

【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10月27日(2005.10.27)

【公開番号】特開2000-344773(P2000-344773A)

【公開日】平成12年12月12日(2000.12.12)

【出願番号】特願平10-203730

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 477/00

A 6 1 K 31/40

【F I】

C 0 7 D 487/04 1 3 4

A 6 1 K 31/40 A D Z

【手続補正書】

【提出日】平成17年7月7日(2005.7.7)

【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

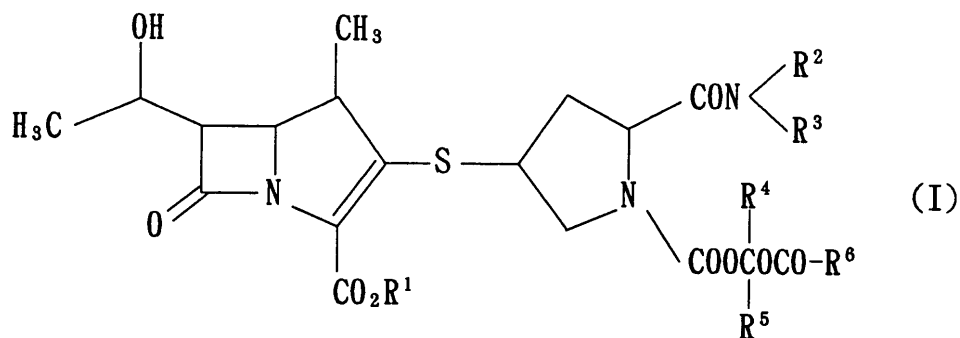
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(I)

【化1】



〔式中、R¹ は生体内で加水分解される修飾基を、R² および R³ は同一または異なってもよく、それぞれ低級アルキル基を、R⁴ および R⁵ は同一または異なってもよく、それぞれ水素原子または低級アルキル基を、R⁶ は炭素数1～10のアルキル基を表す〕で示されるカルバペネム化合物。

【請求項2】

〔1〕 ピバロイルオキシメチル (1R, 5S, 6S) - 2 - [(3S, 5S) - (5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-アセチルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ] - 6 - [(1R) - 1-ヒドロキシエチル] - 1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート、

〔2〕 ピバロイルオキシメチル (1R, 5S, 6S) - 2 - [(3S, 5S) - (5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-プロピオニルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ] - 6 - [(1R) - 1-ヒドロキシエチル] - 1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート、

〔3〕 ピバロイルオキシメチル (1R, 5S, 6S) - 2 - [(3S, 5S) - (5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-イソブチリルオキシメチルオキシカルボニル

) ピロリジン-3-イルチオ]-6-[(1R)-1-ヒドロキシエチル]-1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート、

[4] ピバロイルオキシメチル (1R, 5S, 6S)-2-[(3S, 5S)-(5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-ピバロイルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ]-6-[(1R)-1-ヒドロキシエチル]-1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート、

[5] ピバロイルオキシメチル (1R, 5S, 6S)-2-[(3S, 5S)-(5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-イソバレリルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ]-6-[(1R)-1-ヒドロキシエチル]-1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート、

[6] ピバロイルオキシメチル (1R, 5S, 6S)-2-[(3S, 5S)-(5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-tert-ブチルアセチルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ]-6-[(1R)-1-ヒドロキシエチル]-1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート、

[7] 1-シクロヘキシルオキシカルボニルオキシエチル (1R, 5S, 6S)-2-[(3S, 5S)-(5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-イソブチリルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ]-6-[(1R)-1-ヒドロキシエチル]-1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート、および

[8] 1-エトキシカルボニルオキシエチル (1R, 5S, 6S)-2-[(3S, 5S)-(5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-ピバロイルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ]-6-[(1R)-1-ヒドロキシエチル]-1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレートからなる群より選ばれる請求項1記載のカルバペネム化合物。

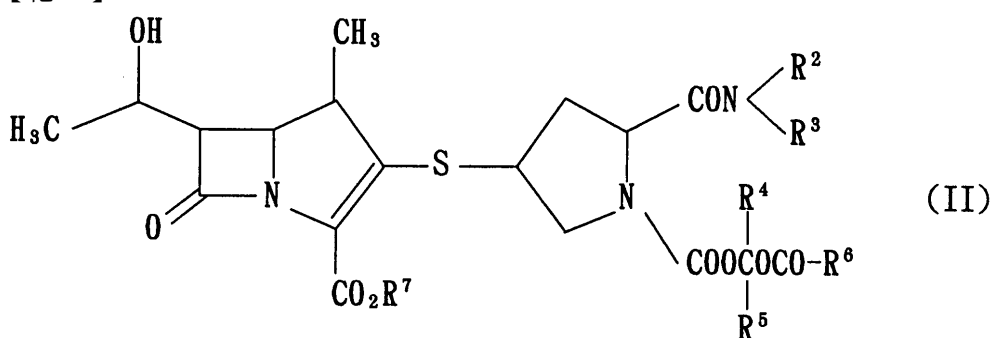
【請求項3】

請求項1または2記載のカルバペネム化合物を有効成分として含有する経口投与用抗菌剤。

【請求項4】

一般式 (I I)

【化2】



〔式中、 R^2 および R^3 は同一または異なってもよく、それぞれ低級アルキル基を、 R^4 および R^5 は同一または異なってもよく、それぞれ水素原子または低級アルキル基を、 R^6 は炭素数1～10のアルキル基を、 R^7 は水素原子またはカルボキシル基の保護基を表す〕で示されるカルバペネム化合物またはその塩。

【請求項5】

[1] p-ニトロベンジル (1R, 5S, 6S)-2-[(3S, 5S)-(5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-プロピオニルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ]-6-[(1R)-1-ヒドロキシエチル]-1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート、

[2] p-ニトロベンジル (1R, 5S, 6S)-2-[(3S, 5S)-(5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-イソブチリルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ]-6-[(1R)-1-ヒドロキシエチル]-1-メチルカル

バペン-2-エム-3-カルボキシレート、

[3] (1R, 5S, 6S)-2-[(3S, 5S)-(5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-プロピオニルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ]-6-[(1R)-1-ヒドロキシエチル]-1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボン酸ナトリウム、および

[4] (1R, 5S, 6S)-2-[(3S, 5S)-(5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-イソブチリルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ]-6-[(1R)-1-ヒドロキシエチル]-1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボン酸ナトリウムからなる群より選ばれる請求項4記載のカルバペネム化合物またはその塩。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0011

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0011】

(2) [1] ピバロイルオキシメチル (1R, 5S, 6S)-2-[(3S, 5S)-(5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-アセチルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ]-6-[(1R)-1-ヒドロキシエチル]-1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート、

[2] ピバロイルオキシメチル (1R, 5S, 6S)-2-[(3S, 5S)-(5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-プロピオニルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ]-6-[(1R)-1-ヒドロキシエチル]-1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート、

[3] ピバロイルオキシメチル (1R, 5S, 6S)-2-[(3S, 5S)-(5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-イソブチリルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ]-6-[(1R)-1-ヒドロキシエチル]-1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート、

[4] ピバロイルオキシメチル (1R, 5S, 6S)-2-[(3S, 5S)-(5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-ピバロイルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ]-6-[(1R)-1-ヒドロキシエチル]-1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート、

[5] ピバロイルオキシメチル (1R, 5S, 6S)-2-[(3S, 5S)-(5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-イソバレリルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ]-6-[(1R)-1-ヒドロキシエチル]-1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート、

[6] ピバロイルオキシメチル (1R, 5S, 6S)-2-[(3S, 5S)-(5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-tert-ブチルアセチルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ]-6-[(1R)-1-ヒドロキシエチル]-1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート、

[7] 1-シクロヘキシルオキシカルボニルオキシエチル (1R, 5S, 6S)-2-[(3S, 5S)-(5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-イソブチリルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ]-6-[(1R)-1-ヒドロキシエチル]-1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート、および

[8] 1-エトキシカルボニルオキシエチル (1R, 5S, 6S)-2-[(3S, 5S)-(5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-ピバロイルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ]-6-[(1R)-1-ヒドロキシエチル]-1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレートからなる群より選ばれる上記(1)のカルバペネム化合物。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0016

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0016】

(5) [1] p-ニトロベンジル (1R, 5S, 6S) - 2 - [(3S, 5S) - (5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-プロピオニルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ] - 6 - [(1R) - 1-ヒドロキシエチル] - 1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート、

[2] p-ニトロベンジル (1R, 5S, 6S) - 2 - [(3S, 5S) - (5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-イソブチリルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ] - 6 - [(1R) - 1-ヒドロキシエチル] - 1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート、

[3] (1R, 5S, 6S) - 2 - [(3S, 5S) - (5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-プロピオニルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ] - 6 - [(1R) - 1-ヒドロキシエチル] - 1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボン酸ナトリウム、および

[4] (1R, 5S, 6S) - 2 - [(3S, 5S) - (5-N, N-ジメチルアミノカルボニル-1-イソブチリルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ] - 6 - [(1R) - 1-ヒドロキシエチル] - 1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボン酸ナトリウムからなる群より選ばれる 上記(4)記載のカルバペネム化合物またはその塩。

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0017

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0017】

なお、上記(2)に例示された具体例の他に、以下のカルバペネム化合物が好ましいものとして例示することができる。

[1] ビバロイルオキシメチル (1R, 5S, 6S) - 2 - [(3S, 5S) - (5-N-エチル-N-メチルアミノカルボニル-1-プロピオニルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ] - 6 - [(1R) - 1-ヒドロキシエチル] - 1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート、

[2] ビバロイルオキシメチル (1R, 5S, 6S) - 2 - [(3S, 5S) - (5-N, N-ジエチルアミノカルボニル-1-プロピオニルオキシメチルオキシカルボニル)ピロリジン-3-イルチオ] - 6 - [(1R) - 1-ヒドロキシエチル] - 1-メチルカルバペン-2-エム-3-カルボキシレート