

【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19年6月21日(2007.6.21)

【公表番号】特表2006-528664(P2006-528664A)

【公表日】平成18年12月21日(2006.12.21)

【年通号数】公開・登録公報2006-050

【出願番号】特願2006-529485(P2006-529485)

【国際特許分類】

C O 7 C 279/08 (2006.01)

C O 7 C 279/22 (2006.01)

C O 7 C 309/14 (2006.01)

【F I】

C O 7 C 279/08 C S P

C O 7 C 279/22

C O 7 C 309/14

【手続補正書】

【提出日】平成19年4月20日(2007.4.20)

【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

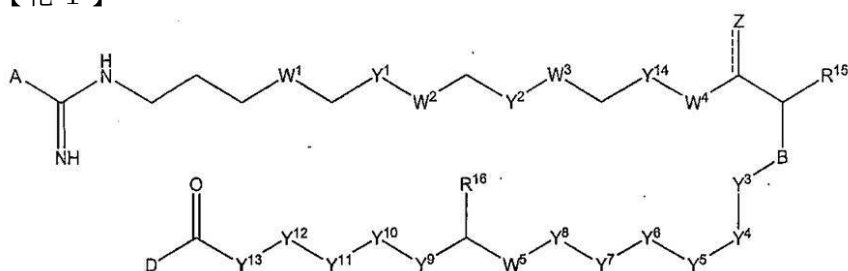
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

【化1】

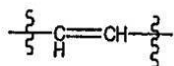


〔式 I〕

式中、Aが $\text{NHC}(\text{O})\text{R}^1$ 、 $\text{N}=\text{CR}^2\text{R}^3$ 、又は NHR^3 から選択され、かつ R^1 、 R^2 及び R^3 が、独立してH、 $\text{C}_1 - 6$ アルキル、 $\text{C}_2 - 6$ アルケニル、 $\text{C}_3 - 6$ シクロアルキル、 $\text{C}_3 - 6$ ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールからなる群から選択され、かつ前記アルキル、アルケニル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールが、ハロゲン、オキソ、OH、 $\text{C}_2 - 6$ アルケニル、 NO_2 、 NH_2 、シクロアルキル、ヘテロアリール又はアリールから選択される基により任意に置換され、前記 $\text{C}_2 - 6$ アルケニル、ヘテロアリール及びアリールが、さらにハロゲン、OH、 $\text{C}_1 - 3$ アルキル NO_2 又は NH_2 から独立して選択される1又は2以上の基により任意に置換され；

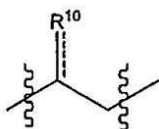
Bが

【化 2】



又は

【化 3】

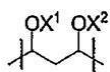


から選択され；かつ R^{10} が OH 、 $-\text{OS}(\text{O})_2\text{OH}$ であるか、又は点線が結合手である場合には R^{10} がオキソであり；

D が OH 又は 1 ～ 2 のフェニル基によって任意に置換された C_{1-6} アルコキシから選択され、かつ前記フェニル基が C_{1-6} アルキル又はハロにより任意に置換され；

W^1 及び W^2 が

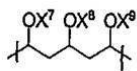
【化 4】



であり；

W^3 が

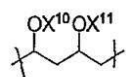
【化 5】



であり；

W^4 が

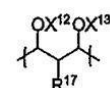
【化 6】



であり；

W^5 が

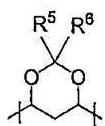
【化 7】



であり；

かつ X^1 、 X^2 、 X^7 、 X^8 、 X^9 、 X^{10} 、 X^{11} 、 X^{12} 及び X^{13} のうち、隣り合う 2 つのいずれかが結合手である場合には、その隣り合う 2 つの酸素原子とそれらに結合する炭素原子とが共に、式：

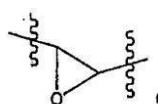
【化 8】



の 6 員環アセタールを形成するように、 X^1 、 X^2 、 X^7 、 X^8 、 X^9 、 X^{10} 、 X^{11} 、 X^{12} 、及び X^{13} が、各々独立して H、 $-C(O)-R^7$ 及び結合手から選択され、 R^5 、 R^6 及び R^7 が、各々独立して H、 C_1-6 アルキル、 C_2-7 アルケニルから選択され；

Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 、 Y^6 、 Y^7 、 Y^8 、 Y^9 、 Y^{10} 、 Y^{11} 、 Y^{12} 、 Y^{13} 、及び Y^{14} が、各々独立して $-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH=CH-$ 、

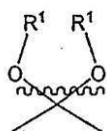
【化 9】



又は $-CH(OH)-CH(OH)-$ から選択され、かつ、この選択からの炭素はすべてメチル基で任意に置換され；

Z が、OH、 C_3-6 シクロアルキル、 C_3-6 ヘテロシクロアルキル、 NHR^8 、

【化 10】



から選択され、点線が結合手の場合には、Z がオキソ又は NC_1-6 アルキルであり；

R^8 が H、 C_1-6 アルキル、 C_2-6 アルケニル又は C_3-6 シクロアルキルから選択され；

R^{15} 、 R^{16} 及び R^{17} が、各々独立して H または CH_3 から選択される；ことを特徴とする、式 I の化合物、又は薬学的に許容されるその塩。

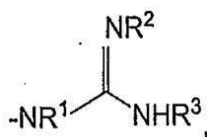
【請求項 2】

Z がオキソであることを特徴とする、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

A が

【化 11】



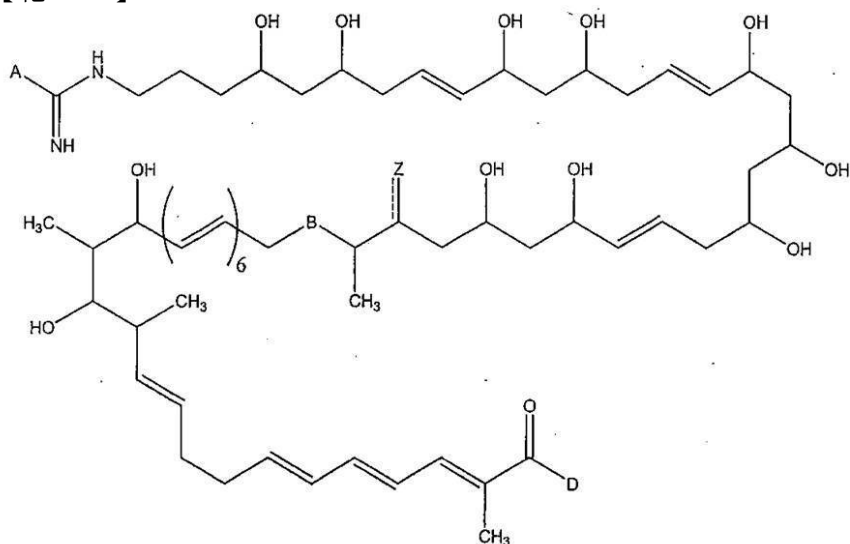
であり、 R^1 、 R^2 及び R^3 が、請求項 1 に定義された通りであることを特徴とする、請求項 1 又は 2 記載の化合物。

【請求項 4】

D が、 $-OH$ であることを特徴とする、請求項 1、2、又は 3 記載の化合物。

【請求項 5】

【化 1 2】



【式 II】

A、B、D、及び Z が、請求項 1 に定義されていることを特徴とする、式 II の化合物又は薬学的に許容されるその塩。

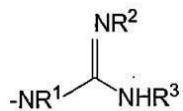
【請求項 6】

Z がオキソであることを特徴とする、請求項 5 記載の化合物。

【請求項 7】

A が

【化 1 3】



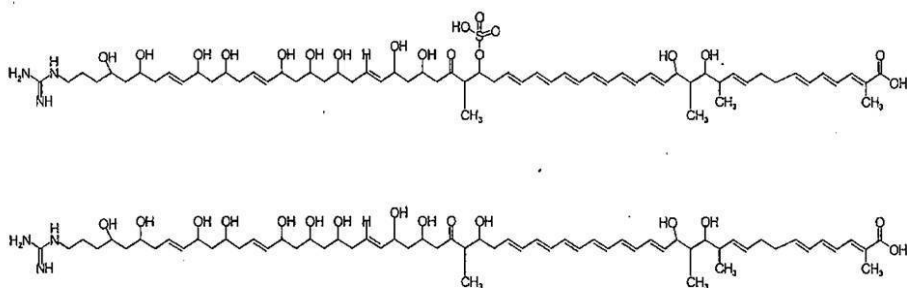
であり、 R^1 、 R^2 及び R^3 が、請求項 1 に定義された通りであることを特徴とする、請求項 5 又は 6 記載の化合物。

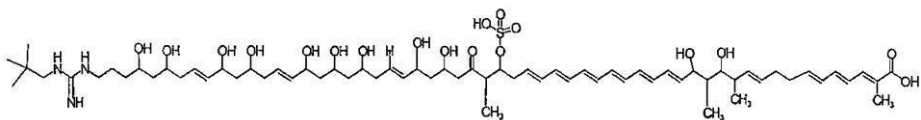
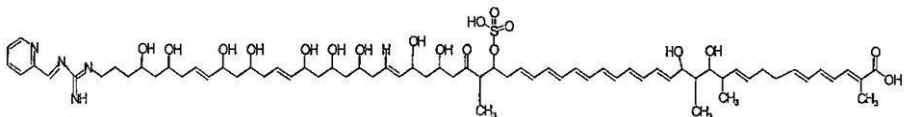
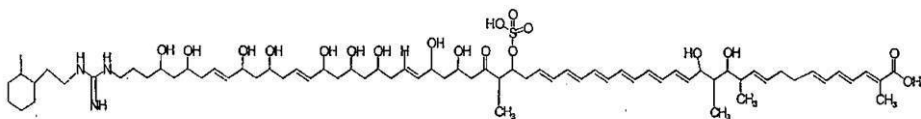
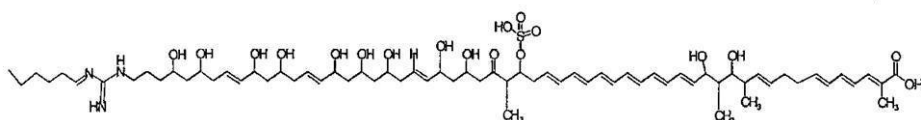
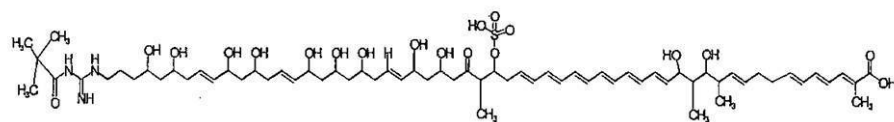
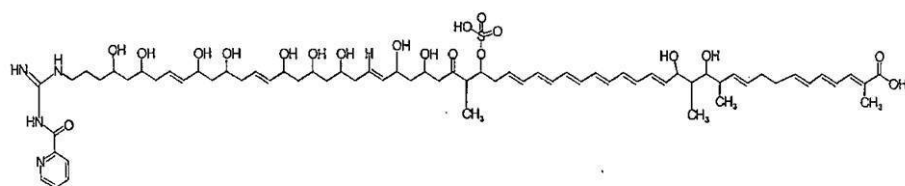
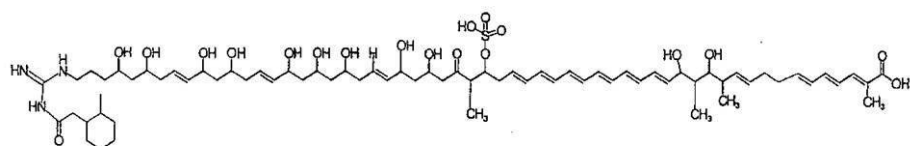
【請求項 8】

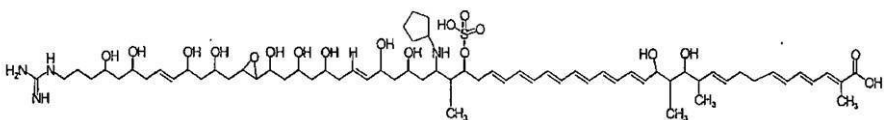
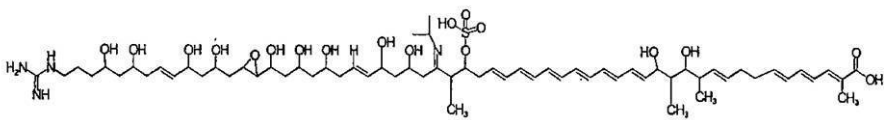
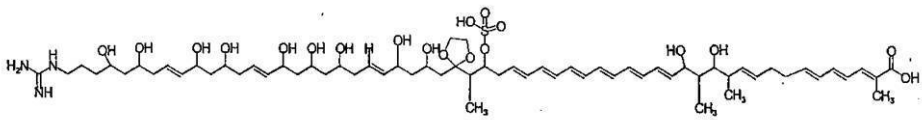
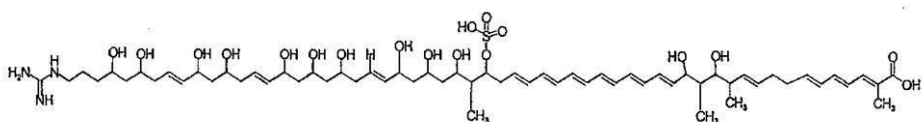
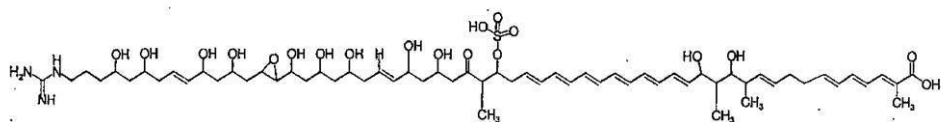
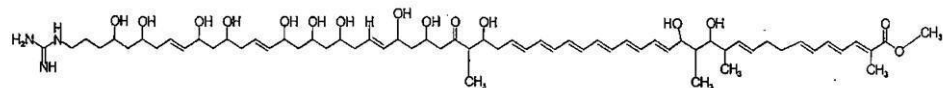
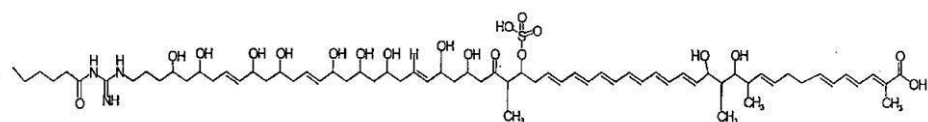
D が -OH であることを特徴とする、請求項 5、6、又は 7 記載の化合物。

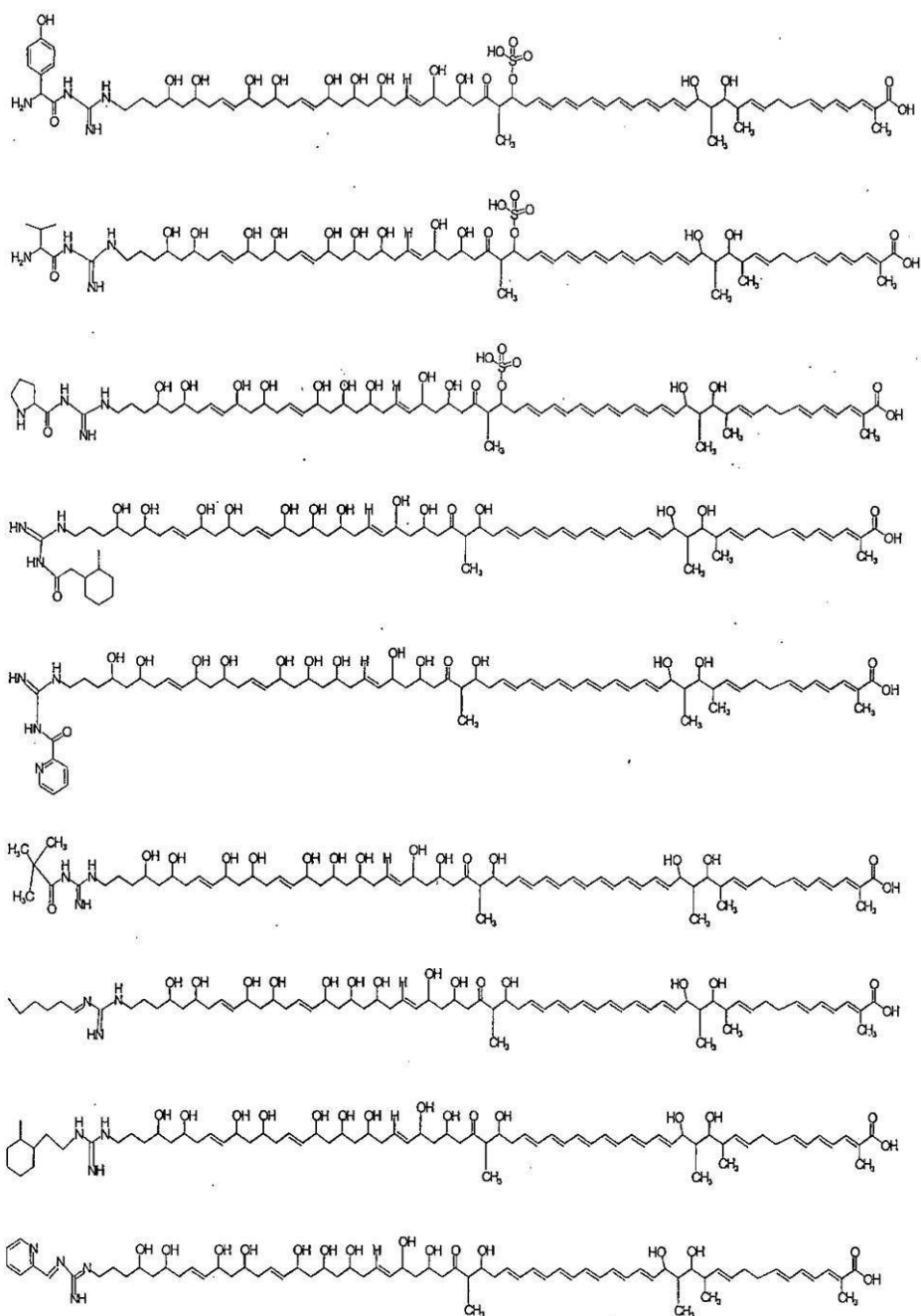
【請求項 9】

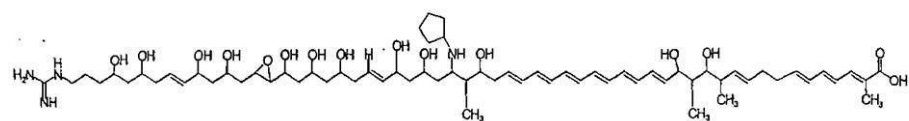
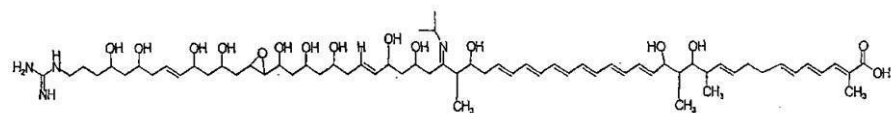
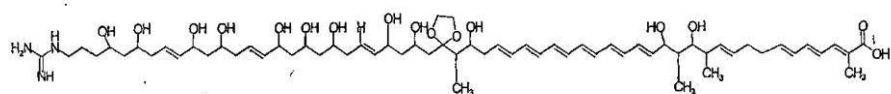
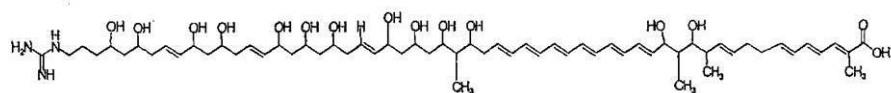
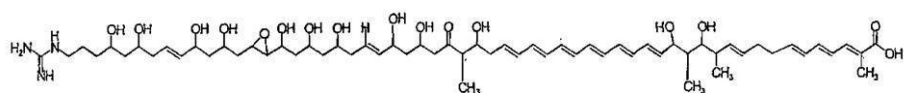
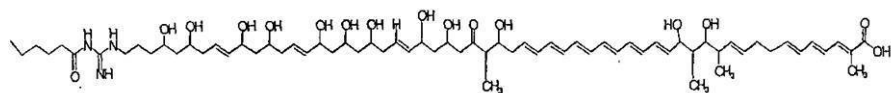
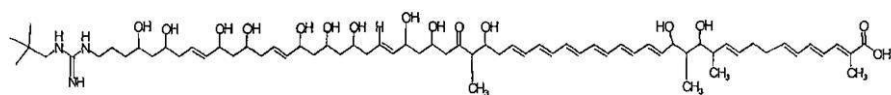
【化 1 4】

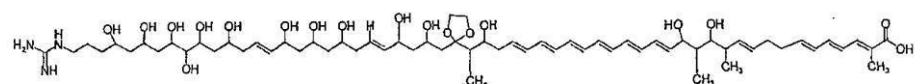
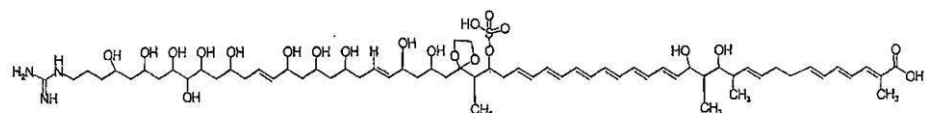
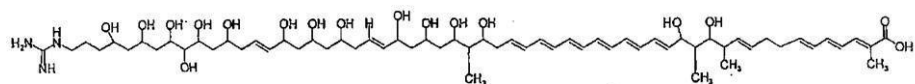
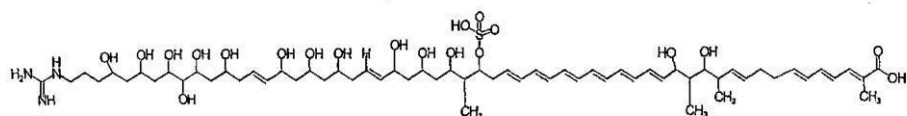
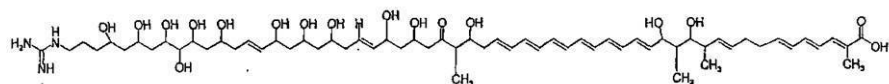
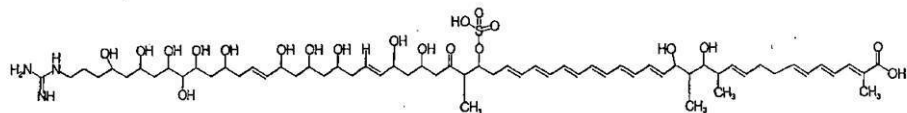
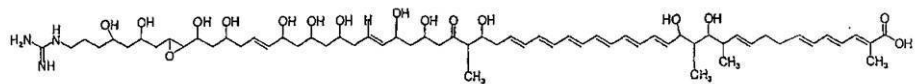
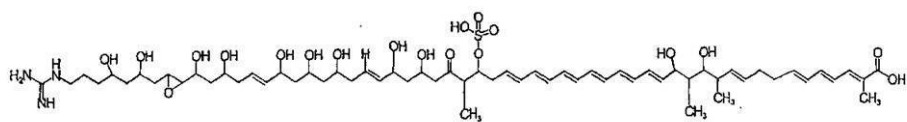


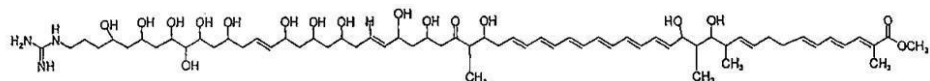
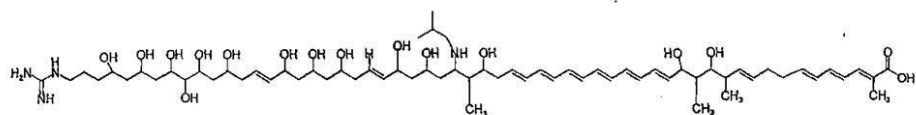
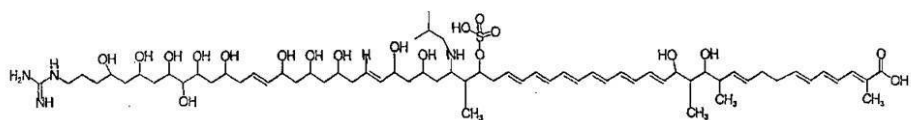
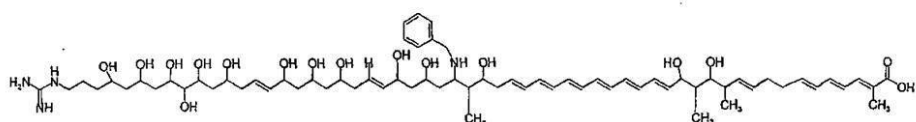
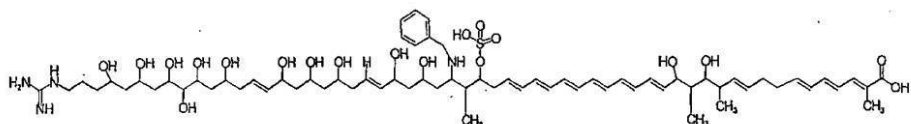
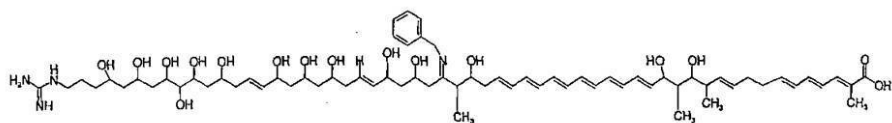
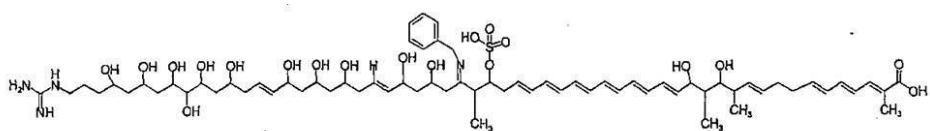








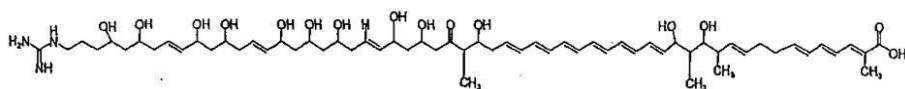
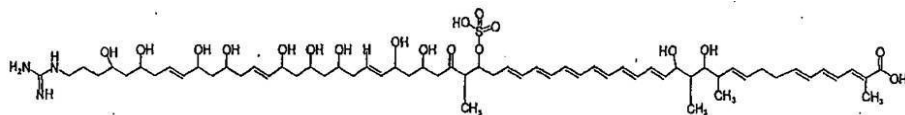




からなる群から選択される化合物。

【請求項 10】

【化 15】



からなる群から選択される化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項 11】

ストレプトマイセス・メラノスポラファシエンス菌株に由来する細胞を培養し；該培

養細胞を、少なくとも1つの炭素原子源と、少なくとも1つの窒素原子源とを含有する増殖培地中で、請求項10記載の前記化合物の製造に要する期間、好氣的にインキュベートし；前記培地を溶媒とともに抽出し；該粗抽出物から請求項10記載の化合物を精製する手順を含む、請求項1～10のいずれか記載の化合物の製造方法。

【請求項12】

前記ストレプトマイセス・メラノスポラファシエンス菌株が、NRRL B-12234又はそのミュータントであることを特徴とする、請求項11記載の方法。

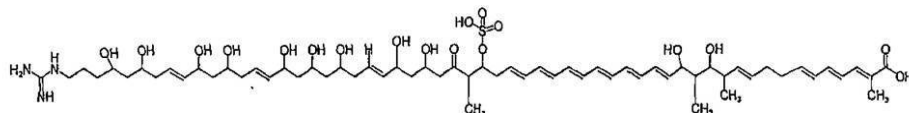
【請求項13】

治療上有効な量の、請求項1～10のいずれか記載の化合物及び薬学的に許容される担体を含有する医薬組成物。

【請求項14】

治療上有効な量の化合物

【化16】

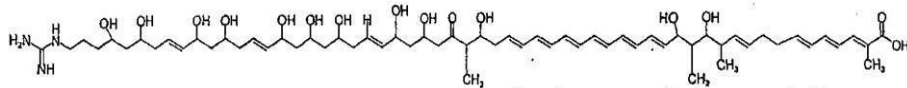


又は薬学的に許容されるその塩、及び薬学的に許容される担体を含有する医薬組成物。

【請求項15】

治療上有効な量の化合物

【化17】



又は薬学的に許容されるその塩、及び薬学的に許容される担体を含有する医薬組成物。

【請求項16】

治療上有効な量の請求項1～10のいずれか記載の化合物を有効成分として含有する、腫瘍増殖の治療用医薬組成物。

【請求項17】

前記腫瘍増殖が、白血病、非小細胞肺癌、直腸がん、中枢神経系（CNS）がん、黒色腫、卵巣がん、腎臓がん、前立腺がん、及び乳がんを含む群から選択されることを特徴とする、請求項16記載の医薬組成物。

【請求項18】

治療上有効な量の請求項1～10のいずれか記載の化合物を有効成分として含有する、真菌感染症の治療用医薬組成物。

【請求項19】

哺乳動物に使用するための請求項18記載の医薬組成物。

【請求項20】

前記真菌感染症が、カンジダ・アルビカンス（C. albicans）により引き起こされることを特徴とする、請求項18又は19記載の医薬組成物。

【請求項21】

前記真菌感染症が、カンジダ菌種（Candida sp.）により引き起こされ、かつ該カンジダ菌種が、カンジダ・グラブラタ（C. glabrata）；カンジダ・ルシタニエ（C. lusitaniae）；カンジダ・パラプシロシス（C. parapsilosis）；カンジダ・クルセイ（C. krusei）；及び

カンジダ・トロピカリス(C. tropicalis)からなる群から選択されることを特徴とする、請求項 18 又は 19 記載の医薬組成物。

【請求項 22】

前記真菌感染症が、フサリウム属菌(Fusarium spp.)；セドスポリウム属菌(Scedosporium spp.)；クリプトコッカス属菌(Cryptococcus spp.)；ムコール亜種(Mucor spp.)；ヒストプラズマ属菌(Histoplasma spp.)；トリコスポロン属菌(Trichosporon spp.)；ブラストミセス属菌(Blastomyces spp.)；又はサッカロミセス・セレビシエ(S. cerevisiae)によって引き起こされることを特徴とする、請求項 18 又は 19 記載の医薬組成物。

【請求項 23】

治療上有効な量の請求項 1～10 のいずれか記載の化合物を有効成分として含有する、真菌感染症に罹患した対象に使用するための真菌感染症の治療用医薬組成物。

【請求項 24】

前記真菌感染症が、カンジダ・アルビカンズ；カンジダ菌種；アスペルギルス菌種(Aspergillus sp.)；フサリウム属菌；セドスポリウム属菌；クリプトコッカス属菌；ムコール亜種；ヒストプラズマ属菌；トリコスポロン属菌；ブラストミセス属菌；及びサッカロミセス・セレビシエからなる群から選択される真菌によって引き起こされることを特徴とする、請求項 23 記載の医薬組成物。

【請求項 25】

前記カンジダ菌種が、カンジダ・グラブラタ；カンジダ・ルシタニエ；カンジダ・パラブシロシス；カンジダ・クルセイ；及びカンジダ・トロピカリスからなる群から選択されることを特徴とする、請求項 24 記載の医薬組成物。