

【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18年11月30日(2006.11.30)

【公表番号】特表2006-509035(P2006-509035A)

【公表日】平成18年3月16日(2006.3.16)

【年通号数】公開・登録公報2006-011

【出願番号】特願2004-570322(P2004-570322)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 263/10 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/422 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/496 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/5377 (2006.01)**

**A 6 1 P 31/04 (2006.01)**

**C 0 7 D 413/10 (2006.01)**

**C 0 7 D 413/12 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 D 263/10 C S P

A 6 1 K 31/422

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 31/04

C 0 7 D 413/10

C 0 7 D 413/12

【手続補正書】

【提出日】平成18年10月12日(2006.10.12)

【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

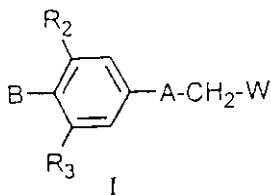
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の式 I :

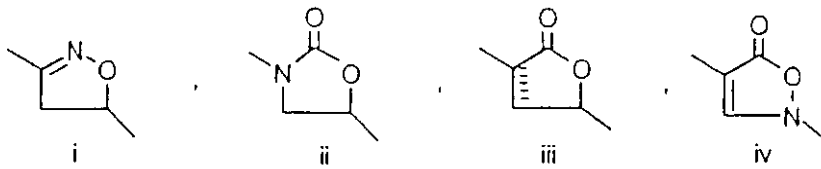
【化1】



(式中、

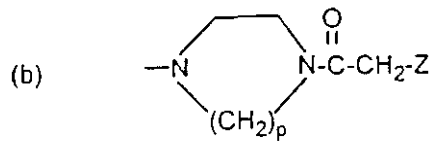
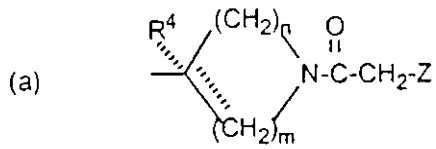
Aは次の構造 i、ii、iiiまたはivである；

## 【化2】



Bは次の(a)または(b)である；

## 【化3】



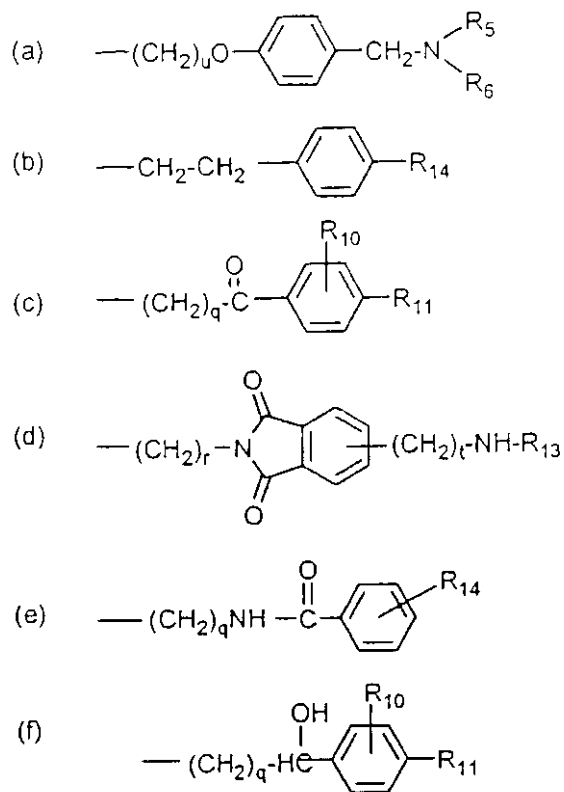
Wは-N(H)C(X)-R<sub>1</sub>、Hetまたは-Y-HETであり、式中のHetまたは-Y-HETは随意に=Sまたは=Oを置換基として有するが、ただしA=構造ivならば、W -Y-HETまたはHetである；

XはOまたはSである；

YはNH、OまたはSである；

Zは次のうちいずれかである；

## 【化4】



R<sub>1</sub> は a) H

b) NH<sub>2</sub>

c) NHC<sub>1-4</sub> アルキル

d) C<sub>1-4</sub> アルキル

e) C<sub>2-4</sub> アルケニル

f) O-C<sub>1-4</sub> アルキル

g) S-C<sub>1-4</sub> アルキルまたは

h) (CH<sub>2</sub>)<sub>s</sub>C<sub>3-6</sub> シクロアルキル

であるが、R<sub>1</sub> 中の各アルキルまたはシクロアルキルは出現のたびに随意に1個、2個または3個のハロゲン (FまたはCl) を置換基として有する；

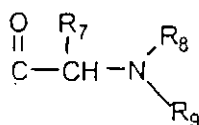
各R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>は独立に水素、ハロゲン (FまたはCl)、メチルまたはエチルである；

R<sub>4</sub>はH、CH<sub>3</sub>またはFである；

R<sub>5</sub>はHまたはC<sub>1-4</sub> アルキルである；

R<sub>6</sub>はH、C<sub>1-4</sub> アルキルまたは

## 【化5】



であるが、またはR<sub>6</sub>はR<sub>5</sub>と共に随意置換飽和複素環を形成する；

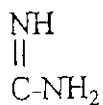
R<sub>7</sub>はHであるか、または下記を随意に置換基として有するC<sub>1-4</sub> アルキルである：-OH、-NH<sub>2</sub>、-NH-C(=NH)-NH<sub>2</sub>、-SH、-SCH<sub>3</sub>、-COOH、-C(O)NH<sub>2</sub>、随意に-OHを置換基として有するフ

エニル；

R<sub>8</sub>はHまたはCH<sub>3</sub>である；

R<sub>9</sub>はH、CH<sub>3</sub>、-C(O)-CH(R<sub>7</sub>)-NR<sub>8</sub>R<sub>8</sub>または

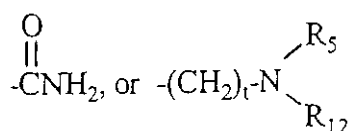
【化6】



である；

R<sub>10</sub>またはR<sub>11</sub>はハロ、C<sub>1-4</sub>アルキル、CF<sub>3</sub>、-CN、-NO<sub>2</sub>、-OH、-O-C<sub>1-4</sub>アルキル、-NH-S(O)<sub>w</sub>C<sub>1-4</sub>アルキル、

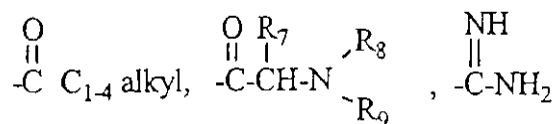
【化7】



である；

R<sub>12</sub>はH、C<sub>1-4</sub>アルキル、-S(O)<sub>2</sub>C<sub>1-4</sub>アルキル、

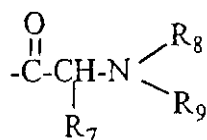
【化8】



であるか、またはR<sub>12</sub>はR<sub>5</sub>と共に飽和複素環を形成する；

R<sub>13</sub>はHまたは

【化9】



である；

R<sub>14</sub>は-(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>NHR<sub>13</sub>、-OH、-OC<sub>1-4</sub>アルキルである；

mは0、1、2、3または4である；

nは0、1、2、3または4であるが、ただしm+n=2、3、4または5であるものとする；

pは2または3である；

qは1または2である；

r、sおよびtは独立に0または1である；

uとwは独立に0、1または2である；

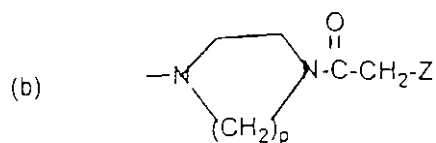
ただしZ=a、bまたはdならばW Hetまたは-Y-HETであり、またA=構造iiiならばZ bである。)

で示される化合物またはその製薬上許容しうる塩。

【請求項 2】

Bが

【化 1 0】

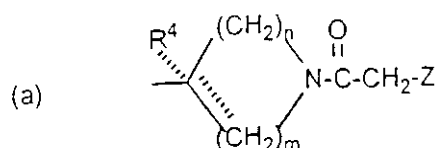


である、請求項1に記載の化合物。

【請求項 3】

Bが

【化 1 1】



である、請求項1に記載の化合物。

【請求項 4】

Zが(a)である、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 5】

R<sub>5</sub>とR<sub>6</sub>がC<sub>1-4</sub>アルキルであるかまたは共に随意置換飽和複素環を形成する、請求項4に記載の化合物。

【請求項 6】

R<sub>5</sub>とR<sub>6</sub>が随意置換モルホリニルおよびピペラジニルを形成する、請求項5に記載の化合物。

【請求項 7】

Zが(c)である、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 8】

R<sub>11</sub>が-C(O)-NH<sub>2</sub>、-NHS(O)<sub>u</sub>C<sub>1-4</sub>アルキル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>-NR<sub>5</sub>R<sub>12</sub>、-CH<sub>2</sub>N(C<sub>1-4</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-C<sub>H2</sub>飽和複素環、-CH<sub>2</sub>-NH-C<sub>1-4</sub>アルキル、-CH<sub>2</sub>-N(C<sub>1-4</sub>アルキル)-C(O)-CHR<sub>7</sub>-NR<sub>8</sub>R<sub>9</sub>、-CH<sub>2</sub>-NH-C(O)-C<sub>1-4</sub>アルキル、-CH<sub>2</sub>-NH-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1-4</sub>アルキル)、-CH<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>または-NH-C(O)-CHR<sub>7</sub>-NR<sub>8</sub>R<sub>9</sub>である、請求項7に記載の化合物。

【請求項 9】

Zが(c)である、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 1 0】

R<sub>11</sub>が-C(O)-NH<sub>2</sub>、-NHS(O)<sub>u</sub>C<sub>1-4</sub>アルキル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>t</sub>-NR<sub>5</sub>R<sub>12</sub>、-CH<sub>2</sub>N(C<sub>1-4</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-C<sub>H2</sub>飽和複素環、-CH<sub>2</sub>-NH-C<sub>1-4</sub>アルキル、-CH<sub>2</sub>-N(C<sub>1-4</sub>アルキル)-C(O)-CHR<sub>7</sub>-NR<sub>8</sub>R<sub>9</sub>、-CH<sub>2</sub>-NH-C(O)-C<sub>1-4</sub>アルキル、-CH<sub>2</sub>-NH-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1-4</sub>アルキル)、-CH<sub>2</sub>-NH<sub>2</sub>または-NH-C(O)-CHR<sub>7</sub>-NR<sub>8</sub>R<sub>9</sub>である、請求項9に記載の化合物。

【請求項 1 1】

Zが(b)であり、R<sub>14</sub>が-OC<sub>1-4</sub>アルキル、-OHまたは-NH-C(O)-CH(R<sub>7</sub>)-NR<sub>8</sub>R<sub>9</sub>である、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 1 2】

次の化合物：

N-(((5S)-3-{4-[4-({4-[(ジエチルアミノ)メチル]フェノキシ}アセチル)ピペラジン-1-イル]-3-フルオロフェニル}-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル)メチル]プロパンチオアミド；

N-(((5S)-3-{4-[4-({4-[(ジエチルアミノ)メチル]フェノキシ}アセチル)ピペラジン-1-イル]-3-フルオロフェニル}-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル)メチル]シクロプロパンカルボチオアミド；

N-(((5S)-3-{4-[4-({4-[(ジエチルアミノ)メチル]フェノキシ}アセチル)ピペラジン-1-イル]-3-フルオロフェニル}-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル)メチル]アセトアミド；

N-(((5S)-3-{4-[4-({4-[(ジメチルアミノ)メチル]フェノキシ}アセチル)ピペラジン-1-イル]-3-フルオロフェニル}-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル)メチル]プロパンチオアミド；

N-(((5S)-3-{4-[4-({4-[(ジメチルアミノ)メチル]フェノキシ}アセチル)ピペラジン-1-イル]-3-フルオロフェニル}-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル)メチル]シクロプロパンカルボチオアミド；

N-(((5S)-3-{4-[4-({4-[(ジメチルアミノ)メチル]フェノキシ}アセチル)ピペラジン-1-イル]-3-フルオロフェニル}-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル)メチル]アセトアミド；

N-({(5S)-3-[3-フルオロ-4-(4-{[4-(モルホリン-4-イルメチル)フェノキシ]アセチル}ピペラジン-1-イル)フェニル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル}メチル)プロパンチオアミド；

N-({(5S)-3-[3-フルオロ-4-(4-{[4-(モルホリン-4-イルメチル)フェノキシ]アセチル}ピペラジン-1-イル)フェニル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル}メチル)シクロプロパンカルボチオアミド；

N-({(5S)-3-[3-フルオロ-4-(4-{[4-(モルホリン-4-イルメチル)フェノキシ]アセチル}ピペラジン-1-イル)フェニル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル}メチル)アセトアミド；

N-(((5S)-3-{3-フルオロ-4-[4-({4-[(4-メチルピペラジン-1-イル)メチル]フェノキシ}アセチル)ピペラジン-1-イル]フェニル}-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル)メチル]プロパンチオアミド；

N-(((5S)-3-{3-フルオロ-4-[4-({4-[(4-メチルピペラジン-1-イル)メチル]フェノキシ}アセチル)ピペラジン-1-イル]フェニル}-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル)メチル]シクロプロパンカルボチオアミド；

N-(((5S)-3-{3-フルオロ-4-[4-({4-[(4-メチルピペラジン-1-イル)メチル]フェノキシ}アセチル)ピペラジン-1-イル]フェニル}-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル)メチル]アセトアミド；

N-(((5S)-3-{4-[4-(4-{4-[(ジメチルアミノ)メチル]フェニル}-4-オキソブタノイル)-1-ピペラジニル]-3-フルオロフェニル}-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル)メチル]プロパンチオアミド；

N-(((5S)-3-{4-[4-(4-{4-[(ジメチルアミノ)メチル]フェニル}-4-オキソブタノイル)-1-ピペラジニル]-3-フルオロフェニル}-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル)メチル]シクロプロパンカルボチオアミド；

N-(((5S)-3-{4-[4-(4-{4-[(ジメチルアミノ)メチル]フェニル}-4-オキソブタノイル)-1-ピペラジニル]-3-フルオロフェニル}-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル)メチル]アセトアミド；

N-({(5S)-3-[3-フルオロ-4-(4-{4-[4-(4-モルホリニルメチル)フェニル]-4-オキソブタノイル}-1-ピペラジニル)フェニル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル}メチル)プロパンチオアミド；

N-({(5S)-3-[3-フルオロ-4-(4-{4-[4-(4-モルホリニルメチル)フェニル]-4-オキソブ

タノイル}-1-ピペラジニル)フェニル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル}メチル)アセトアミド;

N-( { (5S)-3-[3-フルオロ-4-(4-{4-[4-(4-モルホリニルメチル)フェニル]-4-オキソブタノイル}-1-ピペラジニル)フェニル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル}メチル)シクロプロパンカルボチオアミド;

N-[( (5S)-3-{3-フルオロ-4-[4-(4-[4-{4-[(メチルアミノ)メチル]フェニル}-4-オキソブタノイル)ピペラジン-1-イル]フェニル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル)メチル]アセトアミド;

N<sup>1</sup>-(4-{4-[4-(4-{(5S)-5-[(アセチルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル}-2-フルオロフェニル)-ピペラジン-1-イル]-4-オキソブタノイル}ベンジル-N<sup>1</sup>-メチルグリシニアミド;

N<sup>1</sup>-(4-{4-[4-(4-{(5S)-5-[(アセチルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル}-2-フルオロフェニル)-ピペラジン-1-イル]-4-オキソブタノイル}ベンジル-N<sup>1</sup>, N<sup>2</sup>, N<sup>2</sup>-トリメチルグリシニアミド;

N<sup>1</sup>-(4-{4-[4-(4-{(5S)-5-[(アセチルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル}-2-フルオロフェニル)-ピペラジン-1-イル]-4-オキソブタノイル}ベンジル-N<sup>2</sup>, N<sup>2</sup>-ジメチルグリシニアミド;

N<sup>1</sup>-(4-{4-[4-[2-フルオロ-4-{(5S)-2-オキソ-5-[(プロパンチオリルアミノ)メチル]-1,3-オキサゾリジン-3-イル}フェニル)ピペラジン-1-イル]-4-オキソブタノイル}ベンジル-N<sup>2</sup>, N<sup>2</sup>-ジメチルグリシニアミド;

(S)-N<sup>1</sup>-(4-{4-[4-(2-フルオロ-4-{(5S)-2-オキソ-5-[(プロパンチオイルアミノ)メチル]-1,3-オキサゾリジン-3-イル}フェニル)ピペラジン-1-イル]-4-オキソブタノイル}ベンジル)アラニンアミド;

(S)-N<sup>1</sup>-(4-{4-[4-(4-{(5S)-5-[(アセチルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル}-2-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イル]-2-オキソブタノイル}ベンジル)アラニンアミド;

N<sup>1</sup>-(4-{4-[4-(2-フルオロ-4-{(5S)-2-オキソ-5-[(プロパンチオイルアミノ)メチル]-1,3-オキサゾリジン-3-イル}フェニル)ピペラジン-1-イル]-4-オキソブタノイル}ベンジル)グリシニアミド;

(S)-アラニル-(S)-N<sup>1</sup>-(4-{4-[4-(2-フルオロ-4-{(5S)-2-オキソ-5-[(プロパンチオイルアミノ)メチル]-1,3-オキサゾリジン-3-イル}フェニル)ピペラジン-1-イル]-4-オキソブタノイル}ベンジル)アラニンアミド;

(S)-アラニル-(S)-N<sup>1</sup>-(4-{4-[4-(4-{(5S)-5-[(アセチルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル}-2-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イル]-4-オキソブタノイル}ベンジル)アラニンアミド;

N-(4-{4-[4-(4-{(5S)-5-[(アセチルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル}-2-フルオロフェニル)-1-ピペラジニル]-4-オキソブタノイル}ベンジル)アセトアミド;

N-(4-{4-[4-(2-フルオロ-4-{(5S)-2-オキソ-5-[(プロパンチオイルアミノ)メチル]-1,3-オキサゾリジン-3-イル}フェニル)-1-ピペラジニル]-4-オキソブタノイル}ベンジル)アセトアミド;

N-{ [(5S)-3-(3-フルオロ-4-{4-[4-(4-{ [(メチルスルホニル)アミノ]メチル}フェニル)-4-オキソブタノイル]-1-ピペラジニル}フェニル)-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル]メチル}アセトアミド;

N-{ [(5S)-3-(3-フルオロ-4-{4-[4-(4-{ [(メチルスルホニル)アミノ]メチル}フェニル)-4-オキソブタノイル]-1-ピペラジニル}フェニル)-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル]メチル}プロパンチオアミド;

N-( { (5S)-3-[4-(4-{4-[4-(アミノメチル)フェニル]-4-オキソブタノイル]-1-ピペラジニル)-3-フルオロフェニル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル}メチル)プロパンチオアミド;

N-( { (5S)-3-[4-(4-{ 4-[4-(アミノメチル)フェニル]-4-オキソブタノイル]-1-ピペラジニル)-3-フルオロフェニル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル } メチル)アセトアミド;

N<sup>1</sup>-(4-{ 4-[4-(4-{ (5S)-5-(アセチルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル } -2-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イル]-4-オキソブタノイル } ベンジル)グリシンアミド;

2-[3-メチル-3-(4-{ (5S)-2-オキソ-5-[(プロピオニルアミノ)メチル]-1,3-オキサゾリジン-3-イル } フェニル)アゼチジン-1-イル]-2-オキソエチル4-(アミノメチル)ベンズアミド;

N- { [(5S)-3-(4-{ 1-[4-(4-アミノフェニル)-4-オキソブタノイル]-3-メチルアゼチジン-3-イル } フェニル)-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル]メチル } プロパンアミド;

N-( { (5S)-3-[4-(1-{ 4-[4-(グリシルアミノ)フェニル]-4-オキソブタノイル } -3-メチルアゼチジン-3-イル } フェニル)-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル]メチル } プロパンアミド;

N- { [(5S)-3-(4-{ 1-[4-(4-アミノフェニル)-4-オキソブタノイル]-3-メチルアゼチジン-3-イル } -3-フルオロフェニル)-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル]メチル } アセトアミド;

N<sup>1</sup>-(4-{ 4-[3-(4-{ (5S)-5-[(アセチルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル } -2-フルオロフェニル)-3-メチルアゼチジン-1-イル]-4-オキソブタノイル } フェニル)グリシンアミド;

2-[3-(4-{ (5S)-5-[(アセチルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル } -2-フルオロフェニル)-3-メチルアゼチジン-1-イル]-2-オキソエチル-4-(アミノエチル)ベンズアミド;

N- { [(5S)-3-(3-フルオロ-4-{ 4-[4-(4-メトキシフェニル)ブタノイル]ピペラジン-1-イル } フェニル)-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル]メチル } アセトアミド;

N- { [(5S)-3-(3-フルオロ-4-{ 4-[4-(4-ヒドロキシフェニル)ブタノイル]ピペラジン-1-イル } フェニル)-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル]メチル } アセトアミド;

2,2-ジフルオロ-N- { [(5S)-3-(3-フルオロ-4-{ 4-[4-(4-メトキシフェニル)ブタノイル]ピペラジン-1-イル } フェニル)-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル]メチル } エタンチオアミド;

N- { [(5S)-3-(4-{ 4-[4-(4-プロモフェニル)-4-オキソブタノイル]-1-ピペラジニル } -3-フルオロフェニル)-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル]メチル } アセトアミド;

N- { [(5S)-3-(4-{ 4-[4-(4-プロモフェニル)-4-オキソブタノイル]-1-ピペラジニル } -3-フルオロフェニル)-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル]メチル } エタンチオアミド;

N- { [(5S)-3-(4-{ 4-[4-(4-シアノフェニル)-4-オキソブタノイル]-1-ピペラジニル } -3-フルオロフェニル)-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル]メチル } アセトアミド;

4-{ 4-[4-(4-{ (5S)-5-[(アセチルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル } -2-フルオロフェニル)-1-ピペラジニル]-4-オキソブタノイル } ベンズアミド;

4-{ 4-[4-(4-{ (5S)-5-[(エタンチオリルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル } -2-フルオロフェニル)-1-ピペラジニル]-4-オキソブタノイル } ベンズアミド;

N- { [(5S)-3-(4-{ 4-[4-(4-クロロフェニル)-4-オキソブタノイル]-1-ピペラジニル } -3-フルオロフェニル)-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル]メチル } アセトアミド;

N- { [(5S)-3-(4-{ 4-[4-(4-クロロフェニル)-4-オキソブタノイル]-1-ピペラジニル } -3-フルオロフェニル)-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル]メチル } エタンチオアミド;

N- [ ((5S)-3- { 3-フルオロ-4-[4-(4-{ 4-[(メチルスルホニル)アミノ]フェニル } -4-オキソブタノイル)-1-ピペラジニル } フェニル)-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル)メチル]プロパンチオアミド;

N- [ ((5S)-3- { 3-フルオロ-4-[4-(4-{ 4-[(メチルスルホニル)アミノ]フェニル } -4-オキソブタノイル)-1-ピペラジニル } フェニル)-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル)メ

チル]アセトアミド;

N-(4-{4-[4-(2-フルオロ-4-{(5S)-2-オキソ-5-[(プロパンチオリルアミノ)メチル]-1,3-オキサゾリジン-3-イル}フェニル)-1-ピペラジニル]-4-オキソブタノイル}フェニル)アセトアミド;

2-アミノ-N-(4-{4-[4-(2-フルオロ-4-{(5S)-2-オキソ-5-[(プロパンチオリルアミノ)メチル]-1,3-オキサゾリジン-3-イル}フェニル)-1-ピペラジニル]-4-オキソブタノイル}フェニル)アセトアミド;

N-(4-{4-[4-(4-{(5S)-5-[(アセチルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル}-2-フルオロフェニル)-1-ピペラジニル]-4-オキソブタノイル}フェニル)-2-アミノアセトアミド;

N-(4-{4-[4-(4-{(5S)-5-[(アセチルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル}-2-フルオロフェニル)-1-ピペラジニル]-4-オキソブタノイル}フェニル)-(2S)-2-アミノプロパンアミド;

N-1-(4-{4-[4-(4-{(5S)-5-[(エタンチオリルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル}-2-フルオロフェニル)-1-ピペラジニル]-4-オキソブタノイル}フェニル)-(S)-アラニンアミド;

N<sup>1</sup>-[4-(5-{4-[4-((5S)-5-{{(2,2-ジフルオロエタンチオイル)アミノ}メチル}-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル}-2-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イル]-5-オキソペンタノイル}フェニル)グリシンアミド;

N<sup>1</sup>-(4-{5-[4-(4-{(5S)-5-[(アセチルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル}-2-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イル]-5-オキソペンタノイル}フェニル)グリシンアミド;

N-(4-{4-[4-(4-{(5S)-5-[(アセチルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル}-2-フルオロフェニル)-1-ピペラジニル]-4-オキソブチル}フェニル)-2-アミノアセトアミド;

2-アミノ-N-(4-{4-[4-(2-フルオロ-4-{(5S)-2-オキソ-5-[(プロパンチオリルアミノ)メチル]-1,3-オキサゾリジン-3-イル}フェニル)-1-ピペラジニル]-4-オキソブチル}フェニル)アセトアミド;

(S)-2-アミノ-N-(4-{4-[4-(2-フルオロ-4-{(5S)-2-オキソ-5-[(プロパンチオリルアミノ)メチル]-1,3-オキサゾリジン-3-イル}フェニル)-1-ピペラジニル]-4-オキソブチル}フェニル)プロパンアミド;

N-(4-{4-[4-(4-{(5S)-5-[(アセチルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル}-2-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イル]-4-オキソブチル}フェニル)-2-(ジメチルアミノ)アセトアミド;

N-(4-{4-[4-(4-{(5S)-5-[(エタンチオリルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル}-2-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イル]-4-オキソブチル}フェニル)-2-(ジメチルアミノ)アセトアミド;

N<sup>1</sup>-(3-{4-[4-(4-{(5S)-5-[(アセチルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル}-2-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イル]-1-ヒドロキシ-4-オキソブチル}フェニル)グリシンアミド;

N<sup>1</sup>-[3-(4-{4-[4-((5S)-5-{{(2,2-ジフルオロエタンチオリル)アミノ}メチル}-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル)-2-フルオロフェニル]ピペラジン-1-イル}-4-オキソブタノイル}フェニル)グリシンアミド;

N-{[(5S)-3-(3-フルオロ-4-{4-[4-(3-ニトロフェニル)-4-オキソブタノイル]ピペラジン-1-イル}フェニル)-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル]メチル}アセトアミド;

N<sup>1</sup>-(3-{4-[4-(4-{(5S)-5-[(アセチルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル}-2-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イル]-4-オキソブタノイル}フェニル)グリシンアミド;

N-{[(5S)-3-(4-{4-[4-(2-アミノフェニル)-4-オキソブタノイル]ピペラジン-1-イル}-3-フルオロフェニル)-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル]メチル}アセトアミド;

N- { [(5S)-3-(4- { 4-[4-(5-アミノ-1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-2H-イソインドール-2-イル)アセチル]ピペラジン-1-イル} -3-フルオロフェニル)-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-5-イル]メチル} アセトアミド;

N<sup>1</sup>- (2- { 2-[4-(4- { (5S)-5-[(アセチルアミノ)メチル]-2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル} -2-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イル]-2-オキソエチル} -1,3-ジオキソ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル)グリシンアミド;

N<sup>1</sup>- [2-(3- { 4-[4-((5S)-5- { [(2,2-ジフルオロエタンチオリル)アミノ]メチル} -2-オキソ-1,3-オキサゾリジン-3-イル)-2-フルオロフェニル]ピペラジン-1-イル} -3-オキソプロピル)-1,3-ジオキソ-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール-5-イル]グリシンアミド。

【請求項 1 3】

請求項1～12のいずれか1項に記載の化合物を含む、哺乳動物の細菌感染症の治療薬。

【請求項 1 4】

治療薬が哺乳動物に経口、非経口、経皮または局所投与するための医薬組成物として製造され、該医薬組成物の、請求項1～12のいずれか1項に記載の化合物の含量が約0.1～約1000であることを特徴とする、請求項13に記載の治療薬。

【請求項 1 5】

請求項1～12のいずれか1項に記載の化合物と製薬上許容しうる担体とを含む医薬組成物

。