

【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 2001-521039 (P2001-521039A)

【公表日】平成 13 年 11 月 6 日 (2001.11.6)

【出願番号】特願 2000-517980 (P2000-517980)

【国際特許分類】

C 0 7 H 17/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/7048 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 H 17/08 B

A 6 1 K 31/7048

A 6 1 P 31/04

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 10 月 27 日 (2005.10.27)

【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

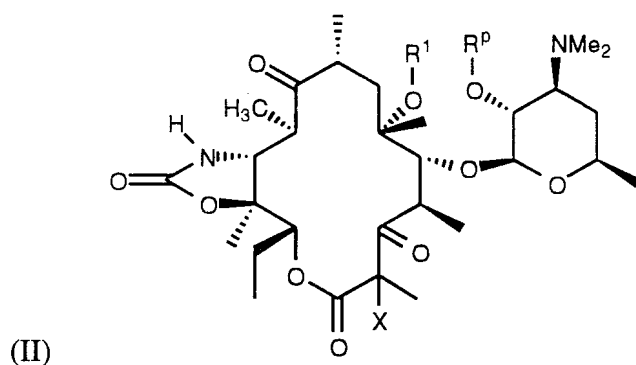
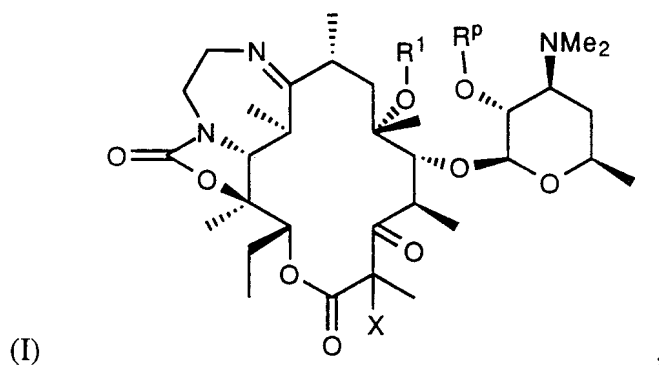
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

【化 1】



から成る群から選択される化合物であって、
上式で、 R^p が水素または水酸基保護基であり、

X が F、Cl、Br、または I であり、および R^1 が、

(1) 任意に 1 つまたは複数の、

(a) アリール、

(b) 置換アリール、

(c) ヘテロアリール、

(d) 置換ヘテロアリール、

(e) $-NR^3R^4$ であって、 R^3 および R^4 が独立に水素および $C_1 \sim C_3$ -アルキルから選択されるか、または R^3 および R^4 がそれらに結合する原子と一緒にあって、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-N(C_1 \sim C_6\text{-アルキル}-)$ 、 $-N(\text{アリール}-C_1 \sim C_6\text{-アルキル}-)$ 、 $-N(\text{置換アリール}-C_1 \sim C_6\text{-アルキル}-)$ 、 $-N(\text{ヘテロアリール}-C_1 \sim C_6\text{-アルキル}-)$ 、および $-N(\text{置換ヘテロアリール}-C_1 \sim C_6\text{-アルキル}-)$ から成る群から選択された部分を含む 3 ~ 7 員環を形成する $-NR^3R^4$

から成る群から選択された置換基で置換された $C_1 \sim C_6$ -アルキル、

(2) $-CH_2-CH=CH-Y$ であって、Y が

(a) H、

(b) アリール、

(c) 置換アリール、

(d) ヘテロアリール、

(e) 置換ヘテロアリール、

(f) $-CH=H_2$ 、

(g) $-CH=CH$ -アリール、

(h) $-CH=CH$ -置換アリール、

(i) $-CH=CH$ -ヘテロアリール、および

(j) $-CH=CH$ -置換ヘテロアリール、

(k) (アリール)オイル、

(l) (置換アリール)オイル、

(m) (ヘテロアリール)オイル、および

(n) (置換ヘテロアリール)オイル、

から成る群から選択される $-CH_2-CH=CH-Y$ 、および

(3) Y が前述のように定義されている $-CH_2-C \equiv C-Y$

から成る群から選択され、

ただし、 R^1 が選択肢 (1) から選択されている化学式 (II) の化合物においては、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル基は置換されていなければならない化合物およびそれらの薬剤として許容される塩およびエステル。

【請求項 2】 R^p が H、 R^1 がメチル、X が F である化学式 (I) の化合物、

R^p が H、 R^1 がメチル、X が Cl である化学式 (I) の化合物、

R^p が H、 R^1 がメチル、X が Br である化学式 (I) の化合物、

R^p が H、 R^1 が $-CH_2-CH=CH-Y$ 、Y が水素、X が F である化学式 (II) b の化合物、

R^p が H、 R^1 が $-CH_2-CH=CH-Y$ 、Y が (3-キノリル)、X が F である化学式 (II) b の化合物、

R^p が H、 R^1 が $-CH_2-CH=CH-Y$ 、Y が 6-ニトロ-3-キノリニル、X が F である化学式 (II) b の化合物、

R^p が H、 R^1 が $-CH_2-CH=CH-Y$ 、Y がフェニル、X が F である化学式 (II) b の化合物、

R^p が H、 R^1 が $-CH_2-CH=CH-Y$ 、Y が 6-tertブトキシカルボニルアミノ-3-キノリニル、X が F である化学式 (II) b の化合物、

R^p が H、 R^1 が $-CH_2-CH=CH-Y$ 、Y が 6-アミノ-3-キノリニル、X が F である化学式 (II) b の化合物、

R^P が H、 R^1 が $-CH_2-CH=CH-Y$ 、Y が 6 - キノリニル -、X が F である化学式 (I I) b の化合物、

R^P が H、 R^1 が $-CH_2-CH=CH-Y$ 、Y が 3 - (1, 8 - ナフチリジニル) -、X が F である化学式 (I I) b の化合物、

R^P が H、 R^1 が $-CH_2-CH=CH-Y$ 、Y が 6 - キノオキサリニル -、X が F である化学式 (I I) b の化合物、

R^P が H、 R^1 が $-CH_2-CH=CH-Y$ 、Y が 6 - (ジメチルアミノ) - 3 - キノリニル -、X が F である化学式 (I I) b の化合物、

R^P が H、 R^1 が $-CH_2-CH=CH-Y$ 、Y が 6 - (アミノスルホニルメチル) - 3 - キノリニル -、X が F である化学式 (I I) b の化合物、

R^P が H、 R^1 が $-CH_2-CH=CH-Y$ 、Y が 6 - (アミノカルボニル) - 3 - キノリニル -、X が F である化学式 (I I) b の化合物、

R^P が H、 R^1 が $-CH_2-CH=CH-Y$ 、Y が 6 - (N - メチルアミノ) - 3 - キノリニル -、X が F である化学式 (I I) b の化合物、

R^P が H、 R^1 が $-CH_2-CH=CH-Y$ 、Y が 6 - (ホルミル) - 3 - キノリニル -、X が F である化学式 (I I) b の化合物、

R^P が H、 R^1 が $-CH_2-CH=CH-Y$ 、Y が 6 - [(ヒドロキシイミノ)メチル] - 3 - キノリニル -、X が F である化学式 (I I) b の化合物、

R^P が H、 R^1 が $-CH_2-CH=CH-Y$ 、Y が 6 - [アミノイミノ(メチル)] - 3 - キノリニル -、X が F である化学式 (I I) b の化合物、

R^P が H、 R^1 が $-CH_2-CH=CH-Y$ 、Y が 6 - [[(1 - メチルエチリデン)アミノイミノ]メチル] - 3 - キノリニル -、X が F である化学式 (I I) b の化合物、

R^P が H、 R^1 が $-CH_2-CH=CH-Y$ 、Y が 3 - (5 - シアノ)ピリジニル -、X が F である化学式 (I I) b の化合物、

R^P が水素、 R^1 が $-CH_2-C(=O)CH_2-Y$ 、Y が水素、X が F である化学式 (I I) の化合物、

R^P が水素、 R^1 が $-CH_2-C(=O)CH_2-Y$ 、Y がフェニルカルボニル -、X が F である化学式 (I I) の化合物、

R^P が水素、 R^1 が $-CH_2-C(=O)CH_2-Y$ 、Y が 2 - チエニルカルボニル -、X が F である化学式 (I I) の化合物、

R^P が水素、 R^1 が $-CH_2-C(=O)CH_2-Y$ 、Y が (6 - クロロ - 3 - ピリジニル)カルボニル -、X が F である化学式 (I I) の化合物、

R^P が水素、 R^1 が $-CH_2-C(=O)CH_2-Y$ 、Y が 3 - キノリニル -、X が F である化学式 (I I) の化合物、

R^P が水素、 R^1 が $-CH_2-C(=O)CH_2-Y$ 、Y が 8 - スルホニルアミノ - 3 - キノリニル -、X が F である化学式 (I I) の化合物、

R^P が水素、 R^1 が $-CH_2-C(=O)CH_2-Y$ 、Y が (2, 2' - ビスチエン) - 5 - イル -、X が F である化学式 (I I) の化合物、

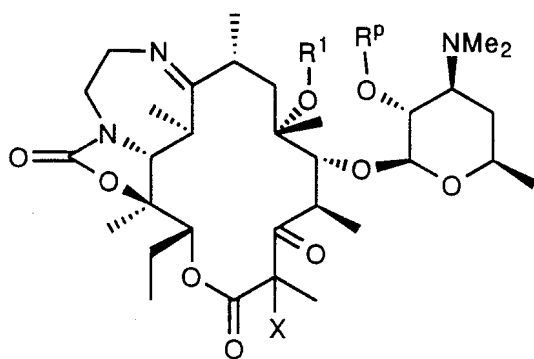
R^P が水素、 R^1 が $-CH_2-C(=O)CH_2-Y$ 、Y が [5 - (2 - ピリジル) - 2 - チエニル] -、X が F である化学式 (I I) の化合物

から成る群から選択された請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】 薬剤として許容される担体と共に治療有効量の請求項 1 の化合物またはそれらの薬剤として許容される塩もしくはエステルを含む、細菌感染を治療するための医薬組成物。

【請求項 4】 化学式 (I) を有する請求項 1 に記載の化合物。

【化 2】

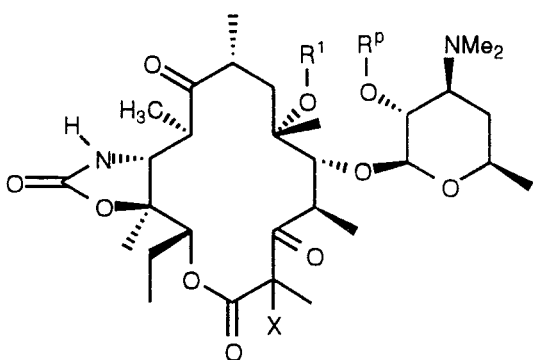


(I)

【請求項 5】 X が F である請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】 化学式 (I I) を有する請求項 1 に記載の化合物。

【化 3】

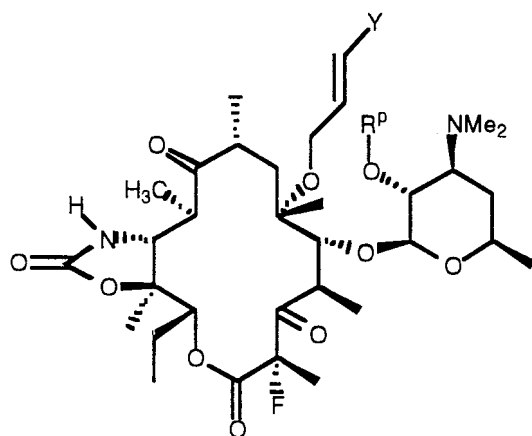


(II)

【請求項 7】 X が F である請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】 化学式 (I I) b を有する請求項 1 に記載の化合物。

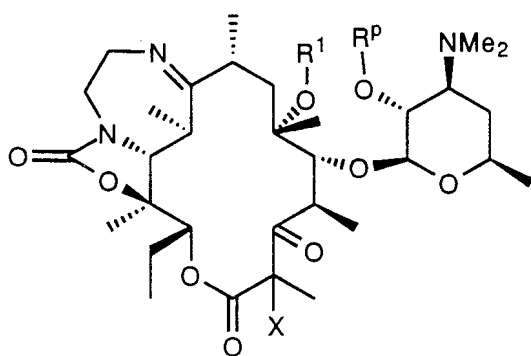
【化 4】



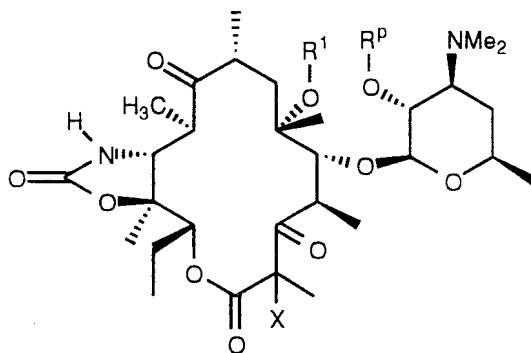
(II)b

【請求項 9】 化学式

【化 5】



(I)



(II)

を有する化合物であって、

式中、 R^P が水素または水酸基保護基であり、

X が F 、 Cl 、 Br 、または I であり、

R^1 が、

(1) 任意に 1 つまたは複数の、

(a) アリール、

(b) 置換アリール、

(c) ヘテロアリール、

(d) 置換ヘテロアリール、

(e) $-NR^3R^4$ であって、 R^3 および R^4 が独立に水素および $C_1 \sim C_3$ -アルキルから選択されるか、または R^3 および R^4 がそれらに結合する原子と一緒にあって、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-N(C_1 \sim C_6\text{-アルキル})-$ 、 $-N(\text{アリール}-C_1 \sim C_6\text{-アルキル})-$ 、 $-N(\text{置換アリール}-C_1 \sim C_6\text{-アルキル})-$ 、 $-N(\text{ヘテロアリール}-C_1 \sim C_6\text{-アルキル})-$ 、および $-N(\text{置換ヘテロアリール}-C_1 \sim C_6\text{-アルキル})-$ から成る群から選択された部分を含む 3 ~ 7 員環を形成する $-NR^3R^4$ 、

から成る群から選択された置換基で置換された $C_1 \sim C_6$ -アルキル、

(2) $-CH_2-CH=CH-Y$ であって、 Y が

(a) H 、

(b) アリール、

(c) 置換アリール、

(d) ヘテロアリール、

(e) 置換ヘテロアリール、

(f) $-CH=H_2$ 、

(g) $-CH=CH$ -アリール、

(h) $-CH=CH$ -置換アリール、

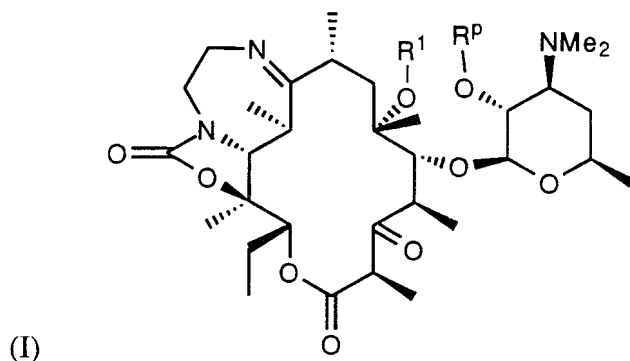
(i) $-CH=CH$ -ヘテロアリール、および

(j) $-CH=CH$ -置換ヘテロアリール、

(k) (アリール) オイル、

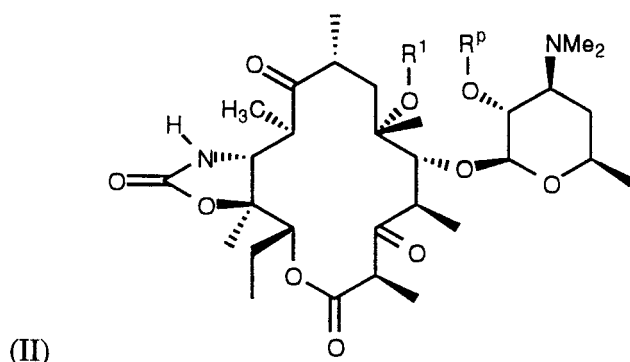
(1) (置換アリール) オイル、
 (m) (ヘテロアリール) オイル、および
 (n) (置換ヘテロアリール) オイル、
 から成る群から選択される $-CH_2-CH=CH-Y$ 、および
 (3) Y が前述のように定義されている $-CH_2-C \equiv C-Y$
 から成る群から選択され、
 ただし、 R^1 が選択肢 (1) から選択される化学式 (I I) の化合物においては、 C_1
 $\sim C_6$ -アルキル基は置換されていなければならない化合物を調製する方法であって、
 (a)

【化 6】



および

【化 7】



から成る群から選択されたそれぞれの化合物を、ハロゲン化試薬で処理して、任意に脱保護することを含む方法。

【請求項 10】 ハロゲン化試薬が、塩基存在下の N - フルオロベンゼンスルホンイミド、ギ酸に溶かした 10 % F_2 、3, 5 - ジクロロ - 1 - フルオロピリジニウムテトラフルオロボレート、3, 5 - ジクロロ - 1 - フルオロピリジニウムトリフレート、 $(CF_3SO_2)_2NF$ 、塩基存在下の N - フルオロ - N - メチル - p - トルエンスルホンアミド、N - フルオロピリジニウムトリフレート、塩基存在下の N - フルオロパーフルオロピペリジン、塩基存在下のヘキサクロロエタン、 $CF_3CF_2CH_2ICl_2$ 、 SO_2Cl_2 、 $SOCl_2$ 、塩基存在下の CF_3SO_2Cl 、 Cl_2 、酢酸存在下の $NaOCl$ 、 $Br_2 \cdot$ ピリジン $\cdot HBr$ 、 Br_2 / 酢酸、塩基存在下の N - プロモスクシンイミド、LDA / $BrCH_2CH_2Br$ 、LDA / CBr_4 、塩基存在下の N - ヨードスクシンイミド、および I_2 から成る群から選択される請求項 9 に記載の方法。

【請求項 11】 生成物が、X が F である化学式 (I) であり、ハロゲン化試薬が水素化ナトリウム存在下の N - フルオロベンゼンスルホンイミドである請求項 9 に記載の方法。

【請求項 1 2】 生成物が、XがFである化学式(I I)であり、ハロゲン化試薬が水素化ナトリウム存在下のN - フルオロベンゼンスルホンイミドである請求項 9 に記載の方法。

【請求項 1 3】 R^1 が $-CH_2 - CH = CH - Y$ であり、Yが、(3 - キノリル)、6 - ニトロ - 3 - キノリニル -、フェニル -、6 - tertブトキシカルボニルアミノ - 3 - キノリニル - 6 - アミノ - 3 - キノリニル -、6 - キノリニル -、3 - (1 , 8 - ナフチリジニル) -、6 - キノオキサリニル -、6 - (ジメチルアミノ) - 3 - キノリニル -、6 - (アミノスルホニルメチル) - 3 - キノリニル -、6 - (アミノカルボニル) - 3 - キノリニル -、6 - (N - メチルアミノ) - 3 - キノリニル -、6 - (ホルミル) - 3 - キノリニル -、6 - [(ヒドロキシイミノ) メチル] - 3 - キノリニル -、6 - [アミノイミノ (メチル)] - 3 - キノリニル -、6 - [[(1 - メチルエチリデン) アミノイミノ] メチル] - 3 - キノリニル -、および 3 - (5 - シアノ) ピリジニル - から成る群から選択される請求項 1 2 に記載の方法。