

【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19年11月8日(2007.11.8)

【公表番号】特表2007-514663(P2007-514663A)

【公表日】平成19年6月7日(2007.6.7)

【年通号数】公開・登録公報2007-021

【出願番号】特願2006-542113(P2006-542113)

【国際特許分類】

C 0 7 C 69/716 (2006.01)

A 6 1 K 31/21 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 69/716 C S P A

A 6 1 K 31/21

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

【手続補正書】

【提出日】平成19年9月18日(2007.9.18)

【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

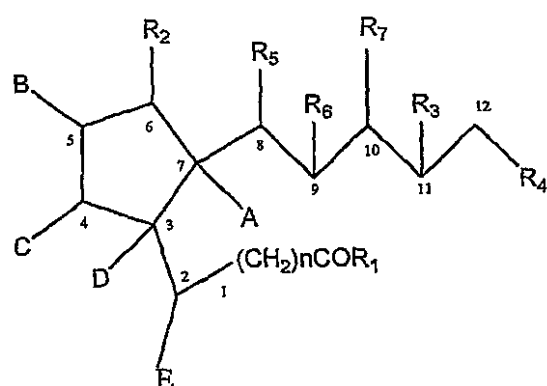
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I

【化1】



式 I

〔式中、nは0、1又は2であり；

R₁は、OH、C₁～C₁₂アルコキシ、C₁～C₁₂置換アルコキシ、アリールオキシ、O-グルコシル又はイミノであり；

R₂は、OH、C₁～C₁₂アルコキシ、C₁～C₁₂置換アルコキシ、O-グルコシル

ル、オキソ、アルキル又はイミノであり；

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、A、B、C、D及びEは各々独立して、H、ハロゲン、OH、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_{12}$ 置換アルコキシ、アリールオキシ、O-グルコシル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル又は $C_1 \sim C_{12}$ 置換アルキルであり；

しかも、 R_1 と R_2 、又は R_1 と R_4 は、一緒になって、随意に置換されているラクトンを形成することができ；

$C_3 : C_7$ 間、 $C_4 : C_5$ 間、及び $C_9 : C_{10}$ 間、の結合は独立して二重結合又は単結合であることができ；

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、A、B、C、D及びEの少なくとも1つはハロゲンであることを条件とし；そして

Aが化合物中の唯一のハロゲンである場合は、Aはフルオロではないことを条件とする）の化合物、あるいは前記式の誘導体（但し、この誘導体は、塩、水和物、溶媒和物、多形体（polymorphs）、光学異性体、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、及びそれらの混合物を包含する、

C_3 での低級アシル側鎖（遊離酸又はエステル又は共役体）、 C_6 炭素でのケト又はヒドロキシ（遊離ヒドロキシ又はエステル）部分又は C_7 でのn-ペンテニル又はn-ペンチル側鎖；

の少なくとも1つを有する）。

【請求項2】

C_9 と C_{10} との間の結合が単結合である、請求項1の化合物。

【請求項3】

R_2 がオキソである、請求項1の化合物。

【請求項4】

R_6 及び R_7 の少なくとも1つがブロモ、ヨード、フルオロ及びクロロから選ばれる、請求項1の化合物。

【請求項5】

R_6 及び R_7 の両方がブロモ、ヨード、フルオロ及びクロロから選ばれる、請求項1の化合物。

【請求項6】

R_6 及び R_7 の両方がブロモである、請求項1の化合物。

【請求項7】

A、B、 R_6 及び R_7 がブロモ、ヨード、フルオロ及びクロロである、請求項1の化合物。

【請求項8】

A、B、 R_6 及び R_7 が、各々ブロモである、請求項1の化合物。

【請求項9】

R_1 がアルコキシである、請求項1の化合物。

【請求項10】

R_3 、 R_4 及び R_5 が、各々Hである、請求項1の化合物。

【請求項11】

C、D及びEが、各々Hである、請求項1の化合物。

【請求項12】

nが0であり； $C_3 : C_7$ 間、 $C_4 : C_5$ 間及び $C_9 : C_{10}$ 間の結合が単結合であり； R_1 がメトキシであり； R_2 がオキソであり； R_3 、 R_4 、 R_5 、A、B、C、D及びEが各々Hであり；そして R_6 及び R_7 が各々ブロモである、請求項1の化合物。

【請求項13】

nが0であり； $C_3 : C_7$ 間、 $C_4 : C_5$ 間及び $C_9 : C_{10}$ 間の結合が単結合であり； R_1 がメトキシであり； R_2 が位置6における炭素への二重結合を介して結合されたOであって、それによりカルボニル基を形成し； R_3 、 R_4 、 R_5 、C、D及びEは各々Hであり；そしてA、B、 R_6 及び R_7 が各々ブロモである、請求項1の化合物。

【請求項 14】

製薬的に許容できる担体及び請求項 1 の化合物を活性成分として含む、製薬組成物。

【請求項 15】

製薬的に許容できる担体及び請求項 12 の化合物を活性成分として含む、製薬組成物。

【請求項 16】

製薬的に許容できる担体及び請求項 13 の化合物を活性成分として含む、製薬組成物。

【請求項 17】

活性成分が製薬的に許容出来る脂質担体中に溶解されている、請求項 14 の製薬組成物。

【請求項 18】

治療的に有効な量の請求項 1 の化合物を含む、癌細胞の増殖を減少させるための製薬組成物。

【請求項 19】

癌が哺乳動物の癌である、請求項 18 の製薬組成物。

【請求項 20】

哺乳動物がヒトである、請求項 19 の製薬組成物。

【請求項 21】

請求項 4 の化合物を含む、癌細胞の増殖を減少させるための製薬組成物。

【請求項 22】

請求項 12 の化合物を含む、癌細胞の増殖を減少させるための製薬組成物。

【請求項 23】

請求項 13 の化合物を含む、癌細胞の増殖を減少させるための製薬組成物。

【請求項 24】

癌が、癌腫、肉腫、腺腫、肝臓細胞癌、胚芽細胞腫、横紋筋肉腫、食道癌、甲状腺癌、神経節芽細胞腫、線維肉腫、粘液肉腫、脂肪肉腫、軟骨肉腫、骨原性肉腫、背索腫、血管肉腫、内皮肉腫、リンパ管肉腫、骨膜腫、ユーイング腫瘍、平滑筋肉腫、ラブドテリオ肉腫 (r h a b d o t h e l i o s a r c o m a)、結腸肉腫、膵臓癌、乳癌、卵巣癌、前立腺癌、扁平上皮癌、基底細胞癌、腺癌、腎細胞癌、肝細胞癌、胆管癌、黒色腫、絨毛癌、精上皮腫、胎生期癌、ウィルムス腫瘍、頸部癌、精巣腫瘍、肺癌、小細胞肺癌、非小細胞肺癌、膀胱癌、上皮癌、神経膠腫、神経膠星状細胞腫、髓芽細胞腫、頭蓋咽頭腫、脳室上皮細胞腫、松果体腫、網膜芽細胞腫、直腸癌、甲状腺の癌、頭及び頸部癌、脳癌、末梢神経系の癌、中枢神経系の癌、神経芽細胞腫、子宮内膜の癌；急性骨髄性白血病、急性骨髄球白血病、急性リンパ球性白血病、慢性骨髄性白血病、慢性リンパ球白血病、肥満細胞性白血病、多発性骨髄腫、骨髄球性リンパ腫、ホジキンリンパ腫、非ホジキンリンパ腫を包含するすべてのタイプの白血病及びリンパ腫を包含するリンパ球増殖性疾患及び造血性悪性疾患からなる群から選ばれる、請求項 18 の製薬組成物。

【請求項 25】

癌が前立腺癌、乳癌、皮膚癌、結腸癌、肺癌、膵臓癌、リンパ腫、白血病、頭及び頸部癌、腎臓癌、卵巣癌、骨癌、肝臓癌及び甲状腺癌からなる群から選ばれる、請求項 18 の製薬組成物。

【請求項 26】

癌が白血病、肺癌、黒色腫及び結腸癌から選ばれる、請求項 18 の製薬組成物。

【請求項 27】

請求項 1 ～ 13 のいずれか 1 項に記載の化合物の治療的に有効な量を活性成分として含有する製薬組成物。

【請求項 28】

癌が、癌腫、肉腫、腺腫、肝臓細胞癌、胚芽細胞腫、横紋筋肉腫、食道癌、甲状腺癌、神経節芽細胞腫、線維肉腫、粘液肉腫、脂肪肉腫、軟骨肉腫、骨原性肉腫、背索腫、血管肉腫、内皮肉腫、リンパ管肉腫、骨膜腫、ユーイング腫瘍、平滑筋肉腫、ラブドテリオ肉腫 (r h a b d o t h e l i o s a r c o m a)、結腸肉腫、膵臓癌、乳癌、卵巣癌、前

立腺癌、扁平上皮癌、基底細胞癌、腺癌、腎細胞癌、肝細胞癌、胆管癌、黒色腫、絨毛癌、精上皮腫、胎生期癌、ウィルムス腫瘍、頸部癌、精巣腫瘍、肺癌、小細胞肺癌、非小細胞肺癌、膀胱癌、上皮癌、神経膠腫、神経膠星状細胞腫、髓芽細胞腫、頭蓋咽頭腫、脳室上皮細胞腫、松果体腫、網膜芽細胞腫、直腸癌、甲状腺の癌、頭及び頸部癌、脳癌、末梢神経系の癌、中枢神経系の癌、神経芽細胞腫、子宮内膜の癌；急性骨髄性白血病、急性骨髄球白血病、急性リンパ球性白血病、慢性骨髄性白血病、慢性リンパ球白血病、肥満細胞性白血病、多発性骨髄腫、骨髄球性リンパ腫、ホジキンリンパ腫、非ホジキンリンパ腫、を包含するすべてのタイプの白血病及びリンパ腫を包含するリンパ球増殖性疾患及び造血性悪性疾患、ならびに上記のすべての転移からなる群から選ばれる、請求項 27 に記載の製薬組成物。

【請求項 29】

癌が前立腺癌、乳癌、皮膚癌、結腸癌、肺癌、脾臓癌、リンパ腫、白血病、頭及び頸部癌、腎臓癌、卵巣癌、骨癌、肝臓癌及び甲状腺癌からなる群から選ばれる、請求項 27 に記載の製薬組成物。

【請求項 30】

癌が、白血病、肺癌、黒色腫及び結腸癌から選ばれる、請求項 27 に記載の製薬組成物

。