アクリルアミド ;

(R , E) - N - メチル - N - (1 - (3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル) エチル) - 3 - (4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - ピリド [2 , 3 - b] ジアゼピン - 8 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - メチル - N - ((1 - メチル - 1 H - インドール - 2 - イル) メチル) - 3 - (4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - ピリド [2 , 3 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 8 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - ((5 - フルオロ - 3 - メチルベンゾ [b] チオフェン - 2 - イル) メチル) - N - メチル - 3 - (4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - ピリド [2 , 3 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 8 - イル) アクリルアミド ;

(R , E) - N - (1 - (3 - エチルベンゾフラン - 2 - イル) エチル) - N - メチル - 3 - (4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - ピリド [2 , 3 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 8 - イル) アクリルアミド ;

(E) - 3 - (5 - ヒドロキシ - 6 , 6 - ジメチル - 7 - オキソ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 8 - ナフチリジン - 3 - イル) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル) メチル) アクリルアミド ;

(E) - 3 - (5 - ヒドロキシ - 6 , 6 - ジメチル - 7 - オキソ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 8 - ナフチリジン - 3 - イル) - N - メチル - N - ((1 - メチル - 1 - インドール - 2 - イル) メチル) アクリルアミド ;

(R , E) - 3 - (5 - ヒドロキシ - 6 , 6 - ジメチル - 7 - オキソ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 8 - ナフチリジン - 3 - イル) - N - メチル - N - (1 - (3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル) エチル) アクリルアミド ;

(R , E) - N - (1 - (3 - エチルベンゾフラン - 2 - イル) エチル) - N - メチル - 3 - (7 - オキソ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 8 - ナフチリジン - 3 - イル) アクリルアミド ;

N - メチル - N - [1 - (R) - (3 - エチル - ベンゾフラン - 2 - イル) - エチル] - 3 - (7 - オキソ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - [1 , 8] ナフチリジン - 3 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - メチル - N - ((3 - メチル - 1 H - インドール - 2 - イル) メチル) - 3 - (3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - メチル - N - ((3 - メチル - 1 H - インドール - 2 - イル) メチル) - 3 - (1 , 2 , 3 , 5 - テトラヒドロピリド [2 , 3 - e] [1 , 4] オキサゼピン - 7 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - ((3 - エチル - 1 H - インドール - 2 - イル) メチル) - N - メチル - 3 - (3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - メチル - 3 - (3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) - N - ((3 - ビニル - 1 H - インドール - 2 - イル) メチル) アクリルアミド ;

(E) - N - ((1 , 3 - ジメチル - 1 H - インドール - 2 - イル) メチル) - N - メチル - 3 - (3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - ((1 , 3 - ジメチル - 1 H - インドール - 2 - イル) メチル) - N - メチル - 3 - 3 - (7 - オキソ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 8 - ナフチリジン - 3 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - ((3 , 7 - ジメチル - 1 H - インドール - 2 - イル) メチル) - N - メチル - 3 - (3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - メチル - N - ((3 , 7 - ジメチル - 1 H - インドール - 2 - イル) メチル - 3 - (7 - オキソ - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - 1 , 8 - ナフチリジン - 3 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - ((3 , 7 - ジメチル - 1 H - インドール - 2 - イル) メチル) - N - メチル - 3 - (8 - オキソ - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリド [2 , 3 - b] アゼピン - 3 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - メチル - N - ((3 - メチル - 7 - (トリフルオロメチル) - 1 H - インドール - 2 - イル) メチル) - 3 - (3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - ((7 - エチル - 3 - メチル - 1 H - インドール - 2 - イル) メチル) - N - メチル - 3 - (3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - ((3 , 6 - ジメチル - 1 H - インドール - 5 - イル) メチル) - N - メチル - 3 - (3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - イル) アクリルアミド ;

(E) - 3 - (2 , 2 - ジメチル - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル) メチル) アクリルアミド塩酸塩 ;

(E) - N - ((3 - クロロベンゾフラン - 2 - イル) メチル) - N - メチル - 3 - (3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - (3 - メトキシ - 2 - プロボキシベンジル) - N - メチル - 3 - (3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - ((3 - イソプロピルベンゾフラン - 2 - イル) メチル) - N - メチル - 3 - (3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - ((3 - エチルベンゾフラン - 2 - イル) メチル - N - メチル - 3 - (3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - ((5 - フルオロ - 3 - メチルベンゾ [b] チオフェン - 2 - イル) メチル - N - メチル - 3 - (3 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ピリド [3 , 2 - b] [1 , 4] オキサジン - 7 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル) メチル) - 3 - (8 - オキソ - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリド [2 , 3 - b] アゼピン - 3 - イル) アクリルアミド ;

(E) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾ [b] チオフェン - 2 - イル) メチル) - 3 - (8 - オキソ - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリド [2 , 3 - b] アゼピン - 3 - イル) アク

リルアミド；

(E) - N - ((3 , 6 - ジメチル - 1 H - インドール - 5 - イル) メチル) - N - メチル - 3 - (8 - オキソ - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 H - ピリド [2 , 3 - b] アゼピン - 3 - イル) アクリルアミド；

(S, E) - 3 - (3 , 4 - シクロペンチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - ピリド [2 , 3 - e] [1 , 4] ジアゼピン - 7 - イル) - N - メチル - N - ((3 - メチルベンゾフラン - 2 - イル) メチル) アクリルアミドトリフルオロ酢酸塩；または、

(E) - 3 - (4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - ピリド [2 , 3 - b] [1 , 4] ジアゼピン - 8 - イル) アクリル酸塩酸塩。

【請求項 19】

前記化合物は、約 32 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 以下、約 16 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 以下、約 8 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 以下、約 4 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 以下、約 2 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 以下、約 1 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 以下、約 0.5 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 以下、約 0.25 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 以下、または約 0.125 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 以下の MIC で FabI を阻害する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 20】

請求項 1 乃至 18 のいずれか 1 項に記載の化合物および薬学的に許容される担体もしくは添加剤を含む、医薬品組成物。

【請求項 21】

前記組成物は、静脈内投与用、注射投与用、局所投与用、全身投与用、または経口投与用に製剤されている、請求項 20 に記載の組成物。

【請求項 22】

細菌性の疾患を治療するため医薬品の製造における請求項 20 に記載の組成物の使用。

【請求項 23】

無生物の表面に、請求項 1 乃至 18 に記載の化合物を接触させることを含む、無生物の表面を殺菌する方法。