

【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 17 年 12 月 22 日 (2005.12.22)

【公表番号】特表 2004-531580 (P2004-531580A)

【公表日】平成 16 年 10 月 14 日 (2004.10.14)

【年通号数】公開・登録公報 2004-040

【出願番号】特願 2003-508705 (P2003-508705)

【国際特許分類第 7 版】

C 07 C 259/06

A 61 K 31/165

A 61 P 11/00

A 61 P 31/04

【F I】

C 07 C 259/06

A 61 K 31/165

A 61 P 11/00

A 61 P 31/04

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 3 月 9 日 (2005.3.9)

【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

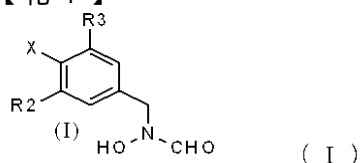
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



[式中、

X は、 $-C(O)OC_{1-3}$ アルキル、 $-OR_1$ 、 $-NR_1R_6$ 、 $-C(O)NR_1R_6$ 、または $-C(O)R_6$ からなる群から選択され；

R₁ は、水素、非置換であるかまたはアルコール、エーテル、アミン、アミド、カルボン酸、ラクタムからなる群から選択される 1 個またはそれ以上の基によって置換されている C_{1-6} アルキル、Ar、 $-C_{1-2}$ アルキル Ar、窒素上にて R₇ で置換されている C_{0-2} アルキルピペリジン - 4 - イル、および窒素上にて R₇ で置換されている C_{0-2} アルキルピロリジン - 3 - イル、または C_{0-2} モルホリンからなる群から選択され；

R₆ は、水素、非置換であるかまたはハライド、アルコール、エーテル、アミンおよびアミドからなる群から選択される 1 個またはそれ以上の基によって置換されている C_{1-6} アルキルからなる群から選択されるか；または

R₁ および R₆ は一緒になって O または置換されていてもよい N を含有していてもよい 5 または 6 員環系を構成してもよく；

Ar は、フェニル、フリル、ピリジル、チエニル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラ

ゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、イミダゾリル、ベンゾフラニル、インドリル、チアゾリジニル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピロリル、およびピリミジル（これらは全て、非置換であっても、または1個またはそれ以上のR4またはR5基によって置換されていてもよい）からなる群から選択され；

R2は、I、Br、Cl、イソプロピルおよびtert-ブチルからなる群から選択され；

R3は、H、I、Br、Cl、イソプロピル、tert-ブチルおよびZ-R8からなる群から選択され；

Zは、O、N、-NC(O)、-C(O)N、-SO₂N、-CONHSO₂、-CONHNHCOおよび-CH₂からなる群から選択され；

R4およびR5は、独立して、水素、-OR9、-CN、F、Cl、Br、I、-CO₂H、-C(O)NR1R6、-NR6COR6、-NH₂、および非置換であっても、または1個またはそれ以上のアルコール、アミン、アミドまたはカルボン酸基によって置換されていてもよいC₁₋₄アルキルからなる群から選択され；

R9は、H、-CH₃または-CF₃であり；

R7は、水素、-C₁₋₄アシルおよび-C₁₋₄アルコキシカルボニルからなる群から選択され；

R8は、非置換であっても、または1個またはそれ以上のアルコール、アミン、アミド、カルボン酸、アリールまたはカルボサイクルによって置換されていてもよいC₁₋₄アルキルからなる群から選択される]

で示される化合物。

【請求項2】

以下の化合物からなる群から選択される化合物：

N-ヒドロキシ-N-(4-メトキシ-3,5-ジメチルベンジル)ホルムアミド；

N-(3,5-ジイソプロピル-4-メトキシベンジル)-N-ヒドロキシホルムアミド

；

2,6-ジクロロ-4-(N-ホルミル-N-ヒドロキシアミノメチル)安息香酸メチル

；

N-[3,5-ジクロロベンジル]-N-ヒドロキシホルムアミド；

N-[3,5-ジクロロ-4-メトキシベンジル]-N-ヒドロキシホルムアミド；

N-ヒドロキシ-N-(4-アミノ-3,5-ジクロロベンジル)ホルムアミド；

N-[3,5-ジクロロ-4-(2-チオフェン-2-イルエトキシ)ベンジル]-N-ヒドロキシホルムアミド；

N-[3,5-ジクロロ-4-(2-ヒドロキシアミノエトキシ)ベンジル]-N-ヒドロキシホルムアミド；

N-[3,5-ジクロロ-4-(ピリジン-4-イルメトキシ)-ベンジル]-N-ヒドロキシホルムアミド；

N-[3,5-ジクロロ-4-((S)-1-メチル-2,5-ジオキソ-ピロリジン-3-イルオキシ)-ベンジル]-N-ヒドロキシホルムアミド；

2-ブトキシ-3-クロロ-N-(2,3-ジヒドロキシプロピル)-5-[(ホルミルヒドロキシアミノ)メチル]-ベンズアミド；

N-{3,5-ジクロロ-4-[2-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-エトキシ]}-N-ヒドロキシホルムアミド；

2-ブトキシ-3-クロロ-5-[(ホルミル-ヒドロキシ-アミノ)-メチル]-安息香酸メチルエステル；

N-[3,5-ジクロロ-4-(1-エチル-ブトキシ)-ベンジル]-N-ヒドロキシホルムアミド；

N-ヒドロキシ-N-(3-ヨード-5-メトキシ-4-フェノキシベンジル)-ホルムアミド；

N-(4-ブトキシ-3-ヨード-5-メトキシベンジル)-N-ヒドロキシホルムアミド；

N - (4 - シクロヘキシルオキシ - 3, 5 - ジクロロ - ベンジル) - N - ヒドロキシ - ホルムアミド ;

N - (2 - アセチルアミノエチル) - 2 - ブトキシ - 3 - クロロ - 5 - [(ホルミルヒドロキシアミノ)メチル]ベンズアミド ;

N - (4 - ブトキシ - 3 - クロロ - 5 - ヒドロキシ - ベンジル) - N - ヒドロキシ - ホルムアミド ;

N - ヒドロキシ - N - [3 - ヨード - 5 - メトキシ - 4 - (2 - メトキシ - エトキシ) - ベンジル] - ホルムアミド ;

N - [3 - クロロ - 4 - (3, 4 - ジクロロ - フェノキシ) - 5 - メトキシ - ベンジル] - N - ヒドロキシ - ホルムアミド ;

N - [4 - ブトキシ - 2, 3 - ジクロロ - 5 - メトキシ - ベンジル] - N - ヒドロキシ - ホルムアミド ;

N - {2 - ブトキシ - 5 - [(ホルミル - ヒドロキシ - アミノ) - メチル] - 3 - ヨード - フェニル} - アセトアミド ;

2 - {2 - ブトキシ - 5 - [(ホルミル - ヒドロキシ - アミノ) - メチル] - 3 - ヨード - フェノキシ} - N - メチル - アセトアミド ; および

N - (3 - クロロ - 5 - メトキシ - 4 - フェノキシベンジル) - N - ヒドロキシホルムアミド。

【請求項 3】

以下の化合物からなる群から選択される化合物 :

N - ヒドロキシ - N - [4 - (4 - ヒドロキシフェノキシ) - 3, 5 - ジヨードベンジル]ホルムアミド ;

N - [3, 5 - ジクロロ - 4 - (4 - メトキシフェノキシ)ベンジル] - N - ヒドロキシホルムアミド ;

N - (4 - ブトキシ - 3, 5 - ジクロロベンジル) - N - ヒドロキシホルムアミド ;

N - (3 - クロロ - 5 - メトキシ - 4 - フェノキシベンジル) - N - ヒドロキシホルムアミド ;

N - (4 - ブトキシ - 3 - クロロ - 5 - メトキシベンジル) - N - ヒドロキシ - ホルムアミド ;

2 - {2 - ブトキシ - 3 - クロロ - 5 - [(ホルミルヒドロキシアミノ)メチル]フェノキシ} - N - メチルアセトアミド ; および

N - (4 - ブトキシ - 3 - ヨード - 5 - メチルアミノ - ベンジル) - N - ヒドロキシ - ホルムアミド。

【請求項 4】

請求項 1 記載の化合物および適当な医薬担体を含む、細菌感染治療に用いるための医薬組成物。

【請求項 5】

N - ヒドロキシ - N - (4 - メトキシ - 3, 5 - ジメチルベンジル)ホルムアミド ;

N - (3, 5 - ジイソプロピル - 4 - メトキシベンジル) - N - ヒドロキシホルムアミド ;

2, 6 - ジクロロ - 4 - (N - ホルミル - N - ヒドロキシアミノメチル)安息香酸メチル ;

N - [3, 5 - ジクロロベンジル] - N - ヒドロキシホルムアミド ;

N - [3, 5 - ジクロロ - 4 - メトキシベンジル] - N - ヒドロキシホルムアミド ;

N - ヒドロキシ - N - (4 - アミノ - 3, 5 - ジクロロベンジル)ホルムアミド ;

N - [3, 5 - ジクロロ - 4 - (2 - チオフェン - 2 - イルエトキシ)ベンジル] - N - ヒドロキシホルムアミド ;

N - [3, 5 - ジクロロ - 4 - (2 - ヒドロキシアミノ)ベンジル] - N - ヒドロキシホルムアミド ; および

N - (3 - クロロ - 5 - メトキシ - 4 - フェノキシベンジル) - N - ヒドロキシホルムアミド ;

ミド

からなる群から選択される化合物を含む、細菌感染治療に用いるための医薬組成物。

【請求項 6】

細菌感染が気道感染およびグラム陽性 T P P からなる群から選択されるものである、請求項 5 記載の医薬組成物。