

【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 21 年 9 月 17 日 (2009.9.17)

【公表番号】特表 2009-503021 (P2009-503021A)

【公表日】平成 21 年 1 月 29 日 (2009.1.29)

【年通号数】公開・登録公報 2009-004

【出願番号】特願 2008-524502 (P2008-524502)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 413/06 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/5355 (2006.01)**

**A 6 1 P 31/04 (2006.01)**

**A 6 1 K 45/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 D 413/06 C S P

A 6 1 K 31/5355

A 6 1 P 31/04

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】平成 21 年 7 月 30 日 (2009.7.30)

【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

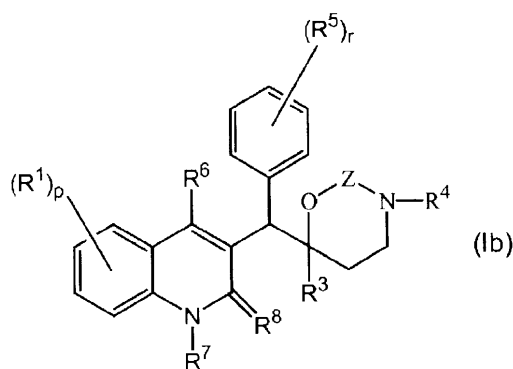
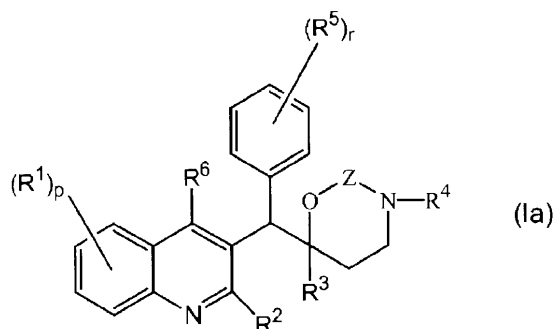
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

細菌感染の処置用の薬剤の製造のための化合物の使用であって、該化合物は式 (I a) および (I b)

## 【化 1】



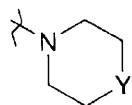
[ 式中、

$R^1$  は水素、ハロ、ハロアルキル、シアノ、ヒドロキシ、Ar、Het、アルキル、アルキルオキシ、アルキルチオ、アルキルオキシアルキル、アルキルチオアルキル、Ar-アルキルもしくはジ(Ar)アルキルであり；

p は 1、2、3 もしくは 4 に等しい整数であり；

$R^2$  は水素、ヒドロキシ、メルカプト、アルキルオキシ、アルキルオキシアルキルオキシ、アルキルチオ、モノもしくはジ(アルキル)アミノまたは式

## 【化 2】



(ここで、Y は  $CH_2$ 、O、S、NH もしくは N-アルキルである) の基であり；

$R^3$  はアルキル、Ar、Ar-アルキル、Het もしくは Het-アルキルであり；

$R^4$  は水素、アルキルもしくはベンジルであり；

$R^5$  は水素、ハロ、ハロアルキル、ヒドロキシ、Ar、アルキル、アルキルオキシ、アルキルチオ、アルキルオキシアルキル、アルキルチオアルキル、Ar-アルキルもしくはジ(Ar)アルキルであるか；または

2 個の隣接する  $R^5$  基は一緒になってそれらが結合しているフェニル環と一緒にナフチルを形成することができ；

r は 1、2、3、4 もしくは 5 に等しい整数であり；そして

$R^6$  は水素、アルキル、Ar もしくは Het であり；

$R^7$  は水素もしくはアルキルであり；

$R^8$  はオキソであるか；または

$R^7$  と  $R^8$  は一緒になって基 -  $CH=CH-N=$  を形成し；

Z は  $CH_2$  もしくは  $C(=O)$  であり；

アルキルは 1 ~ 6 個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分枝鎖状飽和炭化水素基であるか；または 3 ~ 6 個の炭素原子を有する環式飽和炭化水素基であるか；または 1 ~ 6 個の

炭素原子を有する直鎖状もしくは分枝鎖状飽和炭化水素基に結合した 3 ~ 6 個の炭素原子を有する環式飽和炭化水素基であり；ここで、各炭素原子は場合によりヒドロキシ、アルキルオキシもしくはオキソで置換されていてもよく；

A r は、各々場合により 1、2 もしくは 3 個の置換基で置換されていてもよい、フェニル、ナフチル、アセナフチル、テトラヒドロナフチルの群から選択される同素環であり、各置換基はヒドロキシ、ハロ、シアノ、ニトロ、アミノ、モノ - もしくはジアルキルアミノ、アルキル、ハロアルキル、アルキルオキシ、ハロアルキルオキシ、カルボキシル、アルキルオキシカルボニル、アミノカルボニル、モルホリニルおよびモノ - もしくはジアルキルアミノカルボニルの群から独立して選択され；

H e t は N - フェノキシピペリジニル、ピペリジニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、フラニル、チエニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニルおよびピリダジニルの群から選択される単環式複素環；またはキノリニル、キノキサリニル、インドリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、2, 3 - ジヒドロベンゾ [ 1, 4 ] ジオキシニルもしくはベンゾ [ 1, 3 ] ジオキソリルの群から選択される二環式複素環であり；各単環式および二環式複素環は場合により 1、2 もしくは 3 個の置換基で炭素原子上で置換されていてもよく、各置換基はハロ、ヒドロキシ、アルキルもしくはアルキルオキシの群から独立して選択され；

ハロはフルオロ、クロロ、ブロモおよびヨードの群から選択される置換基であり、そして

ハロアルキルは 1 ~ 6 個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分枝鎖状飽和炭化水素基または 3 ~ 6 個の炭素原子を有する環式飽和炭化水素基または 1 ~ 6 個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分枝鎖状飽和炭化水素基に結合した 3 ~ 6 個の炭素原子を有する環式飽和炭化水素基であり；ここで、1 個もしくはそれ以上の炭素原子は 1 個もしくはそれ以上のハロ原子で置換される]

の化合物、その製薬学的に許容しうる酸もしくは塩基付加塩、その第四級アミン、その立体化学的異性体、その互変異性体またはその N - オキシド形態であり、ただし、細菌感染はマイコプラズマ感染以外である使用。

【請求項 2】

R<sup>1</sup> が水素、ハロ、A r、H e t、アルキルもしくはアルキルオキシである請求項 1 に記載の使用。

【請求項 3】

R<sup>1</sup> がハロである請求項 2 に記載の使用。

【請求項 4】

p が 1 に等しい前記請求項のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 5】

R<sup>2</sup> がアルキルオキシである前記請求項のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 6】

R<sup>3</sup> が、各々場合により 1 もしくは 2 個の置換基で置換されていてもよい、ナフチルもしくはフェニルである前記請求項のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 7】

R<sup>4</sup> がアルキルである前記請求項のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 8】

R<sup>5</sup> が水素もしくはハロである前記請求項のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 9】

r が 1 である前記請求項のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 10】

R<sup>6</sup> が水素である前記請求項のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 11】

Z が  $\text{CH}_2$  である前記請求項のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 12】

化合物が式 (I a) の化合物である前記請求項のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 13】

$\text{R}^1$  が水素；ハロ；アルキル；Ar もしくは Het であり； $\text{R}^2$  がアルキルオキシであり； $\text{R}^3$  が、各々場合により 1 もしくは 2 個のハロで置換されていてもよい、ナフチルもしくはフェニルであり； $\text{R}^4$  がアルキルであり； $\text{R}^5$  が水素もしくはハロであり； $\text{R}^6$  が水素であり；Z が  $\text{CH}_2$  である請求項 1 に記載の使用。

【請求項 14】

アルキルが 1 ~ 6 個の炭素原子を有する直鎖状もしくは分枝鎖状飽和炭化水素基である前記請求項のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 15】

細菌感染がグラム陽性細菌による感染である前記請求項のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 16】

(a) 請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の式 (I a) もしくは (I b) の化合物、および (b) 1 種もしくはそれ以上の他の抗菌剤の組み合わせであって、ただし、1 種もしくはそれ以上の他の抗菌剤が抗マイコバクテリア剤以外である組み合わせ。

【請求項 17】

製薬学的に許容しうる担体、ならびに有効成分として、治療的に有効な量の (a) 請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の式 (I a) もしくは (I b) の化合物、および (b) 1 種もしくはそれ以上の他の抗菌剤を含んでなり、ただし、1 種もしくはそれ以上の他の抗菌剤が抗マイコバクテリア剤以外である製薬学的組成物。

【請求項 18】

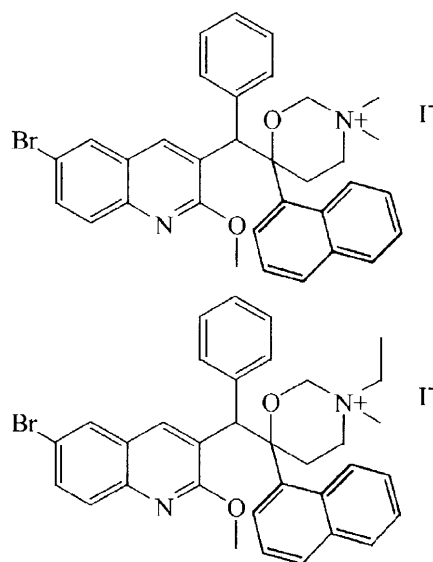
細菌感染の処置のための請求項 16 に記載の組み合わせもしくは請求項 17 に記載の製薬学的組成物の使用。

【請求項 19】

細菌感染の処置における同時、別個もしくは逐次使用のための組み合わせた製剤として、(a) 請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の式 (I a) もしくは (I b) の化合物、および (b) 1 種もしくはそれ以上の他の抗菌剤を含有し、ただし、1 種もしくはそれ以上の他の抗菌剤が抗マイコバクテリア剤以外である製品。

【請求項 20】

【化 3】



その立体化学的異性体もしくはその N - オキシド形態から選択される化合物。

【請求項 21】

細菌感染がブドウ球菌 (Staphylococci)、腸球菌 (Enterococci) または連鎖球菌 (Streptococci) による感染である請求項 1 ~ 15 および 18 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 22】

細菌感染がメチシリン耐性スタヒロコッカス・アウレウス (MRSA)、メチシリン耐性コアグラーゼ陰性ブドウ球菌 (MRCNS)、ペニシリン耐性ストレプトコッカス・ニューモニエまたは多剤耐性エンテロコッカス・フェシウムによる感染である請求項 1 ~ 15 および 18 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 23】

細菌感染がスタヒロコッカス・アウレウスまたはストレプトコッカス・ニューモニエによる感染である請求項 1 ~ 15 および 18 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 24】

細菌感染がメチシリン耐性スタヒロコッカス・アウレウス (MRSA) による感染である請求項 1 ~ 15 および 18 のいずれか 1 項に記載の使用。