

【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】

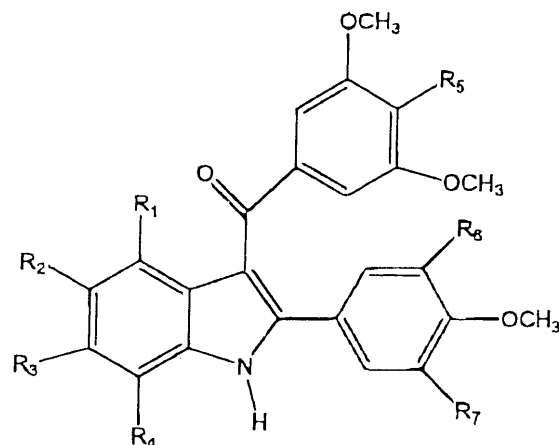
C 0 7 D 209/12
A 6 1 K 31/404
A 6 1 K 31/661
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 35/02
A 6 1 P 43/00
C 0 7 D 209/14
C 0 7 F 9/24

【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、 R^1 または R^3 は、メトキシ基であり；

R^5 は OR^8 であり、ここで R^8 は水素またはアルキル基であり；

そして R^1 から R^7 の残りが全て水素であるか、または R^1 から R^7 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、 R^5 がメトキシのときは、上記 R^1 から R^7 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 (NH_2 、 NHR^9 、または NR^9R^{10} 、ここで R^9 と R^{10} 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】

R^5 がメトキシであり、且つ R^1 と R^3 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 R^1 から R^7 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】

R^7 がOHであり、且つ R^1 、 R^2 、 R^4 および R^6 が全て水素である、請求項2記載の化合物。

【請求項 5】

R^7 が上記アミン基であり、且つ R^1 、 R^2 、 R^4 および R^6 が全て水素である、請求項2記載の化合物。

【請求項 6】

R^7 が $-NH_2$ である、請求項5記載の化合物。

【請求項 7】

R^7 が上記ホスフェートエステル部分であり、且つ R^1 、 R^2 、 R^4 および R^6 が全て水素である、請求項2記載の化合物。

【請求項 8】

R^7 が $-OP(O)(O^-Na^+)_2$ である、請求項2記載の化合物。

【請求項 9】

R^7 が上記ホスホルアミデートであり、且つ R^1 、 R^2 、 R^4 および R^6 が全て水素である、請求項 7 記載の化合物。

【請求項 10】

R^7 が $-NP(O)(OCH_2CH_3)_2$ である、請求項 9 記載の化合物。

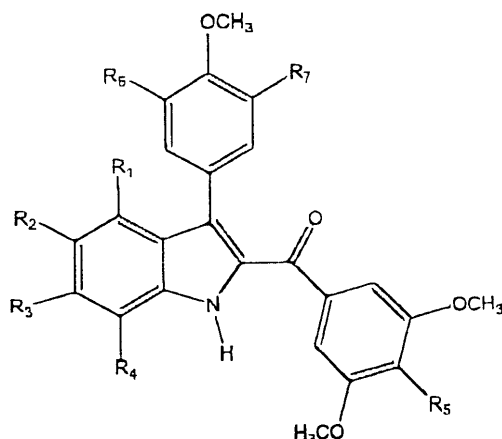
【請求項 11】

R^7 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、 R^1 または R^3 は、メトキシ基であり；

R^5 は OR^8 であり、ここで R^8 は水素またはアルキル基であり；

そして R^1 から R^7 の残りが全て水素であるか、または R^1 から R^7 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、 R^5 がメトキシのときは、上記 R^1 から R^7 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 (NH_2 、 NHR^9 、または NR^9R^{10} 、ここで R^9 と R^{10} 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)、

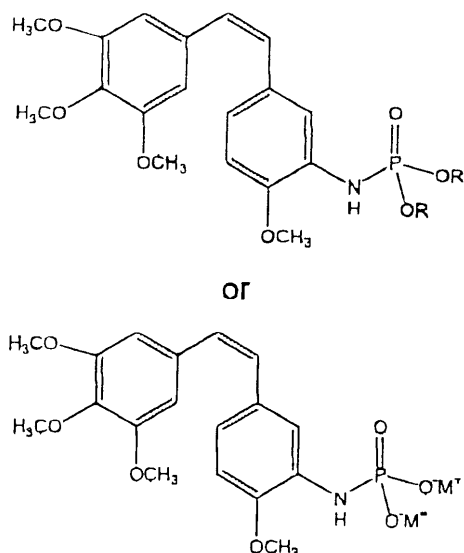
から選択される]

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】



[式中、R は炭素原子 8 個までをもついず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 1 4】

有効成分として請求項 1 - 1 3 のいず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 1 5】

上記系が腫瘍細胞中にある、請求項 1 4 に記載の製薬学的調製物。

【請求項 1 6】

有効成分として請求項 1 - 1 3 のいず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 1 7】

有効成分として請求項 1 - 1 3 のいず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 1 8】

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 - 1 3 のいずれかに記載の化合物を含む、製薬学的調製物。

【請求項 1 9】

有効成分として請求項 1 - 1 3 のいず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。