

【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3月15日(2007.3.15)

【公表番号】特表2003-522168(P2003-522168A)

【公表日】平成15年7月22日(2003.7.22)

【出願番号】特願2001-557860(P2001-557860)

【国際特許分類】

C 0 7 D 407/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/337 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 407/12

A 6 1 K 31/337

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成19年1月25日(2007.1.25)

【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

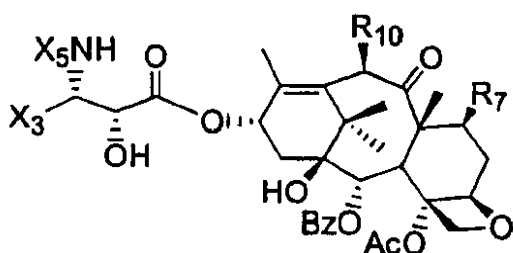
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記の式を有するタキサン：

【化1】



式中、

R₇はカルバモイルオキシであり；

R₁₀はヒドロキシであり；

X₃は、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、または複素環であり；

X₅は、-COX₁₀、-COOX₁₀、または-CONHX₁₀であり；

X₁₀は、ヒドロカルビル、置換ヒドロカルビル、または複素環であり；

Acはアセチルであり；

Bzはベンゾイルである。

【請求項2】 R₇がR_{7a}R_{7b}NCOO-であり、R_{7a}およびR_{7b}の1つが水素であり、もう1つが置換または非置換のC₁～C₈アルキル、C₂～C₈アルケニル、C₂～C₈アルキニル、フェニルまたは複素環である、請求項1に記載のタキサン。

【請求項3】 X₃が、2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、C₁～C₈アルキル、C₂～C₈アルケニルまたはC₂～C₈アルキニルである、請求項1または2に記載のタキサン。

【請求項4】 X₃がフリルまたはチエニルである、請求項1または2に記載のタキサン。

【請求項 5】 X_3 がシクロアルキルである、請求項 1 または 2 に記載のタキサン。

【請求項 6】 X_3 がイソブテニルである、請求項 1 または 2 に記載のタキサン。

【請求項 7】 X_5 が $-COX_{10}$ で、 X_{10} が、置換または非置換のフェニル、2-フリル、3-フリル、2-チエニル、3-チエニル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、 $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルであるか、あるいは X_5 が $-COOX_{10}$ で、 X_{10} が、置換または非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_2 \sim C_8$ アルキニルである、請求項 3 ～ 6 のいずれかに記載のタキサン。

【請求項 8】 X_5 が $-COX_{10}$ で、 X_{10} がフェニルであるか、あるいは X_5 が $-COOX_{10}$ で、 X_{10} が t-ブチルである、請求項 3 ～ 6 のいずれかに記載のタキサン。

【請求項 9】 X_3 がフリルまたはチエニルであり、 R_7 が $R_{7a}R_{7b}NCOO-$ であり、 R_{7a} および R_{7b} の 1 つが水素であり、 R_{7a} および R_{7b} のもう 1 つが $C_1 \sim C_8$ アルキル、フェニルまたは複素環であり、 X_5 が $-COX_{10}$ で、 X_{10} がフェニルであるか、あるいは X_5 が $-COOX_{10}$ で、 X_{10} が t-ブチルである、請求項 1 に記載のタキサン。

【請求項 10】 X_3 が 2-フリルまたは 2-チエニルであり、 R_7 が $R_{7a}R_{7b}NCOO-$ であり、 R_{7a} および R_{7b} の 1 つが水素であり、 R_{7a} および R_{7b} のもう 1 つがメチル、エチルまたは直鎖状、分枝状若しくは環状のプロピルであり、 X_5 が $-COOX_{10}$ で、 X_{10} が t-ブチルである、請求項 1 に記載のタキサン。

【請求項 11】 X_3 が 2-フリルまたは 2-チエニルであり、 R_7 が $R_{7a}R_{7b}NCOO-$ であり、 R_{7a} および R_{7b} の 1 つが水素であり、 R_{7a} および R_{7b} のもう 1 つが置換または非置換のフェニルまたは複素環であり、 X_5 が $-COOX_{10}$ で、 X_{10} が t-ブチルである、請求項 1 に記載のタキサン。

【請求項 12】 請求項 1 に記載されるタキサンおよび少なくとも 1 つの薬学的に受容可能なキャリアを含む医薬組成物。

【請求項 13】 R_7 が $R_{7a}R_{7b}NCOO-$ であり、 R_{7a} および R_{7b} の 1 つが水素であり、 R_{7a} および R_{7b} のもう 1 つが置換または非置換の $C_1 \sim C_8$ アルキル、 $C_2 \sim C_8$ アルケニル、 $C_2 \sim C_8$ アルキニル、フェニルまたは複素環である、請求項 12 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】 請求項 1 に記載されるタキサンおよび少なくとも 1 つの薬学的に受容可能なキャリアを含む経口投与用の組成物。

【請求項 15】 哺乳動物における腫瘍増殖を阻害する方法であって、請求項 1 に記載されるタキサンおよび少なくとも 1 つの薬学的に受容可能なキャリアを含有する医薬組成物の処置有効量を経口投与することを含む方法。

【請求項 16】 X_3 が 2-フリルであり、 X_5 が $-COX_{10}$ で、 X_{10} がイソブテニルまたはトランスプロベニルであり、 R_{7a} が 3,4-ジフルオロフェニル、プロベニル、エチル、m-ニトロフェニルまたはフェニルであり、 R_{7b} が水素である、請求項 2 に記載のタキサン。

【請求項 17】 X_3 が 2-フリルであり、 X_5 が $-COOX_{10}$ で、 X_{10} が t-ブチルであり、 R_{7a} が 3,4-ジフルオロフェニル、プロベニル、シクロヘキシル、エチル、m-ニトロフェニルまたは t-ブチルであり、 R_{7b} が水素である、請求項 2 に記載のタキサン。

【請求項 18】 X_3 が 2-フリルであり、 X_5 が $-COOX_{10}$ で、 X_{10} が t-アミルであり、 R_{7a} が 3,4-ジフルオロフェニル、m-ニトロフェニルまたはフェニルであり、 R_{7b} が水素である、請求項 2 に記載のタキサン。

【請求項 19】 X_3 が 2-フリルであり、 X_5 が $-COX_{10}$ で、 X_{10} がトランスプロベニルであり、 R_{7a} がシクロヘキシルであり、 R_{7b} が水素である、請求項 2 に記載のタキサン。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0069

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0069】

【表 1】

化合物	X ₅	X ₃	R ₇
5522	ibueCO-	2-フリル	3, 4-ジFPhNHC00-
6404	tAmOCO-	2-フリル	3, 4-ジFPhNHC00-
5415	tBuOCO-	2-フリル	3, 4-ジFPhNHC00-
5800	tC ₃ H ₅ CO-	2-フリル	3, 4-ジFPhNHC00-
5575	ibueCO-	2-フリル	C ₃ H ₅ NHC00-
5385	tbuOCO-	2-フリル	C ₃ H ₅ NHC00-
5844	tC ₃ H ₅ CO-	2-フリル	C ₃ H ₅ NHC00-
5373	tBuOCO-	2-フリル	chexNHC00-
5895	tC ₃ H ₅ CO-	2-フリル	chexNHC00-
5588	ibueCO-	2-フリル	EtNHC00-
5393	tBuOCO-	2-フリル	EtNHC00-
6696	tBuOCO-	2-フリル	EtNHC00-
5822	tC ₃ H ₅ CO-	2-フリル	EtNHC00-
5565	ibueCO-	2-フリル	mnipNHC00-
6476	tAmOCO-	2-フリル	mnipNHC00-
5400	tBuOCO-	2-フリル	mnipNHC00-
5747	tC ₃ H ₅ CO-	2-フリル	mnipNHC00-
5535	ibueCO-	2-フリル	PhNHC00-
6399	tAmOCO-	2-フリル	PhNHC00-
5757	tC ₃ H ₅ CO-	2-フリル	PhNHC00-
5454	tBuOCO-	2-フリル	tBuNHC00-

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0094

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0094】

【表 1 8】

化合物	インビトロ ID50 (nm) HCT116
タキソール	2. 1
ドセタキセル	0. 6
5522	< 1
6404	< 10
5415	< 1
5800	< 10
5575	< 1
5385	< 1
5844	< 10
5373	< 10
5895	< 1
5588	< 1
5393	< 1
6696	< 1
5822	< 10
5565	< 1
6476	< 10
5400	< 1
5747	< 10
5535	< 1
6399	< 10
5757	< 10
5454	< 10