

【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24年3月29日 (2012.3.29)

【公表番号】特表2008-504292(P2008-504292A)

【公表日】平成20年2月14日 (2008.2.14)

【年通号数】公開・登録公報2008-006

【出願番号】特願2007-518351(P2007-518351)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 37/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

C 0 7 D 239/94 (2006.01)

C 0 7 D 405/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/517

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 45/00 1 0 1

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 37/00

A 6 1 P 37/04

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 43/00 1 0 7

A 6 1 P 43/00 1 2 1

C 0 7 D 239/94

C 0 7 D 405/04

C 0 7 D 401/12

【誤訳訂正書】

【提出日】平成24年2月10日 (2012.2.10)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

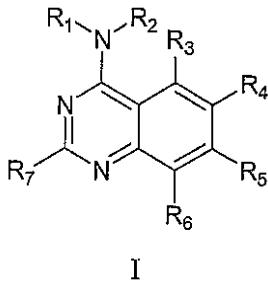
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

被験体において免疫応答を調節するための組成物であって、式 I：

【化 1】



の化合物を含み、ここで

R_1 は、アルキル、-アリール (R_i)_p、またはヘテロシクリルであり；

R_2 は、H、またはアルキルであるか；あるいは

R_1 および R_2 は、一緒に結合して、 R_{1-2} を形成し；

R_3 は、H、-CN、-OH、ハロゲン、アルキル、アリール、アルコキシ、-NR_a R_b、-C(O)R_c、-S(O)_nR_d、またはヘテロシクリルであり；

R_4 は、H、-CN、-OH、ハロゲン、アルキル、アリール、-O-(CH₂)_q-R_g、-O-(CH₂)_q-O-R_e、-NR_aR_b、-S(O)_nR_d、またはヘテロシクリル-R_fであり；

R_5 は、H、-CN、-OH、ハロゲン、アルキル、アリール、-O-(CH₂)_q-R_g、-O-(CH₂)_q-O-R_e、-NR_aR_b、-S(O)_nR_d、またはヘテロシクリルであり；

R_6 は、H、-CN、-OH、ハロゲン、アルキル、アリール、アルコキシ、-NR_a R_b、-C(O)R_c、-S(O)_nR_d、またはヘテロシクリルであり；

R_7 は、H、-OH、ハロゲン、アルキル、アリール、アルコキシ、-NR_aR_b、-S(O)_nR_d、またはヘテロシクリルであり；

各 R_a および各 R_b は、独立して、H、アルキル、-C(O)アルキル、-C(O)アリール、-CHO、アリール、ヘテロシクリル、またはアルコキシであるか；あるいは

R_a および R_b は、一緒に結合して、 R_{1-2} を形成し；

各 R_c は、独立して、H、アルキル、アルコキシ、-NR_aR_b、アリール、またはヘテロシクリルであり；

各 R_d は、独立して、H、アルキル、アルケニル、アリール、または-NR_aR_bであり；

各 R_e は、独立して、H、またはアルキルであり；

R_f は、H、ハロゲン、-OH、-CN、-(CH₂)_qNR_aR_h、アルコキシ、-C(O)R_c、-(CH₂)_qCH₃であり；

各 R_g は、独立して、H、ハロゲン、-C(O)R_c、アリール、ヘテロシクリル、または-NR_aR_bであり；

R_h は、H、または-(CH₂)_qS(O)_nR_dであり；

各 R_i は、独立して、H、ハロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、または-O(CH₂)_q-R_gであり；

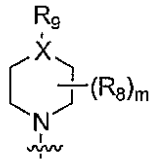
各 n は、独立して、0、1、または2であり；

各 p は、独立して、0、1、2、または3であり；

各 q は、独立して、0、1、または2であり；

R_{1-2} は：

【化2】



に示すような一般構造を有し、ここで

各 R_8 は、独立して、H、-OH、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、-NR_aR_b、または-S(O)_nR_dであって；

各 R_9 は、独立して、H、アルキル、-C(O)R_cであるか、またはXがO、Sもしくは不在の場合、不在であり；

各 X は、独立して、O、S、N、CHであるか、または不在であって、それにより共有結合を形成しており；そして

各 m は、独立して、0、1、または2であり、

ここで該被験体が、ウイルス感染症に罹患している、組成物。

【請求項2】

請求項1に記載の組成物であって、前記 R_2 が、Hである、組成物。

【請求項3】

請求項2に記載の組成物であって、前記 R_1 が、-アリール(R_i)_pである、組成物。

【請求項4】

請求項3に記載の組成物であって、前記 R_1 中のアリールがフェニルであり、該 R_1 中の p が2であり、そして該 R_1 中の R_i 基が、共にハロである、組成物。

【請求項5】

請求項3に記載の組成物であって、前記 R_1 中のアリールがフェニルであり、該 R_1 中の p が2であり、該 R_1 中の一方の R_i 基がハロであり、そして該 R_1 中の他方の R_i 基が-O(CH₂)_q-R_gである、組成物。

【請求項6】

請求項5に記載の組成物であって、前記 R_1 中の q が1であり、そして該 R_1 中の R_g がハロフェニルである、組成物。

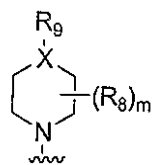
【請求項7】

請求項3に記載の組成物であって、前記 R_1 中の p が1であり、そして該 R_1 中の R_i がアルキニルである、組成物。

【請求項8】

請求項1に記載の組成物であって、前記 R_1 および R_2 が一緒に結合して、 R_{1-2} ：

【化3】



を形成しており、ここで、 R_8 はHであり、XはNであり、そして R_9 は-C(O)NH R_bである、組成物。

【請求項9】

請求項8に記載の組成物であって、前記 R_9 中の R_b が、-フェニル-O-CH₂(CH

$3) 2$ である、組成物。

【請求項 10】

請求項 1 に記載の組成物であって、前記 R_3 および R_6 が、H である、組成物。

【請求項 11】

請求項 1 に記載の組成物であって、前記 R_4 が、 $-O-(CH_2)_q-R_g$ である、組成物。

【請求項 12】

請求項 11 に記載の組成物であって、前記 R_4 中の q が 1 であり、 R_g が H である、組成物。

【請求項 13】

請求項 11 に記載の組成物であって、前記 R_4 中の R_g が、ヘテロシクリルである、組成物。

【請求項 14】

請求項 1 に記載の組成物であって、前記 R_4 および R_5 が、それぞれ $-O-(CH_2)_q-O-R_e$ である、組成物。

【請求項 15】

請求項 14 に記載の組成物であって、前記 R_4 および R_5 中の q が、共に 2 であり、該 R_4 および R_5 中の R_e が、共にメチルである、組成物。

【請求項 16】

請求項 1 に記載の組成物であって、前記 R_4 が $-$ ヘテロシクリル $-R_f$ であり、前記 R_5 が H である、組成物。

【請求項 17】

請求項 16 に記載の組成物であって、前記 R_4 中のヘテロシクリルが、フラニルである、組成物。

【請求項 18】

請求項 17 に記載の組成物であって、前記 R_4 中の R_f が、 $-(CH_2)_q-NHR_h$ である、組成物。

【請求項 19】

請求項 18 に記載の組成物であって、前記 R_h が、 $-(CH_2)_q-S(O)_2-CH_3$ である、組成物。

【請求項 20】

請求項 1 に記載の組成物であって、前記 R_5 が、 $-O-(CH_2)_q-R_g$ である、組成物。

【請求項 21】

請求項 20 に記載の組成物であって、前記 R_5 中の R_g が、ヘテロシクリルである、組成物。

【請求項 22】

請求項 12 に記載の組成物であって、前記 R_5 が、 $-O-(CH_2)_q-R_g$ である、組成物。

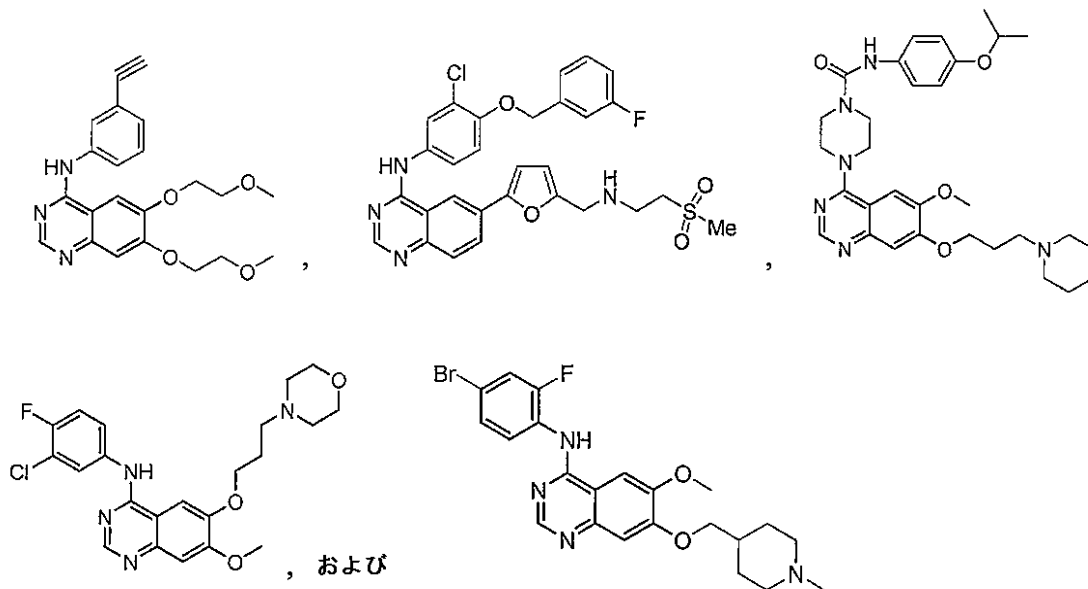
【請求項 23】

請求項 22 に記載の組成物であって、前記 R_5 中の R_g が、ヘテロシクリルである、組成物。

【請求項 24】

被験体において免疫応答を調節するための組成物であって：

【化 4】



からなる群から選択される化合物を含み、ここで該被験体が、ウイルス感染症に罹患している、組成物。

【請求項 25】

請求項 1 に記載の組成物であって、前記 R_7 が、H である、組成物。

【請求項 26】

請求項 1 に記載の組成物であって、前記 R_3 、 R_6 、および R_7 がすべて H である、組成物。

【請求項 27】

請求項 1 ～ 23 のうちのいずれか 1 項に記載の組成物であって、前記 R_7 が、H である、組成物。

【請求項 28】

請求項 1 ～ 23 のうちのいずれか 1 項に記載の組成物であって、前記 R_3 、 R_6 、および R_7 がすべて H である、組成物。

【請求項 29】

請求項 1 ～ 26 のうちのいずれか 1 項に記載の組成物であって、前記調節が、誘発である、組成物。

【請求項 30】

請求項 1 ～ 26 のうちのいずれか 1 項に記載の組成物であって、細胞毒性量以下で前記被験体に投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項 31】

請求項 1 ～ 26 のうちのいずれか 1 項に記載の組成物であって、別の因子と同時投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項 32】

請求項 29 に記載の組成物であって、別の因子と同時投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項 33】

請求項 29 に記載の組成物であって、TNF- α レベルを上昇させ得る用量で投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項 34】

請求項 29 または請求項 33 に記載の組成物であって、前記化合物が、 $20 \mu M$ 未満の定常状態平均薬物血中濃度を有する、組成物。

【請求項 35】

請求項 1 または 2 4 に記載の組成物であって、前記ウイルス感染症が、H C V、H I V、または H S V である、組成物。

【請求項 3 6】

請求項 2 9 に記載の組成物であって、前記誘発が、サイトカイン、ケモカイン、または成長因子の産生を刺激する、組成物。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

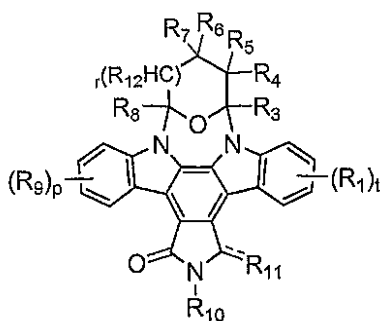
【訂正対象項目名】0 3 0 2

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 3 0 2】

【化 3 3】



の化合物を投与する工程を包含し、ここで

R_1 および R_9 は、それぞれ独立して、H、-CN、-OH、ハロゲン、アルキル、アリール、アルコキシ、-NR_aR_b、-C(O)R_c、-S(O)_nR_d、またはヘテロシクリルであり；

R_3 および R_8 は、それぞれ独立して、H、-CN、-OH、ハロゲン、アルキル、アリール、アルコキシ、-NR_aR_b、-C(O)R_c、-S(O)_nR_d、またはヘテロシクリルであり；

R_4 および R_7 は、それぞれ独立して、H、-CN、-OH、ハロゲン、アルキル、-O-(CH₂)_q-R_e、-C(O)R_c、-O-(CH₂)_q-O-R_e、-NR_aR_b、および -S(O)_nR_d であり；

R_5 および R_6 は、それぞれ独立して、H、-CN、-OH、ハロゲン、アルキル、アリール、アルコキシ、-NR_aR_b、-C(O)R_c、またはヘテロシクリルであり；

R_{10} は、H、アルキル、アリール、-C(O)R_c、またはヘテロシクリルであり；
点線は不在であり、 R_{11} は、H、-CN、-OH、ハロゲン、アルキル、アリール、アルコキシ、-NR_aR_b、-C(O)R_c、-S(O)_nR_d、またはヘテロシクリルであるか；または

点線は存在し、 R_{11} は、OまたはSであり；

R_{12} は、H、アルキル、またはアルコキシであり；

各 R_a および各 R_b は、独立して、H、アルキル、-C(O)R_c、アリール、ヘテロシクリル、またはアルコキシであり；

各 R_c は、独立して、H、アルキル、アルコキシ、-NH₂、-NH(アルキル)、-N(アルキル)₂、アリール、またはヘテロシクリルであり；

各 R_d は、独立して、H、アルキル、アルケニル、アリール、または -NR_aR_b であり；

各 R_e は、独立して、H、ハロゲン、-C(O)R_c、アリール、ヘテロシクリル、または -NR_aR_b であり；

各 n は、独立して、0、1、または2であり；

各 p は、独立して、0、1、2、または3であり；

各 q は、独立して、0、1、または2であり；

各 r は0であって、それにより共有結合を形成しているか、または1であり；そして

各 t は、独立して、0、1、2、または3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】0457

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0457】

置換された置換基が、直鎖基を含む場合、この置換は、鎖内（例えば、2 - ヒドロキシプロピル、2 - アミノブチルなど）か、または鎖末端（例えば、2 - ヒドロキシエチル、3 - シアノプロピルなど）のいずれかにおいて起こり得る。置換された置換基は、共有結合している炭素原子もしくはヘテロ原子の直鎖状、分枝状、または環状の配置であり得る。

【誤訳訂正4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0690

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0690】

（HIV - 1複製アッセイ）

HIV - 1複製に対するヌクレオシドアナログの阻害効果は、MAGI - CCR5細胞におけるウイルス誘発性の感染病巣形成の阻害に起因し得る。簡単にいうと、MAGI - CCR5細胞を、96ウェルプレートにウェル1つあたり 5×10^4 個の細胞で播種する。培養上清を、翌日に除去し、そしてウイルス（ウェル1つあたり約300の病変を形成する単位）を含む新鮮な培養培地および種々の濃度の試験化合物を各ウェルに添加する。ウイルス感染の2日後、この培養上清を、除去し、そして固定溶液（リン酸緩衝化生理食塩水[PBS]中の1%ホルムアミドおよび0.2%グルタルアルデヒド）を各ウェルに添加する。この細胞を、室温にて5分間固定し、そしてPBSによって2回洗浄する。X - Gal染色溶液（PBS中に1mlあたり4mMフェロシアン化カリウム、4mMフェリシアン化カリウム、2mM塩化マグネシウム、および0.4mgの5 - ブロモ - 4 - クロロ - 3 - インドリル - P - D - ガラクトピラノシド）を、各ウェルに添加し、そしてこの細胞を、37℃にて45分間染色する。感染した（青色）細胞の数を、顕微鏡で計測する。