

【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20年2月14日(2008.2.14)

【公表番号】特表2003-522172(P2003-522172A)

【公表日】平成15年7月22日(2003.7.22)

【出願番号】特願2001-557864(P2001-557864)

【国際特許分類】

C 07 D 409/12	(2006.01)
A 61 K 31/337	(2006.01)
A 61 K 31/341	(2006.01)
A 61 K 31/381	(2006.01)
A 61 K 31/4427	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
C 07 D 305/14	(2006.01)
C 07 D 405/12	(2006.01)
C 07 D 405/14	(2006.01)
C 07 D 407/12	(2006.01)
C 07 D 407/14	(2006.01)
C 07 D 409/14	(2006.01)

【F I】

C 07 D 409/12
A 61 K 31/337
A 61 K 31/341
A 61 K 31/381
A 61 K 31/4427
A 61 P 35/00
C 07 D 305/14
C 07 D 405/12
C 07 D 405/14
C 07 D 407/12
C 07 D 407/14
C 07 D 409/14

【手続補正書】

【提出日】平成19年12月19日(2007.12.19)

【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

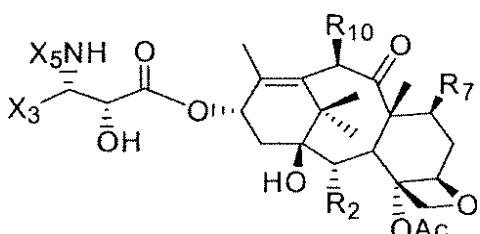
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記の式を有するタキサン：

【化1】



式中、

R_2 はベンゾイルオキシであり；

R_7 はヒドロキシであり；

R_{10} は $R_{10a}COO^-$ であり；

X_3 は、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、または複素環であり、該アルキルは少なくとも2個の炭素原子を有し；

X_5 は、 $-COX_{10}$ 、 $-COOX_{10}$ または $-CONHX_{10}$ であり；

X_{10} は、ヒドロカルビル、置換ヒドロカルビル、または複素環であり；

R_{10a} は、ヒドロカルビル、置換ヒドロカルビル、または複素環であり、該ヒドロカルビルまたは置換ヒドロカルビルは、 R_{10a} が置換基である炭素に関する位および位に炭素原子を有し、該複素環は、 R_{10a} が置換基である炭素に関する位に炭素原子を有し；

Acはアセチルである。

【請求項2】 R_{10a} がエチルまたはプロピルである、請求項1に記載のタキサン。

【請求項3】 X_3 が、2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、 $C_2 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルである、請求項1または2に記載のタキサン。

【請求項4】 X_5 が $-COX_{10}$ で、 X_{10} が、置換または非置換のフェニル、2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルであるか、あるいは X_5 が $-COOX_{10}$ で、 X_{10} が、置換または非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルである、請求項1～3のいずれかに記載のタキサン。

【請求項5】 X_5 が $-COX_{10}$ で、 X_{10} がフェニルであるか、あるいは X_5 が $-COOX_{10}$ で、 X_{10} がt-ブチルである、請求項1～4のいずれかに記載のタキサン。

【請求項6】 X_3 がフリルまたはチエニルであり、 R_{10a} がエチルであり、そして X_5 が $-COX_{10}$ で、 X_{10} がフェニルであるか、あるいは X_5 が $-COOX_{10}$ で、 X_{10} がt-ブチルである、請求項1～4のいずれかに記載のタキサン。

【請求項7】 請求項1～6のいずれかに記載されるタキサンおよび少なくとも1つの薬学的に受容可能なキャリアを含む医薬組成物。

【請求項8】 請求項1～6のいずれかに記載されるタキサンおよび少なくとも1つの薬学的に受容可能なキャリアを含む経口投与用の組成物。

【請求項9】 R_{10a} がエチルまたはプロピルである、請求項7または8に記載の組成物。

【請求項10】 X_3 が、2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、 $C_2 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルである、請求項7～9のいずれかに記載の組成物。

【請求項11】 X_5 が $-COX_{10}$ で、 X_{10} が、置換または非置換のフェニル、2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルであるか、あるいは X_5 が $-COOX_{10}$ で、 X_{10} が、置換または非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルである、請求項7～10のいずれかに記載の組成物。

【請求項12】 哺乳動物における腫瘍増殖を阻害する方法であって、請求項1に記載されるタキサンおよび少なくとも1つの薬学的に受容可能なキャリアを含有する医薬組成物の処置有効量を経口投与することを含む方法。

【請求項13】 R_{10a} がエチルまたはプロピルである、請求項12に記載の方法。

【請求項14】 X_3 が、2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、 $C_2 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルである、請求項12または13に記載の方法。

【請求項15】 X_3 が2-ピリジル、4-ピリジル、2-フリル、3-フリル、2-チエニルまたは3-チエニルであり、 X_5 が $-COOX_{10}$ で、 X_{10} がt-ブチルであり、 R_{10a} がエチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、2-チエニル、2-フリル、イソブテニルまたはtrans-ブ

ロペニルである、請求項 1 に記載のタキサン。

【請求項 16】 X_3 が 2-フリル、3-フリル、2-チエニルまたは 3-チエニルであり、 X_5 が -COOX₁₀ で、 X_{10} が イソブチルであり、R_{10a} が プロピルまたはシクロプロピルである、請求項 1 に記載のタキサン。

【請求項 17】 X_3 が 2-チエニルであり、R_{10a} が シクロプロピルである、請求項 16 に記載のタキサン。

【請求項 18】 X_3 が 2-フリルまたは 2-チエニルであり、 X_5 が -COOX₁₀ で、 X_{10} が エチルまたはイソプロピルであり、R_{10a} が エチル、プロピルまたはシクロプロピルである、請求項 1 に記載のタキサン。