

【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 18 年 1 月 5 日 (2006.1.5)

【公表番号】特表 2004-534848 (P2004-534848A)

【公表日】平成 16 年 11 月 18 日 (2004.11.18)

【年通号数】公開・登録公報 2004-045

【出願番号】特願 2003-512202 (P2003-512202)

【国際特許分類】

**C 0 7 C 327/56 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/175 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/275 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/337 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/34 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/341 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/381 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/404 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/42 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/4406 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/5377 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/661 (2006.01)**

**A 6 1 P 35/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

**C 0 7 D 209/42 (2006.01)**

**C 0 7 D 213/82 (2006.01)**

**C 0 7 D 261/18 (2006.01)**

**C 0 7 D 305/14 (2006.01)**

**C 0 7 D 307/68 (2006.01)**

**C 0 7 D 333/38 (2006.01)**

**C 0 7 D 333/70 (2006.01)**

【 F I 】

C 0 7 C 327/56

A 6 1 K 31/175

A 6 1 K 31/275

A 6 1 K 31/337

A 6 1 K 31/34

A 6 1 K 31/341

A 6 1 K 31/381

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/42

A 6 1 K 31/4406

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/661

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

C 0 7 D 209/42

C 0 7 D 213/82

C 0 7 D 261/18

C 0 7 D 305/14

C 0 7 D 307/68

C O 7 D 333/38

C O 7 D 333/70

## 【手続補正書】

【提出日】平成17年7月8日(2005.7.8)

## 【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

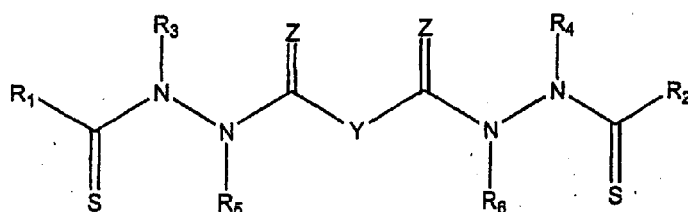
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の構造式：

【化1】



(式中、Yは共有結合、フェニレン基または置換もしくは非置換直鎖ヒドロカルビル基であるか、あるいはYが結合された両>C=Z基と一緒に置換もしくは非置換芳香族基であり；

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は独立してアリール基または置換アリール基であり；

R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は独立して-H、脂肪族基、置換脂肪族基、アリール基または置換アリール基であり；

R<sub>5</sub>～R<sub>6</sub>は独立して-H、脂肪族基、置換脂肪族基、アリール基または置換アリール基であり；

Zは=Oまたは=Sであり；

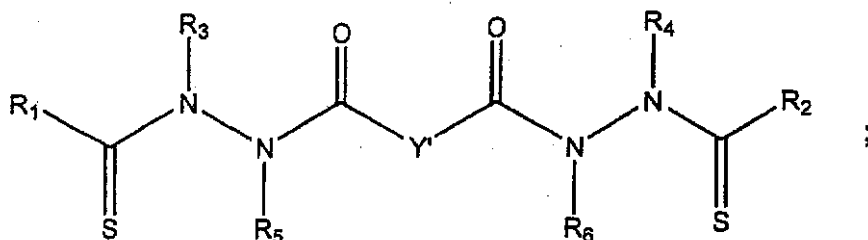
Yが-CH<sub>2</sub>-であり、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>が共にフェニルであり、R<sub>5</sub>～R<sub>6</sub>が全て-Hである場合、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共にフェニルではない)

で表される化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項2】

化合物が以下の構造式：

【化2】



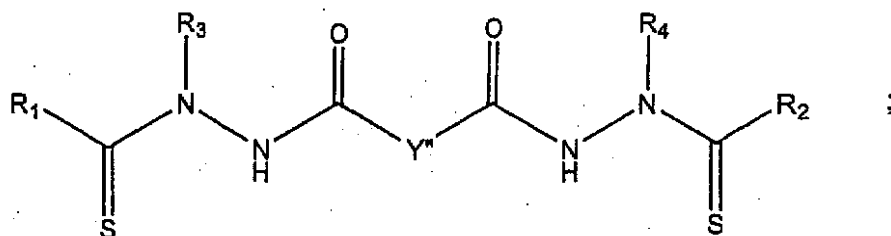
(式中、Y'は共有結合または-CR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>-であり、R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>はそれぞれ独立して-H、脂肪族基または置換脂肪族基であるか、あるいはR<sub>7</sub>が-HでありかつR<sub>8</sub>が置換もしくは非置換アリール基であるか、あるいはR<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は一緒になってC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>置換または非置換アルキレン基である)

で表される請求項1記載の化合物。

【請求項3】

化合物が以下の構造式：

## 【化 3】



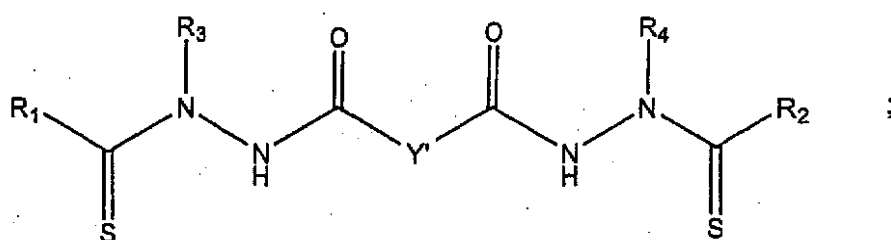
(式中、Y'は共有結合または-CH<sub>2</sub>-である)

で表される請求項 2 記載の化合物。

## 【請求項 4】

化合物が以下の構造式：

## 【化 4】



(式中、Y'は共有結合または-CR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>-である)

で表される請求項 2 記載の化合物。

## 【請求項 5】

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が共にアリール基または置換アリール基であり、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>が共に低級アルキル基または置換低級アルキル基である請求項 4 記載の化合物。

## 【請求項 6】

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が共にフェニルまたは置換フェニルであり、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>が共にメチル、エチル、フェニル、またはチエニルである請求項 5 記載の化合物。

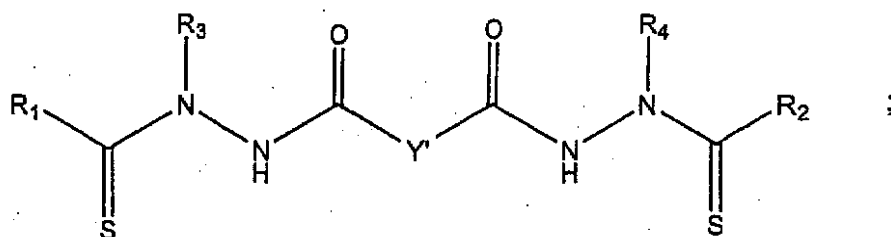
## 【請求項 7】

R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>が共にメチルであるか、またはR<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>が一緒になってプロピレンもしくはブチレンであるか、またはR<sub>7</sub>が-Hであり、R<sub>8</sub>が低級アルキル、チエニル、フェニルまたはベンジルである請求項 6 記載の化合物。

## 【請求項 8】

以下の構造式：

## 【化 5】



(式中、Y'は共有結合または-CR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>-であり；

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に置換または非置換アリール基であり；

R<sub>3</sub> およびR<sub>4</sub>は共に-H、メチルまたはエチルであり；

R<sub>7</sub>は-Hであり、R<sub>8</sub>は-Hまたはメチルである)

で表される化合物またはその生理的に許容され得る塩。

## 【請求項 9】

$R_1$  および  $R_2$  が共に、

## 【化 6】

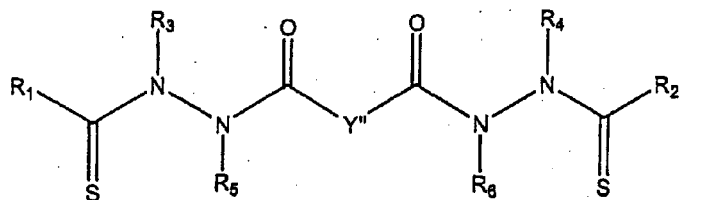
-OH, -Br, -Cl, -I, -F, -OR<sup>a</sup>, -O-COR<sup>a</sup>, -COR<sup>a</sup>, -CN, -NO<sub>2</sub>, -COOH, -SO<sub>3</sub>H, -NH<sub>2</sub>, -NHR<sup>a</sup>, -N(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -COOR<sup>a</sup>, -CHO, -CONH<sub>2</sub>, -CONHR<sup>a</sup>, -CON(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -NHCOR<sup>a</sup>, -NRCOR<sup>a</sup>, -NHCONH<sub>2</sub>, -NHCONR<sup>a</sup>H, -NHCON(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -NR<sup>c</sup>CONH<sub>2</sub>, -NR<sup>c</sup>CONR<sup>a</sup>H, -NR<sup>c</sup>CON(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -C(=NH)-NH<sub>2</sub>, -C(=NH)-NHR<sup>a</sup>, -C(=NH)-N(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -C(=NR<sup>c</sup>)-NH<sub>2</sub>, -C(=NR<sup>c</sup>)-NHR<sup>a</sup>, -C(=NR<sup>c</sup>)-N(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -NH-C(=NH)-NH<sub>2</sub>, -NH-C(=NH)-NHR<sup>a</sup>, -NH-C(=NH)-N(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -NH-C(=NR<sup>c</sup>)-NH<sub>2</sub>, -NH-C(=NR<sup>c</sup>)-NHR<sup>a</sup>, -NH-C(=NR<sup>c</sup>)-N(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -NR<sup>d</sup>H-C(=NH)-NH<sub>2</sub>, -NR<sup>d</sup>-C(=NH)-NHR<sup>a</sup>, -NR<sup>d</sup>-C(=NH)-N(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -NR<sup>d</sup>-C(=NR<sup>c</sup>)-NH<sub>2</sub>, -NR<sup>d</sup>-C(=NR<sup>c</sup>)-NHR<sup>a</sup>, -NR<sup>d</sup>-C(=NR<sup>c</sup>)-N(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -NHNH<sub>2</sub>, -NHNHR<sup>a</sup>, -NHR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>NHR<sup>a</sup>, -SO<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -CH=CHR<sup>a</sup>, -CH=CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -CR<sup>c</sup>=CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -CR<sup>c</sup>=CHR<sup>a</sup>, -CR<sup>c</sup>=CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -CCR<sup>a</sup>, -SH, -SR<sup>a</sup>, -S(O)R<sup>a</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>a</sup>,

アルキル基、置換アルキル基、非芳香族複素環基、置換非芳香族複素環基、ベンジル基、置換ベンジル基、アリール基または置換アリール基(式中、 $R^a \sim R^d$ はそれぞれ独立してアルキル基、置換アルキル基、ベンジル、置換ベンジル、芳香族または置換芳香族基であるか、または一緒になった- $NR^aR^d$ はまた置換もしくは非置換非芳香族複素環基を形成し得る)から選択される1つ以上の基で置換されたフェニルである請求項 8 記載の化合物。

## 【請求項 10】

化合物が以下の構造式：

## 【化 7】



(式中、 $Y''$ は共有結合または-CH<sub>2</sub>である)

で表される請求項 2 記載の化合物。

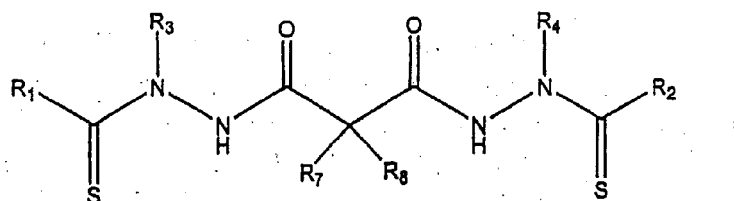
## 【請求項 11】

$R_5$  および  $R_6$  が共に低級アルキル基またはフェニル基である請求項 10 記載の化合物。

## 【請求項 12】

以下の構造式：

## 【化 8】



(式中、

a)  $R_1$  および  $R_2$  は共にフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である；

b)  $R_1$  および  $R_2$  は共にフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にエチルであり； $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である；

c)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 4-シアノフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  はメチルであり； $R_8$  は -H である；

d)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 4-メトキシフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  および

$R_8$  は共に -H である ;

e)  $R_1$  および  $R_2$  は共にフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり ;  $R_7$  はメチルであり ;  $R_8$  は -H である ;

f)  $R_1$  および  $R_2$  は共にフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にエチルであり ;  $R_7$  はメチルであり ;  $R_8$  は -H である ;

g)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 4-シアノフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり ;  $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である ;

h)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,5-ジメトキシフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり ;  $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である ;

i)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,5-ジメトキシフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり ;  $R_7$  はメチルであり ;  $R_8$  は -H である ;

j)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 3-シアノフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり ;  $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である ;

k)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 3-フルオロフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり ;  $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である ;

l)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 4-クロロフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり ;  $R_7$  はメチルであり ;  $R_8$  は -H である ;

m)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2-ジメトキシフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり ;  $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である ;

n)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 3-メトキシフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり ;  $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である ;

o)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,3-ジメトキシフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり ;  $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である ;

p)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,3-ジメトキシフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり ;  $R_7$  はメチルであり ;  $R_8$  は -H である ;

q)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,5-ジフルオロフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり ;  $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である ;

r)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,5-ジフルオロフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり ;  $R_7$  はメチルであり ;  $R_8$  は -H である ;

s)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,5-ジクロロフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり ;  $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である ;

t)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,5-ジメチルフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり ;  $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である ;

u)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,5-ジメトキシフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり ;  $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である ;

v)  $R_1$  および  $R_2$  は共にフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり ;  $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である ; ならびに

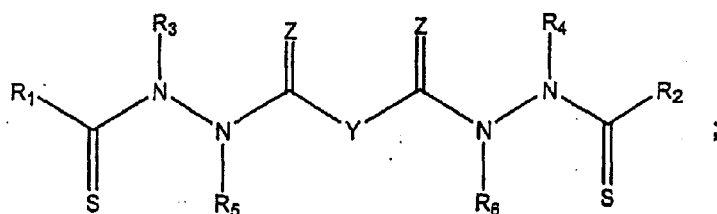
w)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,5-ジメトキシフェニルであり ;  $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり ;  $R_7$  はメチルであり ;  $R_8$  は -H である )

で表される化合物またはその生理的に許容され得る塩。

【請求項 13】

薬学的に許容され得るキャリアまたは希釈剤および以下の構造式：

【化 9】



(式中、

Yは共有結合、フェニレン基または置換もしくは非置換直鎖ヒドロカルビル基であるか、あるいはYが結合された両>C=Z基と一緒に置換もしくは非置換芳香族基であり；

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は独立してアリール基または置換アリール基であり、

R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は独立して-H、脂肪族基、置換脂肪族基、アリール基または置換アリール基であり；

R<sub>5</sub>～R<sub>6</sub>は独立して-H、脂肪族基、置換脂肪族基、アリール基または置換アリール基であり；ならびに

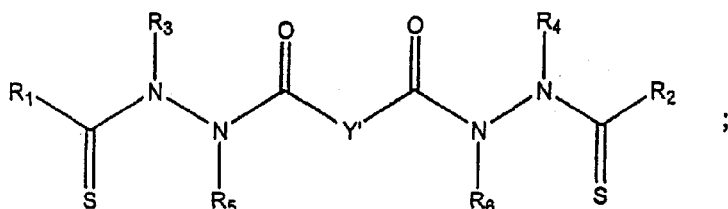
Zは=Oまたは=Sである)

で表される化合物またはその薬学的に許容され得る塩を含んでなる医薬組成物。

【請求項14】

化合物が以下の構造式：

【化10】



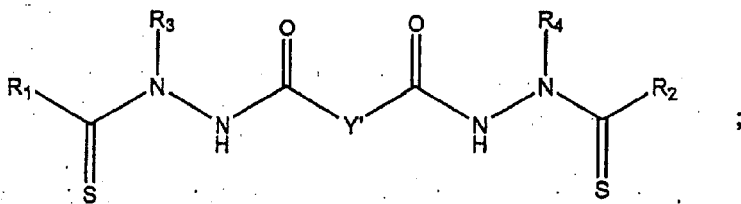
(式中、Y'は共有結合または- $\text{CR}_7\text{R}_8$ -であり、R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は互いに独立して-H、脂肪族基または置換脂肪族基であるか、あるいはR<sub>7</sub>が-HでありかつR<sub>8</sub>が置換もしくは非置換アリール基であるか、あるいはR<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は一緒になってC2～C6置換または非置換アルキレン基である)

で表される請求項13記載の医薬組成物。

【請求項15】

化合物が以下の構造式：

【化11】



(式中、Y'は共有結合または- $\text{CR}_7\text{R}_8$ -である)

で表される請求項14記載の医薬組成物。

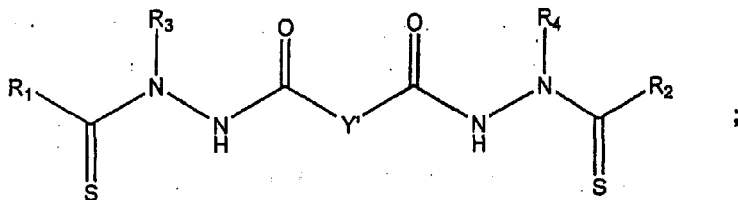
【請求項16】

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が共にフェニルまたは置換フェニルであり、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>がメチル、エチル、フェニル、またはチエニルであり、ならびにR<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>が共にメチルであり、R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は一緒になってプロピレンまたはブチレンであるか、もしくはR<sub>7</sub>が-Hであり、R<sub>8</sub>が低級アルキル、チエニル、フェニルまたはベンジルである請求項15記載の医薬組成物。

【請求項17】

薬学的に許容され得るキャリアまたは希釈剤および以下の構造式：

【化12】



(式中、Y'は共有結合または $-CR_7R_8-$ であり；

$R_1$ および $R_2$ は共に置換または非置換アリール基であり；

$R_3$ および $R_4$ は共に $-H$ 、メチルまたはエチルであり；

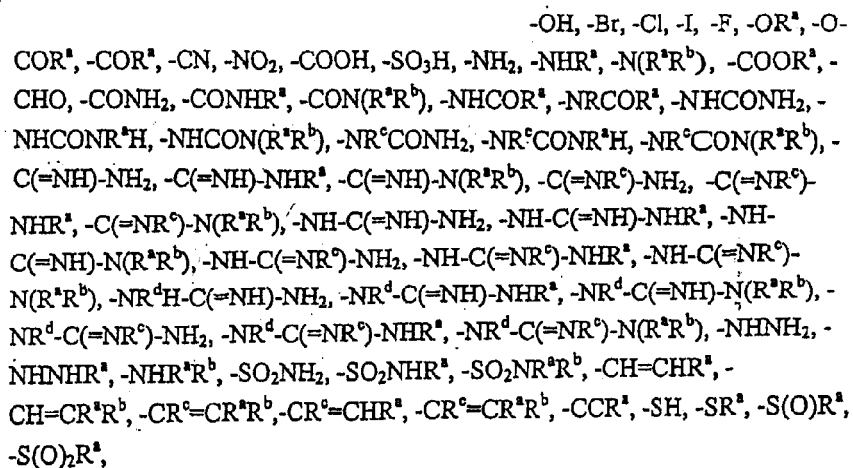
$R_7$ は $-H$ であり $R_8$ は $-H$ またはメチルである）

で表される化合物またはその生理的に許容され得る塩を含んでなる医薬組成物。

【請求項18】

$R_1$ および $R_2$ が共に、

【化13】

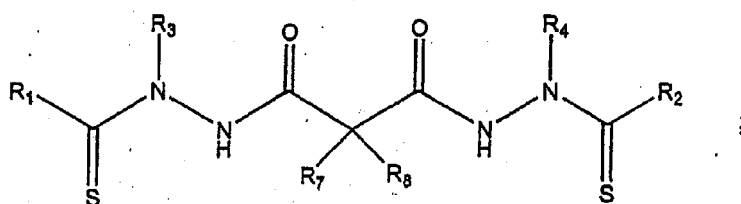


アルキル基、置換アルキル基、非芳香族複素環基、置換非芳香族複素環基、ベンジル基、置換ベンジル基、アリール基または置換アリール基(式中、 $R^a \sim R^d$ はそれぞれ独立してアルキル基、置換アルキル基、ベンジル、置換ベンジル、芳香族または置換芳香族基であるか、または一緒になった $-NR^aR^d$ はまた置換もしくは非置換非芳香族複素環基を形成し得る)から選択される1つ以上の基で置換されたフェニルである請求項17記載の医薬組成物。

【請求項19】

薬学的に許容され得るキャリアまたは希釈剤および以下の構造式：

【化14】



(式中、

a)  $R_1$ および $R_2$ は共にフェニルであり； $R_3$ および $R_4$ は共にフェニルであり； $R_7$ および $R_8$ は共に $-H$ である；

b)  $R_1$ および $R_2$ は共にフェニルであり； $R_3$ および $R_4$ は共にエチルであり； $R_7$ および $R_8$ は共に $-H$ である；

c)  $R_1$ および $R_2$ は共に4-シアノフェニルであり； $R_3$ および $R_4$ は共にメチルであり； $R_7$ はメチルであり； $R_8$ は $-H$ である；

d)  $R_1$ および $R_2$ は共に4-メトキシフェニルであり； $R_3$ および $R_4$ は共にメチルであり； $R_7$ および $R_8$ は共に $-H$ である；

e)  $R_1$ および $R_2$ は共にフェニルであり； $R_3$ および $R_4$ は共にメチルであり； $R_7$ はメチルであり； $R_8$ は $-H$ である；

f)  $R_1$ および $R_2$ は共にフェニルであり； $R_3$ および $R_4$ は共にエチルであり； $R_7$ はメチルであり； $R_8$ は $-H$ である；

g)  $R_1$ および $R_2$ は共に4-シアノフェニルであり； $R_3$ および $R_4$ は共にメチルであり； $R_7$ および $R_8$

は共に -H である；

h)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,5-ジメトキシフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である；

i)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,5-ジメトキシフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  はメチルであり； $R_8$  は -H である；

j)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 3-シアノフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である；

k)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 3-フルオロフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である；

l)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 4-クロロフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  はメチルであり； $R_8$  は -H である；

m)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2-ジメトキシフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である；

n)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 3-メトキシフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である；

o)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,3-ジメトキシフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である；

p)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,3-ジメトキシフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  はメチルであり； $R_8$  は -H である；

q)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,5-ジフルオロフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である；

r)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,5-ジフルオロフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  はメチルであり； $R_8$  は -H である；

s)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,5-ジクロロフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である；

t)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,5-ジメチルフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である；

u)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,5-ジメトキシフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である；

v)  $R_1$  および  $R_2$  は共にフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である；ならびに

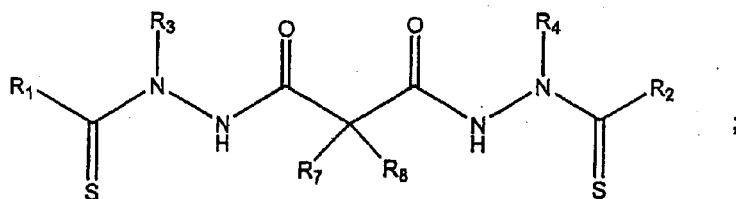
w)  $R_1$  および  $R_2$  は共に 2,5-ジメトキシフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  はメチルであり； $R_8$  は -H である；

で表される化合物またはその生理的に許容され得る塩を含んでなる医薬組成物。

【請求項 20】

薬学的に許容され得るキャリアまたは希釈剤および以下の構造式：

【化 15】



(式中、

$R_1$  および  $R_2$  は共にフェニルであり； $R_3$  および  $R_4$  は共にメチルであり； $R_7$  および  $R_8$  は共に -H である；

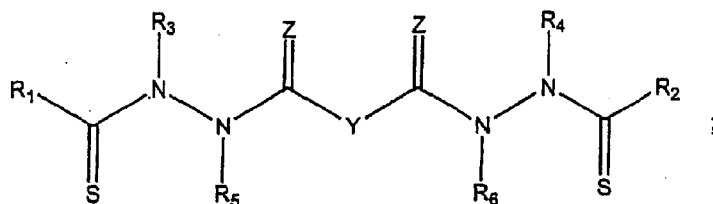
で表される化合物またはその生理的に許容され得る塩を含んでなる医薬組成物。

【請求項 21】

癌を有する被験体を処置するための医薬の製造のための、タキソールまたはタキソールアナログおよび以下の構造式：



## 【化 1 6】



(式中、Yは共有結合、フェニレン基または置換もしくは非置換ヒドロカルビル基であるか、あるいはYが結合された両 $>C=Z$ 基と一緒に置換もしくは非置換芳香族基であり；

$R_1$ および $R_2$ は独立してアリール基または置換アリール基であり；

$R_3$ および $R_4$ は独立して-H、脂肪族基、置換脂肪族基、アリール基または置換アリール基であり；

$R_5 \sim R_6$ は独立して-H、脂肪族基、置換脂肪族基、アリール基または置換アリール基であり；

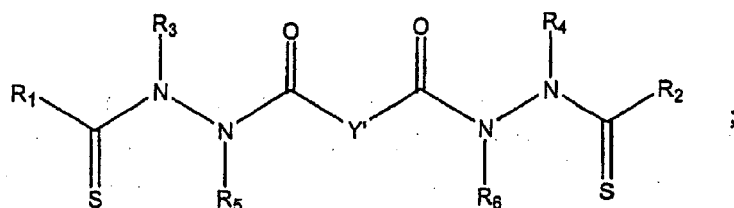
Zは=Oまたは=Sである)

で表される化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

## 【請求項 2 2】

化合物が以下の構造式：

## 【化 1 7】



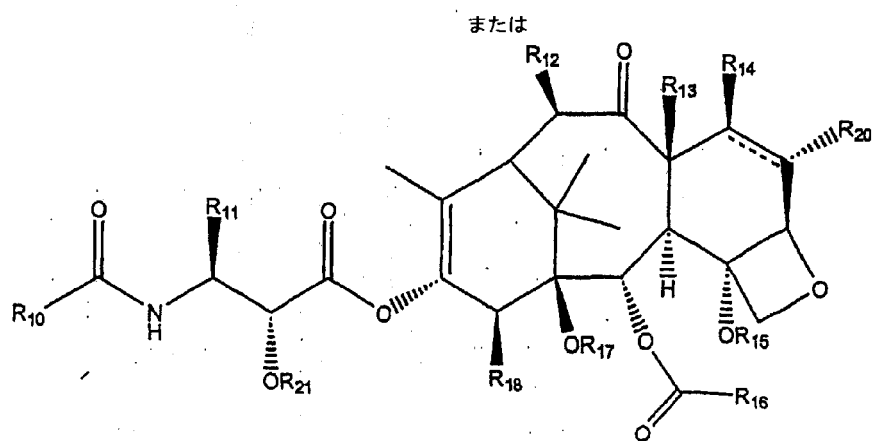
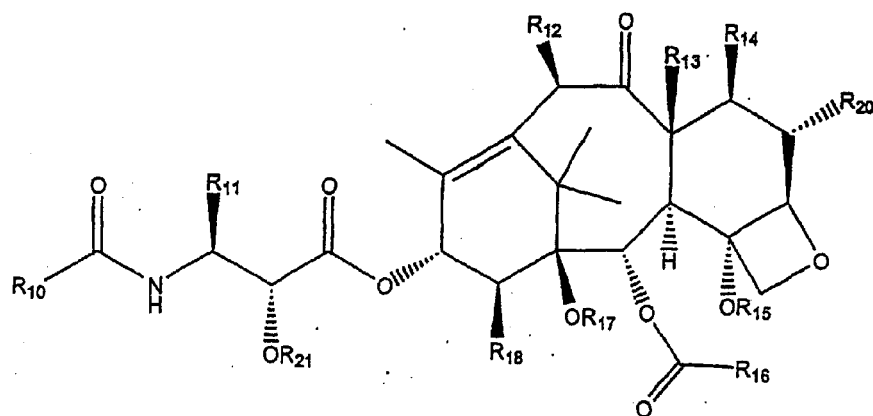
(式中、Y'は共有結合または $-CR_7R_8-$ であり、 $R_7$ および $R_8$ はそれぞれ独立して-H、脂肪族基または置換脂肪族基であるか、あるいは $R_7$ が-Hでありかつ $R_8$ が置換もしくは非置換アリール基であるか、あるいは $R_7$ および $R_8$ は一緒になってC2~C6置換または非置換アルキレン基である)

で表される請求項 2 1 記載の使用。

## 【請求項 2 3】

タキソールアナログが

## 【化 18】



(式中、 $R_{10}$ は低級アルキル基、置換低級アルキル基、フェニル基、置換フェニル基、 $-SR_{19}$ 、 $-NHR_{19}$ または $-OR_{19}$ であり；

$R_{11}$ は低級アルキル基、置換低級アルキル基、アリール基または置換アリール基であり；

$R_{12}$ は $-H$ 、 $-OH$ 、低級アルキル、置換低級アルキル、低級アルコキシ、置換低級アルコキシ、 $-O-C(O)-(低級アルキル)$ 、 $-O-C(O)-(置換低級アルキル)$ 、 $-O-CH_2-O-(低級アルキル)-S-CH_2-O-(低級アルキル)$ であり；

$R_{13}$ は $-H$ 、 $-CH_3$ 、または $R_{14}$ と一緒に $-CH_2-$ であり；

$R_{14}$ は $-H$ 、 $-OH$ 、低級アルコキシ、 $-O-C(O)-(低級アルキル)$ 、置換低級アルコキシ、 $-O-C(O)-(置換低級アルキル)$ 、 $-O-CH_2-O-P(O)(OH)_2$ 、 $-O-CH_2-O-(低級アルキル)$ 、 $-O-CH_2-S-(低級アルキル)$ または $R_{20}$ と一緒に二重結合であり；

$R_{15}$ は $-H$ 、低級アシル、低級アルキル、置換低級アルキル、アルコキシメチル、アルクチオメチル、 $-OC(O)-O(低級アルキル)$ 、 $-OC(O)-O(置換低級アルキル)$ 、 $-OC(O)-NH(低級アルキル)$ または $-OC(O)-NH(置換低級アルキル)$ であり；

$R_{16}$ はフェニルまたは置換フェニルであり；

$R_{17}$ は $-H$ 、低級アシル、置換低級アシル、低級アルキル、置換、低級アルキル、 $(低級アルコキシ)メチル$ または $(低級アルキル)チオメチル$ であり；

$R_{18}$ は $-H$ 、 $-CH_3$ または、 $R_{17}$ ならびに $R_{17}$ および $R_{18}$ が結合された炭素原子と一緒に、5もしくは6員非芳香族複素環式環であり；

$R_{19}$ は低級アルキル基、置換低級アルキル基、フェニル基、置換フェニル基であり；

$R_{20}$ は $-H$ またはハロゲンであり；ならびに

$R_{21}$ は $-H$ 、低級アルキル、置換低級アルキル、低級アシルまたは置換低級アシルである ) から選択される構造式で表される請求項 22 記載の使用。

## 【請求項 24】

$R_{10}$ がフェニル、 $tert$ -ブトキシ、 $-S-CH_2-CH-(CH_3)_2-$ 、 $-S-CH(CH_3)_3$ 、 $-S-(CH_2)_3CH_3$ 、 $-O$

$-\text{CH}(\text{CH}_3)_3-$ 、 $-\text{NH}-\text{CH}(\text{CH}_3)_3$ 、 $-\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$ またはパラ-クロロフェニルであり；

$\text{R}_{11}$ がフェニル、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}_2-$ 、 $-2$ -フラニル、シクロプロピルまたはパラ-トルイルであり；

$\text{R}_{12}$ が $-\text{H}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $\text{CH}_3\text{CO}-$ または $-(\text{CH}_2)_2-\text{N}-$ モルホリノであり；

$\text{R}_{13}$ がメチル、または $\text{R}_{13}$ および $\text{R}_{14}$ と一緒にあって $-\text{CH}_2-$ であり；

$\text{R}_{14}$ が $-\text{H}$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_3$ または $-\text{CH}_2-\text{O}-\text{P}(\text{O})(\text{OH})_2$ であり；

$\text{R}_{15}$ が $\text{CH}_3\text{CO}-$ であり；

$\text{R}_{16}$ がフェニルであり；

$\text{R}_{17}$ が $-\text{H}$ 、または $\text{R}_{17}$ および $\text{R}_{18}$ と一緒にあって $-\text{O}-\text{CO}-\text{O}-$ であり；

$\text{R}_{18}$ が $-\text{H}$ であり；

$\text{R}_{20}$ が $-\text{H}$ または $-\text{F}$ であり；ならびに

$\text{R}_{21}$ が $-\text{H}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{CHBr}-(\text{CH}_2)_{13}-\text{CH}_3$ または $-\text{C}(\text{O})-(\text{CH}_2)_{14}-\text{CH}_3$ ； $-\text{C}(\text{O})-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{OH})-\text{COOH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{CH}_2-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{CH}_2\text{CH}(\text{NH}_2)-\text{CONH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$ または $-\text{C}(\text{O})-\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{CH}_2\text{CH}_3$ である請求項 2 3 記載の使用。

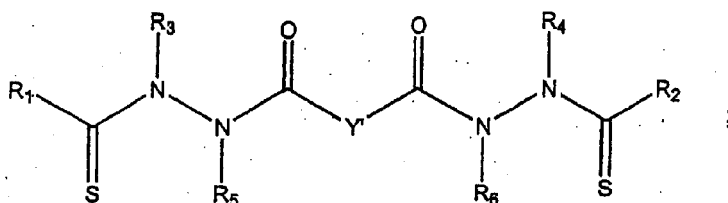
#### 【請求項 2 5】

タキソールアナログが $\text{N}-(2\text{-ヒドロキシプロピル})$ メタクリルアミド、メタクリロイルグリシン-2-ヒドロキシプロピルアミドおよび[2aR[2, 4, 4, 6, 9 (2R, 3S), 11, 12, 12, 12]]-6, 12b-ジアセトキシ-9-[3-ベンズアミド-2-(メタクリロイル-グリシル-L-フェニルアラニル-L-ロイシル-グリシルオキシ)-3-フェニルプロピオニルオキシ]-12-ベンゾイルオキシ-4, 11-ジヒドロキシ-4a, 8, 13, 13-テトラメチル2a, 3, 4, 4a, 5, 6, 9, 10, 11, 12, 12a, 12b-ドデカヒドロ-1H-7, 11-メタノシクロデカ[3, 4]ベンズ[1, 2-b]オキセト-5-オンのコポリマーである請求項 2 2 記載の使用。

#### 【請求項 2 6】

化合物が以下の構造式：

#### 【化 1 9】



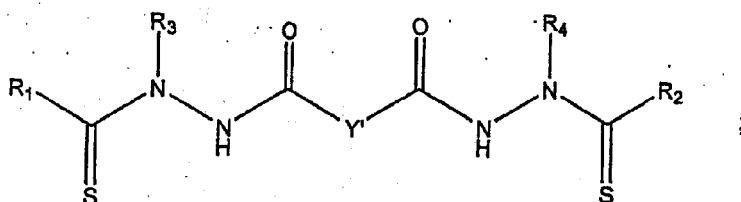
(式中、 $\text{Y}'$ は共有結合または $-\text{CR}_7\text{R}_8-$ である)

で表される請求項 2 3 記載の使用。

#### 【請求項 2 7】

化合物が以下の構造式：

#### 【化 2 0】



(式中、 $\text{Y}'$ は共有結合または $-\text{CR}_7\text{R}_8-$ である)

で表される請求項 2 3 記載の使用。

#### 【請求項 2 8】

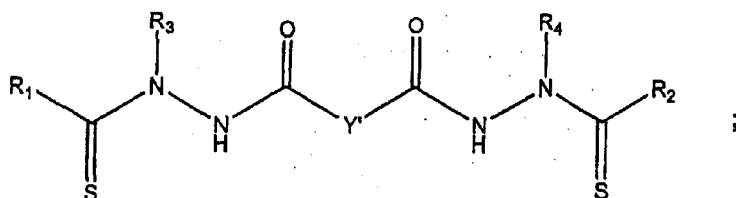
$\text{R}_1$ および $\text{R}_2$ が共にアリール基または置換アリール基であり、 $\text{R}_3$ および $\text{R}_4$ が共に低級アルキル基または置換低級アルキル基である請求項 2 7 記載の使用。

#### 【請求項 2 9】

癌を有する被験体を処置するための医薬の製造のためのタキソールまたはタキソールア

ナログおよび以下の構造式：

【化 2 1】



(式中、Y'は共有結合または-CR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>-であり；

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に置換または非置換アリール基であり；

R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は共に-H、メチルまたはエチルであり；

R<sub>7</sub>は-HでありR<sub>8</sub>は-Hまたはメチルである)

で表される化合物またはその生理的に許容され得る塩の使用。

【請求項 3 0】

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が共に、

【化 2 2】

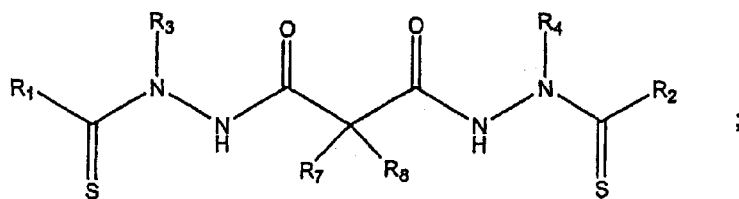
-OH, -Br, -Cl, -I, -F, -OR<sup>a</sup>, -O-COR<sup>a</sup>, -COR<sup>a</sup>, -CN,  
 -NO<sub>2</sub>, -COOH, -SO<sub>3</sub>H, -NH<sub>2</sub>, -NHR<sup>a</sup>, -N(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -COOR<sup>a</sup>, -CHO, -CONH<sub>2</sub>, -  
 CONHR<sup>a</sup>, -CON(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -NHCOR<sup>a</sup>, -NRCOR<sup>a</sup>, -NHCONH<sub>2</sub>, -NHCONR<sup>a</sup>H, -  
 NHCON(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -NR<sup>c</sup>CONH<sub>2</sub>, -NR<sup>c</sup>CONR<sup>a</sup>H, -NR<sup>c</sup>CON(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -C(=NH)-NH<sub>2</sub>, -  
 C(=NH)-NHR<sup>a</sup>, -C(=NH)-N(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -C(=NR<sup>c</sup>)-NH<sub>2</sub>, -C(=NR<sup>c</sup>)-NHR<sup>a</sup>, -C(=NR<sup>c</sup>)-  
 N(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -NH-C(=NH)-NH<sub>2</sub>, -NH-C(=NH)-NHR<sup>a</sup>, -NH-C(=NH)-N(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -NH-  
 C(=NR<sup>c</sup>)-NH<sub>2</sub>, -NH-C(=NR<sup>c</sup>)-NHR<sup>a</sup>, -NH-C(=NR<sup>c</sup>)-N(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -NR<sup>d</sup>H-C(=NH)-  
 NH<sub>2</sub>, -NR<sup>d</sup>-C(=NH)-NHR<sup>a</sup>, -NR<sup>d</sup>-C(=NH)-N(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -NR<sup>d</sup>-C(=NR<sup>c</sup>)-NH<sub>2</sub>, -NR<sup>d</sup>-  
 C(=NR<sup>c</sup>)-NHR<sup>a</sup>, -NR<sup>d</sup>-C(=NR<sup>c</sup>)-N(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -NHNH<sub>2</sub>, -NHNHR<sup>a</sup>, -NHR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -  
 SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>NHR<sup>a</sup>, -SO<sub>2</sub>NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -CH=CHR<sup>a</sup>, -CH=CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -CR<sup>c</sup>=CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -  
 CR<sup>c</sup>=CHR<sup>a</sup>, -CR<sup>c</sup>=CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -CCR<sup>a</sup>, -SH, -SR<sup>a</sup>, -S(O)R<sup>a</sup>, -S(O)<sub>2</sub>R<sup>a</sup>,

アルキル基、置換アルキル基、非芳香族複素環基、置換非芳香族複素環基、ベンジル基、  
 置換ベンジル基、アリール基または置換アリール基(式中、R<sup>a</sup>～R<sup>d</sup>はそれぞれ独立してア  
 ルキル基、置換アルキル基、ベンジル、置換ベンジル、芳香族または置換芳香族基である  
 か、または一緒になった-NR<sup>a</sup>R<sup>d</sup>はまた置換もしくは非置換非芳香族複素環基を形成し得る  
 )から選択される1つ以上の基で置換されたフェニルである請求項 2 9 記載の使用。

【請求項 3 1】

癌を有する被験体を処置するための医薬の製造のためのタキソールまたはタキソールア  
 ナログおよび以下の構造式：

【化 2 3】



(式中、

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共にフェニルであり；R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は共にメチルであり；R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は共に-Hで  
 ある)

で表される化合物またはその生理的に許容され得る塩の使用。