

【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7月4日 (2013.7.4)

【公表番号】特表2009-544676(P2009-544676A)

【公表日】平成21年12月17日 (2009.12.17)

【年通号数】公開・登録公報2009-050

【出願番号】特願2009-521335(P2009-521335)

【国際特許分類】

C 0 7 D 207/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/40 (2006.01)

A 6 1 P 31/10 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/127 (2006.01)

A 6 1 K 9/12 (2006.01)

C 0 7 D 211/72 (2006.01)

A 6 1 K 31/44 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

C 0 7 D 223/12 (2006.01)

C 0 7 D 267/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

C 0 7 D 243/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 241/20 (2006.01)

C 0 7 D 281/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/554 (2006.01)

C 0 7 D 295/16 (2006.01)

A 6 1 K 31/495 (2006.01)

A 6 1 K 31/165 (2006.01)

A 6 1 K 31/198 (2006.01)

A 6 1 K 31/216 (2006.01)

A 6 1 K 31/223 (2006.01)

C 0 7 C 237/08 (2006.01)

C 0 7 C 237/12 (2006.01)

C 0 7 K 5/062 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 207/14 C S P

A 6 1 K 31/40 Z N A

A 6 1 P 31/10

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 9/127

A 6 1 K 9/12

C 0 7 D 211/72

A 6 1 K 31/44

A 6 1 K 31/55

C 0 7 D 223/12                      B  
 C 0 7 D 267/10  
 A 6 1 K 31/553  
 A 6 1 K 31/551  
 C 0 7 D 243/08              5 0 7  
 A 6 1 K 31/5377  
 C 0 7 D 403/12  
 C 0 7 D 401/12  
 C 0 7 D 241/20  
 C 0 7 D 281/06  
 A 6 1 K 31/554  
 C 0 7 D 295/16                      A  
 A 6 1 K 31/495  
 A 6 1 K 31/165  
 A 6 1 K 31/198  
 A 6 1 K 31/216  
 A 6 1 K 31/223  
 C 0 7 C 237/08  
 C 0 7 C 237/12  
 C 0 7 K 5/062

## 【誤訳訂正書】

【提出日】平成25年5月15日(2013.5.15)

## 【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

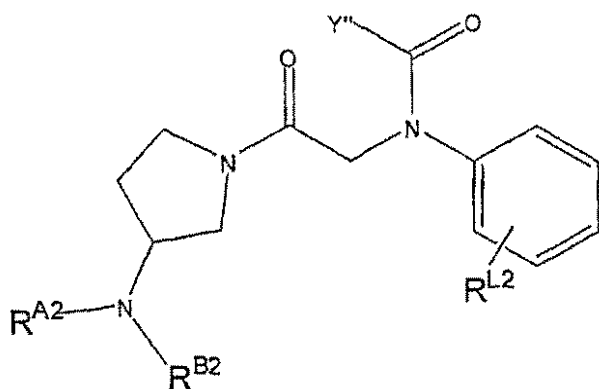
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

以下の式：

【化 1 0】



[ 式中、

$\text{Y}''$  は、Ph、 $-\text{C}_{1-3}$ アルキル Ph および  $-\text{CH}=\text{CHPh}$  からなる群から選択され、  
 Ph は、水素、ハロゲン、 $\text{C}_1-\text{C}_6$ アルキル、 $\text{OR}^{\text{E}2}$ 、 $\text{NR}^{\text{G}2}\text{R}^{\text{H}2}$ 、 $\text{NR}^{\text{G}2}\text{COR}^{\text{W}2}$ 、  
 $\text{NR}^{\text{G}2}\text{SO}_2\text{R}^{\text{W}2}$ 、 $\text{CONR}^{\text{G}2}\text{R}^{\text{H}2}$  および  $\text{SO}_2\text{R}^{\text{W}2}$  からなる群から独立に選択される  $\text{R}^{\text{C}2}$   
 および  $\text{R}^{\text{D}2}$  で置換されており；

$\text{R}^{\text{L}2}$  は、水素、ハロゲン、Ph、OPh および  $\text{OCH}_2\text{Ph}$  からなる群から選択され、  
 Ph はハロゲン、 $\text{C}_1-\text{C}_6$ アルキル、 $\text{OR}^{\text{E}2}$  または  $\text{CO}_2\text{R}^{\text{E}2}$  で置換されていることもあ

り；

$R^{A2}$  および  $R^{B2}$  は、水素、 $C_1 - C_6$  アルキルおよび  $CO_2 R^{F2}$  から独立に選択され；

$R^{E2}$  は、水素または  $C_1 - C_6$  アルキル；

$R^{F2}$  は、 $C_1 - C_6$  アルキル；

$R^{G2}$  および  $R^{H2}$  は独立に、水素または  $C_1 - C_6$  アルキルであるか、または一緒になって、 $NR^{E2}$ 、 $S$  および  $O$  から選択される更なる 1 個のヘテロ原子を含んでもよい 5 または 6 員環の環を形成し；および

$R^{W2}$  は、 $C_1 - C_6$  アルキルである]

で示される化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項 2】

$Y'$  が  $-CH=CHPh$  であり、 $Ph$  は、水素、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $OR^{E2}$ 、 $NR^{G2}R^{H2}$ 、 $NR^{G2}COR^{W2}$ 、 $NR^{G2}SO_2R^{W2}$ 、 $CONR^{G2}R^{H2}$  および  $SO_2R^{W2}$  からなる群から独立に選択される  $R^{C2}$  および  $R^{D2}$  で置換されている請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

$R^{C2}$  および  $R^{D2}$  が水素、ハロゲンおよび  $C_1 - C_6$  アルキルからなる群から独立に選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

$R^{A2}$  は、水素または  $C_1 - C_6$  アルキルである請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

$R^{B2}$  は、水素または  $C_1 - C_6$  アルキルである請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

$R^{L2}$  は、 $Ph$  または  $OPh$  であり、 $Ph$  はハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $OR^{E2}$  または  $CO_2R^{E2}$  で置換されていることもある請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

$R^{C2}$  および  $R^{D2}$  はいずれも水素である請求項 1 に記載の化合物。

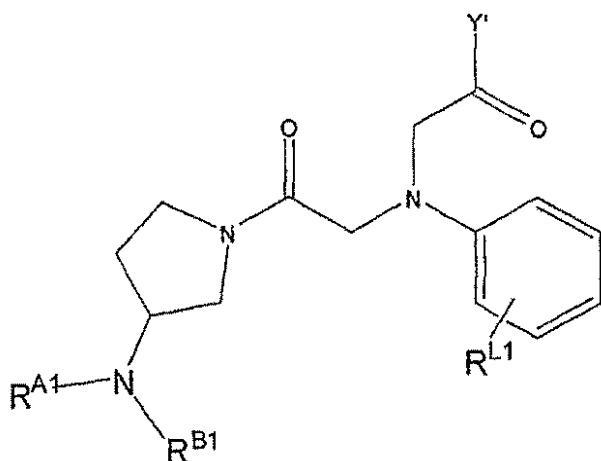
【請求項 8】

$R^{A2}$  および  $R^{B2}$  はいずれも水素である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

次式

【化 1 1】



[ 式中、

$Y'$  は、 $OR^{C1}$  および  $NHR^{D1}$  からなる群から選択され；

$R^{L1}$  は、水素、ハロゲン、 $Ph$ 、 $OPh$  および  $OCH_2Ph$  からなる群から選択され、 $Ph$  はハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $OR^{C1}$  または  $CO_2R^{C1}$  で置換されていることもあり；

$R^{A1}$  および  $R^{B1}$  は、水素、 $C_1 - C_6$  アルキルおよび  $CO_2R^{W1}$  から独立に選択され；

$R^{C1}$  は、水素または  $C_1 - C_6$  アルキル；

$R^{D1}$ は、 $CH_2Ph$ 、 $(CH_2)_2Ph$ または $(CH_2)_2OPh$ であり、 $Ph$ は、 $R^{E1}$ および $R^{F1}$ で置換されており；

$R^{E1}$ および $R^{F1}$ は、水素、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $OR^{C1}$ 、 $NR^{G1}R^{H1}$ 、 $NR^{G1}COR^{W1}$ 、 $NR^{G1}SO_2R^{W1}$ 、 $CONR^{G1}R^{H1}$ または $SO_2R^{W1}$ からなる群から独立に選択され；

$R^{G1}$ および $R^{H1}$ は独立に、水素または $C_1 - C_6$ アルキルであるか、または一緒になって、 $NR^{C1}$ 、 $S$ および $O$ から選択される更なる1個のヘテロ原子を含んでいてもよい5または6員環の環を形成し；および

$R^{W1}$ は、 $C_1 - C_6$ アルキルである]

である化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項10】

$Y'$ は $NHCH_2Ph$ （ここで、 $Ph$ は $R^{E1}$ および $R^{F1}$ で置換されており、 $R^{E1}$ および $R^{F1}$ は水素、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $OR^{C1}$ 、 $NR^{G1}R^{H1}$ 、 $NR^{G1}COR^{W1}$ 、 $NR^{G1}SO_2R^{W1}$ 、 $CONR^{G1}R^{H1}$ または $SO_2R^{W1}$ からなる群から独立に選択される）である請求項9に記載の化合物。

【請求項11】

$R^{E1}$ および $R^{F1}$ は、水素、ハロゲンおよび $C_1 - C_6$ アルキルからなる群から独立に選択される請求項9に記載の化合物。

【請求項12】

$R^{A1}$ は、水素または $C_1 - C_6$ アルキルである請求項9に記載の化合物。

【請求項13】

$R^{B1}$ は、水素または $C_1 - C_6$ アルキルである請求項9に記載の化合物。

【請求項14】

$R^{L1}$ は、 $OPh$ または $OCH_2Ph$ であり、 $Ph$ は置換されていないかまたはハロゲンまたは $C_1 - C_6$ アルキルで置換されている請求項9に記載の化合物。

【請求項15】

$R^{E1}$ および $R^{F1}$ がそれぞれ水素である請求項9に記載の化合物。

【請求項16】

$R^{A1}$ および $R^{B1}$ はいずれも水素である請求項9に記載の化合物。

【請求項17】

$R^{L1}$ は、メタ位またはパラ位の $OPh$ または $OCH_2Ph$ であり、 $Ph$ は置換されていないかまたはハロゲンまたは $C_1 - C_6$ アルキルで置換されている請求項9に記載の化合物。

【請求項18】

真菌感染の処置のための医薬の製造のための請求項1～17のいずれか記載の化合物の使用。

【請求項19】

真菌感染が*Candida*または*Aspergillus*により引き起こされる請求項18に記載の使用。

【請求項20】

請求項1～17のいずれか記載の化合物および製薬的に許容し得る希釈剤または担体を含有する医薬組成物。

【請求項21】

該化合物が*C.albicans*増殖に対して $8 \mu M \sim 55 \mu M$ の $IC_{50}$ を有する請求項19記載の使用。

【請求項22】

該化合物が*A.fumigatus*増殖に対して $4 \mu M \sim 93 \mu M$ の $IC_{50}$ を有する請求項19記載の使用。

【請求項23】

該化合物が*C.albicans*のグルカン生合成に対して $3 \mu M \sim 34 \mu M$ の $IC_{50}$ を有する請

求項 1 9 記載の使用。

【請求項 2 4】

該化合物が *A. fumigatus* の グルカン生合成 に対して 4  $\mu$  M ~ 9 3  $\mu$  M の  $IC_{50}$  を有する  
請求項 1 9 記載の使用。

【請求項 2 5】

前記医薬が補助的な抗真菌化合物と組み合わせて投与されるものである、請求項 1 8 記載の使用。

【請求項 2 6】

さらなる抗真菌化合物がアニデュラファンギン、カスポファンギン、ミカファンギン、ナタマイシン、リモシジン、ナイスタチン、アムホテリシン B、ミコナゾール、ケトコナゾール、クロトリマゾール、エコナゾール、ピフォナゾール、ブトコナゾール、フェンチコナゾール、イソコナゾール、オキシコナゾール、セルタコナゾール、スルコナゾール、チオコナゾール、トリアゾール、フルコナゾール、イトラコナゾール、イサブコナゾール、ラブコナゾール、ボサコナゾール、ポリコナゾール、テルコナゾール、テルピナフィン、アモロルフィン、ナフチフィン、ブテナフィン、シクロピロックスオラミン、5 - フルオロシトシン、ゲンチアナ・バイオレット、ハロプロジン、トルナフテート、またはウンデシレン酸である請求項 2 5 記載の使用。

【請求項 2 7】

前記医薬がさらなる抗真菌化合物とは別の投与経路で投与されるものである、請求項 2 5 の使用。

【請求項 2 8】

真菌感染がブラストミセス症、白癬、コクシジオイドミコーシス、クリプトコッカス症、カンジダ症、モニリア症、皮膚真菌症、皮膚糸状菌症、黄癬、角膜真菌症、フィコミコーシス、スポトリウム症、またはリノスポリジウム症である、請求項 1 8 記載の使用。

【請求項 2 9】

免疫抑制状態にある患者の処置のための医薬の製造のための請求項 1 ~ 1 7 のいずれか記載の化合物の使用。

【請求項 3 0】

患者が A I D S、癌、重症複合免疫不全症、結核、糖尿病、静脈内薬物乱用、または重度の火傷に冒されている請求項 2 9 記載の使用。

【請求項 3 1】

患者が免疫抑制治療を受けている請求項 2 9 記載の使用。

【請求項 3 2】

慢性的な抗生物質、コルチコステロイド処置、長期間の静脈内カテーテル、または長期間の尿道カテーテルの使用を受けている患者の処置のための医薬の製造のための請求項 1 ~ 1 7 のいずれか記載の化合物の使用。

【請求項 3 3】

前記医薬が免疫抑制剤と組み合わせて投与されるものである請求項 1 8 記載の使用。

【請求項 3 4】

前記医薬が化学療法剤と組み合わせて投与されるものである請求項 1 8 記載の使用。

【請求項 3 5】

前記医薬が抗炎症剤と組み合わせて投与されるものである請求項 1 8 記載の使用。

【請求項 3 6】

前記医薬が抗生物質と組み合わせて投与されるものである請求項 1 8 記載の使用。

【請求項 3 7】

前記医薬が抗 H I V 化合物と組み合わせて投与されるものである請求項 1 8 記載の使用。

。

【請求項 3 8】

前記医薬が抗糖尿病薬と組み合わせて投与されるものである請求項 1 8 記載の使用。

【請求項 3 9】

前記医薬が経口、局所的、経皮、静脈内、皮下、皮内、筋肉内、鼻内、直腸、経膈、口腔、または舌下投与されるものである、請求項 1 8 記載の使用。

【請求項 4 0】

前記医薬がクリーム、軟膏、ペースト、ジェル、スプレー、またはリボソーム調製物として投与されるものである請求項 1 8 記載の使用。