

【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17年6月30日(2005.6.30)

【公表番号】特表2003-509408(P2003-509408A)

【公表日】平成15年3月11日(2003.3.11)

【出願番号】特願2001-523374(P2001-523374)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 209/12

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/661

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 43/00

C 0 7 D 209/14

C 0 7 F 9/24

【F I】

C 0 7 D 209/12

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/661

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 209/14

C 0 7 F 9/24 Z

【手続補正書】

【提出日】平成15年9月18日(2003.9.18)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

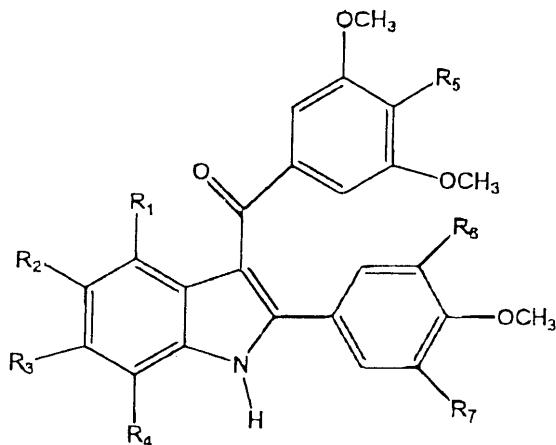
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

構造：

【化1】



[式中、R¹またはR³は、メトキシ基であり；

R⁵はO R⁸であり、ここでR⁸は水素またはアルキル基であり；

そしてR¹からR⁷の残りが全て水素であるか、またはR¹からR⁷の残りのうち少なくとも1つが、

・ホスフェートエステル部分(-OP(O)(O⁻M⁺)₂)（ここでM⁺は製薬学的に許容できるカチオンである）か、または、(-OP(O)(OR)₂)（ここでRは炭素原子8個までをもつ同じか異なるアルキル基である）；および

・ホスホルアミデート(-NP(O)(O⁻M⁺)₂)（ここでM⁺は製薬学的に許容できるカチオンである）か、または、(-NP(O)(OR)₂)（ここでRは同じか異なり炭素原子8個までをもつアルキル基である）；

から選択され、但し、R⁵がメトキシのときは、上記R¹からR⁷の残りのうち少なくとも1つは、代わりに或いは更に加えて、

・ヒドロキシ基；および

・アミン基(NH₂、NHR⁹、またはNR⁹R¹⁰、ここでR⁹とR¹⁰は同じか異なり且つ炭素原子8個までをもつアルキル基から選択される）、

から選択される】

の化合物、または製薬学的に許容できるその塩。

【請求項2】

R⁵がメトキシであり、且つR¹とR³のうち少なくとも1つがメトキシである、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

上記R¹からR⁷の残りが全て水素である、請求項2記載の化合物。

【請求項4】

R⁷がOHであり、且つR¹、R²、R⁴およびR⁶が全て水素である、請求項2記載の化合物。

【請求項5】

R⁷が上記アミン基であり、且つR¹、R²、R⁴およびR⁶が全て水素である、請求項2記載の化合物。

【請求項6】

R⁷が-NH₂である、請求項5記載の化合物。

【請求項7】

R⁷が上記ホスフェートエステル部分であり、且つR¹、R²、R⁴およびR⁶が全て水素である、請求項2記載の化合物。

【請求項8】

R⁷が-OP(O)(O⁻N a⁺)₂である、請求項2記載の化合物。

【請求項 9】

R⁷が上記ホスホルアミデートであり、且つR¹、R²、R⁴およびR⁶が全て水素である
、請求項7記載の化合物。

【請求項 10】

R⁷が-NP(O)(OCH₂CH₃)₂である、請求項9記載の化合物。

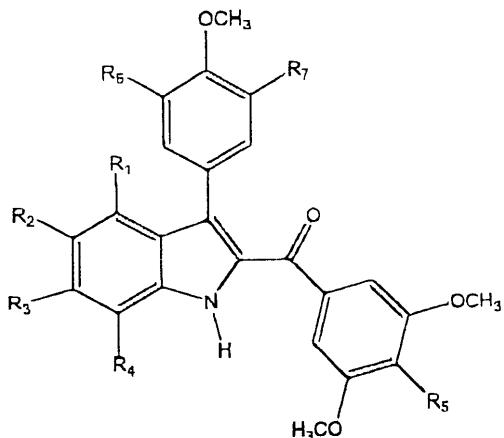
【請求項 11】

R⁷が-NP(O)(O⁻Na⁺)₂である、請求項9記載の化合物。

【請求項 12】

構造：

【化2】



[式中、R¹またはR³は、メトキシ基であり；

R⁵はOR⁸であり、ここでR⁸は水素またはアルキル基であり；

そしてR¹からR⁷の残りが全て水素であるか、またはR¹からR⁷の残りのうち少なくとも1つが、

・ホスフェートエステル部分(-OP(O)(O⁻M⁺)₂)（ここでM⁺は製薬学的に許容できるカチオンである）か、または、(-OP(O)(OR)₂)（ここでRは炭素原子8個までをもつ同じか異なるアルキル基である）；および

・ホスホルアミデート(-NP(O)(O⁻M⁺)₂)（ここでM⁺は製薬学的に許容できるカチオンである）か、または、(-NP(O)(OR)₂)（ここでRは同じか異なり炭素原子8個までをもつアルキル基である）；

から選択され、但し、R⁵がメトキシのときは、上記R¹からR⁷の残りのうち少なくとも1つは、代わりに或いは更に加えて、

・フェノール性部分；および

・アミン基(NH₂、NHR⁹、またはNR⁹R¹⁰、ここでR⁹とR¹⁰は同じか異なり且つ炭素原子8個までをもつアルキル基から選択される）、

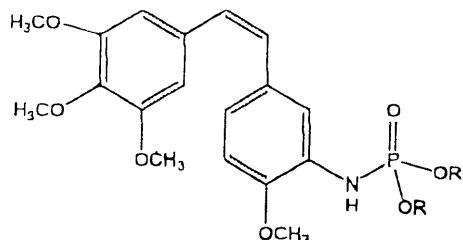
から選択される】

の化合物、または製薬学的に許容できるその塩。

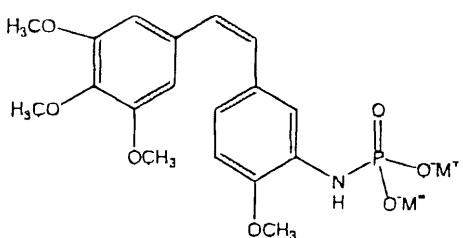
【請求項 13】

構造：

【化3】



or



[式中、Rは炭素原子8個までをもついづれかの適当なアルキルまたは分枝アルキルに選ばれ、2つのR基は同じか異なり、且つM⁺は製薬学的に許容できる塩である]の化合物。

【請求項14】

有効成分として請求項1-13のいづれかに記載の化合物を含む、チューブリン含有系におけるチューブリン重合を阻害するための製薬学的調製物。

【請求項15】

上記系が腫瘍細胞中にある、請求項14に記載の製薬学的調製物。

【請求項16】

有効成分として請求項1-13のいづれかに記載の化合物を含む、新生物形成疾患を罹患している宿主を治療するための製薬学的調製物。

【請求項17】

有効成分として請求項1-13のいづれかに記載の化合物を含む、白血病、黒色腫、および肺、結腸、甲状腺、CNS、卵巣、肛門、前立腺および乳癌を含む群の癌を治療するための製薬学的調製物。

【請求項18】

製薬学的に許容できるキャリアーといっしょに有効成分としての請求項1-13のいづれかに記載の化合物を含む、製薬学的調製物。

【請求項19】

有効成分として請求項1-13のいづれかに記載の化合物を含む、腫瘍脈管構造を選択的に標的とし、そして破壊するための製薬学的調製物。