

【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 25 年 3 月 14 日 (2013.3.14)

【公表番号】特表 2012-517442 (P2012-517442A)

【公表日】平成 24 年 8 月 2 日 (2012.8.2)

【年通号数】公開・登録公報 2012-030

【出願番号】特願 2011-549318 (P2011-549318)

【国際特許分類】

C 0 7 D 211/34 (2006.01)

C 0 7 D 295/14 (2006.01)

C 0 7 D 213/36 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/495 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 211/34 C S P

C 0 7 D 295/14 A

C 0 7 D 213/36

C 0 7 D 405/12

A 6 1 K 31/495

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/445

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 43/00 1 0 1

【手続補正書】

【提出日】平成 25 年 1 月 24 日 (2013.1.24)

【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

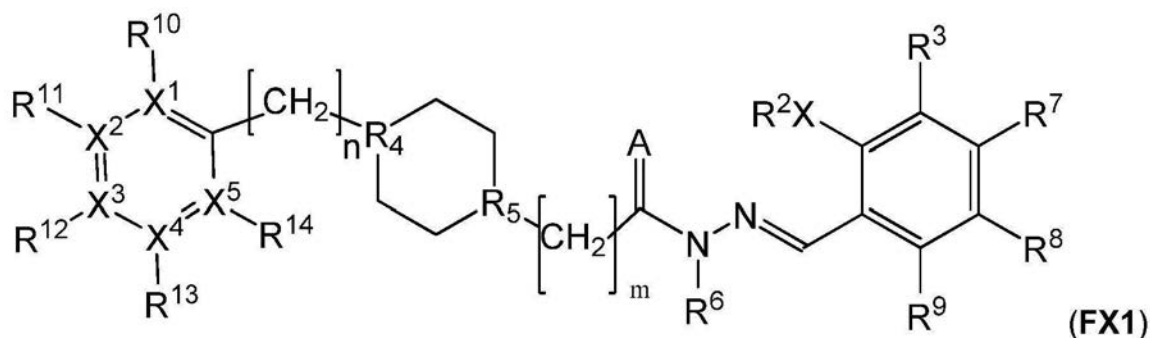
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (F X 1) :

【化 4 5】



を有する化合物であって、式中、

X^1, X^2, X^3, X^4 、および X^5 は、それぞれ独立して C または N であり、 X^1, X^2, X^3, X^4 、および X^5 が N である場合、対応する $R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}$ 、および R^{14} は存在せず、

$R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^3, R^7, R^8$ 、または R^9 のうちの 1 つは、スルホンアミド基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシラート基、スルホニル基、およびアリールスルホニル基からなる群より選択される極性基を含み、

$R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^3, R^7, R^8$ 、または R^9 のうちのその他のものは、水素、ハロゲン、スルホンアミド基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシラート基、スルホニル基、アリールスルホニル基、アルコキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、および $C_2 \sim C_6$ アルケニルからなる群よりそれぞれ独立して選択され、

n および m は、それぞれ独立して 1 ~ 3 の整数であり、

R_4 および R_5 は、それぞれ独立して CH または N であり、

A は O または S であり、

R^6 は水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

X は酸素であり、

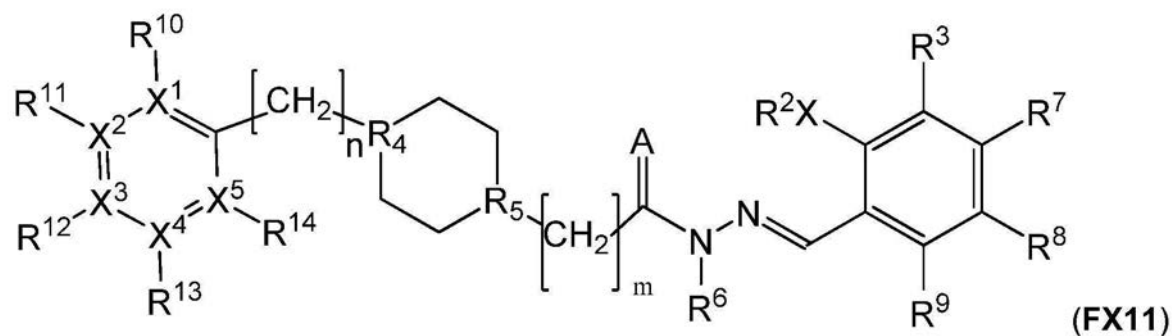
R^2 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、または $C_1 \sim C_6$ アルコキシである、

化合物。

【請求項 2】

式 (FX11) :

【化 4 6】



を有する化合物であって、式中、

X^1, X^2, X^3, X^4 、および X^5 は、それぞれ独立して C または N であり、 X^1, X^2, X^3, X^4 、および X^5 が N である場合、対応する $R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}$ 、および R^{14} は存在せず、

$R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}$ 、および R^{14} のうちの 1 つは、スルホンアミド基、

ニトロ基、アミノ基、カルボキシラート基、スルホニル基、およびアリールスルホニル基からなる群より選択される極性基を含み、

R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、および R^{14} のうちのその他のものは、H、ハロゲン、 $-OH$ 、スルホンアミド基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシラート基、スルホニル基、アリールスルホニル基、およびアルコキシ基からなる群よりそれぞれ独立して選択され、

n および m は、それぞれ独立して1～3の整数であり、

R_4 および R_5 は、それぞれ独立してCHまたはNであり、

AはOまたはSであり、

R^6 は水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

R^3 、 R^7 、 R^8 、 R^9 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、または $C_2 \sim C_6$ アルケニルからそれぞれ独立して選択され、

Xは酸素であり、

R^2 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、または $C_1 \sim C_6$ アルコキシである、化合物。

【請求項3】

R^2 Xは $-OH$ である、請求項1または2に記載の化合物。

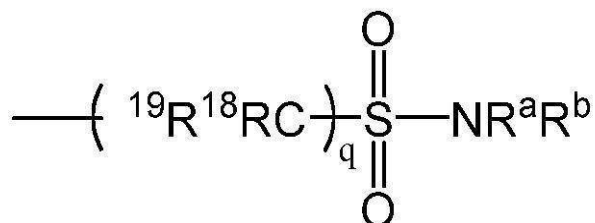
【請求項4】

R^3 はメトキシまたはアリルである、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項5】

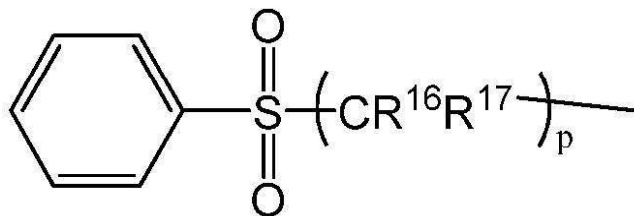
R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^3 、 R^7 、 R^8 、または R^9 のうちの1つは、 $-NO_2$ 、 $-COOH$ 、

【化47】



(式中、 R^a および R^b は、それぞれ独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ アルコキシであり、 R^{18} および R^{19} は、水素および $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選択され、 q は0～3の整数である)、および

【化48】

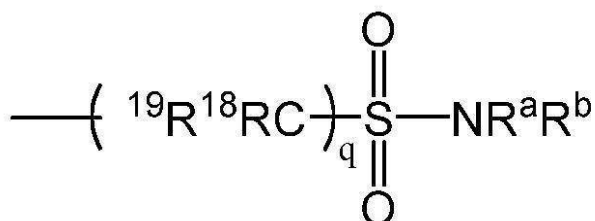


(式中、 R^{16} および R^{17} は、水素および $C_1 \sim C_6$ アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選択され、 p は0～3の整数である)からなる群より選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

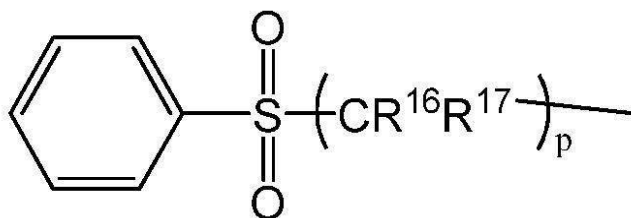
R^{10} 、 R^{11} 、または R^{12} のうちの1つは、 $-NO_2$ 、 $-COOH$ 、

【化 4 9】



(式中、 R^a および R^b は、それぞれ独立して、水素、 $\text{C}1 \sim \text{C}6$ アルキル、および $\text{C}1 \sim \text{C}6$ アルコキシであり、 R^{18} および R^{19} は、水素および $\text{C}1 \sim \text{C}6$ アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選択され、 q は $0 \sim 3$ の整数である)、および

【化 5 0】

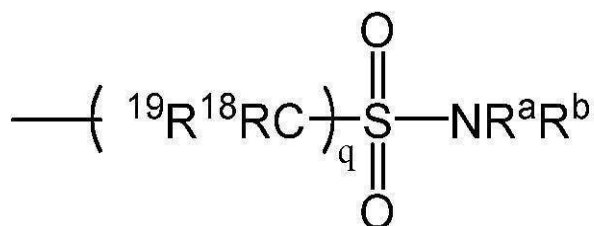


(式中、 R^{16} および R^{17} は、水素および $\text{C}1 \sim \text{C}6$ アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選択され、 p は $0 \sim 3$ の整数である) からなる群より選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 7】

R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^3 、 R^7 、 R^8 、または R^9 のうちの 1 つは、

【化 5 1】

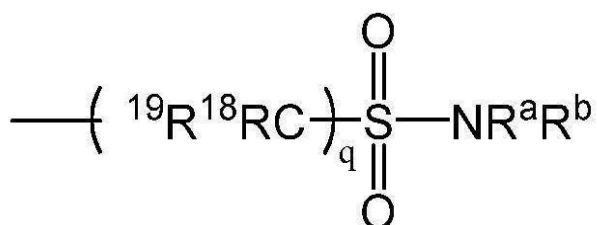


であり、式中、 R^a および R^b は、それぞれ独立して、水素、 $\text{C}1 \sim \text{C}6$ アルキル、および $\text{C}1 \sim \text{C}6$ アルコキシであり、 R^{18} および R^{19} は、水素および $\text{C}1 \sim \text{C}6$ アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選択され、 q は $0 \sim 3$ の整数である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 8】

R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、または R^{14} のうちの 1 つは、

【化 5 2】

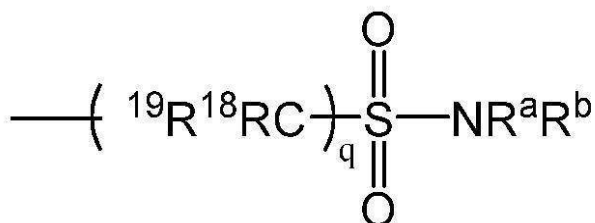


であり、式中、 R^a および R^b は、それぞれ独立して、水素、 $C1 \sim C6$ アルキル、および $C1 \sim C6$ アルコキシであり、 R^{18} および R^{19} は、水素および $C1 \sim C6$ アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選択され、 q は $0 \sim 3$ の整数である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 9】

R^{12} は、

【化 5 3】



であり、式中、 R^a および R^b は、それぞれ独立して、水素、 $C1 \sim C6$ アルキル、および $C1 \sim C6$ アルコキシであり、 R^{18} および R^{19} は、水素および $C1 \sim C6$ アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選択され、 q は $0 \sim 3$ の整数である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 10】

R^a および R^b はそれぞれ水素であり、 q は 0 である、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

R^3 はアリルであり、 X は O であり、 R^2 は水素である、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 12】

R^{12} は $-S(=O)_2-NH_2$ である、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 13】

R^{11} 、 R^{12} 、および R^{13} はメトキシである、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 14】

R^3 はアリルであり、 X は O であり、 R^2 は水素である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

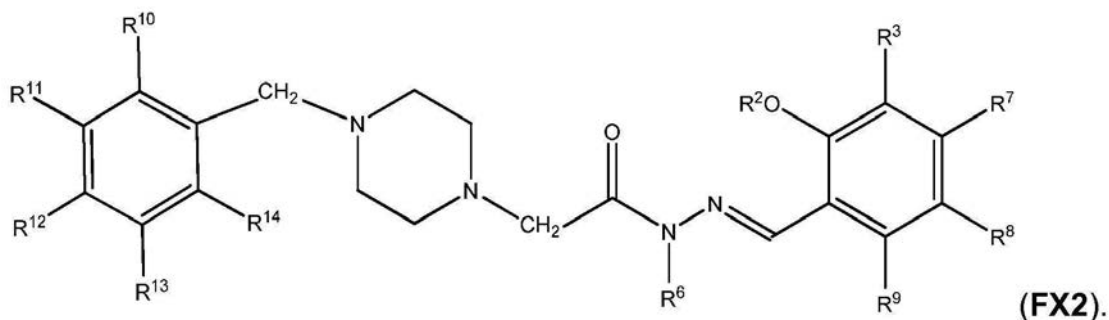
【請求項 15】

X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、および X^5 のうちの 1 つまたは 2 つは N である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 16】

式 (FX2) :

【化 5 4】

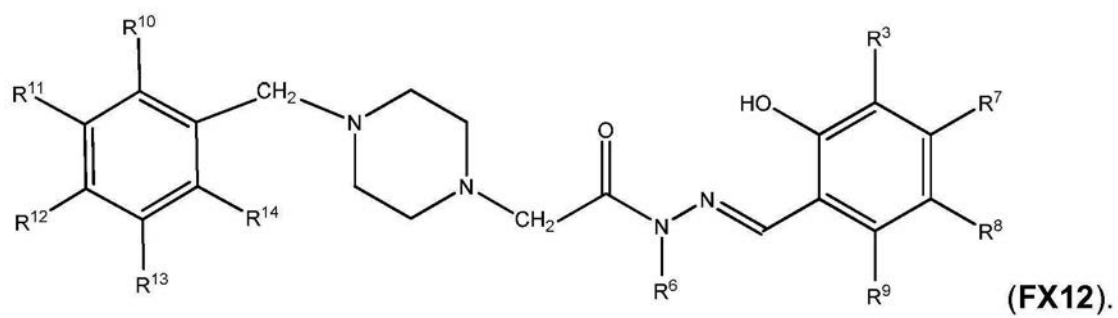


を有する、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 17】

式 (FX12) :

【化 5 5】

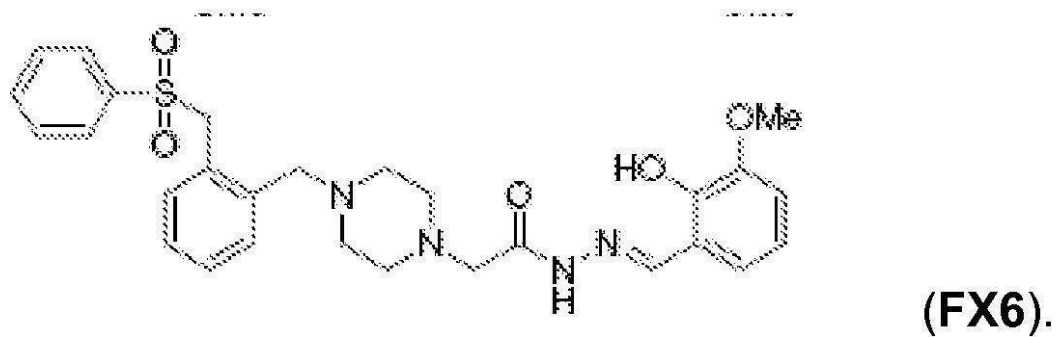
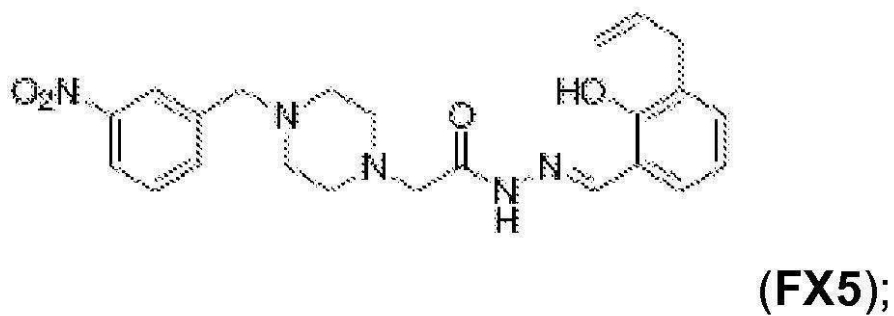
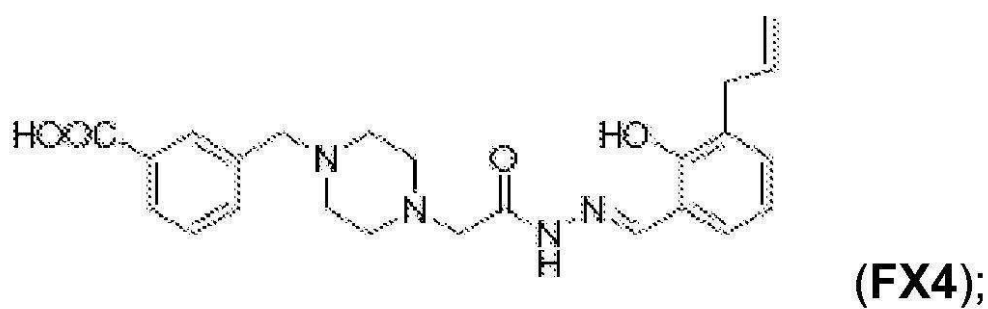
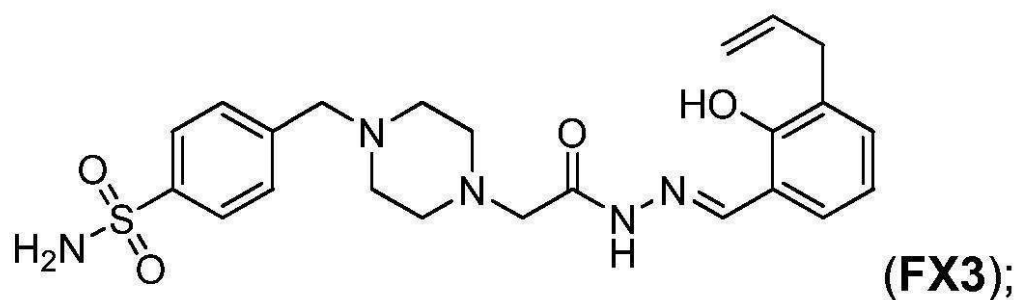


を有する、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 1 8】

式 (F X 3)、(F X 4)、(F X 5)、または (F X 6)：

【化 5 6】

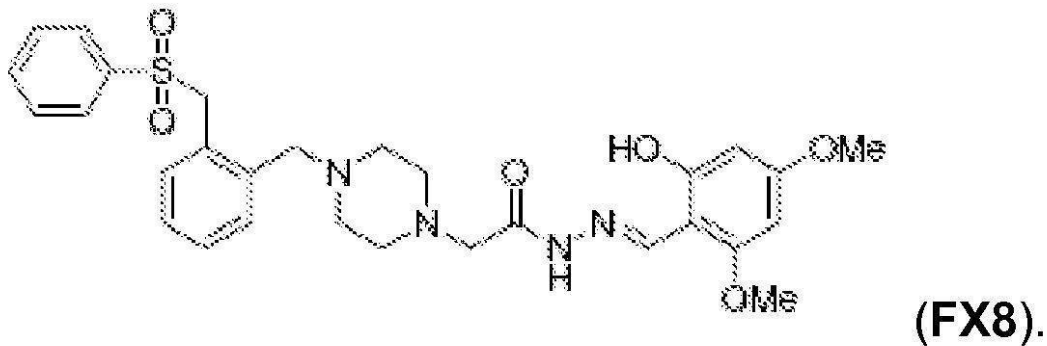
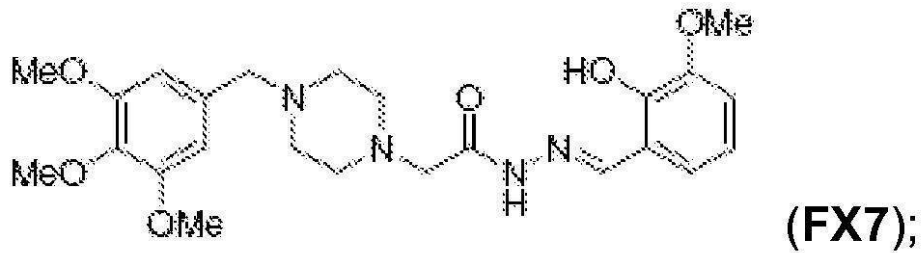


を有する、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 19】

式 (FX7) または (FX8) :

【化 5 7】



を有する、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

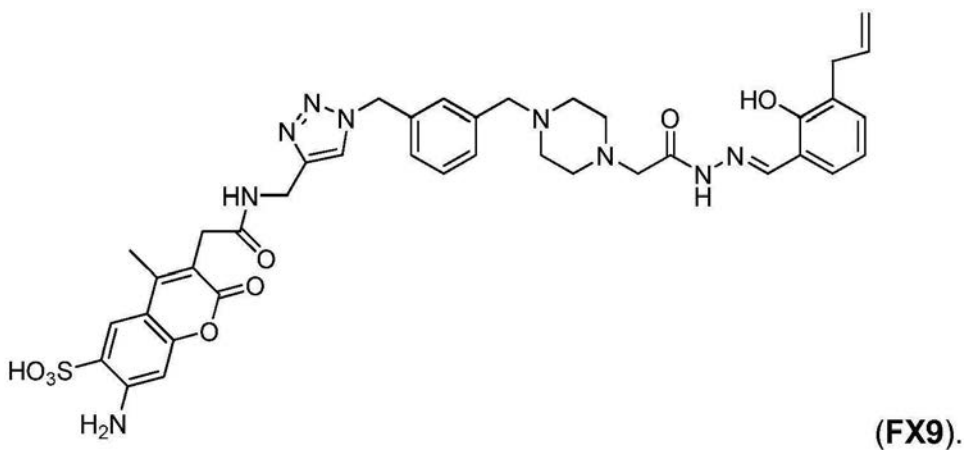
【請求項 2 0】

蛍光標識を含む、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 2 1】

構造 (F X 9) :

【化 5 8】



を有する、請求項 2 0 に記載の化合物。

【請求項 2 2】

癌細胞のアポトーシスを選択的に誘導するための組成物であって、前記癌細胞のプロカスパーゼ - 3 分子を改変することができる化合物を含み、前記化合物が請求項 1 ~ 2 1 のいずれか 1 項に記載の化合物である、組成物。

【請求項 2 3】

処置を必要とする患者中の癌細胞のアポトーシスを選択的に誘導するための組成物であって、前記癌細胞のプロカスパーゼ - 3 分子を改変することができる化合物を含み、前記化合物が請求項 1 ~ 2 1 のいずれか 1 項に記載の化合物である、組成物。

【請求項 24】

癌細胞を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項に記載のプロカスパーゼアクチベーター化合物を含み、前記癌細胞が有効量の前記組成物に曝露され、前記癌細胞がプロカスパーゼアクチベーター化合物での処置に対して潜在的に感受性であることが同定されていることを特徴とする、組成物。

【請求項 25】

癌細胞を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項に記載のプロカスパーゼアクチベーター化合物を含み、前記組成物がプロカスパーゼ - 3 およびプロカスパーゼ - 7 の少なくとも 1 つを活性化することができ、前記癌細胞が有効量の前記組成物に曝露され、前記癌細胞がプロカスパーゼアクチベーター化合物での処置に対して潜在的に感受性であることが同定されていることを特徴とする、組成物。

【請求項 26】

癌細胞の死滅を誘導するための組成物であって、前記癌細胞のプロカスパーゼ - 3 分子を活性化することができる化合物を含み、前記化合物が請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の化合物である、組成物。

【請求項 27】

有効量の 1 つまたは複数の請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む医薬。

【請求項 28】

1 つまたは複数の請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、癌細胞処置のための医薬を作製する方法。

【請求項 29】

細胞のアポトーシスを誘導するための組成物であって、前記細胞に請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項 30】

前記プロカスパーゼアクチベーター化合物の $\log BB$ が $-0.4 \sim -2$ である、請求項 28 に記載の方法。

【請求項 31】

前記プロカスパーゼアクチベーター化合物の $\log BB$ が $-0.4 \sim -2$ である、請求項 22 ~ 26 および 29 のいずれか 1 項に記載の組成物、または請求項 27 に記載の医薬。

【請求項 32】

前記化合物は、患者において感知可能な神経毒性の影響を生じるような程度まで血液脳関門を通過しない、請求項 28 に記載の方法。

【請求項 33】

前記化合物は、患者において感知可能な神経毒性の影響を生じるような程度まで血液脳関門を通過しない、請求項 22 ~ 26 および 29 のいずれか 1 項に記載の組成物、または請求項 27 に記載の医薬。

【請求項 34】

細胞を有効量の請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の化合物と接触させる工程を含む *ex vivo* 法。

【請求項 35】

細胞を処置するための組成物であって、有効量の請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の化合物を含み、前記組成物が前記細胞と接触させられることを特徴とする、組成物。

【請求項 36】

治療で用いるための組成物であって、請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む組成物。

【請求項 37】

癌処置のための組成物であって、請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む組成物。

【請求項 38】

癌処置のための医薬の製造における請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用

。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0012

【補正方法】変更

【補正の内容】

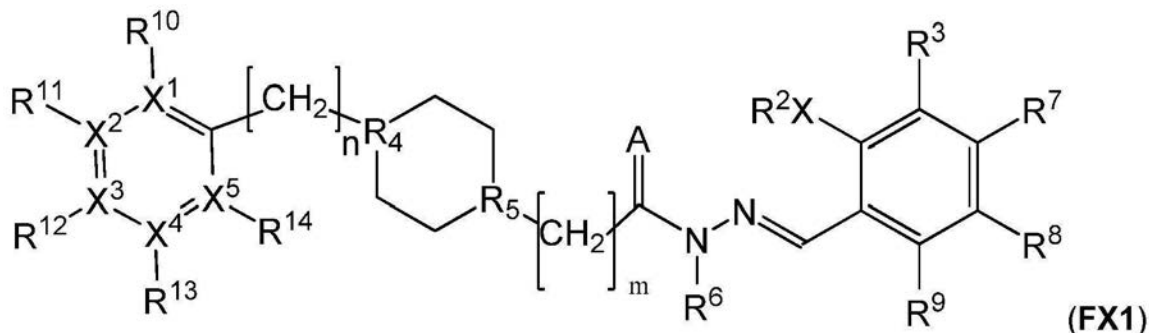
【0012】

本発明は、例えば、以下を提供する：

(項目 1)

式(FX1)：

【化 45】



を有する化合物であって、式中、

X¹、X²、X³、X⁴、およびX⁵は、それぞれ独立してCまたはNであり、X¹、X²、X³、X⁴、およびX⁵がNである場合、対応するR¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、およびR¹⁴は存在せず、

R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴、R³、R⁷、R⁸、またはR⁹のうちの1つは、スルホンアミド基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシレート基、スルホニル基、およびアリールスルホニル基からなる群より選択される極性基を含み、

R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴、R³、R⁷、R⁸、またはR⁹のうちの他のものは、水素、ハロゲン、スルホンアミド基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシレート基、スルホニル基、アリールスルホニル基、アルコキシ基、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルコキシ、およびC₂～C₆アルケニルからなる群よりそれぞれ独立して選択され、

nおよびmは、それぞれ独立して1～3の整数であり、

R₄およびR₅は、それぞれ独立してCHまたはNであり、

AはOまたはSであり、

R⁶は水素またはC₁～C₆アルキルであり、

Xは酸素であり、

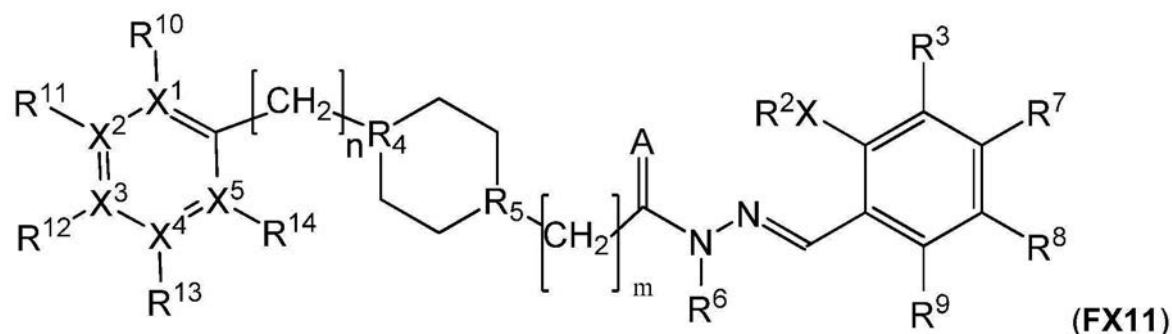
R²は、水素、C₁～C₆アルキル、またはC₁～C₆アルコキシである、

化合物。

(項目 2)

式(FX11)：

【化 4 6】



を有する化合物であって、式中、

X^1, X^2, X^3, X^4 、および X^5 は、それぞれ独立して C または N であり、 X^1, X^2, X^3, X^4 、および X^5 が N である場合、対応する $R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}$ 、および R^{14} は存在せず、

$R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}$ 、および R^{14} のうちの 1 つは、スルホンアミド基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシラート基、スルホニル基、およびアリールスルホニル基からなる群より選択される極性基を含み、

$R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}$ 、および R^{14} のうちのその他のものは、H、ハロゲン、 $-OH$ 、スルホンアミド基、ニトロ基、アミノ基、カルボキシラート基、スルホニル基、アリールスルホニル基、およびアルコキシ基からなる群よりそれぞれ独立して選択され、

n および m は、それぞれ独立して 1 ~ 3 の整数であり、

R_4 および R_5 は、それぞれ独立して CH または N であり、

A は O または S であり、

R^6 は水素または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

R^3, R^7, R^8, R^9 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、または $C_2 \sim C_6$ アルケニルからそれぞれ独立して選択され、

X は酸素であり、

R^2 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、または $C_1 \sim C_6$ アルコキシである、
化合物。

(項目 3)

R^2X は $-OH$ である、項目 1 または 2 に記載の化合物。

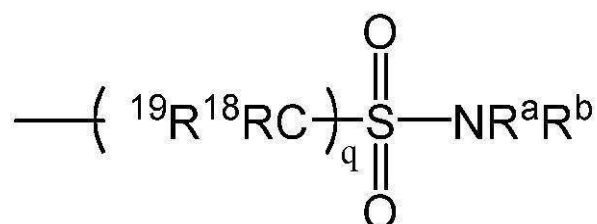
(項目 4)

R^3 はメトキシまたはアリルである、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 5)

$R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^3, R^7, R^8$ 、または R^9 のうちの 1 つは、 $-NO_2$ 、 $-COOH$ 、

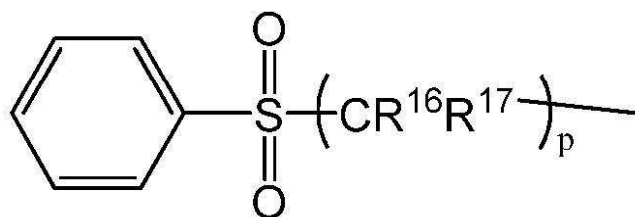
【化 4 7】



(式中、 R^a および R^b は、それぞれ独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、および $C_1 \sim C_6$ アルコキシであり、 R^{18} および R^{19} は、水素および $C_1 \sim C_6$ アルキルからな

る群よりそれぞれ独立して選択され、 q は 0 ～ 3 の整数である)、および

【化 4 8】

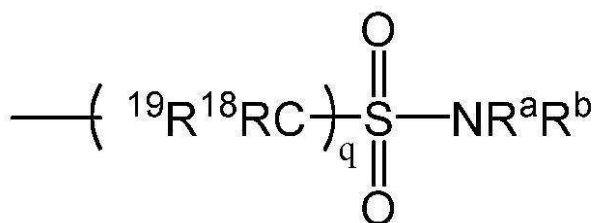


(式中、 R^{16} および R^{17} は、水素および C 1 ～ C 6 アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選択され、 p は 0 ～ 3 の整数である) からなる群より選択される、項目 1 に記載の化合物。

(項目 6)

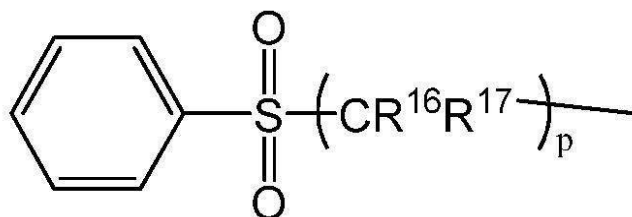
R^{10} 、 R^{11} 、または R^{12} のうちの 1 つは、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{COOH}$ 、

【化 4 9】



(式中、 R^a および R^b は、それぞれ独立して、水素、C 1 ～ C 6 アルキル、および C 1 ～ C 6 アルコキシであり、 R^{18} および R^{19} は、水素および C 1 ～ C 6 アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選択され、 q は 0 ～ 3 の整数である)、および

【化 5 0】

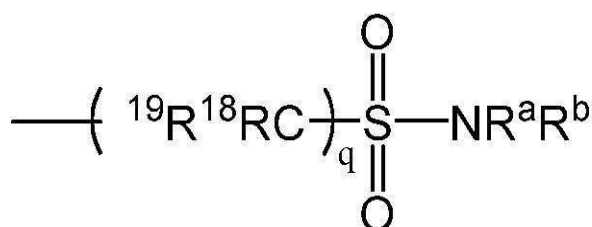


(式中、 R^{16} および R^{17} は、水素および C 1 ～ C 6 アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選択され、 p は 0 ～ 3 の整数である) からなる群より選択される、項目 2 に記載の化合物。

(項目 7)

R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^3 、 R^7 、 R^8 、または R^9 のうちの 1 つは、

【化 5 1】

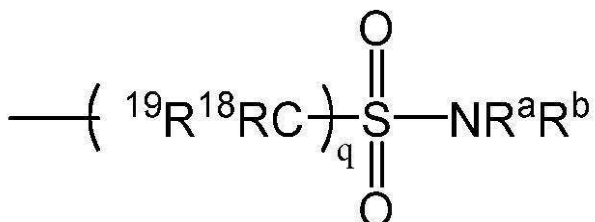


であり、式中、 R^a および R^b は、それぞれ独立して、水素、 $C1 \sim C6$ アルキル、および $C1 \sim C6$ アルコキシであり、 R^{18} および R^{19} は、水素および $C1 \sim C6$ アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選択され、 q は $0 \sim 3$ の整数である、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 8)

R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、または R^{14} のうちの 1 つは、

【化 5 2】

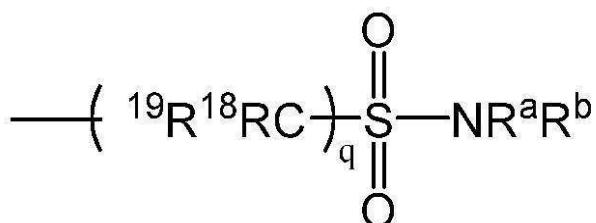


であり、式中、 R^a および R^b は、それぞれ独立して、水素、 $C1 \sim C6$ アルキル、および $C1 \sim C6$ アルコキシであり、 R^{18} および R^{19} は、水素および $C1 \sim C6$ アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選択され、 q は $0 \sim 3$ の整数である、項目 2 に記載の化合物。

(項目 9)

R^{12} は、

【化 5 3】



であり、式中、 R^a および R^b は、それぞれ独立して、水素、 $C1 \sim C6$ アルキル、および $C1 \sim C6$ アルコキシであり、 R^{18} および R^{19} は、水素および $C1 \sim C6$ アルキルからなる群よりそれぞれ独立して選択され、 q は $0 \sim 3$ の整数である、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 10)

R^a および R^b はそれぞれ水素であり、 q は 0 である、項目 9 に記載の化合物。

(項目 11)

R^3 はアリルであり、 X は O であり、 R^2 は水素である、項目 9 に記載の化合物。

(項目 12)

R^{12} は $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{NH}_2$ である、項目 9 に記載の化合物。

(項目 13)

R^{11} 、 R^{12} 、および R^{13} はメトキシである、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 14)

R^3 はアリルであり、 X は O であり、 R^2 は水素である、項目 1 または 2 に記載の化合物。

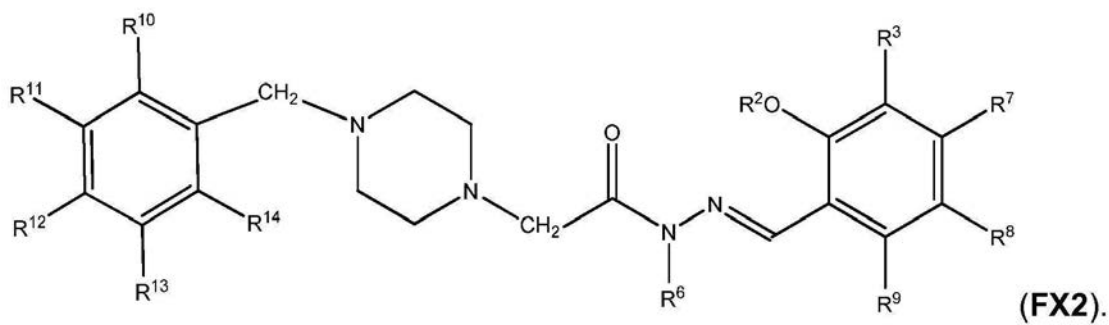
(項目 15)

X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、および X^5 のうちの 1 つまたは 2 つは N である、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 16)

式 (F X 2) :

【化 5 4】

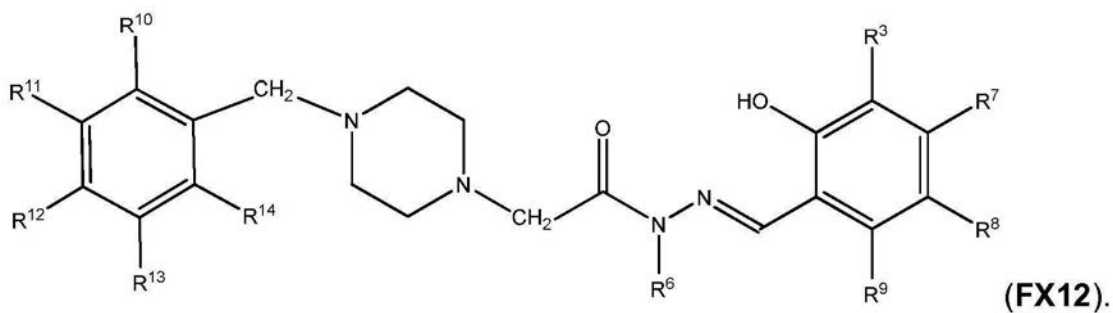


を有する、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 1 7)

式 (F X 1 2) :

【化 5 5】

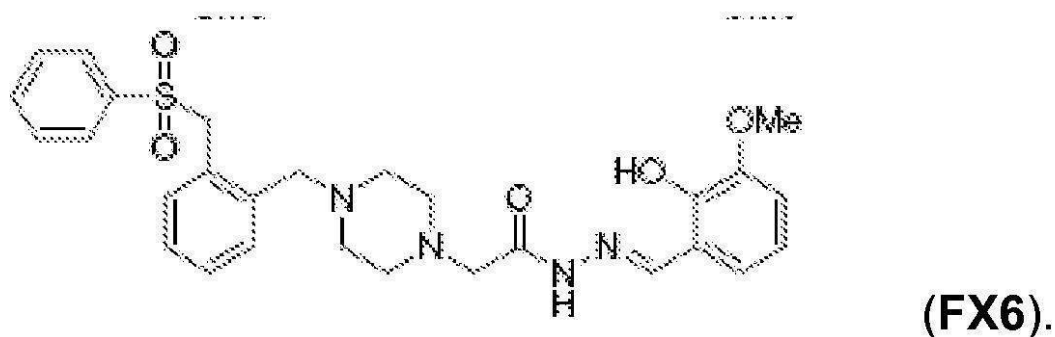
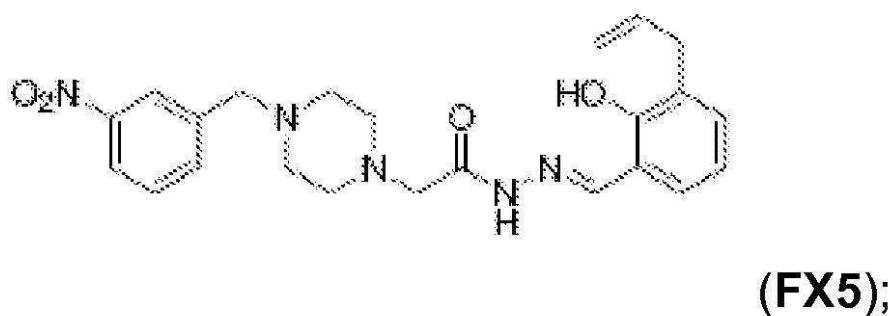
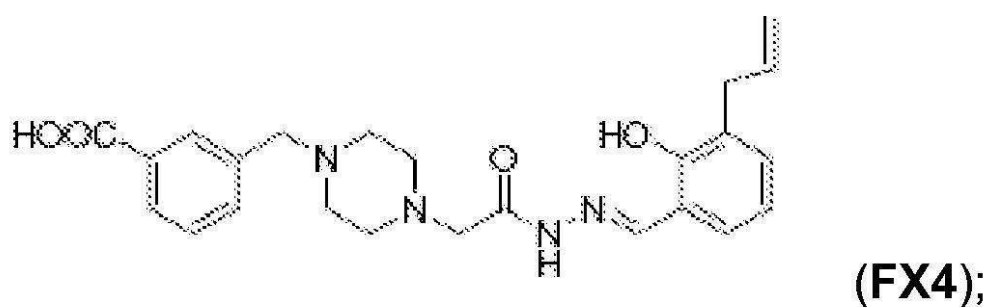
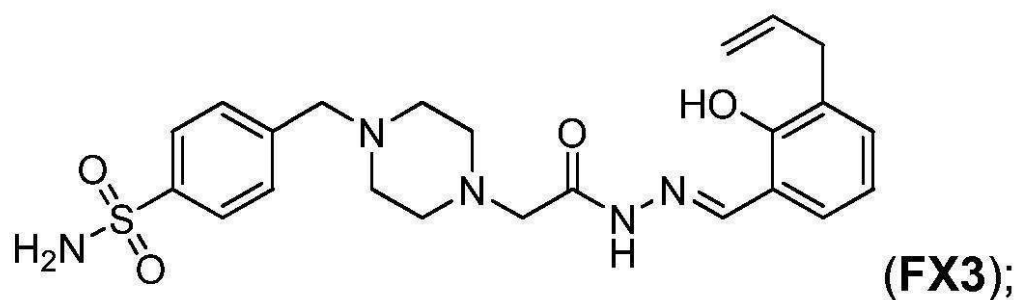


を有する、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 1 8)

式 (F X 3)、(F X 4)、(F X 5)、または (F X 6) :

【化 5 6】

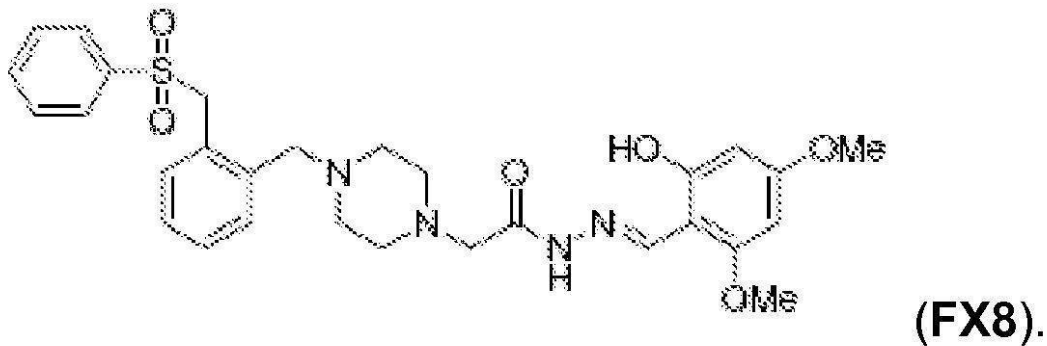
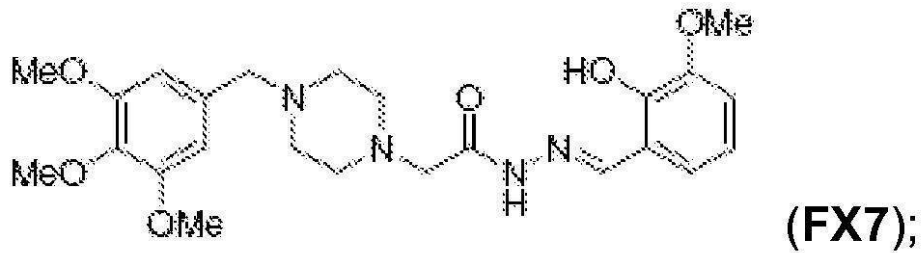


を有する、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 1 9)

式 (F X 7) または (F X 8) :

【化 5 7】



を有する、項目 1 または 2 に記載の化合物。

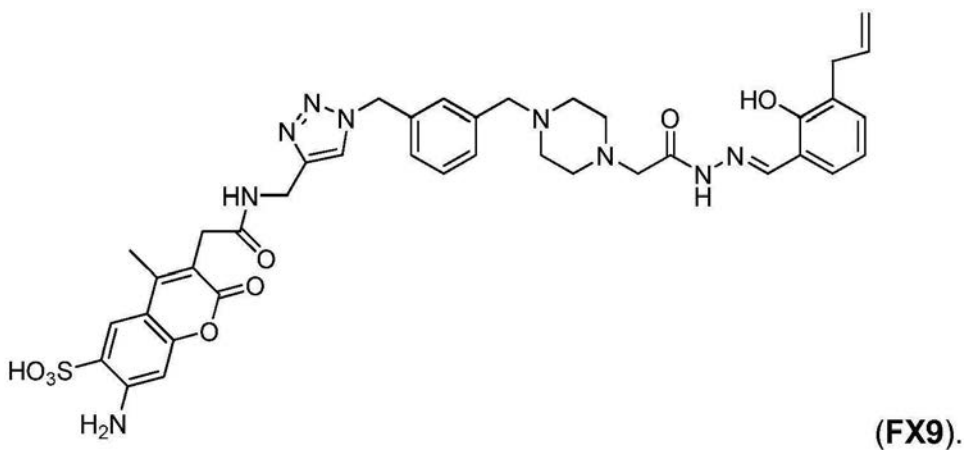
(項目 2 0)

蛍光標識を含む、項目 1 または 2 に記載の化合物。

(項目 2 1)

構造 (F X 9) :

【化 5 8】



を有する、項目 2 0 に記載の化合物。

(項目 2 2)

癌細胞のアポトーシスを選択的に誘導する方法であって、前記癌細胞のプロカスパーゼ - 3 分子を改変することができる化合物を前記癌細胞に投与する工程を含み、前記化合物が項目 1 ~ 2 1 のいずれか 1 項に記載の化合物である、方法。

(項目 2 3)

癌細胞のアポトーシスを選択的に誘導する方法であって、前記癌細胞のプロカスパーゼ - 3 分子を改変することができる化合物を前記癌細胞に投与する工程を含み、前記化合物が項目 1 ~ 2 1 のいずれか 1 項に記載の化合物であり、前記癌細胞が処置を必要とする患者

中に存在する、方法。

(項目24)

癌細胞を処置する方法であって、(a)プロカスパーゼアクチベーター化合物での癌細胞処置に対する潜在的感受性を同定する工程、および(b)前記癌細胞を有効量の前記プロカスパーゼアクチベーター化合物に曝露する工程を含み、前記プロカスパーゼアクチベーター化合物が項目1～21のいずれか1項に記載の化合物である、方法。

(項目25)

癌細胞を処置する方法であって、(a)プロカスパーゼアクチベーター化合物での癌細胞処置に対する潜在的感受性を同定する工程、および(b)前記癌細胞を有効量の前記プロカスパーゼアクチベーター化合物に曝露する工程を含み、前記プロカスパーゼアクチベーター化合物が項目1～21のいずれか1項に記載の化合物であり、前記プロカスパーゼアクチベーター化合物がプロカスパーゼ-3およびプロカスパーゼ-7の少なくとも1つを活性化することができる、方法。

(項目26)

癌細胞の死滅を誘導する方法であって、前記癌細胞のプロカスパーゼ-3分子を活性化することができる化合物を前記癌細胞に投与する工程を含み、前記化合物が項目1～21のいずれか1項に記載の化合物である、方法。

(項目27)

有効量の1つまたは複数の項目1～21のいずれか1項に記載の化合物を含む医薬。

(項目28)

1つまたは複数の項目1～21のいずれか1項に記載の化合物を含む、癌細胞処置のための医薬を作製する方法。

(項目29)

細胞のアポトーシスを誘導する方法であって、前記細胞に項目1～21のいずれか1項に記載の化合物を投与する工程を含む、方法。

(項目30)

前記プロカスパーゼアクチベーター化合物のlogBBが-0.4～-2である、項目22～29のいずれか1項に記載の方法。

(項目31)

前記化合物は、患者において感知可能な神経毒性の影響を生じるような程度まで血液脳関門を通過しない、項目22～29のいずれかに記載の方法。

(項目32)

細胞を有効量の項目1～21に記載の化合物と接触させる工程を含むex vivo法。

(項目33)

細胞を処置する方法であって、細胞を有効量の項目1～21に記載の化合物と接触させる工程を含む、方法。

(項目34)

治療で用いるための項目1～21に記載の化合物。

(項目35)

癌処置のための項目1～21に記載の化合物。

(項目36)

癌処置のための医薬の製造における項目1～21に記載の化合物の使用。

発明の概要

本発明は、概して、化合物、組成物、および治療的処置方法を提供する。実施形態では、本発明は、種々の癌疾患および癌細胞型(乳房、リンパ腫、副腎、腎臓、黒色腫、白血病、神経芽細胞腫、肺、脳、および当該分野で公知の他のものなど)の文脈で適用可能である。