

【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19年5月24日(2007.5.24)

【公表番号】特表2002-540197(P2002-540197A)

【公表日】平成14年11月26日(2002.11.26)

【出願番号】特願2000-607997(P2000-607997)

【国際特許分類】

C 0 7 D 211/76 (2006.01)

A 6 1 K 31/385 (2006.01)

A 6 1 K 31/395 (2006.01)

A 6 1 K 31/45 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

A 6 1 K 31/554 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 223/12 (2006.01)

C 0 7 D 225/02 (2006.01)

C 0 7 D 243/08 (2006.01)

C 0 7 D 245/02 (2006.01)

C 0 7 D 281/06 (2006.01)

C 0 7 D 327/02 (2006.01)

C 0 7 D 513/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 211/76

A 6 1 K 31/385

A 6 1 K 31/395

A 6 1 K 31/45

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 31/551

A 6 1 K 31/554

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 223/12 C

C 0 7 D 225/02

C 0 7 D 243/08 5 0 8

C 0 7 D 245/02

C 0 7 D 281/06

C 0 7 D 327/02

C 0 7 D 513/04 3 9 1

【手続補正書】

【提出日】平成19年3月23日(2007.3.23)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

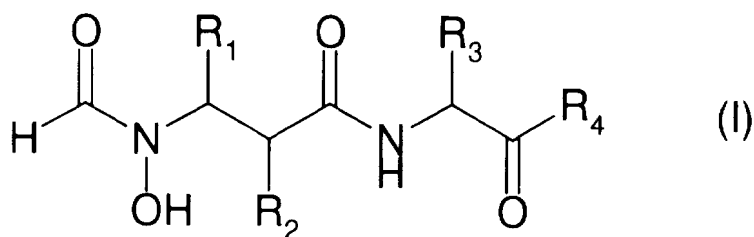
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 式 (I) :

【化 1】



[式中、

R_1 は、水素、メチルまたはトリフルオロメチルを示し；

R_2 は、基 $R_{10} - (X)_n - (ALK) -$ を示し、ここで、

R_{10} は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロシクリル基を示し、そのいずれも非置換であるか、または $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、ヒドロキシ、メルカプト、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ、アミノ、ハロ（フッ素、塩素、臭素及びヨウ素含む）、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COOR^A$ 、 $-NHCOR^A$ 、 $-CONHR^A$ 、 $-NHR^A$ 、 $-NR^A R^B$ または $-CONR^A R^B$ [ここで、 R^A および R^B は、独立して $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基である] で置換されていてもよく、かつ

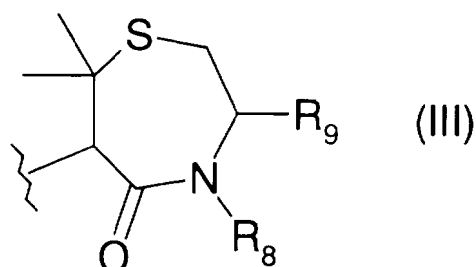
ALK は、直鎖状または分岐状の二価の $C_1 \sim C_6$ アルキレン、 $C_2 \sim C_6$ アルケニレン、 $C_2 \sim C_6$ アルキニレン基を示し、1 以上の隣合っていない $-NH-$ 、 $-O-$ または $-S-$ 連結を介在してもよく、

X は、 $-NH-$ 、 $-O-$ または $-S-$ を示し、かつ

n は、0 または 1 であり；かつ

R_3 および R_4 は、それらがそれぞれ結合した炭素原子と共に、 $(i) (C_1 \sim C_6)$ アルキル、ベンジル、 $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、フェノキシ、ヒドロキシ、メルカプト、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルチオ、アミノ、ハロ（フッ素、塩素、臭素及びヨウ素含む）、トリフルオロメチル、ニトロ、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COR^A$ 、 $-COOR^A$ 、 $-NHCOR^A$ 、 $-CONHR^A$ 、 $-NHR^A$ 、 $-NR^A R^B$ または $-CONR^A R^B$ [ここで、 R^A および R^B は、独立して $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基である] から独立して選択される 4 つまでの置換基で任意に置換されていてもよい、5 ~ 8 の原子の飽和の炭素環式もしくはヘテロシクリル環を形成するか、または (ii) 式 (III) :

【化 2】



[式中、 R_8 は水素または $C_1 \sim C_4$ アルキル、シクロアルキル、フェニルもしくはベンジル基であり、 R_9 は水素または $C_1 \sim C_4$ アルキル、フェニルもしくはベンジル基であり、または R_8 および R_9 は一緒になって二価の $-(CH_2)_p-$ [ここで、 p は 3 または 4 である] を表わす] の環を形成する]

の化合物または医薬的もしくは獣医学的に許容されるその塩、水和物あるいは溶媒和物を含む、ヒトおよびヒトでない哺乳動物での細菌感染の治療用医薬組成物。

【請求項 2】 R_1 が水素である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】 R_2 が、

$C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ アルケニルもしくは $C_3 \sim C_6$ アルキニル；

フェニル環に任意に置換された、フェニル ($C_1 \sim C_6$ アルキル) -、フェニル ($C_3 \sim C_6$ アルケニル) - もしくはフェニル ($C_3 \sim C_6$ アルキニル) -；

シクロアルキル環に任意に置換された、シクロアルキル ($C_1 \sim C_6$ アルキル) -、シクロアルキル ($C_3 \sim C_6$ アルケニル) - もしくはシクロアルキル ($C_3 \sim C_6$ アルキニル) -；

ヘテロシクリル環に任意に置換された、ヘテロシクリル ($C_1 \sim C_6$ アルキル) -、ヘテロシクリル ($C_3 \sim C_6$ アルケニル) - もしくはヘテロシクリル ($C_3 \sim C_6$ アルキニル) -；

または

末端のフェニルもしくはヘテロアリール環に任意に置換された、4 - フェニルフェニル ($C_1 \sim C_6$ アルキル) -、4 - フェニルフェニル ($C_3 \sim C_6$ アルケニル) -、4 - フェニルフェニル ($C_3 \sim C_6$ アルキニル) -、4 - ヘテロアリールフェニル ($C_1 \sim C_6$ アルキル) -、4 - ヘテロアリールフェニル ($C_3 \sim C_6$ アルケニル) -、4 - ヘテロアリールフェニル ($C_3 \sim C_6$ アルキニル) -

である請求項 1 または 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】 R_2 が、メチル、エチル、 n - およびイソ - プロピル、 n - およびイソ - ブチル、 n - ペンチル、イソ - ペンチル 3 - メチル - ブタ - 1 - イル、 n - ヘキシル、 n - ヘプチル、 n - アセチル、 n - オクチル、メチルスルファニルエチル、エチルスルファニルメチル、2 - メトキシエチル、2 - エトキシエチル、2 - エトキシメチル、3 - ヒドロキシプロピル、アリル、3 - フェニルプロプ - 3 - エン - 1 - イル、プロプ - 2 - イン - 1 - イル、3 - フェニルプロプ - 2 - イン - 1 - イル、3 - (2 - クロロフェニル) プロプ - 2 - イン - 1 - イル、ブタ - 2 - イン - 1 - イル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロペンチルメチル、シクロペンチルエチル、シクロペンチルプロピル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルプロピル、フラン - 2 - イルメチル、フラン - 3 - メチル、テトラヒドロフラン - 2 - イルメチル、テトラヒドロフラン - 2 - イルメチル、ピペリジニルメチル、フェニルプロピル、4 - クロロフェニルプロピル、4 - メチルフェニルプロピル、4 - メトキシフェニルプロピル、ベンジル、4 - クロロベンジル、4 - メチルベンジルまたは 4 - メトキシベンジルである請求項 1 または 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】 R_2 が、 n - プロピル、 n - ブチル、 n - ペンチル、ベンジルまたはシクロペンチルメチルである請求項 1 または 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】 R_3 と R_4 により形成される環が式 (I I I) [ここで、 R_8 は、水素、メチル、エチル、 n - プロピル、シクロペンチル、フェニルまたはベンジルであり、 R_9 は、水素、イソブチル、フェニルまたはベンジルである] である、請求項 1 に記載の医薬組成物。