

(12) 특허협력조약에 의하여 공개된 국제출원

(19) 세계지식재산권기구
국제사무국

(43) 국제공개일
2012년 10월 4일 (04.10.2012)



(10) 국제공개번호
WO 2012/134184 A3

- (51) 국제특허분류:
C07D 501/34 (2006.01) A61P 31/00 (2006.01)
A61K 31/546 (2006.01)
- (21) 국제출원번호: PCT/KR2012/002302
- (22) 국제출원일: 2012년 3월 29일 (29.03.2012)
- (25) 출원언어: 한국어
- (26) 공개언어: 한국어
- (30) 우선권정보:
10-2011-0028603 2011년 3월 30일 (30.03.2011) KR
- (71) 출원인 (US 을(를) 제외한 모든 지정국에 대하여): 주식회사 레고켈 바이오사이언스 (LEGOCHEM BIOSCIENCES, LTD.) [KR/KR]; 305-390 대전광역시 유성구 전민동 461-8 번지 대전바이오벤처타운 3층, Daejeon (KR).
- (72) 발명자: 겸
- (75) 발명자/출원인 (US 에 한하여): 조영락 (CHO, Young Lag) [KR/KR]; 305-390 대전광역시 유성구 전민동 461-8 번지 대전바이오벤처타운 3층 (주)레고켈 바이오사이언스, Daejeon (KR). 윤정율 (YUN, Joung Yul) [KR/KR]; 305-390 대전광역시 유성구 전민동 461-8 번지 대전바이오벤처타운 3층 (주)레고켈 바이오사이언스, Daejeon (KR). 박철순 (PARK, Chul Soon) [KR/KR]; 305-390 대전광역시 유성구 전민동 461-8 번지 대전바

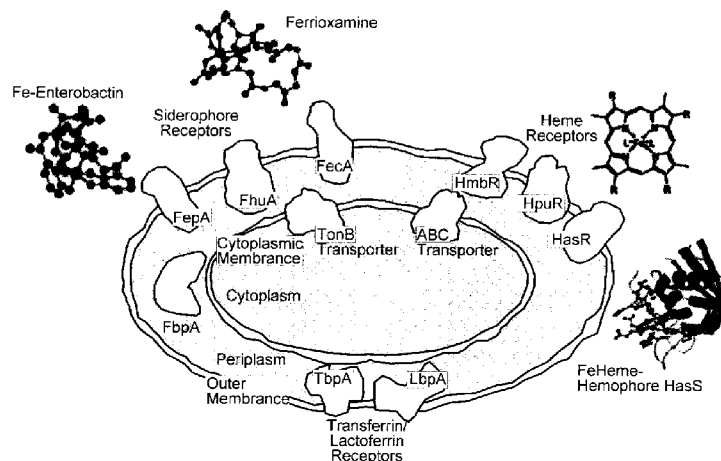
이오벤처타운 3층 (주)레고켈 바이오사이언스, Daejeon (KR). 채상은 (CHAE, Sang Eun) [KR/KR]; 305-390 대전광역시 유성구 전민동 461-8 번지 대전바이오벤처타운 3층 (주)레고켈 바이오사이언스, Daejeon (KR). 이향숙 (LEE, Hyang Sook) [KR/KR]; 305-390 대전광역시 유성구 전민동 461-8 번지 대전바이오벤처타운 3층 (주)레고켈 바이오사이언스, Daejeon (KR). 오규만 (OH, Kyuman) [KR/KR]; 305-390 대전광역시 유성구 전민동 461-8 번지 대전바이오벤처타운 3층 (주)레고켈 바이오사이언스, Daejeon (KR). 허혜진 (HEO, Hye Jin) [KR/KR]; 305-390 대전광역시 유성구 전민동 461-8 번지 대전바이오벤처타운 3층 (주)레고켈 바이오사이언스, Daejeon (KR). 강대혁 (KANG, Dae Hyuck) [KR/KR]; 305-390 대전광역시 유성구 전민동 461-8 번지 대전바이오벤처타운 3층 (주)레고켈 바이오사이언스, Daejeon (KR). 양영재 (YANG, Young Jae) [KR/KR]; 305-390 대전광역시 유성구 전민동 461-8 번지 대전바이오벤처타운 3층 (주)레고켈 바이오사이언스, Daejeon (KR). 권현진 (KWON, Hyun Jin) [KR/KR]; 305-390 대전광역시 유성구 전민동 461-8 번지 대전바이오벤처타운 3층 (주)레고켈 바이오사이언스, Daejeon (KR). 박태교 (PARK, Tae Kyo) [KR/KR]; 305-390 대전광역시 유성구 전민동 461-8 번지 대전바이오벤처타운 3층 (주)레고켈 바이오사이언스, Daejeon (KR). 우성호 (WOO, Sung Ho) [KR/KR]; 305-390 대전광역시 유성구 전민동 461-8 번지 대전바이오벤처타운 3층 (주)레고켈 바이오사이언스, Daejeon (KR). 김용주 (KIM, Yong

[다음 쪽 계속]

(54) Title: NOVEL CEPHALOSPORIN DERIVATIVE AND MEDICAL COMPOSITION CONTAINING SAME

(54) 발명의 명칭 : 신규한 세파로스포린 유도체 및 이를 함유하는 의약 조성물

[Fig. 1]



(57) Abstract: The present invention relates to a novel cephalosporin derivative indicated in chemical formula 1 of the description. In the chemical formula 1, X, Y, L, R₁, R₂ are identical as defined in the detailed explanation. In addition, the present invention relates an antibiotic medical composition containing the novel cephalosporin derivative of the chemical formula 1, a prodrug thereof, a hydrate thereof, a solvate thereof, an isomer thereof, and a pharmaceutically permitted salt thereof, as active ingredients. The novel cephalosporin derivative of the chemical formula 1, the prodrug thereof, the hydrate thereof, the solvate thereof, the isomer thereof, and the pharmaceutically permitted salt thereof have a wide antibacterial spectrum for resistant bacteria, have low toxicity, and in particular, show strong antibacterial effect on gram negative bacteria, and is thus useful as an antibiotic.

(57) 요약서:

[다음 쪽 계속]



Zu) [KR/KR]; 305-390 대전광역시 유성구 전민동 461-8 번지 대전바이오벤처타운 3 층 (주)레고캠 바이오사이언스, Daejeon (KR).

(74) **대리인: 손창규 (SOHN, Chang Kyu);** 135-910 서울특별시 강남구 역삼1동 642-16 번지 성지하이츠 2 차빌딩 1403 호, Seoul (KR).

(81) **지정국** (별도의 표시가 없는 한, 가능한 모든 종류의 국내 권리의 보호를 위하여): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC,

SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) **지정국** (별도의 표시가 없는 한, 가능한 모든 종류의 역내 권리의 보호를 위하여): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 유라시아 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 유럽 (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

공개:

— 국제조사보고서와 함께 (조약 제 21 조(3))

(88) **국제조사보고서 공개일:** 2013 년 3 월 7 일

본 발명은 명세서 상의 화학식 1 로 표시되는 신규한 세파로스포린 유도체에 관한 것이다. 화학식 1 에서, X, Y, L, R₁, R₂ 는 발명의 상세한 설명에 정의된 바와 동일하다. 또한, 본 발명은 상기 화학식 1 의 신규한 세파로스포린 유도체, 이의 프로드럭, 이의 수화물, 이의 용매화물, 이의 이성질체 및 이의 약제학적으로 허용되는 염을 유효성분으로 함유하는 항생제용 의약 조성물에 관한 것이다. 본 발명에 따른 신규한 세파로스포린 유도체, 이의 프로드럭, 이의 수화물, 이의 용매화물, 이의 이성질체 및 이의 약제학적으로 허용되는 염은 내성균에 대한 항균 스펙트럼이 넓고, 독성이 낮으며, 특히 그람음성균에 강한 항균효과를 나타내므로, 항생제로 유용하게 사용될 수 있다.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/KR2012/002302

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: 7
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
Claim 7 pertains to a method for treatment of the human body, and thus pertains to subject matter on which the International Searching Authority is not required to carry out an international search under the provisions of PCT Article 17(2)(a)(i) and PCT Rule 39.1(iv).
2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, the payment of a protest fee.
- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.
- ☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/KR2012/002302**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER*****C07D 501/34(2006.01)i, A61K 31/546(2006.01)i, A61P 31/00(2006.01)i***

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D 501/34; A61K 31/70; A61K 31/545; C07D 501/36; A61K 31/435; A61K 38/16

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Korean Utility models and applications for Utility models

Japanese Utility models and applications for Utility models

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

eKOMPASS (KIPO internal) & PUBMED

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	US 04470983A A (BLUMBACH, JURGEN et al.) 11 September 1984 See the entire document	1-6
A	WO 96-02548 A1 (MERCK & CO., INC.) 01 February 1996 See the entire document	1-6
A	US 5036064A A (GOTSCHL, ERWIN) 30 July 1991 See the entire document	1-6
A	US 7279458 B2 (FATHEREE, PAUL R. et al.) 09 October 2007 See the entire document	1-6

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

29 NOVEMBER 2012 (29.11.2012)

Date of mailing of the international search report

30 NOVEMBER 2012 (30.11.2012)

Name and mailing address of the ISA/KR

Korean Intellectual Property Office
Government Complex-Daejeon, 139 Seonsa-ro, Daejeon 302-701,
Republic of Korea

Facsimile No. 82-42-472-7140

Authorized officer

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.

PCT/KR2012/002302

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member	Publication date
US 04470983A A	11.09.1984	EP 0034760 A1 EP 0034760 B1 JP 56-142289 A US 04603129A A	02.09.1981 30.05.1984 06.11.1981 29.07.1986
WO 96-02548 A1	01.02.1996	AU 4276496 A US 05498777A A US 05541176A A WO 96-02548A1	16.02.1996 12.03.1996 30.07.1996 01.02.1996
US 5036064A A	30.07.1991	EP 0303172 A3 JP 01-066190 A KR 10-1989-0003776 A US 05073550A A US 05138066A A US 05319140A A	15.05.1991 13.03.1989 18.04.1989 17.12.1991 11.08.1992 07.06.1994
US 7279458 B2	09.10.2007	US 2005-0026818 A1 US 2006-0189517 A1 US 7067482 B2	03.02.2005 24.08.2006 27.06.2006

제2기재란 일부 청구항을 조사할 수 없는 경우의 의견(첫 번째 용지의 2의 계속)

PCT 제17조(2)(a)의 규정에 따라 다음과 같은 이유로 일부 청구항에 대하여 본 국제조사보고서가 작성되지 아니하였습니다.

1. ☒ 청구항: 7
이 청구항은 본 기관이 조사할 필요가 없는 대상에 관련됩니다. 즉,
청구항7은 사람을 치료하는 방법에 대한 것이므로 PCT 조약 제17조(2)(a)(i) 및 조약규칙 39.1(IV)의 규정에 의하여 국제조사기관이 국제 조사할 의무가 없는 대상에 해당됩니다.
2. ☐ 청구항:
이 청구항은 유효한 국제조사를 수행할 수 없을 정도로 소정의 요건을 충족하지 아니하는 국제출원의 부분과 관련됩니다. 구체적으로는,
3. ☐ 청구항:
이 청구항은 종속청구항이나 PCT규칙 6.4(a)의 두 번째 및 세 번째 문장의 규정에 따라 작성되어 있지 않습니다.

제3기재란 발명의 단일성이 결여된 경우의 의견(첫 번째 용지의 3의 계속)

본 국제조사기관은 본 국제출원에 다음과 같이 다수의 발명이 있다고 봅니다.

1. ☐ 출원인이 모든 추가수수료를 기간 내에 납부하였으므로, 본 국제조사보고서는 모든 조사 가능한 청구항을 대상으로 합니다.
2. ☐ 추가수수료 납부를 요구하지 않고도 모든 조사 가능한 청구항을 조사할 수 있었으므로, 본 기관은 추가수수료 납부를 요구하지 아니하였습니다.
3. ☐ 출원인이 추가수수료의 일부만을 기간 내에 납부하였으므로, 본 국제조사보고서는 수수료가 납부된 청구항만을 대상으로 합니다. 구체적인 청구항은 아래와 같습니다.
4. ☐ 출원인이 기간 내에 추가수수료를 납부하지 아니하였습니다. 따라서 본 국제조사보고서는 청구범위에 처음 기재된 발명에 한정되어 있으며, 해당 청구항은 아래와 같습니다.

이의신청에
관한 기재

- ☐ 출원인의 이의신청 및 이의신청료 납부(해당하는 경우)와 함께 추가수수료가 납부되었습니다.
- ☐ 출원인의 이의신청과 함께 추가수수료가 납부되었으나 이의신청료가 보정요구서에 명시된 기간 내에 납부되지 아니하였습니다.
- ☐ 이의신청 없이 추가수수료가 납부되었습니다.

A. 발명이 속하는 기술분류(국제특허분류(IPC)) <i>C07D 501/34(2006.01)i, A61K 31/546(2006.01)i, A61P 31/00(2006.01)i</i>		
B. 조사된 분야 조사된 최소문헌(국제특허분류를 기재) C07D 501/34; A61K 31/70; A61K 31/545; C07D 501/36; A61K 31/435; A61K 38/16 조사된 기술분야에 속하는 최소문헌 이외의 문헌 한국등록실용신안공보 및 한국공개실용신안공보 일본등록실용신안공보 및 일본공개실용신안공보 국제조사에 이용된 전산 데이터베이스(데이터베이스의 명칭 및 검색어(해당하는 경우)) eKOMPASS(특허청 내부 검색시스템) & PUBMED		
C. 관련 문헌		
카테고리*	인용문헌명 및 관련 구절(해당하는 경우)의 기재	관련 청구항
A	US 04470983A A (BLUMBACH, JURGEN 외 2명) 1984.09.11 전체 문헌 참조	1-6
A	WO 96-02548 A1 (MERCK & CO., INC.) 1996.02.01 전체 문헌 참조	1-6
A	US 5036064A A (GOTSCHI, ERWIN) 1991.07.30 전체 문헌 참조	1-6
A	US 7279458 B2 (FATHEREE, PAUL R. 외 5명) 2007.10.09 전체 문헌 참조	1-6
☐ 추가 문헌이 C(계속)에 기재되어 있습니다. ☒ 대응특허에 관한 별지를 참조하십시오.		
* 인용된 문헌의 특별 카테고리: “A” 특별히 관련이 없는 것으로 보이는 일반적인 기술수준을 정의한 문헌 “E” 국제출원일보다 빠른 출원일 또는 우선일을 가지나 국제출원일 이후에 공개된 선출원 또는 특허 문헌 “L” 우선권 주장에 의문을 제기하는 문헌 또는 다른 인용문헌의 공개일 또는 다른 특별한 이유(이유를 명시)를 밝히기 위하여 인용된 문헌 “O” 구두 개시, 사용, 전시 또는 기타 수단을 언급하고 있는 문헌 “P” 우선일 이후에 공개되었으나 국제출원일 이전에 공개된 문헌 “T” 국제출원일 또는 우선일 후에 공개된 문헌으로, 출원과 상충하지 않으며 발명의 기초가 되는 원리나 이론을 이해하기 위해 인용된 문헌 “X” 특별한 관련이 있는 문헌. 해당 문헌 하나만으로 청구된 발명의 신규성 또는 진보성이 없는 것으로 본다. “Y” 특별한 관련이 있는 문헌. 해당 문헌이 하나 이상의 다른 문헌과 조합하는 경우로 그 조합이 당업자에게 자명한 경우 청구된 발명은 진보성이 없는 것으로 본다. “&” 동일한 대응특허문헌에 속하는 문헌		
국제조사의 실제 완료일 2012년 11월 29일 (29.11.2012)		국제조사보고서 발송일 2012년 11월 30일 (30.11.2012)
ISA/KR의 명칭 및 우편주소 대한민국 특허청 (302-701) 대전광역시 서구 청사로 189, 4동 (둔산동, 정부대전청사) 팩스 번호 82-42-472-7140		심사관 김미하 전화번호 82-42-481-8736

국제조사보고서에서
인용된 특허문헌

공개일

대응특허문헌

공개일

US 04470983A A

1984.09.11

EP 0034760 A1

1981.09.02

EP 0034760 B1

1984.05.30

JP 56-142289 A

1981.11.06

US 04603129A A

1986.07.29

WO 96-02548 A1

1996.02.01

AU 4276496 A

1996.02.16

US 05498777A A

1996.03.12

US 05541176A A

1996.07.30

WO 96-02548A1

1996.02.01

US 5036064A A

1991.07.30

EP 0303172 A3

1991.05.15

JP 01-066190 A

1989.03.13

KR 10-1989-0003776 A

1989.04.18

US 05073550A A

1991.12.17

US 05138066A A

1992.08.11

US 05319140A A

1994.06.07

US 7279458 B2

2007.10.09

US 2005-0026818 A1

2005.02.03

US 2006-0189517 A1

2006.08.24

US 7067482 B2

2006.06.27