

【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22年5月6日 (2010.5.6)

【公表番号】特表2001-515060(P2001-515060A)

【公表日】平成13年9月18日 (2001.9.18)

【出願番号】特願2000-509683(P2000-509683)

【国際特許分類】

C 0 7 C 211/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

A 6 1 K 47/28 (2006.01)

C 0 7 C 229/16 (2006.01)

C 0 7 C 237/10 (2006.01)

C 1 2 N 15/09 (2006.01)

A 6 1 K 9/127 (2006.01)

A 6 1 K 48/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 211/14

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 47/28

C 0 7 C 229/16

C 0 7 C 237/10

C 1 2 N 15/00

A

A 6 1 K 9/127

A 6 1 K 48/00

【誤訳訂正書】

【提出日】平成22年3月8日 (2010.3.8)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】請求項 1

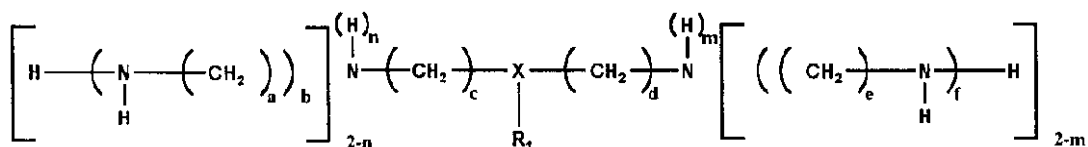
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【請求項 1】一般式 I の化合物：

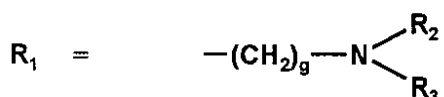
式 I：

【化 1】



不斉中心が存在する時に D -、L - または D L - 形態で存在し、その塩を含み、ここで R₁ は次の一般式の脂肪親和性の残基であり：

【化 2】



式中 R_2 および R_3 が互いに独立してドデシル、ドデセニル、テトラデシル、テトラデセニル、ヘキサデシル、ヘキサデセニル、オクタデシル、オクタデセニルであるか、又は飽和若しくは不飽和であってもよく、分枝若しくは非分枝又はフッ素化若しくは非フッ素化されていてもよい、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29 または 30 個の炭素原子からなる他のアルキル残基であり、

かつ X は次の基の 1 つであり：

【化 3】



式中 $m = 0$ かつ $n = 0$ であり、この場合には $g = 5、6、7$ または 8 、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または 6 とすることができ、または

式中 $m = 0$ かつ $n = 1$ であり、この場合には $g = 5、6、7$ または 8 、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または 6 とすることができ、または

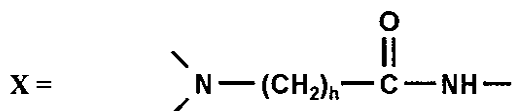
式中 $m = 0$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 5、6、7$ または 8 、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または 6 とすることができ、または

式中 $m = 1$ かつ $n = 1$ であり、この場合には $g = 5、6、7$ または 8 、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または 6 とすることができ、または

式中 $m = 1$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 5、6、7$ または 8 、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または 6 とすることができ、または

式中 $m = 2$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 5、6、7$ または 8 、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または 6 とすることができ、または

【化 4】



式中 $m = 0$ かつ $n = 0$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または 8 、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または 6 および $h = 0、1、2、3、4、5$ または 6 とすることができ、

または

式中 $m = 0$ かつ $n = 1$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または 8 、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $e = 0、1、2$

、3、4、5または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6および $h = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

式中 $m = 0$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6および $h = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

式中 $m = 1$ かつ $n = 1$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6および $h = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

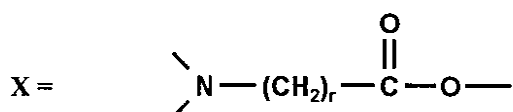
式中 $m = 1$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6および $h = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

式中 $m = 2$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6および $h = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

【化5】



式中 $m = 0$ かつ $n = 0$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6および $r = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

式中 $m = 0$ かつ $n = 1$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6および $r = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

式中 $m = 0$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6および $r = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

式中 $m = 1$ かつ $n = 1$ であり、この場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 および $r = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、

または

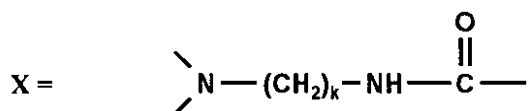
式中 $m = 1$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 および $r = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、

または

式中 $m = 2$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 および $r = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、

または

【化 6】



式中 $m = 0$ かつ $n = 0$ であり、この場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $k = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、

または

式中 $m = 0$ かつ $n = 1$ であり、この場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $k = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、

または

式中 $m = 0$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $k = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、

または

式中 $m = 1$ かつ $n = 1$ であり、この場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $k = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、

または

式中 $m = 1$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0$

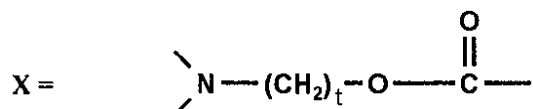
、1、2、3、4、5または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $k = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

式中 $m = 2$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $k = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

【化7】



式中 $m = 0$ かつ $n = 0$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $t = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

式中 $m = 0$ かつ $n = 1$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $t = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

式中 $m = 0$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $t = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

式中 $m = 1$ かつ $n = 1$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $t = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

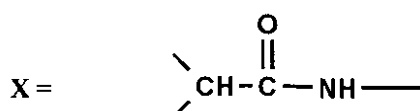
式中 $m = 1$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $t = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

式中 $m = 2$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $t = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

【化 8】



式中 $m = 0$ かつ $n = 0$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または 8 、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または 6 とすることができ、

または

式中 $m = 0$ かつ $n = 1$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または 8 、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または 6 とすることができ、

または

式中 $m = 0$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または 8 、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または 6 とすることができ、

または

式中 $m = 1$ かつ $n = 1$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または 8 、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または 6 とすることができ、

または

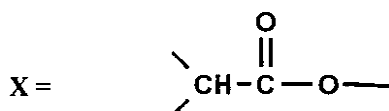
式中 $m = 1$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または 8 、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または 6 とすることができ、

または

式中 $m = 2$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または 8 、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または 6 とすることができ、

または

【化 9】



式中 $m = 0$ かつ $n = 0$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または 8 、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または 6 とすることができ、

または

式中 $m = 0$ かつ $n = 1$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または 8 、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または 6 、 $e = 0、1、2$

、3、4、5または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、
または

式中 $m = 0$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

式中 $m = 1$ かつ $n = 1$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

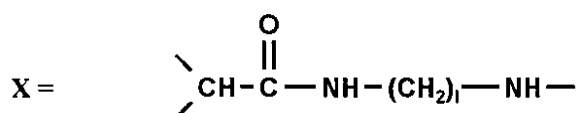
または

式中 $m = 1$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、または

式中 $m = 2$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

【化10】



式中 $m = 0$ かつ $n = 0$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6および $l = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

式中 $m = 0$ かつ $n = 1$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6および $l = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

式中 $m = 0$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6および $l = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

式中 $m = 1$ かつ $n = 1$ であり、この場合には $g = 1、2、3、4、5、6、7$ または8、 $a = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $b = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $c = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $d = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $e = 0、1、2、3、4、5$ または6、 $f = 0、1、2、3、4、5$ または6および $l = 0、1、2、3、4、5$ または6とすることができ、

または

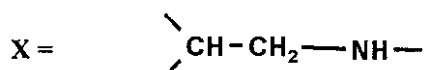
式中 $m = 1$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 および $l = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、

または

式中 $m = 2$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 および $l = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、

または

【化 1 1】



式中 $m = 0$ かつ $n = 0$ であり、この場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、

または

式中 $m = 0$ かつ $n = 1$ であり、この場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、

または

式中 $m = 0$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、

または

式中 $m = 1$ かつ $n = 1$ であり、この場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、

または

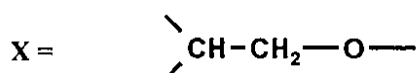
式中 $m = 1$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、

または

式中 $m = 2$ かつ $n = 2$ であり、この場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、

または

【化 1 2】



式中 $m = 0$ および $n = 0$ であり、かつこの場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、または

式中 $m = 0$ および $n = 1$ であり、かつこの場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、または

式中 $m = 0$ および $n = 2$ であり、かつこの場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、または

式中 $m = 1$ および $n = 1$ であり、かつこの場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、または

式中 $m = 1$ および $n = 2$ であり、かつこの場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、または

式中 $m = 2$ および $n = 2$ であり、かつこの場合には $g = 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7$ または 8 、 $a = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $b = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $c = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $d = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $e = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 、 $f = 0, 1, 2, 3, 4, 5$ または 6 とすることができ、

ただし、上記の全ての場合において、 $a = 0$ のとき、 b は 1 より小さいか、もしくは 1 と等しく、 $e = 0$ のとき、 f は 1 より小さいか、もしくは 1 と等しく、かつ $a = b = c = d = e = f = 0$ の場合が除外される。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0020

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0020】

説明として次の仮説を利用することができる。いわゆる DNA 脂質複合体の形成が証明されたことは、成功を収めたトランスフェクションにとって特別重要な定義をもつ。リボソームまたはミセル製剤として使用される DNA および陽イオン脂質が一致する場合、陽イオン脂質のリボソームまたはミセル状の有機体構造の破壊下で DNA の自発的な凝集を生じる。DNA が前記脂質から成る“二重層構造”を有する多層複合体に植込まれた DNA 脂質複合体が形成される (J. O. Raedler ら、科学、第 275 号、810 頁、1997 年)。たとえばスperlミン基が DNA 親和性の頭基として最初に 1 回 DNA に結合すると、その結果ファンデルワールス力を介して安定した“二重層構造”を形成できる

ようにするため、アルキル基が可能な限り平行に配向できるようにしなければならないので、残留分子部（親和性の残基）の弾性および対称性が特に重要になる。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0027

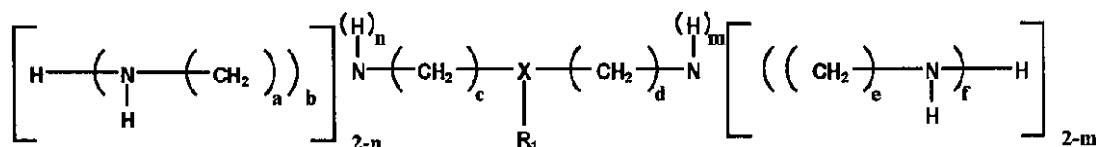
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0027】

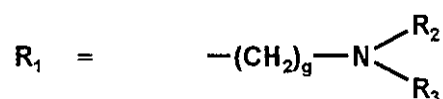
式 I :

【化 3 1】



不斉中心が存在する時に D -、L - または D L - 形態で存在し、その塩を含み、ここで R₁ は次の一般式の脂肪親和性の残基であり：

【化 3 2】



【誤訳訂正 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0046

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0046】

さらに特に重要なものは、たとえばジオレオイルホスファチジルエタノールアミン（D O P E）、ジオレオイルホスファチジルコリン、コレステロールまたはコレステリルアミンのようなコリピドを含むまたは含まない本発明に基づく化合物の少なくとも1つを含有する組成または製剤（リボソームまたはミセル類を含有）である。この組成または製剤（リボソームまたはミセル類を含有）は通常添加物、担体、佐剤などを含有することができる。

【誤訳訂正 5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0047

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0047】

さらに特に重要なものは、DNA、RNA、リボザイム、アンチセンスDNA、PNA、ペプチド類、ペプトイド類およびタンパク質類のような生物学的に実効のある化合物を組入れるための方法であって、その際本発明に基づく化合物、組成または製剤が組入れる（生物学的に活性の）化合物と複合体を形成し、かつ発生した複合体が真核細胞と生体内または試験管内で接触させられる。

【誤訳訂正 6】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0048

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0048】

さらに特に重要なものは、DNA、RNA、リボザイム、アンチセンスDNA、PNA、ペプチド類、ペプトイド類およびタンパク質類のような生物学的に実効のある化合物を真核細胞の中に生体内または試験管内で組入れるための本発明に基づく化合物、組成または製剤（薬剤または試薬を製造するため）の使用である。

さらに特に重要なものは、本発明の化合物の作用を補強する、いわゆる‘エンハンサー’と組合せた、DNA、RNA、リボザイム、アンチセンスDNA、PNA、ペプチド類、ペプトイド類およびタンパク質類のような生物学的に実効のある化合物を真核細胞の中に生体内または試験管内で組入れるための本発明に基づく化合物、組成または製剤（薬剤または試薬を製造するため）の使用である。

【誤訳訂正 7】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0070

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0070】

DNA結合剤とも呼ばれる（たとえばポリリシンなどの）ポリ陽イオンが標的に向けて特定の細胞の表面レセプタに結合する、いわゆる内部化因子（たとえば特定の糖タンパク質）に結合する標的に合せてレセプタを仲介した細胞内取込（Wuら、化学誌、第262号、4429-4432頁、1987年）に比べ、本発明に基づく脂質もしくはそのリボソーム製剤は細胞特異性がない。本発明に基づく脂質もしくはそのリボソーム製剤による標的に合せた供給は、脂質および輸送する生物分子の帯電が調整され、かつ生物分子と脂質間の凝集物に追加して内部化因子が取込まれることにより達成することができる。これはコリピドが頭基としてこのような内部化因子をもつ場合、コリピドによるリボソーム製剤により達成することができる。もう1つ別の可能性は生物分子、脂質および内部化因子から成る中性の帯電に調整された凝集物である。いわゆる内部化因子はトランスフェリン、ガラクトース、マンノース、マンノース-6-ホスフェート、アシアルグリコプロテイン、コンアルブミン、レクチン、トランスコバラミン、-2-マクログロブリン、ビオチン、葉酸、マンノース化グリコプロテインである。その他の因子はEP0535576、EP0544292、WO9421808で取出すものとし、この中に引用して採録されている。内部化因子と同様に細胞特異性の抗体も使用することができる。

【誤訳訂正 8】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0089

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0089】

例 4：

リボソーム/ミセル製剤

ジオレオイルホスファチジルエタノールアミン、ジオレオイルホスファチジルコリン、コレステロールまたはコレステリルアミンが有機溶剤（たとえばクロロホルム）に溶解される。例 1 からの脂質がそれ自体としてまたは塩の形態で、たとえばトリフルオロ酢酸塩の形態で有機溶剤（たとえばクロロホルム）の中に溶解される。異なる溶液を種々の量で組合せることにより、コリピドと触媒脂質とから成る種々の組成が製造される。ガラスフラスコの中に回転蒸発器を利用して脂質薄膜が作られる。この薄膜が高真空中で溶剤残基から遊離される。この薄膜は溶液 1 ml あたり脂質 2 mg の濃度になるまで水または水性緩衝剤で水素化される。その後、冷却しながら超音波（3 x 15 分）で処理される。この製剤がフィルタ（孔径 0.2 μm）に殺菌濾過される。

【誤訳訂正 9】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0092

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0092】

例7：

トランスフェクション

細胞が密度 $1 \sim 1.5 \times 10^5$ を有する12-ウェル-微量滴定プレート上で滴出され、かつ夜通し約60～80%の合流に培養される。細胞を‘ウェル’に転移させるために、 $1.5 \mu\text{g}$ の pCMV<スポーツ>-ガルが $50 \mu\text{l}$ 血清および抗生物質を含有しない DMEM に溶解される。エタノール溶液またはリポソーム製剤としての陽イオン脂質（たとえば3、6、9、 $12 \mu\text{l}$ ）が同様に $50 \mu\text{l}$ 血清および抗生物質を含有しない DMEM に溶解される。この両方の溶液がポリスチレン容器の中で混合され、かつ脂質/DNA 複合体の形成を可能にするため、10～15分間放置される。

【誤訳訂正10】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0094

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0094】

結果

下表および以下の棒グラフはヘラS3細胞の例を比較したトランスフェクション効率を示す。

トランスフェクション試薬1：

N-[2,5-ビス((3-アミノプロピル)アミノ)-1-オキソペンチル]-N',N'-ジオクタデシルエチレン-ジアミン(TFA塩)がリポソーム製剤として25mol%ジオレオイルホスファチジルエタノールアミンで水性滅菌溶液の中に使用された。

全脂質量：2mg/ml。

【誤訳訂正11】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0095

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0095】

トランスフェクション試薬2：

N',N'-ビス-(3-アミノプロピル)N,N'-ジオクタデシルエチレン-ジアミン(TFA塩)がリポソーム製剤として50mol%ジオレオイルホスファチジルエタノールアミンで水性滅菌溶液の中に使用された。全脂質量：2mg/ml。