

【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 12 月 22 日 (2005.12.22)

【公表番号】特表 2004-527530 (P2004-527530A)

【公表日】平成 16 年 9 月 9 日 (2004.9.9)

【年通号数】公開・登録公報 2004-035

【出願番号】特願 2002-579414 (P2002-579414)

【国際特許分類第 7 版】

C 07 C 259/06

A 61 K 31/165

A 61 P 31/04

A 61 P 43/00

【F I】

C 07 C 259/06

A 61 K 31/165

A 61 P 31/04

A 61 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 3 月 9 日 (2005.3.9)

【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

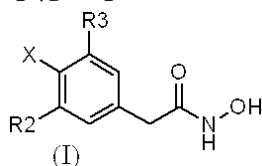
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



[ 式中、

X は、- C ( O ) O C<sub>1-3</sub> アルキル、- O R 1、- N R 1 R 6、- C ( O ) N R 1 R 6、および - C ( O ) R 6 からなる群から選択され；

R 1 は、水素、非置換であるかまたはアルコール、エーテル、アミン、アミドおよびカルボン酸基からなる群から選択される 1 個またはそれ以上の基によって置換されている C<sub>1-6</sub> アルキル、Ar、- C<sub>1-2</sub> アルキル Ar、窒素上にて R 7 で置換されている C<sub>0-2</sub> アルキルピペリジン - 4 - イル、および窒素上にて R 7 で置換されている C<sub>0-2</sub> アルキルピロリジン - 3 - イルからなる群から選択され；

Ar は、フェニル、フリル、ピリジル、チエニル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、イミダゾリル、ベンゾフラニル、インドリル、チアゾリジニル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピロリル、およびピリミジル（これらは全て、非置換であっても、または 1 個またはそれ以上の R 4 または R 5 基によって置換されていてもよい）からなる群から選択されるか；または R 1 および R 6 が一緒になって、O または置換されていてもよい N を含有していてもよい 5 または 6 員環系を構成してもよく；

R 2 は、I、Br、Cl、イソプロピルおよび tert - ブチルからなる群から選択され；  
R 3 は、H、I、Br、Cl、イソプロピル、tert - ブチルおよび Z - R 8 からなる群から選択され；

Z は、O、N、-NC(O)、-C(O)N、-SO<sub>2</sub>N、-CONHSO<sub>2</sub>および -CH<sub>2</sub> からなる群から選択され；

R 4 および R 5 は、独立して、水素、-OR<sub>6</sub>、-CN、F、Cl、Br、I、-CO<sub>2</sub>H、-C(O)NR<sub>1</sub>R<sub>6</sub>、-NR<sub>6</sub>COR<sub>6</sub>、-NH<sub>2</sub>、および非置換であってもまたはアルコール、アミン、アミドおよびカルボン酸からなる群から選択される 1 個またはそれ以上の基によって置換されていてもよい -C<sub>1-4</sub>アルキルからなる群から選択され；

R 6 は、H、または -CH<sub>3</sub> であり；

R 7 は、水素、-C<sub>1-4</sub>アシルおよび -C<sub>1-4</sub>アルコキシカルボニルからなる群から選択され；

R 8 は、非置換であるかまたはアルコール、アミン、アミドおよびカルボン酸からなる群から選択される 1 個またはそれ以上の基によって置換されている -C<sub>1-4</sub>アルキルからなる群から選択される]

で示される化合物。

#### 【請求項 2】

以下の化合物からなる群から選択される化合物：

2 - (3 - クロロ - 4 - シクロプロピルメトキシフェニル) - N - ヒドロキシアセトアミド；

N - ヒドロキシ - 2 - (4 - ヒドロキシ - 3,5 - ジヨードフェニル)アセトアミド；

2 - (4 - ベンジルオキシ - 3,5 - ジヨードフェニル) - N - ヒドロキシアセトアミド；

2 - (3,5 - ジヨード - 4 - フェノキシフェニル) - N - ヒドロキシアセトアミド；

2 - (3,5 - ジヨード - 4 - メトキシフェニル) - N - ヒドロキシアセトアミド；

N - ヒドロキシ - 2 - (3,4,5 - トリメトキシフェニル)アセトアミド；

2 - (3,5 - ジ - tert - ブチル - 4 - メトキシフェニル) - N - ヒドロキシアセトアミド；

2 - (3,5 - ジ - tert - ブチル - 4 - ヒドロキシフェニル) - N - ヒドロキシアセトアミド；

2 - (3 - ヨード - 4 - メトキシ - フェニル) - N - ヒドロキシアセトアミド；および

2 - (4 - エチルアミノ - 3,5 - ジヨードフェニル) - N - ヒドロキシアセトアミド。

#### 【請求項 3】

以下の化合物からなる群から選択される化合物：

N - ヒドロキシ - 2 - [3,5 - ジヨード - 4 - (4 - ヒドロキシフェノキシ)フェニル]アセトアミド；

2 - {4 - [4 - (2 - ジエチルアミノエトキシ)フェノキシ] - 3,5 - ジヨードフェニル} - N - ヒドロキシアセトアミド；

N - ヒドロキシ - 2 - [4 - (4 - ヒドロキシフェノキシ) - 3 - ヨードフェニル]アセトアミド；

N - ヒドロキシ - 2 - (4 - アミノ - 3,5 - ジヨードフェニル)アセトアミド；

N - ヒドロキシ - 2 - [3,5 - ジヨード - 4 - (4 - メトキシフェノキシ)フェニル]アセトアミド；

N - ヒドロキシ - 2 - (3,5 - ジクロロ - 4 - メトキシフェニル)アセトアミド；および

N - ヒドロキシ - 2 - (3,5 - ジクロロ - 4 - フェノキシフェニル)アセトアミド。

#### 【請求項 4】

請求項 1 記載の化合物および適当な医薬担体を含む、細菌感染治療に用いるための医薬組成物。

#### 【請求項 5】

2 - (3 - クロロ - 4 - シクロプロピルメトキシフェニル) - N - ヒドロキシアセトアミド ;

N - ヒドロキシ - 2 - (4 - ヒドロキシ - 3,5 - ジヨードフェニル)アセトアミド ;

2 - (4 - ベンジルオキシ - 3,5 - ジヨードフェニル) - N - ヒドロキシアセトアミド ;

2 - (3,5 - ジヨード - 4 - フェノキシフェニル) - N - ヒドロキシアセトアミド ;

2 - (3,5 - ジヨード - 4 - メトキシフェニル) - N - ヒドロキシアセトアミド ;

N - ヒドロキシ - 2 - (3,4,5 - トリメトキシフェニル)アセトアミド ;

2 - (3,5 - ジ - tert - ブチル - 4 - メトキシフェニル) - N - ヒドロキシアセトアミド ;

2 - (3,5 - ジ - tert - ブチル - 4 - ヒドロキシフェニル) - N - ヒドロキシアセトアミド ;

2 - (3 - ヨード - 4 - メトキシ - フェニル) - N - ヒドロキシアセトアミド ; および

2 - (4 - エチルアミノ - 3,5 - ジヨードフェニル) - N - ヒドロキシアセトアミド  
からなる群から選択される化合物を含む、細菌感染治療に用いるための医薬組成物。

**【請求項 6】**

細菌感染が気道感染およびグラム陽性 T P P からなる群から選択されるものである、請求項 5 記載の医薬組成物。