

【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 07 D 213/75	(2006.01)
C 07 D 405/12	(2006.01)
C 07 D 498/04	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)
C 07 D 413/12	(2006.01)
C 07 D 471/14	(2006.01)
C 07 D 471/20	(2006.01)
C 07 D 405/14	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 31/04	(2006.01)
A 61 P 31/02	(2006.01)
A 61 K 31/444	(2006.01)
A 61 K 31/44	(2006.01)
A 61 K 31/443	(2006.01)
A 61 K 31/553	(2006.01)
A 61 K 31/4375	(2006.01)
A 61 K 31/551	(2006.01)
A 61 K 31/438	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
A 61 K 31/5383	(2006.01)

【F I】

C 07 D 213/75	C S P
C 07 D 405/12	
C 07 D 498/04	1 1 6
C 07 D 471/04	1 1 4 A
C 07 D 413/12	
C 07 D 471/14	1 0 2
C 07 D 471/20	
C 07 D 498/04	1 1 2 T
C 07 D 471/04	1 2 1
C 07 D 405/14	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 31/04	
A 61 P 31/02	
A 61 K 31/444	
A 61 K 31/44	
A 61 K 31/443	
A 61 K 31/553	
A 61 K 31/4375	
A 61 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

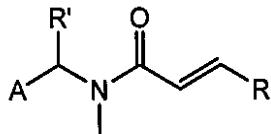
【補正の内容】

【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】



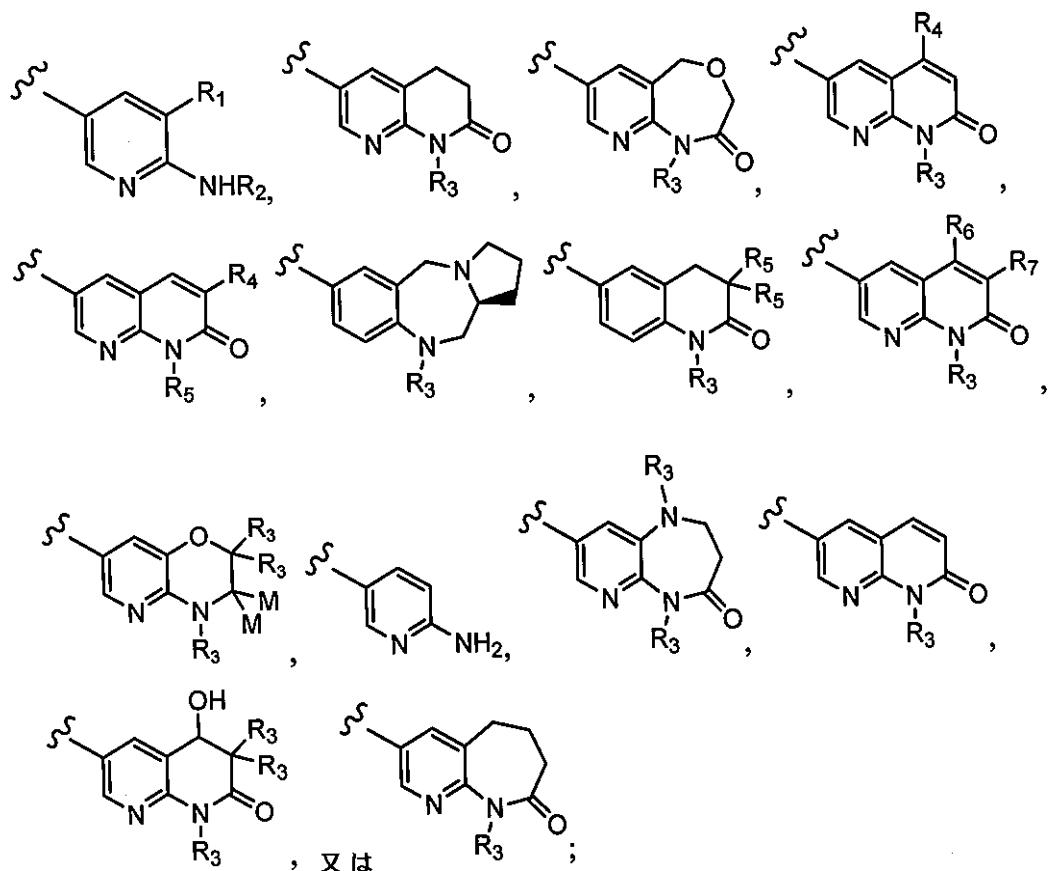
I

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、OR²、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、R²は、H、アルキル、アルキル、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；

R₃ 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；

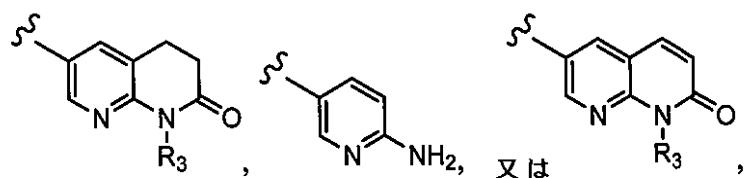
2つのR₅は一緒になってスピロシクロアルカン、スピロアリール、またはスピロヘテロシクロアルカンを形成し：

R₆ は、H、OH、アルキル、またはアリールであり；

R₂は、アルキル、アリニル、シクロアルカン、またはヘンゼン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(R₃)を形成し、但し、Rが下記式である場合。

【化 3】

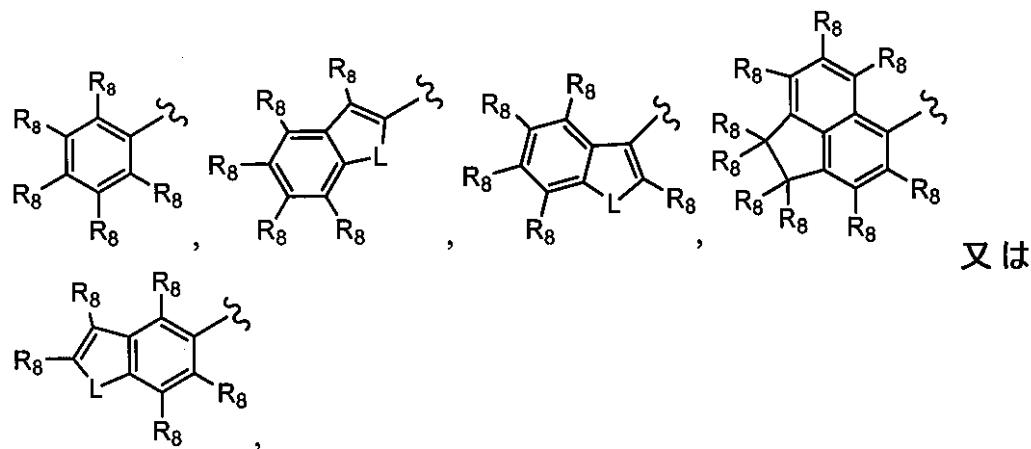


式中、

R' は、(R)-Meである。

【請求項2】

A は、下記から選択される、請求項 1 に記載の化合物。
【化 4】

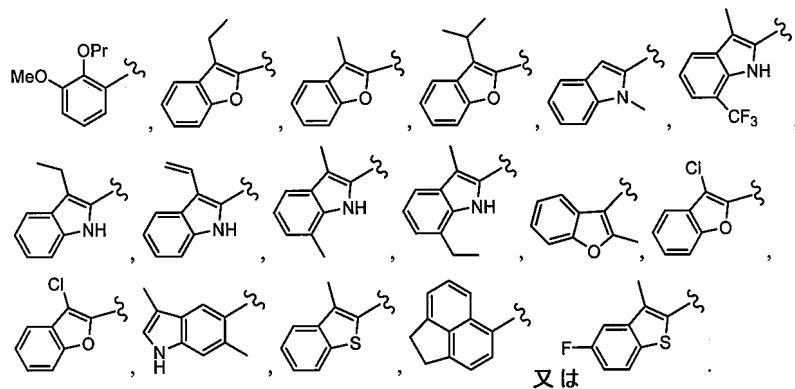


式中、それぞれ個別に、R₈ は、H、C₁ - 4 アルキル、C₁ - 4 ハロアルキル、C₁ - 4 アルケニル、O R"、C N、O C F₃、F、C l、B r、I であり、R" は、H、アルキル、アラルキル、またはヘテロアラルキルであり；そして L は、O、S、または N R₃ である。

【請求項 3】

A は、下記から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

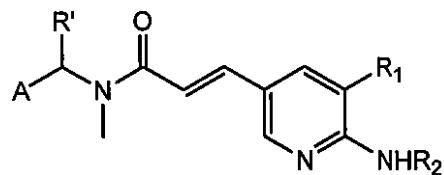
【化 5】



【請求項 4】

前記化合物が下記式 I a で表される、請求項 2 に記載の化合物。

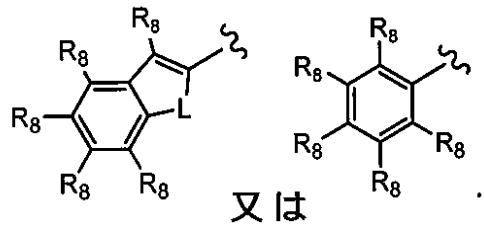
【化 6】



Ia

式中、A は、下記から選択される。

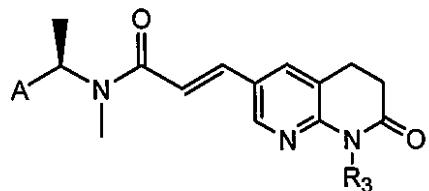
【化7】



【請求項5】

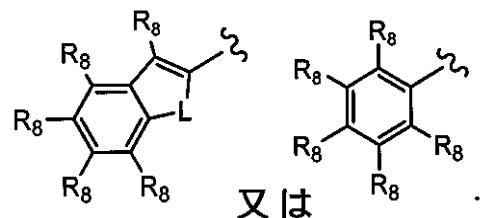
前記化合物が下記式Ibで表される、請求項2に記載の化合物。

【化8】

**Ib**

式中、Aは、下記から選択される。

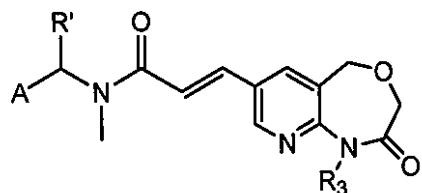
【化9】



【請求項6】

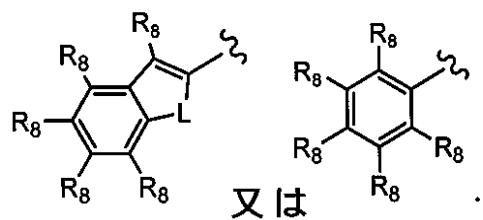
前記化合物が下記式Icで表される、請求項2に記載の化合物。

【化10】

**Ic**

式中、Aは、下記から選択される。

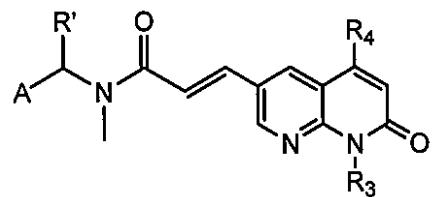
【化11】



【請求項7】

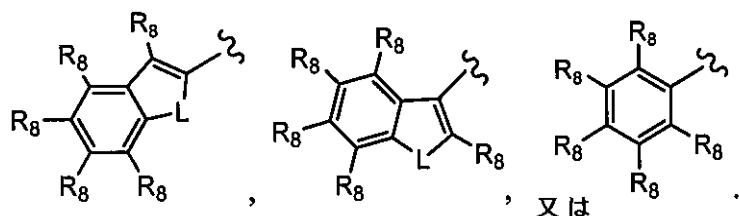
前記化合物が下記式I dで表される、請求項2に記載の化合物。

【化12】

**Id**

式中、Aは下記式で表される。

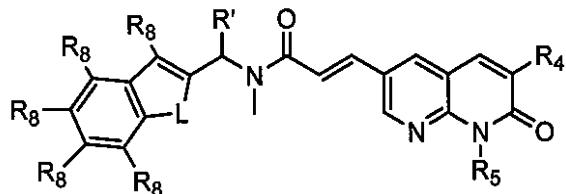
【化13】



【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。

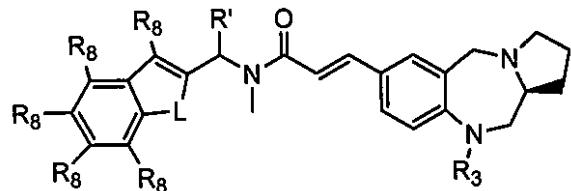
【化14】

**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15】

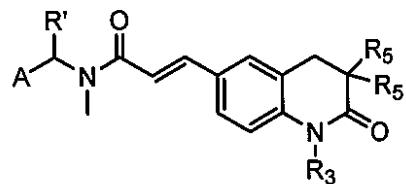


If.

【請求項10】

前記化合物が下記式Igで表される、請求項2に記載の化合物。

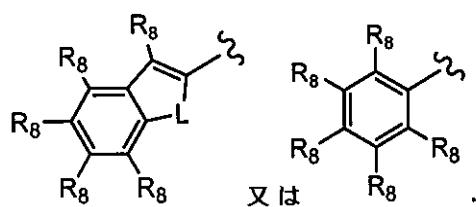
【化16】



Ig

式中、Aは下記式で表される。

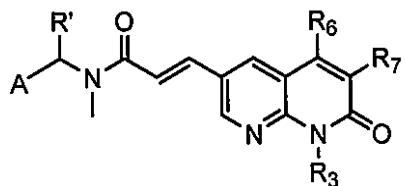
【化17】



【請求項11】

前記化合物が下記式Ihで表される、請求項2に記載の化合物。

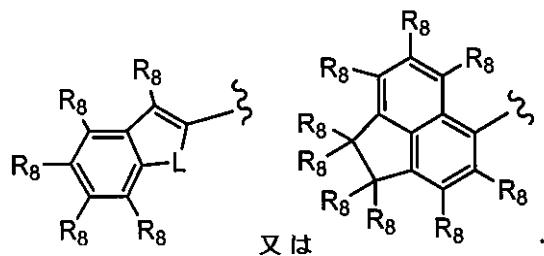
【化18】



Ih

式中、Aは下記式で表される。

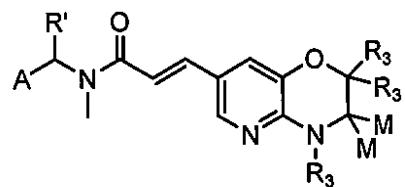
【化19】



【請求項12】

前記化合物が下記式Iiで表される、請求項2に記載の化合物。

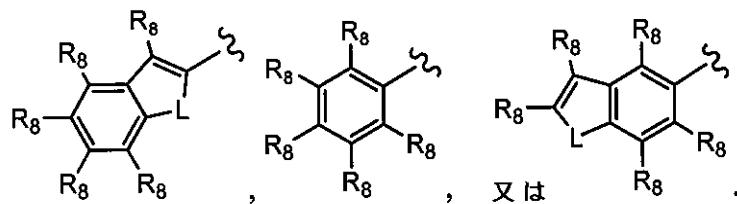
【化20】



Ii

式中、Aは下記式で表される。

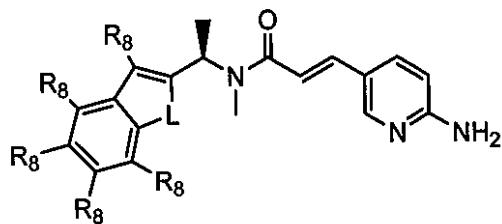
【化21】



【請求項13】

前記化合物が下記式Ijで表される、請求項2に記載の化合物。

【化22】

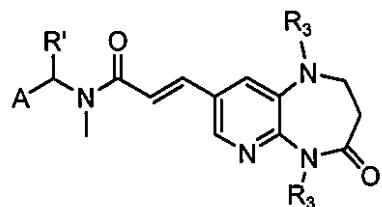


Ij.

【請求項14】

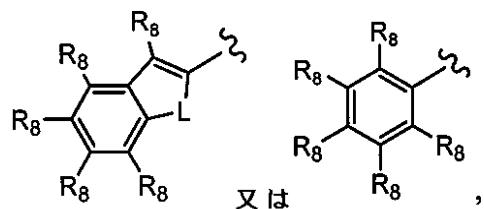
前記化合物が下記式Ikで表される、請求項2に記載の化合物。

【化23】

**Ik**

式中、Aは下記式で表され、

【化24】



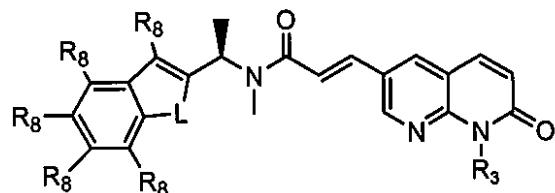
又は

式中、R8およびLはすでに定義したとおりである。

【請求項15】

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。

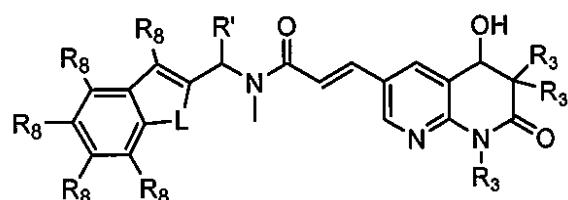
【化25】

**II.**

【請求項16】

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。

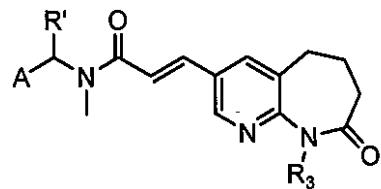
【化26】

**Im.**

【請求項17】

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。

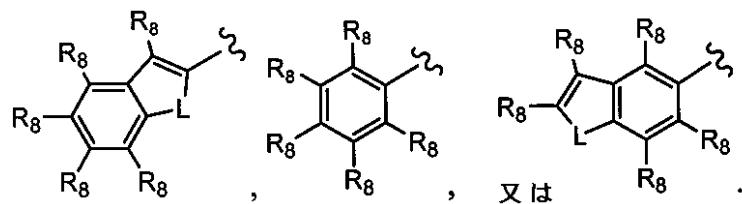
【化 2 7】



In

式中、 A は下記式で表される。

【化 2 8】



【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タン-2-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

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

(E) - N - ((1 - メチル - 1H - インドール - 2 - イル) メチル) - 3 - [7 - オキソ - (4 ' - N - B o c - 6 - スピロピペリジニル) - 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 - プロポキシベンジル) - N - メチル - 3 - [7 - オキソ - (4 ' - N - B o c - 6 - スピロピペリジニル) - 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 - プロポキシベンジル) - N - メチル - 3 - [7 - オキソ - (6 - スピロピペリジニル) - 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 - スピロピペリジニル) - 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 - プロポキシベンジル) - N - メチル - 3 - [7 - オキソ - (4 ' - N - メチル - 6 - スピロピペリジニル) - 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) - 3 - [7 - オキソ - (4 ' - N - メチル - 6 - スピロピペリジニル) - 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 - 2H - 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 - 2H - 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 - 2H - 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 - 2H - 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 - 2H - 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 - 1H - 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 - メチル - N - ((3 - メチル - 1H - 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 - 1H - 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 - 1H - 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 - 1H - 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 - 1H - 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 - プロポキシベンジル) - 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 - メトキシ - プロポキシベンジル - 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-((3,6-ジメチル-1H-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-5H-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-1H-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-1H-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32μg/mL以下、約16μg/mL以下、約8μg/mL以下、約4μg/mL以下、約2μg/mL以下、約1μg/mL以下、約0.5μg/mL以下、約0.25μg/mL以下、または約0.125μg/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。