

【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21年4月9日(2009.4.9)

【公表番号】特表2008-531713(P2008-531713A)

【公表日】平成20年8月14日(2008.8.14)

【年通号数】公開・登録公報2008-032

【出願番号】特願2007-558191(P2007-558191)

【国際特許分類】

C 07 K 7/06 (2006.01)

A 61 K 38/00 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

【F I】

C 07 K 7/06 Z N A

A 61 K 37/02

A 61 P 31/04

【手続補正書】

【提出日】平成21年2月18日(2009.2.18)

【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

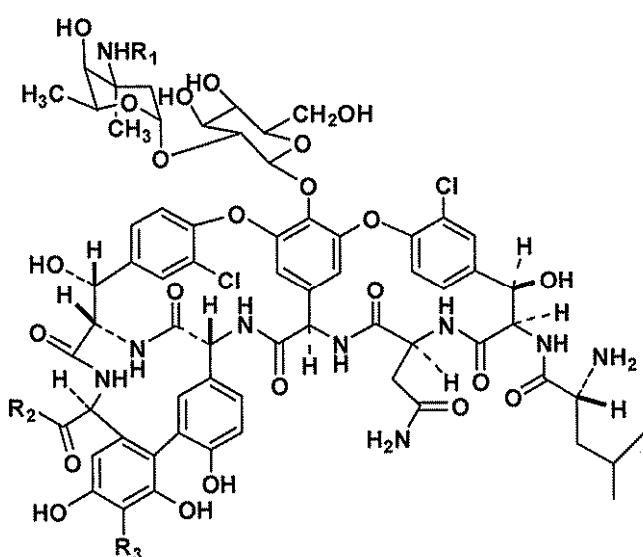
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下:

【化1】



(I)

の式を有する化合物、またはその薬学的に許容される塩、エスエル、溶媒和物、立体異性体、互変異性体もしくはプロドラッグであって、

式中、R<sub>1</sub>は、C(=O)CR<sub>7</sub>R<sub>7a</sub>NR<sub>8</sub>R<sub>8a</sub>であり、ビフェニルを含まず、式中

、

R<sub>7</sub>およびR<sub>7a</sub>は、独立して水素、天然もしくは非天然のアミノ酸の側鎖、アルキル

、またはハロゲン、ヒドロキシ、アルコキシ、アルコキシアルコキシ、カルボキシリ、カルボキシリエステル、-C(=O)NR<sub>8</sub>R<sub>8a</sub>、-NR<sub>8</sub>R<sub>8a</sub>、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、メルカブト、またはチオアルコキシからなる群から選択される1以上の置換基で置換されたアルキルであるか、またはR<sub>7</sub>およびR<sub>7a</sub>は、それらが結合している原子と一緒にになってシクロアルキル環を形成し、該シクロアルキル環は、必要に応じて置換されたO、N、およびSからなる群から選択されるヘテロ原子を必要に応じて含んでいてもよく；

R<sub>8</sub>およびR<sub>8a</sub>は、独立して、水素および非置換または置換された、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、アリール、アリールアルキル、アルキルアリール、およびヘテロアリールからなる群から選択され、該アリール、アルキルアリール、アリールアルキルまたはヘテロアリール基は、1以上の必要に応じて置換されたアリール、ヘテロアリール、または縮合環を必要に応じて含むか、またはR<sub>8</sub>およびR<sub>8a</sub>は、それらが結合している原子と一緒にになってシクロアルキル環を形成し、該シクロアルキル環は、必要に応じて、置換されたO、N、およびSからなる群から選択されるヘテロ原子を必要に応じて含み；

R<sub>2</sub>は、

- (1) OH、
- (2) 1-アダマンタンアミノ、
- (3) 2-アダマンタンアミノ、
- (4) 3-アミノ-1-アダマンタンアミノ、
- (5) 1-アミノ-3-アダマンタンアミノ、
- (6) 3-低級アルキルアミノ-1-アダマンタンアミノ、
- (7) 1-低級アルキルアミノ-3-アダマンタンアミノ、
- (8) アミノ、

(9) NR<sub>9</sub>R<sub>9a</sub>（式中、R<sub>9</sub>およびR<sub>9a</sub>は、独立して水素、低級アルキルまたは置換低級アルキルからなる群から選択される）

からなる群から選択されるか、または

R<sub>9</sub>およびR<sub>9a</sub>は、それらが結合している原子と一緒にになって3員から10員のヘテロシクロアルキル環を形成し、該環は、

- (a) ハロゲン、
- (b) ヒドロキシ、
- (c) C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-アルコキシ、
- (d) C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-アルコキシ-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-アルコキシ、
- (e) オキソ、
- (f) C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-アルキル、
- (g) ハロ-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-アルキル、および
- (h) C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-アルコキシ-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-アルキル

からなる群から独立して選択される1以上の置換基で必要に応じて置換されていてもよく；

R<sub>3</sub>は、水素およびアミノ低級アルキルからなる群から選択され、該アミノ低級アルキルのアミノ基は、非置換または置換されたアルキル、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール、アリールアルキル、アルキルアリール、アルコキシ、アリールオキシ、置換アルコキシ、および置換アリールオキシでさらに置換されている、化合物。

#### 【請求項2】

化合物N'-p-C<sub>8</sub>H<sub>17</sub>O BnHNCH<sub>2</sub>COデスマチル-パンコマイシン。

#### 【請求項3】

化合物N'-p-C<sub>8</sub>H<sub>17</sub>O BnHNCH(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)COデスマチル-パンコマイシン。

#### 【請求項4】

治療的有効量の請求項 1 記載の化合物を、薬学的に許容される担体と一緒に含む、医薬組成物。

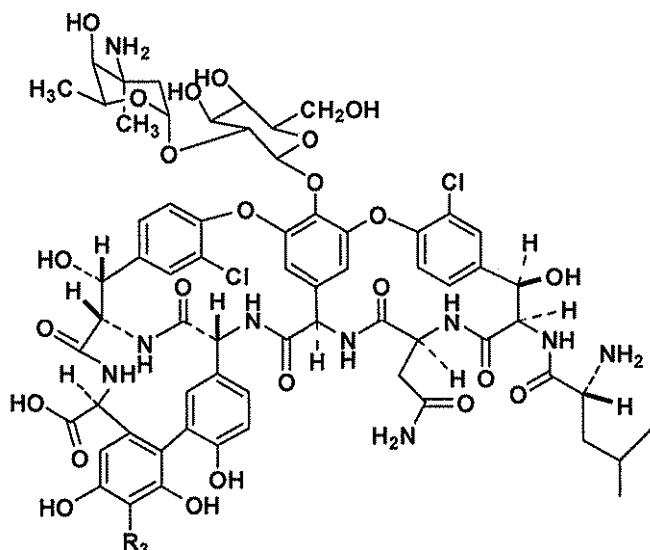
【請求項 5】

抗菌学的有効量の請求項 1 記載の化合物と薬学的に許容される担体とを含む、抗菌治療を必要とする哺乳動物の治療のための組成物。

【請求項 6】

デスマチル - バンコマイシン骨格：

【化 2】



(A)

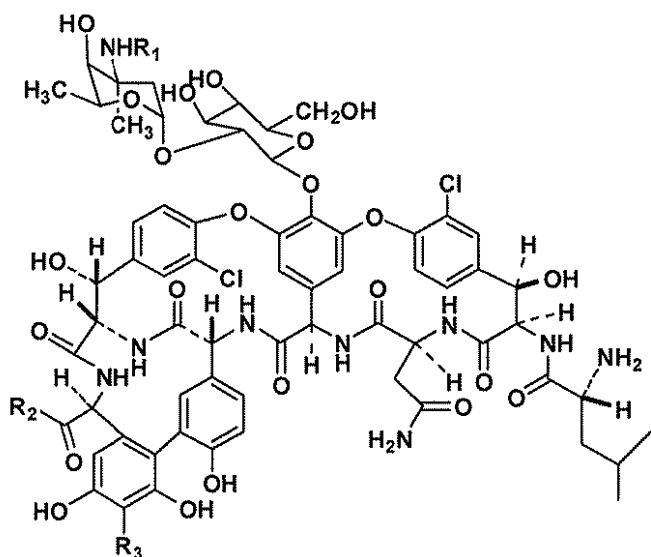
を、

( a ) 該化合物のアミノ置換糖部分におけるアミノ置換基の、構造 - C ( = O ) C R <sub>7</sub> R <sub>7\_a</sub> N R <sub>8</sub> R <sub>8\_a</sub> を有するアシル基によるアシル化、

( b ) 該化合物の大環状の環における酸部分の、R <sub>2</sub> によって定義される置換アミドによる変換；

( c ) ( a ) と ( b ) との組み合わせ；  
からなる群から選択される技術によって修飾し、式：

【化3】



(I)

(式中、R<sub>1</sub> ~ R<sub>7</sub>、R<sub>7a</sub>、R<sub>8</sub>、およびR<sub>8a</sub>は、本明細書で定義した意味を有する)

を有する化合物を形成させることを含む、請求項1記載の化合物の製造方法。