

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2002 年 5 月 23 日 (23.05.2002)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 02/40483 A1

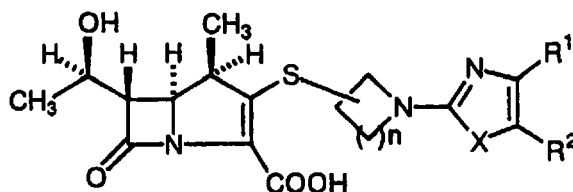
- (51) 国際特許分類: C07D 477/20, (KOBAYASHI, Yoshiyuki) [JP/JP]. 篠塚 剛 (SHI-
A61K 31/407, A61P 31/04 NOZUKA, Tsuyoshi) [JP/JP]. 菅野 修 (KANNO,
Osamu) [JP/JP]; 〒140-8710 東京都品川区広町1丁目2
番58号 三共株式会社内 Tokyo (JP).
- (21) 国際出願番号: PCT/JP01/09960
- (22) 国際出願日: 2001 年 11 月 14 日 (14.11.2001) (74) 代理人: 大野彰夫, 外(OHNO, Akio et al.); 〒140-8710
東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内 Tokyo
(JP).
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ: 特願 2000-350063 (81) 指定国 (国内): AU, BR, CA, CN, CO, CZ, HU, ID, IL,
2000 年 11 月 16 日 (16.11.2000) JP IN, KR, MX, NO, NZ, PH, PL, RU, SG, SK, US, VN, ZA.
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 三共株 (84) 指定国 (広域): ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE,
式会社 (SANKYO COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒 DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR).
103-8426 東京都中央区日本橋本町3丁目5番1号 Tokyo
(JP).
- 添付公開書類:
— 国際調査報告書
- (72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 小林慶行
- 2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。



G00002

(54) Title: 1-METHYLCARBAPENEM DERIVATIVES

(54) 発明の名称: 1-メチルカルバペネム誘導体



(1)

(57) Abstract: 1-Methylcarbapenem compounds having excellent antimicrobial activity, or pharmacologically acceptable ester derivatives or salts thereof; pharmaceutical compositions (particularly antimicrobials) containing the same as the active ingredient; use of the compounds, the ester derivatives, or the salts in preparing the pharmaceutical compositions; and methods for prevention or treatment of diseases (particularly

microbism) by administering the compounds, the ester derivatives, or the salts in pharmacologically effective doses to warm-blooded animals (particularly human beings). The compounds are represented by the general formula (I): (I) wherein R¹ is COOR³ (wherein R³ is hydrogen, C₁₋₆ alkyl, or the like), CONR⁴R⁵ (wherein R⁴ and R⁵ are each hydrogen, optionally substituted C₁₋₆ alkyl, or the like), cyano, CH₂OR⁶ (wherein R⁶ is hydrogen, C₁₋₆ alkyl, or the like), or CH₂NR⁷R⁸ (wherein R⁷ is hydrogen, C₁₋₆ alkyl, or the like, and R⁸ is hydrogen, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ alkanoyl, C₁₋₆ alkoxy carbonyl, or the like); R² is hydrogen or C₁₋₆ alkyl; n is 1, 2, or 3; and X is sulfur or oxygen.

WO 02/40483 A1

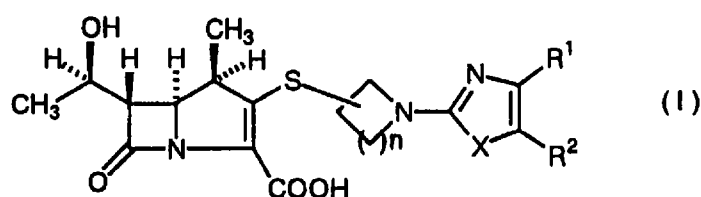
[続葉有]



(57) 要約:

本発明は、優れた抗菌活性を有する 1-メチルカルバペネム化合物、その薬理上許容されるエステル誘導体、その薬理上許容される塩、それらを有効成分として含有する医薬組成物（特に抗菌剤）、該医薬組成物を製造するためのそれら化合物、エステル誘導体又は塩の使用、或いはそれら化合物、エステル誘導体又は塩の薬理的な有効量を温血動物（特にヒト）に投与する疾病（特に細菌感染症）の予防方法又は治療方法に関する。

本発明の 1-メチルカルバペネム化合物は、一般式（I）



[式中、 R^1 は式 $COOR^3$ で表される基（ R^3 は水素原子、C1-C6アルキル基等）、式 $CONR^4R^5$ で表される基（ R^4 及び R^5 は水素原子、置換されていてもよいC1-C6アルキル基等）、シアノ基、式 CH_2OR^6 で表される基（ R^6 は水素原子、C1-C6アルキル基等）または式 $CH_2NR^7R^8$ で表される基（ R^7 は水素原子、C1-C6アルキル基等、 R^8 は水素原子、C1-C6アルキル基、C1-C6アルカノイル基、C1-C6アルコキシカルボニル基等）； R^2 は水素原子またはC1-C6アルキル基； n は1、2または3； X は硫黄原子または酸素原子を示す。] で表される。