

【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】令和1年5月23日(2019.5.23)

【公表番号】特表2018-513194(P2018-513194A)

【公表日】平成30年5月24日(2018.5.24)

【年通号数】公開・登録公報2018-019

【出願番号】特願2017-555587(P2017-555587)

【国際特許分類】

C 07 D	307/58	(2006.01)
A 61 K	31/365	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
A 61 P	31/04	(2006.01)
A 61 K	31/66	(2006.01)
A 61 P	1/02	(2006.01)
A 61 P	1/12	(2006.01)
A 61 P	25/00	(2006.01)
A 61 P	11/00	(2006.01)
A 61 P	27/16	(2006.01)
A 61 P	27/02	(2006.01)
A 61 P	15/00	(2006.01)
C 07 F	9/653	(2006.01)
G 01 N	33/50	(2006.01)
G 01 N	33/15	(2006.01)

【F I】

C 07 D	307/58	C S P
A 61 K	31/365	
A 61 P	43/00	1 1 1
A 61 P	31/04	
A 61 K	31/66	
A 61 P	1/02	
A 61 P	1/12	
A 61 P	25/00	
A 61 P	11/00	
A 61 P	27/16	
A 61 P	27/02	
A 61 P	15/00	
C 07 F	9/653	
G 01 N	33/50	Z
G 01 N	33/15	Z

【手続補正書】

【提出日】平成31年4月11日(2019.4.11)

【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

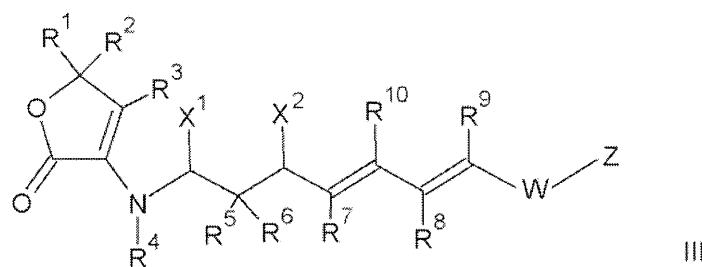
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 ( I I I ) :

【化 1】



の抗生物質化合物またはその塩もしくは立体異性体であって、式中、

R<sup>1</sup> ~ R<sup>3</sup> および R<sup>5</sup> ~ R<sup>10</sup> は、H、アルキル基、置換アルキル基、ハロゲン、OH、NH<sub>2</sub> および SH からなる群より独立に選択され、

R<sup>4</sup> は、H、アルキル基または置換アルキル基であり、

X<sup>1</sup> ~ X<sup>2</sup> は、=O、=S、NH、H、アルキル、ハロゲン、OH、SH および NH<sub>2</sub> からなる群より独立に選択され、

W は、1 ~ 15 個の炭素原子の飽和非環式炭化水素鎖であり、

Z は、窒素原子またはリン原子を含む中性または正電荷の有機基である、

抗生物質化合物またはその塩もしくは立体異性体。

【請求項 2】

2 個のみのキラル中心 S および S' R を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R<sup>4</sup> が H であり、X<sup>1</sup> ~ X<sup>2</sup> が =O または OH から独立に選択される、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

Z は、中性電荷の有機基である、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】

Z は、正電荷の有機基である、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6】

Z は、トリフェニルホスフィン基、グアニジン基、アミノペリミジン基またはアミロライド基である、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7】

グラム陰性細菌の Na<sup>+</sup> - NQR 活性を調節する、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8】

抗菌有効量の請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物と薬学的に許容可能なキャリアとを含む、医薬組成物。

【請求項 9】

グラム陰性細菌によって引き起こされる細菌性疾患の処置のための請求項 1 ~ 7 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 10】

前記細菌性疾患が、コレラ、急性胃腸炎、潰瘍、胃腸感染症、創傷感染、敗血症、食物媒介性下痢、下痢、胃腸炎、在郷軍人病、壊死性歯肉炎、成人性歯周炎、歯周炎、若年性歯周炎、髄膜炎、淋病、肺炎、心内膜炎、耳炎、軟性下疳、肺感染症、皮膜感染症、腹膜炎、外傷、パラチフス熱、腸チフス熱、ペスト、極東猩紅熱、気管支炎、トラコーマ、膿炎、若年性肺炎、急性細気管支炎、急性細気管支炎、ヒト胎児死亡、腹膜感染症、呼吸器感染症、中耳炎、眼感染症および中枢神経系感染症からなる群より選択される、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記細菌性疾患は、コレラ菌 (Vibrio cholerae)、腸炎ビブリオ菌 (

Vibrio parahaemolyticus）、ビブリオ・バルニフィカス（Vibrio vulnificus）、ビブリオ・ガストロエンテリティス（Vibrio gastroenteritis）、ビブリオ・ダムセラ（Vibrio damsela）、ビブリオ・フラビアリス（Vibrio fluvialis）、ビブリオ・フアーニッシイ（Vibrio furnissii）、ビブリオ・ハーベイ（Vibrio harveyi）、ビブリオ・ホリセ（Vibrio hollisae）、ビブリオ・コスティコラ（Vibrio costicola）、ビブリオ・ミミカス（Vibrio mimicus）、ビブリオ・シンシンナティエンシス（Vibrio cincinnatiensis）、アエロモナス・ベロニイ（Aeromonas veronii）、アエロモナス・カビアエ（Aeromonas caviae）、在郷軍人病菌（Legionella pneumophila）、トレポネーマ・デンティコラ（Treponema denticola）、ジンジバリス菌（Porphyromonas gingivalis）、タネレラ・フォーサイシア（Tannerella forsythia）、ヘモフィラス・アクチノミセテムコミタンス（Actinobacillus actinomycetemcomitans）、髄膜炎菌（Neisseria meningitidis）、淋菌（Neisseria gonorrhoeae）、ナイセリア・シッカ（Neisseria sicca）、インフルエンザ菌（Haemophilus influenzae）、軟性下疳菌（Haemophilus ducreyi）、綠膿菌（Pseudomonas aeruginosa）、シュードモナス・シュードアルカリゲネス（Pseudomonas pseudoalcaligenes）、フォトラブダス・アシンビオティカ（Photorhabdus asymbiotica）、サルモネラ菌（パラチフス菌）（Salmonella enterica (s. Paratyphi)）、サルモネラ菌（チフス菌）（Salmonella enterica (s. Typhi)）、クレブシェラ肺炎杆菌（Klebsiella pneumoniae）、ペスト菌（Yersinia pestis）、仮性結核菌（Yersinia pseudotuberculosis）、肺炎クラミジア（Chlamydophila pneumoniae）、トラコーマ病原体（Chlamydia trachomatis）、シムカニア・ネゲベンシスZ（Simkania negevensis Z）、ワドリア・コンドロフィラ（Waddlia chondrophila）、動物バストレラ症病原（Pasteurella multocida）、セラチア・プロテアマキュランス（Serratia proteamaculans）、バクテロイデス・フラギリス（Bacteroides fragilis）およびカタル球菌（Moraxella catarrhalis）からなる群より選択される細菌の感染により引き起こされる、請求項9に記載の医薬組成物。

#### 【請求項12】

前記グラム陰性細菌が、エンテロバクター目、ビブリオ目、バストレラ目、エアロモナス目、シュードモナス目、ナイセリア目からなる群より選択されるプロテオバクテリア門由來の菌種である、請求項9に記載の医薬組成物。

#### 【請求項13】

前記化合物は、哺乳動物細胞に対して非毒性の量で治療効果のある抗生物質である、請求項9～12のいずれか1項に記載の医薬組成物。

#### 【請求項14】

グラム陰性細菌によって引き起こされる細菌性疾患の処置のための医薬の製造のための、請求項1～7のいずれか1項に記載の化合物の使用。

#### 【請求項15】

前記細菌性疾患が、コレラ、急性胃腸炎、潰瘍、胃腸感染症、創傷感染、敗血症、食物媒介性下痢、下痢、胃腸炎、在郷軍人病、壞死性歯肉炎、成人性歯周炎、歯周炎、若年性歯周炎、髄膜炎、淋病、肺炎、心内膜炎、耳炎、軟性下疳、肺感染症、皮膜感染症、腹膜炎、外傷、パラチフス熱、腸チフス熱、ペスト、極東猩紅様熱、気管支炎、トラコーマ、膿炎、若年性肺炎、急性細気管支炎、急性細気管支炎、ヒト胎児死亡、腹膜感染症、呼吸

器感染症、中耳炎、眼感染症および中枢神経系感染症からなる群より選択される、請求項14に記載の使用。

【請求項16】

前記細菌性疾患が、コレラ菌 (*Vibrio cholerae*)、腸炎ビブリオ菌 (*Vibrio parahaemolyticus*)、ビブリオ・バルニフィカス (*Vibrio vulnificus*)、ビブリオ・ガストロエンテリティス (*Vibrio gastroenteritis*)、ビブリオ・ダムセラ (*Vibrio damsela*)、ビブリオ・フラビアリス (*Vibrio fluvialis*)、ビブリオ・フアーニッシイ (*Vibrio furnissii*)、ビブリオ・ハーベイ (*Vibrio harveyi*)、ビブリオ・ホリセ (*Vibrio hollisae*)、ビブリオ・コスティコラ (*Vibrio costicola*)、ビブリオ・ミミカス (*Vibrio mimicus*)、ビブリオ・シンシンナティエンシス (*Vibrio cincinnatiensis*)、アエロモナス・ベロニイ (*Aeromonas veronii*)、アエロモナス・カビアエ (*Aeromonas caviae*)、在郷軍人病菌 (*Legionella pneumophila*)、トレポネーマ・デンティコラ (*Treponema denticola*)、ジンジバリス菌 (*Porphyromonas gingivalis*)、タネレラ・フォーサイシア (*Tannerella forsythia*)、ヘモフィラス・アクチノミセテムコミタンス (*Actinobacillus actinomycetemcomitans*)、髄膜炎菌 (*Neisseria meningitidis*)、淋菌 (*Neisseria gonorrhoeae*)、ナイセリア・シッカ (*Neisseria sicca*)、インフルエンザ菌 (*Haemophilus influenzae*)、軟性下疳菌 (*Haemophilus ducreyi*)、緑膿菌 (*Pseudomonas aeruginosa*)、シュードモナス・シュードアルカリゲネス (*Pseudomonas pseudoalcaligenes*)、フォトラブダス・アシンビオティカ (*Photorhabdus asymbiotica*)、サルモネラ菌 (パラチフス菌) (*Salmonella enterica* (s. *Paratyphi*))、サルモネラ菌 (チフス菌) (*Salmonella enterica* (s. *Typhi*))、クレブシェラ肺炎杆菌 (*Klebsiella pneumonia*)、ペスト菌 (*Yersinia pestis*)、仮性結核菌 (*Yersinia pseudotuberculosis*)、肺炎クラミジア (*Chlamydophila pneumoniae*)、トラコマ病原体 (*Chlamydia trachomatis*)、シムカニア・ネゲvensis Z (*Simkania negevensis* Z)、ワドリア・コンドロフィラ (*Waddlia chondrophila*)、動物パストレラ症病原 (*Pasteurella multocida*)、セラチア・プロテアマキュランス (*Serratia proteam aculans*)、バクテロイデス・フラギリス (*Bacteroides fragilis*) およびカタル球菌 (*Moraxella catarrhalis*) からなる群より選択される細菌の感染により引き起こされる、請求項14に記載の使用。

【請求項17】

前記グラム陰性細菌が、エンテロバクター目、ビブリオ目、パストレラ目、エアロモナス目、シュードモナス目、ナイセリア目からなる群より選択されるプロテオバクテリア門由來の菌種である、請求項14に記載の使用。

【請求項18】

前記化合物は、哺乳動物細胞に対して非毒性の量で治療効果のある抗生物質である、請求項14～17のいずれか1項に記載の使用。