

【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 07 C 327/56	(2006.01)
A 61 K 31/175	(2006.01)
A 61 K 31/275	(2006.01)
A 61 K 31/337	(2006.01)
A 61 K 31/34	(2006.01)
A 61 K 31/341	(2006.01)
A 61 K 31/381	(2006.01)
A 61 K 31/404	(2006.01)
A 61 K 31/42	(2006.01)
A 61 K 31/4406	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 K 31/661	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
C 07 D 209/42	(2006.01)
C 07 D 213/82	(2006.01)
C 07 D 261/18	(2006.01)
C 07 D 305/14	(2006.01)
C 07 D 307/68	(2006.01)
C 07 D 333/38	(2006.01)
C 07 D 333/70	(2006.01)

【F I】

C 07 C 327/56	
A 61 K 31/175	
A 61 K 31/275	
A 61 K 31/337	
A 61 K 31/34	
A 61 K 31/341	
A 61 K 31/381	
A 61 K 31/404	
A 61 K 31/42	
A 61 K 31/4406	
A 61 K 31/5377	
A 61 K 31/661	
A 61 P 35/00	
A 61 P 43/00	1 2 1
C 07 D 209/42	
C 07 D 213/82	
C 07 D 261/18	
C 07 D 305/14	
C 07 D 307/68	

C 0 7 D 333/38

C 0 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

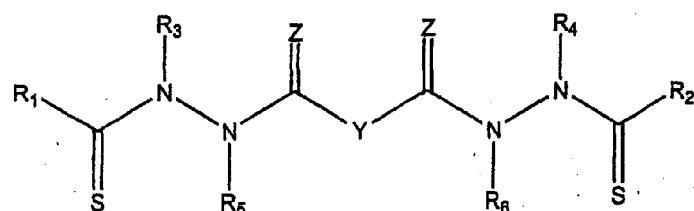
## 【補正の内容】

【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基と一緒にになって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；

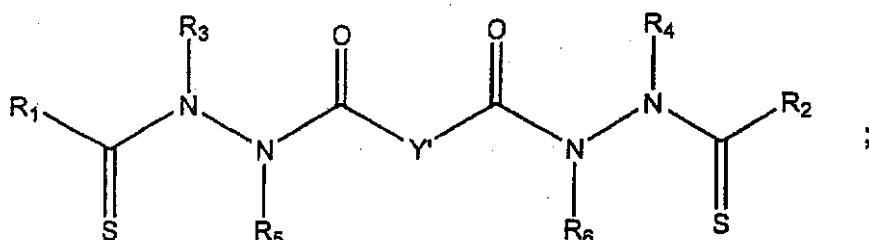
Yが-CH<sub>2</sub>-であり、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>が共にフェニルであり、R<sub>5</sub>～R<sub>6</sub>が全て-Hである場合、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共にフェニルではない)

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】



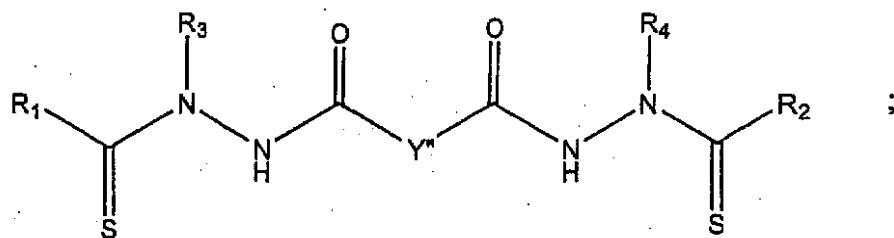
(式中、Y'は共有結合または-CR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>-であり、R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>はそれぞれ独立して-H、脂肪族基または置換脂肪族基であるか、あるいはR<sub>7</sub>が-HでありかつR<sub>8</sub>が置換もしくは非置換アリール基であるか、あるいはR<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は一緒にになってC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>置換または非置換アルキレン基である)

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】



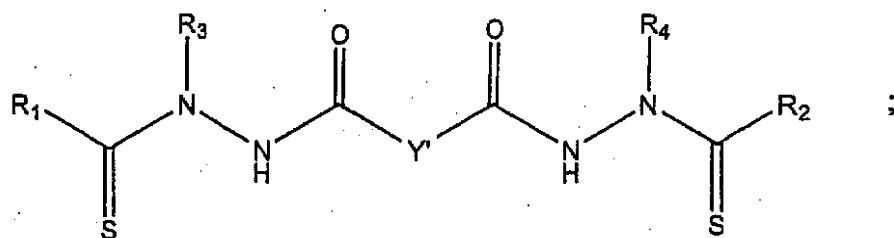
(式中、Y'は共有結合または-CH<sub>2</sub>-である)

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。

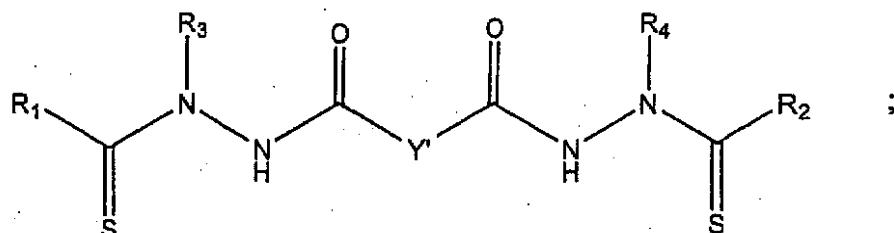
## 【請求項7】

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<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> が共に、

## 【化 6】

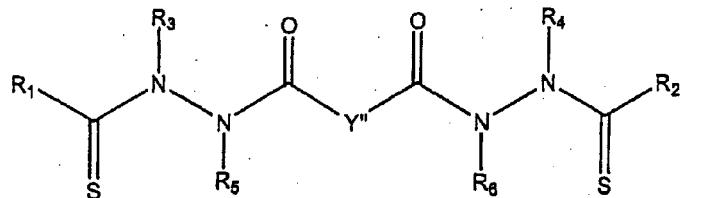
-OH, -Br, -Cl, -I, -F, -OR<sup>a</sup>, -O-COR<sup>a</sup>, -COR<sup>a</sup>, -CN, -NO<sub>2</sub>, -COOH, -SO<sub>3</sub>H, -NH<sub>2</sub>, -NHR<sup>a</sup>, -N(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -COOR<sup>a</sup>, -CHO, -CONH<sub>2</sub>, -CONHR<sup>a</sup>, -CON(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -NHCOR<sup>a</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>a</sup>CONH<sub>2</sub>, -NR<sup>a</sup>CONR<sup>a</sup>H, -NR<sup>a</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(=NH)-NH<sub>2</sub>, -C(=NH)-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>)-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>)-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>)-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>)-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>a</sup>=CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -CR<sup>a</sup>=CHR<sup>a</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。

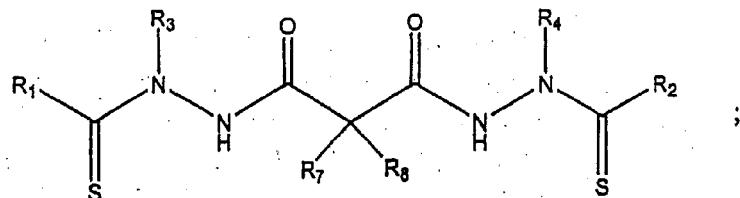
## 【請求項 11】

R<sub>5</sub> および R<sub>6</sub> 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<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;

b) 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> は共にエチルであり; R<sub>7</sub> および R<sub>8</sub> は共に-Hである;

c) R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は共に4-シアノフェニルであり; R<sub>3</sub> および R<sub>4</sub> は共にメチルであり; R<sub>7</sub> はメチルであり; R<sub>8</sub> は-Hである;

d) R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は共に4-メトキシフェニルであり; 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；

e) 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>はメチルであり；R<sub>8</sub>は-Hである；

f) 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>は共にエチルであり；R<sub>7</sub>はメチルであり；R<sub>8</sub>は-Hである；

g) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に4-シアノフェニルであり；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；

h) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,5-ジメトキシフェニルであり；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；

i) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,5-ジメトキシフェニルであり；R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は共にメチルであり；R<sub>7</sub>はメチルであり；R<sub>8</sub>は-Hである；

j) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に3-シアノフェニルであり；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；

k) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に3-フルオロフェニルであり；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；

l) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に4-クロロフェニルであり；R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は共にメチルであり；R<sub>7</sub>はメチルであり；R<sub>8</sub>は-Hである；

m) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2-ジメトキシフェニルであり；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；

n) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に3-メトキシフェニルであり；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；

o) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,3-ジメトキシフェニルであり；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；

p) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,3-ジフルオロフェニルであり；R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は共にメチルであり；R<sub>7</sub>はメチルであり；R<sub>8</sub>は-Hである；

q) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,5-ジフルオロフェニルであり；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；

r) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,5-ジフルオロフェニルであり；R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は共にメチルであり；R<sub>7</sub>はメチルであり；R<sub>8</sub>は-Hである；

s) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,5-ジクロロフェニルであり；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；

t) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,5-ジメチルフェニルであり；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；

u) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,5-ジメトキシフェニルであり；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；

v) 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；ならびに

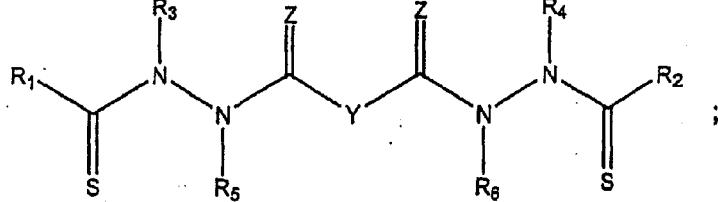
w) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,5-ジメトキシフェニルであり；R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は共にメチルであり；R<sub>7</sub>はメチルであり；R<sub>8</sub>は-Hである)

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 1 3】

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基と一緒にになって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

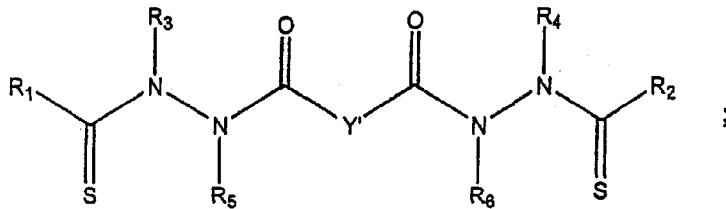
Zは=Sまたは=Sである)

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】



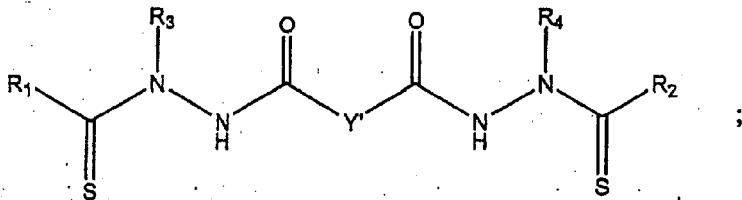
(式中、Y'は共有結合または-CR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>-であり、R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は互いに独立して-H、脂肪族基または置換脂肪族基であるか、あるいはR<sub>7</sub>が-HでありかつR<sub>8</sub>が置換もしくは非置換アリール基であるか、あるいはR<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は一緒にになってC2～C6置換または非置換アルキレン基である)

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-CR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>-である)

で表される請求項14記載の医薬組成物。

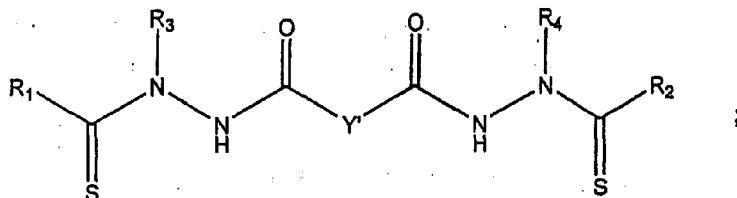
【請求項16】

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】

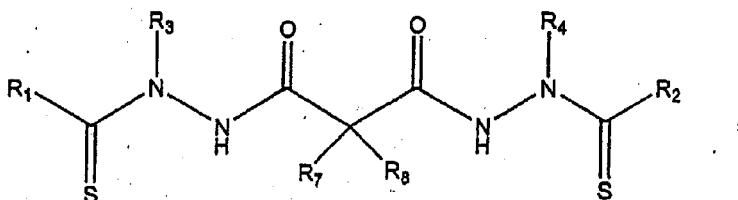
-OH, -Br, -Cl, -I, -F, -OR<sup>a</sup>, -O-  
 $COR^a$ , -COR<sup>a</sup>, -CN, -NO<sub>2</sub>, -COOH, -SO<sub>3</sub>H, -NH<sub>2</sub>, -NHR<sup>a</sup>, -N(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -COOR<sup>a</sup>, -  
CHO, -CONH<sub>2</sub>, -CONHR<sup>a</sup>, -CON(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -NHCOR<sup>a</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>a</sup>CONH<sub>2</sub>, -NR<sup>a</sup>CONR<sup>a</sup>H, -NR<sup>a</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、 $R^a$ ～ $R^d$ 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<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,5-ジメトキシフェニルであり；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；

i) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,5-ジメトキシフェニルであり；R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は共にメチルであり；R<sub>7</sub>はメチルであり；R<sub>8</sub>は-Hである；

j) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に3-シアノフェニルであり；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；

k) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に3-フルオロフェニルであり；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；

l) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に4-クロロフェニルであり；R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は共にメチルであり；R<sub>7</sub>はメチルであり；R<sub>8</sub>は-Hである；

m) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2-ジメトキシフェニルであり；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；

n) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に3-メトキシフェニルであり；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；

o) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,3-ジメトキシフェニルであり；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；

p) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,3-ジメトキシフェニルであり；R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は共にメチルであり；R<sub>7</sub>はメチルであり；R<sub>8</sub>は-Hである；

q) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,5-ジフルオロフェニルであり；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；

r) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,5-ジフルオロフェニルであり；R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は共にメチルであり；R<sub>7</sub>はメチルであり；R<sub>8</sub>は-Hである；

s) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,5-ジクロロフェニルであり；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；

t) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,5-ジメチルフェニルであり；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；

u) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,5-ジメトキシフェニルであり；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；

v) 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；ならびに

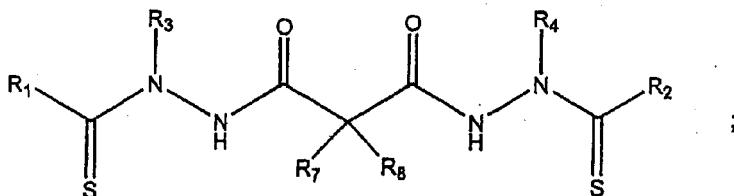
w) R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共に2,5-ジメトキシフェニルであり；R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は共にメチルであり；R<sub>7</sub>はメチルであり；R<sub>8</sub>は-Hである)

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、

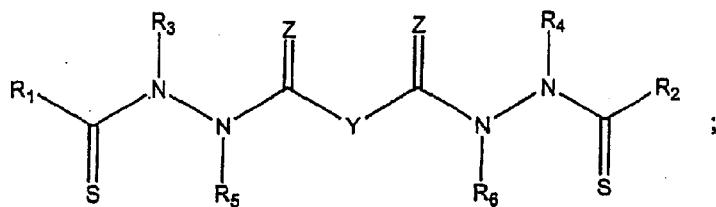
R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は共にフェニルであり；R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は共にメチルであり；R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は共に-Hである)

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16】



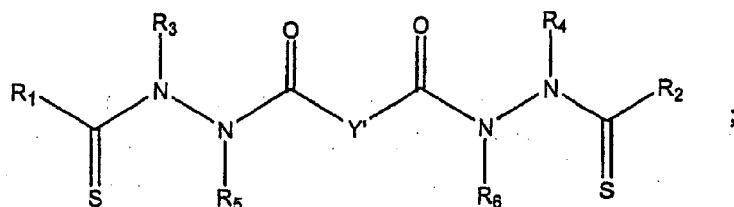
(式中、Yは共有結合、フェニレン基または置換もしくは非置換ヒドロカルビル基であるか、あるいはYが結合された両>C=Z基と一緒にになって置換もしくは非置換芳香族基であり；R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は独立してアリール基または置換アリール基であり；R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は独立して-H、脂肪族基、置換脂肪族基、アリール基または置換アリール基であり；R<sub>5</sub>～R<sub>6</sub>は独立して-H、脂肪族基、置換脂肪族基、アリール基または置換アリール基であり；Zは=Sまたは=Oである)

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22】

化合物が以下の構造式：

## 【化17】



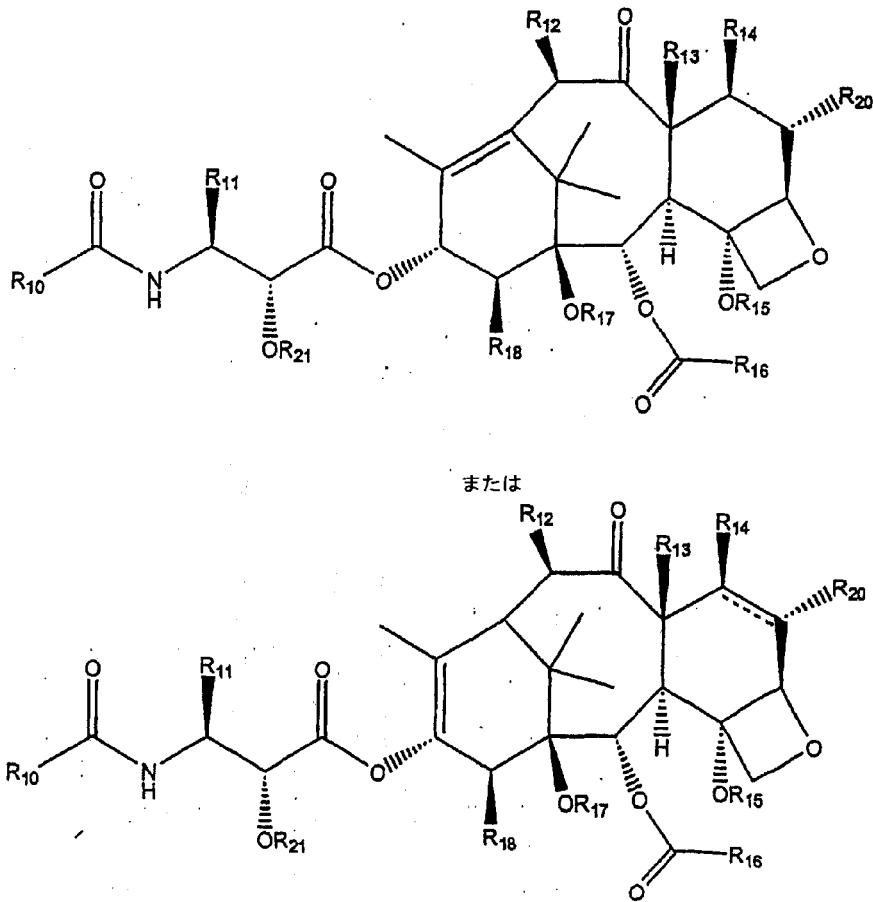
(式中、Y'は共有結合または- $CR_7R_8$ -であり、R<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>はそれぞれ独立して-H、脂肪族基または置換脂肪族基であるか、あるいはR<sub>7</sub>が-HでありかつR<sub>8</sub>が置換もしくは非置換アリール基であるか、あるいはR<sub>7</sub>およびR<sub>8</sub>は一緒にになってC2～C6置換または非置換アルキレン基である)

で表される請求項21記載の使用。

## 【請求項23】

タキソールアナログが

【化18】



(式中、R<sub>10</sub>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<sub>1</sub><sub>9</sub>、-NHR<sub>1</sub><sub>9</sub>または-OR<sub>1</sub><sub>9</sub>であり；

R<sub>11</sub>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<sub>12</sub>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(0)-(低級アルキル)、-O-C(0)-(置換低級アルキル)、-O-CH<sub>2</sub>-O-(低級アルキル)-S-CH<sub>2</sub>-O-(低級アルキル)であり；

R<sub>13</sub>は-H、-CH<sub>3</sub>、またはR<sub>14</sub>と一緒にになって-CH<sub>2</sub>-であり；

R<sub>14</sub>は-H、-OH、低級アルコキシ、-O-C(0)-(低級アルキル)、置換低級アルコキシ、-O-C(0)-(置換低級アルキル)、-O-CH<sub>2</sub>-O-P(0)(OH)、-O-CH<sub>2</sub>-O-(低級アルキル)、-O-CH<sub>2</sub>-S-(低級アルキル)またはR<sub>20</sub>と一緒にになって二重結合であり；

R<sub>15</sub>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(0)-O(低級アルキル)、-OC(0)-O(置換低級アルキル)、-OC(0)-NH(低級アルキル)または-OC(0)-NH(置換低級アルキル)であり；

R<sub>16</sub>はフェニルまたは置換フェニルであり；

R<sub>17</sub>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<sub>18</sub>は-H、-CH<sub>3</sub>または、R<sub>17</sub>ならびにR<sub>18</sub>が結合された炭素原子と一緒にになって、5もしくは6員非芳香族複素環式環であり；

R<sub>19</sub>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<sub>20</sub>は-Hまたはハロゲンであり；ならびに

R<sub>21</sub>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<sub>10</sub>がフェニル、tert-ブトキシ、-S-CH<sub>2</sub>-CH-(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-S-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、-S-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CH<sub>3</sub>、-O-

-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>-、-NH-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、-CH=C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>またはパラ-クロロフェニルであり；  
R<sub>11</sub>がフェニル、(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CHCH<sub>2</sub>-、-2-フラニル、シクロプロピルまたはパラ-トルイルであり；

R<sub>12</sub>が-H、-OH、CH<sub>3</sub>CO-または-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-N-モルホリノであり；

R<sub>13</sub>がメチル、またはR<sub>13</sub>およびR<sub>14</sub>と一緒にになって-CH<sub>2</sub>-であり；

R<sub>14</sub>が-H、-CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>または-CH<sub>2</sub>-O-P(0)(OH)<sub>2</sub>であり；

R<sub>15</sub>がCH<sub>3</sub>CO-であり；

R<sub>16</sub>がフェニルであり；

R<sub>17</sub>が-H、またはR<sub>17</sub>およびR<sub>18</sub>と一緒にになって-O-CO-O-であり；

R<sub>18</sub>が-Hであり；

R<sub>20</sub>が-Hまたは-Fであり；ならびに

R<sub>21</sub>が-H、-C(0)-CHBr-(CH<sub>2</sub>)<sub>13</sub>-CH<sub>3</sub>または-C(0)-(CH<sub>2</sub>)<sub>14</sub>-CH<sub>3</sub>；-C(0)-CH<sub>2</sub>-CH(OH)-COOH、-C(0)-CH<sub>2</sub>-O-C(0)-CH<sub>2</sub>CH(NH<sub>2</sub>)-CONH<sub>2</sub>、-C(0)-CH<sub>2</sub>-O--CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>または-C(0)-O-C(0)-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>である請求項23記載の使用。

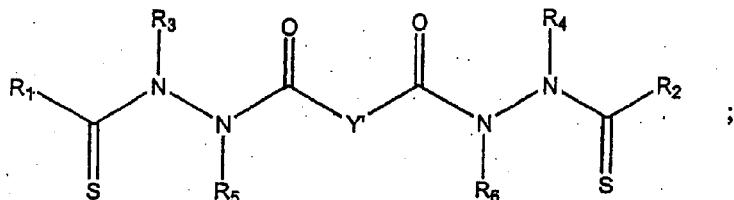
【請求項25】

タキソールアナログがN-(2-ヒドロキシプロピル)メタクリルアミド、メタクリロイルグルシン-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22記載の使用。

【請求項26】

化合物が以下の構造式：

【化19】



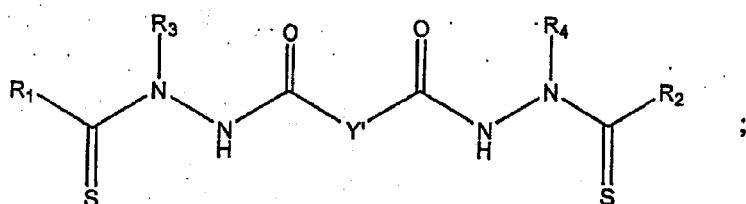
(式中、Y'は共有結合または $-CR_7R_8-$ である)

で表される請求項23記載の使用。

【請求項27】

化合物が以下の構造式：

【化20】



(式中、Y'は共有結合または $-CR_7R_8-$ である)

で表される請求項23記載の使用。

【請求項28】

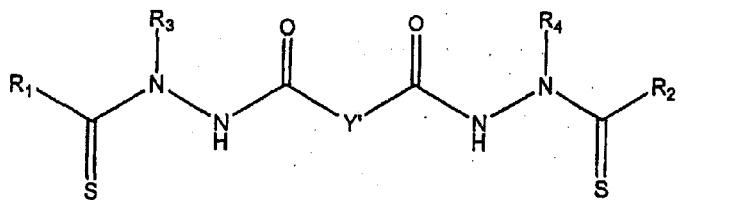
R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が共にアリール基または置換アリール基であり、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>が共に低級アルキル基または置換低級アルキル基である請求項27記載の使用。

【請求項29】

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21】



(式中、Y'は共有結合または- $CR_7R_8$ -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30】

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>が共に、

【化22】

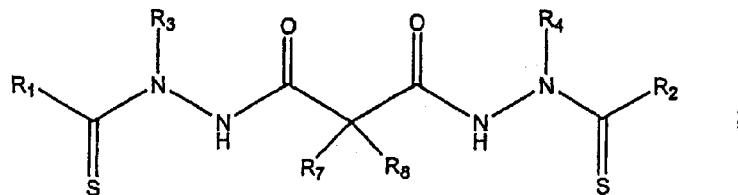
-OH, -Br, -Cl, -I, -F, -OR<sup>a</sup>, -COR<sup>a</sup>, -COR<sup>b</sup>, -CN, -NO<sub>2</sub>, -COOH, -SO<sub>3</sub>H, -NH<sub>2</sub>, -NHR<sup>a</sup>, -N(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -COOR<sup>a</sup>, -CHO, -CONH<sub>2</sub>, -CONHR<sup>a</sup>, -CON(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -NHCOR<sup>a</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(=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29記載の使用。

【請求項31】

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23】



(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。