

【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】令和4年7月7日(2022.7.7)

【国際公開番号】WO2020/002325

【公表番号】特表2021-528449(P2021-528449A)

【公表日】令和3年10月21日(2021.10.21)

【出願番号】特願2020-571762(P2020-571762)

【国際特許分類】

C 0 7 K 7 / 6 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 8 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 1 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 1 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

10

【 F I 】

C 0 7 K 7 / 6 2

A 6 1 K 3 8 / 1 2

A 6 1 P 3 1 / 0 0

A 6 1 P 3 1 / 0 4

【手続補正書】

20

【提出日】令和4年6月29日(2022.6.29)

【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】

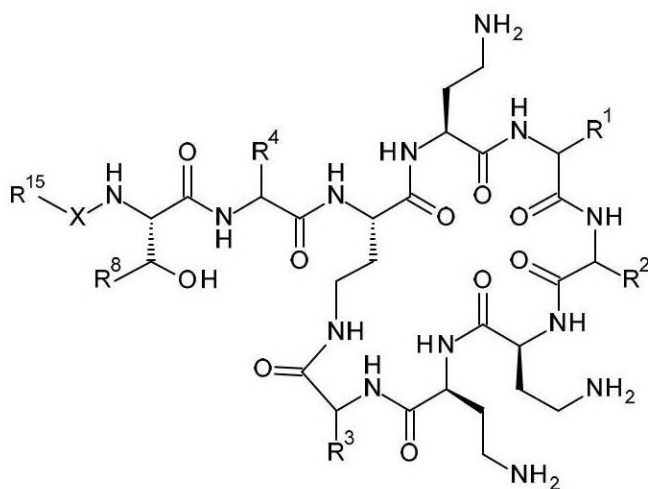
【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】

30



40

[式中、

- X - は、 - C (O) - を表し；

- R 1 は、カルボニル基及びこれが接続している炭素に対してアルファにある窒素と一緒に、フェニルアラニン、ロイシン、ノルロイシン、バリン又はノルバリン残基であり；

- R 2 は、1個のヒドロキシル基で所望により置換されているC 1 ~ 4アルキルであり；

- R 3 は、カルボニル基及びこれが接続している炭素に対してアルファにある窒素と一緒に

50

に、トレオニン残基であり；

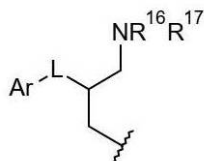
- R 4 は、カルボニル基及びこれが接続している炭素に対してアルファにある窒素と一緒に、

D a p であり；

- R 8 は、水素又はメチルであり；

- R 1 5 は、基；

【化 2】



10

であり、

- R 1 6 は、水素であり；

- R 1 7 は、水素であり；

- L - は、共有結合又はメチレンであり；

- A r は、所望により置換されているアリーールである]

の化合物並びにその塩、溶媒和物及び保護された形態。

【請求項 2】

- R 1 が、カルボニル基及びこれが接続している炭素に対してアルファにある窒素と一緒に、

フェニルアラニン又はロイシン残基、例えば、D - フェニルアラニン残基、である、請求項 1 に記載の化合物。

20

【請求項 3】

- R 2 が、カルボニル基及びこれが接続している炭素に対してアルファにある窒素と一緒に、

ロイシン、アミノブチラート、イソ - ロイシン、トレオニン、バリン又はノル - バリン残基である、例えば、ロイシン又はアミノブチラート残基、例えば、L - ロイシン残基である、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 4】

- R 4 が、カルボニル基及びこれが接続している炭素に対してアルファにある窒素と一緒に、

L - D a p である、請求項 1 ないし 3 のいずれか一項に記載の化合物。

30

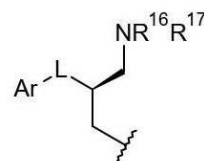
【請求項 5】

- R 8 がメチルである、請求項 1 ないし 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

- R 1 5 が；

【化 3】



40

である、請求項 1 ないし 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

- L - が共有結合である、請求項 1 ないし 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8】

- A r が所望により置換されているフェニルである、請求項 1 ないし 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

前記フェニルが 1 又は 2 個の基 - R S で置換されており、各 - R S が独立に、ハロ、アルキル、ハロアルキル及びアリーールから選択される、例えば、クロロ、プロピル、フェニル

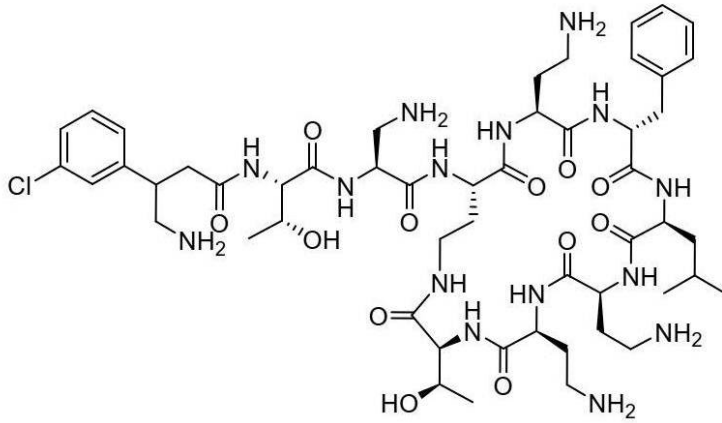
50

及びチオフェニルから選択される、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

式 (I I) :

【化 4】



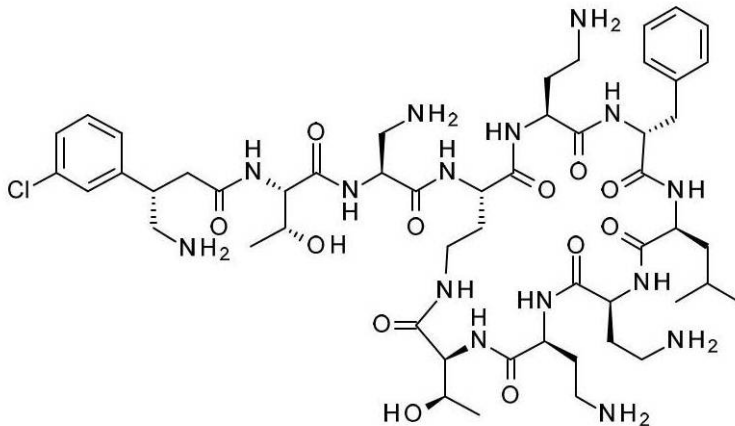
10

の化合物並びにその塩、溶媒和物及び保護された形態である、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 11】

式 (I I) :

【化 5】



30

の化合物並びにその塩、溶媒和物及び保護された形態である、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 12】

請求項 1 ないし 11 のいずれか一項に記載の化合物を、所望により 1 種又は複数の医薬的に受容可能な担体と一緒に含んでなる、医薬組成物。

40

【請求項 13】

治療又は予防の方法で使用するための、請求項 12 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

微生物感染、例えば、細菌感染を治療する方法において使用するための、請求項 12 に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

前記微生物感染がグラム陰性菌感染である、例えば、*Escherichia* spp.、*Klebsiella* spp.、*Enterobacter* spp.、*Salmonella* spp.、*Shigella* spp.、*Citrobacter* spp.、*Morganella morganii*、*Yersinia pseudotub*

50

erculosis 及び他の腸内細菌科、Pseudomonas spp.、Acinetobacter spp.、Moraxella、Helicobacter、Stenotrophomonas、Bdellovibrio、酢酸菌、Legionella 並びにアルファプロテオバクテリアから選択される、グラム陰性菌による感染である、請求項 14 に記載の医薬組成物。

10

20

30

40

50