

【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20年6月19日(2008.6.19)

【公表番号】特表2008-504233(P2008-504233A)

【公表日】平成20年2月14日(2008.2.14)

【年通号数】公開・登録公報2008-006

【出願番号】特願2007-509742(P2007-509742)

【国際特許分類】

|                |           |
|----------------|-----------|
| C 07 D 235/22  | (2006.01) |
| C 07 D 401/12  | (2006.01) |
| C 07 D 413/12  | (2006.01) |
| C 07 D 403/12  | (2006.01) |
| C 07 D 417/12  | (2006.01) |
| C 07 D 405/12  | (2006.01) |
| A 61 K 31/4184 | (2006.01) |
| A 61 K 31/5377 | (2006.01) |
| A 61 K 31/422  | (2006.01) |
| A 61 K 31/454  | (2006.01) |
| A 61 K 31/427  | (2006.01) |
| A 61 K 31/4709 | (2006.01) |
| A 61 K 31/4196 | (2006.01) |
| A 61 K 31/497  | (2006.01) |
| A 61 K 31/4439 | (2006.01) |
| A 61 P 43/00   | (2006.01) |
| A 61 P 31/04   | (2006.01) |
| A 61 K 45/00   | (2006.01) |
| A 61 P 13/02   | (2006.01) |
| A 61 P 31/02   | (2006.01) |
| A 61 P 27/16   | (2006.01) |
| A 61 P 29/00   | (2006.01) |
| A 61 P 7/00    | (2006.01) |
| A 61 P 17/10   | (2006.01) |
| A 61 P 1/02    | (2006.01) |
| A 61 P 9/00    | (2006.01) |
| A 61 P 13/06   | (2006.01) |
| C 40 B 40/04   | (2006.01) |
| G 02 C 13/00   | (2006.01) |
| C 12 N 15/00   | (2006.01) |

【F I】

|                |       |
|----------------|-------|
| C 07 D 235/22  | C S P |
| C 07 D 401/12  | Z N A |
| C 07 D 413/12  |       |
| C 07 D 403/12  |       |
| C 07 D 417/12  |       |
| C 07 D 405/12  |       |
| A 61 K 31/4184 |       |
| A 61 K 31/5377 |       |
| A 61 K 31/422  |       |
| A 61 K 31/454  |       |

A 6 1 K 31/427  
A 6 1 K 31/4709  
A 6 1 K 31/4196  
A 6 1 K 31/497  
A 6 1 K 31/4439  
A 6 1 P 43/00 1 2 3  
A 6 1 P 43/00 1 2 1  
A 6 1 P 31/04  
A 6 1 P 43/00 1 1 1  
A 6 1 K 45/00  
A 6 1 P 31/04 1 7 1  
A 6 1 P 13/02 1 0 5  
A 6 1 P 31/02  
A 6 1 P 27/16  
A 6 1 P 29/00  
A 6 1 P 7/00  
A 6 1 P 17/10  
A 6 1 P 1/02  
A 6 1 P 9/00  
A 6 1 P 13/06  
C 4 0 B 40/04  
G 0 2 C 13/00  
C 1 2 N 15/00

【手続補正書】

【提出日】平成20年4月18日(2008.4.18)

【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

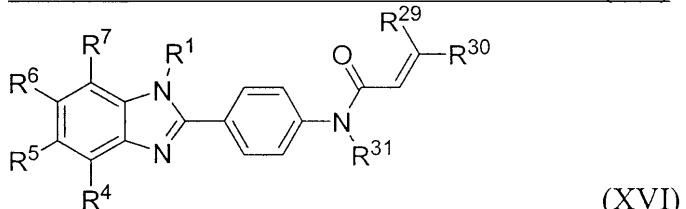
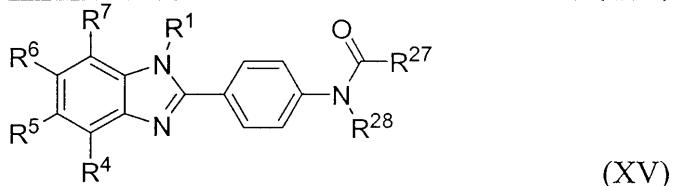
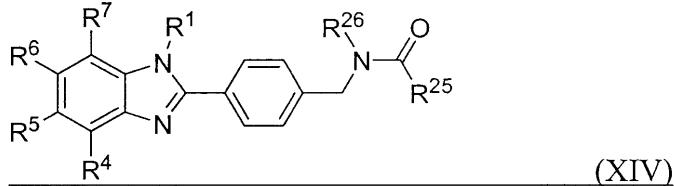
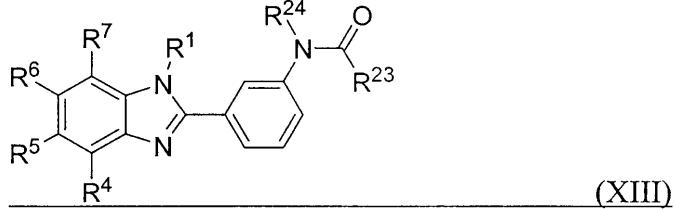
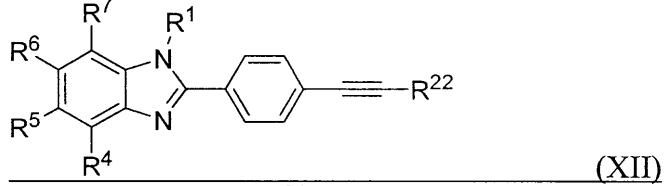
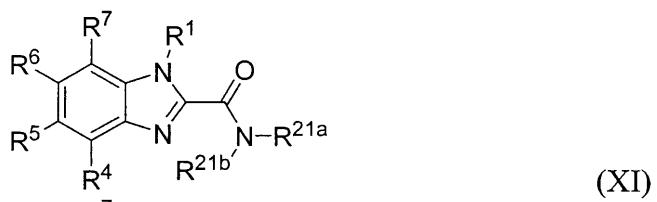
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

微生物細胞の抗生物質耐性を低下させる方法であって、該細胞の抗生物質耐性が低下するよう<sup>に</sup>、該細胞を式(XI)、(XII)、(XIII)、(XIV)、(XV)、(XVI)または(XVII)の転写因子調節化合物：



(式中

$R^1$ はOH、 $OOCOCO_2H$ 、置換もしくは非置換の直鎖状もしくは分枝状の $C_1-C_5$ アルキルオキシ基、または置換もしくは非置換の直鎖状もしくは分枝状の $C_1-C_5$ アルキル基であり；

$R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、および $R^7$ はH、( $C_1-C_5$ 置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、 $CO_2(C_1-C_5)$ 置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、 $CO(C_1-C_5)$ 置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、 $CO$ (置換または非置換のアリールまたはヘテロアリール)、 $CO(C_3-C_6)$ 置換または非置換のシクロアルキル)、 $O(C_1-C_5)$ 置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、 $C(NO_2)(C_1-C_5)$ 置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、置換または非置換のアミノ、 $CO_2H$ 、 $CN$ 、 $NO_2$ 、 $CONH_2$ 、( $CO$ )( $NHOH$ )、およびハロゲンからなる群より独立に選択され；かつ

$R^{21a}$ および $R^{21b}$ はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

$R^{22}$ はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテ

ロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より選択され；

R<sup>23</sup>およびR<sup>24</sup>はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

R<sup>25</sup>およびR<sup>26</sup>はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

R<sup>27</sup>は置換ヘテロアリール；置換アルキル；置換または非置換のアルケニル；アルキニル；アルキルカルボニル、アリールカルボニル；ヘテロアリールカルボニル；スルホニル；アルキルアミノ；アリールアミノ；ヘテロアリールアミノ；アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ；置換直鎖C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルキルまたはアルケニル；置換または非置換のイソキサゾール、チアゾリジン、イミダゾール、キノリン、ピロール、トリアゾール、またはピラジン；2-フルオロフェニル、2-メチルフェニル、2-シアノフェニル、1-メチルフェニル、および1-フルオロフェニルからなる群より選択され；かつ

R<sup>28</sup>はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より選択され；

R<sup>29</sup>、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

R<sup>32</sup>はOH、Br、CN、CO<sub>2</sub>H、モルホリニル、置換アリール、置換または非置換のアルケニル、アルキニル、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より選択され；

R<sup>33</sup>はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アロイルからなる群より選択され；

ただしR<sup>1</sup>がOHであり、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、およびR<sup>7</sup>がHであり、かつR<sup>6</sup>がNO<sub>2</sub>である場合、R<sup>23</sup>はメチルではなく、非置換のフェニルではなく且つ非置換のフラニルではなく；

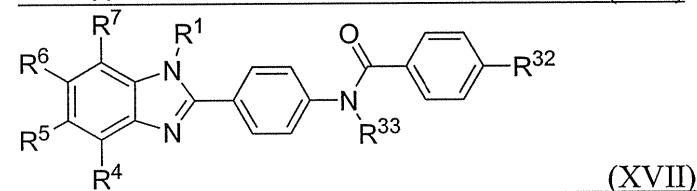
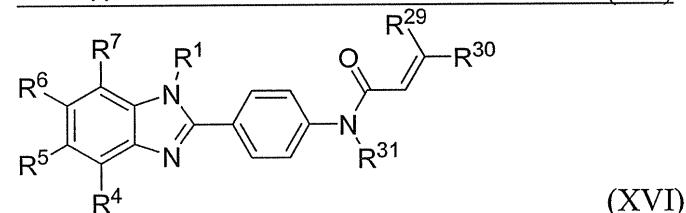
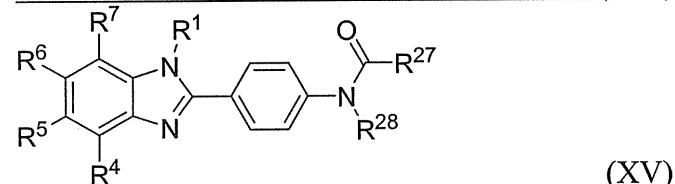
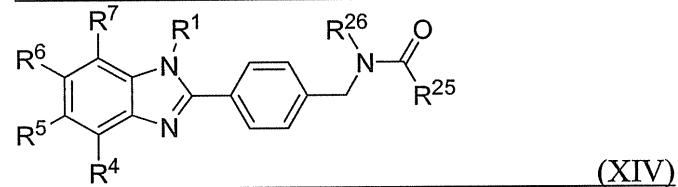
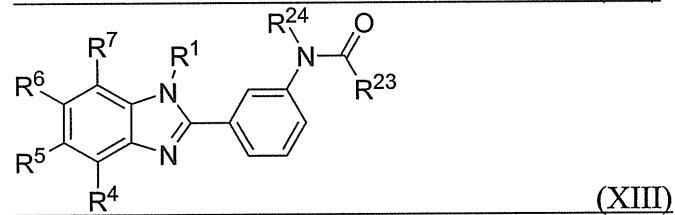
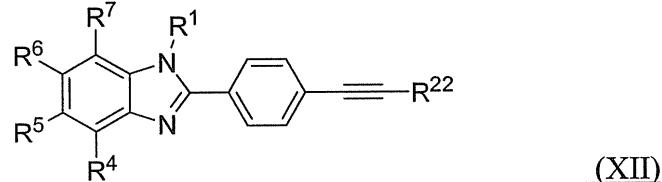
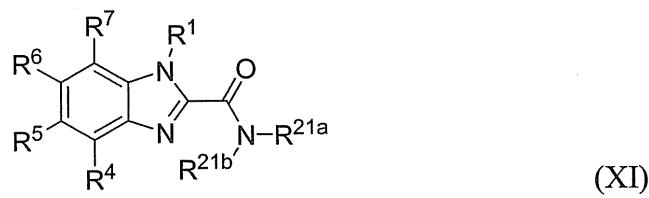
ただしR<sup>1</sup>がOHであり、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、およびR<sup>7</sup>がHであり、かつR<sup>6</sup>がNO<sub>2</sub>である場合、R<sup>25</sup>は非置換フェニルではなく且つO-tert-ブチルではなく；

ただしR<sup>1</sup>がOHであり、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>7</sup>およびR<sup>33</sup>がHであり、R<sup>6</sup>がNO<sub>2</sub>である場合、R<sup>32</sup>はジメチルアミノではなく；かつ

ただしR<sup>1</sup>がOHであり、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>7</sup>およびR<sup>33</sup>がHであり、R<sup>6</sup>がBrである場合、R<sup>32</sup>はジメチルアミノではない）ならびにその薬学的に許容される塩、エステルおよびプロドラッグと接触させる段階を含む方法。

【請求項 2】

転写を調節する方法であって、転写が調節されるように、転写因子を式(XI)、(XII)、(XIII)、(XIV)、(XV)、(XVI)または(XVII)の転写因子調節化合物：



(式中

$R^1$ はOH、OCOCO<sub>2</sub>H、置換もしくは非置換の直鎖状もしくは分枝状のC<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルキルオキシ基、または置換もしくは非置換の直鎖状もしくは分枝状のC<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルキル基であり；

$R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、および $R^7$ はH、(C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、CO(C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、CO(置換または非置換のアリールまたはヘテロアリール)、CO(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>置換または非置換のシクロアルキル)、O(C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、C(NO<sub>2</sub>)(C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、置換または非置換のアミノ、CO<sub>2</sub>H、CN、NO<sub>2</sub>、CONH<sub>2</sub>、(CO)(NHOH)、およびハロゲンからなる群より独立に選択され；かつ

$R^{21a}$ および $R^{21b}$ はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルス

ルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

$R^{22}$ はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より選択され；

$R^{23}$ および $R^{24}$ はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

$R^{25}$ および $R^{26}$ はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

$R^{27}$ は置換ヘテロアリール；置換アルキル；置換または非置換のアルケニル；アルキニル；アルキルカルボニル、アリールカルボニル；ヘテロアリールカルボニル；スルホニル；アルキルアミノ；アリールアミノ；ヘテロアリールアミノ；アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ；置換直鎖C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルキルまたはアルケニル；置換または非置換のイソキサゾール、チアゾリジン、イミダゾール、キノリン、ピロール、トリアゾール、またはピラジン；2-フルオロフェニル、2-メチルフェニル、2-シアノフェニル、1-メチルフェニル、および1-フルオロフェニルからなる群より選択され；かつ

$R^{28}$ はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より選択され；

$R^{29}$ 、 $R^{30}$ および $R^{31}$ はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

$R^{32}$ はOH、Br、CN、CO<sub>2</sub>H、モルホリニル、置換アリール、置換または非置換のアルケニル、アルキニル、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より選択され；

$R^{33}$ はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アロイルからなる群より選択され；

ただし $R^1$ がOHであり、 $R^4$ 、 $R^5$ 、および $R^7$ がHであり、かつ $R^6$ がNO<sub>2</sub>である場合、 $R^{23}$ はメチルではなく、非置換のフェニルではなく且つ非置換のフラニルではなく；

ただし $R^1$ がOHであり、 $R^4$ 、 $R^5$ 、および $R^7$ がHであり、かつ $R^6$ がNO<sub>2</sub>である場合、 $R^{25}$ は非置換フェニルではなく且つO-tert-ブチルではなく；

ただしR<sup>1</sup>がOHであり、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>7</sup>およびR<sup>3,3</sup>がHであり、R<sup>6</sup>がNO<sub>2</sub>である場合、R<sup>3,2</sup>はジメチルアミノではなく；かつ

ただしR<sup>1</sup>がOHであり、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>7</sup>およびR<sup>3,3</sup>がHであり、R<sup>6</sup>がBrである場合、R<sup>3,2</sup>はジメチルアミノではない)ならびにその薬学的に許容される塩、エステルおよびプロドラッグと接触させる段階を含む方法。

### 【請求項3】

R<sup>1</sup>がOHである、請求項1記載の方法。

#### 【請求項4】

$R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^7$ および $R^{26}$ がそれぞれHである、請求項1記載の方法。

### 【請求項 5】

R<sup>6</sup>がNO<sub>2</sub>である、請求項1記載の方法。

## 【請求項 6】

$R^{25}$  が置換アルケニル基である、請求項1記載の方法。

【請求項 7】

置換アルケニル基が置換または非置換のフェニルで置換されている、請求項6記載の方  
法。

### 【請求項 8】

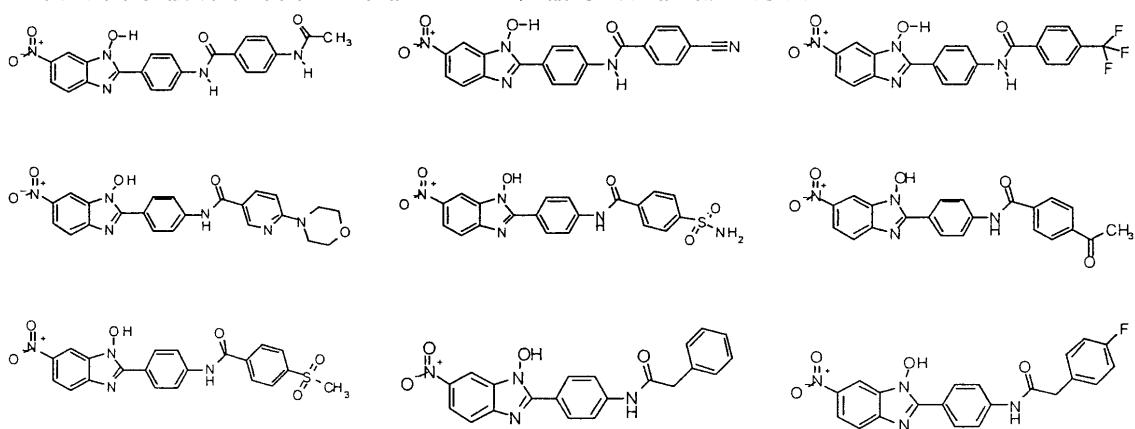
置換フェニルがパラ-ハロゲン化フェニルである。請求項7記載の方法。

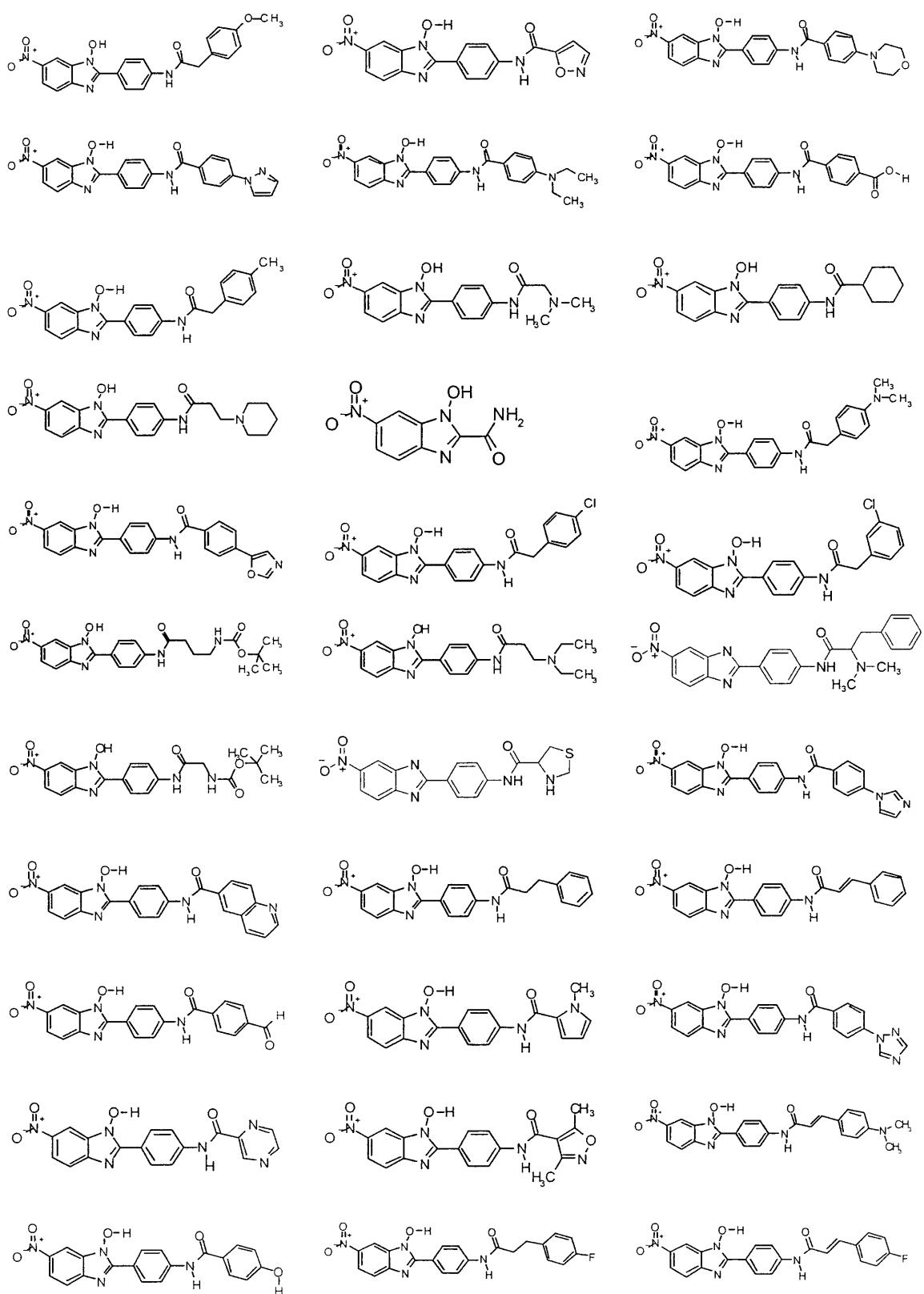
【請求項 9】

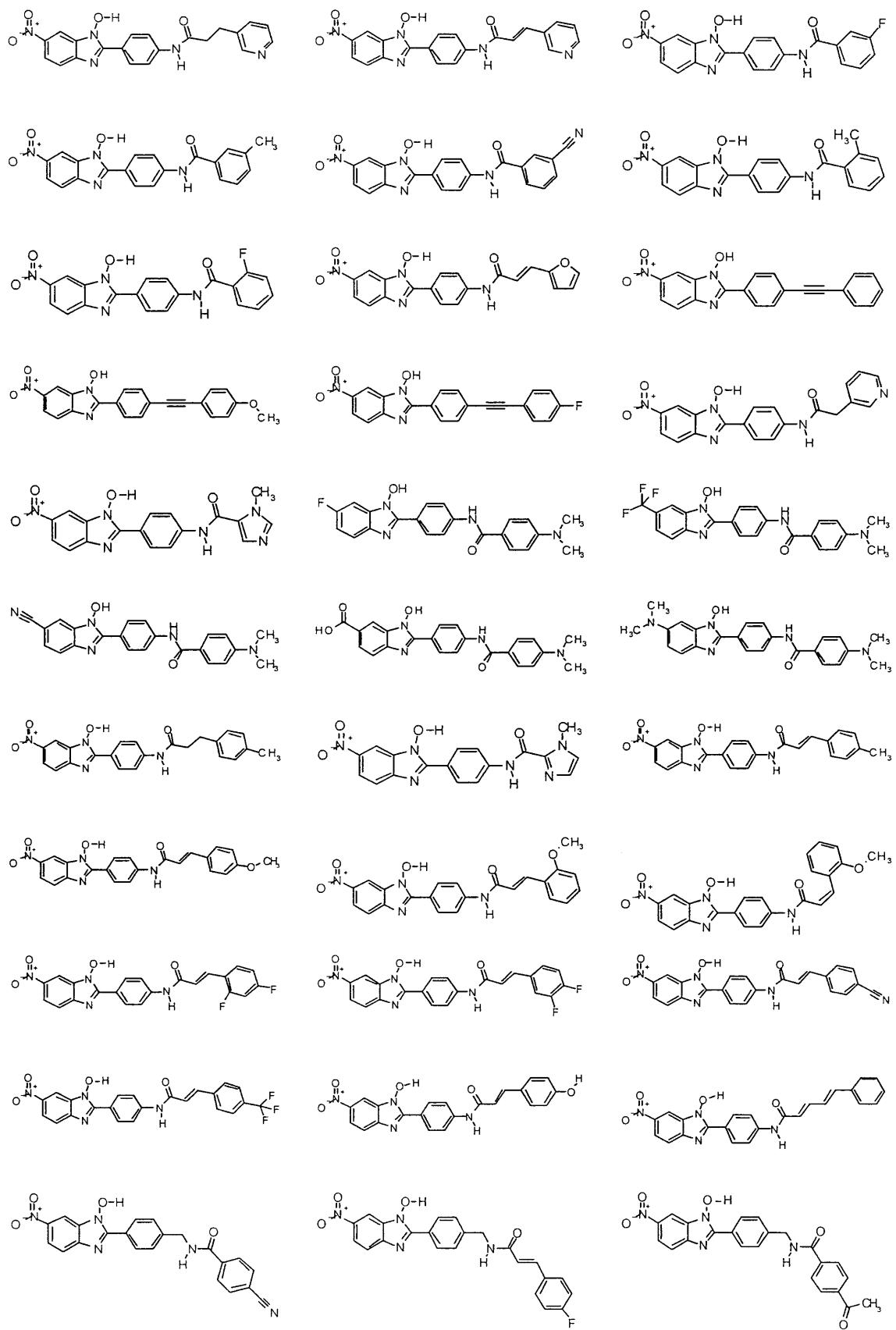
置換フェニルがパラ-フルオロフェニルである、請求項8記載の方法。

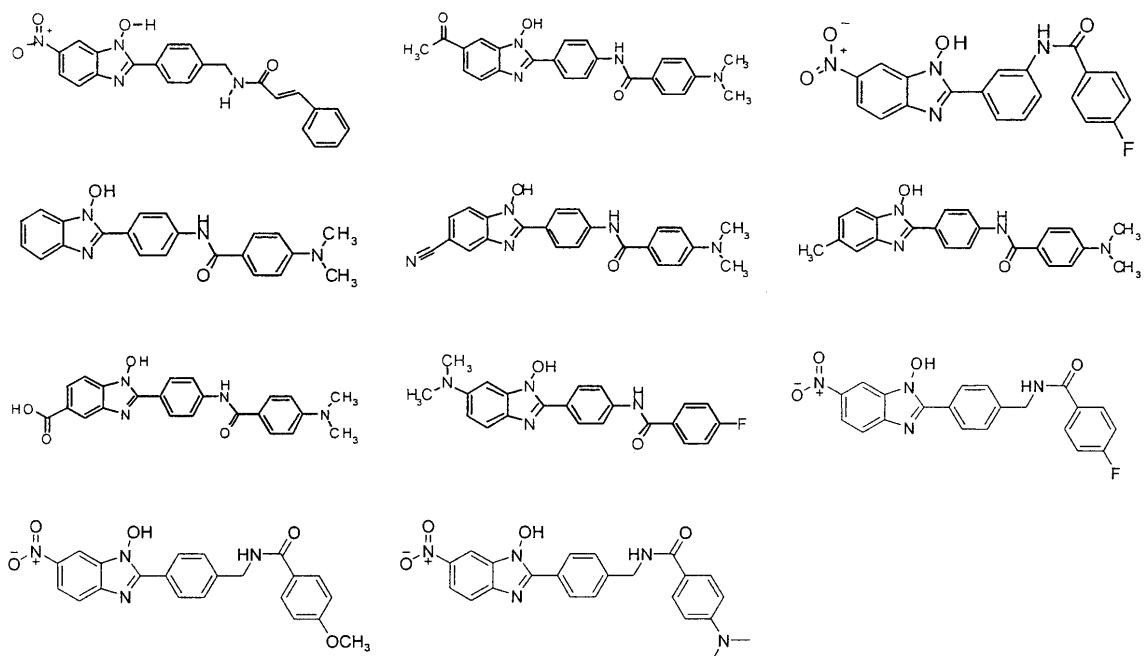
### 【請求項 10】

転写因子調節化合物が下記である。請求項1記載の方法：









## 【請求項 11】

転写因子が転写活性化因子である、請求項1記載の方法。

## 【請求項 12】

転写活性化因子がAraCファミリーポリペプチドである、請求項11記載の方法。

## 【請求項 13】

転写活性化因子がMarAファミリーポリペプチドである、請求項11記載の方法。

## 【請求項 14】

転写因子調節化合物が転写因子阻害化合物である、請求項1記載の方法。

## 【請求項 15】

転写因子が原核生物性である、請求項1記載の方法。

## 【請求項 16】

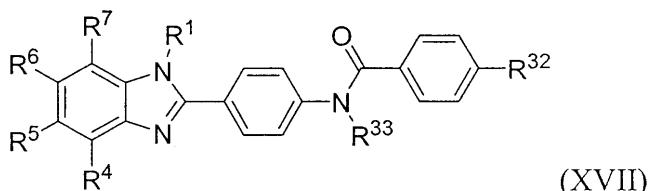
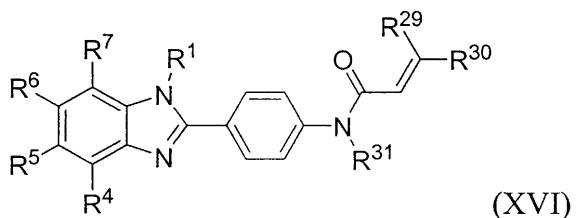
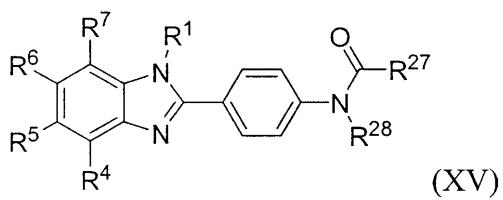
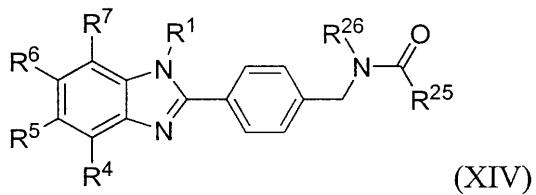
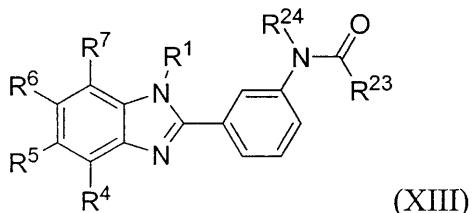
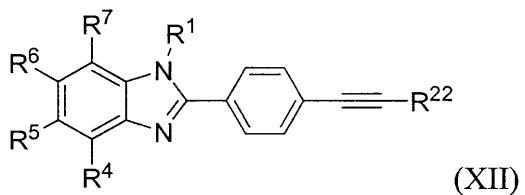
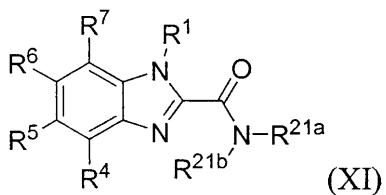
MarAファミリーポリペプチドがMarA、SoxS、RobまたはLcrF (VirF) である、請求項13記載の方法。

## 【請求項 17】

転写因子調節化合物のSoxSに対するEC<sub>50</sub>活性が10 μM未満である、請求項1記載の方法。

## 【請求項 18】

薬学的に許容される担体と転写因子調節化合物とを含む薬学的組成物であって、該化合物が式(XI)、(XII)、(XIII)、(XIV)、(XV)、(XVI)または(XVII)の化合物：



(式中

$R^1$ はOH、 $OCOCO_2H$ 、置換もしくは非置換の直鎖状もしくは分枝状の $C_1-C_5$ アルキルオキシ基、または置換もしくは非置換の直鎖状もしくは分枝状の $C_1-C_5$ アルキル基であり；

$R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、および $R^7$ はH、(C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、CO(C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、CO(置換または非置換のアリールまたはヘテロアリール)、CO(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>置換または非置換のシクロアルキル)、O(C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、C(NOH)(C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、置換または非置換のアミノ、CO<sub>2</sub>H、CN、NO<sub>2</sub>、CONH<sub>2</sub>、(CO)(NHOH)、およびハロゲンからなる群より独立に選択され；かつ

$R^{21a}$ および $R^{21b}$ はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

$R^{22}$ はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より選択され；

$R^{23}$ および $R^{24}$ はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

$R^{25}$  および  $R^{26}$  は H、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

$R^{27}$  は置換ヘテロアリール；置換アルキル；置換または非置換のアルケニル；アルキニル；アルキルカルボニル、アリールカルボニル；ヘテロアリールカルボニル；スルホニル；アルキルアミノ；アリールアミノ；ヘテロアリールアミノ；アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ；置換直鎖  $C_1-C_5$  アルキルまたはアルケニル；置換または非置換のイソキサゾール、チアゾリジン、イミダゾール、キノリン、ピロール、トリアゾール、またはピラジン；2-フルオロフェニル、2-メチルフェニル、2-シアノフェニル、1-メチルフェニル、および1-フルオロフェニルからなる群より選択され；かつ

$R^{28}$  は H、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より選択され；

$R^{29}$ 、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は H、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

$R^{32}$  は OH、Br、CN、 $CO_2H$ 、モルホリニル、置換アリール、置換または非置換のアルケニル、アルキニル、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より選択され；

$R^{33}$  は H、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より選択され；

ただし  $R^1$  が OH であり、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^7$  および  $R^{33}$  が H であり、 $R^6$  が  $NO_2$  である場合、 $R^{32}$  はジメチルアミノではなく；

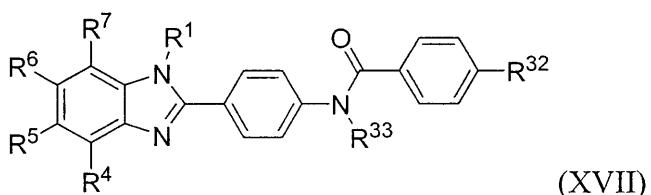
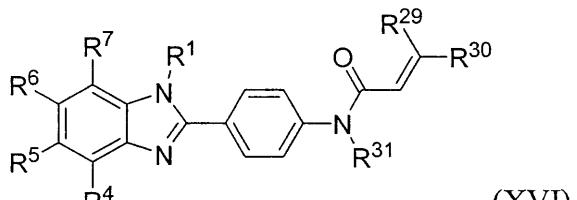
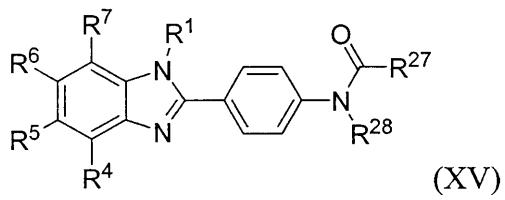
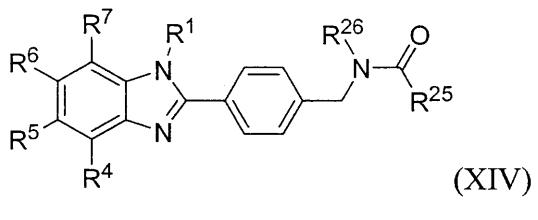
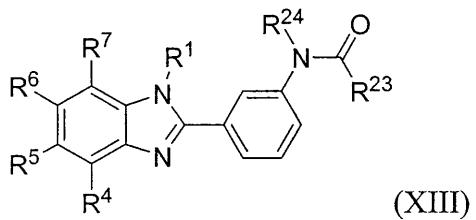
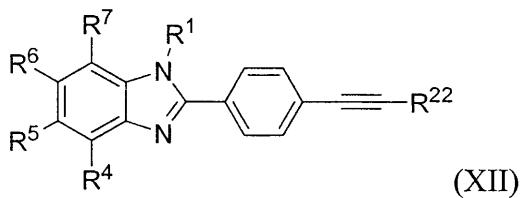
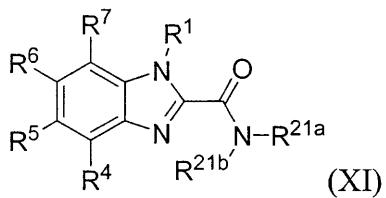
ただし  $R^1$  が OH であり、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^7$  および  $R^{33}$  が H であり、 $R^6$  が Br である場合、 $R^{32}$  はジメチルアミノではなく；

ただし  $R^1$  が OH であり、 $R^4$ 、 $R^5$ 、および  $R^7$  が H であり、かつ  $R^6$  が  $NO_2$  である場合、 $R^{25}$  は非置換フェニルではなく且つ O-tert- ブチルではなく；

ただし  $R^1$  が OH であり、 $R^4$ 、 $R^5$ 、および  $R^7$  が H であり、かつ  $R^6$  が  $NO_2$  である場合、 $R^{23}$  はメチルではなく、非置換フェニルではなく且つ 非置換フラニルではない）、またはその薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグである組成物。

#### 【請求項 19】

被検者の細菌関連状態の予防法であって、被検者の細菌関連状態が予防されるように、被検者に式(XI)、(XII)、(XIII)、(XIV)、(XV)、(XVI)もしくは(XVII)の転写因子調節化合物：



(式中

$R^1$ はOH、 $OCOCO_2H$ 、置換もしくは非置換の直鎖状もしくは分枝状の $C_1-C_5$ アルキルオキシ基、または置換もしくは非置換の直鎖状もしくは分枝状の $C_1-C_5$ アルキル基であり；

$R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、および $R^7$ はH、( $C_1-C_5$ 置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、 $CO_2$ ( $C_1-C_5$ 置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、 $CO(C_1-C_5)$ 置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、 $CO$ (置換または非置換のアリールまたはヘテロアリール)、 $CO(C_3-C_6)$ 置換または非置換のシクロアルキル)、 $O(C_1-C_5)$ 置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、 $C(NOH)(C_1-C_5)$ 置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、置換または非置換のアミノ、 $CO_2H$ 、CN、 $NO_2$ 、 $CONH_2$ 、( $CO$ )( $NHOH$ )、およびハロゲンからなる群より独立に選択され；かつ

$R^{21a}$ および $R^{21b}$ はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

$R^{22}$ はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より選択され；

$R^{23}$ および $R^{24}$ はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

$R^{25}$  および  $R^{26}$  は H、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

$R^{27}$  は置換ヘテロアリール；置換アルキル；置換または非置換のアルケニル；アルキニル；アルキルカルボニル、アリールカルボニル；ヘテロアリールカルボニル；スルホニル；アルキルアミノ；アリールアミノ；ヘテロアリールアミノ；アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ；置換直鎖  $C_1-C_5$  アルキルまたはアルケニル；置換または非置換のイソキサゾール、チアゾリジン、イミダゾール、キノリン、ピロール、トリアゾール、またはピラジン；2-フルオロフェニル、2-メチルフェニル、2-シアノフェニル、1-メチルフェニル、および1-フルオロフェニルからなる群より選択され；かつ

$R^{28}$  は H、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より選択され；

$R^{29}$ 、 $R^{30}$  および  $R^{31}$  は H、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

$R^{32}$  は OH、Br、CN、 $CO_2H$ 、モルホリニル、置換アリール、置換または非置換のアルケニル、アルキニル、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より選択され；

$R^{33}$  は H、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より選択され；

ただし  $R^1$  が OH であり、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^7$  および  $R^{33}$  が H であり、 $R^6$  が  $NO_2$  である場合、 $R^{32}$  はジメチルアミノではなく；

ただし  $R^1$  が OH であり、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^7$  および  $R^{33}$  が H であり、 $R^6$  が Br である場合、 $R^{32}$  はジメチルアミノではなく；

ただし  $R^1$  が OH であり、 $R^4$ 、 $R^5$ 、および  $R^7$  が H であり、かつ  $R^6$  が  $NO_2$  である場合、 $R^{25}$  は非置換フェニルではなく且つ O-tert- ブチルではなく；

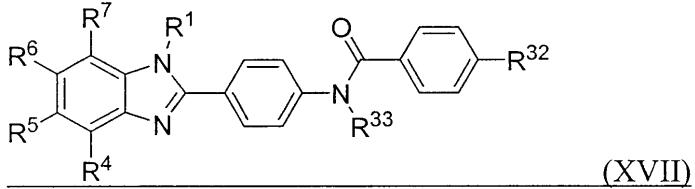
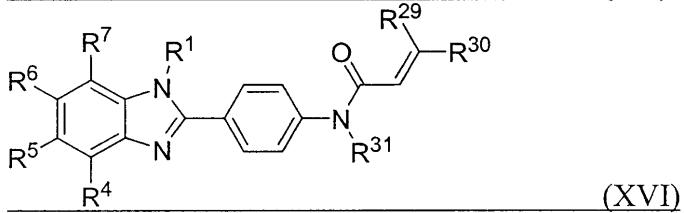
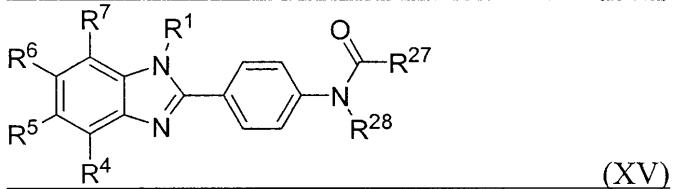
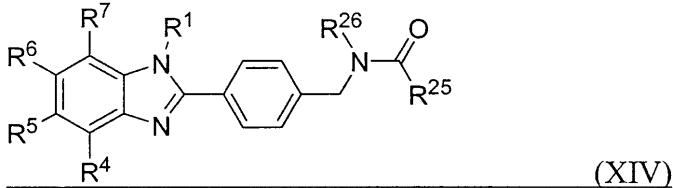
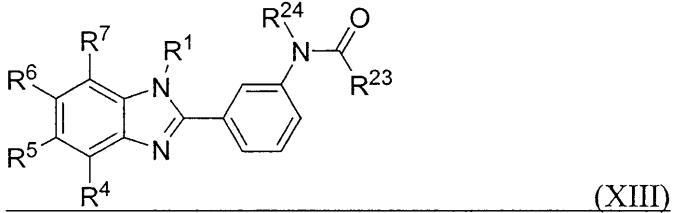
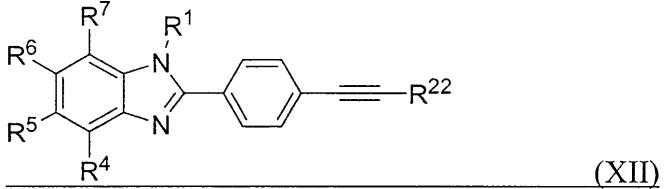
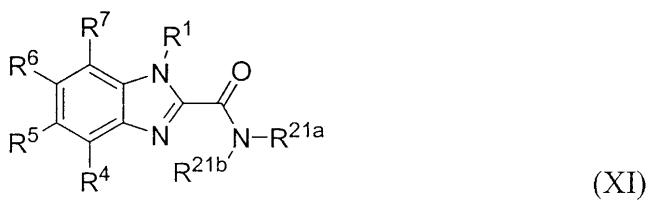
ただし  $R^1$  が OH であり、 $R^4$ 、 $R^5$ 、および  $R^7$  が H であり、かつ  $R^6$  が  $NO_2$  である場合、 $R^{23}$  はメチルではなく、非置換フェニルではなく且つ 非置換フラニルではない）、またはその薬学的に許容される塩、エステルもしくはプロドラッグの有効量を投与する段階を含む方法。

#### 【請求項 20】

被検者がヒトである、請求項 19 記載の方法。

#### 【請求項 21】

式 (XI)、(XII)、(XIII)、(XIV)、(XV)、(XVI) または (XVII) の化合物：



(式中

$R^1$ はOH、OCOCO<sub>2</sub>H、置換もしくは非置換の直鎖状もしくは分枝状のC<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルキルオキシ基、または置換もしくは非置換の直鎖状もしくは分枝状のC<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルキル基であり；

$R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、および $R^7$ はH、(C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、CO(C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、CO(置換または非置換のアリールまたはヘテロアリール)、CO(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>置換または非置換のシクロアルキル)、O(C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、C(NO<sub>2</sub>)(C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>置換または非置換の、直鎖状または分枝状のアルキル)、置換または非置換のアミノ、CO<sub>2</sub>H、CN、NO<sub>2</sub>、CONH<sub>2</sub>、(CO)(NHOH)、およびハロゲンからなる群より独立に選択され；かつ

$R^{21a}$ および $R^{21b}$ はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシリル、アシリルアミノ、アルキルアミノ、アリール

アミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

R<sup>22</sup>はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より選択され；

R<sup>23</sup>およびR<sup>24</sup>はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

R<sup>25</sup>およびR<sup>26</sup>はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

R<sup>27</sup>は置換ヘテロアリール；置換アルキル；置換または非置換のアルケニル；アルキニル；アルキルカルボニル、アリールカルボニル；ヘテロアリールカルボニル；スルホニル；アルキルアミノ；アリールアミノ；ヘテロアリールアミノ；アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ；置換直鎖C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルキルまたはアルケニル；置換または非置換のイソキサゾール、チアゾリジン、イミダゾール、キノリン、ピロール、トリアゾール、またはピラジン；2-フルオロフェニル、2-メチルフェニル、2-シアノフェニル、1-メチルフェニル、および1-フルオロフェニルからなる群より選択され；かつ

R<sup>28</sup>はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より選択され；

R<sup>29</sup>、R<sup>30</sup>およびR<sup>31</sup>はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、およびアロイルからなる群より独立に選択され；

R<sup>32</sup>はOH、Br、CN、CO<sub>2</sub>H、モルホリニル、置換アリール、置換または非置換のアルケニル、アルキニル、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アロイルからなる群より選択され；

R<sup>33</sup>はH、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、アルキルスルホニル、アリールスルホニル、アミノスルホニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロアリールカルボニル、アシル、アシルアミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリールアミノ、アロイルからなる群より選択され；

ただしR<sup>1</sup>がOHであり、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、およびR<sup>7</sup>がHであり、かつR<sup>6</sup>がNO<sub>2</sub>である場合、R<sup>23</sup>はメチルではなく、非置換のフェニルではなく且つ非置換のフラニルではなく；

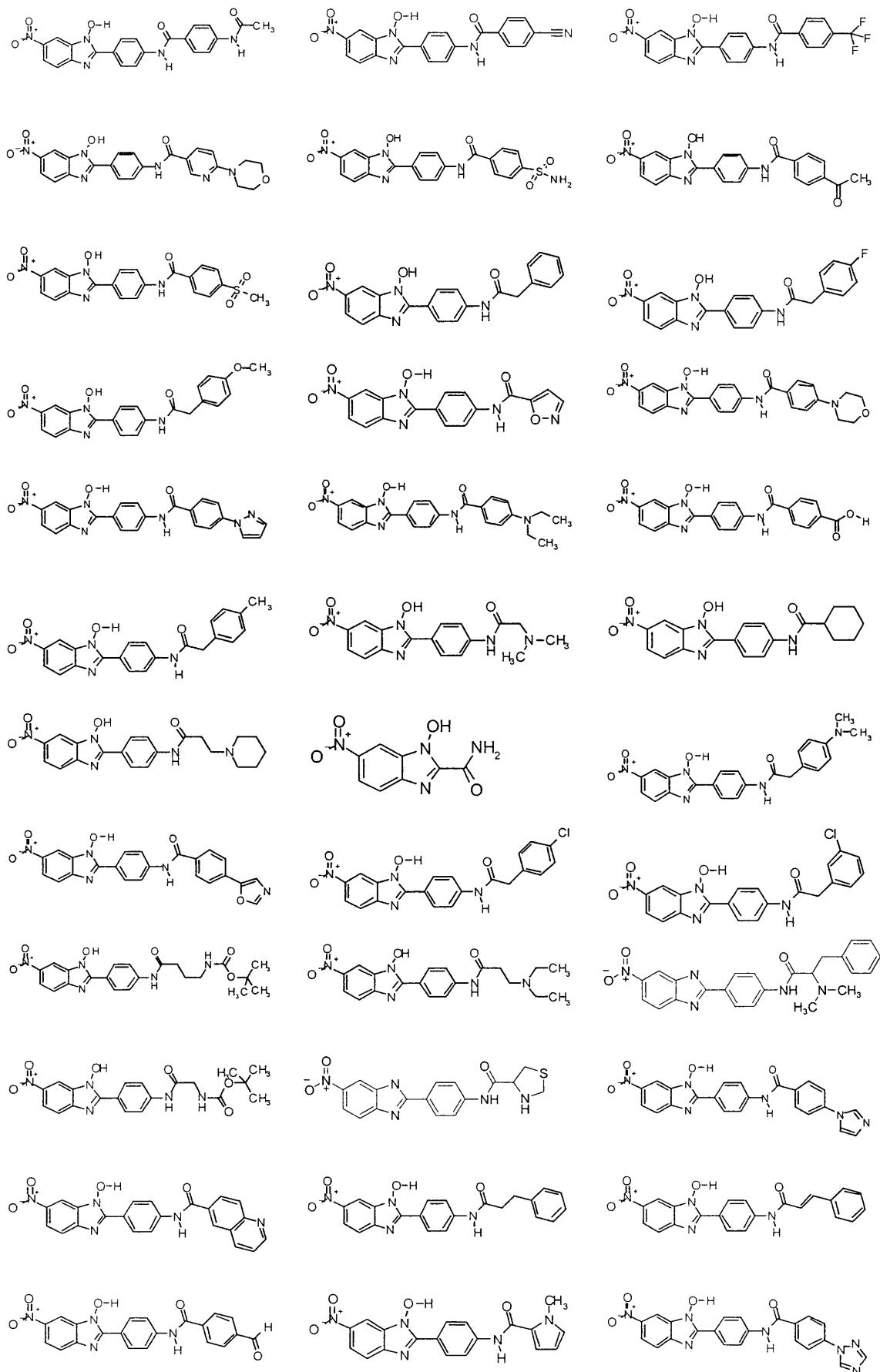
ただしR<sup>1</sup>がOHであり、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、およびR<sup>7</sup>がHであり、かつR<sup>6</sup>がNO<sub>2</sub>である場合、R<sup>25</sup>は非置換フェニルではなく且つO-tert-ブチルではなく；

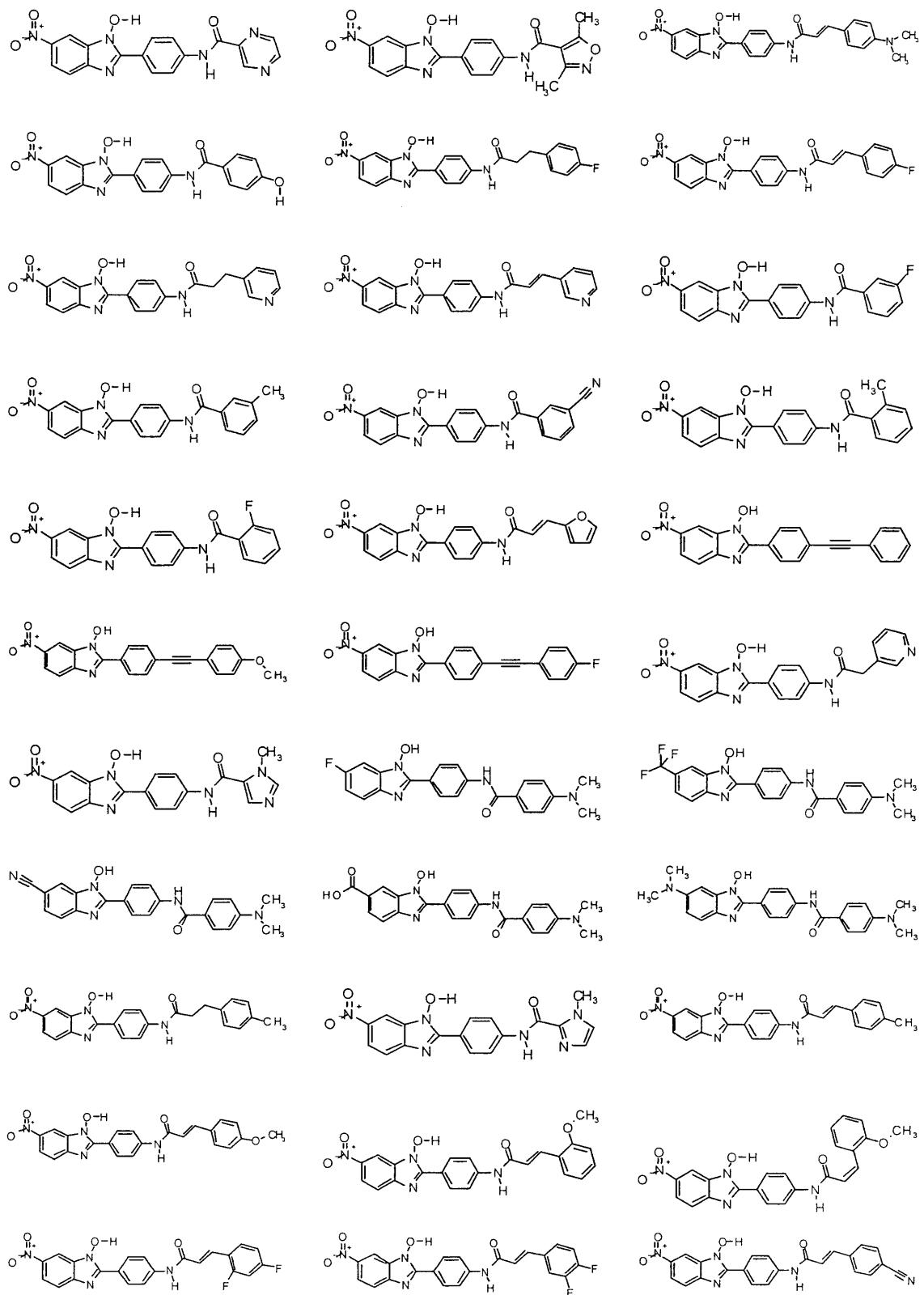
ただしR<sup>1</sup>がOHであり、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>7</sup>およびR<sup>33</sup>がHであり、R<sup>6</sup>がNO<sub>2</sub>である場合、R<sup>32</sup>はジメチルアミノではなく；かつ

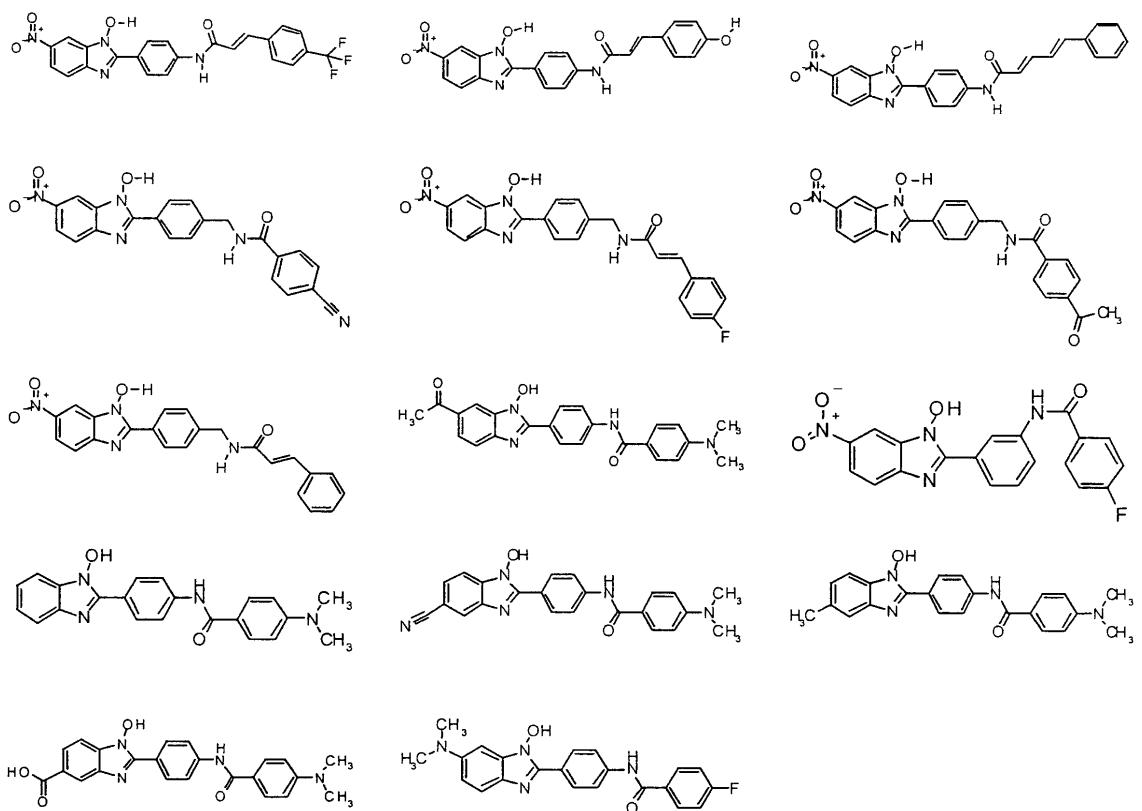
ただしR<sup>1</sup>がOHであり、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>7</sup>およびR<sup>33</sup>がHであり、R<sup>6</sup>がBrである場合、R<sup>32</sup>はジメチルアミノではない）ならびにその薬学的に許容される塩、エステルおよびプロドラッグ。

【請求項 22】

化合物の式が下記である、請求項21記載の化合物：







またはその薬学的に許容される塩、プロドラッグ、もしくはエステル。