



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21), (22) Заявка: 2004137055/04, 17.12.2004

(30) Конвенционный приоритет:
09.02.2000 JP 2000-38099

(43) Дата публикации заявки: 27.05.2006 Бюл. № 15

(62) Номер и дата подачи первоначальной заявки, из
которой данная заявка выделена: 2002121245
08.08.2002

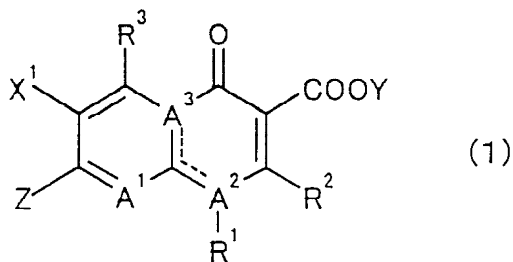
Адрес для переписки:
129010, Москва, ул. Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры", пат.пов. Е.Е.Назиной

(71) Заявитель(и):
ДАЙТИ ФАРМАСЬЮТИКАЛ КО., ЛТД. (JP)(72) Автор(ы):
ТАКЕМУРА Макото (JP),
ТАКАХАСИ Хисаси (JP),
КАВАКАМИ Кацухиро (JP),
НАМБА Кендзи (JP),
ТАНАКА Маюми (JP),
МИЯУТИ Рие (JP)(74) Патентный поверенный:
НАЗИНА ЕЛЕНА ЕВГЕНЬЕВНА

(54) СРЕДСТВО ПРОТИВ КИСЛОУСТОЙЧИВЫХ БАКТЕРИЙ, СОДЕРЖАЩЕЕ
ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИЕ ПРОИЗВОДНЫЕ БЕНЗОКСАЗИНА В КАЧЕСТВЕ АКТИВНОГО
КОМПОНЕНТА

(57) Формула изобретения

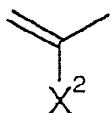
1. Средство против кислотоустойчивых бактерий, содержащее в качестве активного компонента соединение, представленное следующей общей формулой (1), его соль или его гидрат



где R² представляет атом водорода;

R³ представляет атом водорода, аминогруппу, тиольную группу, галогенметильную группу, алкильную группу, имеющую 1-6 углеродных атомов, алкенильную группу, имеющую 2-6 углеродных атомов, алкинильную группу, имеющую 2-6 углеродных атомов, или алкоксигруппу, имеющую 1-6 углеродных атомов, из них аминогруппа может иметь в качестве заместителя(ей) одну или несколько групп, выбранных из формильной группы, алкильной группы, имеющей 1-6 углеродных атомов, и ацильной группы, имеющей 2-5 углеродных атомов;

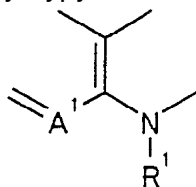
A¹ представляет неполную структуру, представленную формулой (2)



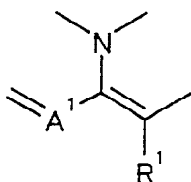
(2)

где X^2 и описанный выше R^1 могут быть объединены с образованием циклической структуры, включающей часть исходного ядра, причем образованное при этом кольцо может содержать атом кислорода, атом азота или атом серы в качестве кольцообразующего атома и кроме того может иметь в качестве заместителя алкильную группу, имеющую 1-6 углеродных атомов, или галогеналкильную группу, имеющую 1-6 углеродных атомов,

A^2 и A^3 каждый представляют атом азота или атом углерода, и образуют неполную структуру



или неполную структуру



вместе с углеродными атомами, объединенными с ними;

X^1 представляет атом галогена, атом водорода или аминогруппу;

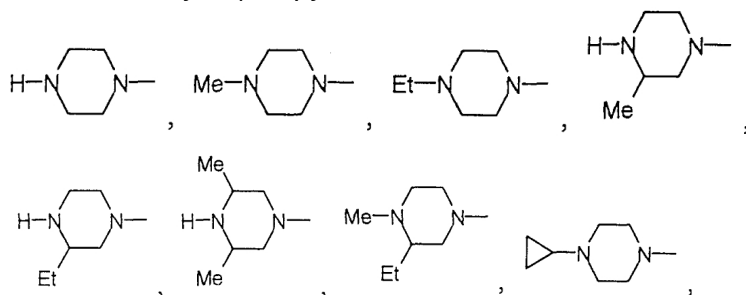
Y представляет атом водорода, фенильную группу, ацетоксиметильную группу, пивалоилоксиметильную группу, этоксикарбонильную группу, холиновую группу, диметиламиноэтильную группу, 5-инданильную группу, фталидинильную группу, 5-алкил-2-оксо-1,3-диоксол-4-илметильную группу, 3-ацетокси-2-оксобутильную группу, алкильную группу, имеющую 1-6 углеродных атомов, алкоксиметильную группу, имеющую 2-7 углеродных атомов, или фенилалкильную группу, которая образована алкиленовой группой, имеющей 1-6 углеродных атомов, и фенильной группой;

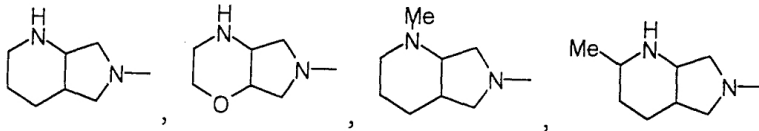
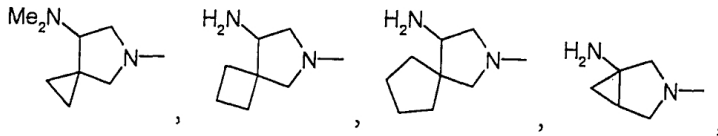
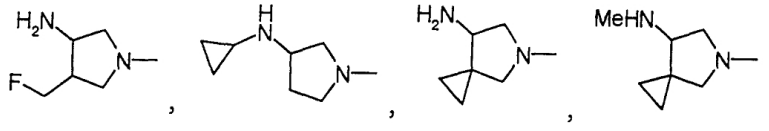
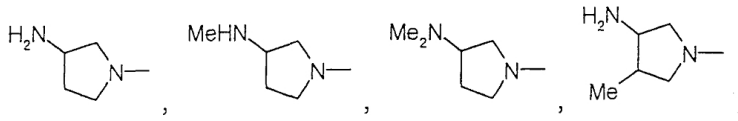
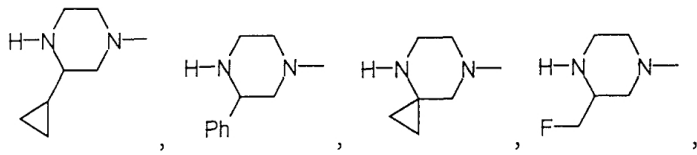
Z представляет моноциклический, бициклический или трициклический гетероциклический заместитель, причем гетероциклический заместитель является насыщенным, частично насыщенным или ненасыщенным, может содержать один или несколько гетероатомов, выбранных из группы, состоящей из атома азота, атома кислорода и атома серы, и кроме того может образовывать бициклоструктуру или спироструктуру, кроме того гетероциклический заместитель может быть замещенным одной или несколькими группами, выбранными из группы, состоящей из атома галогена, аминогруппы, гидроксильной группы, карбамоильной группы, алкильной группы, имеющей 1-6 углеродных атомов, алкиламиногруппы, имеющей 1-6 углеродных атомов, арильной группы, имеющей 6-10 углеродных атомов, гетероарильной группы (которая представляет собой 5- или 6-членное кольцо и содержит 1-4 гетероатома, необязательно выбранных из атома азота, атома кислорода и атома серы), алкоксигруппы, имеющую 1-6 углеродных атомов, алкилтиогруппы, имеющую 1-6 углеродных атомов, галогеналкильную группу, имеющую 1-6 углеродных атомов, и аминоксигруппы, имеющую 1-6 углеродных атомов, причем алкильная группа или алкильная часть алкиламиногруппы, алкоксигруппы, алкилтиогруппы, галогеналкильной группы и аминоксигруппы может иметь циклическую структуру, кроме того может иметь в качестве заместителя(ей) одну или несколько групп, выбранных из группы, состоящей из атома галогена, алкильной группы, имеющей 1-6 углеродных атомов, алкоксигруппы, имеющей 1-6 углеродных атомов, арильной группы, имеющей 6-10 углеродных атомов, и гетероарильной группы (которая представляет собой 5- или 6-

членное кольцо и содержит 1-4 гетероатома, необязательно выбранных из атома азота, атома кислорода и атома серы, аминофрагмент аминогруппы, аминоалкильной группы и алкиламиногруппы может иметь одну или две алкильные группы, имеющие 1-6 углеродных атомов (алкильная группа может иметь циклическую структуру и может иметь одну или несколько групп, выбранных из группы, состоящей из гидроксильной группы, атома галогена, алкилтиогруппы, имеющей 1-6 углеродных атомов, и алкоксигруппы, имеющей 1-6 углеродных атомов, в качестве заместителя(ей))(когда присутствуют две алкильные группы, они могут быть одинаковыми или разными), причем аминофрагмент может быть защищен защитной группой,

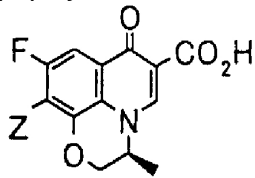
все указанные выше арильные группы и гетероарильные группы могут иметь в качестве заместителя(ей) одну или несколько групп, выбранных из группы, состоящей из атома галогена, гидроксильной группы, тиольной группы, аминогруппы, нитрогруппы, цианогруппы, карбоксильной группы, карбамоильной группы, фенильной группы, алкильной группы, имеющей 1-6 углеродных атомов, алкоксигруппы, имеющей 1-6 углеродных атомов, алкилтиогруппы, имеющей 1-6 углеродных атомов, алкоксикарбонильной группы, имеющей 2-6 углеродных атомов, ацильной группы, имеющей 2-5 углеродных атомов, и гетероарильной группы (которая представляет собой 5- или 6-членное кольцо и содержит 1-4 гетероатома, необязательно выбранных из атома азота, атома кислорода и атома серы), причем указанные алкильная группа, алкоксигруппа, алкилтиогруппа, алкоксикарбонильная группа, ацильная группа, фенильная группа и гетероарильная группа (которая представляет собой 5- или 6-членное кольцо и содержит 1-4 гетероатома, необязательно выбранных из атома азота, атома кислорода и атома серы), могут иметь в качестве заместителя(ей) одну или несколько групп, выбранных из группы, состоящей из атома галогена, гидроксильной группы, алкоксигруппы, имеющей 1-6 углеродных атомов, и алкилтиогруппы, имеющей 1-6 углеродных атомов, и, кроме того, аминогруппа может иметь в качестве заместителя(ей) одну или две группы, выбранные из группы, состоящей из формильной группы, алкильной группы, имеющей 1-6 углеродных атомов, ацильной группы, имеющей 2-5 углеродных атомов, и алкоксикарбонильной группы, имеющей 2-5 углеродных атомов.

2. Средство против кислотоустойчивых бактерий по п.1, в котором в соединении, представленном формулой (1), Z представляет гетероциклический заместитель, выбранный из следующих групп:





3. Средство против кислотоустойчивых бактерий по п.1, содержащее в качестве активного компонента соединение, его соль или его гидрат, в котором исходное ядро формулы



где X₁ определен в п.1, в качестве заместителя Z имеет

