

【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 5 年 11 月 24 日 (2023.11.24)

【公開番号】特開 2023-159197 (P2023-159197A)

【公開日】令和 5 年 10 月 31 日 (2023.10.31)

【年通号数】公開公報 (特許) 2023-205

【出願番号】特願 2023-129305 (P2023-129305)

【国際特許分類】

C 07 F 5/02 (2006.01)

10

A 61 P 31/04 (2006.01)

A 61 P 31/10 (2006.01)

A 61 P 31/12 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 37/08 (2006.01)

A 61 K 31/69 (2006.01)

A 61 K 45/00 (2006.01)

A 61 K 31/427 (2006.01)

A 61 K 31/4439 (2006.01)

【F I】

20

C 07 F 5/02 C

A 61 P 31/04

A 61 P 31/10

A 61 P 31/12

A 61 P 29/00

A 61 P 37/08

A 61 K 31/69

A 61 K 45/00

A 61 K 31/427

A 61 K 31/4439

30

【手続補正書】

【提出日】令和 5 年 11 月 15 日 (2023.11.15)

【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】

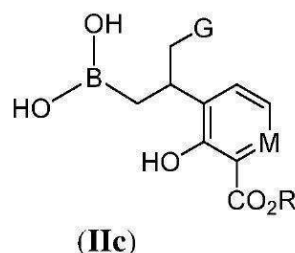
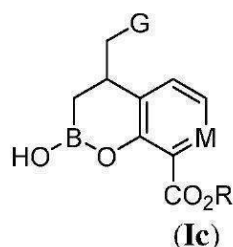
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

40

式 (I c) もしくは式 (I I c) :

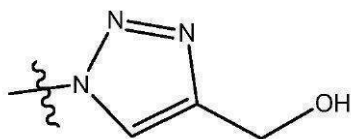
【化 49】



または薬学的に許容されるその塩の構造を有する化合物であって、式中、

Gは、 $-OH$ 、 $-OMe$ 、 $-OBn$ 、 $-CH_2OH$ 、 $N_3$ 、 $NH_2$ 、 $-NHC(=O)H$ 、 $-NHC(=O)CH_3$  および

【化50】



からなる群から選択され、

10

Mは、 $CR^7$  および N からなる群から選択され、

$R^7$  は、 $-H$ 、 $-OR^8$  およびハロゲンからなる群から選択され、

$R^8$  は、必要に応じて置換されている  $C_{1-4}$  アルキルであり、

R は  $-H$  である、

化合物。

【請求項2】

Gが $-OH$ である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

Mが、 $-CH$ 、 $-COMe$ 、 $CF$  および N からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物。

20

【請求項4】

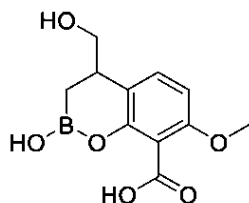
Mが $-COMe$ である、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

$R^8$  が  $C_{1-4}$  アルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

【化51】

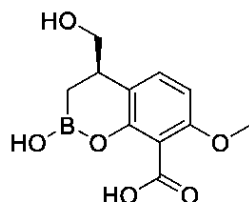


30

または薬学的に許容されるその塩の構造を有する、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

【化52】

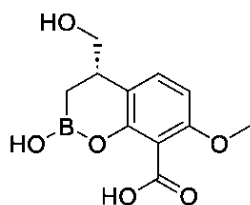


40

または薬学的に許容されるその塩の構造を有する、請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

【化 5 3】

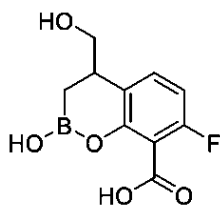


または薬学的に許容されるその塩の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

10

【化 5 4】

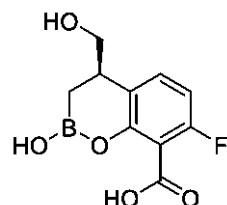


または薬学的に許容されるその塩の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

20

【化 5 5】

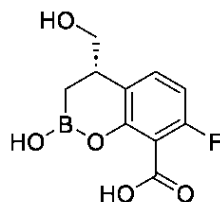


または薬学的に許容されるその塩の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

30

【化 5 6】



または薬学的に許容されるその塩の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 12】

40

治療有効量の請求項 1 から 11 のいずれか一項に記載の化合物および薬学的に許容される賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項 13】

追加の医薬をさらに含む、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 14】

前記追加の医薬が、抗細菌剤、抗真菌剤、抗ウイルス剤、抗炎症剤および抗アレルギー剤からなる群から選択される、請求項 13 に記載の組成物。

【請求項 15】

前記追加の医薬が - ラクタム抗細菌剤である、請求項 14 に記載の組成物。

【請求項 16】

50

前記 - ラクタム抗細菌剤が、アモキシシリン、アンピシリン（ピバンピシリン、ヘタシリン、バカンピシリン、メタムピシリン、タランピシリン）、エピシリン、カルベニシリン（カリンダシリン）、チカルシリン、テモシリン、アズロシリン、ピペラシリン、メズロシリン、メシリナム（ピブメシリナム）、スルベニシリン、ベンジルベニシリン（G）、クロメトシリン、ベンザチンベンジルベニシリン、プロカインベンジルベニシリン、アジドシリン、ペナメシリン、フェノキシメチルベニシリン（V）、プロピシリン、ベンザチンフェノキシメチルベニシリン、フェネチシリン、クロキサシリン（ジクロキサシリン、フルクロキサシリン）、オキサシリン、メチシリン、ナフシリン、ファロペネム、トモペネム、ラズペネム、セファゾリン、セファセトリル、セファドロキシル、セファレキシン、セファログリシン、セファロニウム、セファロリジン、セファロチン、セファピリン、セファトリジン、セファゼドン、セファザフル、セフラジン、セフロキサジン、セフテゾール、セファクロル、セファマンドール、セフミノクス、セフォニシド、セフォラニド、セフォチアム、セフプロジル、セフブペラゾン、セフロキシム、セフゾナム、セホキシチン、セフォテタン、セフメタゾール、ロラカルベフ、セフィキシム、セフトリアキソン、セフカペン、セフダロキシム、セフジニル、セフジトレン、セフェタメト、セフメノキシム、セフォジジム、セフォペラゾン、セフォタキシム、セフピミゾール、セフピラミド、セフボドキシム、セフスロジン、セフテラム、セフチブテン、セフチオレン、セフチゾキシム、フロモキセフ、ラタモキセフ、セフェピム、セフォゾプラン、セフピロム、セフキノム、セフトピプロール、セフタロリン、C X A - 1 0 1、R W J - 5 4 4 2 8、M C - 0 4、5 4 6、M E 1 0 3 6、セフティオフル、セフキノム、セフォベシン、R W J - 4 4 2 8 3 1、R W J - 3 3 3 4 4 1 および R W J - 3 3 3 4 4 2 からなる群から選択される、請求項 1 5 に記載の組成物。

10

20

【請求項 1 7】

前記 - ラクタム抗細菌剤が、セフタジジム、ピアペネム、ドリペネム、エルタペネム、イミペネム、メロペネム、テビペネム、テビペネムピボキシル、アパペネムおよびパニペネムからなる群から選択される、請求項 1 5 に記載の組成物。

【請求項 1 8】

前記 - ラクタム抗細菌剤が、アズトレオナム、チゲモナム、B A L 3 0 0 7 2、S Y N 2 4 1 6 またはカルモナムから選択される、請求項 1 5 に記載の組成物。

【請求項 1 9】

細菌感染を処置する方法における使用のための組成物であって、請求項 1 から 1 1 のいずれか一項に記載の化合物を含む、組成物。

30

【請求項 2 0】

前記組成物が、追加の医薬と組み合わせて投与されることを特徴とする、請求項 1 9 に記載の組成物。

【請求項 2 1】

前記追加の医薬が、抗細菌剤、抗真菌剤、抗ウイルス剤、抗炎症剤および抗アレルギー剤からなる群から選択される、請求項 2 0 に記載の組成物。

【請求項 2 2】

前記追加の医薬が - ラクタム抗細菌剤である、請求項 2 1 に記載の組成物。

40

【請求項 2 3】

前記 - ラクタム抗細菌剤が、アモキシシリン、アンピシリン（ピバンピシリン、ヘタシリン、バカンピシリン、メタムピシリン、タランピシリン）、エピシリン、カルベニシリン（カリンダシリン）、チカルシリン、テモシリン、アズロシリン、ピペラシリン、メズロシリン、メシリナム（ピブメシリナム）、スルベニシリン、ベンジルベニシリン（G）、クロメトシリン、ベンザチンベンジルベニシリン、プロカインベンジルベニシリン、アジドシリン、ペナメシリン、フェノキシメチルベニシリン（V）、プロピシリン、ベンザチンフェノキシメチルベニシリン、フェネチシリン、クロキサシリン（ジクロキサシリン、フルクロキサシリン）、オキサシリン、メチシリン、ナフシリン、ファロペネム、トモペネム、ラズペネム、セファゾリン、セファセトリル、セファドロキシル、セファレキ

50

シン、セファログリシン、セファロニウム、セファロリジン、セファロチン、セファピリン、セファトリジン、セファゼドン、セファザフル、セフラジン、セフロキサジン、セフテゾール、セファクロル、セファマンドール、セフミノクス、セフォニシド、セフォラニド、セフォチアム、セフプロジル、セフペラゾン、セフロキシム、セフゾナム、セホキシチン、セフォテタン、セフメタゾール、ロラカルベフ、セフィキシム、セフトリアキソン、セフカペン、セフダロキシム、セフジニル、セフジトレン、セフェタメト、セフメノキシム、セフォジジム、セフォペラゾン、セフォタキシム、セフピミゾール、セフピラミド、セフボドキシム、セフスロジン、セフテラム、セフチブテン、セフチオレン、セフチゾキシム、フロモキセフ、ラタモキセフ、セフェピム、セフォゾプラン、セフピロム、セフキノム、セフトビプロール、セフタロリン、CXA-101、RWJ-54428、MC-04、546、ME1036、セフティオフル、セフキノム、セフォベシン、RWJ-442831、RWJ-333441およびRWJ-333442からなる群から選択される、請求項22に記載の組成物。

10

【請求項24】

前記 - ラクタム抗細菌剤が、セフトジジム、ピアペナム、ドリペナム、エルタペナム、イミペナム、メロペナム、テビペナム、テビペナムピボキシル、アパペナムおよびパニペナムからなる群から選択される、請求項22に記載の組成物。

【請求項25】

前記 - ラクタム抗細菌剤が、アズトレオナム、チゲモナム、BAL30072、SYN2416およびカルモナムからなる群から選択される、請求項22に記載の組成物。

20

【請求項26】

前記感染が、*Pseudomonas acidovorans*、*Pseudomonas alcaligenes*、*Pseudomonas putida*、*Burkholderia cepacia*、*Aeromonas hydrophilia*、*Francisella tularensis*、*Morganelia morgani*、*Proteus mirabilis*、*Proteus vulgaris*、*Providencia alcalifaciens*、*Providencia rettgeri*、*Providencia stuartii*、*Acinetobacter baumannii*、*Bordetella pertussis*、*Bordetella parapertussis*、*Bordetella bronchiseptica*、*Haemophilus ducreyi*、*Pasteurella multocida*、*Pasteurella haemolytica*、*Branhamella catarrhalis*、*Borrelia burgdorferi*、*Kingella*、*Gardnerella vaginalis*、*Bacteroides distasonis*、*Bacteroides 3452A* homology group、*Clostridium difficile*、*Mycobacterium tuberculosis*、*Mycobacterium avium*、*Mycobacterium intracellulare*、*Mycobacterium leprae*、*Corynebacterium diphtheriae*、*Corynebacterium ulcerans*、*Streptococcus pneumoniae*、*Streptococcus agalactiae*、*Streptococcus pyogenes*、*Enterococcus faecalis*、*Enterococcus faecium*、*Staphylococcus aureus*、*Staphylococcus epidermidis*、*Staphylococcus saprophyticus*、*Staphylococcus intermedius*、*Staphylococcus hyicus* subsp. *hyicus*、*Staphylococcus haemolyticus*、*Staphylococcus hominis*および*Staphylococcus saccharolyticus*からなる群から選択される細菌を含む、請求項19に記載の組成物。

30

40

【請求項27】

50

前記感染が、*Pseudomonas aeruginosa*、*Pseudomonas fluorescens*、*Stenotrophomonas maltophilia*、*Escherichia coli*、*Citrobacter freundii*、*Salmonella typhimurium*、*Salmonella typhi*、*Salmonella paratyphi*、*Salmonella enteritidis*、*Shigella dysenteriae*、*Shigella flexneri*、*Shigella sonnei*、*Enterobacter cloacae*、*Enterobacter aerogenes*、*Klebsiella pneumoniae*、*Klebsiella oxytoca*、*Serratia marcescens*、*Acinetobacter calcoaceticus*、*Acinetobacter haemolyticus*、*Yersinia enterocolitica*、*Yersinia pestis*、*Yersinia pseudotuberculosis*、*Yersinia intermedia*、*Haemophilus influenzae*、*Haemophilus parainfluenzae*、*Haemophilus haemolyticus*、*Haemophilus parahaemolyticus*、*Helicobacter pylori*、*Campylobacter fetus*、*Campylobacter jejuni*、*Campylobacter coli*、*Vibrio cholerae*、*Vibrio parahaemolyticus*、*Legionella pneumophila*、*Listeria monocytogenes*、*Neisseria gonorrhoeae*、*Neisseria meningitidis*、*Moraxella*、*Bacteroides fragilis*、*Bacteroides vulgatus*、*Bacteroides ovalus*、*Bacteroides thetaiotaomicron*、*Bacteroides uniformis*、*Bacteroides eggerthii*および*Bacteroides splanchnicus*からなる群から選択される細菌を含む、請求項19に記載の組成物。

10

20

30

40

50