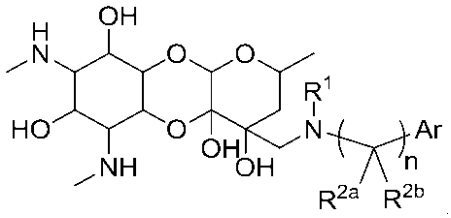
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成29年11月9日(2017.11.9)

【公表番号】特表2016-535075(P2016-535075A)
【公表日】平成28年11月10日(2016.11.10)
【年通号数】公開・登録公報2016-063
【出願番号】特願2016-545270(P2016-545270)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 493/04 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/357 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4433 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/381 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/427 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4178 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/428 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/5377 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/497 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4025 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/506 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/36 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4045 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 45/00 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 9/48 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 9/20 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 9/14 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 9/16 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 9/06 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 9/10 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 9/107 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 9/08 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 9/12 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/43 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/545 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/63 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/18 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/65 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/7056 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/496 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/7036 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 31/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/00 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/47 (2006.01)
Ａ０１Ｋ 61/13 (2017.01)
Ａ２３Ｋ 20/121 (2016.01)
Ａ２３Ｋ 20/195 (2016.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 493/04 １０６Ｚ
Ｃ０７Ｄ 493/04 ＣＳＰ

Ａ６１Ｋ	31/357		
Ａ６１Ｋ	31/4433		
Ａ６１Ｋ	31/381		
Ａ６１Ｋ	31/427		
Ａ６１Ｋ	31/4178		
Ａ６１Ｋ	31/428		
Ａ６１Ｋ	31/5377		
Ａ６１Ｋ	31/497		
Ａ６１Ｋ	31/4025		
Ａ６１Ｋ	31/506		
Ａ６１Ｋ	31/36		
Ａ６１Ｋ	31/4045		
Ａ６１Ｋ	45/00		
Ａ６１Ｋ	9/48		
Ａ６１Ｋ	9/20		
Ａ６１Ｋ	9/14		
Ａ６１Ｋ	9/16		
Ａ６１Ｋ	9/06		
Ａ６１Ｋ	9/10		
Ａ６１Ｋ	9/107		
Ａ６１Ｋ	9/08		
Ａ６１Ｋ	9/12		
Ａ６１Ｋ	31/43		
Ａ６１Ｋ	31/545		
Ａ６１Ｋ	31/63		
Ａ６１Ｋ	31/18		
Ａ６１Ｋ	31/65		
Ａ６１Ｋ	31/7056		
Ａ６１Ｋ	31/496		
Ａ６１Ｋ	31/7036		
Ａ６１Ｐ	31/04		
Ａ６１Ｐ	43/00	１２１	
Ａ６１Ｐ	17/00	１０１	
Ａ６１Ｐ	31/04	１７１	
Ａ６１Ｋ	31/47		
Ａ０１Ｋ	61/00		Ｂ
Ａ２３Ｋ	20/121		
Ａ２３Ｋ	20/195		

【手続補正書】
【提出日】平成29年9月27日(2017.9.27)
【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：

【化１】



（式中、ｎは、１、２、及び３から選択される整数であり；
Ｒ^{1}は、水素及びＣ１～Ｃ４アルキルから選択され；
Ｒ^{2a}及びＲ^{2b}の各存在は、存在するとき、水素及びＣ１～Ｃ３アルキルから独立して選択され；及び
Ａｒは、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、－ＮＨ$_{2}$、Ｃ１～Ｃ３アルキル、Ｃ１～Ｃ３モノアルキル、Ｃ１～Ｃ３ポリハロアルキル、Ｃ１～Ｃ３アルコキシ、Ｃ１～Ｃ３モノハロアルコキシ、Ｃ１～Ｃ３ポリハロアルコキシ、－（Ｃ＝Ｏ）ＯＲ^{9}、－（Ｃ＝Ｏ）ＮＲ^{10a}Ｒ^{10b}、－ＳＯ$_{2}$ＮＲ^{10a}Ｒ^{10b}、－ＳＲ^{9}、及び－ＳＯ$_{2}$Ｒ^{9}から独立して選択される０～３個の基により置換されているアリールまたはヘテロアリールであり；
Ｒ^{9}の各存在は、存在するとき、水素及びＣ１～Ｃ３アルキルから選択され；
Ｒ^{10a}及びＲ^{10b}の各存在は、存在するとき、水素及びＣ１～Ｃ３アルキルから独立して選択される）
により表される構造を有する化合物またはその薬剤的に許容可能な塩。
【請求項２】
Ｒ^{1}が、水素及びメチルから選択される、請求項１記載の化合物。
【請求項３】
Ｒ^{2a}及びＲ^{2b}の各存在が、水素である、請求項１記載の化合物。
【請求項４】
Ａｒが、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、－ＮＨ$_{2}$、Ｃ１～Ｃ３アルキル、Ｃ１～Ｃ３モノアルキル、Ｃ１～Ｃ３ポリハロアルキル、Ｃ１～Ｃ３アルコキシ、Ｃ１～Ｃ３モノハロアルコキシ、Ｃ１～Ｃ３ポリハロアルコキシ、－（Ｃ＝Ｏ）ＯＲ^{9}、－（Ｃ＝Ｏ）ＮＲ^{10a}Ｒ^{10b}、－ＳＯ$_{2}$ＮＲ^{10a}Ｒ^{10b}、－ＳＲ^{9}、及び－ＳＯ$_{2}$Ｒ^{9}から独立して選択される０～３個の基により置換されているフェニルである、請求項１記載の化合物。
【請求項５】
Ａｒが、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、シアノ、ヒドロキシル、－ＮＨ$_{2}$、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、－ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＦ$_{3}$、－ＣＨ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＨＣｌ$_{2}$、－ＣＣｌ$_{3}$、－ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＣＨ$_{2}$ＣＨＦ$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$ＣＦ$_{3}$、－ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{2}$Ｃｌ、－ＣＨ$_{2}$ＣＨＣｌ$_{2}$、－ＣＨ$_{2}$ＣＣｌ$_{3}$、－ＯＣＨ$_{3}$、－ＯＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－ＯＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＯＣＨＦ$_{2}$、－ＯＣＦ$_{3}$、－ＯＣＨ$_{2}$Ｃｌ、－ＯＣＨＣｌ$_{2}$、－ＯＣＣｌ$_{3}$、－ＯＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{2}$Ｆ、－ＯＣＨ$_{2}$ＣＨＦ$_{2}$、－ＯＣＨ$_{2}$ＣＦ$_{3}$、－ＯＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{2}$Ｃｌ、－ＯＣＨ$_{2}$ＣＨＣｌ$_{2}$、－（Ｃ＝Ｏ）ＯＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－（Ｃ＝Ｏ）ＯＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－（Ｃ＝Ｏ）ＯＣＨ$_{3}$、－（Ｃ＝Ｏ）ＯＨ、－（Ｃ＝Ｏ）ＮＨＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－（Ｃ＝Ｏ）ＮＨＣＨ$_{3}$、－（Ｃ＝Ｏ）ＮＨ$_{2}$、－ＳＯ$_{2}$Ｎ（ＣＨ$_{3}$）$_{2}$、－ＳＯ$_{2}$ＮＨＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{3}$、－ＳＯ$_{2}$ＮＨＣＨ$_{3}$、及び－ＳＯ$_{2}$ＮＨ$_{2}$から独立して選択される０～３個の基により置換されているフェニルである、請求項４記載の化合物。
【請求項６】
Ａｒが、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、－ＮＨ$_{2}$、Ｃ１～Ｃ３アルキル、Ｃ１～Ｃ３モノアルキル、Ｃ１～Ｃ３ポリハロアルキル、Ｃ１～Ｃ３アルコキシ、Ｃ１～Ｃ３モノハロアルコキシ、Ｃ１～Ｃ３ポリハロアルコキシ、－（Ｃ＝Ｏ）ＯＲ^{9}、－（Ｃ＝Ｏ）ＮＲ^{10a}Ｒ^{10b}、－ＳＯ$_{2}$ＮＲ^{10a}Ｒ^{10b}、－ＳＲ^{9}、及び－ＳＯ$_{2}$Ｒ^{9}から独立して選択される０～３個の基により置換されているヘテロアリールである、請求項１記載の化合物。
【請求項７】

Ａｒが、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、シアノ、ヒドロキシル、－NH_2、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、－CH_2F、－CHF_2、－CF_3、－CH_2Cl、－$CHCl_2$、－CCl_3、－CH_2CH_2F、－CH_2CHF_2、－CH_2CF_3、－CH_2CH_2Cl、－CH_2CHCl_2、－CH_2CCl_3、－OCH_3、－OCH_2CH_3、－OCH_2F、－$OCHF_2$、－OCF_3、－OCH_2Cl、－$OCHCl_2$、－$OCCl_3$、－OCH_2CH_2F、－OCH_2CHF_2、－OCH_2CF_3、－OCH_2CH_2Cl、－OCH_2CHCl_2、－（Ｃ＝Ｏ）OCH_2CH_3、－（Ｃ＝Ｏ）OCH_2CH_3、－（Ｃ＝Ｏ）OCH_3、－（Ｃ＝Ｏ）ＯＨ、－（Ｃ＝Ｏ）$NHCH_2CH_3$、－（Ｃ＝Ｏ）$NHCH_3$、－（Ｃ＝Ｏ）NH_2、－$SO_2N(CH_3)_2$、－$SO_2NHCH_2CH_3$、－SO_2NHCH_3、及び－SO_2NH_2から独立して選択される０～３個の基により置換されているヘテロアリールである、請求項６記載の化合物。

【請求項８】

Ａｒが、フェニル、ピリジニル、ピリダジニル、フラニル、チオフェニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピロリル、ベンゾ［ｄ］チアゾリル、ベンゾ［ｄ］オキサゾリル、オキサゾロ［４，５－ｃ］ピリジニル、キノリニル、及び１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾリルであり；及びＡｒが、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、－NH_2、Ｃ１～Ｃ３アルキル、Ｃ１～Ｃ３モノアルキル、Ｃ１～Ｃ３ポリハロアルキル、Ｃ１～Ｃ３アルコキシ、Ｃ１～Ｃ３モノハロアルコキシ、Ｃ１～Ｃ３ポリハロアルコキシ、－（Ｃ＝Ｏ）OR^9、－（Ｃ＝Ｏ）$NR^{10a}R^{10b}$、－$SO_2NR^{10a}R^{10b}$、－SR^9、及び－SO_2R^9から独立して選択される０～３個の基により置換されている、請求項１記載の化合物。

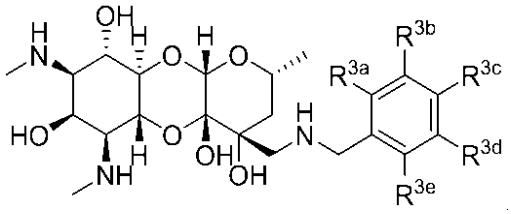
【請求項９】

Ａｒが、フェニル、ピリジニル、ピリダジニル、フラニル、チオフェニル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピロリル、ベンゾ［ｄ］チアゾリル、ベンゾ［ｄ］オキサゾリル、オキサゾロ［４，５－ｃ］ピリジニル、キノリニル、及び１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾリルであり；及びＡｒが、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、シアノ、ヒドロキシル、－NH_2、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、－CH_2F、－CHF_2、－CF_3、－CH_2Cl、－$CHCl_2$、－CCl_3、－CH_2CH_2F、－CH_2CHF_2、－CH_2CF_3、－CH_2CH_2Cl、－CH_2CHCl_2、－CH_2CCl_3、－OCH_3、－OCH_2CH_3、－OCH_2F、－$OCHF_2$、－OCF_3、－OCH_2Cl、－$OCHCl_2$、－$OCCl_3$、－OCH_2CH_2F、－OCH_2CHF_2、－OCH_2CF_3、－OCH_2CH_2Cl、－OCH_2CHCl_2、－（Ｃ＝Ｏ）OCH_2CH_3、－（Ｃ＝Ｏ）OCH_2CH_3、－（Ｃ＝Ｏ）OCH_3、－（Ｃ＝Ｏ）ＯＨ、－（Ｃ＝Ｏ）$NHCH_2CH_3$、－（Ｃ＝Ｏ）$NHCH_3$、－（Ｃ＝Ｏ）NH_2、－$SO_2N(CH_3)_2$、－$SO_2NHCH_2CH_3$、－SO_2NHCH_3、及び－SO_2NH_2から独立して選択される０～３個の基により置換されている、請求項８記載の化合物。

【請求項１０】

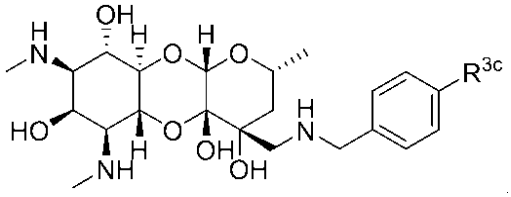
式：

【化２】

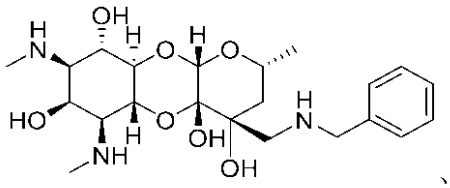


（式中、R^{3a}、R^{3b}、R^{3c}、R^{3d}、及びR^{3e}の各々は、水素、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、－NH_2、Ｃ１～Ｃ３アルキル、Ｃ１～Ｃ３モノアルキル、Ｃ１～Ｃ３ポリハロアルキル、Ｃ１～Ｃ３アルコキシ、Ｃ１～Ｃ３モノハロアルコキシ、Ｃ１～Ｃ３ポリハロアルコキシ、－（Ｃ＝Ｏ）OR^9、－（Ｃ＝Ｏ）$NR^{10a}R^{10b}$、－$SO_2NR^{10a}R^{10b}$、－SR^9、及び－SO_2R^9から独立して選択され、但し、R^{3a}

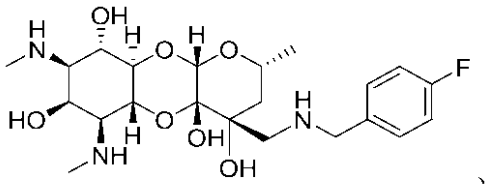
、R^{3b}、R^{3c}、R^{3d}、及びR^{3e}の少なくとも２つは、水素である）
により表される構造を有する、請求項１記載の化合物。
【請求項１１】
R^{3a}、R^{3b}、R^{3c}、R^{3d}、及びR^{3e}の各々が、水素、－Ｆ、－Ｃｌ、－Ｂｒ、シアノ、ヒドロキシル、$-NH_2$、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、$-CH_2F$、$-CHF_2$、$-CF_3$、$-CH_2Cl$、$-CHCl_2$、$-CCl_3$、$-CH_2CH_2F$、$-CH_2CHF_2$、$-CH_2CF_3$、$-CH_2CH_2Cl$、$-CH_2CHCl_2$、$-CH_2CCl_3$、$-OCH_3$、$-OCH_2CH_3$、$-OCH_2F$、$-OCHF_2$、$-OCF_3$、$-OCH_2Cl$、$-OCHCl_2$、$-OCCl_3$、$-OCH_2CH_2F$、$-OCH_2CHF_2$、$-OCH_2CF_3$、$-OCH_2CH_2Cl$、$-OCH_2CHCl_2$、$-(C=O)OCH_2CH_3$、$-(C=O)OCH_2CH_3$、$-(C=O)OCH_3$、$-(C=O)OH$、$-(C=O)NHCH_2CH_3$、$-(C=O)NHCH_3$、$-(C=O)NH_2$、$-SO_2N(CH_3)_2$、$-SO_2NHCH_2CH_3$、$-SO_2NHCH_3$、及び$-SO_2NH_2$から独立して選択され、但し、R^{3a}、R^{3b}、R^{3c}、R^{3d}、及びR^{3e}の少なくとも２つは、水素である、請求項１０記載の化合物。
【請求項１２】
式：
【化３】



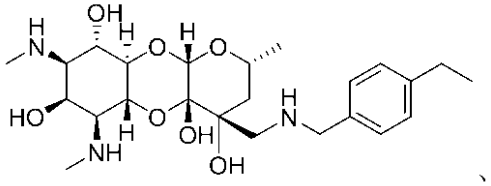
（式中、R^{3c}は、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、$-NH_2$、Ｃ１～Ｃ３アルキル、Ｃ１～Ｃ３モノアルキル、Ｃ１～Ｃ３ポリハロアルキル、Ｃ１～Ｃ３アルコキシ、Ｃ１～Ｃ３モノハロアルコキシ、Ｃ１～Ｃ３ポリハロアルコキシ、$-(C=O)OR^9$、$-(C=O)NR^{10a}R^{10b}$、$-SO_2NR^{10a}R^{10b}$、$-SR^9$、及び$-SO_2R^9$から選択される）
により表される構造を有する、請求項１記載の化合物。
【請求項１３】
【化４－１】



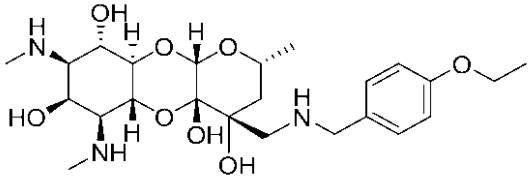
、



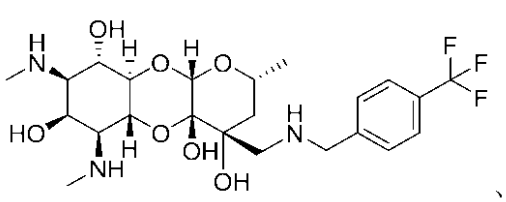
、



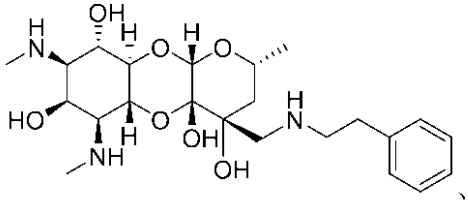
、



、

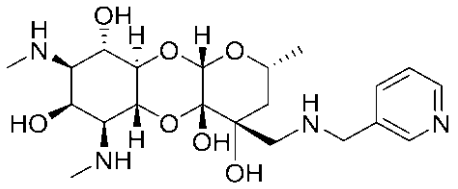


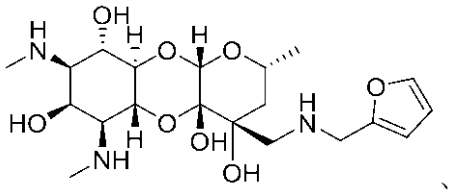
、

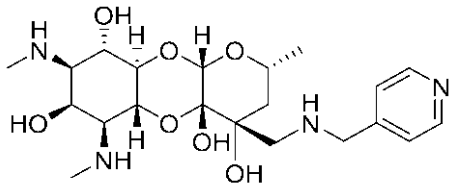


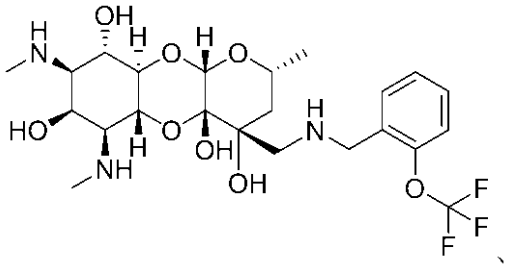
、

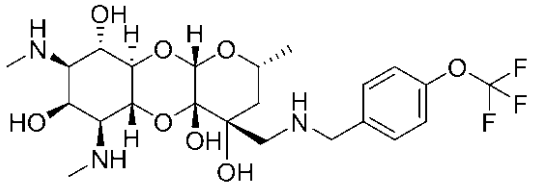
【化４－２】

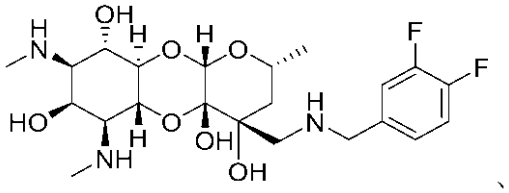


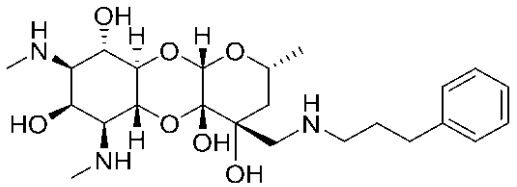


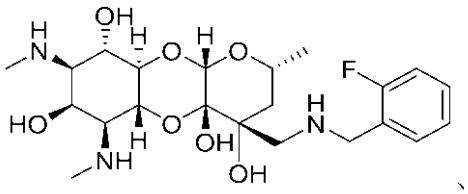


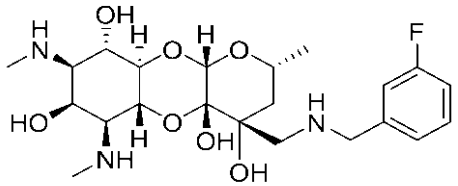


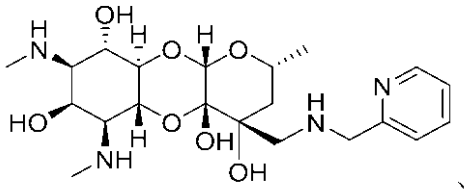


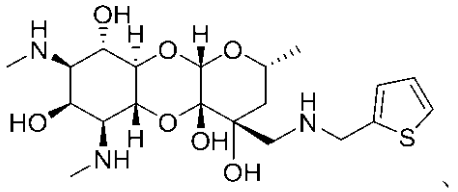


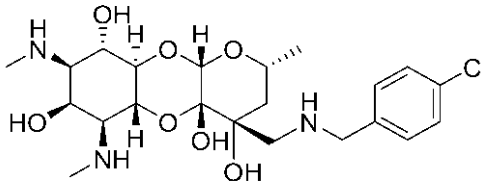


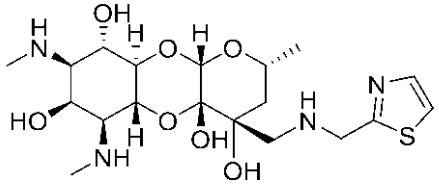


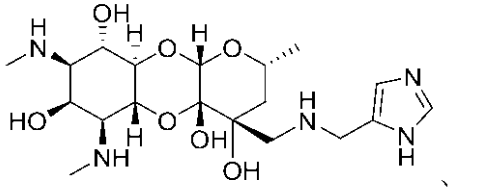


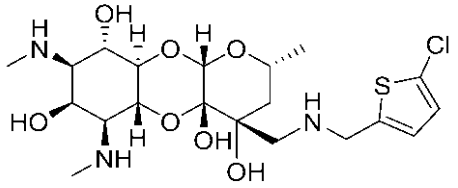


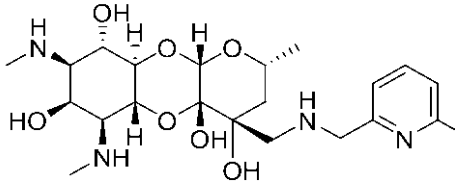




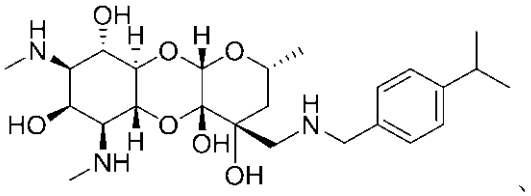


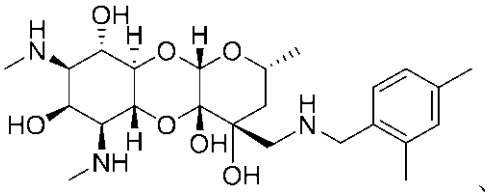


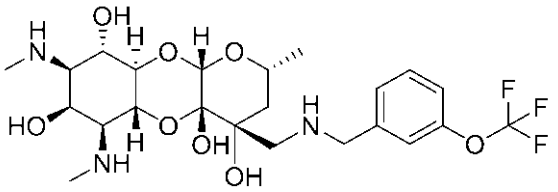


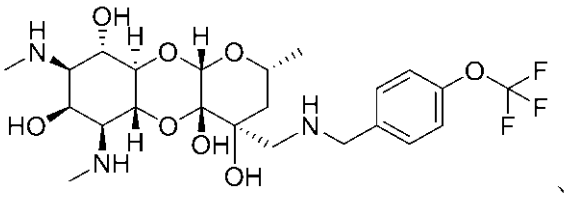


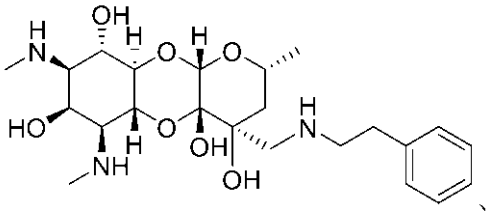
【化４－３】

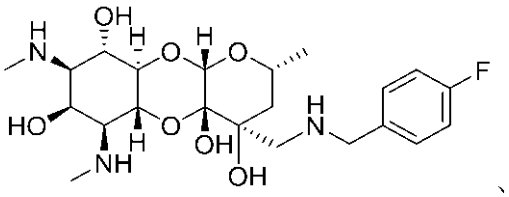

、

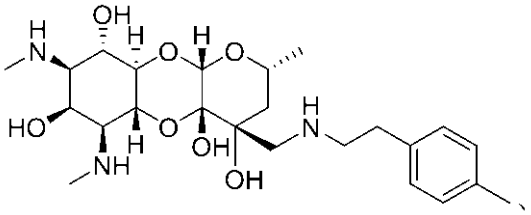

、

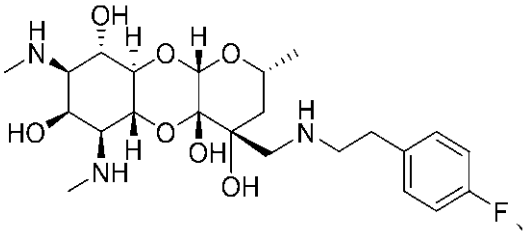

、

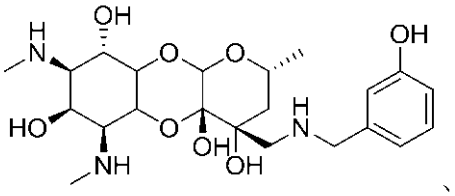

、

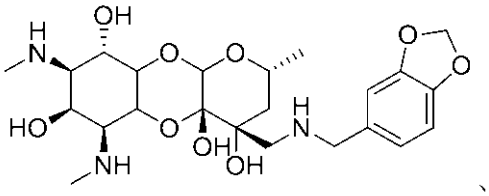

、

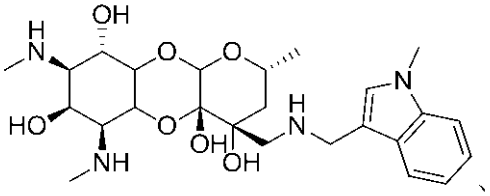

、


、

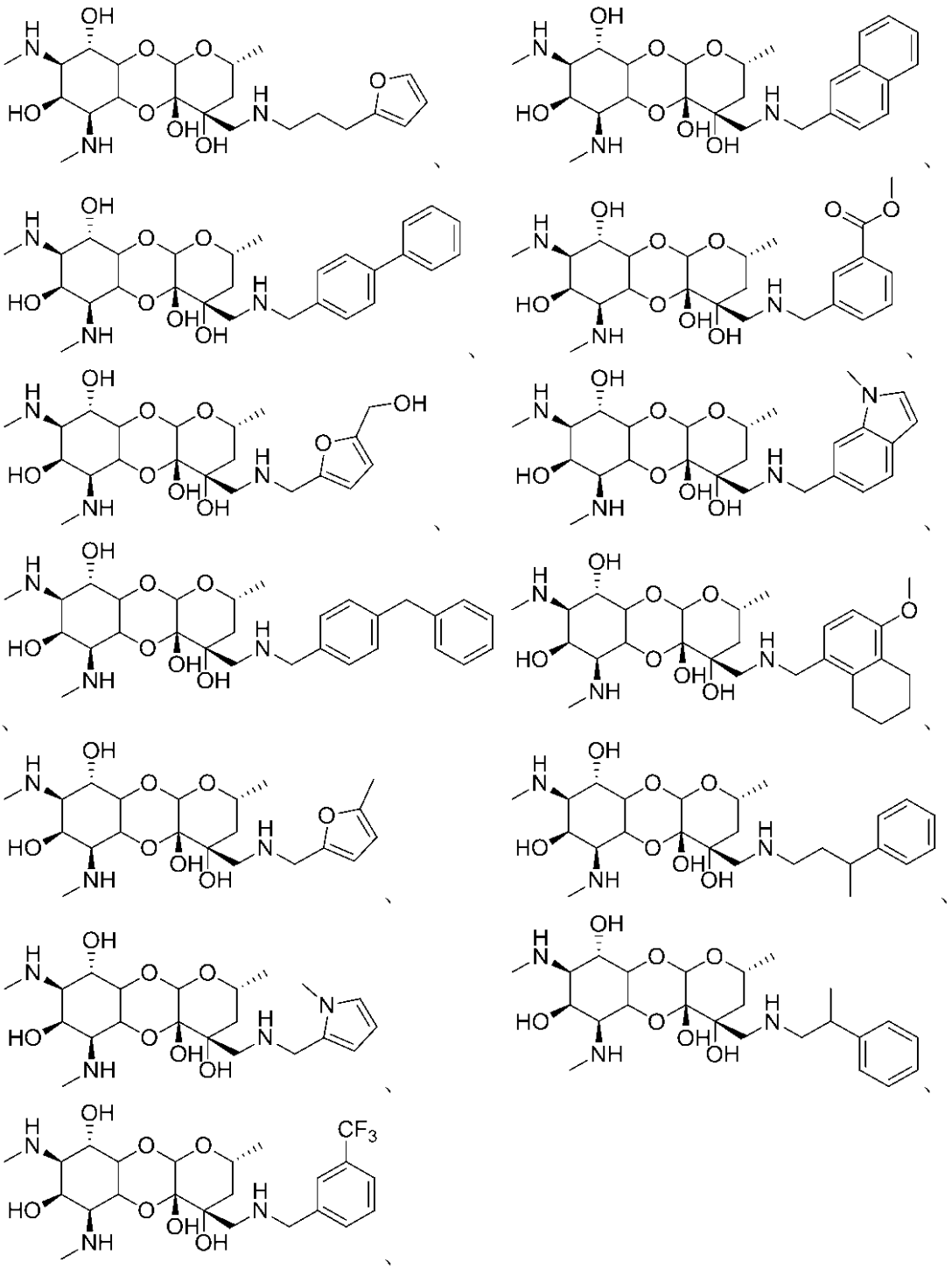

、または


、


、


、

【化４－４】



またはそのサブグループ（subgroup）である、請求項１記載の化合物。

【請求項１４】

医薬組成物であって、請求項１記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩、及び薬剤的に許容可能な担体を含む前記医薬組成物。

【請求項１５】

前記医薬組成物が、カプセル剤、錠剤、丸剤、散剤、顆粒剤、発泡顆粒剤、ゲル剤、ペースト剤、トローチ剤、及びパステル剤（pastille）から選択される固体剤形である、請求項１４記載の医薬組成物。

【請求項１６】

前記医薬組成物が、乳剤、液剤、懸濁剤、シロップ剤、及びエリキシル剤から選択され

る液体剤形である、請求項１４記載の医薬組成物。
【請求項１７】
第２の活性薬をさらに含む、請求項１４記載の医薬組成物。
【請求項１８】
前記第２の活性薬が、抗菌薬である、請求項１７記載の医薬組成物。
【請求項１９】
ヒト対象の細菌感染症の治療方法であって、請求項１記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩の治療効果量を、前記ヒト対象に投与する工程を含む、前記ヒト対象の細菌感染症の治療方法。
【請求項２０】
前記化合物が、ローション剤、クリーム剤、軟膏剤、スプレー剤、または石鹸として製剤される、請求項１９記載の方法。
【請求項２１】
前記化合物が、固体剤形として製剤される、請求項１９記載の方法。
【請求項２２】
前記化合物が、液体剤形として製剤される、請求項１９記載の方法。
【請求項２３】
前記液体剤形が、静脈内投与用に製剤される、請求項２２記載の方法。
【請求項２４】
前記細菌感染症が、グラム陽性細菌感染症と関連する、請求項１９記載の方法。
【請求項２５】
前記グラム陽性細菌が、バチルス属（Bacillus sp.）、クロストリジウム属（Clostridium sp.）、エンテロコッカス属（Enterococcus sp.）、コリネバクテリウム属（Corynebacterium sp.）、及びスタフィロコッカス属（Staphylococcus sp.）、ストレプトコッカス属（Streptococcus sp.）から選択される、請求項２４記載の方法。
【請求項２６】
前記細菌感染症が、グラム陰性細菌感染症に関連する、請求項１９記載の方法。
【請求項２７】
前記グラム陰性細菌が、アシネトバクター属（Acinetobacter sp.）、アエロモナス属（Aeromonas sp.）、バークホルデリア属（Burkholderia sp.）、ボルデテラ属（Bordatella sp.）、シトロバクター属（Citrobacter sp.）、エンテロバクター属（Enterobacter sp.）、エシェリキア属（Escherichia sp.）、フランシセラ属（Francisella sp.）、ヘモフィルス属（Haemophilus sp.）、クレブシエラ属（Klebsiella sp.）、レジオネラ属（Legionella sp.）、モラクセラ属（Moraxella sp.）、ナイセリア属（Neisseria sp.）、プロテウス属（Proteus sp.）、シュードモナス属（Pseudomonas sp.）、サルモネラ属（Salmonella sp.）、シゲラ属（Shigella sp.）、ステノトロフォモナス属（Stenotrophomonas sp.）、ビブリオ属（Vibrio sp.）、及びエルシニア属（Yersinia sp.）から選択される、請求項２６記載の方法。
【請求項２８】
第２の活性薬の治療効果量を、前記ヒト対象に投与することをさらに含む、請求項１９記載の方法。
【請求項２９】
前記第２の活性薬が、少なくとも１つの抗菌薬を含む、請求項２８記載の方法。
【請求項３０】
脊椎動物の細菌感染症の治療方法であって、請求項１記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩の治療効果量を、前記脊椎動物に投与する工程を含む、前記脊椎動物の細菌感染症の治療方法。
【請求項３１】
バイオディフェンス病原体への暴露に関連するヒト対象の治療方法であって、請求項１記載の化合物、またはその薬剤的に許容可能な塩の効果量を、前記ヒト対象に投与する工

程を含む、前記方法。