

【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5年6月21日(2023.6.21)

【国際公開番号】WO2020/232037

【公表番号】特表2022-532734(P2022-532734A)

【公表日】令和4年7月19日(2022.7.19)

【年通号数】公開公報(特許)2022-130

【出願番号】特願2021-568113(P2021-568113)

【国際特許分類】

A 6 1 K 3 1 / 5 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 3 1 / 1 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 7 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 1 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 3 / 0 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

10

【F I】

A 6 1 K 3 1 / 5 8

A 6 1 P 3 1 / 1 0

A 6 1 P 1 7 / 0 0 1 0 1

A 6 1 P 1 1 / 0 0

A 6 1 P 1 / 0 0

A 6 1 P 1 3 / 0 2 1 0 5

20

【手続補正書】

【提出日】令和5年6月13日(2023.6.13)

【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

30

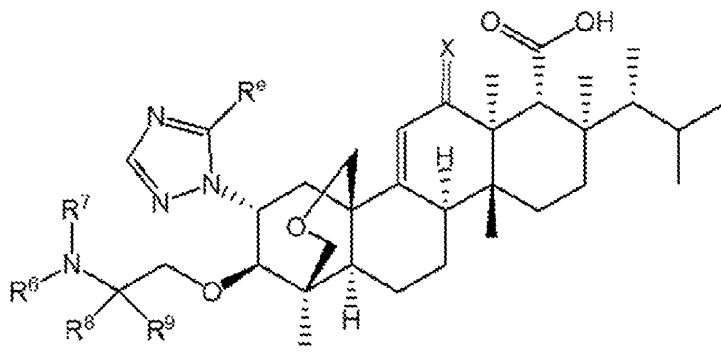
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

カンジダ・アウリス(Candida auris)によってコロニー形成された対象者の解剖学的領域からカンジダ・アウリス(Candida auris)を脱コロニー化するための医薬組成物であって、下記式(I)の化合物又は該化合物の薬学的に許容される塩若しくは水和物を含む医薬組成物。

【化1】



(I)

40

[ 式 中 、

50

XはO又はH、Hであり；

R<sup>e</sup>は、C(O)NR<sup>f</sup>R<sup>g</sup>又は1個若しくは2個の窒素原子を含む6員環ヘテロアリアル基であり、前記ヘテロアリアル基は、環炭素上でフルオロ又はクロロにより、又は環窒素上で酸素によりモノ置換されていても良く；

R<sup>f</sup>、R<sup>g</sup>、R<sup>6</sup>、及びR<sup>7</sup>は、それぞれ独立に水素又はC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルであり；

R<sup>8</sup>はC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>シクロアルキル又はC<sub>4</sub>-C<sub>5</sub>シクロアルキル-アルキルであり；

R<sup>9</sup>はメチル又はエチルであり；

R<sup>8</sup>とR<sup>9</sup>が一緒になって、1個の酸素原子を含む6員飽和環を形成していても良い。

]

10

【請求項2】

前記解剖学的領域が皮膚である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

前記解剖学的領域が粘膜組織である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項4】

前記粘膜組織が、呼吸器、消化管又は尿路の粘膜組織である、請求項3に記載の医薬組成物。

【請求項5】

前記対象者がヒト対象者である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項6】

経口投与に用いる、請求項1に記載の医薬組成物。

20

【請求項7】

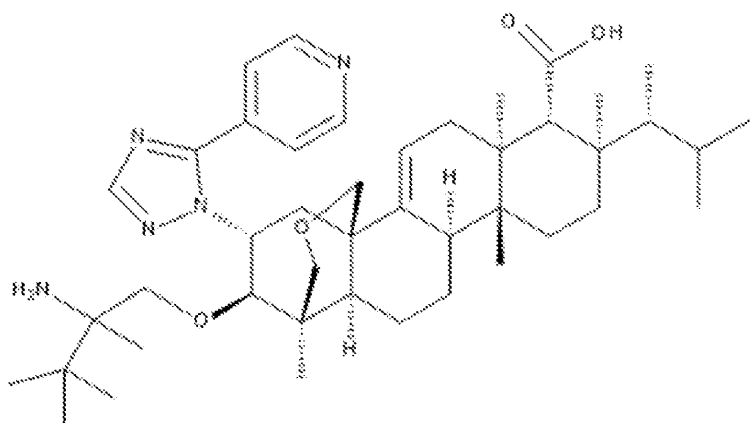
静脈内投与に用いる、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項8】

カンジダ・アウリス (*Candida auris*) によってコロニー形成された対象者の解剖学的領域からカンジダ・アウリス (*Candida auris*) を脱コロニー化するための医薬組成物であって、(1S, 4aR, 6aS, 7R, 8R, 10aR, 10bR, 12aR, 14R, 15R) - 15 - [ [ 2 - アミノ - 2, 3, 3 - トリメチルブチル ] オキシ ] - 8 - [ ( 1R ) - 1, 2 - ジメチルプロピル ] - 14 - [ 5 - ( 4 - ピリジニル ) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル ] - 1, 6, 6a, 7, 8, 9, 10, 10a, 10b, 11, 12, 12a - ドデカヒドロ - 1, 6a, 8, 10a - テトラメチル - 4H - 1, 4a - プロパン - 2H - フェナントロ [ 1, 2 - c ] ピラン - 7 - カルボン酸である下記式 (II) の化合物又は該化合物の薬学的に許容される塩若しくは水和物を含む医薬組成物。

30

【化2】



(II)

40

【請求項9】

前記解剖学的領域が皮膚である、請求項8に記載の医薬組成物。

50

## 【請求項 10】

前記解剖学的領域が粘膜組織である、請求項 8 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 11】

前記粘膜組織が、呼吸器、消化管又は尿路の粘膜組織である、請求項 10 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 12】

前記対象者がヒト対象者である、請求項 8 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 13】

経口投与に用いる、請求項 8 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 14】

静脈投与に用いる、請求項 8 に記載の医薬組成物。

10

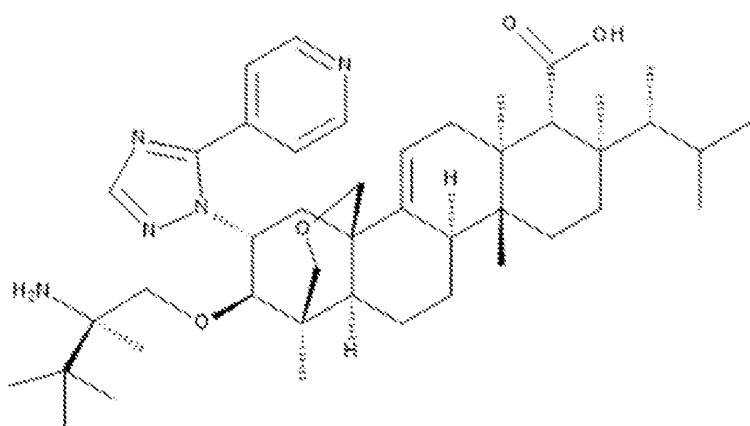
## 【請求項 15】

カンジダ・アウリス (*Candida auris*) によってコロニー形成された対象者の解剖学的領域からカンジダ・アウリス (*Candida auris*) を脱コロニー化するための医薬組成物であって、(1S, 4aR, 6aS, 7R, 8R, 10aR, 10bR, 12aR, 14R, 15R) - 15 - [ [(2R) - 2 - アミノ - 2, 3, 3 - トリメチルブチル] オキシ] - 8 - [ (1R) - 1, 2 - ジメチルプロピル] - 14 - [ 5 - (4 - ピリジニル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル] - 1, 6, 6a, 7, 8, 10, 10a, 10b, 11, 12, 12a - ドデカヒドロ - 1, 6a, 8, 10a - テトラメチル - 4H - 1, 4a - プロパン - 2H - フェナントロ [ 1, 2 - c ]

20

ピラン - 7 - カルボン酸である下記式 (IIa) の化合物又は該化合物の薬学的に許容される塩若しくは水和物を含む医薬組成物。

## 【化 3】



30

(IIa)

## 【請求項 16】

前記解剖学的領域が皮膚である、請求項 15 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 17】

前記解剖学的領域が粘膜組織である、請求項 15 に記載の医薬組成物。

40

## 【請求項 18】

前記粘膜組織が、呼吸器、消化管又は尿路の粘膜組織である、請求項 17 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 19】

前記対象者がヒト対象者である、請求項 15 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 20】

経口投与に用いる、請求項 15 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 21】

静脈投与に用いる、請求項 15 に記載の医薬組成物。

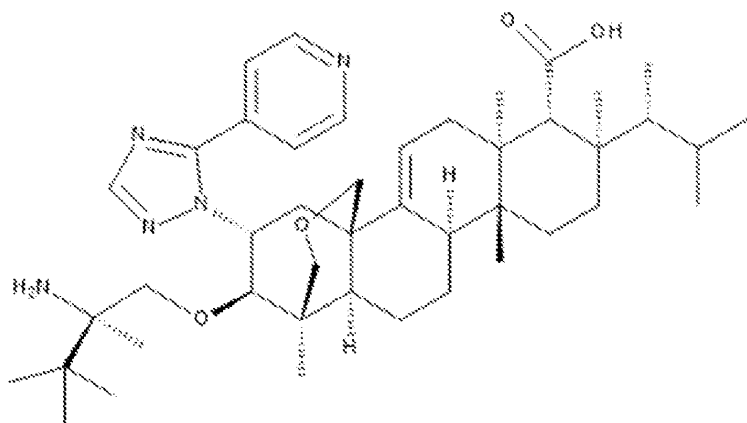
50

## 【請求項 2 2】

カンジダ・アウリス ( *Candida auris* ) によってコロニー形成されたヒト対象者の解剖学的領域からカンジダ・アウリス ( *Candida auris* ) を脱コロニー化するための医薬組成物であって、( 1 S , 4 a R , 6 a S , 7 R , 8 R , 1 0 a R , 1 0 b R , 1 2 a R , 1 4 R , 1 5 R ) - 1 5 - [ [ ( 2 R ) - 2 - アミノ - 2 , 3 , 3 - トリメチルブチル ] オキシ ] - 8 - [ ( 1 R ) - 1 , 2 - ジメチルプロピル ] - 1 4 - [ 5 - ( 4 - ピリジニル ) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ] - 1 , 6 , 6 a , 7 , 8 , 9 , 1 0 , 1 0 a , 1 0 b , 1 1 , 1 2 , 1 2 a - ドデカヒドロ - 1 , 6 a , 8 , 1 0 a - テトラメチル - 4 H - 1 , 4 a - プロパン - 2 H - フェナントロ [ 1 , 2 - c ] ピラン - 7 - カルボン酸である下記式 ( I I a ) の化合物を含む医薬組成物。

10

## 【化 4】



20

(IIa)

## 【請求項 2 3】

前記解剖学的領域が皮膚である、請求項 2 2 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 4】

前記解剖学的領域が粘膜組織である、請求項 2 2 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 2 5】

前記粘膜組織が、呼吸器、消化管又は尿路の粘膜組織である、請求項 2 4 に記載の医薬組成物。

30

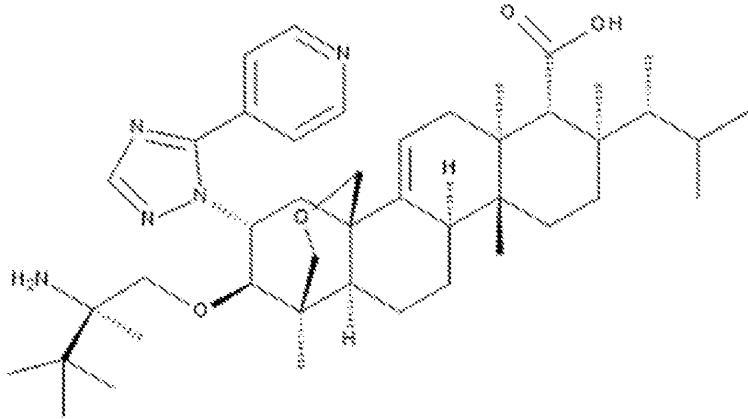
## 【請求項 2 6】

カンジダ・アウリス ( *Candida auris* ) によってコロニー形成されたヒト対象者の解剖学的領域からカンジダ・アウリス ( *Candida auris* ) を脱コロニー化するための医薬組成物であって、下記式 ( I I a ) の化合物の薬学的に許容される塩を含む医薬組成物。

40

50

## 【化5】



10

(IIa)

[ 当該化合物は、(1S, 4aR, 6aS, 7R, 8R, 10aR, 10bR, 12aR, 14R, 15R) - 15 - [ [(2R) - 2 - アミノ - 2, 3, 3 - トリメチルブチル] オキシ ] - 8 - [ (1R) - 1, 2 - ジメチルプロピル ] - 14 - [ 5 - (4 - ピリジニル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル ] - 1, 6, 6a, 7, 8, 9, 10, 10a, 10b, 11, 12, 12a - ドデカヒドロ - 1, 6a, 8, 10a - テトラメチル - 4H - 1, 4a - プロパン - 2H - フェナントロ [ 1, 2 - c ] ピラン - 7 - カルボン酸である。 ]

20

## 【請求項27】

前記解剖学的領域が皮膚である、請求項26に記載の医薬組成物。

## 【請求項28】

前記解剖学的領域が粘膜組織である、請求項26に記載の医薬組成物。

## 【請求項29】

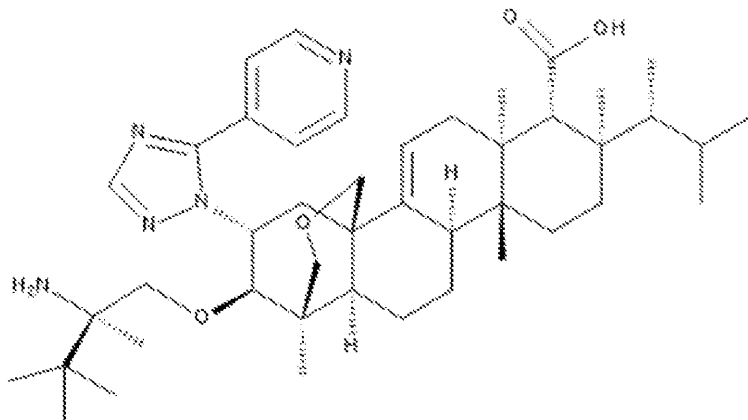
前記粘膜組織が、呼吸器、消化管又は尿路の粘膜組織である、請求項27に記載の医薬組成物。

## 【請求項30】

カンジダ・アウリス (Candida auris) によってコロニー形成されたヒト対象者の解剖学的領域からカンジダ・アウリス (Candida auris) を脱コロニー化するための経口医薬組成物であって、下記式 (IIa) の化合物の薬学的に許容される塩を含む経口医薬組成物。

30

## 【化6】



40

(IIa)

[ 当該化合物は (1S, 4aR, 6aS, 7R, 8R, 10aR, 10bR, 12aR, 14R, 15R) - 15 - [ [(2R) - 2 - アミノ - 2, 3, 3 - トリメチルブチル

50

] オキシ ] - 8 - [ ( 1 R ) - 1 , 2 - ジメチルプロピル ] - 1 4 - [ 5 - ( 4 - ピリジニル ) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ] - 1 , 6 , 6 a , 7 , 8 , 9 , 1 0 , 1 0 a , 1 0 b , 1 1 , 1 2 , 1 2 a - ドデカヒドロ - 1 , 6 a , 8 , 1 0 a - テトラメチル - 4 H - 1 , 4 a - プロパン - 2 H - フェナントロ [ 1 , 2 - c ] ピラン - 7 - カルボン酸であり、

前記解剖学的領域は皮膚又は粘膜組織である。]

【請求項 3 1】

前記薬学的に許容される塩が、前記式 ( I I a ) の化合物のクエン酸塩である、請求項 3 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 2】

錠剤の投与形態である、請求項 3 0 に記載の医薬組成物。

10

20

30

40

50