

【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1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-503416(P2005-503416A)

【公表日】平成17年2月3日(2005.2.3)

【年通号数】公開・登録公報2005-005

【出願番号】特願2003-528832(P2003-528832)

【国際特許分類】

C 07 H 17/08 (2006.01)

A 61 K 31/7048 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

【F I】

C 07 H 17/08 B

A 61 K 31/7048

A 61 P 31/04

C 07 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成17年9月16日(2005.9.16)

【手続補正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

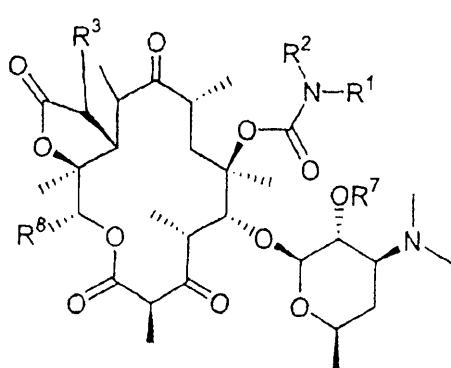
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式1

【化1】



式1

[式中、

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は、独立して、水素、場合により置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-アルキル、場合により置換されていてもよい-C H<sub>2</sub>-C<sub>2-8</sub>アルケニル、および場合により置換されていてもよい-C H<sub>2</sub>-C<sub>2-8</sub>アルキニルから選択され、ここで、その置換基はアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、置換アリール、置換ヘテロアリール、ヒドロキシおよびC<sub>1-8</sub>アルコキシから成る群から選択され、R<sup>3</sup>は、水素、OR<sup>4</sup>、SR<sup>4</sup>およびNR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>(ここで、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>は、独立して、C<sub>1-8</sub>アルキル、C<sub>3-8</sub>アルケニルおよびC<sub>3-8</sub>アルキニルから成る群から選択され、こ

で、前記  $C_{1-8}$  アルキル、 $C_{3-8}$  アルケニルおよび $C_{3-8}$  アルキニルは場合によりアリール、置換アリール、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヒドロキシおよび $C_{1-6}$  アルコキシから成る群から選択される 1 個以上の置換基で置換されていてもよい) から選択され、

$R^7$  は、水素、またはヒドロキシ保護基であり、そして

$R^8$  は、水素、アルキル、 $C_2-C_{10}$ -アルケニル、 $C_2-C_{10}$ -アルキニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクロ、アリール ( $C_1-C_{10}$ ) アルキル、アリール ( $C_2-C_{10}$ ) アルケニル、アリール ( $C_2-C_{10}$ ) アルキニル、ヘテロシクロ ( $C_2-C_{10}$ ) アルケニルおよびヘテロシクロ ( $C_2-C_{10}$ ) アルキニル、 $C_3-C_6$ -シクロアルキル、 $C_5-C_8$ -シクロアルケニル、各アルキルもしくはアルコキシ基中に炭素原子を 1-6 個含有するアルコキシアルキル、および各アルキルもしくはチオアルキル基中に炭素原子を 1-6 個含有するアルキルチオアルキルから選択される] で表される化合物、またはこれの光学異性体、鏡像異性体、ジアステレオマー、ラセミ体またはラセミ混合物、またはこれの薬学的に受け入れられる塩、エステルまたはプロドッグ。

【請求項 2】

$R^1$  および  $R^2$  が独立して水素、置換されている  $C_{1-8}$  アルキル、場合により置換されていてもよい -  $C H_2-C_{2-8}$  アルケニル、および置換されている -  $C H_2-C_{2-8}$  アルキニルから選択され、ここで、その置換基がアリール、置換アリール、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールから選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

$R^3$  が水素または  $O R^4$  である請求項 2 記載の化合物。

【請求項 4】

$R^7$  が水素である請求項 2 記載の化合物。

【請求項 5】

$R^8$  がエチルである請求項 2 記載の化合物。

【請求項 6】

$R^1$  および  $R^2$  が独立して水素および置換されている -  $C H_2-C_{2-8}$  アルケニルから選択され、ここで、その置換基が置換アリールまたは置換ヘテロアリールである請求項 3、4 または 5 記載の化合物。

【請求項 7】

$R^1$  および  $R^2$  が独立して水素、置換されている  $C_{1-8}$  アルキル、場合により置換されていてもよい -  $C H_2-C_{2-8}$  アルケニル、および置換されている -  $C H_2-C_{2-8}$  アルキニルから選択され、ここで、その置換基がアリール、置換アリール、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールから選択され、

$R^3$  が水素または  $O R^4$  であり、そして

$R^7$  が水素である、

請求項 1 記載の化合物。

【請求項 8】

$R^4$  が  $C_{1-8}$  アルキルである請求項 7 記載の化合物。

【請求項 9】

$R^3$  が水素である請求項 8 記載の化合物。

【請求項 10】

$R^8$  がエチルである請求項 9 記載の化合物。

【請求項 11】

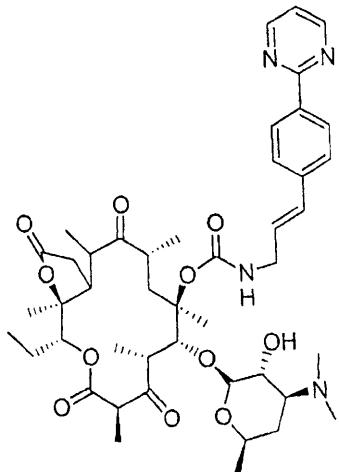
$R^1$  および  $R^2$  が独立して水素、(E)-3-[4-(2-ピリミジニル)フェニル]-2-プロペニル、(E)-3-[1-(2-ピラジニル)-イミダゾール-4-イル]-2-プロペニル、(E)-3-[1-(2-ピリミジニル)-1H-イミダゾール-4-イル]-2-プロペニルおよび(E)-3-[3-(2-ピリミジニル)フェニル]-2-プロペニルから選択される請

求項 10 記載の化合物。

【請求項 12】

構造

【化 2】

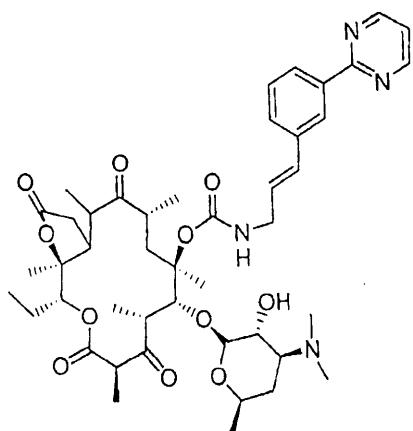


で表される請求項 1 記載の化合物またはこれの薬学的に受け入れられる塩。

【請求項 13】

構造

【化 3】

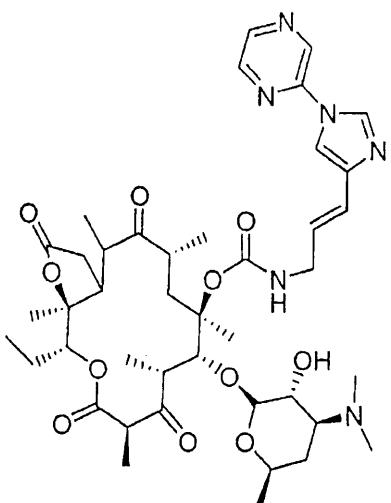


で表される請求項 1 記載の化合物またはこれの薬学的に受け入れられる塩。

【請求項 14】

構造

【化 4】

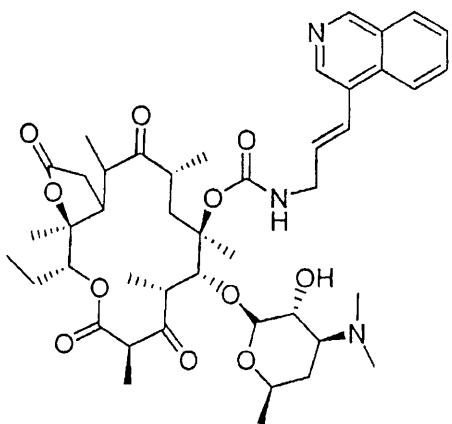


で表される請求項 1 記載の化合物またはこれの薬学的に受け入れられる塩。

【請求項 15】

構造

【化 5】

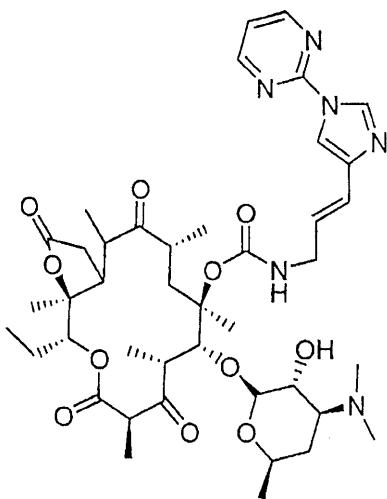


で表される請求項 1 記載の化合物またはこれの薬学的に受け入れられる塩。

【請求項 16】

構造

【化 6】



で表される請求項 1 記載の化合物またはこれの薬学的に受け入れられる塩。

**【請求項 17】**

請求項 1 記載の化合物と薬学的に受け入れられる担体を含んで成る薬剤組成物。

**【請求項 18】**

細菌感染によって引き起こされるか或は細菌感染が一因である状態を有する被験体を治療するための請求項 17 記載の薬剤組成物。

**【請求項 19】**

被験体が細菌感染によって引き起こされるか或は細菌感染が一因である状態に苦しむないようにするための請求項 17 記載の薬剤組成物。

**【請求項 20】**

前記状態が院外感染性肺炎、上気道および下気道感染、皮膚および軟組織感染、髄膜炎、院内感染性肺感染そして骨および関節感染から選択される請求項 18 または 19 記載の薬剤組成物。

**【請求項 21】**

前記細菌が黄色ブドウ球菌、表皮ブドウ球菌、肺炎連鎖球菌、腸球菌種、モラクセラ・カタラリスおよびインフルエンザ菌から選択される請求項 18 または 19 記載の薬剤組成物。

**【請求項 22】**

前記細菌がグラム陽性球菌である請求項 18 または 19 記載の薬剤組成物。

**【請求項 23】**

前記グラム陽性球菌が抗生物質耐性である請求項 22 記載の薬剤組成物。

**【請求項 24】**

前記グラム陽性球菌がエリスロマイシン耐性である請求項 23 記載の薬剤組成物。

**【請求項 25】**

薬剤組成物の製造方法であって、請求項 1 記載の化合物のいずれかと薬学的に受け入れられる担体を混合することを含んで成る方法。