

【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10月2日 (2008.10.2)

【公表番号】特表2004-517045(P2004-517045A)

【公表日】平成16年6月10日 (2004.6.10)

【年通号数】公開・登録公報2004-022

【出願番号】特願2002-521491(P2002-521491)

【国際特許分類】

C 0 7 J 63/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/565 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

C 0 7 B 53/00 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 J 63/00

A 6 1 K 31/565

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 1/02

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 35/00

C 0 7 B 53/00 G

C 0 7 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成20年8月7日 (2008.8.7)

【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

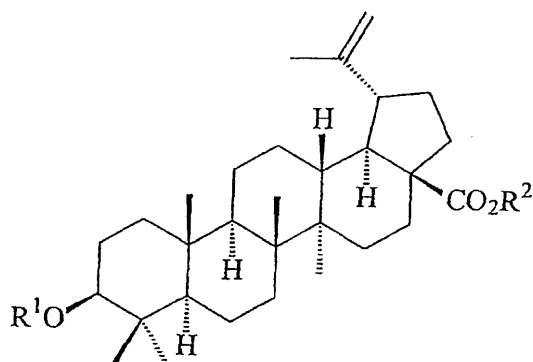
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

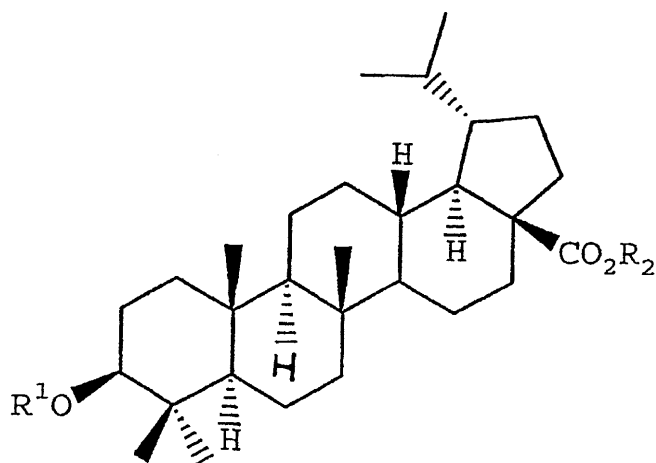
以下の化学式、すなわち；

【化 1】



または、

【化2】



(式中、 R^1 は、水素、 $\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})\text{NR}^4\text{R}^5$ 、 $\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_3 \text{アルキル})\text{CO}_2\text{R}^4$ 、 $\text{COCH}(\text{C}_6\text{H}_5)\text{NR}^4\text{R}^5$ 、 $\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、 $\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})\text{CO}_2\text{R}^4$ 、 $\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{C}_1 \sim \text{C}_3 \text{アルキル}$ 、 $\text{CH}_2\text{OCO}_2\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$ 、 $\text{CH}_2\text{OCCO}_2\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$ 、 $\text{PO}(\text{OH})_2$ 、および、 SO_3H からなる群から選択され、

R^2 は、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$ 、 $\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}\text{NR}^4\text{R}^5$ 、 $\text{CH}_2\text{OCCO}_2\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$ 、 $\text{PO}(\text{OH})_2$ 、 SO_3H 、 $\text{CH}(\text{C}_6\text{H}_5)\text{NR}^4\text{R}^5$ 、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})\text{CO}_2\text{R}^4$ 、および、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{C}_1 \sim \text{C}_3 \text{アルキル}$ からなる群から選択され、

R^4 および R^5 は、独立して、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル}$ 、 $\text{CO}(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{アルキル})$ 、および、アリールからなる群から選択され、あるいは、 R^4 および R^5 が、共に5～7員環を形成し、

n は、1～10であり、

R^1 および R^2 の少なくとも一方が、水素と異なる)

の化学式で表される化合物およびその薬学的に許容可能な塩。

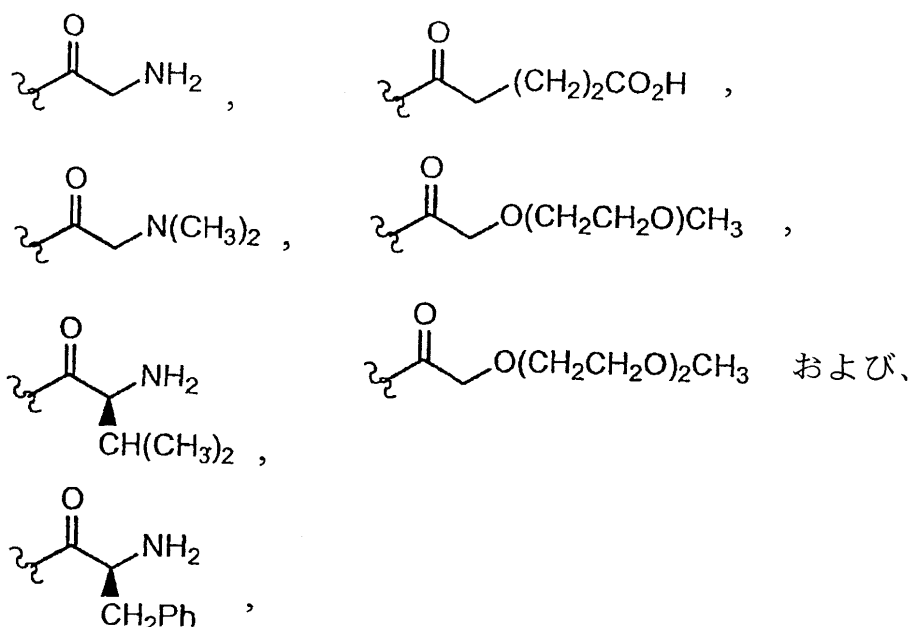
【請求項2】

R^1 および R^2 の少なくとも一方が、水素であり、そして、 R^1 および R^2 の少なくとも一方が、水素と異なる請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R^1 および R^2 が、以下の化学式、すなわち；

【化3】



(式中、Phは、 C_6H_5 である)からなる群から選択された化学式で表される請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

R^1 および R^2 の少なくとも一方が、 $\text{PO}(\text{OH})_2$ であり、残りの R^1 および R^2 の少なくとも一方が、水素である、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

R^1 および R^2 の少なくとも一方が、 $\text{CH}_2\text{OCOC}(\text{CH}_3)_3$ である請求項1に記載の化合物。

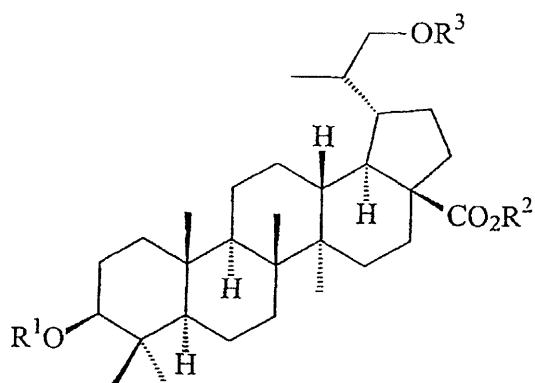
【請求項6】

R^1 および R^2 の少なくとも一方が、 SO_3H であり、残りの R^1 および R^2 の少なくとも一方が、水素である、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

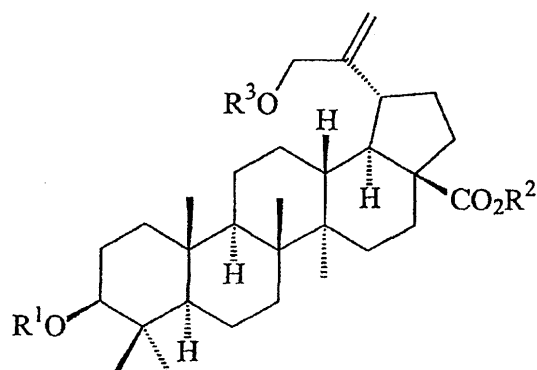
以下の化学式、すなわち；

【化4】



または、

【化5】



(式中、 R^1 および R^3 は、独立して、水素、 $CO(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})NR^4R^5$ 、 $CO(C_1 \sim C_3 \text{アルキル})CO_2R^4$ 、 $COCH(C_6H_5)NR^4R^5$ 、 $CO(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 $CO(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})CO_2R^4$ 、 $CO(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})O(CH_2CH_2O)_nC_1 \sim C_3 \text{アルキル}$ 、 $CH_2OCO_2C_1 \sim C_6 \text{アルキル}$ 、 $CH_2OCOC_1 \sim C_6 \text{アルキル}$ 、 $PO(OH)_2$ 、および、 SO_3H からなる群から選択され、

R^2 は、水素、 $C_1 \sim C_6 \text{アルキル}$ 、 $CH_2C_6H_5$ 、 $C_1 \sim C_6 \text{アルキル}NR^4R^5$ 、 $CH_2OCO_2C_1 \sim C_6 \text{アルキル}$ 、 $PO(OH)_2$ 、 SO_3H 、 $CH(C_6H_5)NR^4R^5$ 、 $(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})CO_2R^4$ 、および、 $(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})O(CH_2CH_2O)_nC_1 \sim C_3 \text{アルキル}$ からなる群から選択され、

R^4 および R^5 は、独立して、水素、 $C_1 \sim C_6 \text{アルキル}$ 、 $CO(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、およびアリールからなる群から選択され、あるいは、 R^4 および R^5 が、共に5～7員環を形成し、

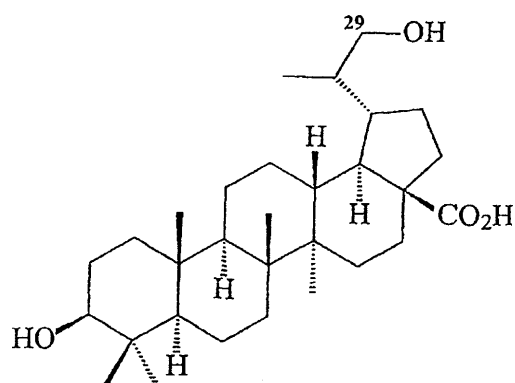
n は、1～10である)

の化学式で表される化合物およびその薬学的に許容可能な塩。

【請求項8】

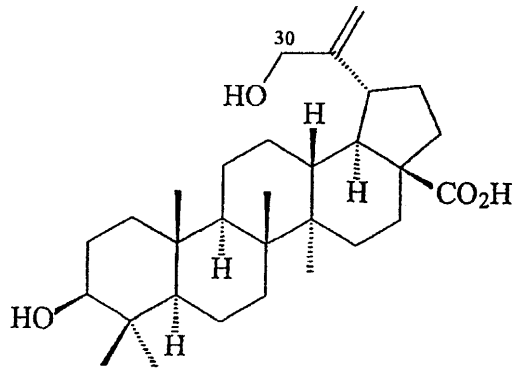
以下の化学式、すなわち；

【化6】



または、

【化7】



の化学式で表される請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

化合物 2、3、4 a ~ 4 j、5 a ~ 5 g、6 a ~ 6 g、7、8、9、10 a、10 b、11 a ~ 11 g、12 a ~ 12 g、13、14 a ~ 14 c、15 a ~ 15 c、22、23、26、27 a ~ 27 i、および、28 a ~ 28 i のいずれかの化合物およびその塩。

【請求項 10】

ベツリン酸またはベツリン酸誘導体に感受性を示す癌の治療剤を製造するための請求項 9 に記載の化合物の使用。

【請求項 11】

前記癌が、黒色腫、扁平上皮腫瘍、乳がん、大腸癌、肉腫、ヒト口腔表皮癌、ホルモン依存性乳癌、前立腺癌、肺癌、神経膠腫、黒色腫、および、神経芽腫からなる群から選択される請求項 10 に記載の使用。

【請求項 12】

ベツリン酸またはベツリン酸誘導体に感受性を示す癌の治療剤を製造するためのベツリン酸のプロドラッグまたはベツリン酸誘導体のプロドラッグの使用。

【請求項 13】

前記癌が、黒色腫、扁平上皮腫瘍、乳がん、大腸癌、肉腫、ヒト口腔表皮癌、ホルモン依存性乳癌、前立腺癌、肺癌、神経膠腫、黒色腫、および、神経芽腫からなる群から選択される請求項 12 に記載の使用。

【請求項 14】

ベツリン酸のプロドラッグまたはベツリン酸誘導体のプロドラッグを、ヒト以外の動物に対して、局所投与、静脈投与、または、腹腔内投与する、工程を含むことを特徴とするベツリン酸またはベツリン酸誘導体に感受性を示す癌の治療方法。

【請求項 15】

H I V の治療剤を製造するための請求項 9 に記載の化合物の使用。

【請求項 16】

H I V の治療剤を製造するためのベツリン酸のプロドラッグまたはベツリン酸誘導体のプロドラッグの使用。

【請求項 17】

ベツリン酸のプロドラッグまたはベツリン酸誘導体のプロドラッグを、ヒト以外の動物に、局所投与、静脈投与、または、腹腔内投与する、工程を含むことを特徴とする H I V の治療方法。

【請求項 18】

請求項 9 に記載の化合物および薬学的に許容可能なキャリアを含む、ことを特徴とする薬学的組成物。

【請求項 19】

ベツリン酸またはベツリン酸誘導体に感受性を示す癌の治療剤を製造するための請求項 18 に記載の組成物の使用。

【請求項 20】

請求項 18 に記載の組成物を ヒト以外の動物に投与する、工程を含むことを特徴とする
H I V の治療方法。