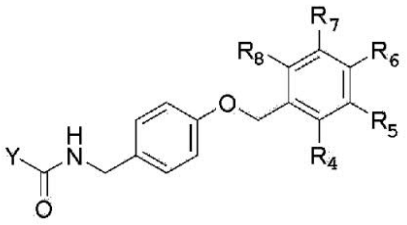
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和3年4月30日(2021.4.30)

【公表番号】特表2019-535814(P2019-535814A)
【公表日】令和1年12月12日(2019.12.12)
【年通号数】公開・登録公報2019-050
【出願番号】特願2019-545217(P2019-545217)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｃ 237/08 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 31/10 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/08 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 17/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 25/28 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/198 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/401 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 207/10 (2006.01)
Ｃ０７Ｂ 51/00 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｃ 237/08 ＣＳＰ
Ａ６１Ｐ 31/10
Ａ６１Ｐ 37/08
Ａ６１Ｐ 11/00
Ａ６１Ｐ 17/00
Ａ６１Ｐ 17/00 １０１
Ａ６１Ｐ 25/28
Ａ６１Ｋ 31/198
Ａ６１Ｋ 31/401
Ｃ０７Ｄ 207/10
Ｃ０７Ｂ 51/00 Ｄ
Ｃ０７Ｂ 51/00 Ｆ

【手続補正書】
【提出日】令和3年3月11日(2021.3.11)
【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】
下記化学式１で表されるベンジルオキシベンジルアミンアミノ酸誘導体、その塩および／または溶媒和物：
［化学式１］

【化１】



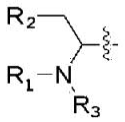
前記化学式１において、

R_4、R_5、R_6、R_7およびR_8は互いに同一であるかまたは異なり、各々独立して水素、C_{1-7}アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン、ハロゲン化C_{1-7}アルキル、C_{1-7}アルキルオキシおよびハロゲン化C_{1-7}アルキルオキシの中から選択され、

Ｙは下記化学式２または３から選択され、

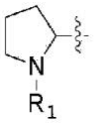
[化学式２]

【化２】



[化学式３]

【化３】



R_1およびR_3は互いに同一であるかまたは異なり、各々独立して水素またはC_{1-7}アルキルであり、

R_2はC_{1-7}アルキルである

（ただし、化学式２のR_1およびR_3が水素であり、R_2が－CH_3である場合は、化学式１のR_5またはR_7はフルオロではない；および

化学式３のR_1が水素である場合は、化学式１のR_4～R_8のいずれか１つは水素ではなく、R_5またはR_7はフルオロではない）。

【請求項２】

前記C_{1-7}アルキルが、直鎖状、分鎖状または環状のC_{1-7}アルキルである、請求項１に記載のベンジルオキシベンジルアミンアミノ酸誘導体、その塩および／または溶媒和物。

【請求項３】

前記化学式１で表される化合物が、

（Ｒ）／（Ｓ）－１－（（４－（（２－（フルオロベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）－１－オキソブタン－２－アミニウムクロリド（化合物１７）；

（Ｒ）／（Ｓ）－１－（（４－（（４－（フルオロベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）－１－オキソブタン－２－アミニウムクロリド（化合物１９）；

（Ｒ）／（Ｓ）－１－オキソ－１－（（４－（（２－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）ブタン－２－アミニウムクロリド（化合物２０）；

（Ｒ）／（Ｓ）－１－オキソ－１－（（４－（（３－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）ブタン－２－アミニウムクロリド（化合物２１）；

（Ｒ）／（Ｓ）－１－オキソ－１－（（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）ブタン－２－アミニウムクロリド（化合物２２）；

（Ｒ）／（Ｓ）－１－（（４－（（３－（クロロベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）－１－オキソブタン－２－アミニウムクロリド（化合物２３）；

（Ｒ）／（Ｓ）－１－（（４－（（４－（クロロベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）－１－オキソブタン－２－アミニウムクロリド（化合物２４）；
（Ｒ）／（Ｓ）－１－（（４－（（４－（トリフルオロベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）－１－オキソペンタン－２－アミニウムクロリド（化合物２６）；
（Ｒ）／（Ｓ）－２－（メチルアミノ）－Ｎ－（４－（（４－トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ブタンアミド（化合物２７）；
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３－クロロベンジル）オキシ）ベンジル）－２－（メチルアミノ）ブタンアミド（化合物２８）；
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（４－クロロベンジル）オキシ）ベンジル）－２－（メチルアミノ）ブタンアミド（化合物２９）；
（Ｒ）／（Ｓ）－２－（メチルアミノ）－Ｎ－（４－（（４－トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ペンタンアミド（化合物３０）；
（Ｒ）／（Ｓ）－２－（メチルアミノ）－Ｎ－（４－（（４－トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ペンタンアミド（化合物３１）；
（Ｒ）／（Ｓ）－ｔｅｒｔ－ブチル－２－（（４－（（３－フルオロベンジル）オキシ）ベンジル）カルバモイル）ピロリジン－１－カルボキシレート（化合物３４）；
（Ｒ）／（Ｓ）－ｔｅｒｔ－ブチル－２－（（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）カルバモイル）ピロリジン－１－カルボキシレート（化合物３６）；
（Ｒ）／（Ｓ）－ｔｅｒｔ－ブチル－２－（（４－（（４－クロロベンジル）オキシ）ベンジル）カルバモイル）ピロリジン－１－カルボキシレート（化合物３７）；
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３－フルオロベンジル）オキシ）ベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミドヒドロクロリド（化合物３８）；
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミドヒドロクロリド（化合物４０）；
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（４－クロロベンジル）オキシ）ベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミドヒドロクロリド（化合物４１）；
（Ｒ）／（Ｓ）－１－メチル－Ｎ－（４－（（３－フルオロベンジル）オキシ）ベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド（化合物４２）；
（Ｒ）／（Ｓ）－１－メチル－Ｎ－（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド（化合物４３）；
（Ｒ）／（Ｓ）－１－メチル－Ｎ－（４－（（４－クロロベンジル）オキシ）ベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド（化合物４４）；
（Ｒ）／（Ｓ）－ｔｅｒｔ－ブチル（１－（（４－（（３，４－クロロベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）－１－オキソブタン－２－イル）カルバメート（化合物５５）；
（Ｒ）／（Ｓ）－ｔｅｒｔ－ブチル（１－オキソ－１－（（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）ペンタン－２－イル）カルバメート（化合物５６）；
（Ｒ）／（Ｓ）－１－（（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）－１－オキソブタン－２－アミニウムクロリド（化合物５７）；
（Ｒ）／（Ｓ）－１－（（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）－１－オキソペンタン－２－アミニウムクロリド（化合物５８）；
（Ｒ）／（Ｓ）－２－（ジメチルアミノ）－Ｎ－（４－（（４－トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ブタンアミド（化合物５９）；
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル）－２－（ジメチルアミノ）ブタンアミド（化合物６０）；
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル）－２－（ジメチルアミノ）ブタンアミド（化合物６１）；
（Ｒ）／（Ｓ）－２－（エチルアミノ）－Ｎ－（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ブタンアミド（化合物６２）；

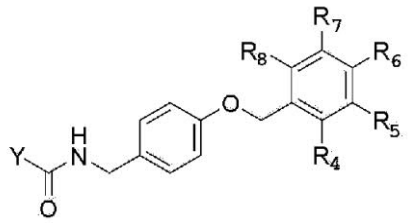
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル－２－（エチルアミノ）ブタンアミド（化合物６３）；
（Ｒ）／（Ｓ）－２－（エチルアミノ）－Ｎ－（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ペンタンアミド（化合物６４）；
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル－２－（エチルアミノ）ペンタンアミド（化合物６５）；
（Ｒ）／（Ｓ）－２－（ジエチルアミノ）－Ｎ－（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ブタンアミド（化合物６６）；
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル－２－（ジエチルアミノ）ブタンアミド（化合物６７）；
（Ｒ）／（Ｓ）－２－（ジエチルアミノ）－Ｎ－（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ペンタンアミド（化合物６８）；および
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル－２－（ジエチルアミノ）ペンタンアミド（化合物６９）
からなる群より選択されたいずれか一つ、またはこれらのＲ体とＳ体のラセミ混合物である、請求項１に記載のベンジルオキシベンジルアミンアミノ酸誘導体、その塩および／または溶媒和物。

【請求項４】

下記化学式１で表されるベンジルオキシベンジルアミンアミノ酸誘導体またはその薬剤学的に許容可能な塩を有効成分として含む、真菌症の予防または治療用の薬学的組成物：

［化学式１］

【化４】



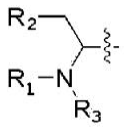
前記化学式１において、

R_4、R_5、R_6、R_7およびR_8は互いに同一であるかまたは異なり、各々独立して水素、C_{1-7}アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン、ハロゲン化C_{1-7}アルキル、C_{1-7}アルキルオキシおよびハロゲン化C_{1-7}アルキルオキシの中から選択され、

Ｙは下記化学式２または３から選択され、

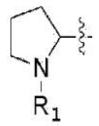
[化学式２]

【化５】



[化学式３]

【化６】



R_1およびR_3は互いに同一であるかまたは異なり、各々独立して水素またはC_{1-7}アルキルであり、

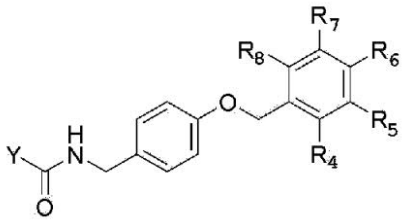
R_2はC_{1-7}アルキルである

（ただし、化学式２のR_1およびR_3が水素であり、R_2が－CH_3である場合は、化学

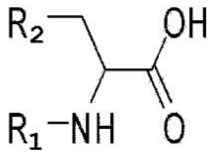
式１のＲ$_5$またはＲ$_7$はフルオロではない；および
化学式３のＲ$_1$が水素である場合は、化学式１のＲ$_4$～Ｒ$_8$のいずれか１つは水素ではなく、Ｒ$_5$またはＲ$_7$はフルオロではない）。
【請求項５】
カンジダ属菌、スポロトリックス属菌、マラセジア属菌、クリプトコックス属菌、アスペルギルス属菌、ニューモシスチス・カリニ菌およびケカビ属菌の中から選択される菌に抗菌活性を有する、請求項４に記載の薬学的組成物。
【請求項６】
前記真菌症が、脳髄膜炎、脳髄膜炎による脳炎症、皮膚カンジダ症、粘膜カンジダ症、腸カンジダ症、尿路カンジダ症、カンジダ性心内膜炎、口腔・咽頭カンジダ症、カンジダ性内眼球炎、カンジダ性敗血症、白癬菌、癜風、スポロトリクム症、真菌性膿瘍、真菌性肉芽腫、化膿性肉芽腫、マズラ菌症、ニューモシスチス肺炎、全身性クリプトコックス症、皮膚粘膜クリプトコックス症、アスペルギルス症、空洞、喀血、アレルギー、陳旧性肺結核、肺線維症、肺嚢胞、慢性発熱、咳、痰、血痰、頑癬、鵞口瘡、真菌感染性痴呆および接合菌症の中から選択される、請求項４に記載の薬学的組成物。
【請求項７】
前記化学式１で表される化合物が、
（Ｒ）／（Ｓ）－１－（（４－（（２－（フルオロベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）－１－オキソブタン－２－アミニウムクロリド（化合物１７）；
（Ｒ）／（Ｓ）－１－（（４－（（４－（フルオロベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）－１－オキソブタン－２－アミニウムクロリド（化合物１９）；
（Ｒ）／（Ｓ）－１－オキソ－１－（（４－（（２－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）ブタン－２－アミニウムクロリド（化合物２０）；
（Ｒ）／（Ｓ）－１－オキソ－１－（（４－（（３－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）ブタン－２－アミニウムクロリド（化合物２１）；
（Ｒ）／（Ｓ）－１－オキソ－１－（（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）ブタン－２－アミニウムクロリド（化合物２２）；
（Ｒ）／（Ｓ）－１－（（４－（（３－（クロロベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）－１－オキソブタン－２－アミニウムクロリド（化合物２３）；
（Ｒ）／（Ｓ）－１－（（４－（（４－（クロロベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）－１－オキソブタン－２－アミニウムクロリド（化合物２４）；
（Ｒ）／（Ｓ）－１－（（４－（（４－（トリフルオロベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）－１－オキソペンタン－２－アミニウムクロリド（化合物２６）；
（Ｒ）／（Ｓ）－２－（メチルアミノ）－Ｎ－（４－（（４－トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ブタンアミド（化合物２７）；
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３－クロロベンジル）オキシ）ベンジル）－２－（メチルアミノ）ブタンアミド（化合物２８）；
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（４－クロロベンジル）オキシ）ベンジル）－２－（メチルアミノ）ブタンアミド（化合物２９）；
（Ｒ）／（Ｓ）－２－（メチルアミノ）－Ｎ－（４－（（４－トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ペンタンアミド（化合物３０）；
（Ｒ）／（Ｓ）－２－（メチルアミノ）－Ｎ－（４－（（４－トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ペンタンアミド（化合物３１）；
（Ｒ）／（Ｓ）－ｔｅｒｔ－ブチル－２－（（４－（（３－フルオロベンジル）オキシ）ベンジル）カルバモイル）ピロリジン－１－カルボキシレート（化合物３４）；
（Ｒ）／（Ｓ）－ｔｅｒｔ－ブチル－２－（（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）カルバモイル）ピロリジン－１－カルボキシレート（化合物３６）；
（Ｒ）／（Ｓ）－ｔｅｒｔ－ブチル－２－（（４－（（４－クロロベンジル）オキシ）ベンジル）カルバモイル）ピロリジン－１－カルボキシレート（化合物３７）；

（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３－フルオロベンジル）オキシ）ベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミドヒドロクロリド（化合物３８）；
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミドヒドロクロリド（化合物４０）；
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（４－クロロベンジル）オキシ）ベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミドヒドロクロリド（化合物４１）；
（Ｒ）／（Ｓ）－１－メチル－Ｎ－（４－（（３－フルオロベンジル）オキシ）ベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド（化合物４２）；
（Ｒ）／（Ｓ）－１－メチル－Ｎ－（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド（化合物４３）；
（Ｒ）／（Ｓ）－１－メチル－Ｎ－（４－（（４－クロロベンジル）オキシ）ベンジル）ピロリジン－２－カルボキサミド（化合物４４）；
（Ｒ）／（Ｓ）－ｔｅｒｔ－ブチル（１－（（４－（（３，４－クロロベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）－１－オキソブタン－２－イル）カルバメート（化合物５５）；
（Ｒ）／（Ｓ）－ｔｅｒｔ－ブチル（１－オキソ－１－（（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）ペンタン－２－イル）カルバメート（化合物５６）；
（Ｒ）／（Ｓ）－１－（（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）－１－オキソブタン－２－アミニウムクロリド（化合物５７）；
（Ｒ）／（Ｓ）－１－（（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル）アミノ）－１－オキソペンタン－２－アミニウムクロリド（化合物５８）；
（Ｒ）／（Ｓ）－２－（ジメチルアミノ）－Ｎ－（４－（（４－トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ブタンアミド（化合物５９）；
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル）－２－（ジメチルアミノ）ブタンアミド（化合物６０）；
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル）－２－（ジメチルアミノ）ブタンアミド（化合物６１）；
（Ｒ）／（Ｓ）－２－（エチルアミノ）－Ｎ－（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ブタンアミド（化合物６２）；
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル－２－（エチルアミノ）ブタンアミド（化合物６３）；
（Ｒ）／（Ｓ）－２－（エチルアミノ）－Ｎ－（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ペンタンアミド（化合物６４）；
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル－２－（エチルアミノ）ペンタンアミド（化合物６５）；
（Ｒ）／（Ｓ）－２－（ジエチルアミノ）－Ｎ－（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ブタンアミド（化合物６６）；
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル－２－（ジエチルアミノ）ブタンアミド（化合物６７）；
（Ｒ）／（Ｓ）－２－（ジエチルアミノ）－Ｎ－（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ペンタンアミド（化合物６８）；および
（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル－２－（ジエチルアミノ）ペンタンアミド（化合物６９）からなる群より選択されたいずれか一つ、またはこれらのＲ体とＳ体のラセミ混合物である、請求項４に記載の薬学的組成物。
【請求項８】
ｉ）下記化学式５または６から選択されるアミノ酸のアミン基を保護基で保護するステップ；
ｉｉ）前記アミン基が保護されたアミノ酸をベンジルアミン誘導体と反応させてアミノ酸のアミン基が保護基で保護されたベンジルオキシベンジルアミニルアミノ酸誘導体を製造するステップ；および

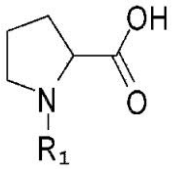
ｉｉｉ）アミン保護基を除去するステップ；
を含む下記化学式１で表されるベンジルオキシベンジルアミンアミノ酸誘導体の製造方法：
[化学式１]
【化７】



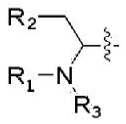
[化学式５]
【化８】



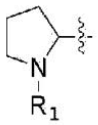
[化学式６]
【化９】



前記化学式１において、
R_4、R_5、R_6、R_7およびR_8は互いに同一であるかまたは異なり、各々独立して水素、C_{1-7}アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン、ハロゲン化C_{1-7}アルキル、C_{1-7}アルキルオキシおよびハロゲン化C_{1-7}アルキルオキシの中から選択され、
Ｙは下記化学式２または３から選択され、
[化学式２]
【化１０】

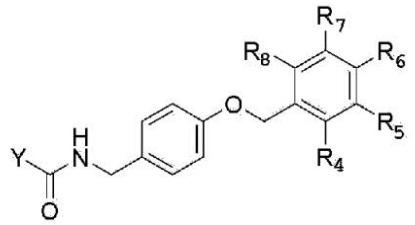


[化学式３]
【化１１】

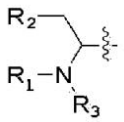


前記化学式２、３、５および６において、
R_1およびR_3は互いに同一であるかまたは異なり、各々独立して水素またはC_{1-7}アルキルであり、
R_2はC_{1-7}アルキルである
（ただし、化学式２のR_1およびR_3が水素であり、R_2が－CH_3である場合は、化学式１のR_5またはR_7はフルオロではない；および
化学式３のR_1が水素である場合は、化学式１のR_4～R_8のいずれか１つは水素ではな

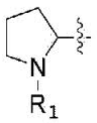
く、R_5またはR_7はフルオロではない）。
【請求項９】
前記ｉｉ）ステップが、アミン基が保護されたアミノ酸をベンジルオキシベンジルアミン誘導体と反応させることである、請求項８に記載の製造方法。
【請求項１０】
前記ｉｉ）ステップが、アミン基が保護されたアミノ酸を４－ヒドロキシベンジルアミンと反応させてアミノ酸のアミン基が保護基で保護された４－ヒドロキシベンジルアミニルアミノ酸誘導体を製造した後、ベンジルブロミド誘導体と反応させることである、請求項８に記載の製造方法。
【請求項１１】
前記ｉｉｉ）ステップが、アミン保護基を除去した後にアルキル化させるステップをさらに含む、請求項８に記載の製造方法。
【請求項１２】
前記化学式１で表される化合物が、カンジダ属菌、スポロトリックス属菌、マラセジア属菌、クリプトコックス属菌、アスペルギルス属菌、ニューモシスチス・カリニ菌およびケカビ属菌の中から選択される菌に抗菌活性を有する、請求項８に記載の製造方法。
【請求項１３】
下記化学式１で表されるベンジルオキシベンジルアミンアミノ酸誘導体またはその薬剤学的に許容可能な塩を有効成分として含む、動物病原性真菌感染を予防または治療するための薬学的組成物：
［化学式１］
【化１２】



前記化学式１において、
R_4、R_5、R_6、R_7およびR_8は互いに同一であるかまたは異なり、各々独立して水素、C_{1-7}アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン、ハロゲン化C_{1-7}アルキル、C_{1-7}アルキルオキシおよびハロゲン化C_{1-7}アルキルオキシの中から選択され、
Ｙは下記化学式２または３から選択され、
[化学式２]
【化１３】



[化学式３]
【化１４】



R_1およびR_3は互いに同一であるかまたは異なり、各々独立して水素またはC_{1-7}アルキルであり、
R_2はC_{1-7}アルキルである
（ただし、化学式２のR_1およびR_3が水素であり、R_2が－CH_3である場合は、化学

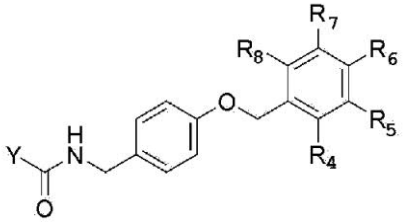
式１のＲ$_5$またはＲ$_7$はフルオロではない；および
化学式３のＲ$_1$が水素である場合は、化学式１のＲ$_4$～Ｒ$_8$のいずれか１つは水素ではなく、Ｒ$_5$またはＲ$_7$はフルオロではない）。

【請求項１４】

下記化学式１で表されるベンジルオキシベンジルアミンアミノ酸誘導体またはその薬剤学的に許容可能な塩を有効成分として含む、植物病原性真菌感染の予防または治療するための薬学的組成物：

［化学式１］

【化１５】



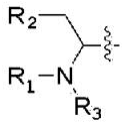
前記化学式１において、

Ｒ$_4$、Ｒ$_5$、Ｒ$_6$、Ｒ$_7$およびＲ$_8$は互いに同一であるかまたは異なり、各々独立して水素、Ｃ$_{1-7}$アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン、ハロゲン化Ｃ$_{1-7}$アルキル、Ｃ$_{1-7}$アルキルオキシおよびハロゲン化Ｃ$_{1-7}$アルキルオキシの中から選択され、

Ｙは下記化学式２または３から選択され、

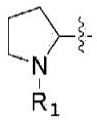
[化学式２]

【化１６】



[化学式３]

【化１７】



Ｒ$_1$およびＲ$_3$は互いに同一であるかまたは異なり、各々独立して水素またはＣ$_{1-7}$アルキルであり、

Ｒ$_2$はＣ$_{1-7}$アルキルである

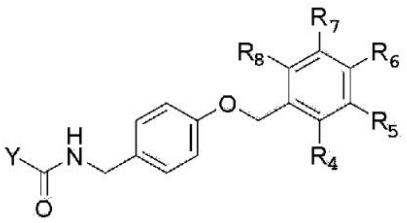
（ただし、化学式２のＲ$_1$およびＲ$_3$が水素であり、Ｒ$_2$が－ＣＨ$_3$である場合は、化学式１のＲ$_5$またはＲ$_7$はフルオロではない；および
化学式３のＲ$_1$が水素である場合は、化学式１のＲ$_4$～Ｒ$_8$のいずれか１つは水素ではなく、Ｒ$_5$またはＲ$_7$はフルオロではない）。

【請求項１５】

下記化学式１で表されるベンジルオキシベンジルアミンアミノ酸誘導体またはその薬剤学的に許容可能な塩を含む、化粧料組成物または人体洗浄用組成物：

［化学式１］

【化１８】



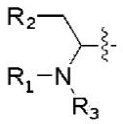
前記化学式１において、

R_4、R_5、R_6、R_7およびR_8は互いに同一であるかまたは異なり、各々独立して水素、C_{1-7}アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン、ハロゲン化C_{1-7}アルキル、C_{1-7}アルキルオキシおよびハロゲン化C_{1-7}アルキルオキシの中から選択され、

Ｙは下記化学式２または３の中から選択され、

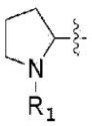
[化学式２]

【化１９】



[化学式３]

【化２０】



R_1およびR_3は互いに同一であるかまたは異なり、各々独立して水素またはC_{1-7}アルキルであり、

R_2はC_{1-7}アルキルである

（ただし、化学式２のR_1およびR_3が水素であり、R_2が－CH_3である場合は、化学式１のR_5またはR_7はフルオロではない；および

化学式３のR_1が水素である場合は、化学式１のR_4～R_8のいずれか１つは水素ではなく、R_5またはR_7はフルオロではない）。

【手続補正２】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】００３０

【補正方法】変更

【補正の内容】

【００３０】

（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル－２－（エチルアミノ）ペンタンアミド（化合物６５）；

（Ｒ）／（Ｓ）－２－（ジエチルアミノ）－Ｎ－（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ブタンアミド（化合物６６）；

（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル－２－（ジエチルアミノ）ブタンアミド（化合物６７）；

（Ｒ）／（Ｓ）－２－（ジエチルアミノ）－Ｎ－（４－（（４－（トリフルオロメチル）ベンジル）オキシ）ベンジル）ペンタンアミド（化合物６８）；

（Ｒ）／（Ｓ）－Ｎ－（４－（（３，４－ジクロロベンジル）オキシ）ベンジル－２－（ジエチルアミノ）ペンタンアミド（化合物６９）；の中から選択されるいずれか一つであってもよく、Ｒ体とＳ体のラセミ混合物であってもよい。