

【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1月17日(2013.1.17)

【公表番号】特表2011-506393(P2011-506393A)

【公表日】平成23年3月3日(2011.3.3)

【年通号数】公開・登録公報2011-009

【出願番号】特願2010-537432(P2010-537432)

【国際特許分類】

C 0 7 K 5/12 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 K 5/12 Z N A

A 6 1 K 37/02

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成23年11月25日(2011.11.25)

【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

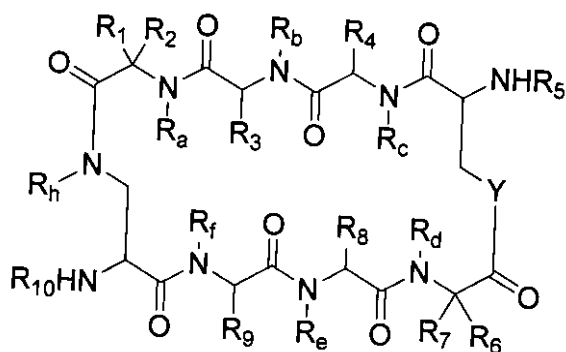
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 I の化合物

【化 1】



式 I

(式中、R₁、R₄、R₆およびR₉は、それぞれ独立に、水素、置換または非置換C₁~C₁₂アルキル、置換または非置換C₂~C₁₂アルケニルおよび置換または非置換C₂~C₁₂アルキニルから選択され、

R₃およびR₈は、それぞれ独立に、置換または非置換C₁~C₁₂メルカプトアルキル基であり、前記メルカプト基は、任意選択で保護されていてもよく、あるいはR₃とR₈は、基-CH₂-S-S-CH₂-を形成し、

R₂は水素であり、

R₇は水素であり、あるいは

対R₁-R₂および/またはR₆-R₇は、独立に、置換または非置換C₁~C₁₂アルキリデンを形成し

、あるいはそれらが結合している対応するC原子と一緒に、置換または非置換 $C_3 \sim C_{12}$ シクロアルキルを形成し、

R_5 および R_{10} は、それぞれ独立に、アミノ保護基および $-(C=O)R''$ から選択され、各 R'' は、独立に、置換または非置換複素環式基および置換または非置換ヘテロシクリルアルキル基から選択され、

R_a 、 R_b 、 R_c 、 R_d 、 R_e および R_f は、それぞれ独立に、水素および置換または非置換 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルから選択され、

Y は、 S 、 O および NR_i から選択され、

R_h は、置換または非置換 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル基、 n が1～25である $-(CH_2-CH_2O)_n-CH_3$ 基、置換または非置換 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニルおよび置換または非置換 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニルから選択され、

R_i は、水素、置換または非置換 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 n が1～25である $-(CH_2-CH_2O)_n-CH_3$ 基、置換または非置換 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニルおよび置換または非置換 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニルから選択される基である)

または薬学的に許容できるその塩、誘導体、互変異性体、プロドラッグもしくは立体異性体。

【請求項2】

R_4 および R_9 が、それぞれ独立に、水素および置換もしくは非置換 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルから選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R_4 および R_9 が、それぞれ独立に、水素ならびにメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、*sec*-ブチルおよび*tert*-ブチルから選択される置換または非置換アルキル基から選択される、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

R_3 および R_8 が、基 $-CH_2-S-S-CH_2-$ を形成する、請求項1から3のいずれかに記載の化合物。

【請求項5】

R_2 および R_7 が水素である、請求項1から4のいずれかに記載の化合物。

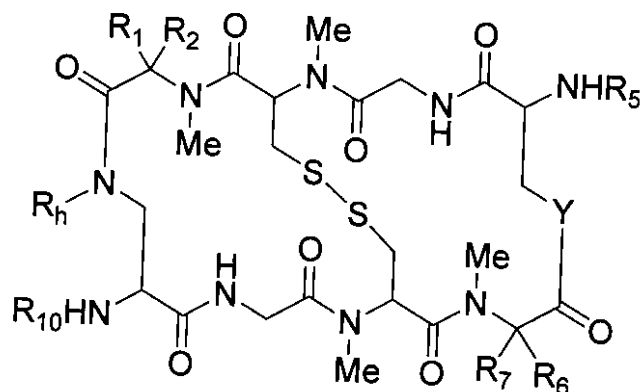
【請求項6】

R_a 、 R_b 、 R_c 、 R_d 、 R_e および R_f が、それぞれ独立に、水素または置換もしくは非置換 $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択される、請求項1から5のいずれかに記載の化合物。

【請求項7】

次式IIを有する、請求項1に記載の化合物

【化2】



式II

(式中、 R_1 、 R_2 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_{10} 、 Y および R_h は、請求項1に定義の通りである)または薬学的に許容できるその塩、誘導体、互変異性体、プロドラッグもしくは立体異性体。

【請求項 8】

R_1 および R_6 が、それぞれ独立に、水素および置換または非置換 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルから選択される、請求項1から7のいずれかに記載の化合物。

【請求項 9】

R_1 および R_6 が、それぞれ独立に、メチル、メチルチオメチルおよびイソプロピルから選択される、請求項8に記載の化合物。

【請求項 10】

R_2 および R_7 が水素である、請求項1から9のいずれかに記載の化合物。

【請求項 11】

R_5 および R_{10} が、それぞれ独立に、アミノ保護基および各 R'' が置換または非置換ヘテロ芳香族基である $-(C=O)R''$ から選択される、請求項1から10のいずれかに記載の化合物。

【請求項 12】

R_5 および R_{10} が、それぞれ独立に、各 R'' が置換または非置換キノリル基である $-(C=O)R''$ である、請求項11に記載の化合物。

【請求項 13】

R_h が $C_1 \sim C_{12}$ アルキルまたは n が1～25である $-(CH_2-CH_2O)_n-CH_3$ 基である、請求項1から12のいずれかに記載の化合物。

【請求項 14】

R_h が、メチル、エチル、プロピルおよびイソプロピルから選択される、請求項13に記載の化合物。

【請求項 15】

Y が、 S または NR_i であり、 R_i が、水素、置換もしくは非置換 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルまたは n が1～25である $-(CH_2-CH_2O)_n-CH_3$ 基である、請求項1から14のいずれかに記載の化合物。

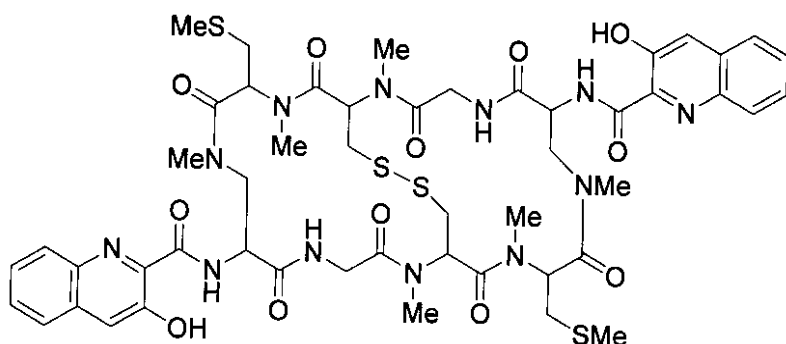
【請求項 16】

Y が NR_i であり、 R_i が、メチル、エチル、プロピルおよびイソプロピルから選択される、請求項15に記載の化合物。

【請求項 17】

以下の式

【化 3】

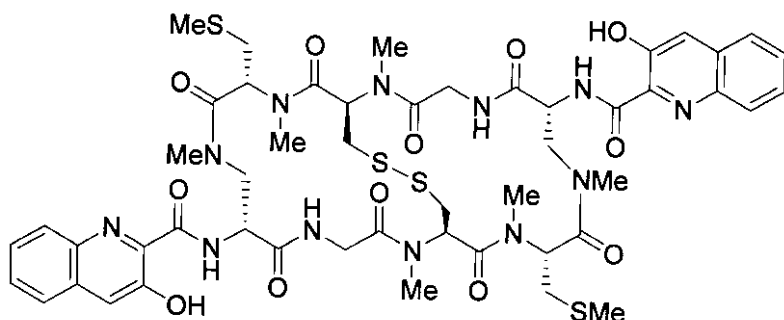


を有する、請求項1に記載の化合物または薬学的に許容できるその塩、誘導体、互変異性体、プロドラッグもしくは立体異性体。

【請求項 18】

以下の式

【化 4】



を有する、請求項17に記載の化合物または薬学的に許容できるその塩、誘導体、互変異性体もしくはプロドラッグ。

【請求項 19】

請求項1から18のいずれかに記載の化合物または薬学的に許容できるそれらの塩、誘導体、互変異性体、プロドラッグもしくは立体異性体および薬学的に許容できる希釈剤または担体を含む、医薬組成物。

【請求項 20】

請求項1から18のいずれかに記載の化合物または薬学的に許容できるそれらの塩、誘導体、互変異性体、プロドラッグもしくは立体異性体を含む、癌の治療に使用するための薬剤。