

【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6月24日(2010.6.24)

【公表番号】特表2009-536939(P2009-536939A)

【公表日】平成21年10月22日(2009.10.22)

【年通号数】公開・登録公報2009-042

【出願番号】特願2009-508535(P2009-508535)

【国際特許分類】

C 0 7 D 413/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 413/10 C S P

A 6 1 K 31/454

A 6 1 P 31/04

C 0 7 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成22年5月7日(2010.5.7)

【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

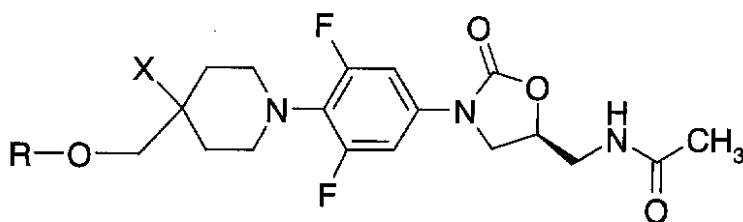
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の一般式Iで表される構造を持つ化合物、およびその製薬上許容される塩、その製薬上許容される溶媒和物、エステル、多形体、エナンチオマー、またはジアステレオマー：

【化1】



式I

該一般式Iにおいて、XはOHまたはFであり；RはCH₃、-(CH₂)_n-CF₃、-(CH₂)_n-CHF₂（nは0，1または2）である。

【請求項2】

以下に列挙するものから選択される化合物：

(5S)-N-{3-[3,5-ジフルオロ-4-(4-ヒドロキシ-(4-メトキシメチル)-ピペリジン-1-イル)フェニル]-2-オキソ-オキサゾリジン-5-イルメチル}-アセタミド；

(5S)-N-{3-[3,5-ジフルオロ-4-(4-フルオロ-(4-メトキシメチル)-ピペリジン-1-イル)フェニル]-2-オキソ-オキサゾリジン-5-イルメチル}-アセタミド；

(5S)-N-{3-[3,5-ジフルオロ-4-(4-ヒドロキシ-(2,2,2-トリフルオロエトキシメチル)-ピ

ペリジン-1-イル)フェニル]-2-オキソ-オキサゾリジン-5-イルメチル}-アセタミド。

【請求項3】

治療上有効な量の、請求項1または2に記載された化合物を、場合により製薬上許容される担体、賦形剤または希釈剤と共に含有する医薬組成物。

【請求項4】

動物またはヒトにおける微生物感染症の治療または予防用の、請求項3記載の医薬組成物。

【請求項5】

前記微生物感染症が、グラム-陽性、グラム-陰性細菌、好気性、嫌気性細菌または非定型細菌に起因するものである、請求項4記載の医薬組成物。

【請求項6】

動物またはヒトにおける微生物感染症の治療または予防用の医薬を製造するための、請求項1または2に記載された化合物の使用。

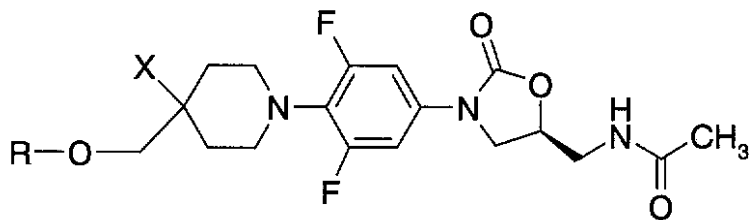
【請求項7】

前記微生物感染症が、グラム-陽性、グラム-陰性細菌、好気性、嫌気性細菌または非定型細菌に起因するものである、請求項6記載の使用。

【請求項8】

以下の一般式Iで表される構造を持つ化合物、およびその製薬上許容される塩、その製薬上許容される溶媒和物、エステル、多形体、エナンチオマー、またはジアステレオマーの製法であって：

【化2】



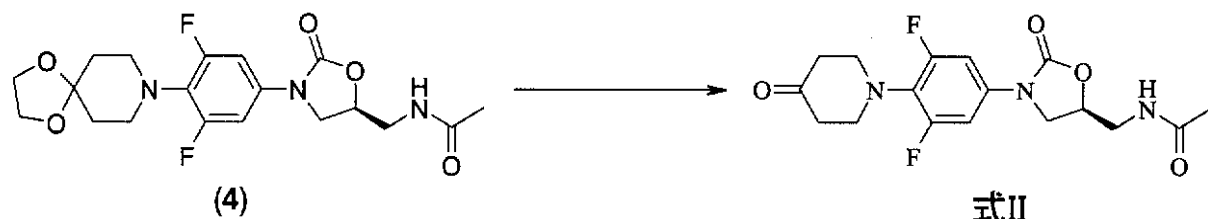
式I

該一般式Iにおいて、XはOHまたはFであり；RはCH₃、-(CH₂)_n-CF₃、-(CH₂)_n-CHF₂（nは0，1または2）であり、

該方法が、

a) 以下の化合物4を、以下の式IIで表される化合物に転化する工程：

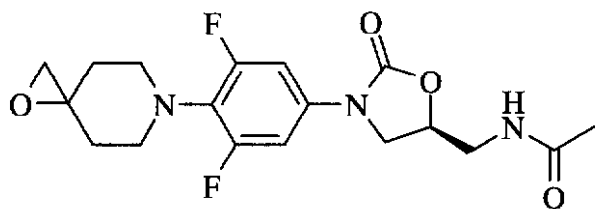
【化3】



式II

b) 該式IIの化合物のカルボニル基を、適切な試薬を用いて、エポキシドに転化して、以下の式IIIで表される化合物を製造する工程：および

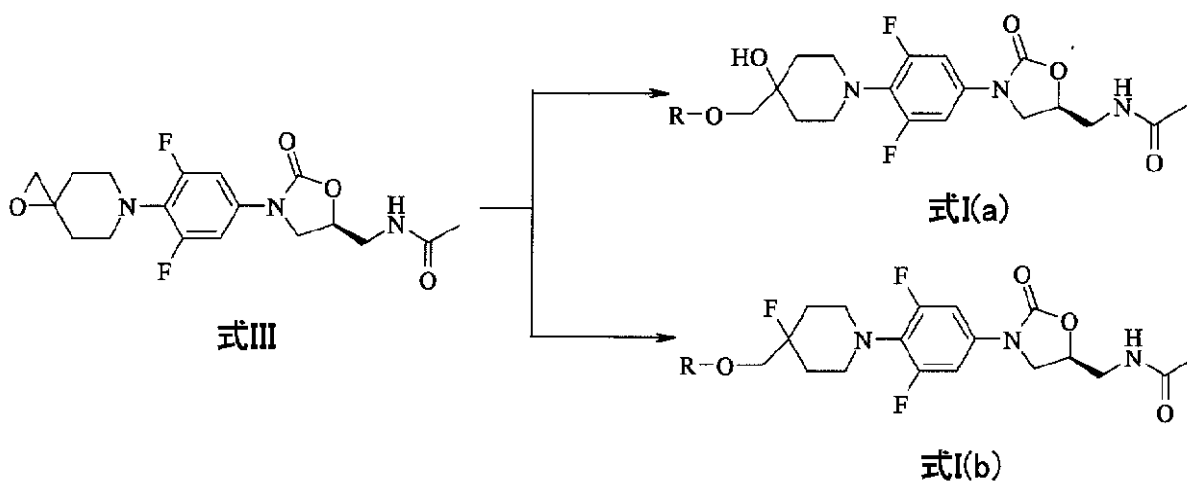
【化 4】



式III

c) 該式IIIの化合物のエポキシドを開環して、以下の式I(a)または式I(b)で表される化合物を得る工程：

【化 5】



を含む、前記方法。

【請求項 9】

前記化合物(4)の前記式IIで表される化合物への転化が、任意の適切な反応順序で、以下に列挙する諸工程を含む：

- a) 該ケタール基を加水分解して、カルボニル基に転化する工程；
 - b) メシレート基をアジド基に転化する工程；
 - c) 該アジド基を還元して、アミンを生成する工程；および
 - d) 該アミンをアセチル化して、アセタミドを生成する工程、
- を含む、請求項8記載の方法。

【請求項 10】

前記適切な試薬が、トリメチルオキソスルホニウムアイオダイドまたはトリメチルオキソスルホニウムクロリドである、請求項8記載の方法。

【請求項 11】

前記エポキシドを、アルコキシドまたは塩基の存在下においてアルコールを使用して開環し、前記式I(a)で表される化合物を得る、請求項8記載の方法。

【請求項 12】

前記エポキシドを、70% HF-ピリジンを用いて開環し、次いでアルキル化して、前記式I(b)で表される化合物を得る、請求項8記載の方法。

【請求項 13】

前記アルコキシドが、ナトリウムメトキシドである、請求項11記載の方法。

【請求項 14】

前記アルコールが、メタノール、トリフルオロメタノール、ジフルオロエタノール、トリフルオロエタノール、ジフルオロプロパノールまたはトリフルオロプロパノールである、請求項11記載の方法。

【請求項 15】

前記塩基が、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、ナトリウムt-ブトキシドまたはカリウムt-ブトキシドである、請求項11記載の方法。

【請求項 16】

更に、前記式I(a)で表される化合物を、フッ素化剤を使用して、前記式I(b)で表される化合物に転化する工程を含む、請求項8記載の方法。

【請求項 17】

前記フッ素化剤が、ジエチルアミノ硫黄トリフルオライド、ジメチルアミノ硫黄トリフルオライド、ピロリジノ硫黄トリフルオライド、N,N-ジエチル-1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロプロピルアミン、N,N-ジエチル-1,2,3,3,3-ペンタフルオロプロペンアミン、フッ化水素またはテトラブチルアンモニウムフルオライドである、請求項16記載の方法。