

【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 0 7 D 409/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/337 (2006.01)

A 6 1 K 31/341 (2006.01)

A 6 1 K 31/381 (2006.01)

A 6 1 K 31/4427 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

C 0 7 D 305/14 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 407/12 (2006.01)

C 0 7 D 407/14 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 409/12

A 6 1 K 31/337

A 6 1 K 31/341

A 6 1 K 31/381

A 6 1 K 31/4427

A 6 1 P 35/00

C 0 7 D 305/14

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 407/12

C 0 7 D 407/14

C 0 7 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

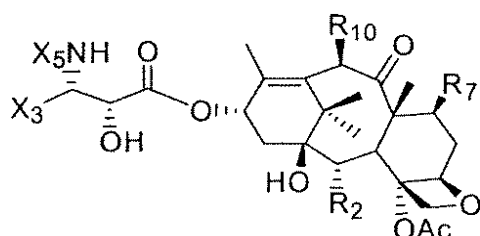
【補正方法】変更

【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_{10a} 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 $-\text{COOX}_{10}$ 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 $-\text{COOX}_{10}$ 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。