

【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 2005-517635(P2005-517635A)

【公表日】平成 17 年 6 月 16 日 (2005.6.16)

【年通号数】公開・登録公報 2005-023

【出願番号】特願 2003-541840(P2003-541840)

【国際特許分類第 7 版】

C 07 D 213/81

A 01 N 43/08

A 01 N 43/10

A 01 N 43/12

A 01 N 43/40

A 01 N 43/54

A 01 N 43/56

A 01 N 43/60

A 01 N 43/80

A 01 N 43/90

A 01 N 47/02

A 61 B 17/00

A 61 F 2/20

A 61 F 2/24

A 61 F 2/30

A 61 J 1/05

A 61 K 7/00

A 61 K 31/381

A 61 K 31/415

A 61 K 31/4155

A 61 K 31/42

A 61 K 31/437

A 61 K 31/44

A 61 K 31/4436

A 61 K 31/444

A 61 K 31/498

A 61 K 31/505

A 61 K 31/506

A 61 M 1/00

A 61 M 5/14

A 61 M 25/00

A 61 M 39/02

A 61 P 31/04

A 61 P 43/00

C 02 F 1/00

C 07 D 213/82

C 07 D 231/16

C 07 D 231/40

C 07 D 239/30

C 07 D 261/18

C 07 D 307/68

C 0 7 D 333/34  
 C 0 7 D 333/38  
 C 0 7 D 333/70  
 C 0 7 D 403/12  
 C 0 7 D 409/04  
 C 0 7 D 409/12  
 C 0 7 D 471/04  
 C 0 9 K 3/00  
 C 1 1 D 3/48

## 【 F I 】

C 0 7 D 213/81	C S P
A 0 1 N 43/08	F
A 0 1 N 43/10	A
A 0 1 N 43/10	F
A 0 1 N 43/12	Z
A 0 1 N 43/40	1 0 1 D
A 0 1 N 43/40	1 0 1 J
A 0 1 N 43/54	A
A 0 1 N 43/54	D
A 0 1 N 43/56	B
A 0 1 N 43/56	D
A 0 1 N 43/60	1 0 1
A 0 1 N 43/80	1 0 1
A 0 1 N 43/90	1 0 4
A 0 1 N 47/02	
A 6 1 B 17/00	3 2 0
A 6 1 F 2/20	
A 6 1 F 2/24	
A 6 1 F 2/30	
A 6 1 K 7/00	D
A 6 1 K 31/381	
A 6 1 K 31/415	
A 6 1 K 31/4155	
A 6 1 K 31/42	
A 6 1 K 31/437	
A 6 1 K 31/44	
A 6 1 K 31/4436	
A 6 1 K 31/444	
A 6 1 K 31/498	
A 6 1 K 31/505	
A 6 1 K 31/506	
A 6 1 M 1/00	5 1 0
A 6 1 M 5/14	3 6 5
A 6 1 M 25/00	3 0 0
A 6 1 P 31/04	
A 6 1 P 43/00	1 1 1
C 0 2 F 1/00	U
C 0 7 D 213/82	
C 0 7 D 231/16	
C 0 7 D 231/40	

C 0 7 D 239/30  
 C 0 7 D 261/18  
 C 0 7 D 307/68  
 C 0 7 D 333/34  
 C 0 7 D 333/38  
 C 0 7 D 333/70  
 C 0 7 D 403/12  
 C 0 7 D 409/04  
 C 0 7 D 409/12  
 C 0 7 D 471/04 1 0 6 C  
 C 0 9 K 3/00 1 1 2 Z  
 C 1 1 D 3/48  
 A 6 1 M 5/14 4 5 9 D  
 A 6 1 J 1/00 3 1 3 N

【手続補正書】

【提出日】平成16年8月18日(2004.8.18)

【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

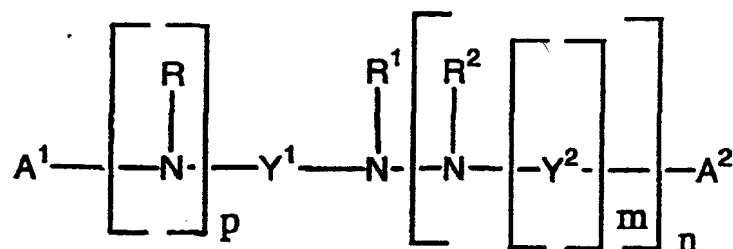
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

微生物の情報伝達システムを調節するための下記式(I)の化合物の使用。

【化1】



式(I)において、

Rは、H、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、

R<sup>1</sup>は、Hであり、

R<sup>2</sup>は、Hであり、

A<sup>1</sup>およびA<sup>2</sup>は、それぞれ少なくとも1つの群Zを含むことが可能な炭素数が1～20の任意の置換アルキル基、あるいは少なくとも1つの群Xを含むことが可能な任意の単環または多環の置換芳香族または非芳香族環系を表し、多環系の場合は少なくとも1つの芳香環を含み、

Zは、S、O、N、NR<sup>4</sup>、CO、CO<sub>2</sub>、CS、SOまたはSOから構成される群に含まれるうちの1つであり、

Xは、S、O、N、NR<sup>4</sup>、SOまたはSO<sub>2</sub>から構成される群に含まれるうちの1つであり、

前記置換環系において、1つまたは複数の炭素原子に置換基R<sup>3</sup>を有し、

前記炭素数が1～20の置換アルキル基において、1つまたは複数の炭素原子に置換基R<sup>3</sup>を有し、

R<sup>3</sup>は、それぞれH、OR<sup>4</sup>、SR<sup>4</sup>、ヒドロキシアルキル、ヒドロキシアルキルアミノ

、シクロアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルキルオキシ、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}^4\text{R}^5$ 、 $\text{CO}_2\text{NR}^4\text{R}^5$ 、 $\text{COR}^4$ 、 $\text{CO}_2\text{R}^4$ 、 $\text{SO}_2\text{R}^4$ 、 $\text{SO}_3\text{R}^4$ 、 $\text{NR}^4\text{R}^5$ 、アルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、

$\text{R}^4$ は、 $\text{H}$ 、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、

$\text{R}^5$ は、 $\text{H}$ 、 $\text{O}$ -アルキル、 $\text{O}$ -アリール、アルキル、ヘテロアリールまたはアリールであり、

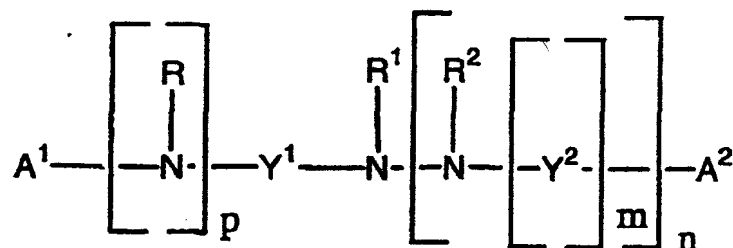
$\text{Y}^1$ および $\text{Y}^2$ は、 $\text{C}=\text{O}$ であり、

$p$ は $0$ 、 $m$ は $1$ 、 $n$ は $1$ 、または $p$ は $1$ 、 $m$ は $1$ 、 $n$ は $1$ である。

【請求項 2】

微生物の情報伝達システムを抑制するための一般式 (I) の化合物の使用。

【化 2】



式 (I) において、

$\text{R}$ は、 $\text{H}$ 、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、

$\text{R}^1$ は、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、

$\text{R}^2$ は、 $\text{H}$ 、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、

$\text{A}^1$ は、単環の置換芳香族環系であり、

$\text{A}^2$ は、1つまたは複数の群 $\text{Z}$ を含むことが可能な炭素数 $1 \sim 20$ の任意の置換アルキル基であり、

$\text{Z}$ は、 $\text{S}$ 、 $\text{O}$ 、 $\text{N}$ 、 $\text{NR}^4$ 、 $\text{CO}$ 、 $\text{CO}_2$ 、 $\text{CS}$ 、 $\text{SO}$ または $\text{SO}$ から構成される群に含まれるうちの1つであり、

$\text{X}$ は、 $\text{S}$ 、 $\text{O}$ 、 $\text{N}$ 、 $\text{NR}^4$ 、 $\text{SO}$ または $\text{SO}_2$ から構成される群に含まれるうちの1つであり、

前記置換環系において、1つまたは複数の炭素原子に置換基 $\text{R}^3$ を有し、

前記炭素数が $1 \sim 20$ の置換アルキル基において、1つまたは複数の炭素原子に置換基 $\text{R}^3$ を有し、

$\text{R}^3$ は、それぞれ $\text{H}$ 、 $\text{OR}^4$ 、 $\text{SR}^4$ 、ヒドロキシアルキル、ヒドロキシアルキルアミン、シクロアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルキルオキシ、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}^4\text{R}^5$ 、 $\text{CO}_2\text{NR}^4\text{R}^5$ 、 $\text{COR}^4$ 、 $\text{CO}_2\text{R}^4$ 、 $\text{SO}_2\text{R}^4$ 、 $\text{SO}_3\text{R}^4$ 、 $\text{NR}^4\text{R}^5$ 、アルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、

$\text{R}^4$ は、 $\text{H}$ 、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、

$\text{R}^5$ は、 $\text{H}$ 、 $\text{O}$ -アルキル、 $\text{O}$ -アリール、アルキル、ヘテロアリールまたはアリールであり、

$\text{Y}^1$ および $\text{Y}^2$ は、 $\text{C}=\text{O}$ であり、

$p$ は $0$ 、 $m$ は $0$ 、 $n$ は $0$ である。

【請求項 3】

薬剤、抗菌剤または防汚用コーティングとしての請求項 1 または 2 に記載の使用。

【請求項 4】

細菌性の損傷および病気を治療または予防するための薬剤、抗菌剤または防汚用コーティングとしての請求項 1 または 2 に記載の使用。

【請求項 5】

グラム陰性細菌によって起こる細菌性の損傷および病気を治療または予防するための薬剤、抗菌剤または防汚用コーティングとしての請求項 1 または 2 に記載の使用。

## 【請求項 6】

*Pseudomonas aeruginosa*または*Burkholderia cepacia*によって起こる細菌性の損傷および病気を治療または予防するための薬剤、抗菌剤または防汚用コーティングとしての請求項 1 または 2 に記載の使用。

## 【請求項 7】

微生物の前記情報伝達システムを阻止する、請求項 1 ないし 6 の何れか 1 項に記載の使用。

## 【請求項 8】

前記情報伝達に依存する毒性因子の発現を阻止する、請求項 1 ないし 7 の何れか 1 項に記載の使用。

## 【請求項 9】

バイオフィルムの処理またはバイオフィルム形成の抑制のための請求項 1 ないし 8 の何れか 1 項に記載の使用。

## 【請求項 10】

医療品、医療器具、医療装置に対するバイオフィルムの処理またはバイオフィルム形成の抑制のための請求項 1 ないし 8 の何れか 1 項に記載の使用。

## 【請求項 11】

殺菌剤、洗浄液、処理液におけるバイオフィルムの処理またはバイオフィルム形成の抑制のための請求項 1 ないし 8 の何れか 1 項に記載の使用。

## 【請求項 12】

個人用衛生用品、洗浄用品、化粧品におけるバイオフィルムの処理またはバイオフィルム形成の抑制のための請求項 1 ないし 8 の何れか 1 項に記載の使用。

## 【請求項 13】

工業環境におけるバイオフィルムの処理またはバイオフィルム形成の抑制のための請求項 1 ないし 8 の何れか 1 項に記載の使用。

## 【請求項 14】

船体、食品加工システム、油回収または製紙工場からなる群から選択される工業環境においてバイオフィルムの処理またはバイオフィルム形成の抑制のための請求項 1 ないし 8 の何れか 1 項に記載の使用。

## 【請求項 15】

環境条件においてバイオフィルムの処理またはバイオフィルム形成の抑制のための請求項 1 ないし 8 の何れか 1 項に記載の使用。

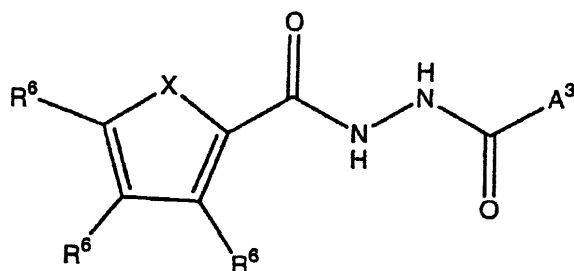
## 【請求項 16】

配水または冷却水システムからなる群から選択される環境条件においてバイオフィルムの処理またはバイオフィルム形成の抑制のための請求項 1 ないし 8 の何れか 1 項に記載の使用。

## 【請求項 17】

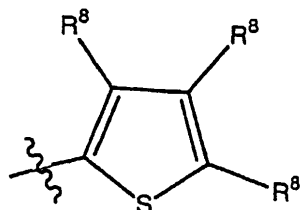
一般式 (X) の化合物およびその薬剤として許容される塩。

## 【化 3】



ここで、 $A^3$ は炭素数が8～20の任意の置換アルキル基または、

【化 5】



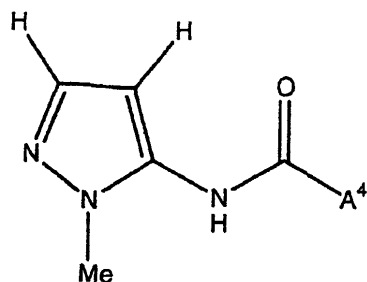
ただし、 2 - チオフェンカルボン酸 - 5 - ニトロ - 2 - ( 2 - チエニルカルボニル ) ヒドラジド、 4 - ブチルチオフェン - 2 - カルボン酸 - N' - ( 4 - ブチル - チオフェン - 2 - カルボニル ) ヒドラジド、 2 - チオフェン - カルボン酸 - 3 - クロロ - 2 - ( 2 - チエニルカルボニル ) ヒドラジド、 2 - チオフェン - カルボン酸 - 5 - ブromo - 2 - ( 2 - チエニルカルボニル ) ヒドラジド、 1 H - ピラゾール - 5 - カルボン酸 - 1 - メチル - 2 - ( 2 - チエニルカルボニル ) ヒドラジド、 2 - チオフェンジカルボン酸 - 5 - ( 4、 5、 6、 7 - テトラヒド - ベンゾ[ b ]チエン - 2 - イル ) - 2 - [[ 5 - ( 4、 5、 6、 7 - テトラヒドベンゾ[ b ]チエン - 2 - イル ) - 2 - チエニル ] - カーボニル ] - ヒドラジド、 1 H - ピロール - 2 - カルボン酸 - 2 - ( 2 - チエニルカルボニル ) - ヒドラジド、 2 - チオフェン - カルボン酸 - 2 - ( 2 - チエニルカルボニル ) - ヒドラジド、 2 - チオフェン - カルボン酸 - N' - ( フラン - 2 - カルボニル ) ヒドラジド、 チオフェン - 2 - カルボン酸 - N' - ( 3 - クロロ - 4 - メチルチオフェン - 2 - カルボニル ) ヒドラジド、 2 - フランカルボン酸 - 5 - [ { 4 - メチル - 6 - ( トリフロロメチル ) - 2 - ピリミジン } チオ } メチル ] - 2 - ( 2 - チエニルカルボンニル ) ヒドラジド、 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸 - 4 - ブromo - 1、 5 - ジメチル - 2 - ( 2 - チエニルカルボンニル ) ヒドラジド、 2 - チオフェン - カルボン酸 - N' - ( 5 - ブromoフラン - 2 - カルボニ

ル) ヒドラジドは除外する。

【請求項 18】

一般式 (X I) の化合物およびその薬剤として許容される塩。

【化 6】



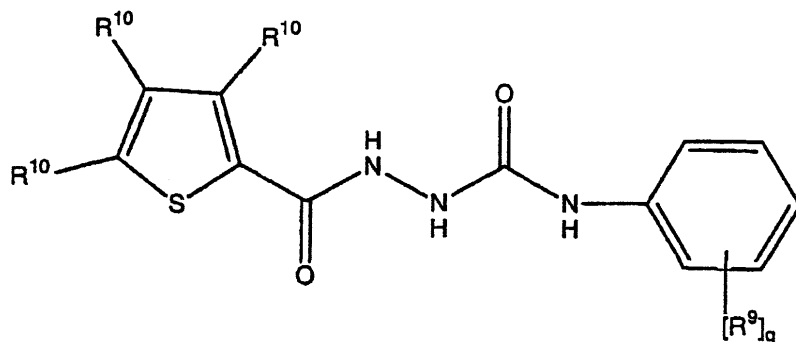
ここで、 $A^4$ は、炭素数 1 ~ 10 の非置換アルキル、または 5 員環ヘテロアリール基であり、上記に定義される少なくとも 1 つの  $R^3$  によって任意に置換可能な O、N、S、N  $R^4$ 、SO、SO<sub>2</sub>、Se または P から選択される少なくとも 1 つのヘテロ原子を含んでいる。

ただし、N - (1 - メチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル) - 1H - ピラゾール - 1 - カルボキアミドおよび 1 - エチル - 3 - メチル - N - (1 - メチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル) - 4 - ニトロ - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキアミドは除外する。

【請求項 19】

一般式 (X I I) の化合物およびその薬剤として許容される塩。

【化 7】



ここで、 $R^9$ は、それぞれ - H、- F、- Cl、- Br、- I、- SO<sub>2</sub>NHR<sup>4</sup>、- SO<sub>2</sub>N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、- NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、- NR<sup>4</sup>-CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキル、- NO<sub>2</sub>、- NR<sup>4</sup>-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-ハロアルキル、- CN、アルキル、シクロアルキル、- OH、- SH、アルキルチオ、アルコキシ、ヒドロキシアルキルアミノ、ハロアルキルオキシ、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、

$q$  は、0、1、2、3、4 または 5 である。

$R^{10}$  は、それぞれ - H、- F、- Cl、- Br、- I、- NO<sub>2</sub>、NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、- CN、アルキル、シクロアルキル、- OH、- SH、アルキルチオ、ヒドロキシアルキルアミノ、ヒドロキシアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、

$R^4$  は、H、アルキル、シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、

$R^5$  は、H、O - アルキル、O - アリール、アルキル、ヘテロアリールまたはアリールであり、

ただし、2 - チオフェンカルボン酸 - 5 - ブロモ - 2 - [ [(4 - クロロフェニル) アミノ] カルボニル] ヒドラジド、2 - チオフェンカルボン酸 - 2 - [ [(4 - エトキシフェノール) アミノ] カルボニル] ヒドラジド、2 - チオフェンカルボン酸 - 3 - メチル - 2 - [ [(3, 4 - ジクロロフェニル) アミノ] カルボニル] ヒドラジド、2 - チオフェンカルボン酸 - 2 - [ [(4 - メチルフェニル) アミノ] カルボニル] ヒドラジド、2 - チオフェン - カルボン酸 - 2 - [ [(4 - クロロフェニル) アミノ] カルボニル] ヒドラジド

ド、2 - チオフェンカルボン酸 - 2 - [ ( 3 - クロロフェニル ) アミノ ] カルボニル ] - ヒドラジド、2 - チオフェンカルボン酸 - 2 - [ ( フェニルアミノ ) カルボニル ] ヒドラジドは除外する。

【請求項 2 0】

薬剤、抗菌剤または防汚用コーティングとして、前記除外される化合物の何れかを含む、請求項 1 7 ないし 1 9 の何れかに記載の化合物の使用。

【請求項 2 1】

細菌性の損傷および病気を治療または予防するための薬剤、抗菌剤または防汚用コーティングとして、前記除外される化合物の何れかを含む、請求項 1 7 ないし 1 9 の何れかに記載の化合物の使用。

【請求項 2 2】

グラム陰性細菌によって起こる細菌性の損傷および病気を治療または予防するための薬剤、抗菌剤または防汚用コーティングとして、前記除外される化合物の何れかを含む、請求項 1 7 ないし 1 9 の何れかに記載の化合物の使用。

【請求項 2 3】

*Pseudomonas aeruginosa* または *Burkholderia cepacia* によって起こる細菌性の損傷および病気を治療または予防するための薬剤、抗菌剤または防汚用コーティングとして、前記除外される化合物の何れかを含む、請求項 1 7 ないし 1 9 の何れかに記載の化合物の使用。

【請求項 2 4】

微生物の前記情報伝達システムを阻止する、請求項 2 0 ないし 2 3 の何れか 1 項に記載の使用。

【請求項 2 5】

前記情報伝達に依存する毒性因子の発現を阻止する、請求項 2 0 ないし 2 4 の何れか 1 項に記載の使用。

【請求項 2 6】

バイオフィルムの処理またはバイオフィルム形成の抑制のための請求項 2 0 ないし 2 5 の何れか 1 項に記載の使用。

【請求項 2 7】

医療品、医療器具、医療装置に対するバイオフィルムの処理またはバイオフィルム形成の抑制のための請求項 2 0 ないし 2 5 の何れか 1 項に記載の使用。

【請求項 2 8】

殺菌剤、洗浄液、処理液におけるバイオフィルムの処理またはバイオフィルム形成の抑制のための請求項 2 0 ないし 2 5 の何れか 1 項に記載の使用。

【請求項 2 9】

個人用衛生用品、洗浄用品、化粧品におけるバイオフィルムの処理またはバイオフィルム形成の抑制のための請求項 2 0 ないし 2 5 の何れか 1 項に記載の使用。

【請求項 3 0】

工業環境におけるバイオフィルムの処理またはバイオフィルム形成の抑制のための請求項 2 0 ないし 2 5 の何れか 1 項に記載の使用。

【請求項 3 1】

船体、食品加工システム、油回収または製紙工場からなる群から選択される工業環境におけるバイオフィルムの処理またはバイオフィルム形成の抑制のための請求項 2 0 ないし 2 5 の何れか 1 項に記載の使用。

【請求項 3 2】

環境条件におけるバイオフィルムの処理またはバイオフィルム形成の抑制のための請求項 2 0 ないし 2 5 の何れか 1 項に記載の使用。

【請求項 3 3】

配水または冷却水システムからなる群から選択される環境条件におけるバイオフィルムの処理またはバイオフィルム形成の抑制のための請求項 2 0 ないし 2 5 の何れか 1 項に



記載の使用。