

【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25年10月10日(2013.10.10)

【公表番号】特表2013-503111(P2013-503111A)

【公表日】平成25年1月31日(2013.1.31)

【年通号数】公開・登録公報2013-005

【出願番号】特願2012-525824(P2012-525824)

【国際特許分類】

C 0 7 D 233/60 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/4178 (2006.01)

A 6 1 K 31/4164 (2006.01)

C 0 7 D 257/04 (2006.01)

C 0 7 D 249/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/4196 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)

A 6 1 P 1/02 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/10 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 33/00 (2006.01)

A 6 1 P 33/02 (2006.01)

C 0 7 C 22/08 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 233/60 1 0 3

C 0 7 D 403/12 C S P

A 6 1 K 31/4178

A 6 1 K 31/4164

C 0 7 D 257/04 E

C 0 7 D 249/08 5 2 3

A 6 1 K 31/4196

C 0 7 D 249/08 5 2 1

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 17/14

A 6 1 P 1/02

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 31/10

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 31/06
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 7/00
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 33/00
 A 6 1 P 33/02
 A 6 1 P 33/02 1 7 3
 C 0 7 C 22/08

【手続補正書】

【提出日】平成25年8月21日(2013.8.21)

【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

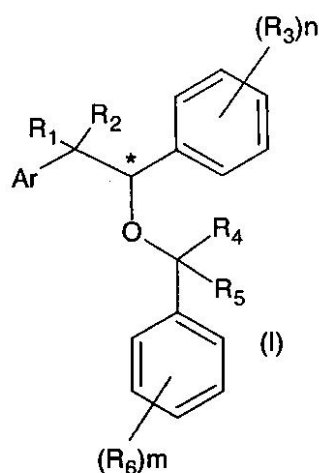
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) であることにより特徴付けられるベンジルアラルキルエーテル化合物、その塩、溶媒和物、プロドラッグ、エステル、鏡像異性体および／または薬学的に許容されるジアステレオ異性体：

【化 1】



ここで、

Ar はアリール、イミダゾリル、1, 2, 4-トリアゾリルまたはベンズイミダゾリルであり；

R₁、R₂、R₄およびR₅は独立して水素、ハロゲンまたはC₁-₆アルキルであり；R₃はハロゲン、C₁-₆アルキルまたはO-R'である置換基であり、ここで、R'は水素また

は低級アルキルであり；

R_6 はアリールまたは置換されたアリール、トリフルオロメチル、トリクロロメチルまたは $O-R'$ であり、ここで、 R' は水素または低級アルキルであり；アリールの置換基は、ハロゲンまたはテトラゾリル基であり；

n および m は独立して 0～5 の整数であり；

但し、 Ar がイミダゾリルであり、 R_3 が塩素であり、 R_6 が p -フェニルであり、および R_1 、 R_2 、 R_4 および R_5 が水素である場合、 n は 2 とは異なり、および／または n および m が 0 および 1 とは異なる場合、 R_3 または R_6 は必ずしも等しくはない置換基により示され、および／または置換基 R_1 、 R_2 、 R_4 および R_5 が同時に水素に等しく、 R_6 がトリフルオロメチルまたはトリクロロメチルである場合、1, 2, 4-トリアゾリル基は 2 位とは異なる位置により主構造に対して結合されなくてはならない。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の化合物であって、それらが薬学的に許容される酸の付加塩の形態にある化合物。

【請求項 3】

請求項 1 に記載の化合物であって、 R_1 、 R_2 、 R_4 および R_5 は水素であり、ベンジル環の何れかの位置で R_3 がハロゲンであり、 n は 0～2 の整数であり、 m は 1 であり、 R_6 はフェニル、フェニル-ハロゲン、(テトラゾリル) フェニル、トリフルオロメチルまたはトリクロロメチルであり； Ar はイミダゾリル基または 1, 2, 4-トリアゾリルであり；但し、 Ar がイミダゾリルであり、 R_3 が塩素であり、 R_6 が p -フェニルである場合、 n は 2 とは異ならなくてはならず、 n および m が 0 および 1 とは異なる場合、 R_3 または R_6 は必ずしも等しくはない置換基により示され、および／または R_6 がトリフルオロメチルまたはトリクロロメチルである場合、1, 2, 4-トリアゾリル基は 2 位とは異なる位置により主構造に対して結合されなくてはならない。

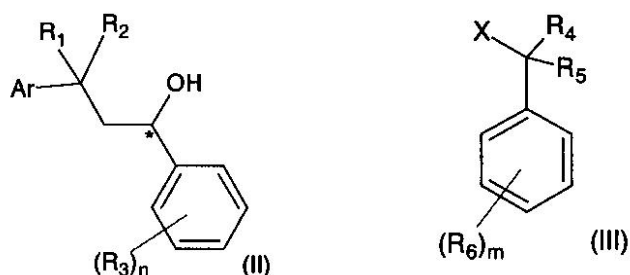
【請求項 4】

請求項 1 または 3 に記載の化合物であって、1-[2-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-{[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}エチル]-1H-イミダゾール；1-[2-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-{[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}エチル]-1H-1, 2, 4-トリアゾール；1-[2-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-{[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}エチル]-4H-1, 2, 4-トリアゾール；1-[2-(2, 4-ジクロロフェニル)]-2-(4-{4-[(2-フェニル)-2H-テトラゾール]ベンジル}オキシ)エチル]-1H-イミダゾール；1-{2-[4'-クロロビフェニル-4-イル)メトキシ]-2-(2, 4-ジクロロフェニル)エチル}-1H-イミダゾール；1-[2-(ビフェニル 4-イルメトキシ)-2-(2, 4-ジクロロフェニル)エチル]-1H-イミダゾールまたはその薬学的に許容される塩であることにより特徴付けられる化合物。

【請求項 5】

請求項 1～4 の何れか 1 項に記載の化合物を製造する方法であって、式 (I I) の化合物と式 (I I I) の化合物とを適切な反応媒体中で反応すること含む方法；

【化 2】



ここにおいて、

Ar はアリール、イミダゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル または ベンズイミダゾリル を示し；

R₁、R₂、R₄ および R₅ は独立して水素、ハロゲンまたは C₁₋₆ アルキルであり；R₃ はハロゲン、C₁₋₆ アルキルまたは O-R' であり、ここで、R' は水素または低級アルキルであり；

R₆ はアリールまたは置換されたアリール、トリフルオロメチル、トリクロロメチルまたは O-R' であり、ここで、R' は水素または低級アルキルであり；アリールの置換基はハロゲンまたはテトラゾリル基であり；

n および m は独立して 0 ～ 5 の整数であり；

X は Cl、Br、I、メタンスルホネートまたはトルエンスルホネートからなる群より選択される要素であり、

ここで、R₁、R₂、R₄ および R₅ が同時に水素に等しく、R₆ がトリフルオロメチルまたはトリクロロメチルである場合、1, 2, 4-トリアゾリル基は 2 位とは異なる位置により主構造に対して結合されなくてはならず；

但し、Ar がイミダゾリルであり、R₃ が塩素であり、R₆ が p-フェニルであり、R₁、R₂、R₄ および R₅ が水素である場合、n は 2 とは異ならなくてはならず、n および m が 0 および 1 とは異なる場合、R₃ または R₆ は必ずしも等しくはない置換基により示される。

【請求項 6】

請求項 5 に記載の化合物を製造する方法であって、前記反応媒体は：

- (a) 極性有機溶媒、
- (b) 20% ～ 70% (w/v) で変更される濃度での強塩基溶液、および
- (c) 反応媒体の総体積中で 0.001 ～ 0.1 g/mL で変更される濃度での塩基性有機塩を含む方法。

【請求項 7】

請求項 6 に記載の方法であって、極性有機溶媒がアセトン、メチルエチルケトンおよびその混合物からなる群より選択される方法。

【請求項 8】

請求項 7 に記載の方法であって、極性有機溶媒がアセトンである方法。

【請求項 9】

請求項 6 に記載の方法であって、強塩基がアルカリ金属およびアルカリ土類金属からなる群より選択される要素を含む方法。

【請求項 10】

請求項 9 に記載の方法であって、強塩基が、水酸化ナトリウムおよび水酸化カリウムからなる群より選択される方法。

【請求項 11】

請求項 6 に記載の方法であって、塩基性有機塩が、ベンジルトリエチルアンモニウムクロライドである方法。

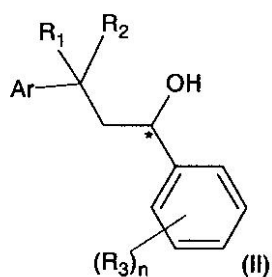
【請求項 1 2】

請求項 6 に記載の方法であって、中間体 (II) および (III) は、トリチル、N, N-ジメチルスルホンアミド、p-メトキシフェニルスルホンアミド、ベンゼンスルホンアミド、2, 2, 2-トリクロロエチルカルバメート、t-ブチルカルバメート、N-2-クロロエチルアミン、N-トリイソプロピルシリルアミン、N-2-ニトロベンジルアミンおよび／またはN-2-テトラヒドロピラニルアミンからなる群より任意に選択される保護基を有する方法。

【請求項 1 3】

中間体化合物であって、式 (II) であることにより特徴付けられる中間体化合物；

【化 3】



ここで、Ar はアリール、イミダゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル または ベンズイミダゾリル；

R₁ および R₂ は独立して水素、ハロゲンまたは C₁-₆ アルキルであり；

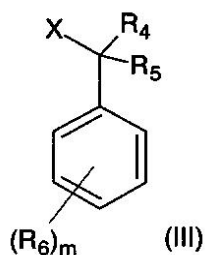
R₃ はハロゲン、C₁-₆ アルキルまたは O-R' であり、ここで、R' は水素または低級アルキルであり；

n は 0 ~ 5 の整数である。

【請求項 1 4】

中間体化合物であって、式 (III) であることにより特徴付けられる中間体化合物；

【化 4】



ここで、R₄ および R₅ は独立して水素、ハロゲンまたは C₁-₆ アルキルであり；

mは0～5の整数であり；

R₆はアリールまたは置換されたアリール、トリフルオロメチル、トリクロロメチルまたはO-R'であり、ここで、R'は水素または低級アルキルであり；アリールの置換基はハロゲンまたはテトラゾリル基であり；

XはCl、Br、I、メタンスルホネートまたはトルエンスルホネートからなる群より選択される要素である。

【請求項15】

微生物の増殖および／または生存の阻害および／または抑制のための請求項1～4の何れか1項に記載の化合物および／またはその混合物の使用。

【請求項16】

請求項15に記載の使用であって、微生物が真菌、バクテリアまたは原生動物である使用。

【請求項17】

微生物に関連する個体における状態および／または疾患の治療および／または予防のための医薬の製造のための請求項1～4の何れか1項に記載の化合物またはその混合物の使用。

【請求項18】

請求項17の何れか1項に記載の使用であって、微生物が真菌、バクテリアまたは原生動物である使用。

【請求項19】

微生物に関連する状態および／または疾患を治療および／または予防する方法であって、請求項1～4の何れか1項に記載の少なくとも1つの化合物またはその混合物の有効量を哺乳動物に投与することを含む方法。

【請求項20】

活性成分としての請求項1～4の何れか1項に記載の少なくとも1つの化合物と、1または1つ以上の薬学的に許容可能な賦形剤とを含む薬学的組成物。

【請求項21】

請求項20に記載の薬学的組成物であって、前記化合物は：

1-[2-(2,4-ジクロロフェニル)-2-{[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}エチル]-1H-イミダゾール；

1-[2-(2,4-クロロフェニル)-2-{[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}エチル]-1H-1,2,4-トリアゾール；

1-[2-(2,4-クロロフェニル)-2-{[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}エチル]-4H-1,2,4-トリアゾール；

1-[2-(2,4-ジクロロフェニル)]-2-(4-[(2-フェニル)-2H-テトラゾール]ベンジル)オキシエチル]-1H-イミダゾール；

1-{2-[4'-クロロビフェニル-4-イル)メトキシ]-2-(2,4-ジクロロフェニル)エチル}-1H-イミダゾール；

1-[2-(ビフェニル4-イルメトキシ)-2-(2,4-ジクロロフェニル)エチル]-1H-イミダゾール；またはその薬学的に許容される塩からなる群より選択される薬学的組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0052

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0052】

もう一つの態様において、本発明は、反応媒体の総体積に関して20%～70%(w/v)の濃度範囲にある強塩基の極性溶媒溶液と0.001～0.1g/mLの濃度範囲にある塩基性有機塩とを含む反応媒体において生じてよい。好ましくは、極性有機溶媒は、

アセトンまたはメチルエチルケトンまたはその混合物であってよく；強塩基溶液は、アルカリ金属およびアルカリ土類金属要素を含む塩基であって、好ましくは水酸化ナトリウムおよび水酸化カリウムからなる群より選択される塩基であってよく、塩基性有機塩は、好ましくは、ベンジルトリエチルアンモニウムクロライドである。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0059

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0059】

[例 1]

10.30 g の化合物 1-(2,4-ジクロロフェニル)-2-(1H-イミダゾール-1-イル)エタノールを 26 mL のアセトンに懸濁し、次に、水中の水酸化ナトリウムの 50% 溶液の 31 mL を添加し、続いて、26 mL 以上のアセトンを添加し、全反応混合物は激しい攪拌上に維持された。次に、0.45 g のベンジルトリエチルアンモニウムクロライドを添加し、30 分間の還流下に反応混合物を維持した。更に貫流下で、8.2 g の 1-(クロロメチル)-4-(トリフルオロメチル)ベンゼン化合物 (13 mL のアセトン中に希釈された) を添加し、6 時間に亘り攪拌と還流を維持した。最後に、不均一な混合物を濾過し、相を分離した。有機相を 45 °C で回転エバポレートして乾燥した。得られた残留物を 100 mL の冷エチルエーテルに溶解した。そこに次に 2 mL の硝酸 (65%) を 0 °C で添加し、1 時間に亘り攪拌を維持した。最後に、産物を濾過し、冷エタノールで洗浄し、65 °C で 12 時間に亘り乾燥した。白色固体として得られた産物 (化合物 B L 1 2 3) は以下の特徴を有した：NMR ¹H (300 MHz-DMSO): 9.05 (1H, s), 7.72-7.74 (1H, m), 7.65-7.66 (4H, m), 7.53-7.54 (1H, m), 7.38-7.45 (3H, m), 5.51-5.20 (1H, m) 4.45-4.64 (4H, m). NMR ¹³C (75MHz-DMSO): 142.1, 136.3, 134.1, 133.6, 133.3, 129.5, 129.2, 128.5, 128.1, 127.9, 125, 2, 125.1, 123,, 119.8, 75.4, 69.7, 51.8; 元素分析計算値 C₁₉H₁₆Cl₂O₄F₃N₃; C=47.72%, H=3.37%, N=8.79%; 実測値: C=48.06%, H=3.44%, N=8.76%. 融点: 173~176 °C。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0146

【補正方法】変更

【補正の内容】

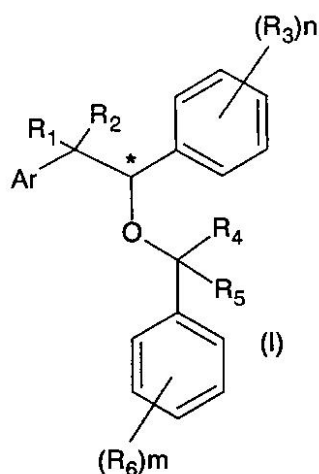
【0146】

(vii) 必須遺伝子、例えば、(a) C d c 2 8 および (b) C i v 1、これは真菌の基本的な細胞周期に関与する。

以下に、当初の特許請求の範囲に記載していた発明を付記する。

[1] 式 (I) であることにより特徴付けられるベンジルアラルキルエーテル化合物、その塩、溶媒和物、プロドラッグ、エステル、鏡像異性体および／または薬学的に許容されるジアステレオ異性体：

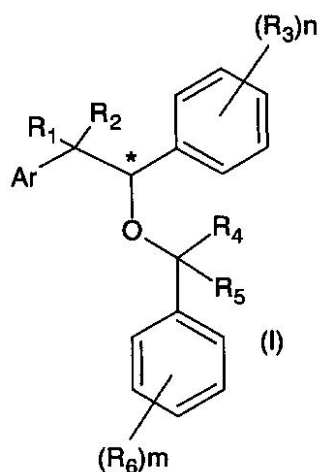
【化 1 3】



ここで、Ar はアリール、イミダゾリル、1, 2, 4-トリアゾリルまたはベンズイミダゾリルであり； R_1 、 R_2 、 R_4 および R_5 は独立して水素、ハロゲンまたは C_{1-6} アルキルであり； R_3 はハロゲン、 C_{1-6} アルキルまたは $O-R'$ である置換基であり、ここで、 R' は水素または低級アルキルであり； R_6 はアリールまたは置換されたアリール、トリフルオロメチル、トリクロロメチルまたは $O-R'$ であり、ここで、 R' は水素または低級アルキルであり；アリールの置換基は、ハロゲンまたはテトラゾリル基であり； n および m は独立して0～5の整数であり；但し、Ar がイミダゾリルであり、 R_3 が塩素であり、 R_6 が p -フェニルであり、および R_1 、 R_2 、 R_4 および R_5 が水素である場合、 n は2とは異なり、および／または n および m が0および1とは異なる場合、 R_3 または R_6 は必ずしも等しくはない置換基により示され、および／または置換基 R_1 、 R_2 、 R_4 および R_5 が同時に水素に等しく、 R_6 がトリフルオロメチルまたはトリクロロメチルである場合、1, 2, 4-トリアゾリル基は2位とは異なる位置により主構造に対して結合されなくてはならない。

[2]同様に抗真菌性、抗菌性および／または抗寄生虫性である、式(I)であることにより特徴付けられるベンジルアララルキルエーテル化合物、その塩、溶媒和物、プロドラッグ、エステル、鏡像異性体および／または薬学的に許容されるジアステレオ異性体：

【化 1 4】



ここで、Ar はアリール、イミダゾリル、1, 2, 4-トリアゾリルまたはベンズイミダゾリルであり；R₁、R₂、R₄およびR₅は独立して水素、ハロゲンまたはC₁₋₆アルキルであり；R₃は、ハロゲン、C₁₋₆アルキルまたはO-R'である置換基であり、ここで、R'は水素または低級アルキルであり；R₆はアリールまたは置換されたアリール、トリフルオロメチル、トリクロロメチルまたはO-R'であり、R'は水素または低級アルキルであり；アリールの置換基は、ハロゲンまたはテトラゾリル基であり；nおよびmは独立して0～5の整数であり；但し、Arがイミダゾリルであり、R₃が塩素であり、R₆がp-フェニルであり、R₁、R₂、R₄およびR₅が水素である場合、nは2とは異ならなくてはならず；およびnおよびmが0および1とは異なる場合、R₃またはR₆は必ずしも等しくはない置換基により示され、および／または置換基R₁、R₂、R₄およびR₅が水素であり、R₆がアリール基または置換されたアリールであるとき、1, 2, 4-トリアゾリル基は2位とは異なる位置により主構造に対して結合されなくてはならない。

[3][1]または[2]に記載の化合物であって、それらが薬学的に許容される酸の付加塩の形態にある化合物。

[4][1]または[2]に記載の化合物であって、それらが硝酸塩の形態にある化合物。

[5][1]または[2]に記載の化合物であって、R₁、R₂、R₄およびR₅は水素であり、ベンジル環の何れかの位置でR₃がハロゲンであり、nは0～2の整数であり、mは1であり、R₆はフェニル、フェニル-ハロゲン、(テトラゾリル)フェニル、トリフルオロメチルまたはトリクロロメチルであり；Arはイミダゾリル基または1, 2, 4-トリアゾリルであり；但し、Arがイミダゾリルであり、R₃が塩素であり、R₆がp-フェニルである場合、nは2とは異ならなくてはならず、nおよびmが0および1とは異なる場合、R₃またはR₆は必ずしも等しくはない置換基により示され、および／またはR₆がトリフルオロメチルまたはトリクロロメチルである場合、1, 2, 4-トリアゾリル基は2位とは異なる位置により主構造に対して結合されなくてはならない。

[6][1]、[2]または[5]に記載の化合物であって、1-[2-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-{[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}エチル]-1H-イミダゾール、またはそれらの薬学的に許容される塩であることにより特徴付けられる化合物。

[7][1]、[2]または[5]に記載の化合物であって、1-[2-(2, 4-ジクロロフェ

ニル) - 2 - { [4 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ} エチル] - 1 H - 1 ,
2, 4 - トリアゾールまたはその薬学的に許容される塩であることにより特徴付けられる
化合物。

[8] [1]、[2]または[5]に記載の化合物であって、1 - [2 - (2, 4 - ジクロロフェ
ニル) - 2 - { [4 - (トリフルオロメチル) ベンジル] オキシ} エチル] - 4 H - 1 ,
2, 4 - トリアゾールまたはその薬学的に許容される塩であることにより特徴付けられる
化合物。

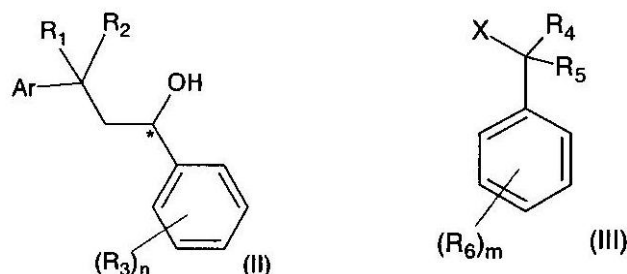
[9] [1]、[2]または[5]に記載の化合物であって、1 - [2 - (2, 4 - ジクロロフェ
ニル)] - 2 - ({ 4 - [(2 - フェニル) - 2 H - テトラゾール] ベンジル} オキシ)
エチル] - 1 H - イミダゾールまたはその薬学的に許容される塩であることにより特徴付
けられる化合物。

[1 0] [1]、[2]または[5]に記載の化合物であって、1 - { 2 - [(4' - クロロピフ
ェニル - 4 - イル) メトキシ] - 2 - (2, 4 - ジクロロフェニル) エチル} - 1 H - イ
ミダゾールまたはその薬学的に許容される塩であることにより特徴付けられる化合物。

[1 1] [1]、[2]または[5]に記載の化合物であって、1 - [2 - (ビフェニル 4 - イル
メトキシ) - 2 - (2, 4 - ジクロロフェニル) エチル] - 1 H - イミダゾール、または
その薬学的に許容される塩であることにより特徴付けられる化合物。

[1 2] [1] ~ [1 1] の何れか 1 項に記載の化合物を製造する方法であって、式 (I I) の
化合物と式 (I I I) の化合物とを適切な反応媒体中で反応すること含む方法：

【化 1 5】

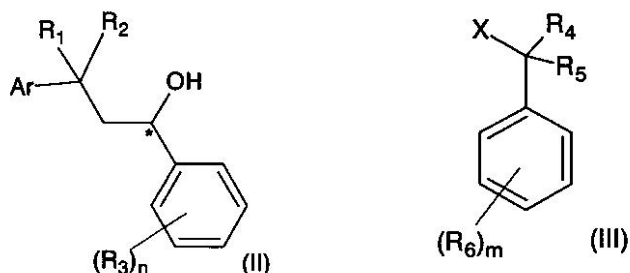


ここにおいて、 Ar はアリール、イミダゾリル、1, 2, 4 - トリアゾリル、ベンズイミ
ダゾリルおよび 1, 2, 4 - トリアゾリルを示し； R_1 、 R_2 、 R_4 および R_5 は独立して水
素、ハロゲンまたは C_{1-6} アルキルであり； R_3 はハロゲン、 C_{1-6} アルキルまたは $O -$
 R' であり、ここで、 R' は水素または低級アルキルであり； R_6 はアリールまたは置換
されたアリール、トリフルオロメチル、トリクロロメチルまたは $O - R'$ であり、ここで
、 R' は水素または低級アルキルであり；アリールの置換基はハロゲンまたはテトラゾリ
ル基であり； n および m は独立して 0 ~ 5 の整数であり； X は Cl 、 Br 、 I 、メタンス
ルホネートまたはトルエンシルホネートからなる群より選択される要素であり、ここで、
 R_1 、 R_2 、 R_4 および R_5 が同時に水素に等しく、 R_6 がトリフルオロメチルまたはトリク
ロロメチルである場合、1, 2, 4 - トリアゾリル基は 2 位とは異なる位置により主構造
に対して結合されなくてはならず、但し、 Ar がイミダゾリルであり、 R_3 が塩素であり
、 R_6 が p - フェニルであり、 R_1 、 R_2 、 R_4 および R_5 が水素である場合、 n は 2 とは異
ななくてはならず、 n および m が 0 および 1 とは異なる場合、 R_3 または R_6 は必ずしも
等しくはない置換基により示される。

[1 3] [1] ~ [1 1] の何れか 1 項に記載の化合物を製造する方法であって、式 (I I) の
化合物と式 (I I I) の化合物とを、(a) 極性有機溶媒、(b) 2 0 % ~ 7 0 % (w /
v) で変更される濃度での強塩基溶液、および (c) 反応媒体の総体積中で 0 . 0 0 1 ~
0 . 1 g / m L で変更される濃度での有機塩基性塩を含む反応媒体中で反応すること含む

方法：

【化 1 6】



ここで、Ar はアリール、イミダゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、ベンズイミダゾリルおよび1, 2, 4-トリアゾリルを示し；R₁、R₂、R₄およびR₅は独立して水素、ハロゲンまたはC₁₋₆アルキルであり；R₃はハロゲン、C₁₋₆アルキルまたはO-R'であり、ここで、R'は水素または低級アルキルであり；R₆はアリールまたは置換されたアリール、トリフルオロメチル、トリクロロメチルまたはO-R'であり、ここで、R'は水素または低級アルキルであり；アリールの置換基はハロゲンまたはテトラゾリル基であり；nおよびmは独立して0～5の整数であり；Xは、Cl、Br、I、メタンスルホネートまたはトルエンスルホネートからなる群より選択される要素であり、ここにおいて、置換基R₁、R₂、R₄およびR₅が同時に水素に等しく、R₆がトリフルオロメチルまたはトリクロロメチルである場合、1, 2, 4-トリアゾリル基は2位とは異なる位置により主構造に対して結合されなくてはならず、但し、Arがイミダゾリルであり、R₃が塩素であり、R₆がp-フェニルであり、R₁、R₂、R₄およびR₅が水素である場合、nは2とは異ならなくてはならず、nおよびmが0および1とは異なる場合、R₃またはR₆は必ずしも等しくはない置換基により表される。

[14][13]に記載の方法であって、極性有機溶媒がアセトン、メチルエチルケトンおよびその混合物からなる群より選択される方法。

[15][14]に記載の方法であって、極性有機溶媒がアセトンである方法。

[16][13]に記載の方法であって、強塩基がアルカリ金属およびアルカリ土類金属からなる群より選択される要素を含む方法。

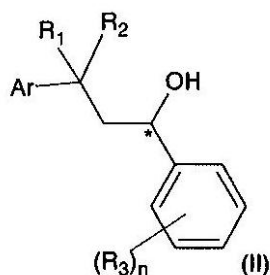
[17][13]に記載の方法であって、強塩基が、水酸化ナトリウムおよび水酸化カリウムからなる群より選択される方法。

[18][13]に記載の方法であって、有機塩が、塩基性トリエチルアルミニウムベンジルアンモニウムクロライドである方法。

[19][13]に記載の方法であって、中間体(II)および(III)は、トリチル、N, N-ジメチルスルホンアミド、p-メトキシフェニルスルホンアミド、ベンゼンスルホンアミドおよび／またはN-2-テトラヒドロピラニルアミンからなる群より任意に選択される保護基を有する方法。

[20]中間体化合物であって、式(II)であることにより特徴付けられる中間体化合物；

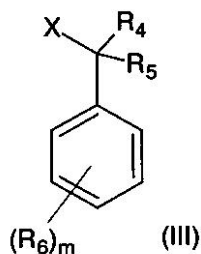
【化 1 7】



ここで、Ar はアリール、イミダゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、ベンズイミダゾリルおよび1, 2, 4-トリアゾリルであり；R₁およびR₂は独立して水素、ハロゲンまたはC₁₋₆アルキルであり；R₃はハロゲン、C₁₋₆アルキルまたはO-R'であり、ここで、R'は水素または低級アルキルであり；nは0～5の整数である。

[2 1] 中間体化合物であって、式 (III) であることにより特徴付けられる中間体化合物；

【化 1 8】



ここで、R₄およびR₅は独立して水素、ハロゲンまたはC₁₋₆アルキルであり；mは0～5の整数であり；R₆はアリールまたは置換されたアリール、トリフルオロメチル、トリクロロメチルまたはO-R'であり、ここで、R'は水素または低級アルキルであり；アリールの置換基はハロゲンまたはテトラゾリル基であり；XはCl、Br、I、メタンスルホネートまたはトルエンスルホネートからなる群より選択される要素である。
[2 2] 微生物の増殖および／または生存の阻害および／または抑制のための[1]～[1 1]の何れか1項に記載の化合物および／またはその混合物の使用。

[2 3] [2 2]に記載の使用であって、微生物が病原体である使用。

[2 4] [2 2]または[2 3]に記載の使用であって、微生物が真菌である使用。

[2 5] [2 4]に記載の方法であって、真菌がアスペルギルス、ミクロスポルム、エビデルモフィトン、トリコフィトン、カンジダ、フィコミセス、ジゴミセス、リゾプス、ムコール、アブシジア、マラセジア、エクソフィアラ、ピエドライア、トリコスボルム、スポロトリクス、クラドスポリウム、フィアロフォラ、ホセカエア、ヒストプラスマ、コクシジオイデス、フザリウム、ペニシリウム、プレストミセス、クリプトコッカス、パラコキシジオイデス、スセドスポリウム、サッカロミセス、ピエドライア、アクチノミセス、ケラチノミセス、ナンニジア、アルスロデルマ、クテノミセス、オルピジウム、フィソデマ、シノキトリウム、フィトフォラ、バーチシリウム、グリオクラジウム、リチスマ、スクレロチニア、オフィオストマ、ロフィオデルミウム、エルシノエ、カプノジウム、ミコスファエレラ、ベンツリア、ゲウマンノミセス、アルテルナリア、ビボラリス、ボトリチス、

セルコスボラ、ジプロジア、ドゥレスクレラ、エキセルオヒルム、フォーマ、フォモシス、リソクトニア、プシニア、エリスフェ、フィルラクチニア、ウンシヌラ、フラグミジウム、メラムソラ、ユーチファ、ヒポシキロン、キシラリア、セラトバシジウム、ヘテロバシジウム、タナテホルスおよびアルミルラリアの属からなる群より選択される使用。

[26][24]に記載の使用であって、真菌が皮膚糸状菌である使用。

[27][26]に記載の使用であって、皮膚糸状菌真菌がエピデルモフィトン種、ミクロスポルム種およびトリコフィトン種からなる群より選択される使用。

[28][22]または[23]に記載の使用であって、微生物が細菌である使用。

[29][28]に記載の使用であって、細菌がアクチノミセス、コリネバクテリウム、マイコバクテリウム、ノカルジア、バチルス、ビフィドバクテリウム、クロストリジウム、エリジペロスリックス、リステリア、スタフィロコッカス、ストレプトコッカス、ニューモコッカス、アナプラズマ、エールリヒア、ネオリケッチア、ウォルバキア、バクテリオイデス、バルトネラ、ボルデテラ、ボレリア、ブルセラ、ブルクホルデルリア、カンピロバクター、クラミジア、クラミドフィラ、エシェリキア、クレブシエラ、プロテウス、サルモネラ、セラチア、エルシニア、フゾバクテリウム、ヘリコバクター、アシネトバクター、マイコプラズマ、ウレアプラズマ、ナイセリア、メニンゴコッカス、アクチノバチルス、ヘモフィルス、パスツレラ、シュードモナス、リケッチアおよびトレボネーマの属からなる群より選択される使用。

[30][22]または[23]に記載の使用であって、微生物が原生動物である使用。

[31][30]に記載の使用であって、原生動物がプラスモジウム、トキソプラズマ、バランチジウム、コクシジア、クリプトスポリジウム、シロスポラ、イソスポーラ、サルコシスチス、バベシア、タイレリア、ジエントアメーバ、ジアルジア、レーシュマニア、アカントアメーバ、プラストシスチス、アナプラズマ、エールリヒア、トリコモナス、トリパノソーマ、ジアルジアおよびエントアメーバの属からなる群より選択される使用。

[32]個体における微生物によるコロニー形成の治療および／または予防のための[1]～[11]の何れか1つに記載の化合物および／またはその混合物の使用。

[33][32]に記載の使用であって、微生物が病原体である使用。

[34][32]または[33]に記載の使用であって、微生物が真菌である使用。

[35][34]に記載の使用であって、真菌が、アスペルギルス、ミクロスポルム、エピデルモフィトン、トリコフィトン、カンジダ、フィコミセス、ジゴミセス、リゾプス、ムコール、アブシジア、マラセジア、エクソフィアラ、ピエドライア、トリコスボルム、スポロトリクス、クラドスポリウム、フィアロフォラ、ホセカエア、ヒストプラスマ、コクシジオイデス、フザリウム、ペニシリウム、プレストミセス、クリプトコッカス、パラコクシジオイデス、スセドスポリウム、サッカロミセス、ピエドライア、アクチノミセス、ケラチノミセス、ナンニジア、アルスロデルマ、クテノミセス、オルビジウム、フィソデマ、シノキトリウム、フィトフォラ、バーチシリウム、グリオクラジウム、リチスマ、スクレロチニア、オフィオストマ、ロフィオデルミウム、エルシノエ、カプノジウム、ミコスファエレラ、ベンツリア、ゲウマンノミセス、アルテルナリア、ビボラリス、ボトリチス、セルコスボラ、ジプロジア、ドゥレスクレラ、エキセルオヒルム、フォーマ、フォモシス、リソクトニア、プシニア、エリスフェ、フィルラクチニア、ウンシヌラ、フラグミジウム、メラムソラ、ユーチファ、ヒポシキロン、キシラリア、セラトバシジウム、ヘテロバシジウム、タナテホルスおよびアルミルラリアの属からなる群より選択される使用。

[36][34]に記載の使用であって、真菌が皮膚糸状菌である使用。

[37][36]に記載の使用であって、皮膚糸状菌真菌がエピデルモフィトン種、ミクロスポルム種およびトリコフィトン種からなる群より選択される使用。

[38][32]または[33]に記載の使用であって、微生物が細菌である使用。

[39][38]に記載の使用であって、細菌がアクチノミセス、コリネバクテリウム、マイコバクテリウム、ノカルジア、バチルス、ビフィドバクテリウム、クロストリジウム、エリジペロスリックス、リステリア、スタフィロコッカス、ストレプトコッカス、ニューモコッカス、アナプラズマ、エールリヒア、ネオリケッチア、ウォルバキア、バクテリオイ

デス、バルトネラ、ボルデテラ、ボレリア、ブルセラ、ブルクホルデリア、カンピロバクター、クラミジア、クラミドフィラ、エシェリキア、クレブシエラ、プロテウス、サルモネラ、セラチア、エルシニア、フゾバクテリウム、ヘリコバクター、アシネトバクター、マイコプラズマ、ウレアプラズマ、ナイセリア、メニンゴコッカス、アクチノバチルス、ヘモフィルス、パスツレラ、シュードモナス、リケッチアおよびトレポネーマの属からなる群より選択される使用。

[40][32]または[33]に記載の使用であって、微生物が原生動物である使用。

[41][40]に記載の使用であって、原生動物がプラスモジウム、トキシプラズマ、バランチジウム、コクシジア、クリプトスポリジウム、シロスポラ、イソスポーラ、サルコシスチス、バベシア、タイレリア、ジエントアメーバ、ジアルジア、レーシュマニア、アカントアメーバ、ブラストシスチス、アナプラズマ、エールリヒア、トリコモナス、トリパノソーマ、ジアルジアおよびエントアメーバの属からなる群より選択される使用。

[42]個体における微生物に関連する状態および／または疾患の治療および／または予防のための[1]～[11]の何れか1つに記載の化合物および／またはその混合物の使用。

[43][42]に記載の使用であって、個体が哺乳動物である使用。

[44][43]に記載の使用であって、哺乳動物がヒトである使用。

[45][42]～[44]の何れか1つに記載の使用であって、微生物が真菌である使用。

[46][45]に記載の使用であって、真菌がアスペルギルス、ミクロスポルム、エピデルモフィトン、トリコフィトン、カンジダ、フィコミセス、ジゴミセス、リゾプス、ムコール、アブシジア、マラセジア、エクソフィアラ、ピエドライア、トリコスボルム、スポロトリクス、クラドスポリウム、フィアロフォラ、ホセカエア、ヒストプラズマ、コクシジオイデス、フザリウム、ペニシリウム、プレストミセス、クリプトコッカス、パラコクシジオイデス、スセドスポリウム、サッカロミセス、ピエドライア、アクチノミセス、ケラチノミセス、ナンニジア、アルスロデルマ、クテノミセス、オルビジウム、フィソデマ、シノキトリウム、フィトフォラ、バーチシリウム、グリオクラジウム、リチスマ、スクレロチニア、オフィオストマ、ロフィオデルミウム、エルシノエ、カブノジウム、ミコスファエレラ、ベンツリア、ゲウマンノミセス、アルテルナリア、ビボラリス、ボトリチス、セルコスボラ、ジプロジア、ドゥレスクレラ、エキセルオヒルム、フォーマ、フォモシス、リソクトニア、プシニア、エリスフェ、フィルラクチニア、ウンシヌラ、フラグミジウム、メラムソラ、ユーチファ、ヒポシキロン、キシラリア、セラトバシジウム、ヘテロバシジウム、タナテホルスおよびアルミルラリアの属からなる群より選択される使用。

[47][45]に記載の使用であって、真菌が皮膚糸状菌である使用。

[48][47]に記載の使用であって、皮膚糸状菌真菌が、エピデルモフィトン種、ミクロスポルム種およびトリコフィトン種からなる群より選択される使用。

[49][42]～[44]の何れか1つに記載の使用であって、状態および／または疾患が、小孢子性の白癬、頭部白癬、禿瘡、白癬疹の頭部白癬、「ソラマメ」白癬、白癬性毛瘡、体部白癬、足部白癬、頑癬、耳白癬、渦状癬、爪白癬、癬風、ピチロスポルム毛嚢炎、黒癬、黒色砂毛症、トリコスボロン症、口腔カンジダ症、陰門腔カンジダ症、亀頭包皮カンジダ症、間擦部カンジダ症、小胞カンジダ症、皮膚粘膜カンジダ症、パラコクシジオイデス症、ロボ真菌症、クロモミコーシス、スポロトリクム症、ユーミセトーマ、ヒストプラズマ症、フェオフィホ真菌症、エントモフトロミコーシス、ムコール菌症、クリプトコッカス症、コクシジオイデス症、北アメリカ分芽菌症および／またはリノスポリジウム症からなる群より選択される使用。

[50][42]～[44]の何れか1項に記載の使用であって、微生物が細菌である使用。

[51][50]に記載の使用であって、細菌が、アクチノミセス、コリネバクテリウム、マイコバクテリウム、ノカルジア、バチルス、ビフィドバクテリウム、クロストリジウム、エリジペロスリックス、リステリア、スタフィロコッカス、ストレプトコッカス、ニューモコッカス、アナプラズマ、エールリヒア、ネオリケッチア、ウォルバキア、バクテリオイデス、バルトネラ、ボルデテラ、ボレリア、ブルセラ、ブルクホルデリア、カンピロバクター、クラミジア、クラミドフィラ、エシェリキア、クレブシエラ、プロテウス、サル

モネラ、セラチア、エルシニア、フゾバクテリウム、ヘリコバクター、アシネトバクター、マイコプラズマ、ウレアプラズマ、ナイセリア、メニンゴコッカス、アクチノバチルス、ヘモフィルス、パスツレラ、シュードモナス、リケッチアおよびトレポネーマの属からなる群より選択される使用。

[52][42]~[44]の何れか1つに記載の使用であって、状態および／または疾患が放線菌症、ウップル病、ジフテリア、紅色陰癰ハンセン病、ブルーリ潰瘍、ヨーネ病、結核、結核腫、心膜炎、紅斑、菌腫、炭疽病、ボツリヌス中毒症、腸炎、腸性毒血症、ガス壊疽、破傷風、丹毒、髄膜炎、肺炎、せつ腫症、膿瘍疹、心内膜炎、リウマチ熱、アナプラズマ病、エールリヒア症、血管腫症、ブルセラ症、類鼻疽症、結膜炎、鼠径性病性リンパ肉芽腫、トラコーマ、オウム病、赤痢、肉芽腫、腸チフス、パラチフス、歯肉炎、レジオネラ症、レプトスピラ症、胸膜肺炎、淋病、発疹チフス、ペインツ、梅毒、癌、神経梅毒、ツラレミアおよびコレラからなる群より選択される使用。

[53][42]~[44]の何れか1つに記載の使用であって、微生物が原生動物である使用。

[54][53]に記載の使用であって、原生動物が、プラスモジウム、トキソプラズマ、バランチジウム、コクシジア、クリプトスポリジウム、シロスポラ、イソスポーラ、サルコシスチス、バベシア、タイレリア、ジエントアメーバ、ジアルジア、レーシュマニア、アカントアメーバ、プラストシスチス、アナプラズマ、エールリヒア、トリコモナス、トリパノソーマ、ジアルジアおよびエントアメーバの属からなる群より選択される使用。

[55][42]~[44]の何れか1つに記載の使用であって、状態および／または疾患がマラリア、トキソプラズマ症、バランチジウム症、コクシジウム症、クリプトスポリジウム症、シクロスポラ症、イソスポーラ症、肉孢子虫症、バベシア症、交疫、タイレリア症、トリパノソーマ症、二核アメーバ症、ジアルジア症、レーシュマニア症、トリコモナス症、シャーガス病、アメーバ症およびアメーバ赤痢からなる群より選択される使用。

[56]微生物に関連する個体における状態および／または疾患の治療および／または予防のための医薬の製造のための[1]~[11]の何れか1つに記載の化合物またはその混合物の使用。

[57][56]に記載の使用であって、個体が哺乳動物である使用。

[58][57]に記載の使用であって、哺乳動物がヒトである使用。

[59][56]~[58]の何れか1項に記載の使用であって、微生物が真菌である使用。

[60][59]に記載の使用であって、真菌がアスペルギルス、ミクロスポルム、エピデルモフィトン、トリコフィトン、カンジダ、フィコミセス、ジゴミセス、リゾプス、ムコール、アブシジア、マラセジア、エクソフィアラ、ピエドライア、トリコスポルム、スポロトリクス、クラドスポリウム、フィアロフォラ、ホセカエア、ヒストプラスマ、コクシジオイデス、フザリウム、ペニシリウム、プレストミセス、クリプトコッカス、パラコクシジオイデス、スセドスポリウム、サッカロミセス、ピエドライア、アクチノミセス、ケラチノミセス、ナンニジア、アルスロデルマ、クテノミセス、オルピジウム、フィソデマ、シノキトリウム、フィトフォラ、バーチシリウム、グリオクラジウム、リチスマ、スクレロチニア、オフィオストマ、ロフィオデルミウム、エルシノエ、カプノジウム、ミコスファエレラ、ベンツリア、ゲウマンノミセス、アルテルナリア、ビボラリス、ボトリチス、セルコスボラ、ジプロジア、ドゥレスクレラ、エキセルオヒルム、フォーマ、フォモシス、リソクトニア、プシニア、エリスフェ、フィルラクチニア、ウンシヌラ、フラグミジウム、メラムソラ、ユーチファ、ヒボシキロン、キシラリア、セラトバシジウム、ヘテロバシジウム、タナテホルスおよびアルミルラリアの属からなる群より選択される使用。

[61][59]に記載の使用であって、真菌が皮膚糸状菌である使用。

[62][61]に記載の使用であって、皮膚糸状菌真菌が、エピデルモフィトン種、ミクロスポルム種およびトリコフィトン種からなる群より選択される使用。

[63][56]~[58]の何れか1つに記載の使用であって、状態および／または疾患が、小孢子性の白癬、頭部白癬、禿瘡、頭部白癬の運動選手の足、「ソラマメ」白癬、白癬性毛瘡、体部白癬、足部白癬、頑癬、耳白癬、渦状癬、爪白癬、癬風、ピチロスポルム毛嚢

炎、黒癬、黒色砂毛症、トリコスボロン症、口腔カンジダ症、陰門腔カンジダ症、亀頭包皮カンジダ症、間擦部カンジダ症、小胞カンジダ症、皮膚粘膜カンジダ症、パラコクシジオイデス症、ロボ真菌症、クロモミコーシス、スポロトリクム症、ユーミセトーマ、ヒストプラスマ症、フェオフィホ真菌症、エントモフトロミコーシス、ムコール菌症、クリプトコッカス症、コクシジオイデス症、北アメリカ分芽菌症および／またはリノスポリジウム症からなる群より選択される使用。

[64][56]～[58]の何れか1つに記載の使用であって、微生物が細菌である使用。

[65][64]に記載の使用であって、細菌がアクチノミセス、コリネバクテリウム、マイコバクテリウム、ノカルジア、バチルス、ビフィドバクテリウム、クロストリジウム、エリジペロスリックス、リステリア、スタフィロコッカス、ストレプトコッカス、ニューモコッカス、アナプラズマ、エールリヒア、ネオリケッチア、ウォルバキア、バクテリオイデス、バルトネラ、ボルデテラ、ボレリア、ブルセラ、ブルクホルデリア、カンピロバクター、クラミジア、クラミドフィラ、エシェリキア、クレブシエラ、プロテウス、サルモネラ、セラチア、エルシニア、フゾバクテリウム、ヘリコバクター、アシネトバクター、マイコプラズマ、ウレアプラズマ、ナイセリア、メニンゴコッカス、アクチノバチルス、ヘモフィルス、パスツレラ、シュードモナス、リケッチアおよびトレポネーマの属からなる群より選択される使用。

[66][56]～[58]の何れか1項に記載の使用であって、状態および／または疾患が放線菌症、ウップル病、ジフテリア、紅色陰癬ハンセン病、ブルーリ潰瘍、ヨーネ病、結核、結核腫、心膜炎、紅斑、菌腫、炭疽病、ボツリヌス中毒症、腸炎、腸性毒血症、ガス壊疽、破傷風、丹毒、髄膜炎、肺炎、せつ腫症、膿痂疹、心内膜炎、リウマチ熱、アナプラズマ病、エールリヒア症、血管腫症、ブルセラ症、類鼻疽症、結膜炎、鼠径性病性リンパ肉芽腫、トラコーマ、オウム病、赤痢、肉芽腫、腸チフス、パラチフス、歯肉炎、レジオネラ症、レプトスピラ症、胸膜肺炎、淋病、発疹チフス、ペインツ、梅毒、癌、神経梅毒、ツラレミアおよびコレラからなる群より選択される使用。

[67][56]～[58]の何れか1つに記載の使用であって、微生物が原生動物である使用。

[68][67]に記載の使用であって、原生動物がプラスモジウム、トキソプラズマ、バランチジウム、コクシジア、クリプトスポリジウム、シロスポラ、イソスポーラ、サルコシスチス、バベシア、タイレリア、ジエントアメーバ、ジアルジア、レーシュマニア、アカントアメーバ、ブラストシスチス、アナプラズマ、エールリヒア、トリコモナス、トリパノソーマ、ジアルジアおよびエントアメーバの属からなる群より選択される使用。

[69][56]～[58]の何れか1つに記載の使用であって、状態および／または疾患が、マラリア、トキソプラズマ症、バランチジウム症、コクシジウム症、クリプトスポリジウム症、シクロスポラ症、イソスポーラ症、肉胞子虫症、バベシア症、交疫、タイレリア症、トリパノソーマ症、二核アメーバ症、ジアルジア症、レーシュマニア症、トリコモナス症、シャーガス病、アメーバ症およびアメーバ赤痢からなる群より選択される使用。

[70]微生物の増殖および／または生存を阻害するための薬物の製造のための[1]～[11]の何れか1つに記載の化合物またはその混合物の使用。

[71][70]に記載の使用であって、微生物が真菌である使用。

[72][71]に記載の使用であって、真菌がアスペルギルス、ミクロスポルム、エピデルモフィトン、トリコフィトン、カンジダ、フィコミセス、ジゴミセス、リゾプス、ムコール、アブシジア、マラセジア、エクソフィアラ、ピエドライア、トリコスボルム、スポロトリクス、クラドスポリウム、フィアロフォラ、ホセカエア、ヒストプラスマ、コクシジオイデス、フザリウム、ペニシリウム、プレストミセス、クリプトコッカス、パラコクシジオイデス、スセドスポリウム、サッカロミセス、ピエドライア、アクチノミセス、ケラチノミセス、ナンニジア、アルスロデルマ、クテノミセス、オルビジウム、フィソデマ、シノキトリウム、フィトフォラ、バーチシリウム、グリオクラジウム、リチスマ、スクレロチニア、オフィオストマ、ロフィオデルミウム、エルシノエ、カプノジウム、ミコスファエレラ、ベンツリア、ゲウマンノミセス、アルテルナリア、ビボラリス、ボトリチス、

セルコスボラ、ジプロジア、ドゥレスクレラ、エキセルオヒルム、フォーマ、フォモシス、リソクトニア、プシニア、エリスフェ、フィルラクチニア、ウンシヌラ、フラグミジウム、メラムソラ、ユーチファ、ヒポシキロン、キシラリア、セラトバシジウム、ヘテロバシジウム、タナテホルスおよびアルミルラリからなる群より選択される使用。

[73][71]に記載の使用であって、真菌が皮膚糸状菌である使用。

[74][73]に記載の使用であって、皮膚糸状菌真菌がエピデルモフィトン種、ミクロスポルム種およびトリコフィトン種からなる群より選択される使用。

[75][70]に記載の使用であって、微生物が細菌である使用。

[76][75]に記載の使用であって、細菌が、アクチノミセス、コリネバクテリウム、マイコバクテリウム、ノカルジア、バチルス、ビフィドバクテリウム、クロストリジウム、エリジペロスリックス、リステリア、スタフィロコッカス、ストレプトコッカス、ニューモコッカス、アナプラズマ、エールリヒア、ネオリケッチア、ウォルバキア、バクテリオイデス、バルトネラ、ボルデテラ、ボレリア、ブルセラ、ブルクホルデリア、カンピロバクター、クラミジア、クラミドフィラ、エシェリキア、クレブシエラ、プロテウス、サルモネラ、セラチア、エルシニア、フゾバクテリウム、ヘリコバクター、アシネトバクター、マイコプラズマ、ウレアプラズマ、ナイセリア、メニンゴコッカス、アクチノバチルス、ヘモフィルス、パスツレラ、シュードモナス、リケッチアおよびトレボネーマの属からなる群より選択される使用。

[77][70]に記載の使用であって、微生物が原生動物である使用。

[78][77]に記載の使用であって、原生動物が、プラスモジウム、トキソプラズマ、バランチジウム、コクシジア、クリプトスポリジウム、シロスポラ、イソスポーラ、サルコシスチス、バベシア、タイレリア、ジエントアメーバ、ジアルジア、レーシュマニア、アカントアメーバ、プラストシスチス、アナプラズマ、エールリヒア、トリコモナス、トリパノソーマ、ジアルジアおよびエントアメーバの属からなる群より選択される使用。

[79]抗真菌剤としての[1]～[11]の何れか1つに記載の化合物またはその混合物の使用。

[80]静真菌剤および／または殺真菌剤としての[79]に記載の使用。

[81][1]～[11]の何れか1項に記載の化合物またはその混合物の使用であって、抗真菌活性を有する薬物の製造のための使用。

[82][81]に記載の使用であって、薬物が静真菌性および／または殺真菌性活性を有する使用。

[83]微生物に関連する状態および／または疾患を治療および／または予防する方法であって、[1]～[11]の何れか1つに記載の少なくとも1つの化合物またはその混合物の有効量を哺乳動物に投与することを含む方法。

[84]活性成分としての[1]～[11]の何れか1つに記載の少なくとも1つの化合物と、1または1つ以上の薬学的に許容可能な賦形剤とを含む薬学的組成物。

[85]活性成分として、

1-[2-(2,4-ジクロロフェニル)-2-{[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}エチル]-1H-イミダゾール、またはその薬学的に許容される塩；1-[2-(2,4-ジクロロフェニル)-2-{[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}エチル]-1H-1,2,4-トリアゾール；1-[2-(2,4-ジクロロフェニル)-2-{[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}エチル]-4H-1,2,4-トリアゾール；1-[2-(2,4-ジクロロフェニル)]-2-(4-{[4-(トリフルオロメチル)ベンジル]オキシ}エチル)-1H-イミダゾール；1-{2-[4-(4'-クロロビフェニル-4-イル)メトキシ]-2-(2,4-ジクロロフェニル)エチル}-1H-イミダゾール；および1-[2-(ビフェニル4-イルメトキシ)-2-(2,4-ジクロロフェニル)エチル]-1H-イミダゾール；からなる群より選択される少なくとも1つの化合物と、1または1つ以上の薬学的に許容される賦形剤とを含む薬学的組成物。

[86][84]～[85]の何れかの記載の薬学的組成物であって、局所、経口、非経口また

は腹腔内投与のための医薬組成物。

[8 7] [8 6] に記載の薬学的組成物であって、局所投与のための薬学的組成物。

[8 8] [8 6] に記載の薬学的組成物であって、経口投与のための薬学的組成物。

[8 9] [8 4] および [8 5] の何れかに記載の薬学的組成物であって、活性成分の濃度が 0 . 0 0 1 ~ 1 0 0 0 m g の範囲内で変更される薬学的組成物。

[9 0] 活性成分としての [1] ~ [1 1] の何れか 1 つに記載の少なくとも 1 つの化合物と、
1 または 1 つ以上の薬学的に許容される賦形剤とを含む医薬。