

【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27年10月1日(2015.10.1)

【公表番号】特表2013-542976(P2013-542976A)

【公表日】平成25年11月28日(2013.11.28)

【年通号数】公開・登録公報2013-064

【出願番号】特願2013-539319(P2013-539319)

【国際特許分類】

C 07 D 277/68 (2006.01)

C 07 D 417/12 (2006.01)

A 61 K 31/428 (2006.01)

A 61 K 31/4439 (2006.01)

A 61 K 31/5377 (2006.01)

A 61 K 31/4725 (2006.01)

A 61 K 31/4709 (2006.01)

A 61 K 31/541 (2006.01)

A 61 P 31/06 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

【F I】

C 07 D 277/68 C S P

C 07 D 417/12

A 61 K 31/428

A 61 K 31/4439

A 61 K 31/5377

A 61 K 31/4725

A 61 K 31/4709

A 61 K 31/541

A 61 P 31/06

A 61 P 31/04

【誤訳訂正書】

【提出日】平成27年8月13日(2015.8.13)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0032

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0032】

以下に続く文章において、「GP」という用語は、異方性結合(heterolytic bond)を破壊し、一対の電子が離脱することにより、分子から容易に切断され得る基を意味することを意図する。従って、例えば、この基は置換反応において容易に別の基により置き換えられ得る。例えば、このような脱離基は、ハロゲンまたは活性化されたヒドロキシル基、例えばメタンスルホナート、ベンゼンスルホナート、p-トルエンスルホナート、トリフラーート、アセテートなどである。脱離基の例およびこれらの調製に関する参考文献は、「Advanced Organic Chemistry」, M. B. Smith and J. March, 6th Edition, Wiley Interscience, 2007, p. 496 - 501に示されている。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

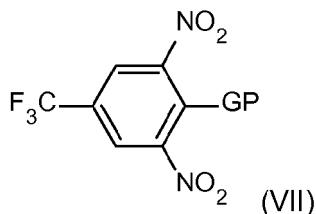
【訂正対象項目名】0049

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0049】

【化7】

[式中、GPが脱離基、好ましくはハロゲンを表す。]

とを反応させることによって調製される。

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

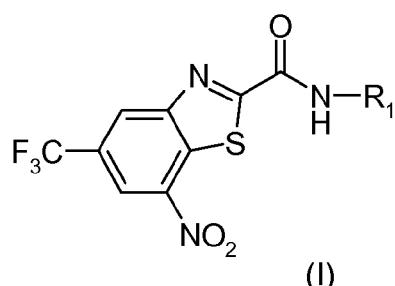
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物：

【化1】



であって、

式中、R1は、

- 以下により置換された(C1-C4)アルキル  
1以上のハロゲン原子；

OH、(C1-C3)アルコキシ、(C3-C6)ヘテロシクロアルキルもしくは(C1-C3)フルオロアルコキシ基およびハロゲン原子から互いに独立して選択される1以上の基により場合により置換されたアリール1個；

(C1-C4)アルキル基およびハロゲン原子から互いに独立して選択される1以上の基により、場合により置換されたヘテロアリール1個；

非置換のヘテロアリール-NH1個；

非置換の(C3-C6)シクロアルキル1個；

(C1-C3)アルキル、アリールおよびアリール(C1-C3)アルキル基から互いに独立して選択された1以上の基により、場合により置換された(C3-C6)ヘテロシクロアルキル1個；

または

- 以下により二置換された(C1-C4)アルキル1個

非置換のアリール；

および

非置換の(C3-C6)ヘテロシクロアルキル  
を表す、

塩基の形態または酸もしくは塩基の付加塩の形態の、化合物。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物であって：

R<sub>1</sub> が、

- 以下により置換された (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル基

1 以上のフッ素原子；

O H、メトキシ、モルホリンまたはトリフルオロメトキシ基および塩素またはフッ素原子から互いに独立して選択された 1 以上の基により、場合により置換されたフェニル1個；

メチルもしくはエチル基または塩素原子から互いに独立して選択された 1 以上の基により、場合により置換された、ピリジニル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、チエニル、ベンゾオキサゾリル、テトラヒドロイソキノリニル、キノリニルおよびチアゾリル基的1個；

非置換のピリジニル - NH 基1個；

非置換のシクロヘキシリル基1個；

メチル、フェニルおよびベンジル基から互いに独立して選択された 1 以上の基により、場合により置換された、テトラヒドロピラニル基、モルホニリル基、ピロリジニル基およびチオモルホニリル基的1個；

または

- 以下により二置換された (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル基1個：

非置換のフェニル；

および

非置換のモルホリニル基

を表すことを特徴とする、

塩基の形態または酸もしくは塩基の付加塩の形態の、化合物。

【請求項 3】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物であって、以下の化合物：

- N - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) エチル ] - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド；  
 - 7 - ニトロ - N - [ 2 - ( テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イル ) エチル ] - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド；  
 - 7 - ニトロ - N - ( 2 - ピリジン - 2 - イルエチル ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド；  
 - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - N - ( 3 , 3 , 3 - トリフルオロプロピル ) - 2 - ベンゾチアゾールカルボキサミド；  
 - 7 - ニトロ - N - ( ピリジン - 2 - イルメチル ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド；  
 - N - [ 3 - ( 4 - モルホリニル ) プロピル ] - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 2 - ベンゾチアゾールカルボキサミド；  
 - N - [ 2 - ( 4 - メトキシフェニル ) エチル ] - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド；  
 - N - ( シクロヘキシリルメチル ) - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド；  
 - N - [ 2 - ( 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 2 ( 1 H ) - イル ) エチル ] - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド；  
 - 7 - ニトロ - N - ( チエン - 2 - イルメチル ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド；  
 - 7 - ニトロ - N - ( キノリン - 3 - イルメチル ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド；

- 7 - ニトロ - N - ( 2 - ピロリジン - 1 - イルエチル ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- 7 - ニトロ - N - { 2 - [ 4 - トリフルオロメトキシ ) フェニル ] エチル } - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- N - [ 2 - ( 4 - フルオロフェニル ) エチル ] - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- N - [ 2 - ( 3 , 4 - ジメトキシフェニル ) エチル ] - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- N - [ 2 - ( 3 - クロロフェニル ) エチル ] - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- N - [ 2 - ( 2 - ヒドロキシフェニル ) エチル ] - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- N - [ 2 - ( 4 - ヒドロキシフェニル ) エチル ] - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- N - ( 4 - クロロベンジル ) - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- 7 - ニトロ - N - ( チエン - 3 - イルメチル ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- 7 - ニトロ - N - [ 2 - ( ピリジン - 2 - イルアミノ ) エチル ] - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- 7 - ニトロ - N - [ 2 - チオモルホリン - 4 - イルエチル ] - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- 7 - ニトロ - N - ( ピリジン - 3 - イルメチル ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- N - ( 2 - モルホリン - 4 - イルベンジル ) - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- N - [ 2 - ( 3 - メチルピリジン - 2 - イル ) エチル ] - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- N - ( 2 - モルホリン - 4 - イル - 2 - フェニルエチル ) - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- N - [ 2 - ( 2 , 2 - ジメチル - 4 - フェニルテトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イル ) エチル ] - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- N - [ 2 - ( 6 - メチルピリジン - 2 - イル ) エチル ] - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- N - [ 3 - ( 3 , 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル ) プロピル ] - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- 7 - ニトロ - N - [ 2 - ( 1 H - ピラゾール - 1 - イル ) エチル ] - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- N - ( 2 - モルホリン - 4 - イルエチル ) - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- N - [ ( 4 - ベンジルモルホリン - 2 - イル ) メチル ] - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- N - ( 2 - メチル - 2 - モルホリン - 4 - イルプロピル ) - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- 7 - ニトロ - N - ( 3 - ピリジン - 3 - イルプロピル ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- 7 - ニトロ - N - ( 2 - チエン - 2 - イルエチル ) - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;  
- N - [ 2 - ( 5 - クロロ - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) エチル ] -

7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;

- N - [ 3 - ( 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 5 - イル ) プロピル ] - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;

- N - [ 2 - ( 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル ) エチル ] - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;

- N - [ 2 - ( 4 - エチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) エチル ] - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド ;

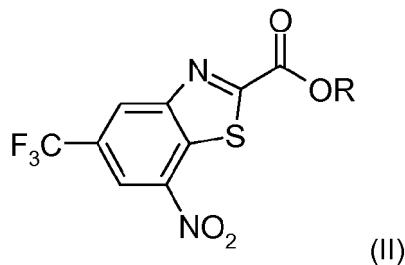
- N - [ 2 - ( 4 , 5 - ジメチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) エチル ] - 7 - ニトロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - カルボキサミド

に対応することを特徴とする、化合物。

【請求項 4】

式 ( II ) の化合物

【化 2】



[式中、Rは(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルを表す。]

を、式 ( III ) のアミン :

【化 3】



[式中、R<sub>1</sub>は式 ( I ) の化合物に関して定義されたとおりである。]

と反応することを特徴とする、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の式 ( I ) の化合物の調製方法。

【請求項 5】

塩基の形態または酸もしくは塩基の付加塩の形態の、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の式 ( I ) の化合物を含むことを特徴とする医薬品。

【請求項 6】

塩基の形態または酸もしくは塩基の付加塩の形態の、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の式 ( I ) の化合物および少なくとも 1 種の医薬として許容される賦形剤を含むことを特徴とする医薬組成物。

【請求項 7】

結核の治療および / または予防用の狭域抗生物質医薬品を調製するための、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の式 ( I ) の化合物。

【請求項 8】

抗生物質が、結核の治療および / または予防用の抗菌作用を有することを特徴とする、請求項 7 に記載の式 ( I ) の化合物。

【請求項 9】

抗生物質が、M. タブエルクローシス (M. tuberculosis) に対する抗菌作用を有することを特徴とする、請求項 8 に記載の式 ( I ) の化合物。