

【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6年8月16日(2024.8.16)

【国際公開番号】WO2022/035752
【公表番号】特表2023-537921(P2023-537921A)
【公表日】令和5年9月6日(2023.9.6)
【年通号数】公開公報(特許)2023-168
【出願番号】特願2023-508551(P2023-508551)
【国際特許分類】

10

C 0 7 H 1 7 / 0 8 (2 0 0 6 . 0 1)
A 6 1 K 3 1 / 7 0 4 8 (2 0 0 6 . 0 1)
A 6 1 P 3 1 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)

【F I】

C 0 7 H 1 7 / 0 8 K C S P
A 6 1 K 3 1 / 7 0 4 8
A 6 1 P 3 1 / 1 0

【手続補正書】
【提出日】令和6年8月7日(2024.8.7)

20

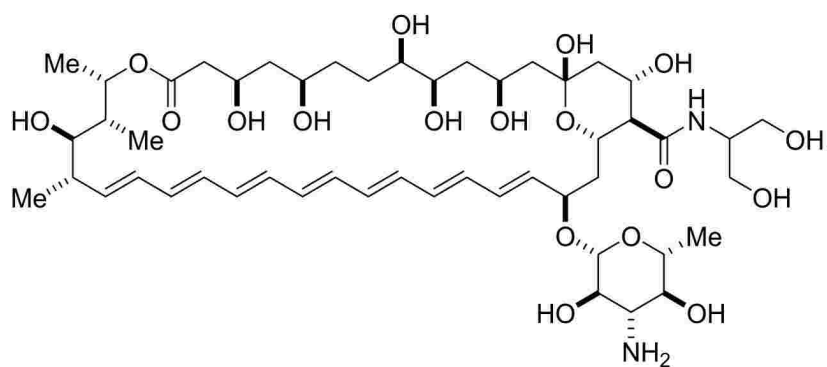
【手続補正1】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項1】

30

40

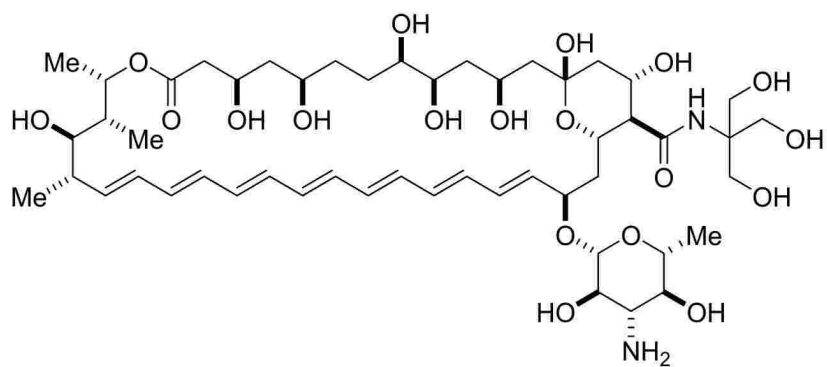
50

【化 1】



10

、及び

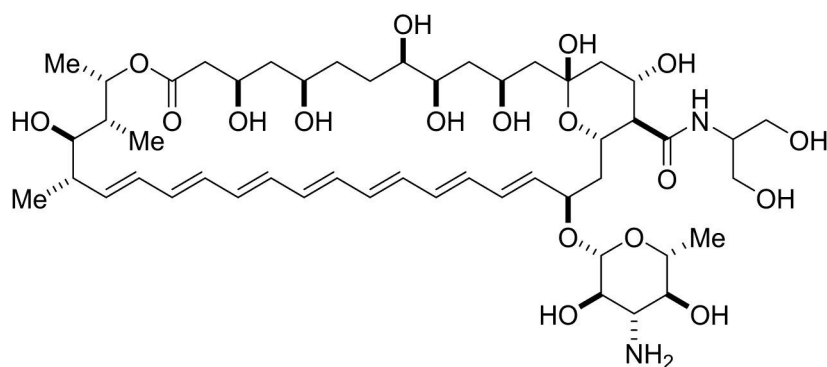


20

またはそれらの薬学的に許容される塩からなる群から選択される、化合物。

【請求項 2】

【化 2】



30

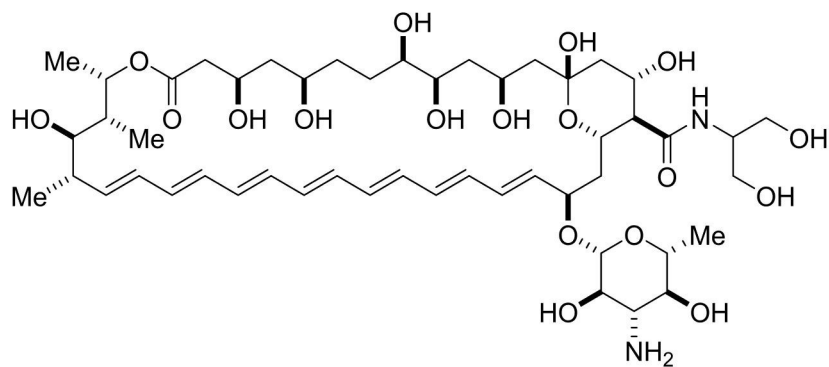
40

またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

50

【化 3】

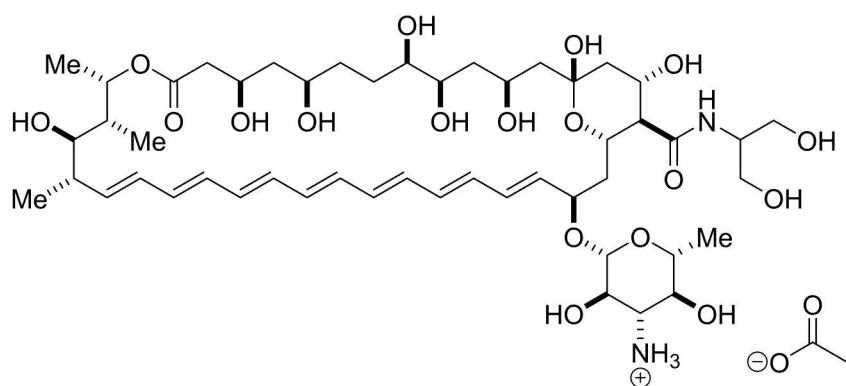


10

である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

【化 4】



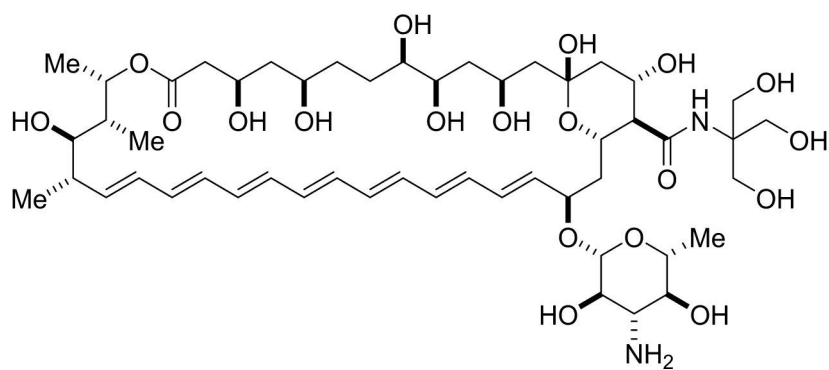
20

30

である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

【化 5】



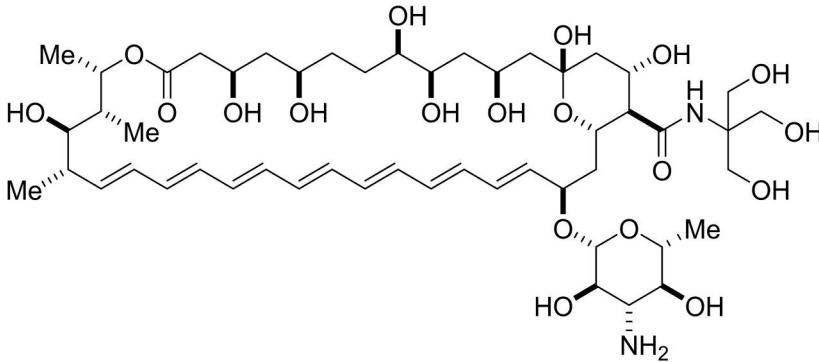
40

またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物。

50

【請求項 6】

【化 6】



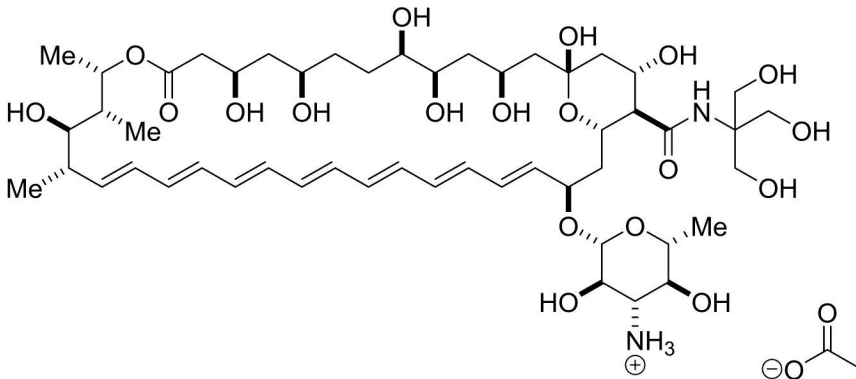
10

である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

【化 7】

20



30

である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物と、薬学的に許容される担体とを含む、医薬組成物。

【請求項 9】

静脈投与剤形である、請求項 8 に記載の医薬組成物。

40

【請求項 10】

経口剤形である、請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物を含む、真菌感染症を治療するための組成物。

【請求項 12】

静脈内投与される、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 13】

経口投与される、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 14】

50

真菌感染症の治療のための薬剤の製造における、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0197

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0197】

耐性試験（図 23）：健康なマウスを 3 匹 / グループに分けた。すべての動物をシクロホスファミド（150 mg / kg）で - 2 日目と + 3 日目に、酢酸コルチゾン（250 mg / kg）で - 1 日目と + 6 日目に好中球減少症に変換した。化合物 3 及びアンピソームの目標投与量を IP として毎日 7 日間投与し、生存率を 14 日間監視した。

10

目的：免疫不全モデルにおける化合物 3 及び AmB 投薬 IP の耐性

感染なし、忍容性試験のみ

n = 3 マウス / グループ

シクロホスファミド：150 mg / kg - 2 日目及び + 3 日目

酢酸コルチゾン：250 mg / kg 日 - 1 及び + 6

それぞれの薬剤を 7 日間 IP 投与した

マウスを 14 日間観察した

生存率：

20

化合物 3 15 mg / kg QD：66%

化合物 3 25 mg / kg QD：100%

化合物 3 35 mg / kg QD：100%

化合物 3 45 mg / kg QD：66%

AmB 25 mg / kg QD：66%

留意点：

臨床的に、45 mg / kg の化合物 3 及び 25 mg / kg の AmB IP は、D3 ~ D12 に始まる同様の無気力及び荒れた毛皮の徴候を示した。25 ~ 35 mg / kg の化合物 3 は、マウスの摂食能力、清潔を保つ能力、及び実験全体の活動に影響を与えなかったが、45 mg / kg では影響があった。感染モデルにおいて、35 mg / kg の化合物 3 投与 IP を 7 日間使用することができる。

30

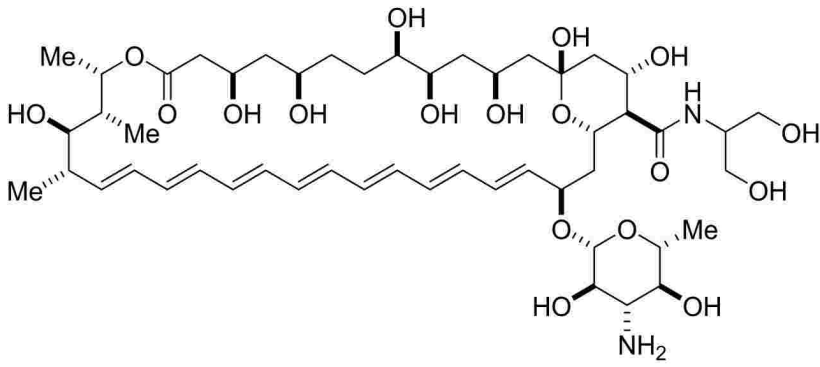
最後に、本発明の好ましい実施態様を項分け記載する。

[実施態様 1]

40

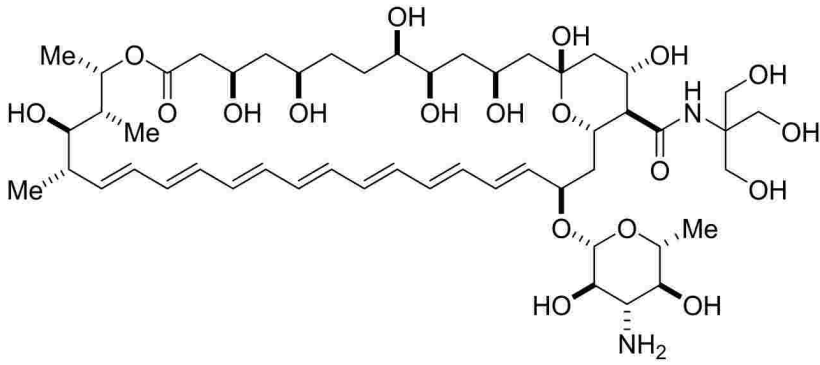
50

【化 2 2】



10

、及び

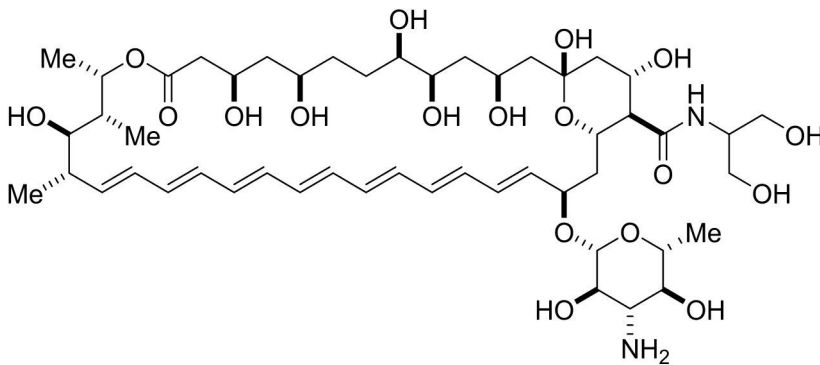


20

またはそれらの薬学的に許容される塩からなる群から選択される、化合物。

[実施態様 2]

【化 2 3】



30

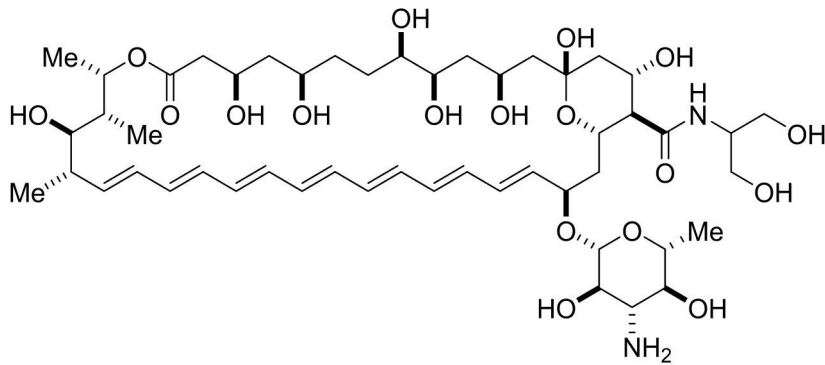
40

またはその薬学的に許容される塩である、実施態様 1 に記載の化合物。

[実施態様 3]

50

【化 2 4】

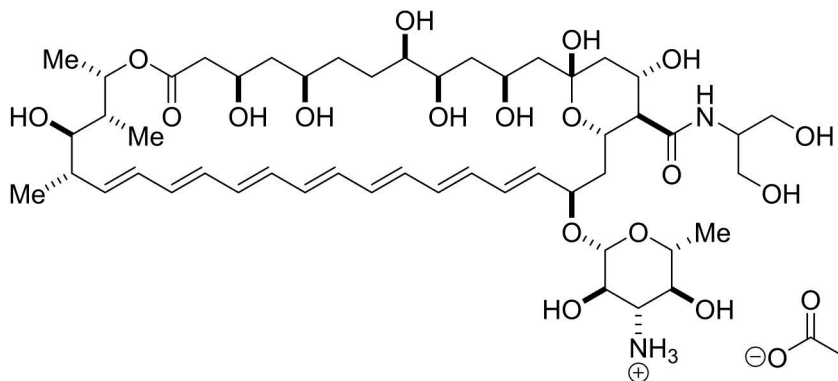


10

である、実施態様 1 に記載の化合物。

[実施態様 4]

【化 2 5】



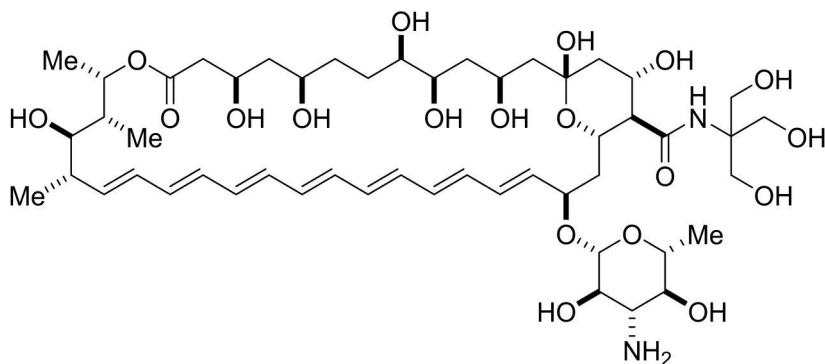
20

30

である、実施態様 1 に記載の化合物。

[実施態様 5]

【化 2 6】



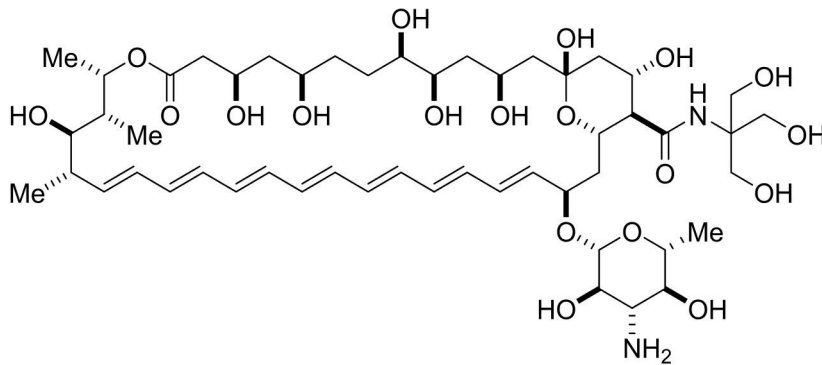
40

またはその薬学的に許容される塩である、実施態様 1 に記載の化合物。

50

[実施態様 6]

【化 2 7】

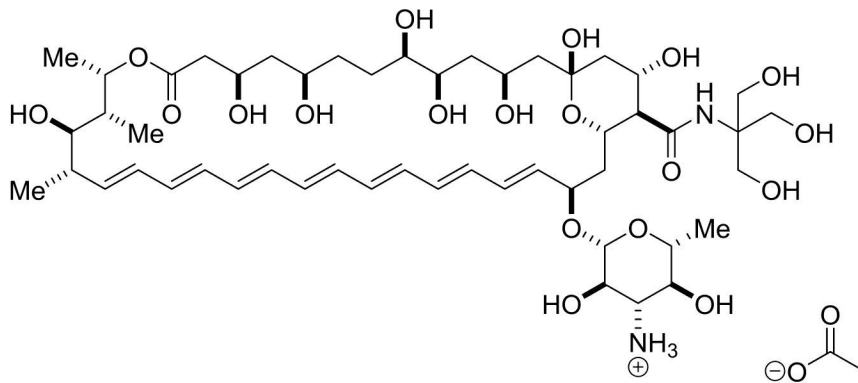


10

である、実施態様 1 に記載の化合物。

[実施態様 7]

【化 2 8】



20

30

である、実施態様 1 に記載の化合物。

[実施態様 8]

実施態様 1 ~ 7 のいずれかに記載の化合物と、薬学的に許容される担体とを含む、医薬組成物。

[実施態様 9]

静脈投与剤形である、実施態様 8 に記載の医薬組成物。

40

[実施態様 10]

経口剤形である、実施態様 8 に記載の医薬組成物。

[実施態様 11]

真菌感染症を治療する方法であって、治療有効量の実施態様 1 ~ 7 のいずれかに記載の化合物を、それを必要とする対象に投与し、それによって前記真菌感染症を治療することを含む、前記方法。

[実施態様 12]

前記化合物が静脈内投与される、実施態様 11 に記載の方法。

[実施態様 13]

前記化合物が経口投与される、実施態様 11 に記載の方法。

50

[実施態様 1 4]

真菌感染症の治療のための薬剤の製造における、実施態様 1 ~ 7 のいずれかに記載の化合物の使用。

[実施態様 1 5]

薬剤として使用するための、実施態様 1 ~ 7 のいずれかに記載の化合物。

[実施態様 1 6]

真菌感染症の治療に使用するための、実施態様 1 ~ 7 のいずれかに記載の化合物。

10

20

30

40

50