

【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12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2004-527583(P2004-527583A)

【公表日】平成16年9月9日(2004.9.9)

【年通号数】公開・登録公報2004-035

【出願番号】特願2003-501833(P2003-501833)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 C 271/12

A 6 1 K 31/27

A 6 1 P 35/00

C 0 7 C 269/06

C 0 7 D 295/00

【F I】

C 0 7 C 271/12

A 6 1 K 31/27

A 6 1 P 35/00

C 0 7 C 269/06

C 0 7 D 295/00 A

C 0 7 D 295/00 Z

【手続補正書】

【提出日】平成17年4月15日(2005.4.15)

【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

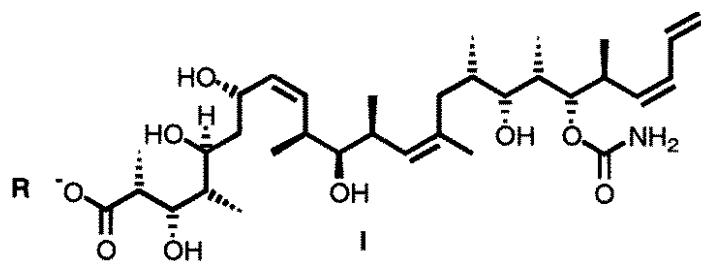
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

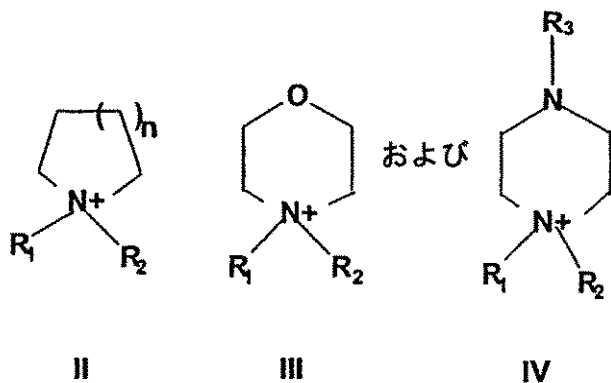
式 I :

【化1】



[式中、Rは、 Li^+ 、 Na^+ 、 K^+ 、 $1/2\text{Ca}^{++}$ 、 $1/2\text{Mg}^{++}$ 、 $1/2\text{Mn}^{++}$ 、 $\text{R}_1\text{R}_2\text{R}_3\text{R}_4\text{N}^+$ 、または

【化 2】



(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 は各々独立して、水素、 (C_{1-12}) アルキル、ヒドロキシ (C_{2-8}) アルキルまたはベンジルであり； n は 1 - 5 である) から選択される窒素含有環である]

の化合物。

【請求項 2】

式 I において、 R が、 Li^+ 、 Na^+ 、 K^+ 、 $1/2 Ca^{++}$ 、 $R_1 R_2 R_3 R_4 N^+$ または式 III、III および IV (式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 は、各々独立して、水素、 (C_{1-8}) アルキル、ヒドロキシ (C_{2-6}) アルキルまたはベンジルであり； n は 1 - 3 である) から選択される窒素含有環である、請求項 1 記載の化合物。

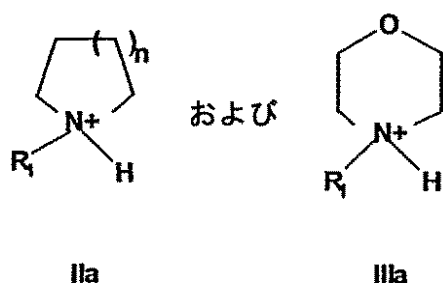
【請求項 3】

式 I において、 R が、 Na^+ 、 K^+ 、 $1/2 Ca^{++}$ 、 $R_1 R_2 R_3 R_4 N^+$ 、または式 III および III (式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 は、各々独立して、水素、 (C_{1-6}) アルキル、ヒドロキシ (C_{2-4}) アルキルまたはベンジルであり； n は 1 または 2 である) から選択される窒素含有環である、請求項 2 記載の化合物。

【請求項 4】

式 I において、 R が、 Na^+ 、 $1/2 Ca^{++}$ 、 $R_1 R_2 R_3 N^+$ または

【化 3】



(式中、 R_1 、 R_2 および R_3 は、各々独立して、水素、 (C_{1-6}) アルキル、ヒドロキシエチルまたはベンジルであり； n は 1 または 2 である) から選択される窒素含有環である、請求項 3 記載の化合物。

【請求項 5】

(2R, 3S, 4S, 5S, 7S, 8Z, 10S, 11S, 12S, 13Z, 16S, 17S, 18S, 19S, 20S, 21Z)-19-[(アミノカルボニル)オキシ]-3, 5, 7, 11, 17-ペンタヒドロキシ-2, 4, 10, 12, 14, 16, 18, 20-オクタメチル-8, 13, 21, 23-テトラコサテトラエン酸ナトリウム塩である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 6】

薬学的に許容し得る担体または希釈剤、および治療的有效量の、請求項 1 ~ 4 のいずれか

に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 7】

薬学的担体または希釈剤、および治療の有効量の(2R,3S,4S,5S,7S,8Z,10S,11S,12S,13Z,16S,17S,18S,19S,20S,21Z)-19-[(アミノカルボニル)オキシ]-3,5,7,11,17-ペンタヒドロキシ-2,4,10,12,14,16,18,20-オクタメチル-8,13,21,23-テトラコサテトラエン酸ナトリウム塩を含む、請求項 6 記載の医薬組成物。

【請求項 8】

ヒトまたは動物の体の治療的処置に使用するための、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の式 I の化合物。

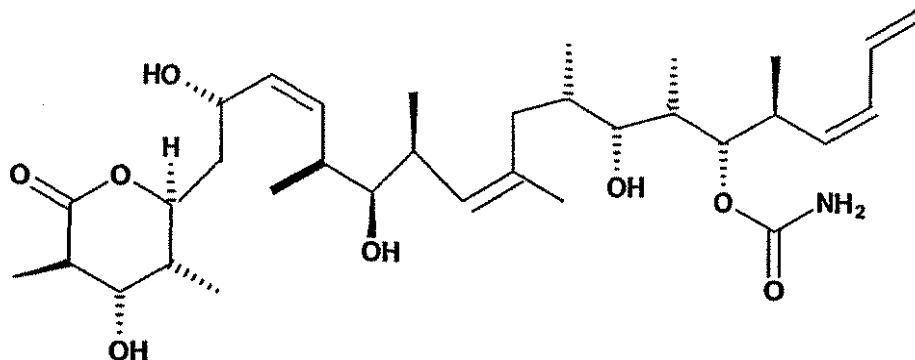
【請求項 9】

腫瘍の化学療法で使用するための医薬組成物の製造における、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の式 I の化合物の使用。

【請求項 10】

極性有機溶媒の存在下、ROH (R は請求項 1 で定義されたとおり) を用いて、式 1

【化 4】



1

を示す化合物を加水分解することを含む、請求項 1 記載の化合物の製造方法。

【請求項 11】

該溶媒がエーテルであって、加水分解が 0 および 20 の間の温度で行われる、請求項 10 に記載の方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0004

【補正方法】変更

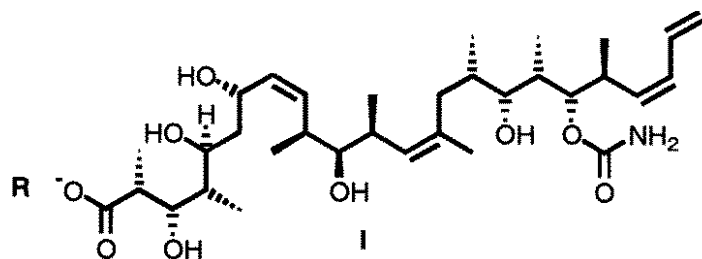
【補正の内容】

【0004】

(本発明の詳細な説明)

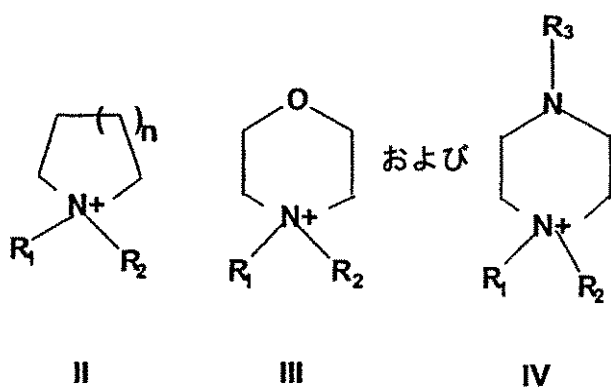
本発明の本質は、ある種のディスコデルモライド酸塩が腫瘍を処置する際に有用であるという発見である。ひとつの態様において、本発明は、
式 I :

【化 2】



[式中、Rは、 Li^+ 、 Na^+ 、 K^+ 、 $1/2 \text{Ca}^{++}$ 、 $1/2 \text{Mg}^{++}$ 、 $1/2 \text{Mn}^{++}$ 、 $\text{R}_1 \text{R}_2 \text{R}_3 \text{R}_4 \text{N}^+$ または

【化 3】



(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 は、各々独立して、水素、 (C_{1-12}) アルキル、ヒドロキシ (C_{2-8}) アルキルまたはベンジルであり； n は1-5である) から選択される窒素含有環である]の新規抗腫瘍剤を提供する。