

【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24年12月13日 (2012.12.13)

【公表番号】特表2009-502974(P2009-502974A)

【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2008-524308(P2008-524308)

【国際特許分類】

C 0 7 C 323/52 (2006.01)

C 0 7 D 235/14 (2006.01)

C 0 7 D 295/08 (2006.01)

C 0 7 D 233/88 (2006.01)

C 0 7 D 235/30 (2006.01)

A 6 1 K 31/215 (2006.01)

A 6 1 K 31/4184 (2006.01)

A 6 1 K 31/5375 (2006.01)

A 6 1 K 31/4168 (2006.01)

A 6 1 P 31/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/10 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 0 1 K 67/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 323/52 C S P

C 0 7 D 235/14

C 0 7 D 295/08 Z

C 0 7 D 233/88

C 0 7 D 235/30 A

A 6 1 K 31/215

A 6 1 K 31/4184

A 6 1 K 31/5375

A 6 1 K 31/4168

A 6 1 P 31/00

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 31/06

A 6 1 P 17/10

A 6 1 P 29/00

A 0 1 K 67/00 5 0 1

【誤訳訂正書】

【提出日】平成24年10月24日 (2012.10.24)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

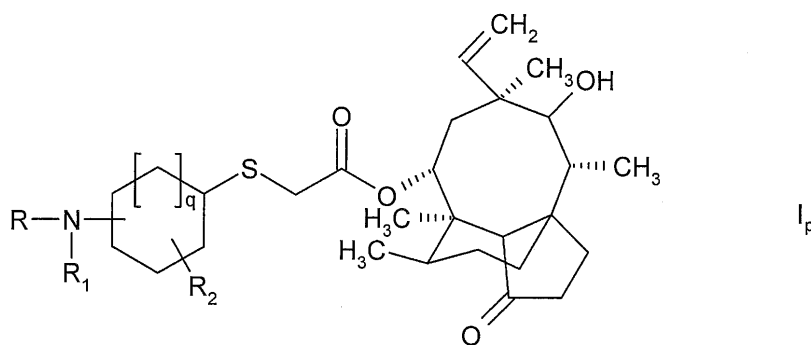
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 I_p

【化 1】



(式中、

R は水素又は (C₁ - 8) アルキルを示し、R₁ は(C₃ - 12) シクロアルキル、非置換の (C₁ - 8) アルキル、又は、

ヒドロキシシル基；

ハロゲン；

(C₁ - 6) アルキルオキシカルボニル；(C₁ - 4) アルキルアミノカルボニル；(C₃ - 8) シクロアルキルもしくはシクロヘキシル；(C₆ - 18) アリール；、または

3 ~ 7 員環の複素環基であり、N、O、及び S からなる群から選ばれる、1 ~ 4 個のヘテロ原子を含み、他の環と縮環されていてもよい複素環基；

R₂ は水素又は (C₁ - 4) アルキルを示し、

q は 0、1 又は 2 から選ばれる数を示し；及び、

-N(RR₁) 基は、シクロアルキル環の位置 3 または位置 4 にある)

で表される化合物、または

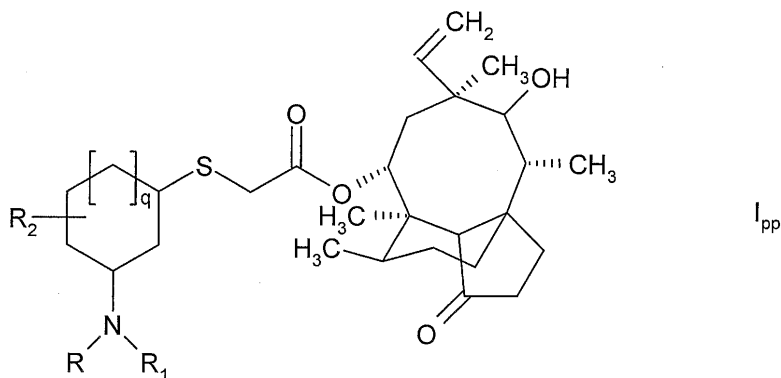
14 - O - [((3 - (モルホリン - 4 - イル) - シクロヘキサン - 1 - イル) - スルファニル) - アセチル] - ムチリン

である化合物。

【請求項 2】

一般式 I_{pp}

【化 2】

(式中、R、R₁、R₂ 及び q は請求項 1 に定義されている)

で表される請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

14 - O - [(3 - ジエチルアミノ - シクロヘキサン - 1 - イル) - スルファニルアセ

チル] - ムチリン、

14 - O - { [(3 - メチルアミノ - シクロペンタ - 1 - イル) - スルファニル] - アセチル} - ムチリン、

14 - O - { [(3 - エチルアミノ - シクロペンタ - 1 - イル) - スルファニル] - アセチル} - ムチリン、

14 - O - { [(3 - エチルアミノ - 1 - メチル - シクロペンタ - 1 - イル) - スルファニル] - アセチル} - ムチリン、

14 - O - { [(3 - エチルアミノ - 2 - メチル - シクロペンタ - 1 - イル) - スルファニル] - アセチル} - ムチリン、

14 - O - { [(3 - エチルアミノ - シクロヘキサニル) - スルファニル] - アセチル} - ムチリン、

14 - O - { [3 - (sec - ブチルアミノ) - シクロペンタ - 1 - イル] - スルファニル] - アセチル} - ムチリン、

14 - O - [((3 - (sec - ブチルアミノ) - シクロヘキサン - 1 - イル) - スルファニル) - アセチル] - ムチリン、

14 - O - [((1 - (sec - ブチルアミノ) - シクロヘプタン - 3 - イル) - スルファニル) - アセチル] - ムチリン、

14 - O - { [3 - (2, 2, 2 - トリフルオロ - エチルアミノ) - シクロペンタ - 1 - イル] - スルファニル] - アセチル} - ムチリン、

14 - O - { [3 - (2, 2, 2 - トリフルオロ - エチルアミノ) - シクロヘキサン - 1 - イル] - スルファニル] - アセチル} - ムチリン、

14 - O - { [3 - (2, 2 - ジフルオロ - エチルアミノ) - シクロヘキサン - 1 - イル] - スルファニル] - アセチル} - ムチリン、

14 - O - { [(3 - (2 - ヒドロキシ - エチルアミノ) - シクロペンタ - 1 - イル) - スルファニル] - アセチル} - ムチリン、

14 - O - { [3 - (2 - ヒドロキシ - プロピルアミノ) - シクロペンタ - 1 - イル] - スルファニル] - アセチル} - ムチリン、

14 - O - [((3 - (1 - イソプロピル - 2 - ヒドロキシ - エチルアミノ) - シクロペンタ - 1 - イル) - スルファニル) - アセチル] - ムチリン、

14 - O - [((3 - (1 - イソプロピル - 2 - ヒドロキシ - エチルアミノ) - シクロヘキサン - 1 - イル) - スルファニル) - アセチル] - ムチリン、

14 - O - { [3 - (2 - ヒドロキシ - 1 - ヒドロキシメチル - 1 - メチル - エチルアミノ) - シクロペンタ - 1 - イル] - スルファニル] - アセチル} - ムチリン、

14 - O - { [3 - (2 - ヒドロキシ - 1, 1 - ビス - ヒドロキシメチル - エチルアミノ) - シクロペンタ - 1 - イル] - スルファニル] - アセチル} - ムチリン、

14 - O - [((3 - (メトキシカルボニル - メチルアミノ) - シクロペンタ - 1 - イル) - スルファニル) - アセチル] - ムチリン、

14 - O - [((3 - (エトキシカルボニル - メチルアミノ) - シクロペンタ - 1 - イル) - スルファニル) - アセチル] - ムチリン、

14 - O - [(((3 - (イソプロポキシカルボニル - メチルアミノ) - シクロペンタ - 1 - イル) - スルファニル) - アセチル] - ムチリン、

14 - O - { [3 - (メトキシプロピオニル - 2 - アミノ) - シクロペンタ - 1 - イル] - スルファニル] - アセチル} - ムチリン、

14 - O - { [3 - (イソプロポキシプロピオニル - 2 - アミノ) - シクロペンタ - 1 - イル] - スルファニル] - アセチル} - ムチリン、

14 - O - { [(3 - メチルカルバモイルメチルアミノ - シクロペンタ - 1 - イル) - スルファニル] - アセチル} - ムチリン、

14 - O - [(((3 - (1 - シクロヘキシルエチル) - アミノ) - シクロヘキサン - 1 - イル) - スルファニル) - アセチル] - ムチリン、

14 - O - [(((3 - (フェニルエチル) - アミノ) - シクロペンタン - 1 - イル) -

- スルファニル) - アセチル] - ムチリン、
 14 - O - [((3 - (フェニルエチル) - アミノ) - シクロヘキサン - 1 - イル)
 - スルファニル) - アセチル] - ムチリン、
 14 - O - { [3 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イルメチルアミノ) - シクロペン
 タ - 1 - イルスルファニル] - アセチル } - ムチリン、
 14 - O - { [(3 - ジメチルアミノ - シクロペンタ - 1 - イル) - スルファニル] -
 アセチル } - ムチリン、
 14 - O - { [(3 - ジエチルアミノ - シクロペンタ - 1) - イル) - スルファニル]
 - アセチル } - ムチリン、
 14 - O - [((3 - ジエチルアミノ - シクロヘプタン - 1 - イル) - スルファニル)
 - アセチル] - ムチリン、
 14 - O - { [(3 - シクロプロピルアミノ - シクロペンタ - 1 - イル) - スルファニ
 ル] - アセチル } - ムチリン、
 14 - O - { [(3 - シクロプロピルアミノ - シクロヘキサン - 1 - イル) - スルファ
 ニル] - アセチル } - ムチリン、
 14 - O - [((3 - (モルホリン - 4 - イル) - シクロヘキサン - 1 - イル) - スル
 ファニル) - アセチル] - ムチリン、
 14 - O - { [(3 - (1 H - イミダゾール - 2 - イルアミノ) - シクロペンタ - 1 -
 イル) - スルファニル] - アセチル } - ムチリン、及び、
 14 - O - { [(3 - (1 H - ベンゾイミダゾール - 2 - イルアミノ) - シクロペンタ
 - 1 - イル) - スルファニル] - アセチル } - ムチリンからなる群より選ばれることを特
 徴とする請求項 1 または 2 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 4】

塩及び / 又は溶媒和物状であることを特徴とする請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】

医薬品として用いられることを特徴とする請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6】

微生物によって媒介される病気を治療するための薬剤の調合における、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 7】

少なくとも 1 つの医薬品賦形剤と合わせた、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 8】

他の薬剤活性剤をさらに含むことを特徴とする請求項 7 に記載の医薬組成物。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0013

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0013】

上述の化合物において、

- ・シクロアルキルは、例えば (C₅ - ₇) シクロアルキルを含む (C₄ - ₈) シクロアルキル基などの、(C₃ - ₁₂) のシクロアルキルであり、
- ・ヘテロサイクリルは、3 ~ 7 員環、好ましくは 5 ~ 6 員環の複素環基であり、N、O、及び S、好ましくは N 及び O から選ばれる 1 ~ 4 個、好ましくは 2 個のヘテロ原子を含むものを包含し、例えばフェニルを含む (C₆ - ₁₂) アリールなどの、他の環 / 系と縮環されてもよく、
- ・“ヘテロサイク - N - イル - シクロアルキル” は、5 ~ 7 員環であり、少なくとも 1 つ

が窒素ヘテロ原子であるN、O、及びSから選ばれる1～4個のヘテロ原子を含むヘテロサイクリルを意味し、当該窒素ヘテロ原子は、例えばモルホリン-1-イルなどのシクロアルキルと結合しており、

・アルキルは、例えば(C₁ - 4)アルキルなどの(C₁ - 8)アルキルであることが好ましく、

・アルキルは、非置換のアルキル及び置換されたアルキルを含み、例えば、非置換のアルキル、又は、以下の1つ以上に置換されたアルキル：

例えば1つか2つのヒドロキシル基；

ハロゲン；

例えば(C₁ - 6)アルキルオキシカルボニルなどの例えば1つのアルキルオキシカルボニル；

例えば(C₁ - 4)アルキルアミノカルボニルなどの例えば1つのアルキルアミノカルボニル；

例えば(C₃ - 8)シクロアルキルやシクロヘキシルなどの例えば1つのシクロアルキル；

例えば(C₆ - 18)アリールやフェニルなどの例えば1つのアニール；

3～7員環、好ましくは5～6員環の複素環基であり、N、O、及びS、好ましくはN及びOから選ばれる1～4個、好ましくは2個のヘテロ原子を含むものを包含するヘテロサイクリルであって、例えばフェニルなどの(C₆ - 18)アリール、例えばイミダゾール-2-イル、ベンズイミダゾール、及びベンズイミダゾール-2-イルなどのイミダゾリルなどの、他の環系と縮環されていてもよい、例えば1つのヘテロサイクリル、であって、なお、14-O-[(ヘテロサイク-N-イル-シクロアルキル)-スルファニル-若しくは-オキシ)-アセチル、-チオアセチル若しくは-イミノ-オキシ]-ムチリン、若しくは14-O-[(ヘテロサイク-N-イル-シクロアルキル)-アルキルスルファニル-若しくは-アルキル-オキシ)-アセチル、-チオアセチル若しくは-イミノ-オキシ]-ムチリンの場合には、ヘテロサイクリル基は、ヘテロサイクリル窒素原子を介してシクロアルキルと結合している。

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0016

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0016】

(式中、

Rは水素又は(C₁ - 8)アルキルを示し、

R₁は、

・例えば(C₅ - 7)シクロアルキルを含む(C₄ - 8)シクロアルキルなどの(C₃ - 12)シクロアルキルを含むシクロアルキル、

・非置換の(C₁ - 8)アルキル、又は、

・1つ以上に置換された(C₁ - 8)アルキル：

好ましくは1つか2つのヒドロキシル基；

ハロゲン；

好ましくは1つの例えば(C₁ - 6)アルキルオキシカルボニルなどのアルキルオキシカルボニル；

好ましくは1つの例えば(C₁ - 4)アルキルアミノカルボニルなどのアルキルアノカルボニル；

好ましくは1つの例えばシクロヘキシルなどの(C₃ - 8)シクロアルキル；好ましくは1つの例えばフェニルなどの(C₆ - 18)アリール；

3～7員環、好ましくは5～6員環の複素環基であり、N、O、及びS、好ましくはN及びOから選ばれる1～4個、好ましくは2個のヘテロ原子を含むものを包含するヘテロ

サイクリルであって、例えばフェニルなどの (C_{6-18}) アリール、例えばイミダゾール-2-イルなどのイミダゾリル、及び例えばベンズイミダゾール-2-イルなどのベンズイミダゾールなどのうち、好ましくは1つの他の環ノ系と縮環されていてよいヘテロサイクリル、

を示し、

Xは硫黄、酸素、又は NR_{10} (R_{10} は水素又は (C_{1-8}) アルキルを示す) を示し、

Yは硫黄又は酸素を示し、

R_2 は水素、又は、例えば(プレウロ)ムチリンなどの従来的な有機的置換基及び (C_{1-4}) アルキルやハロゲン元素などの従来的な化学的置換基などである、置換基を含む1つ以上の置換基を示し、

R_4 及び R_5 は互いに独立的に水素又は (C_{1-8}) アルキルを示し、

R_3 及び R_3' は水素、重水素、又はハロゲンを示し、

R_6 、 R_7 、及び R_8 は互いに独立的に水素、ハロゲン、又は重水素を示し、

mは0～4から選ばれる数を示し、

nは0～10から選ばれる数を示し、及び、

pは0～10から選ばれる数を示し、

なお、nプラスpは少なくとも1であり、好ましくは13未満であり、例えば3～5を含む3～8などである)

好ましい実施形態によれば、式Iの化合物において、

- ・ R 及び R_1 は上記で定義した通りであり、
- ・ R_2 は水素又は (C_{1-4}) アルキルを示し、
- ・ R_3 は水素を示し、
- ・ R_3' は水素を示し、
- ・ R_4 は水素を示し、
- ・ R_5 は水素を示し、
- ・ R_6 は水素を示し、
- ・ R_7 は水素を示し、
- ・ Xは酸素を示し、
- ・ Yは硫黄を示し、
- ・ mは0～4から選ばれる数を示し、さらに好ましくは、mは0を示し、
- ・ nは0～8から選ばれる数を示し、さらに好ましくは、例えば2又は3などの0～7を示し、
- ・ pは0～8から選ばれる数を示し、さらに好ましくは、例えば1などの0～7を示しており、

なお、nプラスpは少なくとも2であり、好ましくは9未満であり、さらに好ましくは、nプラスpは3又は4である。例えば、ここで定義された各単置換基は、好ましい置換基であり、他の置換基に対して独立的である。