

【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3月10日(2005.3.10)

【公表番号】特表2000-515532(P2000-515532A)

【公表日】平成12年11月21日(2000.11.21)

【出願番号】特願平10-507584

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 453/02

A 6 1 K 31/407

A 6 1 K 31/4375

A 6 1 K 31/439

A 6 1 P 31/00

C 0 7 D 455/02

C 0 7 D 471/08

C 0 7 D 487/08

【F I】

C 0 7 D 453/02

A 6 1 K 31/407

A 6 1 K 31/4375

A 6 1 K 31/439

A 6 1 P 31/00

C 0 7 D 455/02

C 0 7 D 471/08

C 0 7 D 487/08

【手続補正書】

【提出日】平成16年6月2日(2004.6.2)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】補正の内容のとおり

【補正方法】変更

【補正の内容】

# 手続補正書

平成16年 6月 2日

特許庁長官殿

1. 事件の表示

平成10年特許願第507584号



2. 補正をする者

氏名(名称) スミスクライン・ピーチャム・パブリック・  
リミテッド・カンパニー

3. 代理人

住所 〒540-0001  
大阪府大阪市中央区城見1丁目3番7号 IMPビル  
青山特許事務所  
電話 06-6949-1261 FAX 06-6949-0361

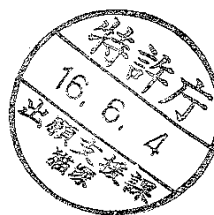
氏名 弁理士 (6214) 青山 葆



4. 補正対象書類名 請求の範囲

5. 補正対象項目名 請求の範囲

6. 補正の内容  
別紙のとおり。



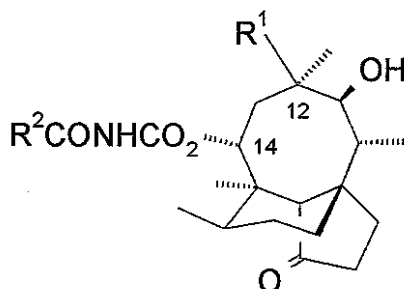
方式  
審査



(別紙)

## 請求の範囲

1. 式(3) :



(3)

[式中、R<sup>1</sup>はビニルまたはエチルであり、

R<sup>2</sup>は基R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>CH<sub>2</sub>-、またはR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>C=CH-であり、ここにR<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>はアザ二環式環システムであるか、あるいはR<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>はそれらが結合する炭素原子と一緒にアザ二環式システムを形成する]で示される化合物、またはその医薬上許容される塩もしくは誘導体。

2. 各アザビシクロ環システムが、アザビシクロ [2. 2. 2] オクチル、アザビシクロ [2. 2. 1] ヘプチル、アザビシクロ [3. 2. 1] オクチル、アザビシクロ [4. 4. 0] デシル、キヌクリジニル、アザビシクロ [3. 2. 1] オクテニル、およびアザビシクロ [3. 3. 1] ノニ-5-イルからなる群より選択される請求項1記載の化合物。

3. (1-アザ-ビシクロ [2. 2. 2] オクタン-4-カルボニル) -カルバミン酸ムチリン14-エステル;

(1-アザ-ビシクロ [2. 2. 2] オクタン-4-カルボニル) -カルバミン酸ムチリン14-エステル塩酸塩;

(1-アザ-ビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-4-カルボニル) -カルバミン酸ムチリン14-エステル;

{ (3S, 4R) -1-アザ-ビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-3-カルボ

ニル} -カルバミン酸ムチリン14-エステル;

{ (3S, 4R) -1-アザ-ビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-4-カルボニル} -カルバミン酸14-デオキシ-19, 20-ジヒドロ-ムチリン14-エステル;

(1-アザ-ビシクロ [2. 2. 2] オクタン-4-カルボニル) -カルバミン酸14-デオキシ-19, 20ジヒドロ-ムチリン14-エステル;

(1-アザ-ビシクロ [2. 2. 2] オクタン-3-カルボニル) -カルバミン酸ムチリン14-エステル;

{ (3S, 4R) -1-アザ-ビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-3-カルボニル} -カルバミン酸ムチリン14-エステル塩酸塩;

(1-アザ-ビシクロ [3. 2. 1] オクタン-5-カルボニル) -カルバミン酸ムチリン14-エステル;

(1-アザ-ビシクロ [2. 2. 2] オクタン-2-カルボニル) -カルバミン酸ムチリン14-エステル;

{ (3R, 4S) -1-アザ-ビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-3-カルボニル} -カルバミン酸ムチリン14-エステル;

{ (3R, 4S) -1-アザ-ビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-3-カルボニル} -カルバミン酸ムチリン14-エステル塩酸塩;

{ (3R, 4R) -1-アザ-ビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-3-カルボニル} -カルバミン酸ムチリン14-エステル塩酸塩;

{ (3S, 4S) -1-アザ-ビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン-3-カルボニル} -カルバミン酸ムチリン14-エステル塩酸塩;

(1-アザ-ビシクロ [4. 4. 0] デカン-4-カルボニル) -カルバミン酸ムチリン14-エステル塩酸塩 (エクアトリアル異性体);

(1-アザ-ビシクロ [4. 4. 0] デカン-4-カルボニル) -カルバミン酸ムチリン14-エステル塩酸塩 (アキシヤル異性体);

{ (1-アザ-ビシクロ [4. 4. 0] デシ-4-イル) -アセチル} -カルバミン酸ムチリン14-エステル;

(1-アザ-ビシクロ [3. 2. 1] オクト-3-エン-3-カルボニル) -カルバミン酸ムチリン14-エステル;

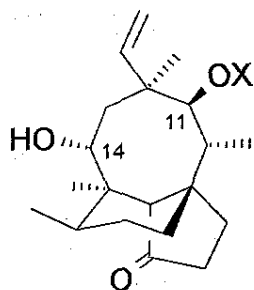
(1-アザ-ビシクロ [3. 3. 1] ノナン-5-カルボニル) -カルバミン酸ムチリン14-エステル;

{ (1-アザ-ビシクロ [2. 2. 0] オクト-3-イリデン) -アセチル} -カルバミン酸ムチリン14-エステル; および

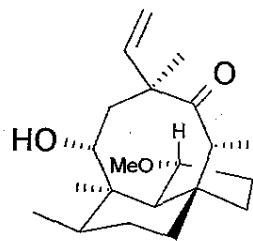
{ (1-アザ-ビシクロ [2. 2. 2] オクト-3-イル) -アセチル} -カルバミン酸ムチリン14-エステル

から選択される、請求項1の式(3)で示される化合物。

4. 上記請求項のいずれか1つに記載の化合物の製造方法であって、Xが水素またはヒドロキシル保護基である式(4)の化合物、または式(5)の化合物を、式 $R^3CONCO$ 、 $R^4CH_2CONCO$ 、または $R^5R^6C=CHCONCO$ :



(4)



(5)

で示されるイソシアン酸アシルと反応させることを含む方法。

5. シアン酸銀および塩基の存在下で式(4)の化合物を、式 $R^3COC1$ 、 $R^4CH_2COC1$ 、または $R^5R^6C=CHCOC1$ で示される化合物と反応させ ( $R^3$ から $R^6$ までのそれぞれを適当な場合には保護する)、ついで、下記工程:

- ・生成物を酸で処理して式(3)の化合物を得る
- ・ $R^3$ から $R^6$ までの保護された基を脱保護する
- ・1の $R^3$ から $R^6$ までの基を別の $R^3$ から $R^6$ までの基に変換する
- ・12位においてビニル基を水素化してエチル基を生成させる

の1つまたはそれ以上を所望の順序で行うことを含む請求項4記載の方法。

6. シアン酸銀および塩基の存在下で式(5)の化合物を、式 $R^3COC1$ 、 $R^4CH_2COC1$ 、または $R^5R^6C=CHCOC1$ で示される化合物と反応させ(  $R^3$ から $R^6$ までのそれぞれを適当な場合には保護する)、ついで、下記工程:

- ・生成物を酸で処理して式(3)の化合物を得る
- ・ $R^3$ から $R^6$ までの保護された基を脱保護する
- ・1の $R^3$ から $R^6$ までの基を別の $R^3$ から $R^6$ までの基に変換する
- ・12位においてビニル基を水素化してエチル基を生成させる

の1つまたはそれ以上を所望の順序で行うことを含む請求項4記載の方法。

7. 医薬上許容される担体または賦形剤と一緒にした請求項1、2または3記載の化合物を含む医薬組成物。

8. 治療に使用される請求項1の式(3)で示される化合物。

9. 微生物感染の治療において使用する医薬組成物の製造における請求項1の式(3)で示される化合物の使用。