

【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25年9月12日(2013.9.12)

【公表番号】特表2013-500996(P2013-500996A)

【公表日】平成25年1月10日(2013.1.10)

【年通号数】公開・登録公報2013-002

【出願番号】特願2012-523087(P2012-523087)

【国際特許分類】

C 0 7 D 498/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/5365 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 498/04 1 1 2 Q

C 0 7 D 498/04 C S P

A 6 1 P 31/06

A 6 1 K 31/5365

【手続補正書】

【提出日】平成25年7月30日(2013.7.30)

【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

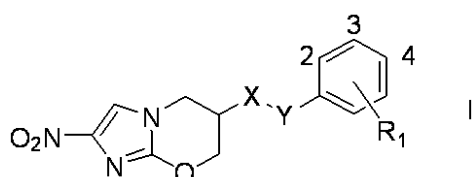
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I :

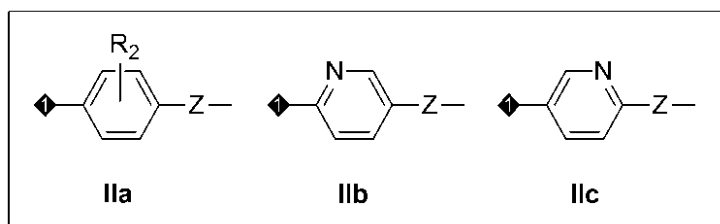
【化1】



{ 式中、XはO、OCH₂、OCH₂CH=CHまたはOCH₂C Cであり；

Yは式IIa - IIcのいずれか1；

【化2】



[式中、「黒塗り四角形中の1」はXへの結合であり、式IIaは置換基としてR₂を有する環を含み、および

式IIa - IIc中のZはCH₂、CH=CH、C Cまたは直接結合である]であり；

数字2、3および4は置換基としてR₁を有する末端の環上の環位置であり、

式Iの末端の環は各環位置にC、CHまたはアザを含み、および

式IおよびIIa中の R_1 および R_2 は、各々、いずれかの利用可能な環位置に位置する1、2または3の置換基であり、それらは、独立して、H、F、Cl、 CF_3 、 OCF_2H 、 OCF_3 またはそれらの組合せである}

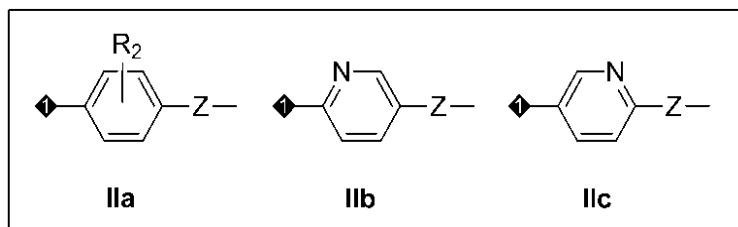
の一般構造を有する化合物。

【請求項2】

XはO、 OCH_2 、 $OCH_2CH=CH$ または OCH_2C Cであり；

Yは式IIa - IIcのいずれか1：

【化3】



[式中、「黒塗り四角形中の1」はXへの結合であり、式IIaは置換基として R_2 を有する環を含み、および

式IIa - IIc中のZは CH_2 、 $CH=CH$ 、C Cまたは直接結合である] であり、

数字2、3および4は置換基として R_1 を有する末端の環上の環位置であり、

式Iの末端の環は、各環位置にCまたはCHを含み、または2 - 位にアザを含みかつ残りの各環位置にCまたはCHを含み、または3 - 位にアザを含みかつ残りの各環位置にCまたはCHを含み、

式I中の R_1 は環位置4に位置するF、環位置4に位置する OCF_3 、環位置2に位置するCl、環位置3に位置するCl、環位置3に位置するF、環位置4に位置する CF_3 、またはそれらの組合せのうちのいずれか1またはそれを超えるものであり、および

式IIa中の R_2 はいずれかの利用可能な位置のHまたはFのいずれか1または2である、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

治療上有効な量の請求項1記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項4】

さらに、医薬上許容し得る賦形剤、補助剤、不活性成分、緩衝剤または安定剤を含む請求項3記載の医薬組成物。

【請求項5】

さらに、1またはそれを超えるさらなる抗 - 感染症治療剤を含む請求項3記載の医薬組成物。

【請求項6】

請求項3記載の医薬組成物を投与することを含む微生物感染症を予防および治療する方法。

【請求項7】

微生物感染症がマイコバクテリウム・チューベルクロシス (Mycobacterium tuberculosis) によって引き起こされる請求項6記載の方法。

【請求項8】

A. (6S) - 6 - { [2' - クロロ - 4' - (トリフルオロメトキシ) [1,1' - ビフェニル] - 4 - イル] メトキシ } - 2 - ニトロ - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ [2,1 - b] [1,3] オキサジン；

B. (6S) - 6 - { [3' - フルオロ - 4' - (トリフルオロメトキシ) [1,1' - ビフェニル] - 4 - イル] メトキシ } - 2 - ニトロ - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ [2,1 - b] [1,3] オキサジン；

C. (6S) - 2 - ニトロ - 6 - { [4' - (トリフルオロメトキシ) [1,1' - ビフェニル] - 4 - イル] メトキシ } - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ [2,1 - b] [1,3] オキサジン；

D. (6S) - 2 - ニトロ - 6 - ({4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジニル]ベンジル}オキシ) - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

E. (6S) - 2 - ニトロ - 6 - ({4 - [6 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジニル]ベンジル}オキシ) - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

F. (6S) - 6 - {[3 - フルオロ - 4' - (トリフルオロメトキシ)[1,1' - ビフェニル] - 4 - イル]メトキシ} - 2 - ニトロ - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

G. (6S) - 2 - ニトロ - 6 - {[4' - (トリフルオロメトキシ)[1,1' - ビフェニル] - 4 - イル}オキシ} - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

H. (6S) - 6 - ({2 - フルオロ - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジニル]ベンジル}オキシ) - 2 - ニトロ - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

I. (6S) - 6 - {[2 - フルオロ - 4' - (トリフルオロメトキシ)[1,1' - ビフェニル] - 4 - イル]メトキシ} - 2 - ニトロ - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

J. (6S) - 2 - ニトロ - 6 - ({4 - [4 - (トリフルオロメトキシ)ベンジル]ベンジル}オキシ) - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

K. (6S) - 2 - ニトロ - 6 - ({(2E) - 3 - [4' - (トリフルオロメトキシ)[1,1' - ビフェニル] - 4 - イル] - 2 - プロペニル}オキシ) - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

L. (6S) - 6 - ({2 - フルオロ - 4 - [6 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジニル]ベンジル}オキシ) - 2 - ニトロ - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

M. (6S) - 6 - {[4 - (5 - フルオロ - 2 - ピリジニル)ベンジル]オキシ} - 2 - ニトロ - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

N. (6S) - 2 - ニトロ - 6 - ({3 - [4' - (トリフルオロメトキシ)[1,1' - ビフェニル] - 4 - イル] - 2 - プロピニル}オキシ) - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

O. (6S) - 2 - ニトロ - 6 - [(4 - {(E) - 2 - [4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル]エチニル}ベンジル)オキシ] - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

P. (6S) - 2 - ニトロ - 6 - [(4 - {[4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル]エチニル}ベンジル)オキシ] - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;および
それらの混合物、光学または幾何学異性体、薬理学的に許容し得る塩誘導体およびプロドラッグ。

【請求項 9】

A. (6S) - 6 - {[6 - (4 - フルオロフェニル) - 3 - ピリジニル]メトキシ} - 2 - ニトロ - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

B. (6S) - 2 - ニトロ - 6 - ({6 - [4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル] - 3 - ピリジニル}メトキシ) - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

C. (6S) - 2 - ニトロ - 6 - ({5 - [4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル] - 2 - ピリジニル}メトキシ) - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

D. (6S) - 2 - ニトロ - 6 - [(5 - {[4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル]エチニル} - 2 - ピリジニル)メトキシ] - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

E. (6S) - 6 - ({6 - [3 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル] - 3 - ピリジニル}メトキシ) - 2 - ニトロ - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

F. (6S) - 6 - ({5 - [3 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル] - 2 - ピリジニル}メトキシ) - 2 - ニトロ - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

G. (6S) - 2 - ニトロ - 6 - [(5 - {[6 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジニル]エチニル} - 2 - ピリジニル)メトキシ] - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

H. (6S) - 6 - ({6 - [3 - クロロ - 4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル] - 3 - ピリジニル}メトキシ) - 2 - ニトロ - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;

I. (6S) - 2 - ニトロ - 6 - [(6 - {[4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル]エチニル} - 3 - ピリジニル)メトキシ] - 6,7 - ジヒドロ - 5H - イミダゾ[2,1-b][1,3]オキサジン;および
それらの混合物、光学または幾何学異性体、薬理学的に許容し得る塩誘導体およびプロドラッグ。