

【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 0 7 D 413/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/4162 (2006.01)

A 6 1 K 31/422 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 413/10

A 6 1 K 31/4162

A 6 1 K 31/422

A 6 1 K 31/437

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 31/04

C 0 7 D 471/04 1 0 4 H

C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z

C 0 7 D 487/04 1 3 8

C 0 7 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

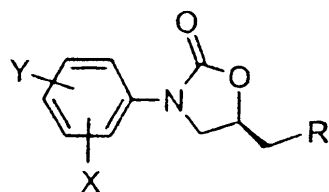
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 式 1

【化 1】

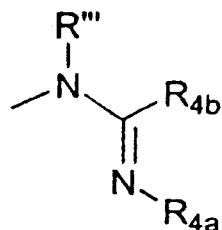


式 I

[式中、

R は OH、O - アリール、O - ヘテロアリール、N₃、OR、OSO₂R、- NR
R、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 tert - ブトキシカルボニル、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いてもよい炭素数 6 までの直鎖状もしくは分枝鎖状のアルキル、 $-CO_2-R_1$ 、 $-CO-R_1$ 、 $-CO-SR_1$ 、 $-CS-R_1$ 、 $P(O)(OR_2)(OR_3)$ 、および $-SO_2-R_4$ よりなる群から選択され、ここで

R_1 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、OH、シアノ、3 個までのハロゲン原子により置換されていてもよい) および $-NR_5$ 、 R_6 (R_5 および R_6 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、

R_2 および R_3 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

R_4 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 CN、 COR_{4c} 、 $COOR_{4c}$ 、 $CONHR_{4c}$ 、 $CO-NR_{4c}R_{4d}$ 、 SO_2R_{4c} 、 SO_2NHR_{4c} 、 $SO_2-NR_{4c}R_{4d}$ 、または NO_2 であり、

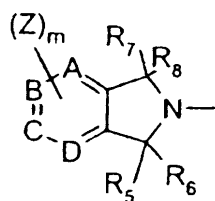
R_{4b} は H、アルキル、 OR_{4c} 、 SR_{4c} 、アミノ、 NHR_{4c} 、 $NR_{4c}R_{4d}$ 、(C1 - C8) アルキルアリアルまたはモノ - 、ジ - 、トリ、およびペル - ハロ (C1 - C8) アルキルであり、

R_{4c} および R_{4d} は独立して H、アルキル、アリアルから選択され、或いは $NR_{4c}R_{4d}$ 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あ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、

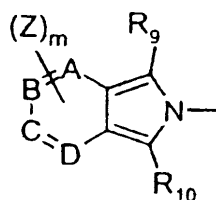
X は独立してハロゲン、OH、メルカプト、ニトロ、ハロ - C_{1-8} - アルキル、 C_{1-8} アルコキシ、チオ - C_{1-8} - アルキル、 C_{1-8} - アルキル - アミノ、ジ (C_{1-8} - アルキル -) アミノ、ホルミル、カルボキシ、アルコキシカルボニル、 C_{1-8} アルキル - $CO-O-$ 、 C_{1-8} アルキル - $CO-NH-$ 、カルボキサミド、アリアル、置換された - アリアル、ヘテロアリアル、置換された - ヘテロアリアル、CN、アミン、 C_{3-6} シクロアルキル、場合により F、Cl、OH、 C_{1-8} アルコキシおよび C_{1-8} 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いてもよい C_{1-8} 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

R_5 、 R_6 、 R_7 、および R_8 は各々独立してH、アルキル、CN、ニトロ、 C_{1-8} アルキル、ハロ- C_{1-8} -アルキル、ホルミル、カルボキシ、アルコシカルボニル、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 R_5 および R_6 並びに/または R_7 および R_8 は一緒になってオキソ基を形成し、

R_9 および R_{10} 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、 C_{1-8} アルキル、ハロ- C_{1-8} -アルキル、 C_{1-8} アルコシル、チオ- C_{1-8} -アルキル、アミノ、 C_{1-8} -アルキル-アミノ、ジ(C_{1-8} -アルキル-)アミノ、ホルミル、カルボキシ、アルコシカルボニル、 C_{1-8} -アルキル-CO-O-、 C_{1-8} -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、

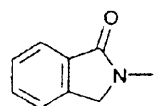
Zはハロゲン、アルキル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、CN、CHO、COアルキル、アミン、(ジアルキルアミノ)アルキル(ここでジアルキルアミノはジメチルアミン、ジエチルアミンから選択される)、モルホリニル、チオモルホリニル、ピロリジニル、もしくはピペリジニル、またはアルコシ、またはNHCO-(C_1 - C_8 -アルキル)から選択され、そして

mは0または1である]

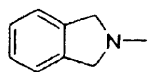
の化合物並びにその薬剤学的に許容可能な塩類およびエステル類。

【請求項2】 Yが

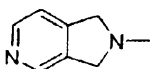
【化4】



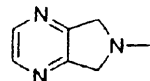
イソインドロン;



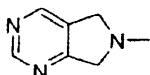
(1,3-ジヒドロ-2H-イソインドル-2-イル)-;



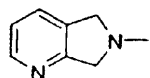
(6,7-ジヒドロ-5H-ピリジン [3,4-c] ピリジン-6-イル)-;



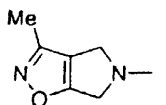
(5,7-ジヒドロ-6H-ピリジン [3,4-b] ピリジン-6-イル)-;



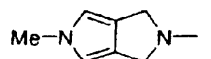
(6,7-ジヒドロ-5H-ピリジン [3,4-d] ピリジン-6-イル)-;



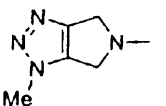
(5,7-ジヒドロ-6H-ピリジン [3,4-b] ピリジン-6-イル)-;



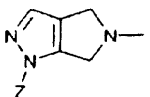
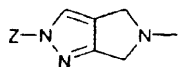
(4,6-ジヒドロ-3-メチル-5H-ピリジン [3,4-d] イソキサゾール-5-イル)-;



(3,5-ジヒドロ-5-メチルピリジン [3,4-c] ピロル-2(1H)イル)-;および



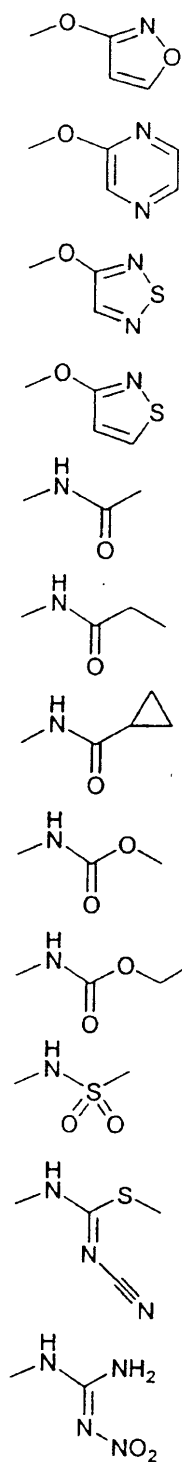
(4,6-ジヒドロ-1-メチルピリジン [3,4-d] -1,2,3-トリアゾール-5(1H)-イル)



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

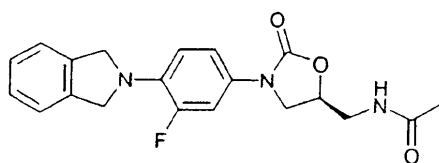
【化5】



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：

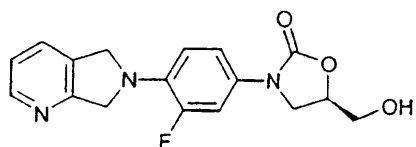
【化 6】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 5】 式：

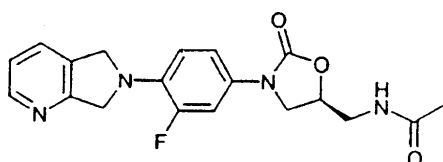
【化 7】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 6】 式：

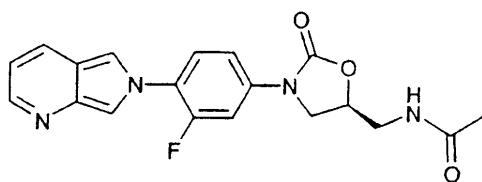
【化 8】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 7】 式：

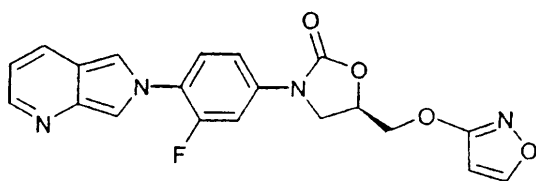
【化 9】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 8】 式：

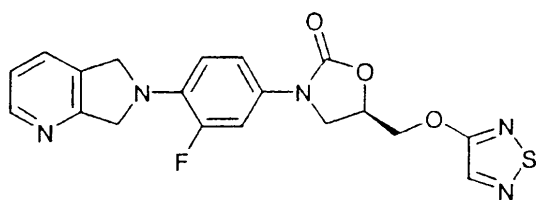
【化 10】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 9】 式：

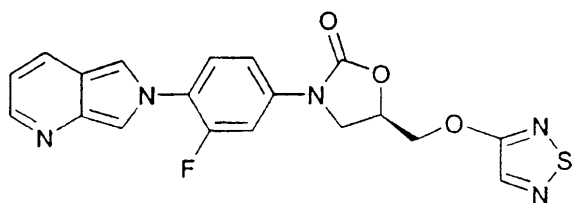
【化 11】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 10】 式：

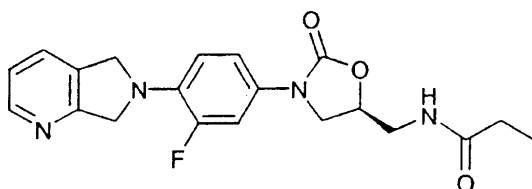
【化 12】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 1 1】 式：

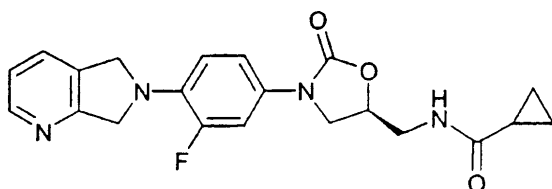
【化 1 3】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 1 2】 式：

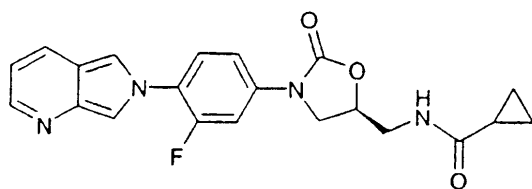
【化 1 4】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 1 3】 式：

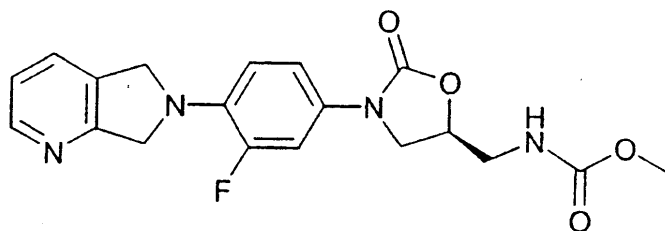
【化 1 5】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 1 4】 式：

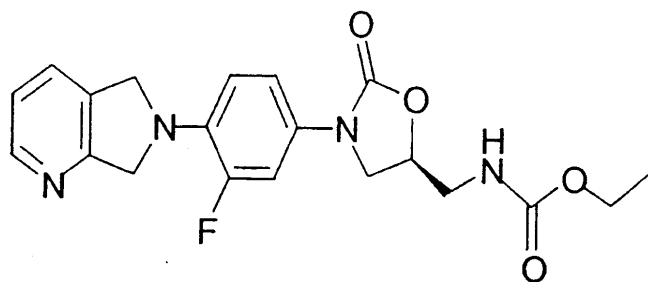
【化 1 6】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 1 5】 式：

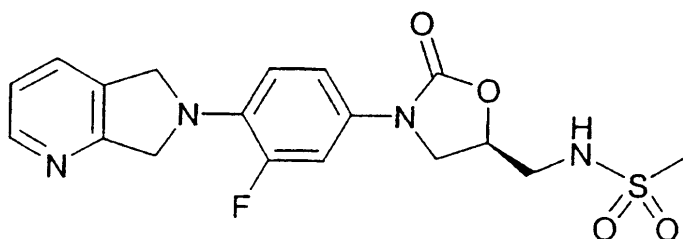
【化 1 7】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 1 6】 式：

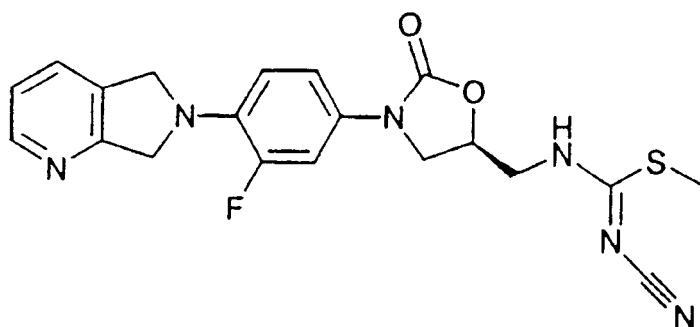
【化 1 8】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 1 7】 式：

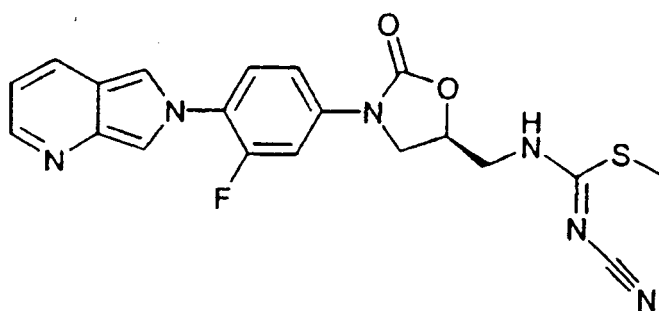
【化 1 9】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 1 8】 式：

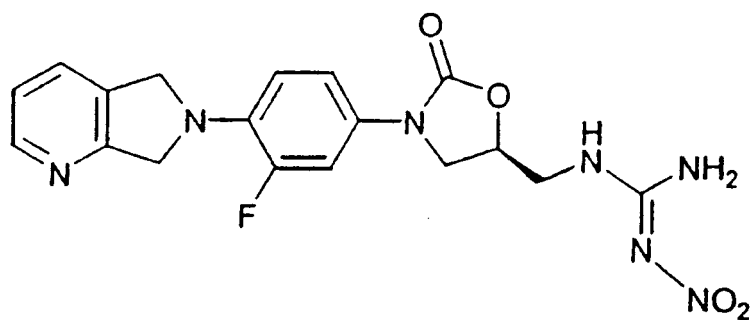
【化 2 0】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 1 9】 式：

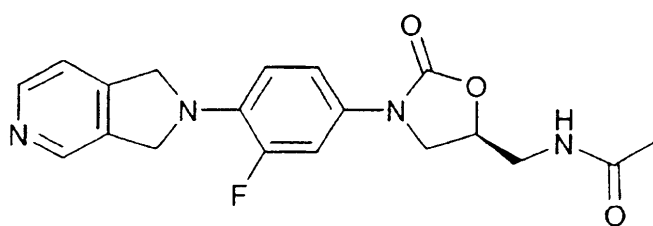
【化 2 1】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 2 0】 式：

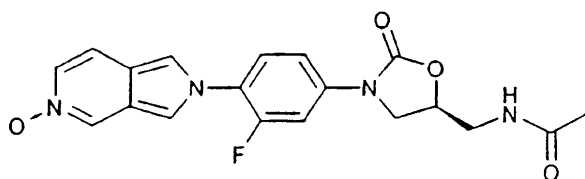
【化 2 2】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 2 1】 式：

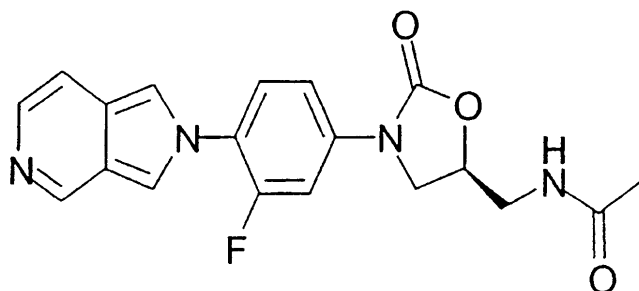
【化 2 3】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 2 2】 式：

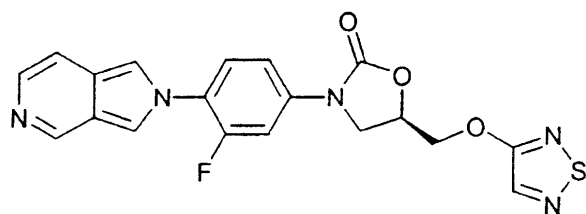
【化 2 4】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 2 3】 式：

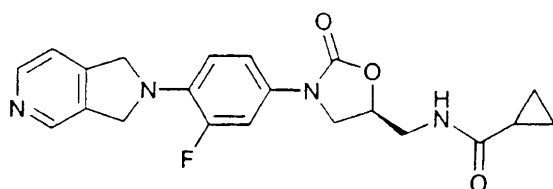
【化 2 5】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 2 4】 式：

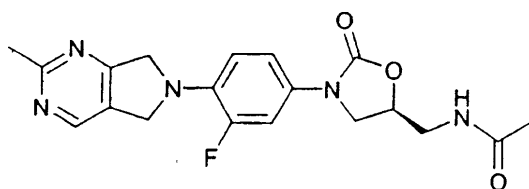
【化 2 6】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 2 5】 式：

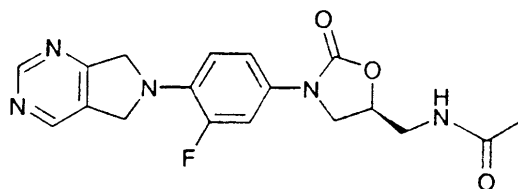
【化 2 7】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 2 6】 式：

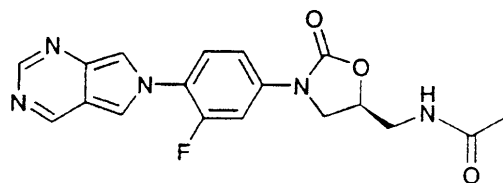
【化 2 8】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 2 7】 式：

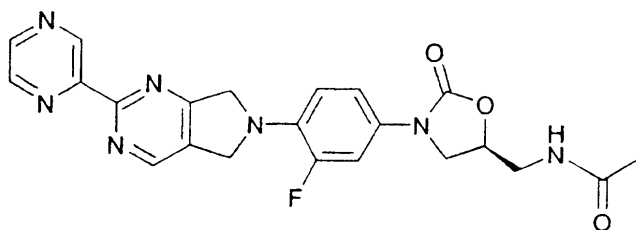
【化 2 9】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 2 8】 式：

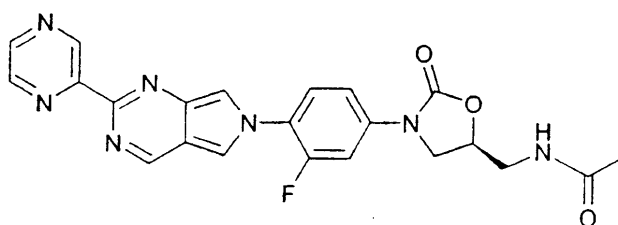
【化 3 0】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 2 9】 式：

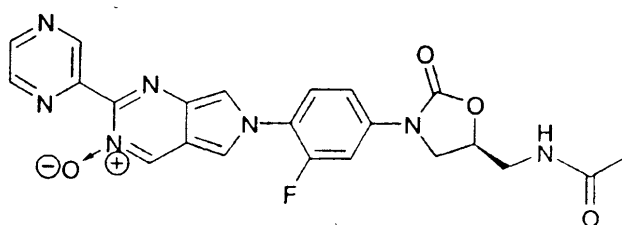
【化 3 1】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 3 0】 式：

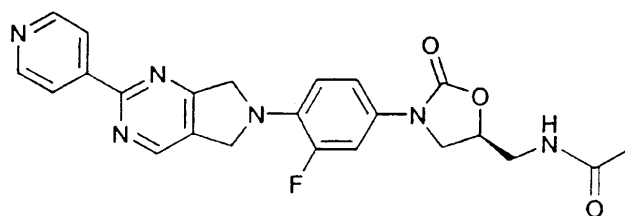
【化 3 2】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 3 1】 式：

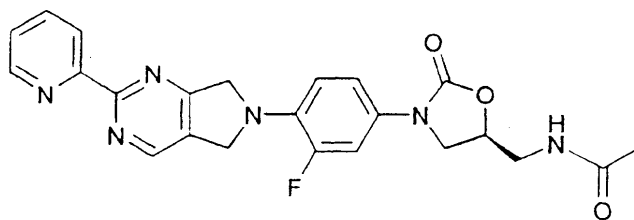
【化 3 3】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 3 2】 式：

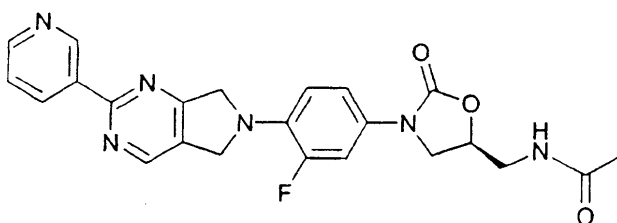
【化 3 4】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 33】 式：

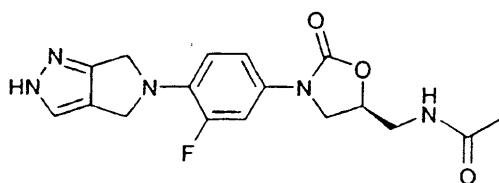
【化 35】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 34】 式：

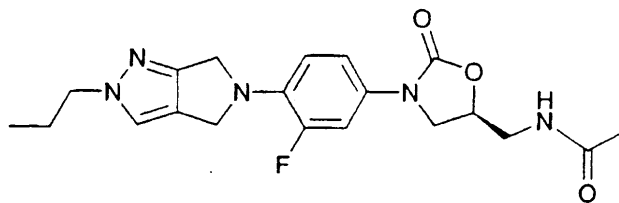
【化 36】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 35】 式：

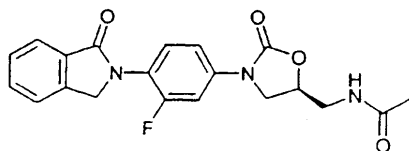
【化 37】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 36】 式：

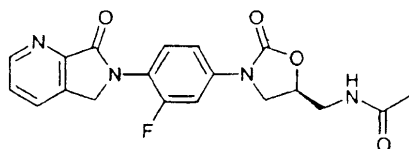
【化 38】



を有する請求項 1 の化合物。

【請求項 37】 式：

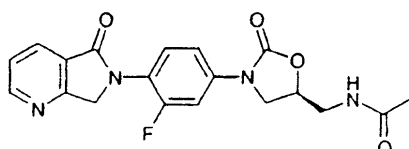
【化 3 9】



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 4 0】 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のある患者を処置する方法であって、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 4 1】 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 4 2】 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炎感染症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。

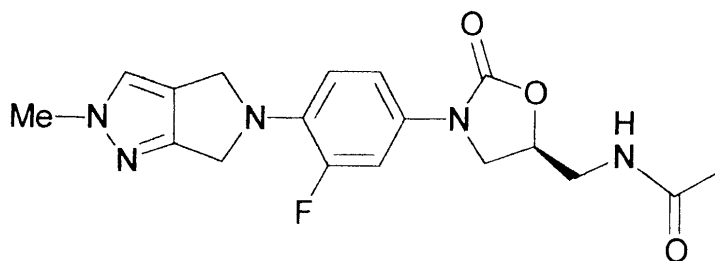
【請求項 4 3】 該細菌が黄色葡萄球菌 (*S.aureus*)、表皮葡萄球菌 (*S.epidermidis*)、肺炎連鎖球菌 (*S.pneumoniae*)、化膿連鎖球菌 (*S.pyogenes*)、腸球菌種 (*Enterococcus* spp.)、モラクセラ・カタールハリス (*Moraxella catarrhalis*) およびインフルエンザ菌 (*H.influenzae*) よりなる群から選択される請求項 4 0 または 4 1 の方法。

【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 4 5】 該グラム - 陽性球菌が薬剤 - 耐性である請求項 4 4 の方法。

【請求項 4 6】 式：

【式 4 1】



を有する化合物。