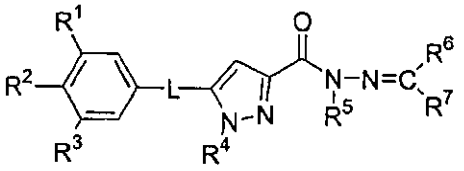
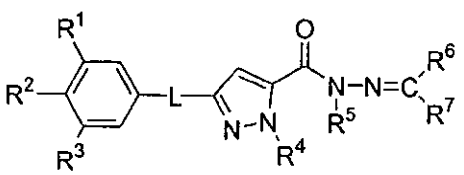
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成19年9月13日(2007.9.13)

【公表番号】特表2006-508178(P2006-508178A)
【公表日】平成18年3月9日(2006.3.9)
【年通号数】公開・登録公報2006-010
【出願番号】特願2004-571158(P2004-571158)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ　31/415　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　 9/12　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/4155　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　45/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　31/04　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 231/14　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 403/12　(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ　31/415
Ａ６１Ｋ　 9/12
Ａ６１Ｋ　31/4155
Ａ６１Ｋ　45/00
Ａ６１Ｐ　31/04
Ｃ０７Ｄ 231/14
Ｃ０７Ｄ 403/12

【手続補正書】
【提出日】平成19年7月24日(2007.7.24)
【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】
細菌感染を治療又は予防するための医薬組成物であって、
以下の式1aまたは1bの構造を有する化合物、そのエナンチオマーもしくはジアステレオマー、またはその薬学的に許容される塩を含む前記組成物。
【化１】



1a



1b

［上記各式中、
R^1、R^2およびR^3は、それぞれ独立して、水素（Ｈ）、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、ハロ、アミノ、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、置換または非置換アルキルアミノ、置換または非置換アルキルアミノアルキル、置換または非置換アルコキシ、置換または非置換アルコキ

シアルキル、置換または非置換アルキルチオ、置換または非置換アルキルチオアルキル、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、置換または非置換カルボシクリル、置換または非置換カルボシクリルアルキル、置換または非置換カルボシクリルオキシ、置換または非置換カルボシクリルオキシアルキル、置換または非置換カルボシクリルアミノ、置換または非置換カルボシクリルアミノアルキル、置換または非置換ヘテロシクリル、置換または非置換ヘテロシクリルアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルオキシ、置換または非置換ヘテロシクリルオキシアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルアミノ、および置換または非置換ヘテロシクリルアミノアルキルからなる群より選択され、

R^4およびR^5は、独立して、H、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、および置換または非置換シクロアルキルからなる群より選択されるが、ここで、R^4がHである場合は、構造1aおよび1bで表される2つの互変異性体として存在することができ、

R^6およびR^7は、独立して、H、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、置換または非置換シクロアルキル、置換または非置換アリール、置換または非置換アリールアルキル、置換または非置換アルキルアリール、置換または非置換ヘテロアリールであるか、あるいは、R^6およびR^7は、置換または非置換の炭素、窒素または硫黄からなる群より選択される環原子を有する、単環または縮合環系からなる、芳香族または非芳香族の、複素環式もしくは炭素環式環または環系の部分を構成する原子であり、

Lは、存在しないか、あるいは、連続した直鎖状の結合で1～6個の原子を有するリンカーからなる群より選択される。]

【請求項２】

R^1、R^2およびR^3が、それぞれ独立して、水素（H）、置換または非置換C_{1-6}アルキル、置換または非置換C_{2-6}アルケニル、置換または非置換C_{2-6}アルキニル、ハロ、アミノ、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、置換または非置換C_{1-6}アルキルアミノ、置換または非置換C_{1-6}アルキルアミノアルキル、置換または非置換C_{1-6}アルコキシ、置換または非置換C_{1-6}アルコキシアルキル、置換または非置換C_{1-6}アルキルチオ、置換または非置換C_{1-6}アルキルチオアルキル、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、置換または非置換C_{3-12}カルボシクリル、置換または非置換C_{3-12}カルボシクリルアルキル、置換または非置換C_{3-12}カルボシクリルオキシ、置換または非置換C_{3-12}カルボシクリルオキシアルキル、置換または非置換C_{3-12}カルボシクリルアミノ、置換または非置換C_{3-12}カルボシクリルアミノアルキル、置換または非置換の3～12員ヘテロシクリル、置換または非置換の3～12員ヘテロシクリル-C_{1-6}アルキル、置換または非置換の3～12員ヘテロシクリルオキシ、置換または非置換の3～12員ヘテロシクリルオキシ-C_{1-6}アルキル、置換または非置換の3～12員ヘテロシクリルアミノ、および置換または非置換の3～12員ヘテロシクリルアミノ-C_{1-6}アルキルからなる群より選択され、

R^4およびR^5が、独立して、H、置換または非置換C_{1-6}アルキル、置換または非置換C_{2-6}アルケニル、置換または非置換C_{2-6}アルキニル、および置換または非置換C_{3-8}シクロアルキルからなる群より選択されるが、ここで、R^4がHである場合は、構造1aおよび1bで表される2つの互変異性体として存在することができ、

R^6およびR^7が、独立して、H、置換または非置換C_{1-6}アルキル、置換または非置換C_{2-6}アルケニル、置換または非置換C_{2-6}アルキニル、置換または非置換C_{3-12}シクロアルキル、置換または非置換アリール、置換または非置換アリールアルキル、置換または非置換C_{1-6}アルキルアリール、置換または非置換C_{4-12}ヘテロアリールであるか、あるいは、R^6およびR^7が、置換または非置換の炭素、窒素または硫黄からなる群より選択される環原子を有する、3～6員単環または6～12員縮合環系からなる、芳香族または非芳香族の、複素環式もしくは炭素環式環または環系の部分を構成する原子であり、

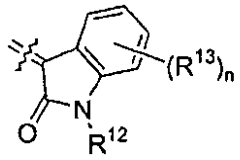
Lが、存在しないか、あるいは、連続した直鎖状の結合で1～6個の原子を有するリンカーからなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項３】

R^4およびR^5が、独立して、H、置換または非置換C_{1-6}アルキル、および置換または非置換C_{3-8}シクロアルキルからなる群より選択されるが、ここで、R^4がHである場合は、構造1aおよび1bで表される2つの互変異性体として存在することができ、

R^6およびR^7が、独立して、H、置換または非置換C_{1-6}アルキル、置換または非置換C_{2-6}アルケニル、置換または非置換C_{2-6}アルキニル、置換または非置換C_{3-12}シクロアルキル、置換または非置換アリール、置換または非置換アリールアルキル、置換または非置換C_{1-6}アルキルアリール、置換または非置換C_{4-12}ヘテロアリールであるか、あるいは、R^6およびR^7が、以下の構造：

【化２】



（ここで、R^{12}は、H、置換または非置換C_{1-6}アルキル、置換または非置換C_{2-6}アルケニル、置換または非置換C_{2-6}アルキニル、および置換または非置換C_{3-8}シクロアルキルからなる群より選択され、

各R^{13}は、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、ハロ、アミノ、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、置換または非置換アルキルアミノ、置換または非置換アルキルアミノアルキル、置換または非置換アルコキシ、置換または非置換アルコキシアルキル、置換または非置換アルキルチオ、置換または非置換アルキルチオアルキル、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、置換または非置換カルボシクリル、置換または非置換カルボシクリルアルキル、置換または非置換カルボシクリルアキシ、置換または非置換カルボシクリルアキシアルキル、置換または非置換カルボシクリルアミノ、置換または非置換カルボシクリルアミノアルキル、置換または非置換ヘテロシクリル、置換または非置換ヘテロシクリルアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルオキシ、置換または非置換ヘテロシクリルオキシアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルアミノ、および置換または非置換ヘテロシクリルアミノアルキルからなる群より選択され、

nは、0、1、2、3、および4から選択される整数である）

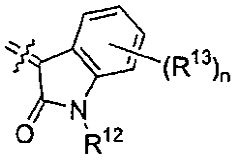
を有する環系の部分を構成する原子であり、

Lが、存在しないか、あるいは、連続した直鎖状の結合で1～3個の原子を有するリンカーからなる群より選択される、請求項2に記載の組成物。

【請求項４】

R^4、R^5およびR^6がHであり、かつR^7が1個以上のC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、ハロ、アミノ、またはヒドロキシで置換されていてもよいフェニルであるか、あるいは、R^6およびR^7が、以下の構造：

【化３】

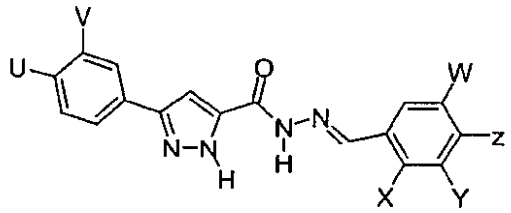


（ここで、R^{12}は、H、置換または非置換C_{1-6}アルキル、および置換または非置換C_{3-8}シクロアルキルからなる群より選択され、

各R^{13}は、置換または非置換C_{1-6}アルキル、置換または非置換C_{2-6}アルケニル、置換または非置換C_{2-6}アルキニル、ハロ、アミノ、置換または非置換C_{1-6}アシル、置換または非置換アリール、置換または非置換C_{1-6}アルコキシ、置換または非置換C_{1-6}アルコキシアルキル、ニトロ、ヒドロキシル、およびシアノからなる群より選択され、

nは、0、1、および2から選択される整数である）

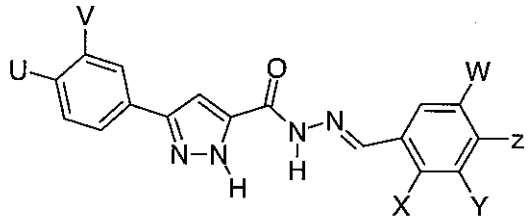
を有する環系の部分を構成する原子であり、
Lが存在しない、請求項3に記載の組成物。
【請求項５】
前記化合物が式2の構造：
【化４】



2

［式中、U、V、W、X、YおよびZは、同一でも異なっていてもよく、それぞれ独立して、H、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、ハロ、アミノ、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、置換または非置換アルキルアミノ、置換または非置換アルキルアミノアルキル、置換または非置換アルコキシ、置換または非置換アルコキシアルキル、置換または非置換アルキルチオ、置換または非置換アルキルチオアルキル、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、置換または非置換カルボシクリル、置換または非置換カルボシクリルアルキル、置換または非置換カルボシクリルオキシ、置換または非置換カルボシクリルオキシアルキル、置換または非置換カルボシクリルアミノ、置換または非置換カルボシクリルアミノアルキル、置換または非置換ヘテロシクリル、置換または非置換ヘテロシクリルアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルオキシ、置換または非置換ヘテロシクリルオキシアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルアミノ、および置換または非置換ヘテロシクリルアミノアルキルからなる群より選択される］
を有する化合物、そのエナンチオマーもしくはジアステレオマー、またはその薬学的に許容される塩である、請求項1に記載の組成物。
【請求項６】
U、V、W、X、YおよびZが、それぞれ独立して、H、C_{1-4}アルキル、C_{3-6}シクロアルキル、C_{1-4}アルコキシ、ハロ、ヒドロキシル、およびアミノからなる群より選択される、請求項5に記載の組成物。
【請求項７】
前記化合物が以下の式2および表により示される構造を有する化合物1～19からなる群より選択される、請求項5に記載の組成物。

【化５】



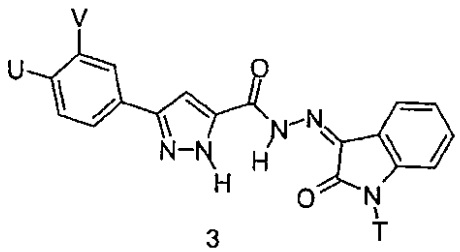
2

化合物番号	U	V	W	X	Y	Z
1	H	H	OCH_3	H	OCH_3	OCH_3
2	H	OCH_3	H	H	OCH_3	OCH_3
3	H	OCH_3	H	H	OCH_2CH_3	OH
4	H	H	H	OH	H	OH
5	H	H	H	H	OCH_3	OH
6	H	H	Br	OH	H	H
7	H	OCH_2CH_3	H	OH	OCH_3	H
8	CH_3	H	H	OH	OCH_3	H
9	H	H	H	OH	H	H
10	H	OCH_3	H	H	OH	H
11	H	H	H	H	H	CH_3
12	H	H	C_4H_9	H	C_4H_9	OH
13	OCH_3	H	H	H	H	H
14	H	OCH_3	H	H	H	OH
15	Cl	H	H	H	OCH_3	OCH_3
16	OCH_3	H	H	H	H	OH
17	OCH_3	H	OCH_3	H	OCH_3	OCH_3
18	OCH_3	H	H	H	OCH_3	OCH_3
19	OC_2H_5	H	H	H	OCH_3	OH

【請求項８】

前記化合物が式3の構造：

【化６】



3

［式中、UおよびVは、同一でも異なっていてもよく、それぞれ独立して、H、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、ハロ、アミノ、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、置換または非置換アルキルアミノ、置換または非置換アルキルアミノアルキル、置換または非置換アルコキシ、置換または非置換アルコキシアルキル、置換または非置換アルキルチオ、置換または非置換アルキルチオアルキル、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、置換または非置換カルボシクリル、置換または非置換カルボシクリルアルキル、置換または非置換カルボシクリルオキシ、置換または非置換カルボシクリルオキシアルキル、置換または非置換カルボシクリルアミノ、置換または非置換カルボシクリルアミノアルキル、置換または非置換ヘテロシクリル、置換または非置換ヘテロシクリルアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルオキシ、置換または非置換ヘテロシクリルオキシアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルアミノ、および置換または非置換ヘテロシクリルアミノアルキルからなる群より選択され、

Tは、H、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、および置換または非置換シクロアルキルからなる群より選択される］

を有する、請求項1に記載の組成物。

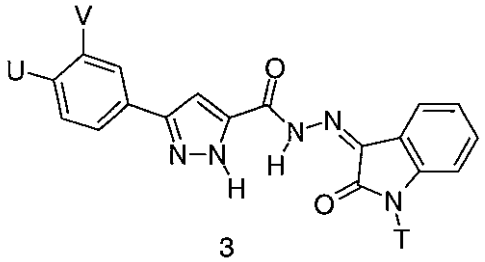
【請求項９】

UおよびVが、それぞれ独立して、H、C_{1-4}アルキル、C_{1-4}アルコキシ、およびアリールからなる群より選択され、TがHおよびC_{1-4}アルキルからなる群より選択される、請求項8に記載の組成物。

【請求項１０】

前記化合物が以下の式3および表により示される構造を有する化合物20および21からなる群より選択される、請求項8に記載の組成物。

【化７】



3

化合物番号	T	U	V
20	C_2H_5	H	H
21	C_2H_5	H	C_6H_5

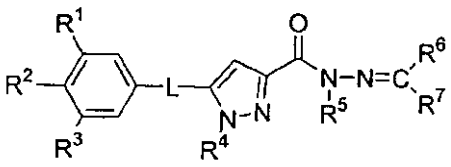
【請求項１１】

製薬上許容される担体をさらに含む、請求項1～10のいずれか1項に記載の組成物。

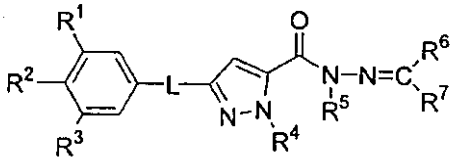
【請求項１２】

別の抗生物質、抗ウイルス化合物、抗癌化合物、ビタミン、微量金属サプリメント、イオン、およびこれらの組合せからなる群より選択される追加の成分をさらに含む、請求項

11に記載の組成物。
【請求項１３】
非経口的または経口的に投与するための組成物である、請求項1～10のいずれか1項に記載の組成物。
【請求項１４】
静脈内、皮下、筋内、眼窩内、眼、脳室内、頭蓋内、関節包内、脊髄内、槽内、腹腔内、鼻腔内、経口、口腔粘膜、直腸、膣、局所、およびこれらの組合せからなる群より選択される経路から投与するための組成物である、請求項1～10のいずれか1項に記載の組成物。
【請求項１５】
エーロゾル、乱刺法、または外科的移植術により投与するための組成物である、請求項1～10のいずれか1項に記載の組成物。
【請求項１６】
前記細菌感染がグラム陽性菌またはマイコプラズマ細菌により引き起こされる、請求項1～10のいずれか1項に記載の組成物。
【請求項１７】
前記細菌がグラム陽性菌である、請求項16に記載の組成物。
【請求項１８】
前記グラム陽性菌がストレプトコッカス属（Streptococcus）、エンテロコッカス属（Enterococcus）、スタフィロコッカス属（Staphylococcus）、バシラス属（Bacillus）、クロストリジウム属（Clostridium）、リステリア属（Listeria）、およびこれらの組合せからなる群より選択される、請求項17に記載の組成物。
【請求項１９】
前記細菌感染がグラム陰性菌により引き起こされる、請求項1～10のいずれか1項に記載の組成物。
【請求項２０】
前記グラム陰性菌がエシェリキア属（Escherichia）、サルモネラ属（Salmonella）、シュードモナス属（Pseudomonas）、ヘリコバクター属（Helicobacter）、レジオネラ属（Legionella）、シゲラ属（Shigella）、エルジニア属（Yersinia）、ナイセリア属（Neisseria）、およびこれらの組合せからなる群より選択される、請求項19に記載の組成物。
【請求項２１】
細菌の増殖を阻止するための組成物であって、以下の式1aまたは1bの構造を有する化合物、そのエナンチオマーもしくはジアステレオマー、またはその薬学的に許容される塩を含む、前記組成物。
【化８】



1a



1b

［上記各式中、
R^1、R^2およびR^3は、それぞれ独立して、水素（H）、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、ハロ、アミノ、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、置換または非置換アルキルアミノ、置換または非置換アルキルアミノアルキル、置換または非置換アルコキシ、置換または非置換アルコキシアルキル、置換または非置換アルキルチオ、置換または非置換アルキルチオアルキル、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、置換または非置換カルボシクリル、置換または非置換カ

ルボシクリルアルキル、置換または非置換カルボシクリルオキシ、置換または非置換カルボシクリルオキシアルキル、置換または非置換カルボシクリルアミノ、置換または非置換カルボシクリルアミノアルキル、置換または非置換ヘテロシクリル、置換または非置換ヘテロシクリルアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルオキシ、置換または非置換ヘテロシクリルオキシアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルアミノ、および置換または非置換ヘテロシクリルアミノアルキルからなる群より選択され、

R^4およびR^5は、独立して、H、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、および置換または非置換シクロアルキルからなる群より選択されるが、ここで、R^4がHである場合は、構造1aおよび1bで表される2つの互変異性体として存在することができ、

R^6およびR^7は、独立して、H、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、置換または非置換シクロアルキル、置換または非置換アリール、置換または非置換アリールアルキル、置換または非置換アルキルアリール、置換または非置換ヘテロアリールであるか、あるいは、R^6およびR^7は、置換または非置換の炭素、窒素または硫黄からなる群より選択される環原子を有する、単環または縮合環系からなる、芳香族または非芳香族の、複素環式もしくは炭素環式環または環系の部分を構成する原子であり、

Lは、存在しないか、あるいは、連続した直鎖状の結合で1～6個の原子を有するリンカーからなる群より選択される。］

【請求項２２】

R^1、R^2およびR^3が、それぞれ独立して、水素（H）、置換または非置換C_{1-6}アルキル、置換または非置換C_{2-6}アルケニル、置換または非置換C_{2-6}アルキニル、ハロ、アミノ、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、置換または非置換C_{1-6}アルキルアミノ、置換または非置換C_{1-6}アルキルアミノアルキル、置換または非置換C_{1-6}アルコキシ、置換または非置換C_{1-6}アルコキシアルキル、置換または非置換C_{1-6}アルキルチオ、置換または非置換C_{1-6}アルキルチオアルキル、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、置換または非置換C_{3-12}カルボシクリル、置換または非置換C_{3-12}カルボシクリルアルキル、置換または非置換C_{3-12}カルボシクリルオキシ、置換または非置換C_{3-12}カルボシクリルオキシアルキル、置換または非置換C_{3-12}カルボシクリルアミノ、置換または非置換C_{3-12}カルボシクリルアミノアルキル、置換または非置換の3～12員ヘテロシクリル、置換または非置換の3～12員ヘテロシクリル-C_{1-6}アルキル、置換または非置換の3～12員ヘテロシクリルオキシ、置換または非置換の3～12員ヘテロシクリルオキシ-C_{1-6}アルキル、置換または非置換の3～12員ヘテロシクリルアミノ、および置換または非置換の3～12員ヘテロシクリルアミノ-C_{1-6}アルキルからなる群より選択され、

R^4およびR^5が、独立して、H、置換または非置換C_{1-6}アルキル、置換または非置換C_{2-6}アルケニル、置換または非置換C_{2-6}アルキニル、および置換または非置換C_{3-8}シクロアルキルからなる群より選択されるが、ここで、R^4がHである場合は、構造1aおよび1bで表される2つの互変異性体として存在することができ、

R^6およびR^7が、独立して、H、置換または非置換C_{1-6}アルキル、置換または非置換C_{2-6}アルケニル、置換または非置換C_{2-6}アルキニル、置換または非置換C_{3-12}シクロアルキル、置換または非置換アリール、置換または非置換アリールアルキル、置換または非置換C_{1-6}アルキルアリール、置換または非置換C_{4-12}ヘテロアリールであるか、あるいは、R^6およびR^7が、置換または非置換の炭素、窒素または硫黄からなる群より選択される環原子を有する、3～6員単環または6～12員縮合環系からなる、芳香族または非芳香族の、複素環式もしくは炭素環式環または環系の部分を構成する原子であり、

Lが、存在しないか、あるいは、連続した直鎖状の結合で1～6個の原子を有するリンカーからなる群より選択される、請求項21に記載の組成物。

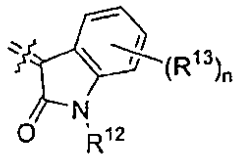
【請求項２３】

R^4およびR^5が、独立して、H、置換または非置換C_{1-6}アルキル、および置換または非置換C_{3-8}シクロアルキルからなる群より選択されるが、ここで、R^4がHである場合は、構造1

aおよび1bで表される2つの互変異性体として存在することができ、

R^6およびR^7が、独立して、H、置換または非置換C_{1-6}アルキル、置換または非置換C_{2-6}アルケニル、置換または非置換C_{2-6}アルキニル、置換または非置換C_{3-12}シクロアルキル、置換または非置換アリール、置換または非置換アリールアルキル、置換または非置換C_{1-6}アルキルアリール、置換または非置換C_{4-12}ヘテロアリールであるか、あるいは、R^6およびR^7が、以下の構造：

【化９】



（ここで、R^{12}は、H、置換または非置換C_{1-6}アルキル、置換または非置換C_{2-6}アルケニル、置換または非置換C_{2-6}アルキニル、および置換または非置換C_{3-8}シクロアルキルからなる群より選択され、

各R^{13}は、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、ハロ、アミノ、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、置換または非置換アルキルアミノ、置換または非置換アルキルアミノアルキル、置換または非置換アルコキシ、置換または非置換アルコキシアルキル、置換または非置換アルキルチオ、置換または非置換アルキルチオアルキル、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、置換または非置換カルボシクリル、置換または非置換カルボシクリルアルキル、置換または非置換カルボシクリルアキシ、置換または非置換カルボシクリルアキシアルキル、置換または非置換カルボシクリルアミノ、置換または非置換カルボシクリルアミノアルキル、置換または非置換ヘテロシクリル、置換または非置換ヘテロシクリルアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルオキシ、置換または非置換ヘテロシクリルオキシアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルアミノ、および置換または非置換ヘテロシクリルアミノアルキルからなる群より選択され、

nは、0、1、2、3、および4から選択される整数である）

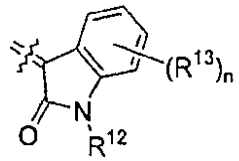
を有する環系の部分を構成する原子であり、

Lが、存在しないか、あるいは、連続した直鎖状の結合で1～3個の原子を有するリンカーからなる群より選択される、請求項22に記載の組成物。

【請求項２４】

R^4、R^5およびR^6がHであり、かつR^7が1個以上のC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、ハロ、アミノ、またはヒドロキシで置換されていてもよいフェニルであるか、あるいは、R^6およびR^7が、以下の構造：

【化１０】



（ここで、R^{12}は、H、置換または非置換C_{1-6}アルキル、および置換または非置換C_{3-8}シクロアルキルからなる群より選択され、

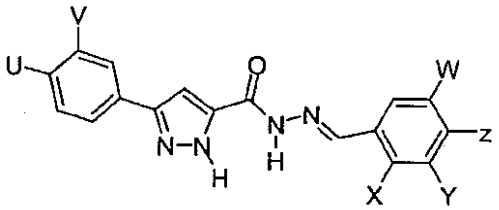
各R^{13}は、置換または非置換C_{1-6}アルキル、置換または非置換C_{2-6}アルケニル、置換または非置換C_{2-6}アルキニル、ハロ、アミノ、置換または非置換C_{1-6}アシル、置換または非置換アリール、置換または非置換C_{1-6}アルコキシ、置換または非置換C_{1-6}アルコキシアルキル、ニトロ、ヒドロキシル、およびシアノからなる群より選択され、

nは、0、1、および2から選択される整数である）

を有する環系の部分を構成する原子であり、

Lが存在しない、請求項23に記載の組成物。

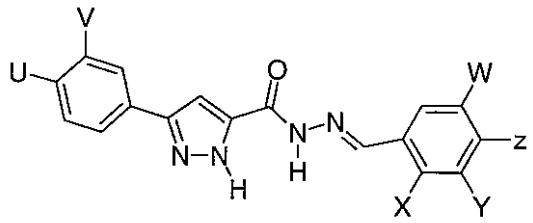
【請求項２５】
前記化合物が式2の構造：
【化１１】



2

［式中、U、V、W、X、YおよびZは、同一でも異なっていてもよく、それぞれ独立して、H、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、ハロ、アミノ、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、置換または非置換アルキルアミノ、置換または非置換アルキルアミノアルキル、置換または非置換アルコキシ、置換または非置換アルコキシアルキル、置換または非置換アルキルチオ、置換または非置換アルキルチオアルキル、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、置換または非置換カルボシクリル、置換または非置換カルボシクリルアルキル、置換または非置換カルボシクリルオキシ、置換または非置換カルボシクリルオキシアルキル、置換または非置換カルボシクリルアミノ、置換または非置換カルボシクリルアミノアルキル、置換または非置換ヘテロシクリル、置換または非置換ヘテロシクリルアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルオキシ、置換または非置換ヘテロシクリルオキシアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルアミノ、および置換または非置換ヘテロシクリルアミノアルキルからなる群より選択される］
を有する化合物、そのエナンチオマーもしくはジアステレオマー、またはその薬学的に許容される塩である、請求項21に記載の組成物。
【請求項２６】
U、V、W、X、YおよびZが、それぞれ独立して、H、C_{1-4}アルキル、C_{3-6}シクロアルキル、C_{1-4}アルコキシ、ハロ、ヒドロキシル、およびアミノからなる群より選択される、請求項25に記載の組成物。
【請求項２７】
前記化合物が以下の式2および表により示される構造を有する化合物1～19からなる群より選択される、請求項25に記載の組成物。

【化１２】



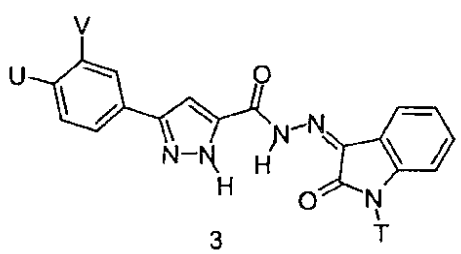
2

化合物番号	U	V	W	X	Y	Z
1	H	H	OCH_3	H	OCH_3	OCH_3
2	H	OCH_3	H	H	OCH_3	OCH_3
3	H	OCH_3	H	H	OCH_2CH_3	OH
4	H	H	H	OH	H	OH
5	H	H	H	H	OCH_3	OH
6	H	H	Br	OH	H	H
7	H	OCH_2CH_3	H	OH	OCH_3	H
8	CH_3	H	H	OH	OCH_3	H
9	H	H	H	OH	H	H
10	H	OCH_3	H	H	OH	H
11	H	H	H	H	H	CH_3
12	H	H	C_4H_9	H	C_4H_9	OH
13	OCH_3	H	H	H	H	H
14	H	OCH_3	H	H	H	OH
15	Cl	H	H	H	OCH_3	OCH_3
16	OCH_3	H	H	H	H	OH
17	OCH_3	H	OCH_3	H	OCH_3	OCH_3
18	OCH_3	H	H	H	OCH_3	OCH_3
19	OC_2H_5	H	H	H	OCH_3	OH

【請求項２８】

前記化合物が式3の構造：

【化１３】



3

［式中、UおよびVは、同一でも異なっていてもよく、それぞれ独立して、H、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、ハロ、アミノ、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、置換または非置換アルキルアミノ、置換または非置換アルキルアミノアルキル、置換または非置換アルコキシ、置換または非置換アルコキシアルキル、置換または非置換アルキルチオ、置換または非置換アルキルチオアルキル、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、置換または非置換カルボシクリル、置換または非置換カルボシクリルアルキル、置換または非置換カルボシクリルオキシ、置換または非置換カルボシクリルオキシアルキル、置換または非置換カルボシクリルアミノ、置換または非置換カルボシクリルアミノアルキル、置換または非置換ヘテロシクリル、置換または非置換ヘテロシクリルアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルオキシ、置換または非置換ヘテロシクリルオキシアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルアミノ、および置換または非置換ヘテロシクリルアミノアルキルからなる群より選択され、

Tは、H、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、および置換または非置換シクロアルキルからなる群より選択される］

を有する、請求項21に記載の組成物。

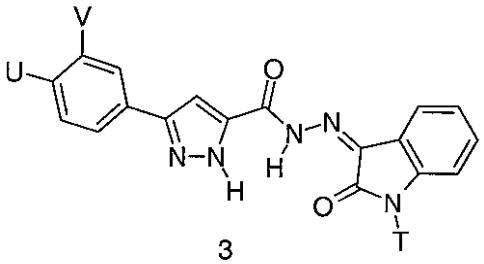
【請求項２９】

UおよびVが、それぞれ独立して、H、C_{1-4}アルキル、C_{1-4}アルコキシ、およびアリールからなる群より選択され、TがHおよびC_{1-4}アルキルからなる群より選択される、請求項28に記載の組成物。

【請求項３０】

前記化合物が以下の式3および表により示される構造を有する化合物20および21からなる群より選択される、請求項28に記載の組成物。

【化１４】



3

化合物番号	T	U	V
20	C_2H_5	H	H
21	C_2H_5	H	C_6H_5

【請求項３１】

前記細菌がグラム陽性菌またはマイコプラズマ細菌である、請求項21～30のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項３２】

前記細菌がグラム陽性菌である、請求項31に記載の組成物。

【請求項３３】

前記グラム陽性菌がストレプトコッカス属（Streptococcus）、エンテロコッカス属（Enterococcus）、スタフィロコッカス属（Staphylococcus）、バシラス属（Bacillus）、クロストリジウム属（Clostridium）、リステリア属（Listeria）、およびこれらの組合せからなる群より選択される、請求項32に記載の組成物。

【請求項３４】

前記細菌がグラム陰性菌である、請求項21～30のいずれか1項に記載の組成物。

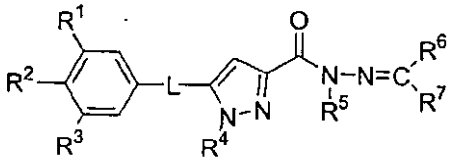
【請求項３５】

前記グラム陰性菌がエシェリキア属（Escherichia）、サルモネラ属（Salmonella）、シュードモナス属（Pseudomonas）、ヘリコバクター属（Helicobacter）、レジオネラ属（Legionella）、シゲラ属（Shigella）、エルジニア属（Yersinia）、ナイセリア属（Neisseria）、およびこれらの組合せからなる群より選択される、請求項34に記載の組成物。

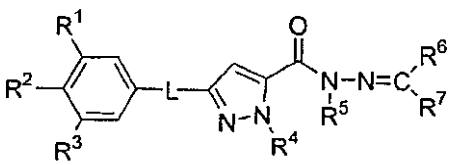
【請求項３６】

DNAポリメラーゼIIIの活性を阻害するための組成物であって、以下の式1aまたは1bの構造を有する化合物、そのエナンチオマーもしくはジアステレオマー、またはその薬学的に許容される塩を含む前記組成物。

【化１５】



1a



1b

［上記各式中、

R^1、R^2およびR^3は、それぞれ独立して、水素（H）、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、ハロ、アミノ、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、置換または非置換アルキルアミノ、置換または非置換アルキルアミノアルキル、置換または非置換アルコキシ、置換または非置換アルコキシアルキル、置換または非置換アルキルチオ、置換または非置換アルキルチオアルキル、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、置換または非置換カルボシクリル、置換または非置換カルボシクリルアルキル、置換または非置換カルボシクリルオキシ、置換または非置換カルボシクリルオキシアルキル、置換または非置換カルボシクリルアミノ、置換または非置換カルボシクリルアミノアルキル、置換または非置換ヘテロシクリル、置換または非置換ヘテロシクリルアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルオキシ、置換または非置換ヘテロシクリルオキシアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルアミノ、および置換または非置換ヘテロシクリルアミノアルキルからなる群より選択され、

R^4およびR^5は、独立して、H、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、および置換または非置換シクロアルキルからなる群より選択されるが、ここで、R^4がHである場合は、構造1aおよび1bで表される2つの互変異性体として存在することができ、

R^6およびR^7は、独立して、H、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、置換または非置換シクロアルキル、置換または非置換アリール、置換または非置換アリールアルキル、置換または非置換アルキルアリール、置換または非置換ヘテロアリールであるか、あるいは、R^6およびR^7は、置換または非置換の炭素、窒素または硫黄からなる群より選択される環原子を有する、単環または縮合環系からなる、芳香族または非芳香族の、複素環式もしくは炭素環式環または環系の部分を構成する原子であり、

Lは、存在しないか、あるいは、連続した直鎖状の結合で1～6個の原子を有するリンカーからなる群より選択される。］

【請求項３７】

R^1、R^2およびR^3が、それぞれ独立して、水素（H）、置換または非置換C_{1-6}アルキル、置換または非置換C_{2-6}アルケニル、置換または非置換C_{2-6}アルキニル、ハロ、アミノ、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、置換または非置換C_{1-6}アルキルアミノ、置換または非置換C_{1-6}アルキルアミノアルキル、置換または非置換C_{1-6}アルコキシ、置換または非置換C_{1-6}アルコキシアルキル、置換または非置換C_{1-6}アルキルチオ、置換または非置換C_{1-6}アルキルチオアルキル、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、置換または非置

換C_{3-12}カルボシクリル、置換または非置換C_{3-12}カルボシクリルアルキル、置換または非置換C_{3-12}カルボシクリルオキシ、置換または非置換C_{3-12}カルボシクリルオキシアルキル、置換または非置換C_{3-12}カルボシクリルアミノ、置換または非置換C_{3-12}カルボシクリルアミノアルキル、置換または非置換の3～12員ヘテロシクリル、置換または非置換の3～12員ヘテロシクリル-C_{1-6}アルキル、置換または非置換の3～12員ヘテロシクリルオキシ、置換または非置換の3～12員ヘテロシクリルオキシ-C_{1-6}アルキル、置換または非置換の3～12員ヘテロシクリルアミノ、および置換または非置換の3～12員ヘテロシクリルアミノ-C_{1-6}アルキルからなる群より選択され、

R^4およびR^5が、独立して、H、置換または非置換C_{1-6}アルキル、置換または非置換C_{2-6}アルケニル、置換または非置換C_{2-6}アルキニル、および置換または非置換C_{3-8}シクロアルキルからなる群より選択されるが、ここで、R^4がHである場合は、構造1aおよび1bで表される2つの互変異性体として存在することができ、

R^6およびR^7が、独立して、H、置換または非置換C_{1-6}アルキル、置換または非置換C_{2-6}アルケニル、置換または非置換C_{2-6}アルキニル、置換または非置換C_{3-12}シクロアルキル、置換または非置換アリール、置換または非置換アリールアルキル、置換または非置換C_{1-6}アルキルアリール、置換または非置換C_{4-12}ヘテロアリールであるか、あるいは、R^6およびR^7が、置換または非置換の炭素、窒素または硫黄からなる群より選択される環原子を有する、3～6員単環または6～12員縮合環系からなる、芳香族または非芳香族の、複素環式もしくは炭素環式環または環系の部分を構成する原子であり、

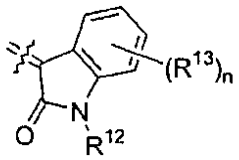
Lが、存在しないか、あるいは、連続した直鎖状の結合で1～6個の原子を有するリンカーからなる群より選択される、請求項36に記載の組成物。

【請求項３８】

R^4およびR^5が、独立して、H、置換または非置換C_{1-6}アルキル、および置換または非置換C_{3-8}シクロアルキルからなる群より選択されるが、ここで、R^4がHである場合は、構造1aおよび1bで表される2つの互変異性体として存在することができ、

R^6およびR^7が、独立して、H、置換または非置換C_{1-6}アルキル、置換または非置換C_{2-6}アルケニル、置換または非置換C_{2-6}アルキニル、置換または非置換C_{3-12}シクロアルキル、置換または非置換アリール、置換または非置換アリールアルキル、置換または非置換C_{1-6}アルキルアリール、置換または非置換C_{4-12}ヘテロアリールであるか、あるいは、R^6およびR^7が、以下の構造：

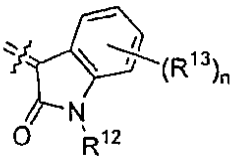
【化１６】



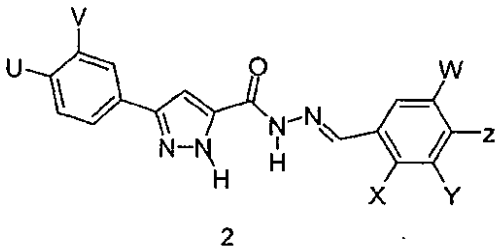
（ここで、R^{12}は、H、置換または非置換C_{1-6}アルキル、置換または非置換C_{2-6}アルケニル、置換または非置換C_{2-6}アルキニル、および置換または非置換C_{3-8}シクロアルキルからなる群より選択され、

各R^{13}は、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、ハロ、アミノ、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、置換または非置換アルキルアミノ、置換または非置換アルキルアミノアルキル、置換または非置換アルコキシ、置換または非置換アルコキシアルキル、置換または非置換アルキルチオ、置換または非置換アルキルチオアルキル、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、置換または非置換カルボシクリル、置換または非置換カルボシクリルアルキル、置換または非置換カルボシクリルアキシ、置換または非置換カルボシクリルアキシアルキル、置換または非置換カルボシクリルアミノ、置換または非置換カルボシクリルアミノアルキル、置換または非置換ヘテロシクリル、置換または非置換ヘテロシクリルアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルオキシ、置換または非置換ヘテロシクリルオキシアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルアミノ、および置換または非置換ヘテロシクリルアミノアルキルから

なる群より選択され、
nは、0、1、2、3、および4から選択される整数である）
を有する環系の部分を構成する原子であり、
Lが、存在しないか、あるいは、連続した直鎖状の結合で1～3個の原子を有するリンカーからなる群より選択される、請求項37に記載の組成物。
【請求項３９】
R^4、R^5およびR^6がHであり、かつR^7が1個以上のC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、ハロ、アミノ、またはヒドロキシで置換されていてもよいフェニルであるか、あるいは、R^6およびR^7が、以下の構造：
【化１７】



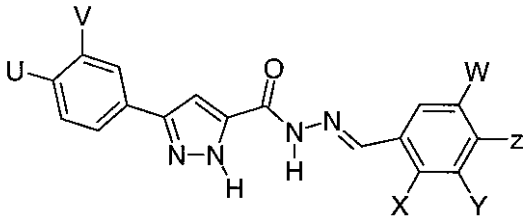
（ここで、R^{12}は、H、置換または非置換C_{1-6}アルキル、および置換または非置換C_{3-8}シクロアルキルからなる群より選択され、
各R^{13}は、置換または非置換C_{1-6}アルキル、置換または非置換C_{2-6}アルケニル、置換または非置換C_{2-6}アルキニル、ハロ、アミノ、置換または非置換C_{1-6}アシル、置換または非置換アリール、置換または非置換C_{1-6}アルコキシ、置換または非置換C_{1-6}アルコキシアルキル、ニトロ、ヒドロキシル、およびシアノからなる群より選択され、
nは、0、1、および2から選択される整数である）
を有する環系の部分を構成する原子であり、
Lが存在しない、請求項38に記載の組成物。
【請求項４０】
前記化合物が式2の構造：
【化１８】



2

［式中、U、V、W、X、YおよびZは、同一でも異なっていてもよく、それぞれ独立して、H、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、ハロ、アミノ、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、置換または非置換アルキルアミノ、置換または非置換アルキルアミノアルキル、置換または非置換アルコキシ、置換または非置換アルコキシアルキル、置換または非置換アルキルチオ、置換または非置換アルキルチオアルキル、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、置換または非置換カルボシクリル、置換または非置換カルボシクリルアルキル、置換または非置換カルボシクリルオキシ、置換または非置換カルボシクリルオキシアルキル、置換または非置換カルボシクリルアミノ、置換または非置換カルボシクリルアミノアルキル、置換または非置換ヘテロシクリル、置換または非置換ヘテロシクリルアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルオキシ、置換または非置換ヘテロシクリルオキシアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルアミノ、および置換または非置換ヘテロシクリルアミノアルキルからなる群より選択される］
を有する化合物、そのエナンチオマーもしくはジアステレオマー、またはその薬学的に許容される塩である、請求項36に記載の組成物。

【請求項４１】
U、V、W、X、YおよびZが、それぞれ独立して、H、C_{1-4}アルキル、C_{3-6}シクロアルキル、C_{1-4}アルコキシ、ハロ、ヒドロキシル、およびアミノからなる群より選択される、請求項40に記載の組成物。
【請求項４２】
前記化合物が以下の式2および表により示される構造を有する化合物1～19からなる群より選択される、請求項40に記載の組成物。
【化１９】

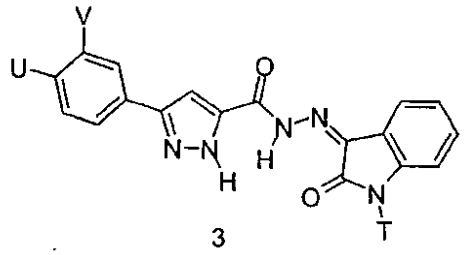


2

化合物番号	U	V	W	X	Y	Z
1	H	H	OCH_3	H	OCH_3	OCH_3
2	H	OCH_3	H	H	OCH_3	OCH_3
3	H	OCH_3	H	H	OCH_2CH_3	OH
4	H	H	H	OH	H	OH
5	H	H	H	H	OCH_3	OH
6	H	H	Br	OH	H	H
7	H	OCH_2CH_3	H	OH	OCH_3	H
8	CH_3	H	H	OH	OCH_3	H
9	H	H	H	OH	H	H
10	H	OCH_3	H	H	OH	H
11	H	H	H	H	H	CH_3
12	H	H	C_4H_9	H	C_4H_9	OH
13	OCH_3	H	H	H	H	H
14	H	OCH_3	H	H	H	OH
15	Cl	H	H	H	OCH_3	OCH_3
16	OCH_3	H	H	H	H	OH
17	OCH_3	H	OCH_3	H	OCH_3	OCH_3
18	OCH_3	H	H	H	OCH_3	OCH_3
19	OC_2H_5	H	H	H	OCH_3	OH

【請求項４３】
前記化合物が式3の構造：

【化２０】



3

［式中、UおよびVは、同一でも異なっていてもよく、それぞれ独立して、H、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、ハロ、アミノ、置換または非置換アシル、置換または非置換アリール、置換または非置換アルキルアミノ、置換または非置換アルキルアミノアルキル、置換または非置換アルコキシ、置換または非置換アルコキシアルキル、置換または非置換アルキルチオ、置換または非置換アルキルチオアルキル、ニトロ、ヒドロキシル、シアノ、置換または非置換カルボシクリル、置換または非置換カルボシクリルアルキル、置換または非置換カルボシクリルオキシ、置換または非置換カルボシクリルオキシアルキル、置換または非置換カルボシクリルアミノ、置換または非置換カルボシクリルアミノアルキル、置換または非置換ヘテロシクリル、置換または非置換ヘテロシクリルアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルオキシ、置換または非置換ヘテロシクリルオキシアルキル、置換または非置換ヘテロシクリルアミノ、および置換または非置換ヘテロシクリルアミノアルキルからなる群より選択され、

Tは、H、置換または非置換アルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、および置換または非置換シクロアルキルからなる群より選択される］

を有する、請求項36に記載の組成物。

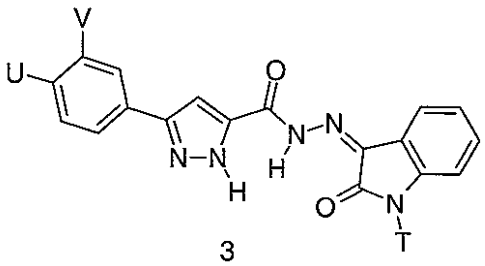
【請求項４４】

UおよびVが、それぞれ独立して、H、C_{1-4}アルキル、C_{1-4}アルコキシ、およびアリールからなる群より選択され、TがHおよびC_{1-4}アルキルからなる群より選択される、請求項43に記載の組成物。

【請求項４５】

前記化合物が以下の式3および表により示される構造を有する化合物20および21からなる群より選択される、請求項43に記載の組成物。

【化２１】



3

化合物番号	T	U	V
20	C_2H_5	H	H
21	C_2H_5	H	C_6H_5

【請求項４６】

DNAポリメラーゼIIIがpol IIICクラスまたはpol IIIEクラスの酵素である、請求項36～45のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項４７】

DNAポリメラーゼIIIがグラム陽性菌またはマイコプラズマ細菌由来である、請求項36～

45のいずれか1項に記載の組成物。
【請求項４８】
細菌性DNAポリメラーゼIIIがグラム陽性菌由来である、請求項47に記載の組成物。
【請求項４９】
前記グラム陽性菌がストレプトコッカス属（Streptococcus）、エンテロコッカス属（Enterococcus）、スタフィロコッカス属（Staphylococcus）、バシラス属（Bacillus）、クロストリジウム属（Clostridium）、リステリア属（Listeria）、およびこれらの組合せからなる群より選択される、請求項48に記載の組成物。
【請求項５０】
DNAポリメラーゼIIIがpol IIIEクラスの酵素である、請求項46に記載の組成物。
【請求項５１】
pol IIIEクラスの酵素がグラム陰性菌由来である、請求項50に記載の組成物。
【請求項５２】
前記グラム陰性菌がエシェリキア属（Escherichia）、サルモネラ属（Salmonella）、シュードモナス属（Pseudomonas）、ヘリコバクター属（Helicobacter）、レジオネラ属（Legionella）、シゲラ属（Shigella）、エルジニア属（Yersinia）、ナイセリア属（Neisseria）、およびこれらの組合せからなる群より選択される、請求項49に記載の組成物。