

【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 0 7 K 7/06 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 K 7/06 Z N A

A 6 1 K 37/02

A 6 1 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

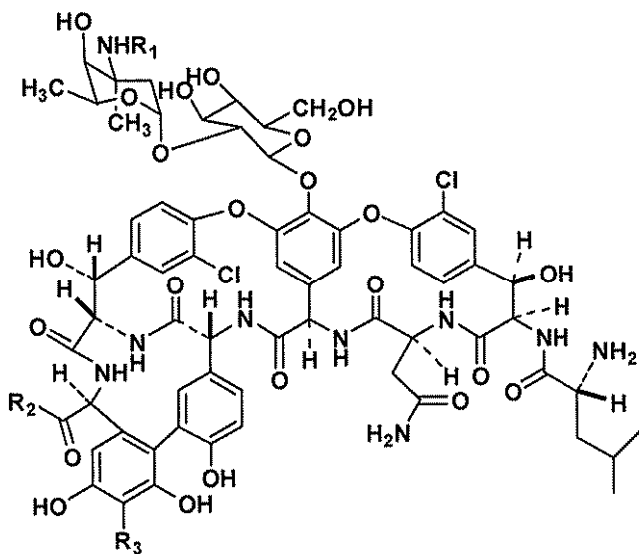
【補正の内容】

【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_1 は、 $C(=O)CR_7R_{7a}NR_8R_{8a}$ であり、ビフェニルを含まず、式中

R_7 および R_{7a} 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、アルコシアルコキシ、カルボキシル、カルボキシルエステル、 $-C(=O)NR_8R_{8a}$ 、 $-NR_8R_{8a}$ 、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、メルカプト、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_7 および R_{7a} は、それらが結合している原子と一緒に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もよく、

R_8 および R_{8a} 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、アリーラルキル、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、アリーラ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_8 および R_{8a} は、それらが結合している原子と一緒に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_2 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_9R_{9a} (式中、 R_9 および R_{9a} 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_9 および R_{9a} は、それらが結合している原子と一緒に 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) $C_1 - C_3$ - アルコキシ、
- (d) $C_1 - C_3$ - アルコキシ - $C_1 - C_3$ - アルコキシ、
- (e) オキシ、
- (f) $C_1 - C_3$ - アルキル、
- (g) ハロ - $C_1 - C_3$ - アルキル、および
- (h) $C_1 - C_3$ - アルコキシ - $C_1 - C_3$ - 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_3 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、アリーラルキル、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 $N' - p - C_8H_{17}OBnHNCH_2CO$ デスメチル - バンコマイシン。

【請求項 3】

化合物 $N' - p - C_8H_{17}OBnHNCH(CH_3)CO$ デスメチル - バンコマイシン。

【請求項 4】

治療の有効量の請求項 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。

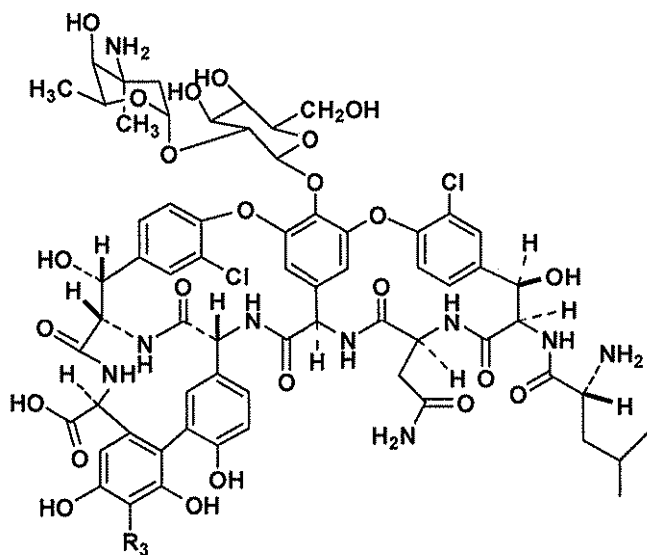
【請求項 5】

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】

デスメチル - バンコマイシン骨格：

【化 2】



(A)

を、

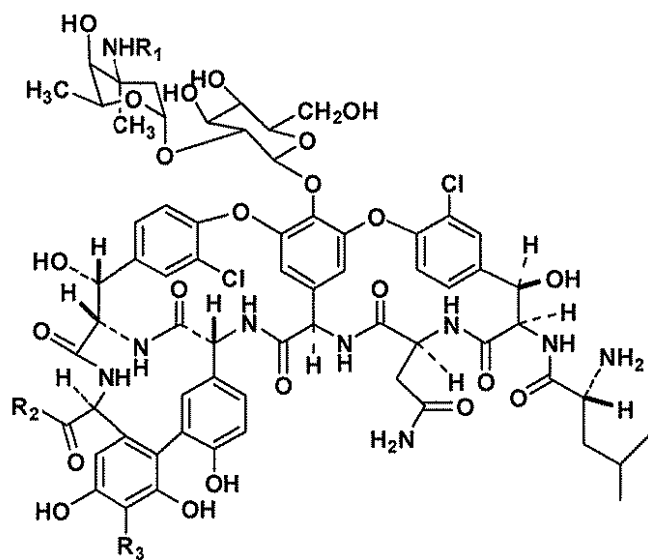
(a) 該化合物のアミノ置換糖部分におけるアミノ置換基の、構造 - C(=O)CR₇R_{7a}NR₈R_{8a}を有するアシル基によるアシル化、

(b) 該化合物の大環状の環における酸部分の、R₂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_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、および R_5 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。