【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14日(2007.6.14)

【公表番号】特表2002-543058(P2002-543058A)
【公表日】平成14年12月17日(2002.12.17)
【出願番号】特願2000-613816(P2000-613816)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ　38/00　　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　17/06　　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　35/00　　(2006.01)
Ｃ０７Ｃ 237/12　　(2006.01)
Ｃ０７Ｃ 271/22　　(2006.01)
Ｃ０７Ｋ　 5/00　　(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ　37/02
Ａ６１Ｐ　17/06
Ａ６１Ｐ　35/00
Ｃ０７Ｃ 237/12
Ｃ０７Ｃ 271/22
Ｃ０７Ｋ　 5/00

【誤訳訂正書】
【提出日】平成19年4月19日(2007.4.19)
【誤訳訂正１】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】０００６
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【０００６】
アミノ保護基とは、好ましくはベンジルオキシカルボニル、シクロアルキルアルコキシカルボニル、特にシクロヘキシルメトキシカルボニル、またはtert-ブトキシカルボニルである。非置換または置換ヘテロアリールアルキルは、好ましくはピリジルアルキル、とりわけ２－ピリジルメチルおよび４－ピリジルメチルである。
【誤訳訂正２】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】００１５
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【００１５】
R_1は、好ましくは水素、ピリジルアルコキシカルボニル、ナフチルアルコキシカルボニル、ナフチルアルキルカルボニル、ベンジル－ＣＨ(ＯＨ)－カルボニル、フェノキシメチルカルボニル、フェニルアルキルカルボニル、または非置換もしくはアルキルもしくはアミノ基によって置換されたtert.－ブトキシカルボニル、シクロアルキルアルコキシカルボニル、特にシクロヘキシルメトキシカルボニルもしくはベンジルオキシカルボニルのようなアミノ保護基である；それは特にナフチルメトキシカルボニル、ナフチルメチルカルボニル、ピリジルメトキシカルボニル、フェニルプロピオニル、アミノフェニルプロピオニル、tert.－ブトキシカルボニル、アミノベンジルカルボニル、アルキルベンジルオキシカルボニル、ジアルキルベンジルオキシカルボニルまたはベンジルオキシカルボニルで、いっそうさらに好ましいのはベンジルオキシカルボニルである。

【誤訳訂正３】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】００３５
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【００３５】
実施例９：{１－［１－ベンジル－２－ヒドロキシ－３－［１－(２－ヒドロキシ－４－メトキシ－ベンジルカルバモイル)－２，２－ジメチル－プロピルカルバモイル］－３－(４－メトキシ－ベンジルアミノ)－プロピルカルバモイル］－２，２－ジメチル－プロピル}－カルバミン酸　ベンジルエステル
表題の化合物は、US 5,538,997の実施例４と同様に合成した。一つの構造単位は、「さらなる中間体」のもと、ステップＣ.ｃ)でＢＯＣ－Ｌ－バリン　p－ニトロフェニルエステルの代わりにＢＯＣ－Ｌ－tert－ロイシン　p－ニトロフェニルエステルを用いることによって合成した。ES-MS(表題の化合物)：841.0［M+H$^+$］；HPLC(システムＡ)は、t_R＝7.22minで単一のピークを示した。
【誤訳訂正４】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】００４３
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【００４３】
本明細書に記載の増殖性疾患を処置する「本発明の化合物」の有用性は下記の試験法で証明し得る。
20Ｓプロテアソームの阻害
「本発明の化合物」は、20Ｓプロテアソームを阻害する。
【誤訳訂正５】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】００５６
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【００５６】
ヌードマウスにおける固形腫瘍の移植：
ドナーマウスを麻酔(Forene「登録商標」，Abbott，Switzerland)し、頸部切断により屠殺した。皮膚を消毒し、腫瘍を切開して摘出する。腫瘍塊の外縁を解剖用メスを用いて除去し、得られた塊を高さ約３－４ｍｍの断片に整えた。３－４ｍｍ^{2}の切片に切り、滅菌された0.9% w/v 塩化ナトリウム中に入れた。壊死している腫瘍の切片は使用しなかった。
【誤訳訂正６】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】００６５
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【００６５】
ホローファイバー・アッセイ：ヌードマウスにおける抗腫瘍評価
この分析評価において、ホローファイバーに包まれた４つの相異なるヒト腫瘍を、ヌードマウス(無胸腺メス異系交配ヌードマウス(Ncr nu/nu))の皮下および／または腹膜内に移植した。次に、動物を適当な賦形剤中に処方されたテスト化合物で処置し、一方、対照動物は賦形剤のみで処置した。実験終了時にファイバーを回収し、生存する細胞数をメタボリック・アッセイ(metabolic assay)(MTT，臭化 3-［4,5-ジメチルチアゾール-2-イル］-2,5-ジフェニルテトラゾリウム)を用いて測定した。テスト化合物の活性は、実験動物

における細胞生長(Ｔ)と賦形剤のみで処置した対照動物における細胞成長(Ｃ)との比較によって測定され、％Ｔ／Ｃとして表される。
【誤訳訂正７】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】００７５
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【００７５】
さらに、本発明は、好ましくは、「本発明の化合物」、ここで
ＡおよびＢは、非置換またはC_1－C_4アルキルもしくはC_1－C_4アルコキシカルボニルC_1－C_4アルキルによって置換されたアミノアシル部分をそれぞれ表し；
R_1は水素；あるいは式R_5Ｙ－基、ここで
R_5は水素；非置換またはフェノキシ、ヒドロキシまたはアミノ基で置換されたC_1－C_4アルキル；C_2－C_4アルケニル；C_2－C_4アルキニル；C_6－C_{10}アリール；非置換またはヒドロキシ、C_1－C_4アルキル、アミノまたはC_1－C_4アルキルアミノで置換されたC_7－C_{12}アリールアルキル；ピリジルC_1－C_4アルキルを表し；およびＹは－Ｏ－ＣＯ－または－ＣＯ－を表し；
R_2はC_7－C_{12}アリールアルキル基を表し；
R_3はハロゲン、C_1－C_4アルキル、C_1－C_4アルコキシまたはヒドロキシC_1－C_4アルコキシ基を表し；および
R_4は非置換または４位がメトキシによって置換された２－ヒドロキシベンジルを表わす；
の利用に関する。
【誤訳訂正８】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】００７６
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【００７６】
さらに好ましくは、本発明は、「本発明の化合物」、ここで
ＡおよびＢは、非置換またはC_1－C_4アルキルまたはC_1－C_4アルコキシカルボニルC_1－C_4アルキルによって置換されたアミノアシル部分をそれぞれ表し；
R_1は水素；あるいは式R_5Ｙ－基、ここで
R_5は水素；非置換またはフェノキシ、ヒドロキシまたはアミノ基で置換されたC_1－C_4アルキル；C_2－C_4アルケニル；C_2－C_4アルキニル；C_6－C_{10}アリール；非置換またはヒドロキシ、C_1－C_4アルキル、アミノもしくはC_1－C_4アルキルアミノ基で置換されたC_7－C_{12}アリールアルキル；ピリジルC_1－C_4アルキルを表し；およびＹは－Ｏ－ＣＯ－または－ＣＯ－を表し；
R_2はC_7－C_{12}アリールアルキル基を表し；
R_3はC_1－C_4アルコキシ基を表し；および
R_4は４位がメトキシによって置換された２－ヒドロキシベンジルを表わす；
の利用に関する。
【誤訳訂正９】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】００８８
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【００８８】
「本発明の化合物」は、伝統的な化学療法で許容される希釈液および担体と混合しても

よく、ならびに液剤、錠剤またはカプセル剤といった形態で、例えば非経口的または静脈注射、好ましくは経口的に投与されてもよい。もちろん、活性物質の濃度は、例えば、使用される「本発明の化合物」、所望の処置および種の性質に依存して変化するであろう。

【誤訳訂正１０】
【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】
そのような組成物は、本発明の一部を形成する。それゆえ、本発明はまた、とりわけ増殖性疾患の処置のため、特にヒトまたは動物の治療的処置に使用するため、医薬品担体と一体となった式I*の「本発明の化合物」を含む医薬組成物に関する。

【誤訳訂正１１】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】００９１
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【００９１】
「エマルション前濃縮物」とは、経口投与後、水性媒体中、例えば水中または胃液中で自発的にエマルションを形成する剤型である。本エマルションは透明で、熱力学的に安定である。親油性相は担体媒体の重量に対して約10から85%を構成でき；界面活性剤は担体媒体の重量に対して約5から80%を構成でき；親水性相は担体媒体の重量に対して約10から50%を構成できる。

【誤訳訂正１２】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】００９９
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【００９９】
v) スルホコハク酸ジオクチルまたはコハク酸ジ－［２－エチルヘキシル］
vi) リン脂質、特にレシチン
vii) プロピレングリコール・モノ－およびジ－脂肪酸エステル