

【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23年9月22日(2011.9.22)

【公表番号】特表2007-528875(P2007-528875A)

【公表日】平成19年10月18日(2007.10.18)

【年通号数】公開・登録公報2007-040

【出願番号】特願2006-547323(P2006-547323)

【国際特許分類】

C 0 7 D 225/06 (2006.01)

C 0 7 D 498/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/395 (2006.01)

A 6 1 K 31/5386 (2006.01)

A 6 1 K 31/424 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/40 (2006.01)

A 6 1 K 47/44 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 225/06 C S P

C 0 7 D 498/08

A 6 1 K 31/395

A 6 1 K 31/5386

A 6 1 K 31/424

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/40

A 6 1 K 47/44

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 47/14

【誤訳訂正書】

【提出日】平成23年8月4日(2011.8.4)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

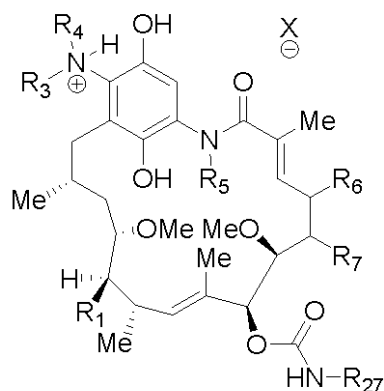
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記構造式2で表される絶対立体化学を有する純粋かつ単離された化合物。

【化 1】



2

(ここで、それぞれ別異に、

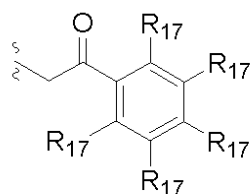
X^- は、塩化物、臭化物、ヨウ化物、 $H_2PO_4^-$ 、 HSO_4^- 、メチルスルホナート、ベンゼンスルホナート、p-トルエンスルホナート、トリフルオロメチルスルホナート、10-カンファースルホナート、ナフタレン-1-スルホン酸-5-スルホナート、エタン-1-スルホン酸-2-スルホナート、シクラミン酸塩、チオシアン酸塩、ナフタレン-2-スルホナートおよびシュウ酸塩より成る群から選択され；

R_1 は、水酸基または $-OC(O)R_8$ であり；

R_3 および R_4 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アラルキル、ヘテロアラルキルまたは $-[(CR_2)_p]-R_{16}$ であり；あるいは、 R_3 は R_4 と一緒に、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R_5 は、水素または下記の構造式1aを有する基であり；

【化 2】



1a

ここで、 R_{17} は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン化物、水酸基、アルコキシ、アリーロキシ、アシルオキシ、アミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、アシルアミノ、アラルキルアミノ、ニトロ、アシルチオ、カルボキシアミド、カルボキシル、ニトリル、 $-COR_{18}$ 、 $-CO_2R_{18}$ 、 $-N(R_{18})CO_2R_{19}$ 、 $-OC(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-N(R_{18})SO_2R_{19}$ 、 $-N(R_{18})C(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、および $-CH_2O-$ ヘテロサイクリルより成る群から選択され；

R_6 および R_7 はいずれも水素であり；あるいは、 R_6 および R_7 は一緒に結合を形成し；

R_8 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは $-[(CR_2)_p]-R_{16}$ であり；

R_{16} は、それぞれ別異に、水素、水酸基、アシルアミノ、 $-N(R_{18})COR_{19}$ 、 $-N(R_{18})C(O)OR_{19}$ 、 $-N(R_{18})SO_2R_{19}$ 、 $-CON(R_{18})(R_{19})$ 、 $-OC(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-SO_2N(R_{18})(R_{19})$ 、

$N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-OC(O)OR_{18}$ 、 $-COOR_{18}$ 、 $-C(O)N(OH)(R_{18})$ 、 $-OS(O)_2OR_{18}$ 、 $-S(O)_2OR_{18}$ 、 $-OP(O)(OR_{18})(OR_{19})$ 、 $-N(R_{18})P(O)(OR_{18})(OR_{19})$ および $-P(O)(OR_{18})(OR_{19})$ より成る群から選択され；

p は 1、2、3、4、5 または 6 であり；

R_{18} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R_{19} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；あるいは、 R_{18} は、 R_{19} と一緒に、必要に応じて置換された 4~8 員環を表し；

R_{27} は、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアラルキルであり；

R_1 が水素であり、 R_6 および R_7 は一緒に二重結合を形成し、 R_{27} は水素である場合には、 R_3 および R_4 の 少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してもおらず；さらに、

二重結合の立体化学は、E もしくは Z、またはそれらの混合物である。）

【請求項 2】

R_1 は水酸基であることを特徴とする請求項 1 記載の化合物。

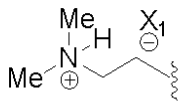
【請求項 3】

R_3 はアリルであることを特徴とする請求項 1 記載の化合物。

【請求項 4】

R_3 は、下記構造式 9 で表されるかまたはその遊離塩基であることを特徴とする請求項 1 記載の化合物。

【化 3】



9

(ここで、 X^- は、塩化物、臭化物、ヨウ化物、 $H_2PO_4^-$ 、 HSO_4^- 、メチルスルホナート、ベンゼンスルホナート、p-トルエンスルホナート、トリフルオロメチルスルホナート、10-カンファースルホナート、ナフタレン-1-スルホン酸-5-スルホナート、エタン-1-スルホン酸-2-スルホナート、シクラミン酸塩、チオシアン酸塩、ナフタレン-2-スルホナートおよびシュウ酸塩より成る群から選択される。)

【請求項 5】

R_4 は水素であることを特徴とする請求項 1 記載の化合物。

【請求項 6】

R_5 は水素であることを特徴とする請求項 1 記載の化合物。

【請求項 7】

R_6 および R_7 は一緒に結合を形成していることを特徴とする請求項 1 記載の化合物。

【請求項 8】

R_{27} は水素であることを特徴とする請求項 1 記載の化合物。

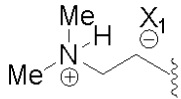
【請求項 9】

R_1 は水酸基であり； R_3 はアリルであり；さらに、 R_4 は水素であることを特徴とする請求項 1 記載の化合物。

【請求項 10】

R_1 は水酸基であり； R_3 は下記構造式 9 で表されるかまたはその遊離塩基であり；さらに、 R_4 は水素であることを特徴とする請求項 1 記載の化合物。

【化 4】



9

(ここで、 X^- は、塩化物、臭化物、ヨウ化物、 $H_2PO_4^-$ 、 HSO_4^- 、メチルスルホナート、ベンゼンスルホナート、p-トルエンスルホナート、トリフルオロメチルスルホナート、10-カンファースルホナート、ナフタレン-1-スルホン酸-5-スルホナート、エタン-1-スルホン酸-2-スルホナート、シクラミン酸塩、チオシアン酸塩、ナフタレン-2-スルホナートおよびシュウ酸塩より成る群から選択される。)

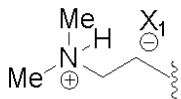
【請求項 1 1】

R_1 は水酸基であり； R_3 はアリルであり； R_4 は水素であり；さらに、 R_5 は水素であることを特徴とする請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 2】

R_1 は水酸基であり； R_3 は下記構造式9で表されるかまたはその遊離塩基であり； R_4 は水素であり；さらに、 R_5 は水素であることを特徴とする請求項 1 記載の化合物。

【化 5】



9

(ここで、 X^- は、塩化物、臭化物、ヨウ化物、 $H_2PO_4^-$ 、 HSO_4^- 、メチルスルホナート、ベンゼンスルホナート、p-トルエンスルホナート、トリフルオロメチルスルホナート、10-カンファースルホナート、ナフタレン-1-スルホン酸-5-スルホナート、エタン-1-スルホン酸-2-スルホナート、シクラミン酸塩、チオシアン酸塩、ナフタレン-2-スルホナートおよびシュウ酸塩より成る群から選択される。)

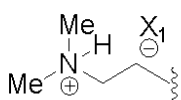
【請求項 1 3】

R_1 は水酸基であり； R_3 はアリルであり； R_4 は水素であり； R_5 は水素であり；さらに、 R_6 および R_7 は一緒に結合を形成していることを特徴とする請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 4】

R_1 は水酸基であり； R_3 は下記構造式9で表されるかまたはその遊離塩基であり； R_4 は水素であり； R_5 は水素であり；さらに、 R_6 および R_7 は一緒に結合を形成していることを特徴とする請求項 1 記載の化合物。

【化 6】



9

(ここで、 X^- は、塩化物、臭化物、ヨウ化物、 $H_2PO_4^-$ 、 HSO_4^- 、メチルスルホナート、ベンゼンスルホナート、p-トルエンスルホナート、トリフルオロメチルスルホナート、10-カンファースルホナート、ナフタレン-1-スルホン酸-5-スルホナート、エタン-1-スルホン酸-2-スルホナート、シクラミン酸塩、チオシアン酸塩、ナフタレン-2-スルホナートおよびシュウ酸塩より成る群から選択される。)

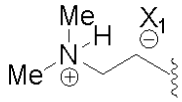
【請求項 1 5】

R₁は水酸基であり；R₃はアリルであり；R₄は水素であり；R₅は水素であり；R₆およびR₇は一緒に結合を形成しており；さらに、R₂₇は水素であることを特徴とする請求項1記載の化合物。

【請求項16】

R₁は水酸基であり；R₃は下記構造式9で表されるかまたはその遊離塩基であり；R₄は水素であり；R₅は水素であり；R₆およびR₇は一緒に結合を形成しており；さらに、R₂₇は水素であることを特徴とする請求項1記載の化合物。

【化7】



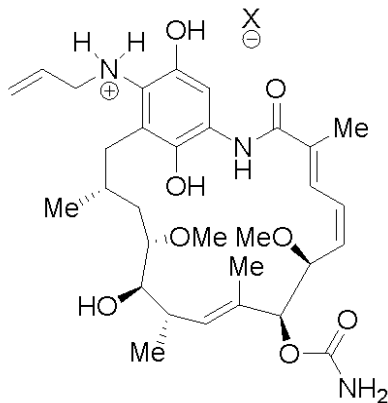
9

(ここで、X⁻は、塩化物、臭化物、ヨウ化物、H₂PO₄⁻、HSO₄⁻、メチルスルホナート、ベンゼンスルホナート、p-トルエンスルホナート、トリフルオロメチルスルホナート、10-カンファースルホナート、ナフタレン-1-スルホン酸-5-スルホナート、エタン-1-スルホン酸-2-スルホナート、シクラミン酸塩、チオシアン酸塩、ナフタレン-2-スルホナートおよびシュウ酸塩より成る群から選択される。)

【請求項17】

下記構造式3で表される絶対立体化学を有する純粋かつ単離された化合物。

【化8】



3

(ここで、X⁻は、塩化物、臭化物、ヨウ化物、H₂PO₄⁻、HSO₄⁻、メチルスルホナート、ベンゼンスルホナート、p-トルエンスルホナート、トリフルオロメチルスルホナート、10-カンファースルホナート、ナフタレン-1-スルホン酸-5-スルホナート、エタン-1-スルホン酸-2-スルホナート、シクラミン酸塩、チオシアン酸塩、ナフタレン-2-スルホナートおよびシュウ酸塩より成る群から選択される。)

【請求項18】

X⁻は塩化物であることを特徴とする請求項17記載の化合物。

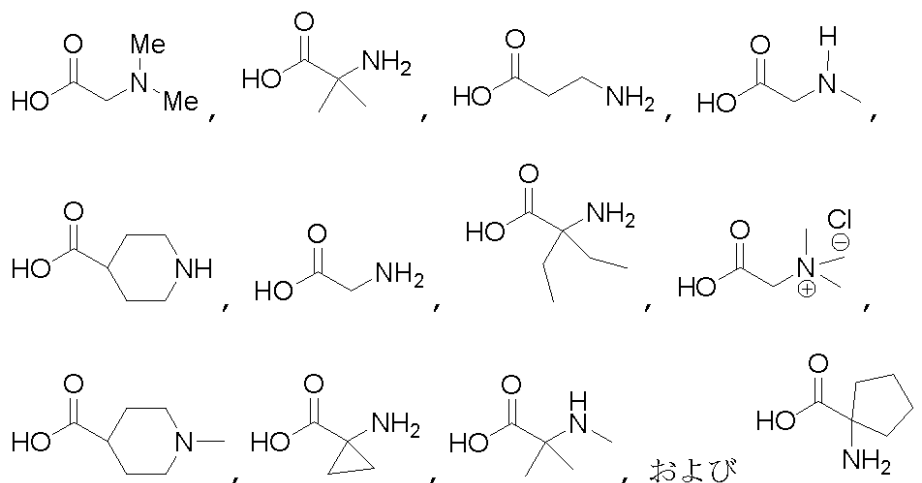
【請求項19】

X⁻は臭化物であることを特徴とする請求項17記載の化合物。

【請求項20】

請求項1-19いずれか1項記載の化合物；および下記よりなる群から選択されるアミノ酸を含有することを特徴とする組成物。

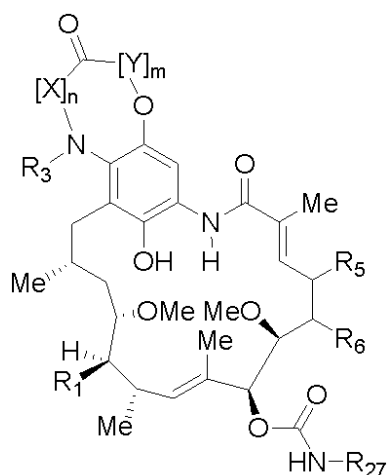
【化9】



【請求項21】

下記構造式5で表される絶対立体化学を有する化合物。

【化10】



5

(ここで、それぞれ別異に、

n は0、1または2であり；

m は0、1または2であり；

X および Y は、それぞれ別異に $\text{C}(\text{R}_{30})_2$ であり；このとき、 R_{30} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリーールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；あるいは $-\text{[(CR}_2)_p]-\text{R}_{16}$ であり；

R_1 は、水酸基または $-\text{OC}(\text{O})\text{R}_8$ であり；

R_3 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アラルキル、ヘテロアラルキルまたは $-\text{[(CR}_2)_p]-\text{R}_{16}$ であり；

R_5 および R_6 は共に水素であり；あるいは、 R_5 および R_6 は一緒に結合を形成しており；

R_8 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリーール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリーール、ヘテロアラルキルまたは $-\text{[(CR}_2)_p]-\text{R}_{16}$ であり；

R_{16} は、それぞれ別異に、水素、水酸基、アシルアミノ、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{COR}_{19}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{C}(\text{O})\text{OR}_{19}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{SO}_2(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{CON}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{OR}_{18}$ 、 $-\text{COOR}_{18}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{OH})(\text{R}_{18})$ 、 $-\text{OS}(\text{O})_2\text{OR}_{18}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{OR}_{18}$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}_{18})(\text{OR}_{19})$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{P}(\text{O})(\text{OR}_{18})(\text{OR}_{19})$ および $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}_{18})(\text{OR}_{19})$ であり；

pは1、2、3、4、5または6であり；

R₁₈は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R₁₉は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；あるいは、R₁₈は、R₁₉と一緒に、必要に応じて置換された4~8員環を表し；

R₂₇は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアラルキルであり；さらに、二重結合の立体化学は、EもしくはZ、またはそれらの混合物である。）

【請求項22】

R₁は水酸基であることを特徴とする請求項21記載の化合物。

【請求項23】

R₃はアリルであることを特徴とする請求項21記載の化合物。

【請求項24】

R₅およびR₆は一緒に結合を形成していることを特徴とする請求項21記載の化合物。

【請求項25】

R₂₇は水素であることを特徴とする請求項21記載の化合物。

【請求項26】

XおよびYは -CH₂- であることを特徴とする請求項21記載の化合物。

【請求項27】

nは0であり；mは0または1であることを特徴とする請求項21記載の化合物。

【請求項28】

R₁は水酸基であり；R₃はアリルであることを特徴とする請求項21記載の化合物。

【請求項29】

R₁は水酸基であり；R₃はアリルであり；さらに、R₅およびR₆は一緒に結合を形成していることを特徴とする請求項21記載の化合物。

【請求項30】

R₁は水酸基であり；R₃はアリルであり；R₅およびR₆は一緒に結合を形成しており；さらに、R₂₇は水素であることを特徴とする請求項21記載の化合物。

【請求項31】

R₁は水酸基であり；R₃はアリルであり；R₅およびR₆は一緒に結合を形成しており；R₂₇は水素であり；さらに、XおよびYは -CH₂- であることを特徴とする請求項21記載の化合物。

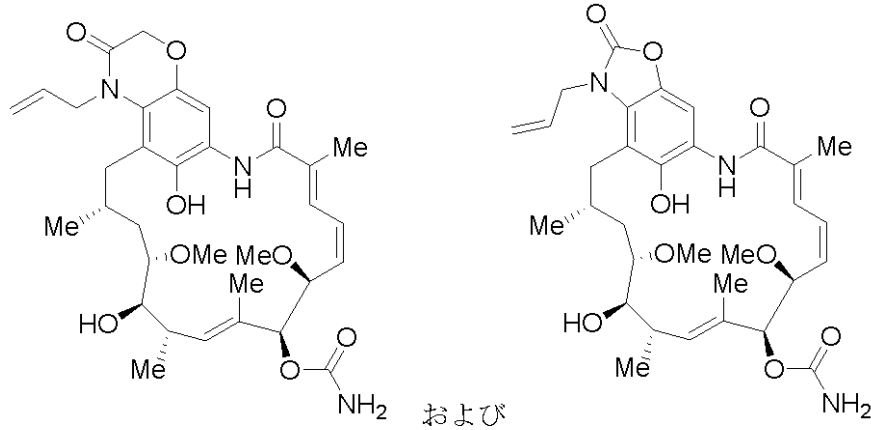
【請求項32】

R₁は水酸基であり；R₃はアリルであり；R₅およびR₆は一緒に結合を形成しており；R₂₇は水素であり；XおよびYは -CH₂- であり；nは0であり；さらに、mは0または1であることを特徴とする請求項21記載の化合物。

【請求項33】

下記より成る群から選択される化合物。

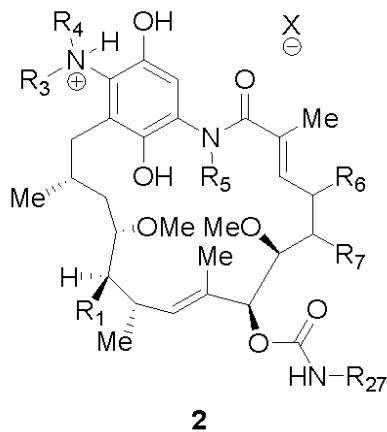
【化 1 1】



【請求項 3 4】

薬剤学的に許容される少なくとも 1 種類の賦形剤；および下記構造式 2 で示される化合物を含む医薬組成物。

【化 1 2】



(ここで、それぞれ別異に、

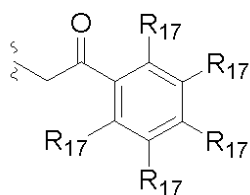
X⁻ は、塩化物、臭化物、ヨウ化物、H₂PO₄⁻、HSO₄⁻、メチルスルホナート、ベンゼンスルホナート、p-トルエンスルホナート、トリフルオロメチルスルホナート、10-カンファースルホナート、ナフタレン-1-スルホン酸-5-スルホナート、エタン-1-スルホン酸-2-スルホナート、シクラミン酸塩、チオシアン酸塩、ナフタレン-2-スルホナートおよびシュウ酸塩より成る群から選択され；

R₁ は、水酸基または -OC(O)R₈ であり；

R₃ および R₄ はそれぞれ独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アラルキル、ヘテロアラルキルおよび -[(CR₂)_p] - R₁₆ よりなる群から選択され；あるいは、R₃ は R₄ と一緒に、必要に応じて置換された 4~8 員の複素環を表し；

R₅ は、水素および下記構造式 6a を有する基より成る群から選択され；

【化 1 3】



6a

ここで、R₁₇ は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン化物、水酸基、アルコキシル、アリ

ールオキシ、アシルオキシ、アミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、アシルアミノ、アラルキルアミノ、ニトロ、アシルチオ、カルボキシアミド、カルボキシル、ニトリル、
 $-COR_{18}$ 、 $-CO_2R_{18}$ 、 $-N(R_{18})CO_2R_{19}$ 、 $-OC(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-N(R_{18})SO_2R_{19}$ 、 $-N(R_{18})C(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、および $-CH_2O-$ ヘテロサイクリルより成る群から選択され；

R_6 および R_7 はいずれも水素であり；あるいは、 R_6 および R_7 は一緒に結合を形成し；

R_8 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは $-[(CR_2)_p]$
 $-R_{16}$ であり；

R_{16} は、それぞれ別異に、水素、水酸基、アシルアミノ、 $-N(R_{18})COR_{19}$ 、 $-N(R_{18})C(O)OR_{19}$ 、 $-N(R_{18})SO_2R_{19}$ 、 $-CON(R_{18})(R_{19})$ 、 $-OC(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-SO_2N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-OC(O)OR_{18}$ 、 $-COOR_{18}$ 、 $-C(O)N(OH)(R_{18})$ 、 $-OS(O)_2OR_{18}$ 、 $-S(O)_2OR_{18}$ 、 $-OP(O)(OR_{18})(OR_{19})$ 、 $-N(R_{18})P(O)(OR_{18})(OR_{19})$ および $-P(O)(OR_{18})(OR_{19})$ より成る群から選択され；

p は1、2、3、4、5または6であり；

R_{18} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R_{19} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；あるいは、 R_{18} は、 R_{19} と一緒に、必要に応じて置換された4~8員環を表し；

R_{27} は、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R_1 が水素であり、 R_6 および R_7 は一緒に二重結合を形成し、 R_{27} は水素である場合には、 R_3 および R_4 の少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してもおらず；さらに、

二重結合の立体化学は、EもしくはZ、またはそれらの混合物である。）

【請求項35】

抗酸化剤をさらに含むことを特徴とする請求項34記載の医薬組成物。

【請求項36】

緩衝剤をさらに含むことを特徴とする請求項34記載の医薬組成物。

【請求項37】

金属キレート化剤をさらに含むことを特徴とする請求項34記載の医薬組成物。

【請求項38】

抗酸化剤および緩衝剤をさらに含むことを特徴とする請求項34記載の医薬組成物。

【請求項39】

抗酸化剤および金属キレート化剤をさらに含むことを特徴とする請求項34記載の医薬組成物。

【請求項40】

緩衝剤および金属キレート化剤をさらに含むことを特徴とする請求項34記載の医薬組成物。

【請求項41】

抗酸化剤、緩衝剤および金属キレート化剤をさらに含むことを特徴とする請求項34記載の医薬組成物。

【請求項42】

前記抗酸化剤は、アスコルビン酸塩、塩酸システイン、亜硫酸水素ナトリウム、メタ亜硫酸水素ナトリウム、亜硫酸ナトリウム、チオグリセロール、メルカプト酢酸ナトリウム、ホルムアルデヒドスルホキレートナトリウム、アスコルビン酸パルミテート、ブチル化ヒドロキシアニソール、ブチル化ヒドロキシトルエン、レシチン、没食子酸プロピルまたは $-トコフェロール$ であることを特徴とする請求項41記載の医薬組成物。

【請求項43】

前記抗酸化剤がアスコルビン酸塩であることを特徴とする請求項41記載の医薬組成物。

【請求項44】

前記緩衝剤は、クエン酸塩、アスコルビン酸塩、リン酸塩、重炭酸塩、炭酸塩、フマル酸塩、酢酸塩、酒石酸塩、リンゴ酸塩、コハク酸塩、乳酸塩、マレイン酸塩、グリシン、または天然に存在するその他の - もしくは - アミノ酸であることを特徴とする請求項41記載の医薬組成物。

【請求項45】

前記緩衝剤がクエン酸塩であることを特徴とする請求項41記載の医薬組成物。

【請求項46】

前記金属キレート化剤は、クエン酸、エチレンジアミン四酢酸(EDTA)およびその塩、DTPA(ジエチレントリアミン五酢酸)およびその塩、EGTAおよびその塩、NTA(ニトリロ酢酸)およびその塩、ソルビトールおよびその塩、酒石酸およびその塩、N-ヒドロキシイミノジアセタートおよびその塩、ヒドロキシエチルエチレンジアミン四酢酸およびその塩、1-および3-プロパンジアミン四酢酸およびそれらの塩類、1-および3-ジアミノ-2-ヒドロキシプロパン四酢酸およびそれらの塩類、グルコン酸ナトリウム、ヒドロキシエタンニリン酸およびその塩、または、リン酸およびその塩であることを特徴とする請求項41記載の医薬組成物。

【請求項47】

前記金属キレート化剤がEDTAであることを特徴とする請求項41記載の医薬組成物。

【請求項48】

前記緩衝剤がクエン酸塩であり、前記抗酸化剤がアスコルビン酸塩であり、さらに、前記金属キレート剤がEDTAであることを特徴とする請求項41記載の医薬組成物。

【請求項49】

前記EDTAの、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.001~0.1であることを特徴とする請求項48記載の医薬組成物。

【請求項50】

前記EDTAの、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.01~0.05であることを特徴とする請求項48記載の医薬組成物。

【請求項51】

前記アスコルビン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.001~1であることを特徴とする請求項48記載の医薬組成物。

【請求項52】

前記アスコルビン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.01~1であることを特徴とする請求項48記載の医薬組成物。

【請求項53】

前記クエン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.05~2であることを特徴とする請求項48記載の医薬組成物。

【請求項54】

前記クエン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.21であることを特徴とする請求項48記載の医薬組成物。

【請求項55】

前記EDTAの、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.001~0.1であり；前記アスコルビン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.001~1であることを特徴とする請求項48記載の医薬組成物。

【請求項56】

前記EDTAの、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.01~0.05であり；前記アスコルビン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.01~1であることを特徴とする請求項48記載の医薬組成物。

【請求項57】

前記EDTAの、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.001~0.1であり；前記アス

コルビン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.001~1であり；前記クエン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.05~2であることを特徴とする請求項48記載の医薬組成物。

【請求項58】

前記EDTAの、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.01~0.05であり；前記アスコルビン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.01~1であり；前記クエン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.2~1であることを特徴とする請求項48記載の医薬組成物。

【請求項59】

可溶化剤をさらに含むことを特徴とする請求項34から58いずれか1項記載の医薬組成物。

【請求項60】

前記可溶化剤は、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類、ポリオキシエチレンステアリン酸塩類、ベンジルアルコール、エチルアルコール、ポリエチレングリコール類、プロピレングリコール、グリセリン、シクロデキストリンまたはポロキサマー類であることを特徴とする請求項59記載の医薬組成物。

【請求項61】

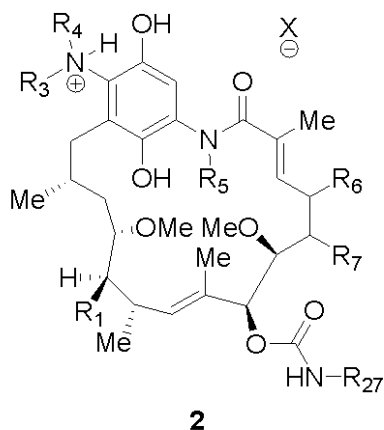
薬剤学的に許容される少なくとも1種類の賦形剤；

下記構造式2で表される化合物；および

0.00001%~5% (m/v) の下記構造式10で表される化合物または薬剤学的に許容されるその塩を含有し、

構造式2の化合物は：

【化14】



で表され、ここで、それぞれ別異に、

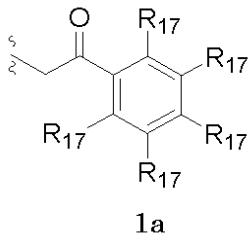
X⁻は、塩化物、臭化物、ヨウ化物、H₂PO₄⁻、HSO₄⁻、メチルスルホナート、ベンゼンスルホナート、p-トルエンスルホナート、トリフルオロメチルスルホナート、10-カンファースルホナート、ナフタレン-1-スルホン酸-5-スルホナート、エタン-1-スルホン酸-2-スルホナート、シクラミン酸塩、チオシアン酸塩、ナフタレン-2-スルホナートおよびシュウ酸塩より成る群から選択され；

R₁は、水酸基または-OC(O)R₈であり；

R₃およびR₄は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アラルキル、ヘテロアラルキルまたは-[(CR₂)_p]-R₁₆であり；あるいは、R₃はR₄と一緒に、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R₅は、水素または下記の構造式1aを有する基であり；

【化15】



ここで、 R_{17} は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン化物、水酸基、アルコキシ、アリールオキシ、アシルオキシ、アミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、アシルアミノ、アラルキルアミノ、ニトロ、アシルチオ、カルボキシアミド、カルボキシル、ニトリル、 $-\text{COR}_{18}$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}_{18}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{CO}_2\text{R}_{19}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{SO}_2\text{R}_{19}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、および $-\text{CH}_2\text{O}-$ ヘテロサイクリルより成る群から選択され；

R_6 および R_7 はいずれも水素であり；あるいは、 R_6 および R_7 は一緒に結合を形成し；

R_8 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは $-\text{[(CR}_2\text{)}_p\text{]}-\text{R}_{16}$ であり；

R_{16} は、それぞれ別異に、水素、水酸基、アシルアミノ、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{COR}_{19}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{C}(\text{O})\text{OR}_{19}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{SO}_2\text{R}_{19}$ 、 $-\text{CON}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{OR}_{18}$ 、 $-\text{COOR}_{18}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{OH})(\text{R}_{18})$ 、 $-\text{OS}(\text{O})_2\text{OR}_{18}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{OR}_{18}$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}_{18})(\text{OR}_{19})$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{P}(\text{O})(\text{OR}_{18})(\text{OR}_{19})$ および $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}_{18})(\text{OR}_{19})$ より成る群から選択され；

p は1、2、3、4、5または6であり；

R_{18} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

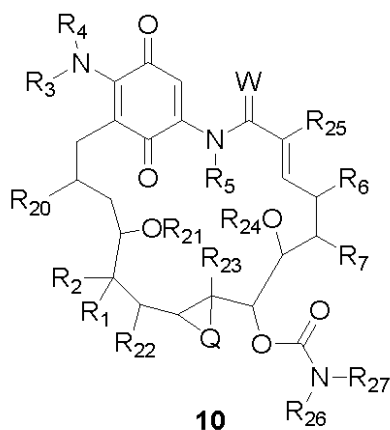
R_{19} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；あるいは、 R_{18} は、 R_{19} と一緒に、必要に応じて置換された4~8員環を表し；

R_{27} は、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアラルキルであり；

R_1 が水素であり、 R_6 および R_7 は一緒に二重結合を形成し、 R_{27} は水素である場合には、 R_3 および R_4 の少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してもおらず；さらに、

二重結合の立体化学は、EもしくはZ、またはそれらの混合物であり；そして、
構造式10の化合物は：

【化16】



で表され、ここで、それぞれ別異に、

Wは酸素であり；

Qは結合であり；

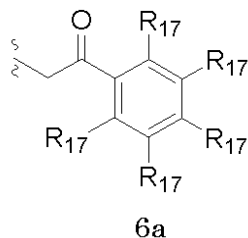
X⁻は、薬剤学的に許容される酸の共役塩基であり；

R₁は、水酸基または -OC(O)R₈であり；さらに、R₂は水素であり；

R₃およびR₄は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アラルキル、ヘテロアラルキルおよび - [(CR₂)_p] - R₁₆より成る群から選択され；あるいは、R₃はR₄と一緒に、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R₅は、H、および下記構造式6aを有する基より成る群から選択され；

【化17】



ここで、R₁₇は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン化物、水酸基、アルコキシル、アリーロキシ、アシルオキシ、アミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、アシルアミノ、アラルキルアミノ、ニトロ、アシルチオ、カルボキシアミド、カルボキシル、ニトリル、-COR₁₈、-CO₂R₁₈、-N(R₁₈)CO₂R₁₉、-OC(O)N(R₁₈)(R₁₉)、-N(R₁₈)SO₂R₁₉、-N(R₁₈)C(O)N(R₁₈)(R₁₉)、および -CH₂O-ヘテロサイクリルより成る群から選択され；

R₆およびR₇はいずれも水素であり；あるいは、R₆およびR₇と一緒に結合を形成し；

R₈は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは - [(CR₂)_p] - R₁₆であり；

R₁₆は、それぞれ別異に、水素、水酸基、アシルアミノ、-N(R₁₈)COR₁₉、-N(R₁₈)C(O)OR₁₉、-N(R₁₈)SO₂(R₁₉)、-CON(R₁₈)(R₁₉)、-OC(O)N(R₁₈)(R₁₉)、-SO₂N(R₁₈)(R₁₉)、-N(R₁₈)(R₁₉)、-OC(O)OR₁₈、-COOR₁₈、-C(O)N(OH)(R₁₈)、-OS(O)₂OR₁₈、-S(O)₂OR₁₈、-OP(O)(OR₁₈)(OR₁₉)、-N(R₁₈)P(O)(OR₁₈)(OR₁₉)および -P(O)(OR₁₈)(OR₁₉)より成る群から選択され；

pは1、2、3、4、5または6であり；

R₁₈は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R₁₉は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

あるいは、R₁₈は、R₁₉と一緒に、必要に応じて置換された4~8員環を表し；

R₂₀、R₂₁、R₂₂、R₂₄およびR₂₅は、それぞれ別異にアルキルであり；

R₂₃はアルキルであり；

R₂₆およびR₂₇は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R₁が水酸基であり、R₆およびR₇と一緒に二重結合を形成し、R₂₀はメチルであり、R₂₁はメチルであり、R₂₂はメチルであり、R₂₃はメチルであり、R₂₄はメチルであり、R₂₅はメチルであり、R₂₆は水素であり、およびR₂₇は水素である場合に、R₃およびR₄の少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してもおらず；さらに

構造式10の立体中心における絶対立体化学は、RもしくはS、またはそれらの混合物であり、また、二重結合の立体化学は、EもしくはZ、またはそれらの混合物であることを特徴とする医薬組成物。

【請求項 6 2】

抗酸化剤をさらに含むことを特徴とする請求項 6 1 記載の医薬組成物。

【請求項 6 3】

緩衝剤をさらに含むことを特徴とする請求項 6 1 記載の医薬組成物。

【請求項 6 4】

金属キレート化剤をさらに含むことを特徴とする請求項 6 1 記載の医薬組成物。

【請求項 6 5】

抗酸化剤および緩衝剤をさらに含むことを特徴とする請求項 6 1 記載の医薬組成物。

【請求項 6 6】

抗酸化剤および金属キレート化剤をさらに含むことを特徴とする請求項 6 1 記載の医薬組成物。

【請求項 6 7】

緩衝剤および金属キレート化剤をさらに含むことを特徴とする請求項 6 1 記載の医薬組成物。

【請求項 6 8】

抗酸化剤、緩衝剤および金属キレート化剤をさらに含むことを特徴とする請求項 6 1 記載の医薬組成物。

【請求項 6 9】

前記抗酸化剤は、アスコルビン酸塩、塩酸システイン、亜硫酸水素ナトリウム、メタ亜硫酸水素ナトリウム、亜硫酸ナトリウム、チオグリセロール、メルカプト酢酸ナトリウム、ホルムアルデヒドスルホキシレートナトリウム、アスコルビン酸パルミテート、ブチル化ヒドロキシアニソール、ブチル化ヒドロキシトルエン、レシチン、没食子酸プロピルまたは - トコフェロールであることを特徴とする請求項 6 8 記載の医薬組成物。

【請求項 7 0】

前記抗酸化剤がアスコルビン酸塩であることを特徴とする請求項 6 8 記載の医薬組成物。

【請求項 7 1】

前記緩衝剤は、クエン酸塩、アスコルビン酸塩、リン酸塩、重炭酸塩、炭酸塩、フマル酸塩、酢酸塩、酒石酸塩、リンゴ酸塩、コハク酸塩、乳酸塩、マレイン酸塩、グリシン、または天然に存在するその他の - もしくは - アミノ酸であることを特徴とする請求項 6 8 記載の医薬組成物。

【請求項 7 2】

前記緩衝剤がクエン酸塩であることを特徴とする請求項 6 8 記載の医薬組成物。

【請求項 7 3】

前記金属キレート化剤は、クエン酸、エチレンジアミン四酢酸 (EDTA) およびその塩、DTPA (ジエチレントリアミン五酢酸) およびその塩、EGTA およびその塩、NTA (ニトリロ酢酸) およびその塩、ソルビトールおよびその塩、酒石酸およびその塩、N - ヒドロキシイミノジアセタートおよびその塩、ヒドロキシエチルエチレンジアミン四酢酸およびその塩、1 - および 3 - プロパンジアミン四酢酸およびそれらの塩類、1 - および 3 - ジアミノ - 2 - ヒドロキシプロパン四酢酸およびそれらの塩類、グルコン酸ナトリウム、ヒドロキシエタンニリン酸およびその塩、または、リン酸およびその塩であることを特徴とする請求項 6 8 記載の医薬組成物。

【請求項 7 4】

前記金属キレート化剤が EDTA であることを特徴とする請求項 6 8 記載の医薬組成物。

【請求項 7 5】

前記緩衝剤がクエン酸塩であり、前記抗酸化剤がアスコルビン酸塩であり、さらに、前記金属キレート化剤が EDTA であることを特徴とする請求項 6 8 記載の医薬組成物。

【請求項 7 6】

前記 EDTA の、構造式 2 で表される化合物に対するモル比は、0.001 ~ 0.1 であることを特徴とする請求項 7 5 記載の医薬組成物。

【請求項 7 7】

前記EDTAの、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.01～0.05であることを特徴とする請求項75記載の医薬組成物。

【請求項78】

前記アスコルビン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.001～1であることを特徴とする請求項75記載の医薬組成物。

【請求項79】

前記アスコルビン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.01～1であることを特徴とする請求項75記載の医薬組成物。

【請求項80】

前記クエン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.05～2であることを特徴とする請求項75記載の医薬組成物。

【請求項81】

前記クエン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.21であることを特徴とする請求項75記載の医薬組成物。

【請求項82】

前記EDTAの、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.001～0.1であり；前記アスコルビン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.001～1であることを特徴とする請求項75記載の医薬組成物。

【請求項83】

前記EDTAの、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.01～0.05であり；前記アスコルビン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.01～1であることを特徴とする請求項75記載の医薬組成物。

【請求項84】

前記EDTAの、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.001～0.1であり；前記アスコルビン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.001～1であり；前記クエン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.05～2であることを特徴とする請求項75記載の医薬組成物。

【請求項85】

前記EDTAの、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.01～0.05であり；前記アスコルビン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.01～1であり；前記クエン酸の、構造式2で表される化合物に対するモル比は、0.2～1であることを特徴とする請求項75記載の医薬組成物。

【請求項86】

可溶化剤をさらに含むことを特徴とする請求項61から85いずれか1項記載の医薬組成物。

【請求項87】

前記可溶化剤は、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類、ポリオキシエチレンステアリン酸塩類、ベンジルアルコール、エチルアルコール、ポリエチレングリコール類、プロピレングリコール、グリセリン、シクロデキストリンまたはポロキサマー類であることを特徴とする請求項86記載の医薬組成物。

【請求項88】

構造式2で表される前記化合物の濃度は、0.00016M～0.160Mであることを特徴とする請求項34から87いずれか1項記載の医薬組成物。

【請求項89】

構造式2で表される前記化合物の濃度は、0.00032M～0.080Mであることを特徴とする請求項34から87いずれか1項記載の医薬組成物。

【請求項90】

治療的効果量の請求項1-19および21-33いずれか1項記載の化合物、あるいは治療的効果量の請求項20および34から89いずれか1項記載の組成物を含む、哺乳類において癌を治療するための医薬組成物。

【請求項 9 1】

前記癌は、造血系、免疫系、内分泌系、肺、胃腸管系、筋骨格系、生殖系、中枢神経系または泌尿器系の癌であることを特徴とする請求項 9 0 記載の医薬組成物。

【請求項 9 2】

前記癌は、哺乳類の骨髄組織、リンパ節組織、膵臓組織、甲状腺組織、肺、結腸組織、直腸組織、肛門組織、肝臓組織、皮膚、骨、卵巣組織、子宮組織、膣組織、乳房、前立腺、精巣組織、脳、脳幹、髄膜組織、腎臓または膀胱に存在していることを特徴とする請求項 9 0 記載の医薬組成物。

【請求項 9 3】

前記癌は、哺乳類の骨髄組織、リンパ節組織、乳房、肺、卵巣または前立腺に存在していることを特徴とする請求項 9 0 記載の医薬組成物。

【請求項 9 4】

前記癌は、乳癌、多発性骨髄腫、前立腺癌、ホジキンリンパ腫、非ホジキンリンパ腫、急性リンパ球性白血病、慢性リンパ急性白血病、急性骨髄性白血病、慢性骨髄性白血病、腎細胞癌、悪性黒色腫、膵臓癌、肺癌、直腸結腸癌、結腸癌、脳腫瘍、腎臓癌、頭部および頸部癌、膀胱癌、甲状腺癌、卵巣癌、子宮頸癌または骨髄異形成症候群であることを特徴とする請求項 9 0 記載の医薬組成物。

【請求項 9 5】

前記癌は、乳癌、急性骨髄性白血病、慢性骨髄性白血病、黒色腫、多発性骨髄腫、小細胞性肺癌、卵巣癌または前立腺癌であることを特徴とする請求項 9 0 記載の医薬組成物。

【請求項 9 6】

前記哺乳類は、霊長類、ウマ、イヌ、ネコまたはウシであることを特徴とする請求項 9 0 記載の医薬組成物。

【請求項 9 7】

前記哺乳類がヒトであることを特徴とする請求項 9 0 記載の医薬組成物。

【請求項 9 8】

前記化合物の投与様式が、吸入、経口、静注、舌下、眼窩、経皮、直腸、膣、局所、筋肉内、動脈内、くも膜下、皮下、頬内または経鼻投与であることを特徴とする請求項 9 0 記載の医薬組成物。

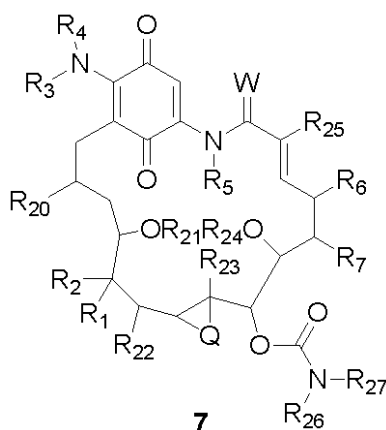
【請求項 9 9】

前記化合物の投与様式が静脈内投与であることを特徴とする請求項 9 0 記載の医薬組成物。

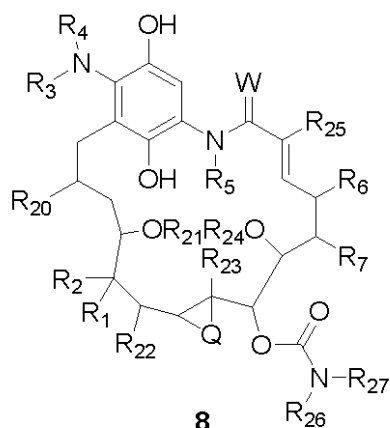
【請求項 1 0 0】

構造式1で表される化合物を調製する方法であって、反応溶媒中、構造式7で表される化合物に還元剤を混合して構造式8で表される化合物を得て；

【化 1 8】

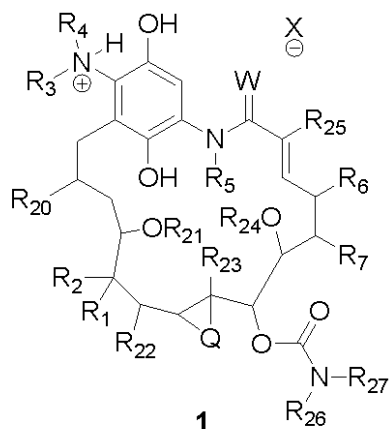


【化 1 9】



さらに、前記構造式8で表される化合物に薬剤学的に許容される酸を混合することにより、構造式1で表される化合物を得る；工程を含み、

【化 2 0】



ここで、それぞれ別異に、

Wは酸素であり；

Qは結合であり；

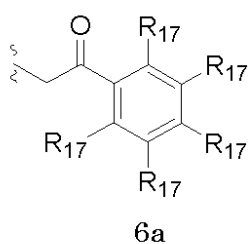
X⁻は、薬剤学的に許容される酸の共役塩基であり；

R₁は、水酸基または -OC(O)R₈であり；さらに、R₂は水素であり；

R₃およびR₄は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アラルキル、ヘテロアラルキルおよび - [(CR₂)_p] - R₁₆より成る群から選択され；あるいは、R₃はR₄と一緒に、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R₅は、H、および下記構造式6aを有する基より成る群から選択され；

【化 2 1】



ここで、R₁₇は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン化物、水酸基、アルコキシル、アリールオキシ、アシルオキシ、アミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、アシルアミノ、アラルキルアミノ、ニトロ、アシルチオ、カルボキシアミド、カルボキシル、ニトリル、-COR₁₈、-CO₂R₁₈、-N(R₁₈)CO₂R₁₉、-OC(O)N(R₁₈)(R₁₉)、-N(R₁₈)SO₂R₁₉、-N(R₁₈)C

(O)N(R₁₈)(R₁₉)、および -CH₂O- ヘテロサイクリルより成る群から選択され；

R₆およびR₇はいずれも水素であり；あるいは、R₆およびR₇は一緒に結合を形成し；

R₈は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは - [(CR₂)_p] - R₁₆であり；

R₁₆は、それぞれ別異に、水素、水酸基、アシルアミノ、-N(R₁₈)COR₁₉、-N(R₁₈)C(O)OR₁₉、-N(R₁₈)SO₂(R₁₉)、-CON(R₁₈)(R₁₉)、-OC(O)N(R₁₈)(R₁₉)、-SO₂N(R₁₈)(R₁₉)、-N(R₁₈)(R₁₉)、-OC(O)OR₁₈、-COOR₁₈、-C(O)N(OH)(R₁₈)、-OS(O)₂OR₁₈、-S(O)₂OR₁₈、-OP(O)(OR₁₈)(OR₁₉)、-N(R₁₈)P(O)(OR₁₈)(OR₁₉)および -P(O)(OR₁₈)(OR₁₉)より成る群から選択され；

pは1、2、3、4、5または6であり；

R₁₈は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R₁₉は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

あるいは、R₁₈は、R₁₉と一緒に、必要に応じて置換された4~8員環を表し；

R₂₀、R₂₁、R₂₂、R₂₄およびR₂₅は、それぞれ別異にアルキルであり；

R₂₃は、アルキルであり；

R₂₆およびR₂₇は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R₁が水酸基であり、R₆およびR₇は一緒に二重結合を形成し、R₂₀はメチルであり、R₂₁はメチルであり、R₂₂はメチルであり、R₂₃はメチルであり、R₂₄はメチルであり、R₂₅はメチルであり、R₂₆は水素であり、およびR₂₇は水素である場合に、R₃およびR₄の少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してもおらず；さらに

構造式1の立体中心における絶対立体化学は、RもしくはS、またはそれらの混合物であり、また、二重結合の立体化学は、EもしくはZ、またはそれらの混合物であることを特徴とする調製法。

【請求項101】

前記還元剤は、ヒドロ亜硫酸ナトリウム、亜鉛、アスコルビン酸、または電気化学的還元であることを特徴とする請求項100記載の調製法。

【請求項102】

前記還元剤は、ヒドロ亜硫酸ナトリウムであることを特徴とする請求項100記載の調製法。

【請求項103】

前記反応溶媒は、ジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタン、クロロベンゼン、THF、2-MeTHF、ジエチルエーテル、ジグリム、1,2-ジメトキシエタン、MTBE、THP、ジオキサン、2-エトキシブタン、メチルブチルエーテル、酢酸エチル、酢酸メチル、2-ブタノン、水またはそれらの混合物であることを特徴とする請求項100記載の調製法。

【請求項104】

前記反応溶媒は、酢酸エチルと水の混合物であることを特徴とする請求項100記載の調製法。

【請求項105】

前記酸のpKaは、水中で-10~7であることを特徴とする請求項100記載の調製法。

【請求項106】

前記酸のpKaは、水中で-10~4であることを特徴とする請求項100記載の調製法。

【請求項107】

前記酸のpKaは、水中で-10~1であることを特徴とする請求項100記載の調製法。

【請求項 108】

前記酸のpKaは、水中で -10 ~ -3であることを特徴とする請求項100記載の調製法。

【請求項 109】

前記酸は、HCl、HBr、H₂SO₄、メタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸、トリフルル酸、カンファースルホン酸、ナフタレン-1,5-ジスルホン酸、エタン-1,2-ジスルホン酸、シクラミン酸、チオシアン酸、ナフタレン-2-スルホン酸またはシュウ酸であることを特徴とする請求項100記載の調製法。

【請求項 110】

前記酸がHClであることを特徴とする請求項100記載の調製法。

【請求項 111】

前記酸がHBrであることを特徴とする請求項100記載の調製法。

【請求項 112】

前記酸を気体として添加することを特徴とする請求項100記載の調製法。

【請求項 113】

前記酸を有機溶媒に溶解することを特徴とする請求項100記載の調製法。

【請求項 114】

前記有機溶媒がEtOAc、DCM、IPAまたはジオキサンであることを特徴とする請求項113記載の調製法。

【請求項 115】

R₁が水酸基であり；R₃がアリルであり；R₄が水素であり；R₅が水素であり；R₆およびR₇は一緒に二重結合を形成し、R₂₀はメチルであり、R₂₁はメチルであり、R₂₂はメチルであり、R₂₃はメチルであり、R₂₄はメチルであり、R₂₅はメチルであり、R₂₆は水素であり、およびR₂₇は水素であることを特徴とする請求項108から114いずれか1項記載の調製法。

【請求項 116】

前記哺乳類がヒトであり、前記癌が非小細胞性肺癌であり、前記化合物が上記構造式3で示され、さらにX⁻は塩化物であることを特徴とする請求項90記載の医薬組成物。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0219

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0219】

ある実施態様においては、本発明は、上述の組成物および付随する定義に関し、ここで、該抗酸化剤は、アスコルビン酸塩、塩酸システイン、亜硫酸水素ナトリウム、メタ亜硫酸水素ナトリウム、亜硫酸ナトリウム、チオグリセロール、メルカプト酢酸ナトリウム、ホルムアルデヒドスルホキシレートナトリウム、アスコルビン酸パルミテート、ブチル化ヒドロキシアニソール、ブチル化ヒドロキシトルエン、レシチン、没食子酸プロピルまたは - トコフェロールである。

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0249

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0249】

ある実施態様においては、本発明は、上述の組成物および付随する定義に関し、ここで、該抗酸化剤は、アスコルビン酸塩、塩酸システイン、亜硫酸水素ナトリウム、メタ亜硫酸水素ナトリウム、亜硫酸ナトリウム、チオグリセロール、メルカプト酢酸ナトリウム、ホルムアルデヒドスルホキシレートナトリウム、アスコルビン酸パルミテート、ブチル化ヒドロキシアニソール、ブチル化ヒドロキシトルエン、レシチン、没食子酸プロピルまた

は - トコフェロールである。

【誤訳訂正4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0307

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0307】

薬剤学的に許容される抗酸化剤としては次のようなものが挙げられるが、これらに限定されるわけではない：(1)水溶性抗酸化剤、例えば、アスコルビン酸、塩酸システイン、亜硫酸水素ナトリウム、メタ亜硫酸水素ナトリウム、亜硫酸ナトリウム、チオグリセロール、メルカプト酢酸ナトリウムおよびホルムアルデヒドスルホキシレートナトリウムなど；(2)油溶性抗酸化剤、例えば、アスコルビン酸パルミテート、ブチル化ヒドロキシアニソール(BHA)、ブチル化ヒドロキシトルエン(BHT)、レシチン、没食子酸プロピル、
- トコフェロールなど。

【誤訳訂正5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0012

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0012】

ここで、 R_{17} は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン化物、水酸基、アルコキシル、アリーロキシ、アシルオキシ、アミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、アシルアミノ、アラキルアミノ、ニトロ、アシルチオ、カルボキシアミド、カルボキシル、ニトリル、
- COR_{18} 、
- CO_2R_{18} 、
- $N(R_{18})CO_2R_{19}$ 、
- $OC(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、
- $N(R_{18})SO_2R_{19}$ 、
- $N(R_{18})C(O)N(R_{18})(R_{19})$ および CH_2O -ヘテロサイクリルより成る群から選択され；

R_6 および R_7 はいずれも水素であり；あるいは、 R_6 および R_7 は互いに結合を形成し；

R_8 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリール、ヘテロアラキルまたは - $[(CR_2)_p]$ - R_{16} であり；

R_9 は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリール、ヘテロアラキルまたは - $[(CR_2)_p]$ - R_{16} であり；

R_{10} および R_{11} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリール、ヘテロアラキルおよび - $[(CR_2)_p]$ - R_{16} より成る群から選択され；あるいは、 R_{10} および R_{11} は、それらが結合している窒素を共有し、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R_{12} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリール、ヘテロアラキルまたは - $[(CR_2)_p]$ - R_{16} であり；

R_{13} および R_{14} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリール、ヘテロアラキルおよび - $[(CR_2)_p]$ - R_{16} より成る群から選択され；あるいは、 R_{13} および R_{14} は、それらが結合している窒素を共有し、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R_{16} は、水素、水酸基、アシルアミノ、
- $N(R_{18})COR_{19}$ 、
- $N(R_{18})C(O)OR_{19}$ 、
- $N(R_{18})SO_2R_{19}$ 、
- $CON(R_{18})(R_{19})$ 、
- $OC(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、
- $SO_2N(R_{18})(R_{19})$ 、
- $N(R_{18})(R_{19})$ 、
- $C(O)OR_{18}$ 、
- $COOR_{18}$ 、
- $C(O)N(OH)(R_{18})$ 、
- $OS(O)_2OR_{18}$ 、
- $S(O)_2OR_{18}$ 、
- $OP(O)(OR_{18})(OR_{19})$ 、
- $N(R_{18})P(O)(OR_{18})(OR_{19})$ および - $P(O)(OR_{18})(OR_{19})$ より成る群から選択され；

p は1、2、3、4、5または6であり；

R_{18} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R_{19} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；あるいは、 R_{18} は、 R_{19} と共に、必要に応じて置換された4~8員環を表し；

R_{20} 、 R_{21} 、 R_{22} 、 R_{24} および R_{25} は、それぞれ別異にアルキルであり；

R_{23} は、アルキル、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{COOR}_{18}$ または $-\text{CH}(\text{OR}_{18})_2$ であり；

R_{26} および R_{27} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R_1 が水酸基であり、 R_2 が水素であり、 R_6 および R_7 は共に二重結合を形成し、 R_{20} はメチルであり、 R_{21} はメチルであり、 R_{22} はメチルであり、 R_{23} はメチルであり、 R_{24} はメチルであり、 R_{25} はメチルであり、 R_{26} は水素であり、 R_{27} は水素であり、 Q は結合であり、さらに、 W は酸素である場合に； R_3 および R_4 の少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してもおらず；さらに、

構造式1の立体中心における絶対立体化学は、 R もしくは S 、またはそれらの混合物であり、また、二重結合の立体化学は、 E もしくは Z 、またはそれらの混合物である。

【誤訳訂正6】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0016

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0016】

ここで、 R_{17} は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン化物、水酸基、アルコキシル、アリーロキシ、アシルオキシ、アミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、アシルアミノ、アラルキルアミノ、ニトロ、アシルチオ、カルボキシアミド、カルボキシル、ニトリル、 $-\text{COR}_{18}$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}_{18}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{CO}_2\text{R}_{19}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{SO}_2\text{R}_{19}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ および CH_2O -ヘテロサイクリルより成る群から選択され；

R_6 および R_7 はいずれも水素であり；あるいは、 R_6 および R_7 は互いに結合を形成し；

R_8 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは $-\text{[(CR}_2\text{)}_p]$ - R_{16} であり；

R_{16} は、水素、水酸基、アシルアミノ、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{COR}_{19}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{C}(\text{O})\text{OR}_{19}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{SO}_2\text{R}_{19}$ 、 $-\text{CON}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{OR}_{18}$ 、 $-\text{COOR}_{18}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{OH})(\text{R}_{18})$ 、 $-\text{OS}(\text{O})_2\text{OR}_{18}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{OR}_{18}$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}_{18})(\text{OR}_{19})$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{P}(\text{O})(\text{OR}_{18})(\text{OR}_{19})$ および $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}_{18})(\text{OR}_{19})$ より成る群から選択され；

p は 1、2、3、4、5 または 6 であり；

R_{18} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R_{19} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；あるいは、 R_{18} は、 R_{19} と共に、必要に応じて置換された4~8員環を表し；

R_{27} は、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアラルキルであり；

R_1 が水酸基であり、 R_2 が水素であり、 R_6 および R_7 は共に二重結合を形成し、 R_{27} は水素である場合に； R_3 および R_4 の少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してもおらず；さらに、

二重結合の立体化学は、EもしくはZ、またはそれらの混合物である。

【誤訳訂正7】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0027

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0027】

ここで、 R_{17} は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン化物、水酸基、アルコキシ、アリアルオキシ、アシルオキシ、アミノ、アルキルアミノ、アリアルアミノ、アシルアミノ、アラルキルアミノ、ニトロ、アシルチオ、カルボキシアミド、カルボキシル、ニトリル、 $-COR_{18}$ 、 $-CO_2R_{18}$ 、 $-N(R_{18})CO_2R_{19}$ 、 $-OC(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-N(R_{18})SO_2R_{19}$ 、 $-N(R_{18})C(O)N(R_{18})(R_{19})$ および CH_2O -ヘテロサイクリルより成る群から選択され；

R_6 および R_7 はいずれも水素であり；あるいは、 R_6 および R_7 は互いに結合を形成し；

R_8 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリアル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリアル、ヘテロアラルキルまたは $-[(CR_2)_p]-R_{16}$ であり；

R_9 は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリアル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリアル、ヘテロアラルキルまたは $-[(CR_2)_p]-R_{16}$ であり；

R_{10} および R_{11} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリアル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリアル、ヘテロアラルキルおよび $-[(CR_2)_p]-R_{16}$ より成る群から選択され；あるいは、 R_{10} および R_{11} は、それらが結合している窒素を共有し、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R_{12} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリアル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリアル、ヘテロアラルキルまたは $-[(CR_2)_p]-R_{16}$ であり；

R_{13} および R_{14} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリアル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリアル、ヘテロアラルキルおよび $-[(CR_2)_p]-R_{16}$ より成る群から選択され；あるいは、 R_{13} および R_{14} は、それらが結合している窒素を共有し、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R_{16} は、水素、水酸基、アシルアミノ、 $-N(R_{18})COR_{19}$ 、 $-N(R_{18})C(O)OR_{19}$ 、 $-N(R_{18})SO_2R_{19}$ 、 $-CON(R_{18})(R_{19})$ 、 $-OC(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-SO_2N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-OC(O)OR_{18}$ 、 $-COOR_{18}$ 、 $-C(O)N(OH)(R_{18})$ 、 $-OS(O)_2OR_{18}$ 、 $-S(O)_2OR_{18}$ 、 $-OP(O)(OR_{18})(OR_{19})$ 、 $-N(R_{18})P(O)(OR_{18})(OR_{19})$ および $-P(O)(OR_{18})(OR_{19})$ より成る群から選択され；
 p は1、2、3、4、5または6であり；

R_{18} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリアル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリアルおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R_{19} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリアル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリアルおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

あるいは、 R_{18} は、 R_{19} と共に、必要に応じて置換された4~8員環を表し；

R_{20} 、 R_{21} 、 R_{22} 、 R_{24} および R_{25} は、それぞれ別異にアルキルであり；

R_{23} は、アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CHO$ 、 $-COOR_{18}$ または $-CH(OR_{18})_2$ であり；

R_{26} および R_{27} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリアル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリアルおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R_1 が水酸基であり、 R_2 が水素であり、 R_6 および R_7 は互いに二重結合を形成し、 R_{20} はメチルであり、 R_{21} はメチルであり、 R_{22} はメチルであり、 R_{23} はメチルであり、 R_{24} はメチル

であり、 R_{25} はメチルであり、 R_{26} は水素であり、 R_{27} は水素であり、 Q は結合であり、 W が酸素である場合に、 R_3 および R_4 の少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してもおらず；さらに

構造式6の立体中心における絶対立体化学は、 R もしくは S 、またはそれらの混合物であり、また、二重結合の立体化学は、 E もしくは Z 、またはそれらの混合物である。

【誤訳訂正8】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0031

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0031】

ここで、 R_{17} は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン化物、水酸基、アルコキシ、アリアルオキシ、アシルオキシ、アミノ、アルキルアミノ、アリアルアミノ、アシルアミノ、アルキルアミノ、ニトロ、アシルチオ、カルボキシアミド、カルボキシル、ニトリル、 $-COR_{18}$ 、 $-CO_2R_{18}$ 、 $-N(R_{18})CO_2R_{19}$ 、 $-OC(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-N(R_{18})SO_2R_{19}$ 、 $-N(R_{18})C(O)N(R_{18})(R_{19})$ および CH_2O -ヘテロサイクリルより成る群から選択され；

R_6 および R_7 はいずれも水素であり；あるいは、 R_6 および R_7 は互いに結合を形成し；

R_8 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリアル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリアル、ヘテロアラルキルまたは $-[(CR_2)_p]$ - R_{16} であり；

R_9 は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリアル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリアル、ヘテロアラルキルまたは $-[(CR_2)_p]$ - R_{16} であり；

R_{10} および R_{11} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリアル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリアル、ヘテロアラルキルおよび $-[(CR_2)_p]$ - R_{16} より成る群から選択され；あるいは、 R_{10} および R_{11} は、それらが結合している窒素を共有し、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R_{12} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリアル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリアル、ヘテロアラルキルまたは $-[(CR_2)_p]$ - R_{16} であり；

R_{13} および R_{14} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリアル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリアル、ヘテロアラルキルおよび $-[(CR_2)_p]$ - R_{16} より成る群から選択され；あるいは、 R_{13} および R_{14} は、それらが結合している窒素を共有し、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R_{16} は、それぞれ別異に、水素、水酸基、アシルアミノ、 $-N(R_{18})COR_{19}$ 、 $-N(R_{18})C(O)OR_{19}$ 、 $-N(R_{18})SO_2R_{19}$ 、 $-CON(R_{18})(R_{19})$ 、 $-OC(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-SO_2N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-OC(O)OR_{18}$ 、 $-COOR_{18}$ 、 $-C(O)N(OH)(R_{18})$ 、 $-S(O)_2OR_{18}$ 、 $-S(O)_2OR_{18}$ 、 $-OP(O)(OR_{18})(OR_{19})$ 、 $-N(R_{18})P(O)(OR_{18})(OR_{19})$ および $-P(O)(OR_{18})(OR_{19})$ より成る群から選択され；

p は1、2、3、4、5または6であり；

R_{18} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリアル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリアルおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R_{19} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリアル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリアルおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；あるいは、 R_{18} は、 R_{19} と共に、必要に応じて置換された4~8員環を表し；

R_{20} 、 R_{21} 、 R_{22} 、 R_{24} および R_{25} は、それぞれ別異にアルキルであり；

R_{23} は、アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CHO$ 、 $-COOR_{18}$ または $-CH(OR_{18})_2$ であり；

R_{26} および R_{27} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリアル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリアルおよびヘテロアラルキルより成る群から

選択され；

R_1 が水酸基であり、 R_2 が水素であり、 R_6 および R_7 は互いに二重結合を形成し、 R_{20} はメチルであり、 R_{21} はメチルであり、 R_{22} はメチルであり、 R_{23} はメチルであり、 R_{24} はメチルであり、 R_{25} はメチルであり、 R_{26} は水素であり、 R_{27} は水素であり、 Q は結合であり、 W が酸素である場合に、 R_3 および R_4 の少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してもおらず；さらに

構造式6または10の立体中心における絶対立体化学は、 R もしくは S 、またはそれらの混合物であり、また、二重結合の立体化学は、 E もしくは Z 、またはそれらの混合物である。

【誤訳訂正9】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0036

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0036】

ここで、 R_{17} は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン化物、水酸基、アルコキシ、アリーロキシ、アシルオキシ、アミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、アシルアミノ、アラキルアミノ、ニトロ、アシルチオ、カルボキシアミド、カルボキシル、ニトリル、 $-COR_{18}$ 、 $-CO_2R_{18}$ 、 $-N(R_{18})CO_2R_{19}$ 、 $-OC(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-N(R_{18})SO_2R_{19}$ 、 $-N(R_{18})C(O)N(R_{18})(R_{19})$ および CH_2O -ヘテロサイクリルより成る群から選択され；

R_6 および R_7 はいずれも水素であり；あるいは、 R_6 および R_7 は互いに結合を形成し；

R_8 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリール、ヘテロアラキルまたは $-[(CR_2)_p]-R_{16}$ であり；

R_9 は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリール、ヘテロアラキルまたは $-[(CR_2)_p]-R_{16}$ であり；

R_{10} および R_{11} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリール、ヘテロアラキルおよび $-[(CR_2)_p]-R_{16}$ より成る群から選択され；あるいは、 R_{10} および R_{11} は、それらが結合している窒素を共有し、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R_{12} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリール、ヘテロアラキルまたは $-[(CR_2)_p]-R_{16}$ であり；

R_{13} および R_{14} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリール、ヘテロアラキルおよび $-[(CR_2)_p]-R_{16}$ より成る群から選択され；あるいは、 R_{13} および R_{14} は、それらが結合している窒素を共有し、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R_{16} は、水素、水酸基、アシルアミノ、 $-N(R_{18})COR_{19}$ 、 $-N(R_{18})C(O)OR_{19}$ 、 $-N(R_{18})SO_2R_{19}$ 、 $-CON(R_{18})(R_{19})$ 、 $-OC(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-SO_2N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-OC(O)OR_{18}$ 、 $-COOR_{18}$ 、 $-C(O)N(OH)(R_{18})$ 、 $-OS(O)_2OR_{18}$ 、 $-S(O)_2OR_{18}$ 、 $-OP(O)(OR_{18})(OR_{19})$ 、 $-N(R_{18})P(O)(OR_{18})(OR_{19})$ および $-P(O)(OR_{18})(OR_{19})$ より成る群から選択され；

p は1、2、3、4、5または6であり；

R_{18} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラキルより成る群から選択され；

R_{19} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラキルより成る群から選択され；

あるいは、 R_{18} は、 R_{19} と共に、必要に応じて置換された4~8員環を表し；

R_{20} 、 R_{21} 、 R_{22} 、 R_{24} および R_{25} は、それぞれ別異にアルキルであり；

R_{23} は、アルキル、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{COOR}_{18}$ または $-\text{CH}(\text{OR}_{18})_2$ であり；

R_{26} および R_{27} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R_1 が水酸基であり、 R_2 が水素であり、 R_6 および R_7 は互いに二重結合を形成し、 R_{20} はメチルであり、 R_{21} はメチルであり、 R_{22} はメチルであり、 R_{23} はメチルであり、 R_{24} はメチルであり、 R_{25} はメチルであり、 R_{26} は水素であり、 R_{27} は水素であり、 Q は結合であり、 W が酸素である場合に、 R_3 および R_4 の少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してもおらず；さらに

構造式1の立体中心における絶対立体化学は、 R もしくは S 、またはそれらの混合物であり、また、二重結合の立体化学は、 E もしくは Z 、またはそれらの混合物である。

【誤訳訂正10】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0112

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0112】

ここで、 R_{17} は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン化物、水酸基、アルコキシ、アリールオキシ、アシルオキシ、アミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、アシルアミノ、アラルキルアミノ、ニトロ、アシルチオ、カルボキシアミド、カルボキシル、ニトリル、 $-\text{COR}_{18}$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}_{18}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{CO}_2\text{R}_{19}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{SO}_2\text{R}_{19}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、および $-\text{CH}_2\text{O}$ - ヘテロサイクリルより成る群から選択され；

R_6 および R_7 はいずれも水素であり；あるいは、 R_6 および R_7 は互いに結合を形成し；

R_8 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは $-\text{[(CR}_2\text{)}_p]$ - R_{16} であり；

R_9 は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは $-\text{[(CR}_2\text{)}_p]$ - R_{16} であり；

R_{10} および R_{11} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルおよび $-\text{[(CR}_2\text{)}_p]$ - R_{16} より成る群から選択され；あるいは、 R_{10} および R_{11} は、それらが結合している窒素を共有し、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R_{12} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは $-\text{[(CR}_2\text{)}_p]$ - R_{16} であり；

R_{13} および R_{14} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルおよび $-\text{[(CR}_2\text{)}_p]$ - R_{16} より成る群から選択され；あるいは、 R_{13} および R_{14} は、それらが結合している窒素を共有し、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R_{16} は、水素、水酸基、アシルアミノ、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{COR}_{19}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{C}(\text{O})\text{OR}_{19}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{SO}_2(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{CON}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{OR}_{18}$ 、 $-\text{COOR}_{18}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{OH})(\text{R}_{18})$ 、 $-\text{OS}(\text{O}_2)\text{OR}_{18}$ 、 $-\text{S}(\text{O}_2)\text{OR}_{18}$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}_{18})(\text{OR}_{19})$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{P}(\text{O})(\text{OR}_{18})(\text{OR}_{19})$ および $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}_{18})(\text{OR}_{19})$ より成る群から選択され；

p は 1、2、3、4、5 または 6 であり；

R_{18} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R_{19} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；あるいは、 R_{18} は、 R_{19} と共に、必要に応じて置換された4~8員環を表し；

R_{20} 、 R_{21} 、 R_{22} 、 R_{24} および R_{25} は、それぞれ別異にアルキルであり；

R_{23} は、アルキル、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{COOR}_{18}$ または $-\text{CH}(\text{OR}_{18})_2$ であり；

R_{26} および R_{27} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R_1 が水酸基であり、 R_2 が水素であり、 R_6 および R_7 は共に二重結合を形成し、 R_{20} はメチルであり、 R_{21} はメチルであり、 R_{22} はメチルであり、 R_{23} はメチルであり、 R_{24} はメチルであり、 R_{25} はメチルであり、 R_{26} は水素であり、 R_{27} は水素であり、 Q は結合であり、さらに、 W は酸素である場合に； R_3 および R_4 の少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してもおらず；さらに、

構造式1の立体中心における絶対立体化学は、 R もしくは S 、またはそれらの混合物であり、また、二重結合の立体化学は、 E もしくは Z 、またはそれらの混合物である。

【誤訳訂正 1 1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 1 1 3

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 1 1 3】

ある実施態様においては、本発明は、上述の化合物および付随する定義に関し、 R_1 が水酸基であり、 R_2 が水素であり、 R_5 が水素であり、 R_6 および R_7 は共に二重結合を形成し、 R_{20} はメチルであり、 R_{21} はメチルであり、 R_{22} はメチルであり、 R_{23} はメチルであり、 R_{24} はメチルであり、 R_{25} はメチルであり、 R_{26} は水素であり、 R_{27} は水素であり、 Q は結合であり、さらに、 W は酸素である場合に； R_3 および R_4 の少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してはいない。

【誤訳訂正 1 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 1 4 1

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 1 4 1】

ここで、 R_{17} は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン化物、水酸基、アルコキシル、アリーロキシ、アシルオキシ、アミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、アシルアミノ、アラルキルアミノ、ニトロ、アシルチオ、カルボキシアミド、カルボキシル、ニトリル、 $-\text{COR}_{18}$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}_{18}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{CO}_2\text{R}_{19}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{SO}_2\text{R}_{19}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、および $-\text{CH}_2\text{O}$ -ヘテロサイクリルより成る群から選択され；

R_6 および R_7 はいずれも水素であり；あるいは、 R_6 および R_7 は互いに結合を形成し；

R_8 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは $-\text{[(CR}_2\text{)}_p]$ - R_{16} であり；

R_{16} は、水素、水酸基、アシルアミノ、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{COR}_{19}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{C}(\text{O})\text{OR}_{19}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{SO}_2\text{R}_{19}$ 、 $-\text{CON}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{OR}_{18}$ 、 $-\text{COOR}_{18}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{OH})(\text{R}_{18})$ 、 $-\text{OS}(\text{O})_2\text{OR}_{18}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{OR}_{18}$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}_{18})(\text{OR}_{19})$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{P}(\text{O})(\text{OR}_{18})(\text{OR}_{19})$ および $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}_{18})(\text{OR}_{19})$ より成る群から選択され；

p は1、2、3、4、5または6であり；

R_{18} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロ

アルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R_{19} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；あるいは、 R_{18} は、 R_{19} と共に、必要に応じて置換された4~8員環を表し；

R_{27} は、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアラルキルであり；

R_1 が水酸基であり、 R_2 が水素であり、 R_6 および R_7 は共に二重結合を形成し、 R_{27} は水素である場合には； R_3 および R_4 の少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してもおらず；さらに、

二重結合の立体化学は、EもしくはZ、またはそれらの混合物である。

【誤訳訂正 1 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 1 4 2

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 1 4 2】

ある実施態様においては、本発明は、上述の化合物および付随する定義に関し、ここで、 R_1 が水酸基であり、 R_2 が水素であり、 R_6 および R_7 は共に二重結合を形成し、 R_{27} は水素である場合には； R_3 および R_4 の少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してもいない。

【誤訳訂正 1 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 2 1 0

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 2 1 0】

ここで、 R_{17} は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン化物、水酸基、アルコキシル、アリーロキシ、アシルオキシ、アミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、アシルアミノ、アラルキルアミノ、ニトロ、アシルチオ、カルボキシアミド、カルボキシル、ニトリル、 $-\text{COR}_{18}$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}_{18}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{CO}_2\text{R}_{19}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{SO}_2\text{R}_{19}$ 、 $-\text{N}(\text{R}_{18})\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}_{18})(\text{R}_{19})$ 、および $-\text{CH}_2\text{O}-$ ヘテロサイクリルより成る群から選択され；

R_6 および R_7 はいずれも水素であり；あるいは、 R_6 および R_7 は互いに結合を形成し；

R_8 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは $-\text{[(CR}_2\text{)}_p\text{]}-\text{R}_{16}$ であり；

R_9 は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは $-\text{[(CR}_2\text{)}_p\text{]}-\text{R}_{16}$ であり；

R_{10} および R_{11} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルおよび $-\text{[(CR}_2\text{)}_p\text{]}-\text{R}_{16}$ より成る群から選択され；あるいは、 R_{10} および R_{11} は、それらが結合している窒素を共有し、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R_{12} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは $-\text{[(CR}_2\text{)}_p\text{]}-\text{R}_{16}$ であり；

R_{13} および R_{14} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラ

ルキルおよび $-(CR_2)_p$ - R_{16} より成る群から選択され；あるいは、 R_{13} および R_{14} は、それらが結合している窒素を共有し、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R_{16} は、それぞれ別異に、水素、水酸基、アシルアミノ、 $-N(R_{18})COR_{19}$ 、 $-N(R_{18})C(O)OR_{19}$ 、 $-N(R_{18})SO_2(R_{19})$ 、 $-CON(R_{18})(R_{19})$ 、 $-OC(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-SO_2N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-OC(O)OR_{18}$ 、 $-COOR_{18}$ 、 $-C(O)N(OH)(R_{18})$ 、 $-OS(O)_2OR_{18}$ 、 $-S(O)_2OR_{18}$ 、 $-OP(O)(OR_{18})(OR_{19})$ 、 $-N(R_{18})P(O)(OR_{18})(OR_{19})$ および $-P(O)(OR_{18})(OR_{19})$ より成る群から選択され；

p は 1、2、3、4、5 または 6 であり；

R_{18} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R_{19} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

あるいは、 R_{18} は、 R_{19} と共に、必要に応じて置換された4~8員環を表し；

R_{20} 、 R_{21} 、 R_{22} 、 R_{24} および R_{25} は、それぞれ別異にアルキルであり；

R_{23} は、アルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CHO$ 、 $-COOR_{18}$ または $-CH(OR_{18})_2$ であり；

R_{26} および R_{27} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R_1 が水酸基であり、 R_2 が水素であり、 R_6 および R_7 は互いに二重結合を形成し、 R_{20} はメチルであり、 R_{21} はメチルであり、 R_{22} はメチルであり、 R_{23} はメチルであり、 R_{24} はメチルであり、 R_{25} はメチルであり、 R_{26} は水素であり、 R_{27} は水素であり、 Q は結合であり、 W が酸素である場合に、 R_3 および R_4 の少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してもおらず；さらに

構造式6の立体中心における絶対立体化学は、 R もしくは S 、またはそれらの混合物であり、また、二重結合の立体化学は、 E もしくは Z 、またはそれらの混合物である。

【誤訳訂正 1 5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 2 1 1

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 2 1 1】

ある実施態様においては、本発明は、上述の組成物および付随する定義に関し、 R_1 が水酸基であり、 R_2 が水素であり、 R_5 が水素であり、 R_6 および R_7 は互いに二重結合を形成し、 R_{20} はメチルであり、 R_{21} はメチルであり、 R_{22} はメチルであり、 R_{23} はメチルであり、 R_{24} はメチルであり、 R_{25} はメチルであり、 R_{26} は水素であり、 R_{27} は水素であり、 Q は結合であり、 W が酸素である場合に、 R_3 および R_4 の少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してもいない。

【誤訳訂正 1 6】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 2 4 0

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 2 4 0】

ここで、 R_{17} は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン化物、水酸基、アルコキシ、アリールオキシ、アシルオキシ、アミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、アシルアミノ、アラルキルアミノ、ニトロ、アシルチオ、カルボキシアミド、カルボキシル、ニトリル、

- COR₁₈、 - CO₂R₁₈、 - N(R₁₈)CO₂R₁₉、 - OC(O)N(R₁₈)(R₁₉)、 - N(R₁₈)SO₂R₁₉、 - N(R₁₈)C(O)N(R₁₈)(R₁₉)、および - CH₂O - ヘテロサイクリルより成る群から選択され；

R₆およびR₇はいずれも水素であり；あるいは、R₆およびR₇は互いに結合を形成し；

R₈は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは - [(CR₂)_p] - R₁₆であり；

R₉は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは - [(CR₂)_p] - R₁₆であり；

R₁₀およびR₁₁は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルおよび - [(CR₂)_p] - R₁₆より成る群から選択され；あるいは、R₁₀およびR₁₁は、それらが結合している窒素を共有し、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R₁₂は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは - [(CR₂)_p] - R₁₆であり；

R₁₃およびR₁₄は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルおよび - [(CR₂)_p] - R₁₆より成る群から選択され；あるいは、R₁₃およびR₁₄は、それらが結合している窒素を共有し、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R₁₆は、それぞれ別異に、水素、水酸基、アシルアミノ、 - N(R₁₈)COR₁₉、 - N(R₁₈)C(O)OR₁₉、 - N(R₁₈)SO₂R₁₉、 - CON(R₁₈)(R₁₉)、 - OC(O)N(R₁₈)(R₁₉)、 - SO₂N(R₁₈)(R₁₉)、 - N(R₁₈)(R₁₉)、 - OC(O)OR₁₈、 - COOR₁₈、 - C(O)N(OH)(R₁₈)、 - OS(O)₂OR₁₈、 - S(O)₂OR₁₈、 - OP(O)(OR₁₈)(OR₁₉)、 - N(R₁₈)P(O)(OR₁₈)(OR₁₉)および - P(O)(OR₁₈)(OR₁₉)より成る群から選択され；

pは1、2、3、4、5または6であり；

R₁₈は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R₁₉は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

あるいは、R₁₈は、R₁₉と共に、必要に応じて置換された4~8員環を表し；

R₂₀、R₂₁、R₂₂、R₂₄およびR₂₅は、それぞれ別異にアルキルであり；

R₂₃は、アルキル、 - CH₂OH、 - CHO、 - COOR₁₈または - CH(OR₁₈)₂であり；

R₂₆およびR₂₇は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R₁が水酸基であり、R₂が水素であり、R₆およびR₇は互いに二重結合を形成し、R₂₀はメチルであり、R₂₁はメチルであり、R₂₂はメチルであり、R₂₃はメチルであり、R₂₄はメチルであり、R₂₅はメチルであり、R₂₆は水素であり、R₂₇は水素であり、Qは結合であり、Wが酸素である場合に、R₃およびR₄の少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してもおらず；さらに

構造式6または10の立体中心における絶対立体化学は、RもしくはS、またはそれらの混合物であり、また、二重結合の立体化学は、EもしくはZ、またはそれらの混合物である。

【誤訳訂正17】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0241

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0241】

ある実施態様においては、本発明は、上述の組成物および付随する定義に関し、 R_1 が水酸基であり、 R_2 が水素であり、 R_5 が水素であり、 R_6 および R_7 は互いに二重結合を形成し、 R_{20} はメチルであり、 R_{21} はメチルであり、 R_{22} はメチルであり、 R_{23} はメチルであり、 R_{24} はメチルであり、 R_{25} はメチルであり、 R_{26} は水素であり、 R_{27} は水素であり、 Q は結合であり、 W が酸素である場合に、 R_3 および R_4 の少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してもいない。

【誤訳訂正18】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0286

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0286】

ここで、 R_{17} は、それぞれ別異に、水素、ハロゲン化物、水酸基、アルコキシ、アリーロキシ、アシルオキシ、アミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、アシルアミノ、アラキルアミノ、ニトロ、アシルチオ、カルボキシアミド、カルボキシル、ニトリル、 $-COR_{18}$ 、 $-CO_2R_{18}$ 、 $-N(R_{18})CO_2R_{19}$ 、 $-OC(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-N(R_{18})SO_2R_{19}$ 、 $-N(R_{18})C(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、および $-CH_2O-$ ヘテロサイクリルより成る群から選択され；

R_6 および R_7 はいずれも水素であり；あるいは、 R_6 および R_7 は互いに結合を形成し；

R_8 は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリール、ヘテロアラキルまたは $-[(CR_2)_p]$ $-R_{16}$ であり；

R_9 は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリール、ヘテロアラキルまたは $-[(CR_2)_p]$ $-R_{16}$ であり；

R_{10} および R_{11} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリール、ヘテロアラキルおよび $-[(CR_2)_p]$ $-R_{16}$ より成る群から選択され；あるいは、 R_{10} および R_{11} は、それらが結合している窒素を共有し、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R_{12} は、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリール、ヘテロアラキルまたは $-[(CR_2)_p]$ $-R_{16}$ であり；

R_{13} および R_{14} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリール、ヘテロアラキルおよび $-[(CR_2)_p]$ $-R_{16}$ より成る群から選択され；あるいは、 R_{13} および R_{14} は、それらが結合している窒素を共有し、必要に応じて置換された4~8員の複素環を表し；

R_{16} は、それぞれ別異に、水素、水酸基、アシルアミノ、 $-N(R_{18})COR_{19}$ 、 $-N(R_{18})C(O)OR_{19}$ 、 $-N(R_{18})SO_2R_{19}$ 、 $-CON(R_{18})(R_{19})$ 、 $-OC(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-SO_2N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-OC(O)OR_{18}$ 、 $-COOR_{18}$ 、 $-C(O)N(OH)(R_{18})$ 、 $-OS(O)_2OR_{18}$ 、 $-S(O)_2OR_{18}$ 、 $-OP(O)(OR_{18})(OR_{19})$ 、 $-N(R_{18})P(O)(OR_{18})(OR_{19})$ および $-P(O)(OR_{18})(OR_{19})$ より成る群から選択され；

p は1、2、3、4、5または6であり；

R_{18} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラキルより成る群から選択され；

R_{19} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラキルより成る群から選択され；

あるいは、 R_{18} は、 R_{19} と共に、必要に応じて置換された4~8員環を表し；

R_{20} 、 R_{21} 、 R_{22} 、 R_{24} および R_{25} は、それぞれ別異にアルキルであり；

R_{23} は、アルキル、 $-\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{COOR}_{18}$ または $-\text{CH}(\text{OR}_{18})_2$ であり；

R_{26} および R_{27} は、それぞれ別異に、水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルより成る群から選択され；

R_1 が水酸基であり、 R_2 が水素であり、 R_6 および R_7 は互いに二重結合を形成し、 R_{20} はメチルであり、 R_{21} はメチルであり、 R_{22} はメチルであり、 R_{23} はメチルであり、 R_{24} はメチルであり、 R_{25} はメチルであり、 R_{26} は水素であり、 R_{27} は水素であり、 Q は結合であり、 W が酸素である場合に、 R_3 および R_4 の少なくともいずれかは水素ではなく、また、共同して未置換アゼチジンを表してもおらず；さらに

構造式1の立体中心における絶対立体化学は、 R もしくは S 、またはそれらの混合物であり、また、二重結合の立体化学は、 E もしくは Z 、またはそれらの混合物である。