

【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5月11日(2006.5.11)

【公表番号】特表2002-507616(P2002-507616A)

【公表日】平成14年3月12日(2002.3.12)

【出願番号】特願2000-537879(P2000-537879)

【 国 際 特 許 分 類 】

C 0 7 D 501/46 (2006.01)

A 6 1 K 31/546 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

C 0 7 D 233/52 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 501/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 501/46

A 6 1 K 31/546

A 6 1 P 31/04

C 0 7 D 233/52

C 0 7 D 487/04 1 3 6

C 0 7 D 487/04 1 4 0

C 0 7 D 501/04

【手續補正書】

【提出日】平成18年3月17日(2006.3.17)

【手續補正 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

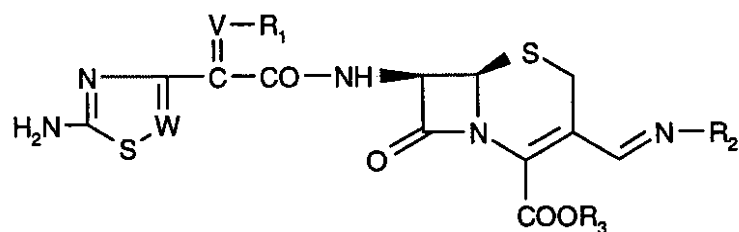
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 式：

【化 1】



「式中、

W は、 C H 又は N を示し、

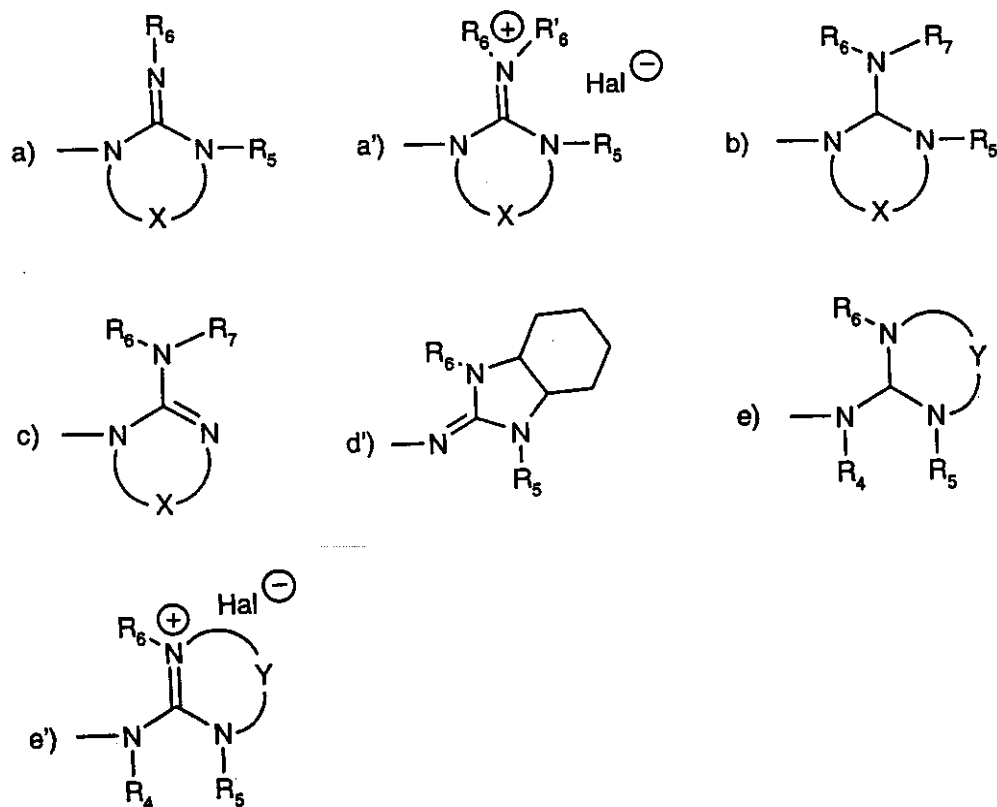
V は、C H 又は N O を示し、

R₁ は、水素、アシル、カルボキシル又はアルキルを示し、

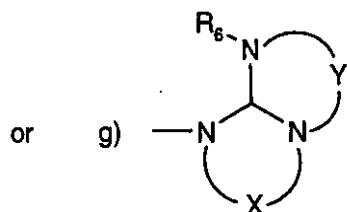
R₃ は、水素又はエステル部分を示し、

R₂ は、式：

【化 2】



【化 3】



(式中、

X 及び Y は、互いに独立にそれぞれ、 $(C_2 - 5)$ アルキレン又は $(C_2 - 5)$ アルケニレン (但し、1 個の $-C=C-$ 二重結合が存在するか又は少なくとも C_4 のアルケニレンの場合に 2 個の $-C=C-$ 二重結合が存在する) を示し、

R_4 は、水素又はアルキルを示し、

R_5 は、水素、アルキル又はアミノイミノメチルを示し、

R_6 は、水素、アルキル、シクロアルキル、アミノ、ヒドロキシ、アルコキシ、ヘテロシクリル又は式 $-N=CHR_8$ (但し、 R_8 は、アルキル、アリール又はヘテロシクリルを示す) の基を示し、又は

R_5 及び R_6 は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、ヘテロシクリルを示し、

R'_6 は、アルキルを示し、

R_7 は、水素を示し、又は

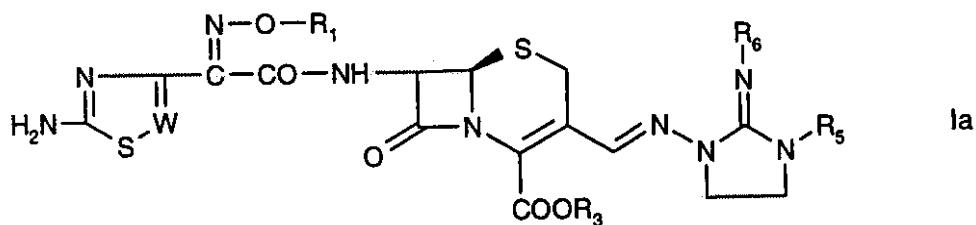
R_6 及び R_7 は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、ヘテロシクリルを形成する)

の基を示す]

の化合物。

【請求項 2】 式

【化 4】



(式中、W、 R_1 、 R_3 、 R_5 及び R_6 は、請求項 1 で定義された通りである) の化合物。

【請求項 3】 7 - { [(5 - アミノ - 1, 2, 4 - チアジアゾール - 3 - イル) - (Z) - (フルオロメトキシイミノ) アセチル] アミノ } - 3 - { [(3 - エチル - 2 - メチルイミノ - イミダゾリジン - 1 - イル) イミノ] メチル } - 3 - セフェム - 4 - カルボン酸。

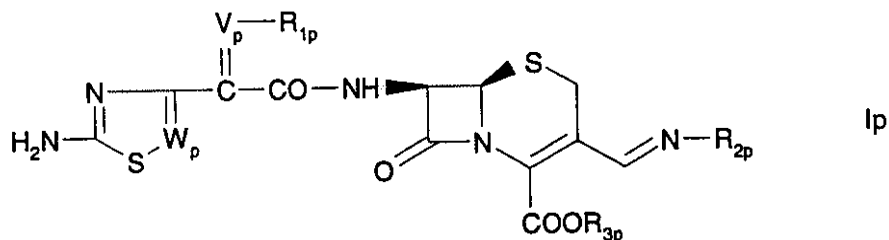
【請求項 4】 遊離形での請求項 1 ~ 3 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】 塩の形で請求項 1 ~ 3 の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6】 溶媒和物の形で上記請求項の何れか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7】 式：

【化 5】



[式中、

W_p は、CH 又は N を示し、

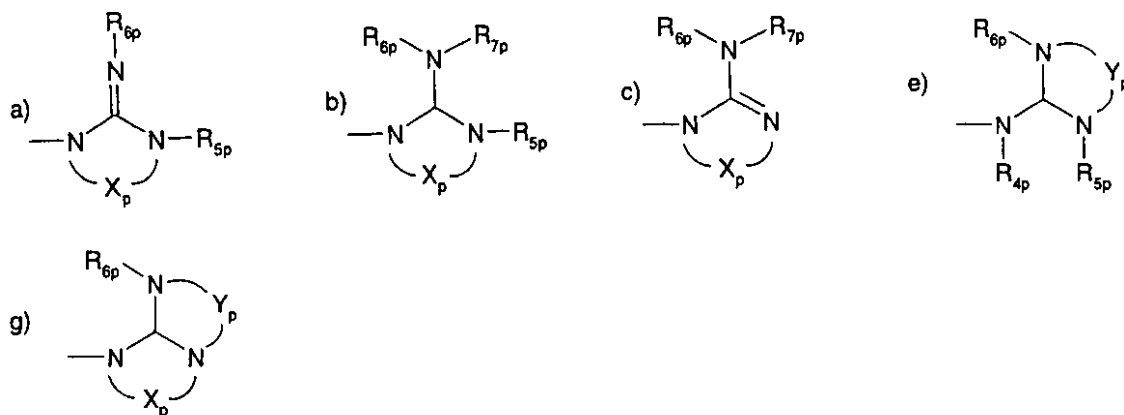
V_p は、= CH - 又は = N - O - を示し、

R_{1p} は、水素、アシル、カルボキシル、置換されていないアルキル又はハロゲン若しくはカルボキシルによって置換されたアルキルを示し、

R_{3p} は、水素、エステル生成基又はカチオンを示し、

R_{2p} は、式：

【化 6】



(式中、 X_p 及び Y_p は、同じか又は異なっており、それぞれ - (CH₂)_n - 基 (式中、n は 2 ~ 5 の数字を示し、そして任意に 1 個又は 2 個の CH₂ - 基は - CH = CH - 基によって置き換わり、そして任意に 1 個又は 2 個以上の水素原子は、ハロゲン、アルキル、シクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、カルボキシル又はエトキシカ

ルボニルによって置き換わっている)を示し、

R_{4p} は、水素、アルキル又はヒドロキシアルキルを示し、

R_{5p} は、水素、アルキル、(ポリ)ヒドロキシアルキル又はアミノアルキル(但し、任意にアルキル基は更に、官能基、例えばカルボン酸残基、スルホン酸残基又はリン酸残基によって置換されている)を示し、

R_{6p} は、水素、アルキル、ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、アミノ、ヒドロキシ、アルコキシアルキル、シクロアルキル、基 $N = CHR_{8p}$ (式中、 R_{8p} は、アリール又はヘテロアリールを示す)又は基 $-NR_{9p}R_{10}$ (式中、 R_{9p} 及び R_{10} は、同じか若しくは異なっており、それぞれ水素、アルキル、ヒドロキシアルキル若しくはアリールを示すか又は窒素原子と一緒にあって、5若しくは6環員を有し1個若しくは2個の窒素及び/若しくは酸素原子を有する飽和の非置換複素環を示す)を示し、そして

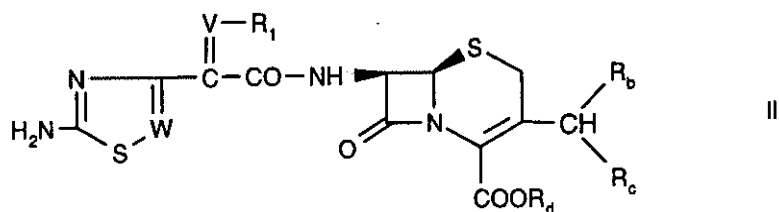
R_{7p} は、水素を示すか又は

R_{7p} 及び R_{6p} は、窒素原子と一緒にあって、1個又は2個の窒素及び/又は酸素原子を含有する5~7環員を有する複素環を示す。但し、 W_p が CH を示し、 V_p が $=N-O-$ を示し、 R_{1p} が水素又はメチルを示し、 R_{2p} が式 d) の基を示し、そして R_{3p} が水素を示す場合、 R_{5p} 及び R_{6p} は、同時に水素又はメチル以外の基を示す]

の、遊離形で又は、このような形が存在する場合、それらの酸付加塩、内部塩、第四級塩若しくは水和物の形での化合物。

【請求項 8】 式：

【化 7】



(式中、 W 、 V 及び R_1 は、前記定義された通りであり、そして

) R_b はヒドロキシを示し、そして R_c 及び R_d は一緒になって結合を示すか又は

) R_d は、水素、カチオン、エステル生成基又はシリル基を示し、そして R_b 及び R_c は一緒になってオキソ基を示す)

の化合物を、遊離形又はその酸付加塩の形で、式：

【化 8】



(式中、 R_2 は前記定義された通りである)

のアミンと反応させることを含む、式 I の化合物の製造方法。

【請求項 9】 薬物として使用するための、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】 微生物性疾患の治療のための医薬の製造に使用するための請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】 少なくとも 1 種の薬物坦体又は希釈剤と組み合わせて、薬物的に許容される塩形又は遊離形で、式 I の化合物を含有する薬物組成物。

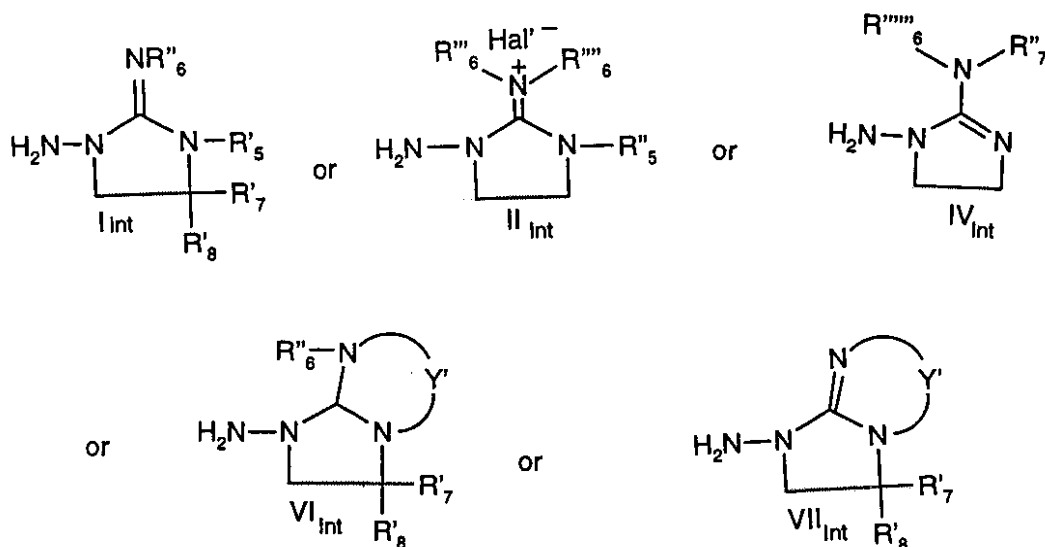
【請求項 12】 シュードモナス、エシエリヒア、エンテロバクター、クレブシエラ、モラクセラ、エンテロコッカス、ストレプトコッカス及びスタフィロコッカスから選択された細菌によって起こされる微生物性疾患の治療に於ける、請求項 10 に記載の使用のための、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 13】 薬物としての、請求項 1 に記載の式 I の化合物の使用又は請求項 12 に記載の組成物の使用。

【請求項 14】 微生物性疾患の治療が必要な被検者に、有効量の式 I の化合物を投薬することを含む、微生物性疾患の治療方法。

【請求項 15】 式：

【化 9】



[式中、

Y' は、アルキレンを示し、

R'_5 は、水素、アルキル又はアルキルアミノを示し、

R''_6 は、水素、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、シクロアルキル、アミノ又はヘテロシクリルを示し、

R'_7 及び R'_8 は、互いに独立に、水素、カルボキシル、アルコキシカルボニル又はアルキルを示し、

R''_6 及び R''_6 は、互いに独立に、アルキルを示し、又は

R''_6 及び R''_6 は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、ヘテロシクリルを示し、

R'_5 は、アルキルを示し、又は

R'_5 及び R''_6 は一緒にあって、アルキレンを示し、

R'_5 及び R''_6 は互いに独立に、アルキルを示し、

R''_6 及び R'_7 は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、ヘテロシクリルを形成し、

R'_4 及び R''_6 は互いに独立に、アルキルを示し、そして

Hal' は、ハロゲンを示す。(但し、 R'_5 、 R'_7 及び R'_8 が水素であり、 R''_6 が水素、2 - (N - モルホリノ) エチル、3 - (N, N - ジメチルアミノ) プロピル、(2 - ヒドロキシエチル) アミノ又は 2 - ヒドロキシエチルである式 I_{Int} の化合物を除く。)

の化合物。