

【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

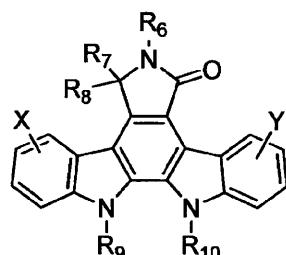
【補正の内容】

【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】



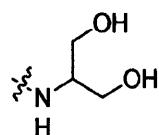
(S)

[式中、

X及びYは、それぞれ独立に、H、OH、Cl、プロポキシ、又はエチルチオメチルで  
あり；

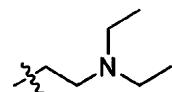
R<sub>6</sub>は、H、C<sub>1-3</sub>アルキル、-NH<sub>2</sub>、ベンジル、

## 【化2】



又は

## 【化3】

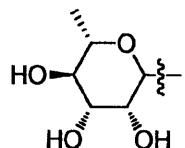


であり；

R<sub>7</sub>及びR<sub>8</sub>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；

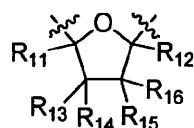
R<sub>9</sub>及びR<sub>10</sub>は、それぞれ独立に、H、メチル、-D-グルコピラノシリル、4-O-  
メチル-D-グルコピラノシリル、シアノエチル、又は

## 【化4】



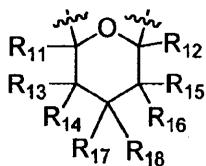
であるか、或いは一緒になって、以下の：

## 【化5】



又は

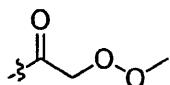
【化6】



を形成してもよく、ここで

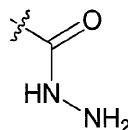
R<sub>11</sub>は、メチルであり；R<sub>12</sub>は、Hであり；R<sub>13</sub>及びR<sub>14</sub>は、それぞれ独立に、H、メトキシ、-OH、ヒドロキシメチル、メチルカルボキシレート、メチルアミノ、メチルアミノメチル、プロピルアミノメチル、ジメチルアミノメチル、メトキシカルボニル、

【化7】



又は

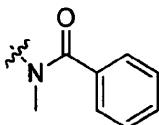
【化8】



であり；

R<sub>15</sub>及びR<sub>16</sub>は、それぞれ独立に、H、OH、又は

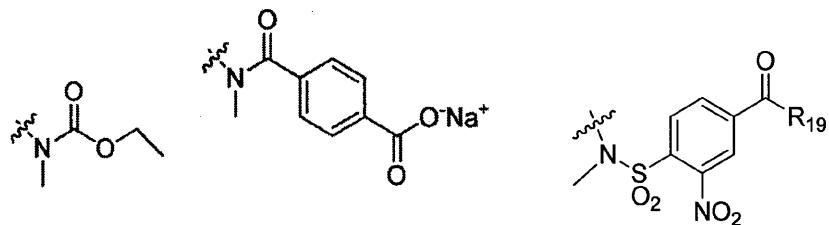
【化9】



であり；

R<sub>17</sub>及びR<sub>18</sub>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<sub>19</sub>は、メトキシ、ヒドロキシ、-NH-NH<sub>2</sub>、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бин、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、PDGFRa、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、スタウロスボリン、7-ヒドロキシスタウロスボリン、KT5926、スタウロスボリン・アグリコン、SF2370、KT5823、4'-N-ベンゾイルスタウロスボリン、Go6976、N,N-ジメチルスタウロスボリン、NA0359、N-エトキシカルボニル-7-オキソスタウロスボリン、KT-6124、CGP42700、4'-デメチルアミノ-4',5'-ジヒドロキシスタウロスボリン、7-オキソスタウロスボリン、CEP751、NA0346、NA0359、3'-デメトキシ-3'-ヒドロキシスタウロスボリン、KT6006、7-O-メチル-UCN01、TAN999、NA0346、NA0345、NA0344、CGP44171A、SCH47112、N,N-ジメチルスタウロスボリン、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ボリン、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、スタウロスボリン、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。