



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21), (22) Заявка: 2007133709/04, 27.01.2006

(30) Конвенционный приоритет:
28.01.2005 US 60/647,841

(43) Дата публикации заявки: 20.03.2009 Бюл. № 8

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу:
10.09.2007(86) Заявка РСТ:
US 2006/002801 (27.01.2006)(87) Публикация РСТ:
WO 2006/083678 (10.08.2006)

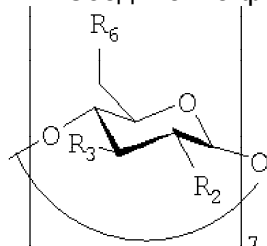
Адрес для переписки:
101000, Москва, М.Златоустинский пер., 10,
кв.15, "ЕВРОМАРКПАТ", пат.пов.
И.А.Веселицкой, рег. № 11

(71) Заявитель(и):
ПИННЕКЛ ФАРМАСЬЮТИКЛЗ, ИНК. (US)(72) Автор(ы):
ФАХМИ Ноуррендин (US),
ШМИДТМАНН Франк Уэрнер (US),
ХЕХТ Сидни (US)

(54) ПРОИЗВОДНЫЕ В-ЦИКЛОДЕКСТРИНА В КАЧЕСТВЕ АНТИБАКТЕРИАЛЬНЫХ АГЕНТОВ

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы



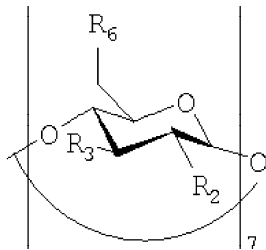
где R₂ означает H, OH, OAc, O-(низш.)алкил, O-Me или O(CH₂CH₂O)_n, R₃ означает H, OH, OAc, O-(низш.)алкил, O-Me, OSO₃Na или NH₂, и R₆ означает N, моно-, ди- или тризамещенный группами алкил, аралкил, арил, гетероциклическое кольцо или гетероциклический алкил, а любой из указанных заместителей замещен атомами N, O или S, которые также замещены атомом H, группами алкил, аралкил или арил.

2. Соединение по п. 1, в котором n равно от приблизительно 1 до приблизительно 10.

3. Соединение по п. 1, в котором в каждом из R₂, R₃ и R₆ один или более атомов углерода необязательно заменен на атом S, N или O.

4. Фармацевтическая композиция, включающая соединение по п. 1 и фармацевтически приемлемый носитель.

5. Способ подавления роста бактерий, включающий контактирование бактерий с соединением формулы



где R_2 означает H, OH, OAc, OMe, O-(низш.)алкил, или $O(CH_2CH_2O)_n$, R_3 означает H, OH, OAc, OMe, O-(низш.)алкил, OSO_3Na или NH_2 , и R_6 означает H, NH_2 , $S(CH_2)_mNH_2$, I, N_3 , SH, (низш.)алкил, S-алкилгуанидил, O-алкилгуанидил, S-аминоалкил, O-аминоалкил, аминоалкил, (низш.)O-алкил, аралкил, арил, гетероциклическое кольцо, OSO_3Na или N, моно-, ди- или тризамещенный группами алкил, аралкил, арил, гетероциклическое кольцо или гетероциклический алкил, любой из указанных заместителей замещен атомами N, O или S, которые также замещены атомом H, группами алкил, аралкил или арил.

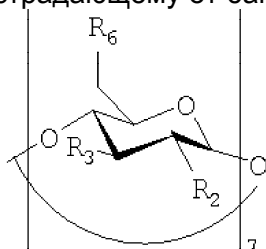
6. Способ по п. 5, в котором n равно от приблизительно 1 до приблизительно 10 и m равно от приблизительно 1 до приблизительно 10.

7. Способ по п. 5, в котором в каждом из R_2 , R_3 или R_6 любой один или более атомов углерода необязательно заменен на атом S, N или O.

8. Способ по п. 5, в котором бактерия находится в организме млекопитающего.

9. Способ по п. 7, в котором млекопитающим является человек.

10. Способ лечения бактериальной инфекции, включающий введение млекопитающему, страдающему от бактериальной инфекции, соединения формулы



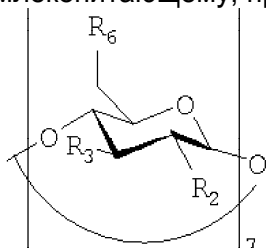
где R_2 означает H, OH, OAc, OMe, O-(низш.)алкил, или $O(CH_2CH_2O)_n$, R_3 означает H, OH, OAc, OMe, O-(низш.)алкил, OSO_3Na или NH_2 , и R_6 означает H, NH_2 , $S(CH_2)_mNH_2$, I, N_3 , SH, (низш.)алкил, S-алкилгуанидил, O-алкилгуанидил, S-аминоалкил, O-аминоалкил, аминоалкил, O-(низш.)алкил, аралкил, арил, гетероциклическое кольцо, OSO_3Na или N, моно-, ди- или тризамещенный группами алкил, аралкил, арил, гетероциклическое кольцо или гетероциклический алкил, а любой из указанных заместителей замещен атомами N, O или S, которые также замещены атомом H, группами алкил, аралкил или арил.

11. Способ по п. 10, в котором n равно от приблизительно 1 до 5 приблизительно 10 и m равно от приблизительно 1 до приблизительно 10.

12. Способ по п. 10, в котором в каждом из R_2 , R_3 или R_6 любой один или более атомов углерода необязательно заменен на атом S, N или O.

13. Способ по п. 10, в котором млекопитающим является человек.

14. Способ профилактики бактериальной инфекции, включающий введение млекопитающему, предрасположенному к бактериальной инфекции, соединения формулы



где R_2 означает H, OH, OAc, OMe, O-(низш.)алкил, или $O(CH_2CH_2O)_n$, R_3 означает H, OH, OAc, OMe, O-(низш.)алкил, OSO_3Na или NH_2 , и R_6 означает H, NH_2 , $S(CH_2)_mNH_2$, I, N_3 , SH, (низш.)алкил, S-алкилгуанидил, O-алкилгуанидил, S-аминоалкил, O-аминоалкил, аминоалкил, O-(низш.)алкил, арилалкил, арил, гетероциклическое кольцо, OSO_3Na или N, моно-, ди- или тризамещенный на алкил, аралкил, арил, гетероциклическое кольцо или гетероциклический алкил, а любой из указанных заместителей замещен атомами N, O или

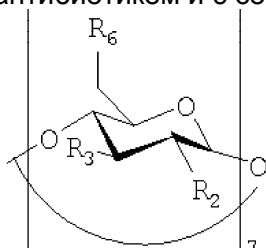
S, которые также замещены атомом H, группами алкил, аралкил или арил.

15. Способ по п. 14, в котором n равно от приблизительно 1 до приблизительно 10 и m равно от приблизительно 1 до приблизительно 10.

16. Способ по п. 14, в котором в каждом из R_2 , R_3 или R_6 любой один или более атомов углерода необязательно заменен на атом S, N или O.

17. Способ по п. 14, в котором млекопитающим является человек.

18. Способ потенцирования активности антибиотика для подавления роста бактерий, устойчивых к указанному антибиотику, включающий контактирование бактерий с указанным антибиотиком и с соединением формулы



где R_2 означает H, OH, OAc, OMe, O-(низш.)алкил, или $O(CH_2CH_2O)_n$, R_3 означает H, OH, OAc, OMe, O-(низш.)алкил, OSO_3Na или NH_2 , и R_6 означает H, NH_2 , $S(CH_2)_mNH_2$, I, N_3 , SH, (низш.)алкил, S-алкилгуанидил, O-алкилгуанидил, S-аминоалкил, O-аминоалкил, аминоалкил, O-(низш.)алкил, аралкил, арил, гетероциклическое кольцо, OSO_3Na или N, моно-, ди- или тризамещенный группой алкил, аралкил, арил, гетероциклическое кольцо или гетероциклический алкил, а любой из указанных заместителей замещен атомом N, O или S, которые также замещены атомом H, группой алкил, аралкил или арил.

19. Способ по п. 18, в котором n равно от приблизительно 1 до приблизительно 10 и m равно от приблизительно 1 до приблизительно 10.

20. Способ по п. 18, в котором в каждом из R_2 , R_3 или R_6 любой один или более атомов углерода необязательно заменен на атом S, N или O.

21. Способ по п. 18, в котором бактерия находится в организме млекопитающего.

22. Способ по п. 21, в котором млекопитающим является человек.