

【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20日(2007.9.20)

【公表番号】特表2003-516404(P2003-516404A)

【公表日】平成15年5月13日(2003.5.13)

【出願番号】特願2001-543541(P2001-543541)

【国際特許分類】

C 07 D 413/10	(2006.01)
A 61 K 31/4162	(2006.01)
A 61 K 31/422	(2006.01)
A 61 K 31/437	(2006.01)
A 61 K 31/519	(2006.01)
A 61 P 31/04	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)
C 07 D 487/04	(2006.01)

【F I】

C 07 D 413/10	
A 61 K 31/4162	
A 61 K 31/422	
A 61 K 31/437	
A 61 K 31/519	
A 61 P 31/04	
C 07 D 471/04	1 0 4 H
C 07 D 471/04	1 0 4 Z
C 07 D 487/04	1 3 8
C 07 D 487/04	1 4 0

【手続補正書】

【提出日】平成19年8月1日(2007.8.1)

【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

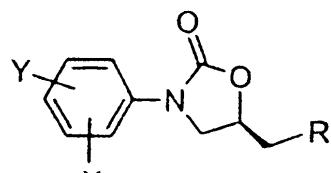
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 式1

【化1】

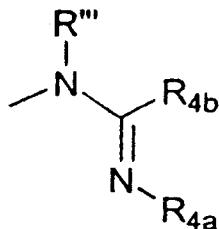


式I

[式中、

RはOH、O-アリール、O-ヘテロアリール、N₃、OR'、OSO₂R'、-NR'、または

【化2】



よりなる群から選択され、

ここで：

(i) R は炭素数 6までの直鎖状もしくは分枝鎖状のアシルまたはベンジルであり、
(ii) R は炭素数 5までの直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、フェニルまたはトリルであり、そして

(iii) R および R は独立して H、炭素数 3 ~ 6 のシクロアルキル、フェニルまたは t e r t - プトキシカルボニル、フルオレニルオキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、場合によりシアノもしくは炭素数 4までのアルコキシカルボニルにより置換されてもよい炭素数 6までの直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、- C O₂ - R₁、- C O - R₁、- C O - S R₁、- C S - R₁、P(O)(O R₂)(O R₃)、および - S O₂ - R₄ よりなる群から選択され、ここで

R₁ は H、炭素数 3 ~ 6 のシクロアルキル、トリフルオロメチルまたはフェニル、ベンジル、または炭素数 5までのアシル、炭素数 6までの直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル(該アルキルは場合により炭素数 5までの直鎖状もしくは分枝鎖状のアルコキシカルボニル、O H、シアノ、3個までのハロゲン原子により置換されてもよい)および - N R₅ R₆ (R₅ および R₆ は同一もしくは相異なりそして H、フェニルまたは炭素数 4までの直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルから選択される)よりなる群から選択され、

R₂ および R₃ は同一もしくは相異なりそして水素または炭素数 4までの直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルから選択され、そして

R₄ は炭素数 4までの直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキルまたはフェニルから選択され、そして

R_{4a} は C N、C O R_{4c}、C O O R_{4c}、C O N H R_{4c}、C O - N R_{4c} R_{4d}、S O₂ R_{4c}、S O₂ N H R_{4c}、S O₂ - N R_{4c} R_{4d}、または N O₂ であり、

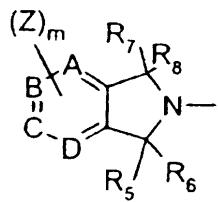
R_{4b} は H、アルキル、O R_{4c}、S R_{4c}、アミノ、N H R_{4c}、N R_{4c} R_{4d}、(C₁ - C₈)アルキルアリールまたはモノ-、ジ-、トリ、およびペル-ハロ(C₁ - C₈)アルキルであり、

R_{4c} および R_{4d} は独立して H、アルキル、アリールから選択され、或いは N R_{4c} R_{4d} 基の場合には R_{4c} および R_{4d} はそれらが結合している窒素原子と一緒にになって未置換であるかもしくは置換されたピロリジニル、ピペリジニルまたはモルホリニル基を形成し、

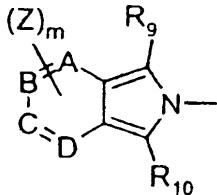
X は独立してハロゲン、O H、メルカプト、ニトロ、ハロ - C₁₋₈ - アルキル、C₁₋₈ アルコキシ、チオ - C₁₋₈ - アルキル、C₁₋₈ - アルキル - アミノ、ジ(C₁₋₈ - アルキル -)アミノ、ホルミル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、C₁₋₈ アルキル - C O - O - 、C₁₋₈ アルキル - C O - N H - 、カルボキサミド、アリール、置換された - アリール、ヘテロアリール、置換された - ヘテロアリール、C N、アミン、C₃₋₆ シクロアルキル、場合により F、C₁、O H、C₁₋₈ アルコキシルおよび C₁₋₈ アシルオキシよりなる群から選択される 1 個もしくはそれ以上の構成要素により置換されてもよい C₁₋₈ アルキルよりなる群から選択される 0 ~ 4 個の構成要素であり、そして

Y は式 II または III :

【化3】



式II



式III

の基であり、

ここで

R₅、R₆、R₇、およびR₈は各々独立してH、アルキル、CN、ニトロ、C₁₋₈アルキル、ハロ-C₁₋₈-アルキル、ホルミル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、カルボキサミド、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、または置換されたヘテロアリールであるか、或いはR₅およびR₆並びに/またはR₇およびR₈は一緒になってオキソ基を形成し、

R₉およびR₁₀は各々独立してH、ハロゲン、アルキル、OH、CN、メルカプト、ニトロ、C₁₋₈アルキル、ハロ-C₁₋₈-アルキル、C₁₋₈アルコキシリル、チオ-C₁₋₈-アルキル、アミノ、C₁₋₈-アルキル-アミノ、ジ(C₁₋₈-アルキル-)アミノ、ホルミル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、C₁₋₈-アルキル-CO-O-、C₁₋₈-アルキル-CO-NH-、カルボキサミド、アリール、置換された-アリール、アルコキシ、ヘテロアリール、置換された-ヘテロアリール、またはアミンであり、

A、B、C、およびDは5~10員の芳香族またはヘテロ芳香族環を形成するためにC、S、O、およびNから選択され、該ヘテロ芳香族環はS、O、およびNよりなる群から選択される1~4個の構成要素を有し、

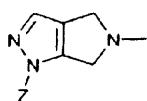
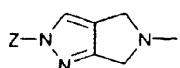
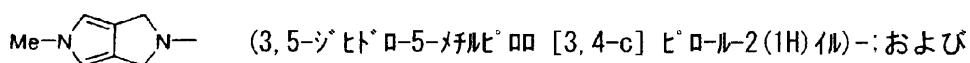
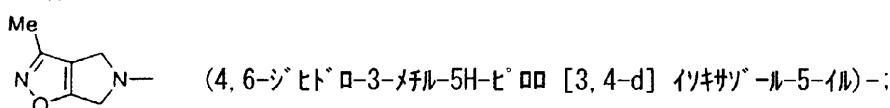
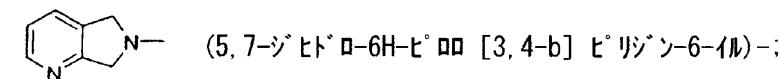
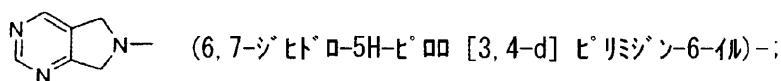
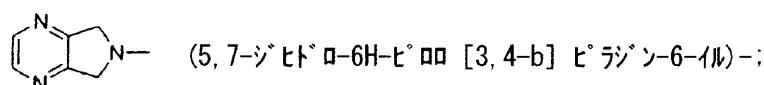
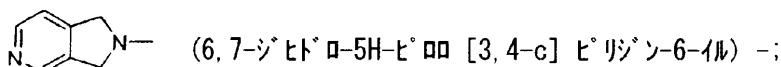
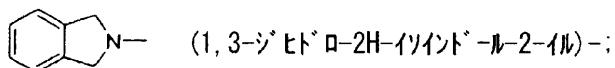
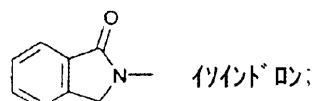
Zはハロゲン、アルキル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、CN、CHO、COアルキル、アミン、(ジアルキルアミノ)アルキル(ここでジアルキルアミノはジメチルアミン、ジエチルアミンから選択される)、モルホリニル、チオモルホリニル、ビロリジニル、もしくはピペリジニル、またはアルコキシ、またはNHCO-(C₁-C₈-アルキル)から選択され、そして

mは0または1である]

の化合物並びにその薬剤学的に許容可能な塩類およびエステル類。

【請求項2】 Yが

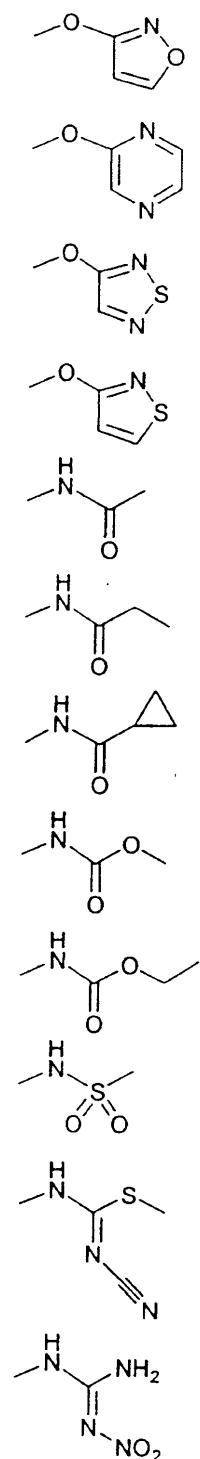
【化4】



よりなる群から選択される請求項1の化合物。

【請求項3】 Rが-NHCOCH₃であるかまたは

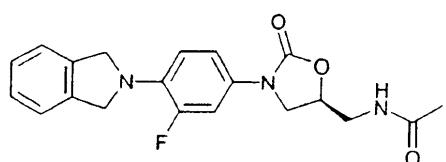
【化5】



よりなる群から選択される請求項 1 の化合物。

【請求項4】 式：

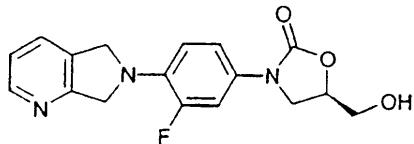
【化 6】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 5】式：

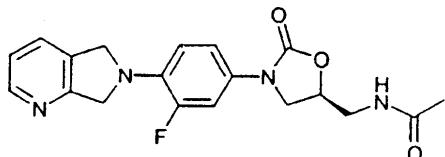
【化 7】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 6】式：

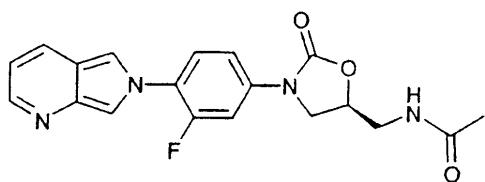
【化 8】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 7】式：

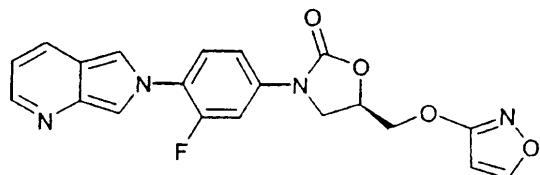
【化 9】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 8】式：

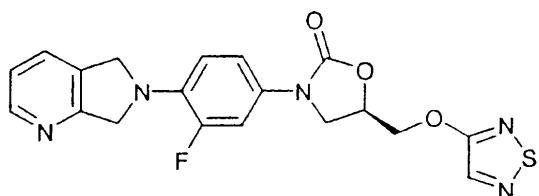
【化 10】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 9】式：

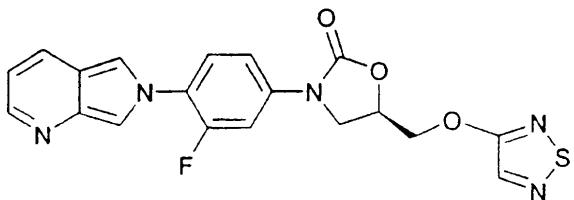
【化 11】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 10】式：

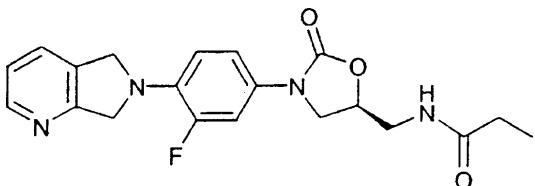
【化 12】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 1 1】 式 :

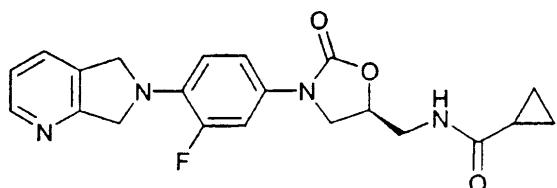
【化 1 3】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 1 2】 式 :

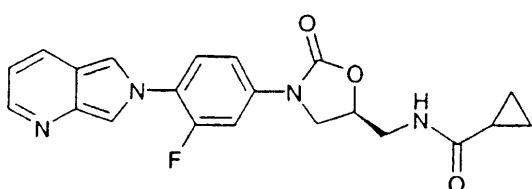
【化 1 4】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 1 3】 式 :

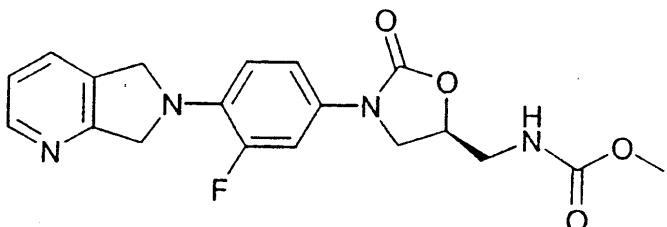
【化 1 5】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 1 4】 式 :

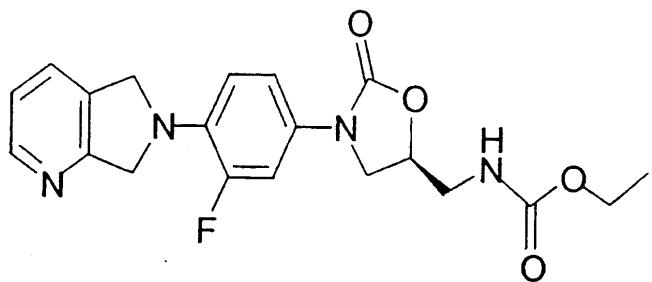
【化 1 6】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 1 5】 式 :

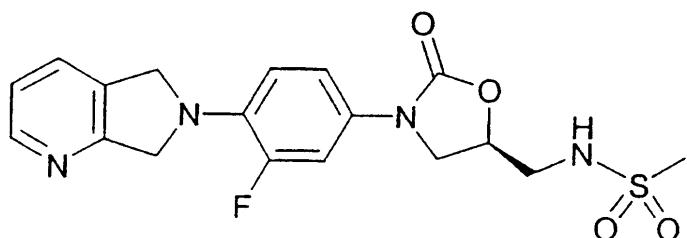
【化17】



を有する請求項1の化合物。

【請求項16】 式：

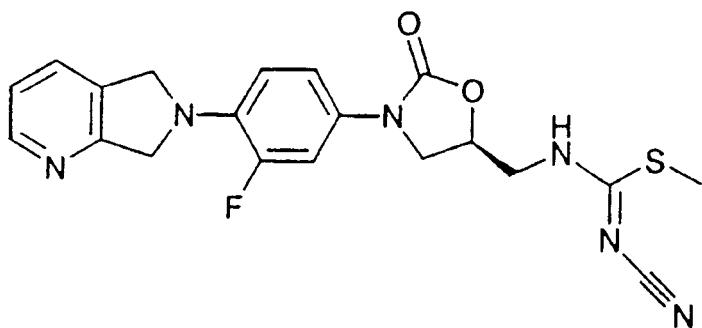
【化18】



を有する請求項1の化合物。

【請求項17】 式：

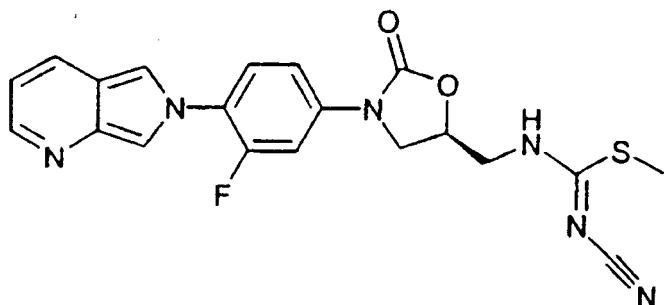
【化19】



を有する請求項1の化合物。

【請求項18】 式：

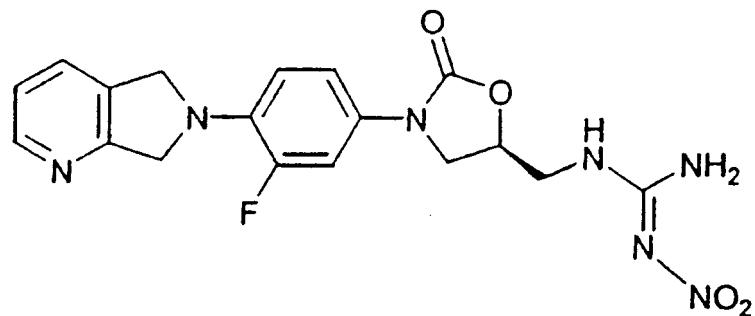
【化20】



を有する請求項1の化合物。

【請求項19】 式：

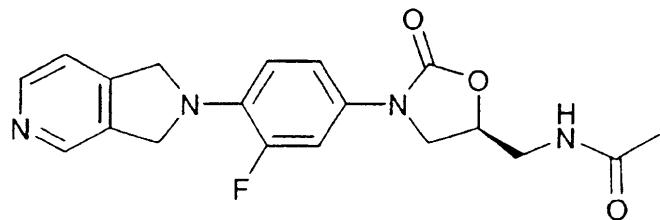
【化21】



を有する請求項1の化合物。

【請求項20】式:

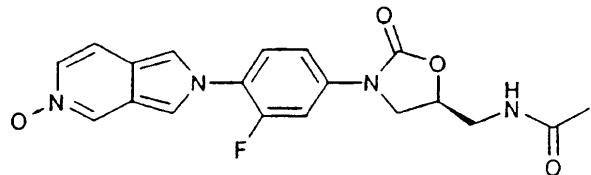
【化22】



を有する請求項1の化合物。

【請求項21】式:

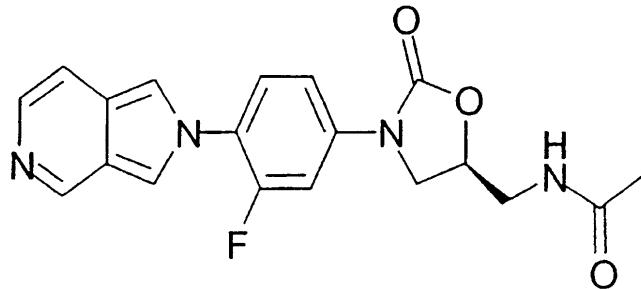
【化23】



を有する請求項1の化合物。

【請求項22】式:

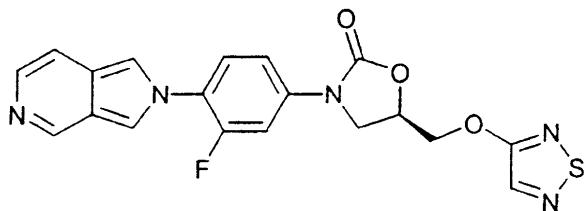
【化24】



を有する請求項1の化合物。

【請求項23】式:

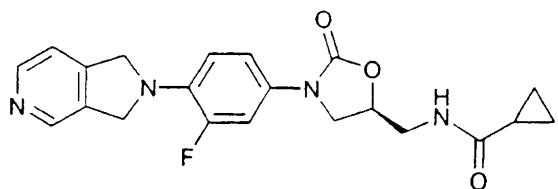
【化25】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 2 4】 式 :

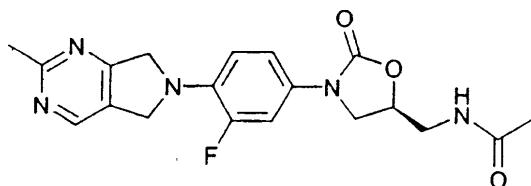
【化 2 6】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 2 5】 式 :

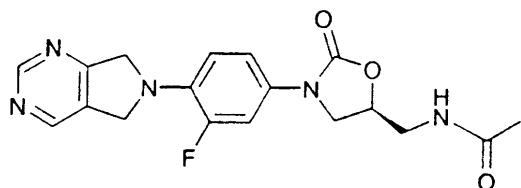
【化 2 7】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 2 6】 式 :

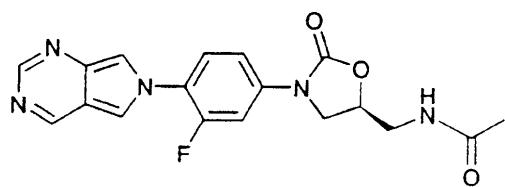
【化 2 8】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 2 7】 式 :

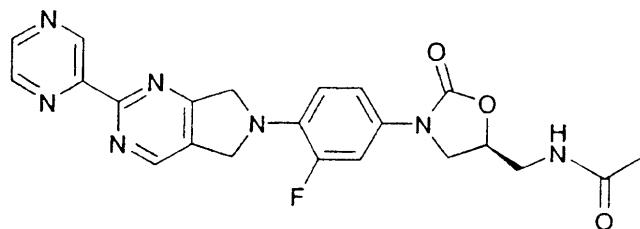
【化 2 9】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 2 8】 式 :

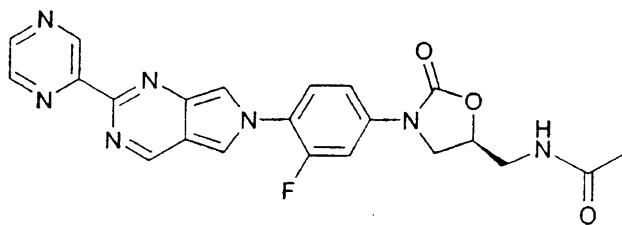
【化 3 0】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項29】 式：

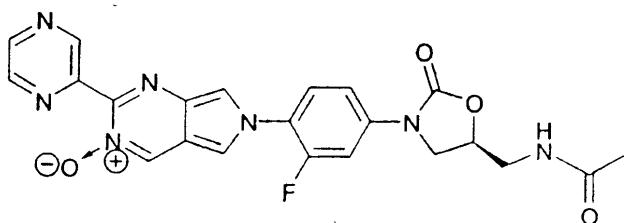
【化 3 1】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 30】 式：

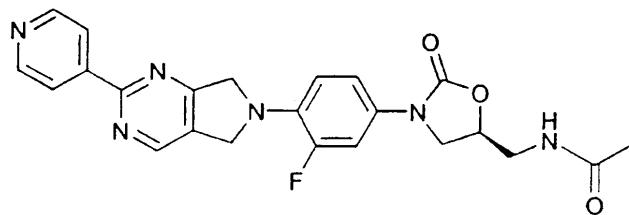
【化 3 2】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 3 1】 式：

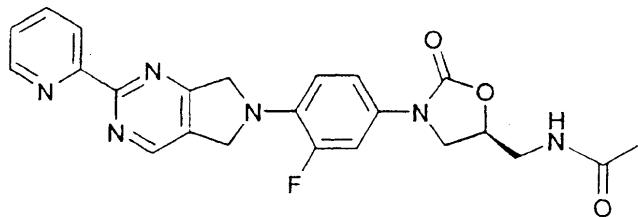
【化 3 3】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 3 2】 式：

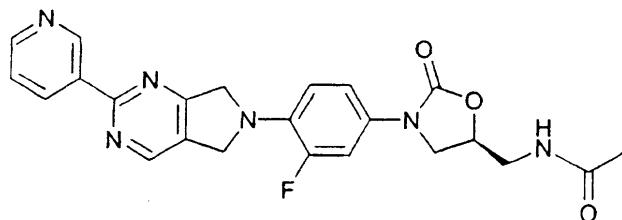
【化 3 4】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 3 3】 式 :

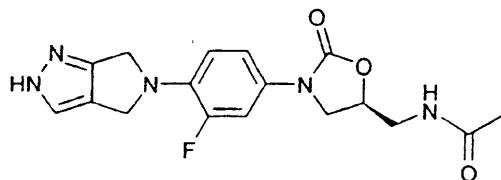
【化 3 5】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 3 4】 式 :

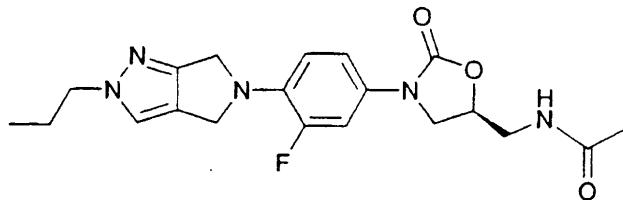
【化 3 6】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 3 5】 式 :

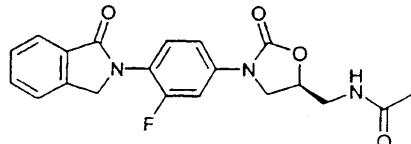
【化 3 7】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 3 6】 式 :

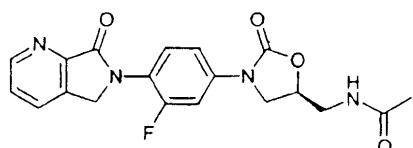
【化 3 8】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 3 7】 式 :

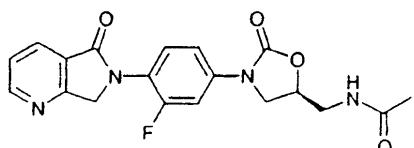
【化 3 9】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 3 8】 式：

【化 4 0】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 3 9】 請求項 1 に記載の化合物および薬剤学的に許容可能な担体を含んで
なる薬剤組成物。

【請求項40】 細菌感染により引き起こされるかまたはそれが一因である症狀のある患者を処置する方法であつて、該哺乳動物に治療に有効な量の請求項1に記載の化合物を投与することを含んでなる方法。

【請求項41】 患者が細菌感染により引き起こされるかまたはそれが一因である症状を患うことを予防する方法であって、患者に予防に有効な薬用量の請求項1に記載の化合物を投与することを含んでなる方法。

【請求項42】 該症状が市中感染肺炎(community-acquired pneumonia)、上部および下部気道感染症、皮膚および軟質組織感染症、骨および関節感染症並びに院内感染肺感染症よりなる群から選択される請求項40または41の方法。

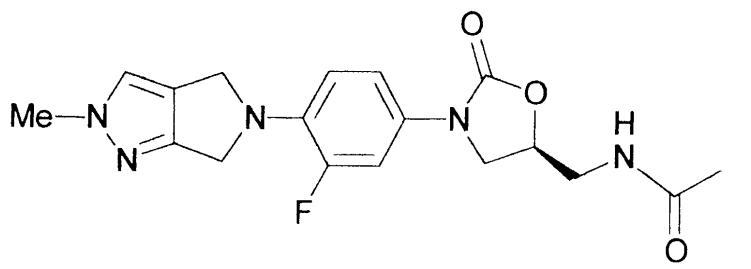
【請求項 4 3】 該細菌が黄色葡萄球菌(*S.aureus*)、表皮葡萄球菌(*S.epidermidis*)、肺炎連鎖球菌(*S.pneumoniae*)、化膿連鎖球菌(*S.pyogenes*)、腸球菌種(*Enterococcus spp.*)、モラクセラ・カタールハリス(*Moraxella catarrhalis*)およびインフルエンザ菌(*H.influenzae*)よりなる群から選択される請求項 4 0 または 4 1 の方法。

【請求項 4-4】 該細菌がグラム-陽性球菌である請求項 4-0 または 4-1 の方法。

【請求項45】該グラム-陽性球菌が薬剤-耐性である請求項44の方法。

【請求項 4 6】 式：

【式41】



を有する化合物。