

【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】令和 3 年 1 月 14 日 (2021.1.14)

【公開番号】特開 2019-142823 (P2019-142823A)

【公開日】令和 1 年 8 月 29 日 (2019.8.29)

【年通号数】公開・登録公報 2019-035

【出願番号】特願 2018-30208 (P2018-30208)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

A 6 1 K 31/7056 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/7068 (2006.01)

A 6 1 K 33/24 (2019.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/553

A 6 1 K 31/7056

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/517

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/7068

A 6 1 K 33/24

A 6 1 K 31/519

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 11 月 25 日 (2020.11.25)

【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

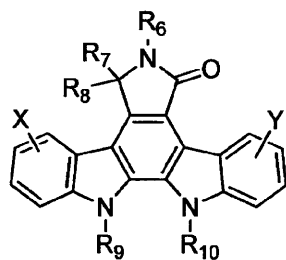
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記一般式 (S) で表される化合物 (S)、若しくはその薬学的に許容される塩、又は薬学的に許容されるポリマーに前記化合物 (S) 若しくはその薬学的に許容される塩が結合した薬物複合体を含む、抗がん剤耐性のがんを治療又は予防するための医薬組成物。

【化 1】



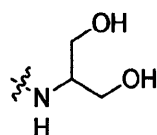
(S)

[式中、

X 及び Y は、それぞれ独立に、H、OH、C₁、プロボキシ、又はエチルチオメチルであり；

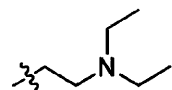
R₆ は、H、C₁₋₃アルキル、-NH₂、ベンジル、

【化 2】



又は

【化 3】

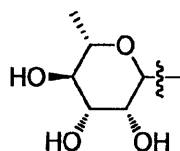


であり；

R₇ 及び R₈ は、それぞれ独立に、H、-OH、又はメトキシであるか、或いは一緒になってO = を形成してもよく；

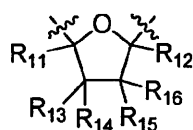
R₉ 及び R₁₀ は、それぞれ独立に、H、メチル、-D-グルコピラノシル、4-O-メチル-D-グルコピラノシル、シアノエチル、又は

【化 4】



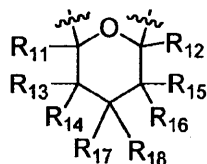
であるか、或いは一緒になって、以下の：

【化 5】



又は

【化 6】



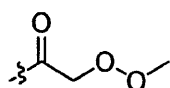
を形成してもよく、ここで

R_{11} は、メチルであり；

R_{12} は、H であり；

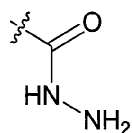
R_{13} 及び R_{14} は、それぞれ独立に、H、メトキシ、-OH、ヒドロキシメチル、メチルカルボキシレート、メチルアミノ、メチルアミノメチル、プロピルアミノメチル、ジメチルアミノメチル、メトキシカルボニル、

【化 7】



又は

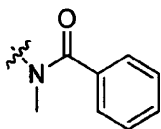
【化 8】



であり；

R_{15} 及び R_{16} は、それぞれ独立に、H、OH、又は

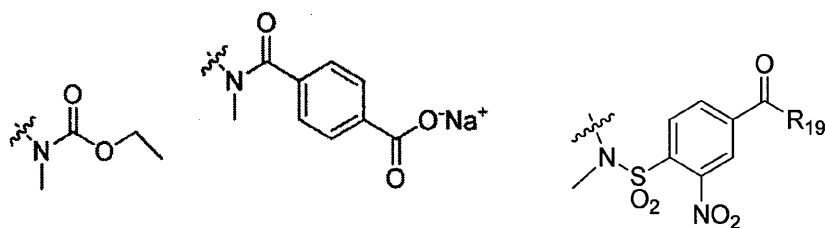
【化 9】



であり；

R_{17} 及び R_{18} は、H、OH、メチルアミノ、ジメチルアミノ、オキシム、又は下記のいずれかの式で表される基

【化 10】



であり、ここで、

R_{19} は、メトキシ、ヒドロキシ、-NH-NH₂、又は活性エステルを含む基である。

【請求項 2】

前記抗がん剤が、ゲフィチニブ、アファチニブ、オシメルチニブ、ダサチニブ、エルロチニブ、ゲムシタピン、シスプラチン、ペメトレキセド、及びミドスタウリンからなる群より選択される少なくとも１種の抗がん剤である、請求項１に記載の医薬組成物。

【請求項３】

前記抗がん剤が、キナーゼを標的とする分子標的薬である、請求項１又は２に記載の医薬組成物。

【請求項４】

前記キナーゼが、EGFR、ABL1、ALK1、HER2、c-Kit、FGFR1、FGFR2、FGFR3、c-Src、PDGFRα、RET、DDR2、TRKA、及びFlt-3からなる群より選択される少なくとも１種のキナーゼである、請求項３に記載の医薬組成物。

【請求項５】

前記抗がん剤耐性のがんが、ゲートキーパー変異を有するキナーゼを発現するがんである、請求項１～４のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項６】

前記キナーゼが、d746-750、T790M、及びC797Sの変異を有するEGFRである、請求項５に記載の医薬組成物。

【請求項７】

前記化合物（Ｓ）が、スタウロスポリン、７-ヒドロキシスタウロスポリン、KT5926、スタウロスポリン・アグリコン、SF2370、KT5823、４'-N-ベンゾイルスタウロスポリン、G6976、N,N-ジメチルスタウロスポリン、NA0359、N-エトキシカルボニル-７-オキソスタウロスポリン、KT-6124、CGP42700、４'-デメチルアミノ-４'，５'-ジヒドロキシスタウロスポリン、７-オキソスタウロスポリン、CEP751、NA0346、NA0359、３'-デメトキシ-３'-ヒドロキシスタウロスポリン、KT6006、７-O-メチル-UCN01、TAN999、NA0346、NA0345、NA0344、CGP44171A、SCH47112、N,N-ジメチルスタウロスポリン、TAN1030A、レスタウルチニブ、４'-デメチルアミノ-４'-ヒドロキシスタウロスポリン、AFN941、エドテカリン、ベカテカリン、K252a、及びK252aヒドラジドからなる群より選択される少なくとも１種の化合物である、請求項１～６のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項８】

前記化合物（Ｓ）が、スタウロスポリン、K252a、及びK252aヒドラジドからなる群より選択される少なくとも１種の化合物である、請求項７に記載の医薬組成物。

【請求項９】

前記薬物複合体がミセルを形成している、請求項１～８のいずれか一項に記載の医薬組成物。