

【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22年8月5日 (2010.8.5)

【公表番号】特表2009-541289(P2009-541289A)

【公表日】平成21年11月26日 (2009.11.26)

【年通号数】公開・登録公報2009-047

【出願番号】特願2009-515958(P2009-515958)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/428 (2006.01)

C 0 7 D 417/04 (2006.01)

C 0 7 D 417/06 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 498/04 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 277/82 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/501 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/428

C 0 7 D 417/04 C S P

C 0 7 D 417/06

C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z

C 0 7 D 471/04 1 0 8 Q

C 0 7 D 498/04 1 1 2 T

C 0 7 D 487/04 1 4 0

C 0 7 D 471/04 1 1 3

C 0 7 D 471/04 1 1 4 A

C 0 7 D 277/82

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/497

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/501

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成22年6月21日 (2010.6.21)

【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

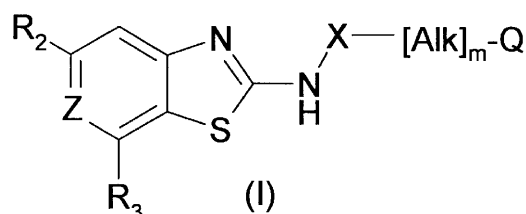
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



[式中、

mは0または1であり；

Qは水素またはシクロプロピルであり；

Alkは、エーテル(-O-)、チオエーテル(-S-)またはアミノ(-NR-)（ここで、Rは水素、-CNまたはC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルである）結合を含んでもよく、任意に置換されていてもよい、2価のC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン、アルケニレンまたはアルキニレン基であり；

Xは-C(=O)NR<sub>6</sub>-、-S(O)NR<sub>6</sub>-、-C(=O)O-または-S(=O)O-（ここで、R<sub>6</sub>は水素、任意に置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル、-Cycまたは-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル)-Cyc（ここで、Cycは、3～7の環原子を有する、任意に置換されていてもよい単環式の炭素環式基もしくは複素環式基である））であり；

ZはNもしくはCH、またはCFであり；

R<sub>2</sub>は基Q<sup>1</sup>-[Alk<sup>1</sup>]<sub>q</sub>-Q<sup>2</sup>-

（ここで、

qは0または1であり；

Alk<sup>1</sup>は、エーテル(-O-)、チオエーテル(-S-)もしくはアミノ(-NR-)結合を中間もしくは末端に含んでもよく、任意に置換されていてもよい、2価の直鎖状もしくは分枝鎖状のC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニレンまたはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニレン基であり；

Q<sup>2</sup>は、5もしくは6の環原子を有し、任意に置換されていてもよい、2価の単環式の炭素環式基もしくは複素環式基であるか、または9もしくは10の環原子を有し、任意に置換されていてもよい、2価の2環式の炭素環式基もしくは複素環式基であり；

Q<sup>1</sup>は水素、任意の置換基、または3～7の環原子を有し、任意に置換されていてもよい、炭素環式基もしくは複素環式である）

であり；

R<sub>3</sub>は水素以外の基Q<sup>4</sup>-[Alk<sup>2</sup>]<sub>p</sub>-[Q<sup>3</sup>]<sub>q</sub>-

（ここで、

pおよびqは独立して0または1であり；

Alk<sup>2</sup>は任意に置換されていてもよい、2価のC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキレン、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニレンまたはC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニレン基であり；

Q<sup>3</sup>は5もしくは6の環原子を有し、任意に置換されていてもよい、2価の単環式の炭素環式基もしくは複素環式基であるか、または9もしくは10の環原子を有し、任意に置換されていてもよい、2価の2環式の炭素環式基もしくは複素環式基であり；

Q<sup>4</sup>は水素、任意の置換基、または3～7の環原子を有し、任意に置換されていてもよい、炭素環式基もしくは複素環式基である）

である]

の化合物、またはその塩、水和物、溶媒和物もしくはN-オキサイドを含む抗菌性の組成物

## 【請求項 2】

細菌の増殖を阻害するのに十分な量の、請求項1で定義された化合物(1)を、汚染または潜在的な汚染の部位に適用することを含む、ヒトを除く基体の細菌汚染を処置または予防する方法。

## 【請求項 3】

置換基 $R_3$ において $q$ が1である、請求項1で定義された式(1)の化合物、またはその塩、水和物、溶媒和物もしくはN-オキサイド。

## 【請求項 4】

$Z$ がCHである、請求項3に記載の化合物。

## 【請求項 5】

$m$ が1であり、 $Q$ が水素であり、 $Alk$ が $-CH_2CH_2-$ であり、 $X$ が $-C(O)NH-$ である、請求項3または4に記載の化合物。

## 【請求項 6】

$Q^2$ が任意に置換されていてもよいピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリジン-2-オン、チアゾール、ピロール、キノリン、イソキノリン、ベンズイミダゾールまたは5-アザインドール環である、請求項3~5のいずれか一つに記載の化合物。

## 【請求項 7】

$Alk^1$ が存在し、それが任意に置換されていてもよい2価の $C_1-C_3$ アルキレン基であり、該アルキレン基が $-NH-$ 結合を含むか、または $Q^2$ に結合する $-NH-$ で終結していてもよい、請求項3~6のいずれか一つに記載の化合物。

## 【請求項 8】

$Alk^1$ が2価の $C_2-C_3$ アルキレン基であり、それが $Q^2$ に結合する $-NH-$ で終結しかつ $-NH-$ 結合に隣接するC原子上でオキソ置換されており、それにより $Alk^1$ が式 $-(CH_2)_{0-2}C(=O)NH-$ を有する、請求項7に記載の化合物。

## 【請求項 9】

$Alk^1$ が式 $-(CH_2)_{1-2}NHC(=O)-$ を有し、該 $(C=O)$ が $Q^2$ に結合している、請求項7に記載の化合物。

## 【請求項 10】

$Q^1$ が式 $-NR^A R^B$ （ここで、 $R^A$ および $R^B$ は独立して水素、または $(C_1-C_6)$ アルキル、ヒドロキシ $(C_1-C_6)$ アルキルもしくは $(C_1-C_3)$ アルコキシ $(C_1-C_3)$ アルキル基であるか、または $R^A$ および $R^B$ はそれらが結合している窒素と一緒になって環式アミノ環を形成している）の基である、請求項7~9のいずれか一つに記載の化合物。

## 【請求項 11】

$p$ が1である、請求項3~10のいずれか一つに記載の化合物。

## 【請求項 12】

$Q^4$ が水素であり、 $p$ が0である、請求項3~10のいずれか一つに記載の化合物。

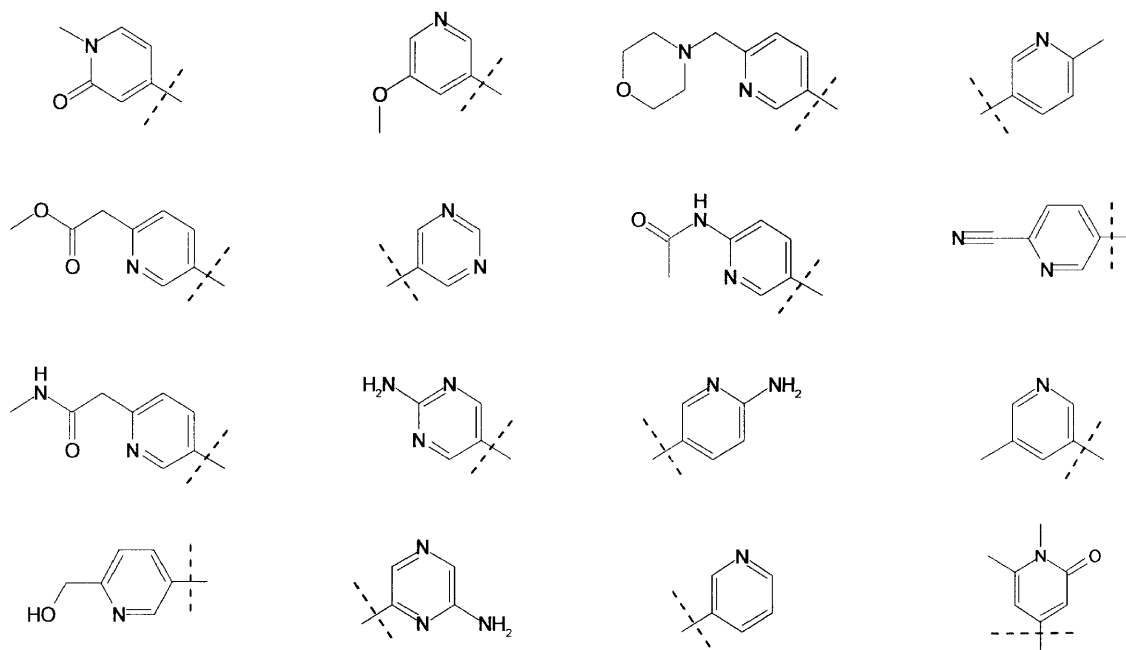
## 【請求項 13】

$Q^3$ が任意に置換されていてもよいピリジン環、任意に置換されていてもよいピリミジン環、または任意に置換されていてもよいピラジン環である、請求項3~12のいずれか一つに記載の化合物。

## 【請求項 14】

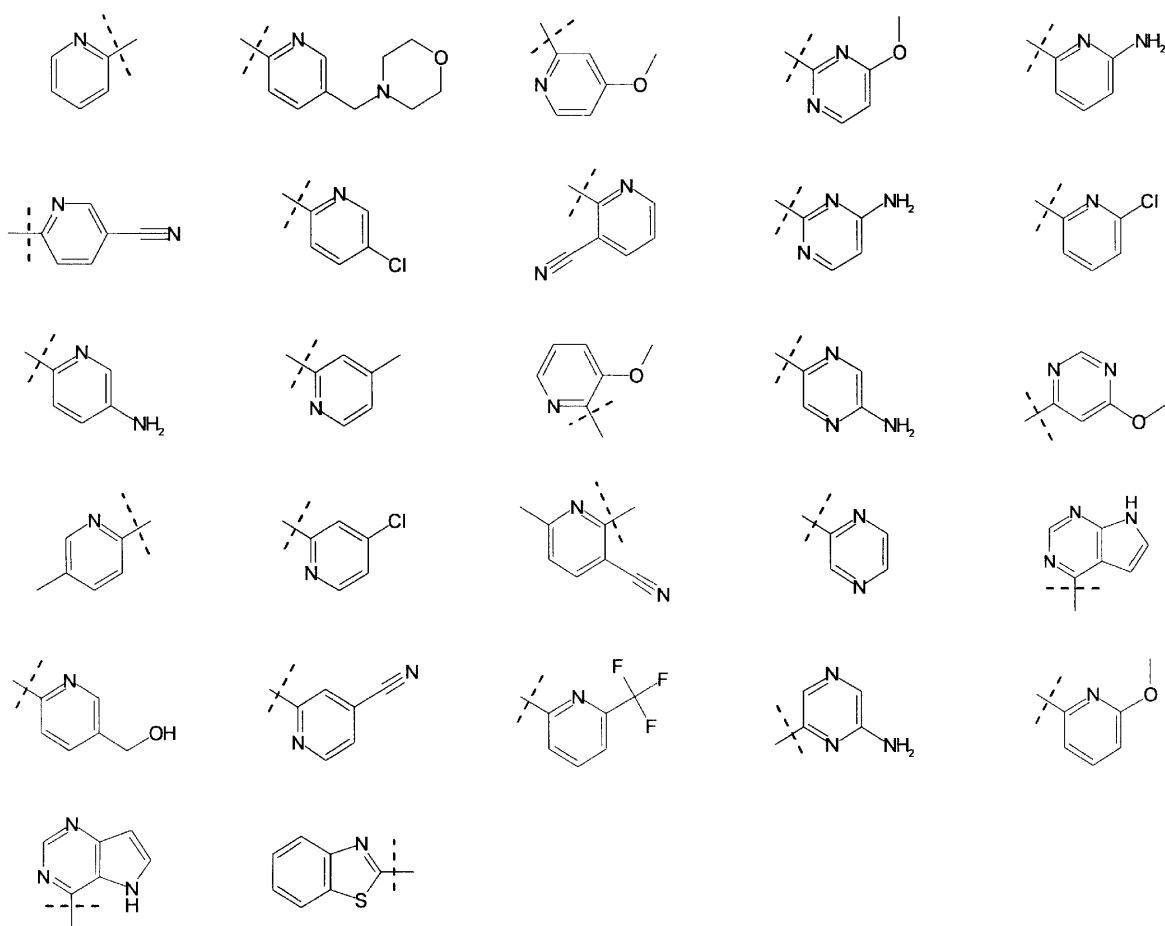
$m$ が1であり、 $Q$ が水素であり、 $Alk$ が $-CH_2CH_2-$ であり、 $X$ が $-C(O)NH-$ であり、 $R_2$ が次の基：

## 【化 2】



から選択される基であり、 $R_3$ が次の基：

## 【化 3】



から選択される基である、請求項3または4に記載の化合物。

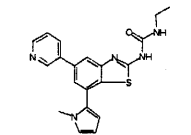
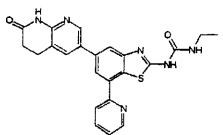
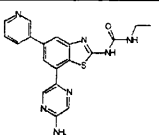
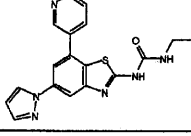
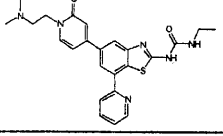
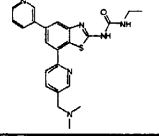
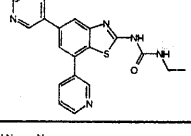
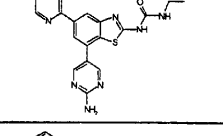
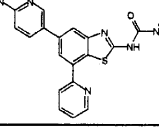
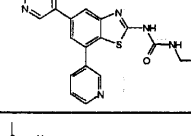
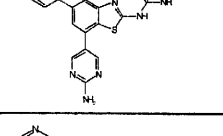
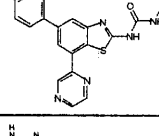
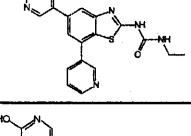
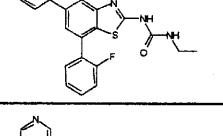
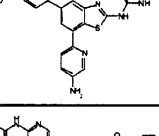
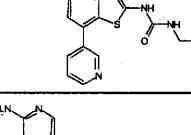
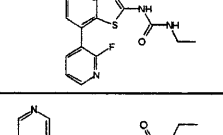
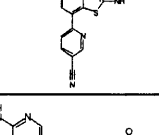
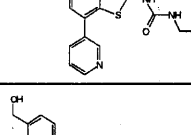
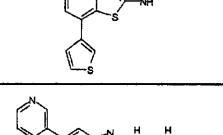
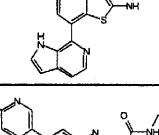
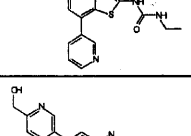
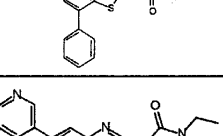
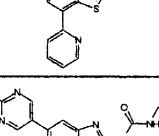
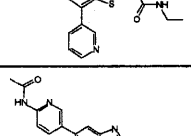
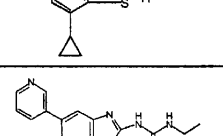
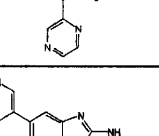
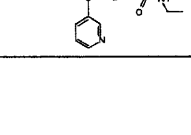
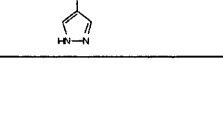
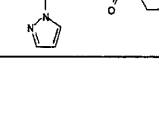
## 【請求項 15】

次の表に示された化合物からなる群から選択される化合物。

【表 1 - 1】

実施例 番号	構造	実施例 番号	構造	実施例 番号	構造
1		61		121	
2		62		122	
3		63		123	
4		64		124	
5		65		125	
6		66		126	
7		67		127	
8		68		128	
9		69		129	
10		70		130	

【表 1 - 2】

11		71		131	
12		72		132	
13		73		133	
14		74		134	
15		75		135	
16		76		136	
17		77		137	
18		78		138	
19		79		139	
20		80		140	

【表 1 - 3】

21		81		141	
22		82		142	
23		83		143	
24		84		144	
25		85		145	
26		86		146	
27		87		147	
28		88		148	
29		89		149	
30		90		150	

【表 1 - 4】

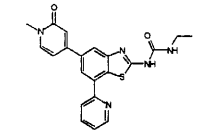
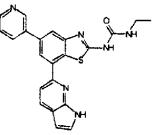
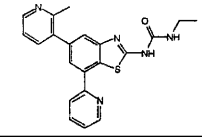
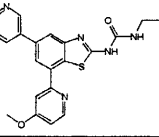
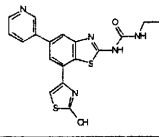
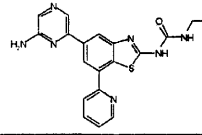
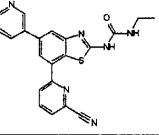
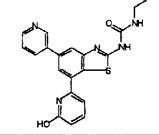
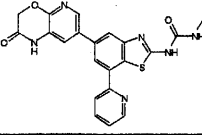
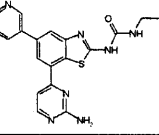
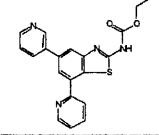
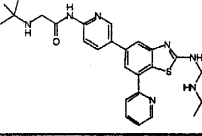
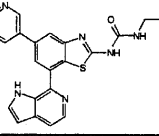
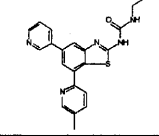
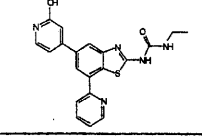
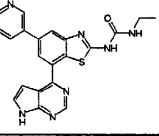
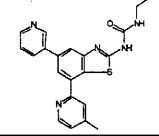
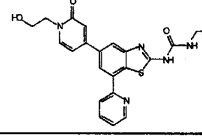
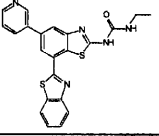
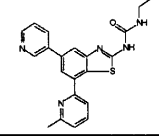
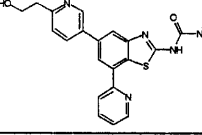
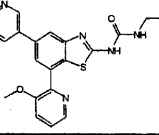
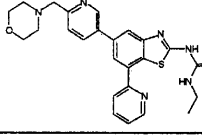
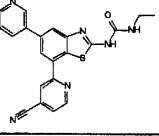
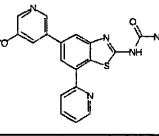
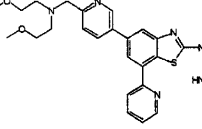
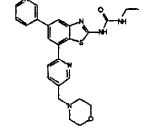
31		91		151	
32		92		152	
33		93		153	
34		94		154	
35		95		155	
36		96		156	
37		97		157	
38		98		158	
39		99		159	
40		100		160	



【表 1 - 5】

41		101		161	
42		102		162	
43		103		163	
44		104		164	
45		105		165	
46		106		166	
47		107		167	
48		108		168	
49		109		169	
50		110		170	

【表 1 - 6】

51		111			
52		112		172	
53		113		173	
54		114		174	
55		115		175	
56		116		176	
57		117		177	
58		118			
59		119		179	
60		120			

からなる群から選択される化合物。

【請求項 16】

請求項3～15のいずれか一つに記載の化合物を、医薬的に許容される担体とともに含む医薬組成物。