

【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20年5月15日(2008.5.15)

【公表番号】特表2003-529593(P2003-529593A)

【公表日】平成15年10月7日(2003.10.7)

【出願番号】特願2001-572483(P2001-572483)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/82 (2006.01)

A 6 1 K 31/426 (2006.01)

A 6 1 K 31/44 (2006.01)

A 6 1 K 31/4409 (2006.01)

A 6 1 K 31/495 (2006.01)

A 6 1 K 31/4985 (2006.01)

A 6 1 K 31/50 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

C 0 7 D 213/81 (2006.01)

C 0 7 D 237/24 (2006.01)

C 0 7 D 239/42 (2006.01)

C 0 7 D 241/26 (2006.01)

C 0 7 D 277/20 (2006.01)

C 0 7 D 277/56 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 213/82

A 6 1 K 31/426

A 6 1 K 31/44

A 6 1 K 31/4409

A 6 1 K 31/495

A 6 1 K 31/4985

A 6 1 K 31/50

A 6 1 K 31/505

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 31/04

C 0 7 D 213/81

C 0 7 D 237/24

C 0 7 D 239/42 Z

C 0 7 D 241/26

C 0 7 D 277/56

C 0 7 D 471/04 1 1 6

C 0 7 D 487/04 1 4 2

【手続補正書】

【提出日】平成20年3月26日(2008.3.26)

【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

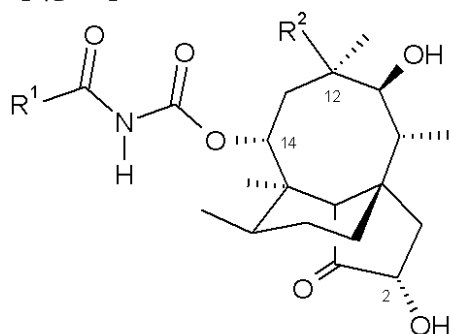
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 式 (I) :

【化 1】



[式中 :

R¹ は 5 - または 6 - 員の置換されていてもよいヘテロアリール基であり ;

R² はビニルまたはエチルを意味する]

で示される化合物。

【請求項 2】 R¹ が 1 個または 2 個の窒素原子を含み、さらに酸素または硫黄から選択されるヘテロ原子を含んでいてもよい 5 または 6 - 員の単環 ; または 3 個の窒素原子を含む 5 または 6 - 員環 ; あるいはベンゼン環または 1 個もしくは 2 個の窒素原子を含む別の 5 または 6 - 員の置換されていてもよいヘテロアリールに縮合した 1 個または 2 個の窒素原子を含む 5 または 6 - 員環からなる、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】 R¹ がピリジン、ピリダジン、ピリミジン、ピラジン、イソキサゾール、チアゾール、イミダゾール、ピラゾール、1, 2, 3 - トリアゾール、1, 2, 4 - トリアゾール、ベンズイミダゾール、3 - オキソ - 3, 4 - ジヒドロピリド[2, 3 - b]ピラジンまたはピラゾロ[1, 5 - a]ピリミジンを含む、請求項 1 または 2 記載の化合物。

【請求項 4】 R¹ がピリジン、ピリミジンおよびチアゾールを含む、請求項 1 ないし 3 のいずれか 1 項記載の式 (I) の化合物。

【請求項 5】 R¹ についての置換基がアミノ、モノ - またはジ - (C₁ - 6) アルキルアミノ、(C₁ - 6) アルキル、(C₁ - 6) アルコキシ、ニトロおよび含窒素ヘテロサイクリルから選択される、請求項 1 ないし 4 のいずれか 1 項記載の式 (I) の化合物。

【請求項 6】

(6 - アミノ - 3 - ピリジニルカルボニル)カルバミン酸 2 - (S) - ヒドロキシムチリン 1, 4 - エステル ;

(5 - アミノニコチノイル)カルバミン酸 2 - (S) - ヒドロキシムチリン 1, 4 - エステル ;

(2 - N - メチルアミノピリミジン - 5 - イルカルボニル)カルバミン酸 2 - (S) - ヒドロキシムチリン 1, 4 - エステル ;

(3 - アミノ - 6 - ピリダジニルカルボニル)カルバミン酸 2 - (S) - ヒドロキシムチリン 1, 4 - エステル ;

(3 - N - メチルピリダジン - 6 - イルカルボニル)カルバミン酸 2 - (S) - ヒドロキシムチリン 1, 4 - エステル ;

(6 - アミノ - 5 - シアノニコチノイル)カルバミン酸 2 - (S) - ヒドロキシムチリン 1, 4 - エステル ;

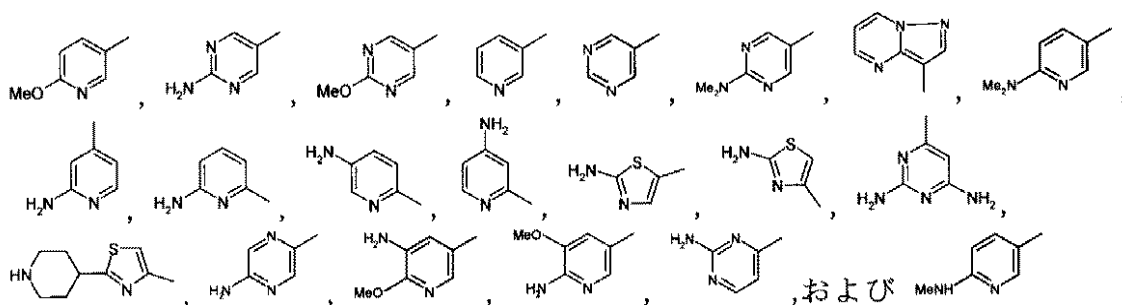
[2 - (1 - カルボキシアミドメチルピペリジン - 4 - イル)チアゾール - 4 - カルボニル]カルバミン酸 2 - (S) - ヒドロキシムチリン 1, 4 - エステル ;

[2 - (1 - シアノメチルピペリジン - 4 - イル)チアゾール - 4 - カルボニル]カルバミン酸 2 - (S) - ヒドロキシムチリン 1, 4 - エステル ;

(6 - アミノピリジン - 2 - イルカルボニル)カルバミン酸 1, 9, 20 - ジヒドロ - 2 - (S) - ヒドロキシムチリン 1, 4 - エステル ;

(6-アミノ-5-シアノニコチノイル)カルバミン酸 19,20-ジヒドロ-2-(S)-ヒドロキシムチリン14-エステル;
 (3-オキソ-3,4-ジヒドロピリド[2,3-b]ピラジン-7-イルカルボニル)カルバミン酸 19,20-ジヒドロ-2-(S)-ヒドロキシムチリン14-エステル;
 (2-アミノチアゾール-5-イルカルボニル)カルバミン酸 19,20-ジヒドロ-2-(S)-ヒドロキシムチリン14-エステル;
 (5-アミノ-6-メトキシニコチノイル)カルバミン酸 19,20-ジヒドロ-2-(S)-ヒドロキシムチリン14-エステル;
 (6-アミノ-5-ニトロニコチノイル)カルバミン酸 2-(S)-ヒドロキシムチリン14-エステル;
 (2-アミノ-6-メトキシピリミジン-4-イルカルボニル)カルバミン酸 2-(S)-ヒドロキシムチリン14-エステル;
 および R^2 がエチルであり、 R^1 が

【化2】



から選択されるところの式(I)の化合物からなる群より選択される、請求項1記載の式(I)の化合物。

【請求項7】

(5-アミノ-6-メトキシ-3-ピリジニルカルボニル)カルバミン酸 2-(S)-ヒドロキシムチリン14-エステル;
 (5-アミノ-6-メトキシ-3-ピリジニルカルボニル)カルバミン酸 19,20-ジヒドロ-2-(S)-ヒドロキシムチリン14-エステル;
 (6-アミノ-3-ピリジニルカルボニル)カルバミン酸 19,20-ジヒドロ-2-(S)-ヒドロキシムチリン14-エステル;
 (6-ジメチルアミノ-3-ピリジニルカルボニル)カルバミン酸 2-(S)-ヒドロキシムチリン14-エステル; および
 (3-アミノ-6-ピリダジニルカルボニル)カルバミン酸 2-(S)-ヒドロキシムチリン14-エステル

からなる群より選択される、請求項1記載の式(I)の化合物。

【請求項8】 請求項1記載の式(I)の化合物および医薬上許容される担体または賦形体を含む医薬組成物。

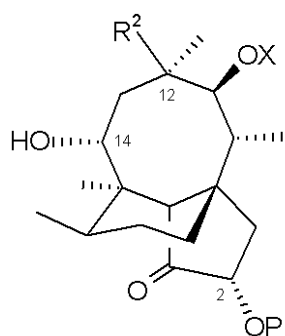
【請求項9】 治療にて用いるための請求項1記載の式(I)の化合物。

【請求項10】 微生物感染の処理に用いるための医薬の調製における請求項1に記載の式(I)の化合物の使用。

【請求項11】

請求項1に記載の式(I)の化合物の製法であって、式(II):

【化3】



[式中、X および P は水素またはヒドロキシ保護基、例えば、アシル基であり、 R^2 は請求項 1 の記載と同意義である]

で示される化合物を、式： $R^{1A}CONCO$

[式中、 R^{1A} は上記した R^1 であるか、または R^1 に変換可能な基、例えば、その中に保護された置換基を含む基を意味する]

で示されるアシルイソシアネートと反応させ、その後、必要ならば、

(i) 基 P および / または X を脱保護して、2 または 11 位の各々にヒドロキシル基を形成させ、

(j) 例えば、保護基を除去して、基 R^{1A} を R^1 に変換し、

(k) 基 R^1 を別の基 R^1 に変換し、および

(l) 12 位のビニル基を水素化してエチル基を形成させる

ことを含む、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物の製造方法。