

【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18年4月6日(2006.4.6)

【公表番号】特表2005-536492(P2005-536492A)

【公表日】平成17年12月2日(2005.12.2)

【年通号数】 公開・登録公報2005-047

【出願番号】特願2004-519862(P2004-519862)

【國際特許分類】

C O 7 H 17/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/706 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/06 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 H 17/08 C S P L

A 6 1 K 31/706

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 31/06

【手續補正書】

【提出日】平成18年2月14日(2006.2.14)

【手續補正 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

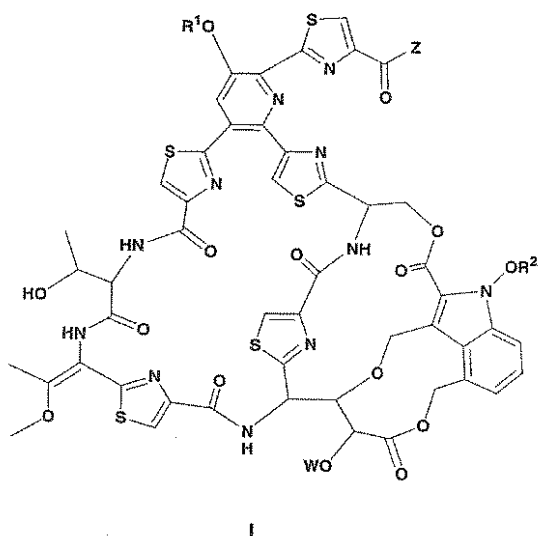
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

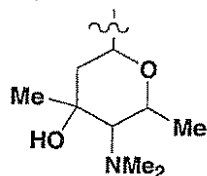
式 I :

【化 1】



[式中、
W は

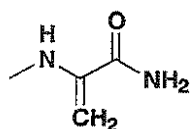
【化 2】



であり；

Z は -NH₂ および

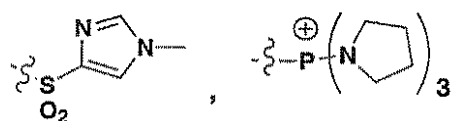
【化 3】



からなる群から選択され；

R¹ は

【化 4】



、水素、-P(O)A¹A²、-C(O)C₁₋₆アルキル、-C(O)アリール、-C(O)NHC₁₋₆アルキル、-C(O)NHアリール、-(CH₂CH₂O)_mMe、-C₁₋₆アルケニル、-C₁₋₆アルキニル、および-C₁₋₆アルキルからなる群から選択され；ここで該C₁₋₆アルキルは1から6個のヒドロキシで適宜置換されるか、または以下の(a)～(i)：すなわち、

(a) CO₂R³；

(b) CONR⁴R⁵；

(c) OP(O)A¹A²；

(d) SO₃H；

(e) -O(CH₂)_nSiR⁶₃；

(f) ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、およびモルホリニルからなる群から選択されるヘテロ脂環式基；

(g) シアノ；

(h) エポキシ；および

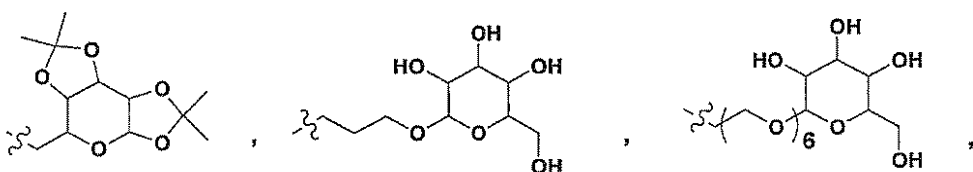
(i) アリール；

からなる群から選択される同一または異なる1から2個の置換基で適宜置換され；

ただし、R¹ および R² は同時に H ではなく；

R² は

【化 5】



、水素、-P(O)A¹A²、-SO₃H、-C(O)C₁₋₆アルキル、-C(O)CH=CHCO₂R³、-C(O)アリール、-C(O)N(H)(C₁₋₆アルキル-T)、-C(O)N(Me)(C₁₋₆アルキル-T)、-(CH₂CH₂O)_pH、-(CH₂CH₂O)_qMe、-C₁₋₆アルケニル、-C₁₋₆アルキルおよび-C₁₋₆

アルキニルからなる群から選択され；ここで該 - C₁₋₆ アルキルは 1 から 6 個のヒドロキシで適宜置換されるか、または以下の (j) ~ (v) ：すなわち、

(j) ハロ；

(k) C O₂ R³；

(l) C O N R⁴ R⁵；

(m) O P (O) A¹ A²；

(n) P (O) A¹ A²；

(o) S O₃ H；

(p) - O (C H₂)_r S i R⁶₃；

(q) ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、イミダゾリル、およびピリジルからなる群から選択されるヘテロ環式基またはヘテロ脂環式基；

(r) シアノ；

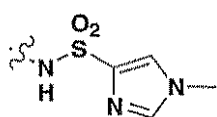
(s) アジド；

(t) アリール；

(u) N R⁴ R⁵；および

(v)

【化 6】



からなる群から選択される同一または異なる 1 から 2 個の置換基で適宜置換され；

R³ は、水素、C₁₋₆ アルキル、アリル、ベンジル、2 - ヒドロキシエチル、および 2 - テトラヒドロピラニルからなる群から選択され；

R⁴ および R⁵ は各々独立して、水素、C₁₋₆ アルキル、C H₂ C N、C H₂ C H₂ N H (t - ブチルオキシカルボニル)、C (= N H) N H₂ および S O₂ N (C₁₋₆ アルキル)₂ からなる群から選択されるか；または R⁴ および R⁵ がそれに結合する窒素と共に一緒になって、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、イミダゾリル、およびピリジルからなる群から選択されるヘテロ環式基またはヘテロ脂環式基を形成し；

R⁶ は C₁₋₆ アルキルおよびフェニルから選択され；

A¹ および A² は各々独立して、水素、- C₁₋₆ アルキル、- O C₁₋₆ アルキル、ベンジルオキシ、2 - クロロエトキシ、およびヒドロキシからなる群から選択され；

T は、水素、- O H、- (C H₂ C H₂ O)_s H、- (C H₂ C H₂ O)_t C H₃ および - N R⁴ R⁵ からなる群から選択され；

m、n、p、q、r、s および t は独立して 1 ~ 6 であり；および

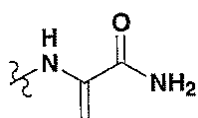
アリールはハロまたは - C O₂ R³ で適宜置換されるフェニル基からなる]

の化合物、またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 2】

Z が

【化 7】



である請求項 1 の化合物、またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 3】

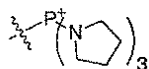
Z が - N H₂ である請求項 1 の化合物、またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 4】

(a) R¹ および R² は C H₃ である；

- (b) R^1 および R^2 は $P(O)(CH_3)OH$ である ;
 (c) R^1 および R^2 は $CH_2OP(O)(OH)_2$ である ;
 (d) R^1 は $P(O)(CH_3)OH$ であり、 R^2 は H である ;
 (e) R^1 は

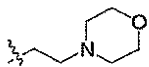
【化 8】



であり、 R^2 は H である ;

- (f) R^1 は H であり、 R^2 は $P(O)(CH_3)OH$ である ;
 (g) R^1 は H であり、 R^2 は CH_2CONH_2 である ;
 (h) R^1 は H であり、 R^2 は $CH_2CO_2CH_3$ である ;
 (i) R^1 は H であり、 R^2 は $CH_2CH_2CH_2SO_3H$ である ;
 (j) R^1 は H であり、 R^2 は $CH_2P(O)(OEt)_2$ である ;
 (k) R^1 は H であり、 R^2 は $CH_2OP(O)(OH)_2$ である ;
 (l) R^1 は H であり、 R^2 は CH_2CH_2Cl である ;
 (m) R^1 は H であり、 R^2 は

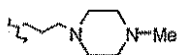
【化 9】



である ;

- (n) R^1 は H であり、 R^2 は CH_3 である ;
 (o) R^1 は H であり、 R^2 は $CONH(CH_2CH_2O)_4H$ である ;
 (p) R^1 は H であり、 R^2 は

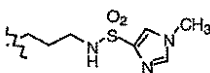
【化 10】



である ; および

- (q) R^1 は H であり、 R^2 は

【化 11】



である

からなる (a) ~ (q) の群から選択される請求項 2 の化合物。

【請求項 5】

R^1 が H であり、 R^2 が $CH_2CH_2CH_2SO_3H$ である、請求項 3 の化合物。

【請求項 6】

請求項 1 の化合物の治療上の有効量、および医薬的に許容される担体、添加剤、もしくは希釈剤を含む医薬組成物。

【請求項 7】

請求項 1 の化合物を含む、細菌感染またはマイコバクテリア感染を治療または予防するための組成物。

【請求項 8】

該細菌感染またはマイコバクテリア感染がグラム陽性細菌またはマイコバクテリアによって引き起こされる、請求項 7 の組成物。

【請求項 9】

該グラム陽性細菌感染またはマイコバクテリア感染が、メチシリン耐性黄色ブドウ球菌、バンコマイシン耐性黄色ブドウ球菌、バンコマイシン耐性エンテロコッカス・フェカー

リス、バンコマイシン耐性エンテロコッカス・フェシウム、ペニシリン耐性肺炎連鎖球菌
および結核菌からなる群から選択されるメンバーで引き起こされる請求項 8 の組成物。