

【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2年7月9日(2020.7.9)

【公表番号】特表2019-520343(P2019-520343A)

【公表日】令和1年7月18日(2019.7.18)

【年通号数】公開・登録公報2019-028

【出願番号】特願2018-563056(P2018-563056)

【国際特許分類】

C 07 D	519/00	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	35/02	(2006.01)
A 61 K	31/475	(2006.01)
A 61 K	31/55	(2006.01)
A 61 K	31/506	(2006.01)
A 61 K	31/497	(2006.01)
A 61 K	31/501	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D	519/00	3 1 1
C 07 D	519/00	C S P
A 61 P	35/00	
A 61 P	35/02	
A 61 K	31/475	
A 61 K	31/55	
A 61 K	31/506	
A 61 K	31/497	
A 61 K	31/501	
A 61 P	43/00	1 0 5

【手続補正書】

【提出日】令和2年6月1日(2020.6.1)

【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

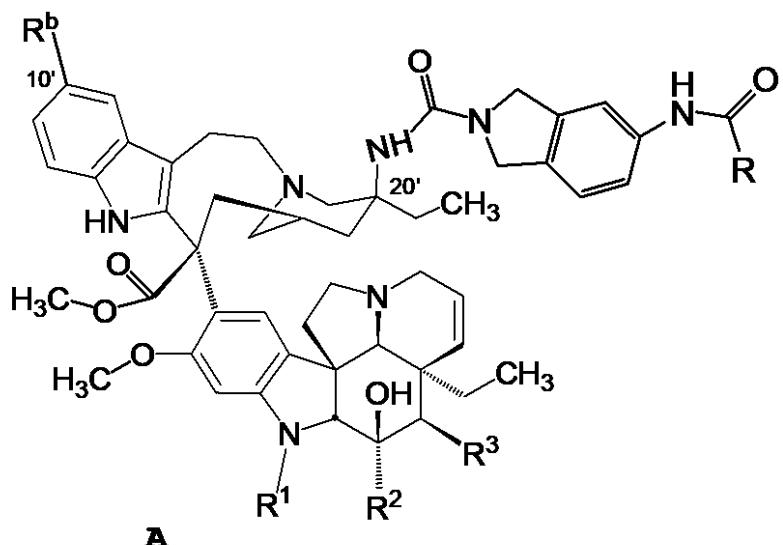
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

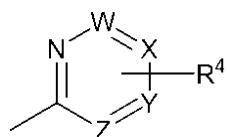
【請求項1】

下記構造式A、



	$R^1$	$R^2$	$R^3$
ピンプラスチン	$-CH_3$	$\begin{matrix} O \\    \\ -C-OCH_3 \end{matrix}$	$\begin{matrix} O \\    \\ -O-C-CH_3 \end{matrix}$
ピンクリスチン	$\begin{matrix} O \\    \\ -CH \end{matrix}$	$\begin{matrix} O \\    \\ -C-OCH_3 \end{matrix}$	$\begin{matrix} O \\    \\ -O-C-CH_3 \end{matrix}$
ピンデシン	$-CH_3$	$\begin{matrix} O \\    \\ -C-NH_2 \end{matrix}$	$-OH$

(式中、Rは、下記式の置換基であり、



式中、Nは、窒素であり、W、X、Y及びZの1つは、窒素(N)であってもよく、窒素でないときには、W、X、Y及びZは、CHであるか又はW、X、Y及びZの1つは、CR<sup>4</sup>であり、R<sup>4</sup>は、ヒドリド又は電子供与性置換基であり、かつ

R<sup>b</sup>は、F又はHである)

の20'-ヒドロキシ-ピンカ誘導体又はその医薬的に許容可能な塩。

#### 【請求項2】

W、X、Y及びZの1つが、窒素である、請求項1に記載の20'-ヒドロキシ-ピンカ誘導体又はその医薬的に許容可能な塩。

#### 【請求項3】

Wが、窒素である、請求項2に記載の20'-ヒドロキシ-ピンカ誘導体又はその医薬的に許容可能な塩。

#### 【請求項4】

Xが、窒素である、請求項2に記載の20'-ヒドロキシ-ピンカ誘導体又はその医薬的に許容可能な塩。

#### 【請求項5】

Yが、窒素である、請求項2に記載の20'-ヒドロキシ-ピンカ誘導体又はその医薬的に

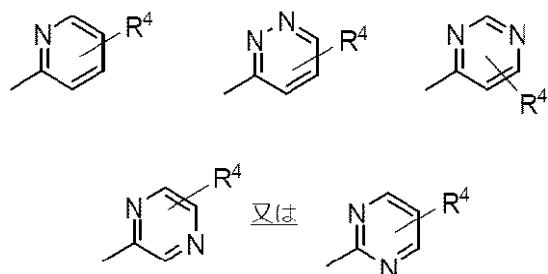
許容可能な塩。

【請求項 6】

Zが、窒素である、請求項 2 に記載の20' - ヒドロキシ-ビンカ誘導体又はその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 7】

Rが、以下の 1 つ以上の構造式を有する、請求項 1 に記載の20' - ヒドロキシ-ビンカ誘導体又はその医薬的に許容可能な塩。



【請求項 8】

R<sup>4</sup>が、ヒドリドであるか、又はC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ヒドロカルビル、アミノ、モノC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ヒドロカルビルアミノ、ジC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ヒドロカルビルアミノ及びC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ヒドロカルビルオキシ基から成る群より選択される、請求項 7 に記載の20' - ヒドロキシ-ビンカ誘導体又はその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 9】

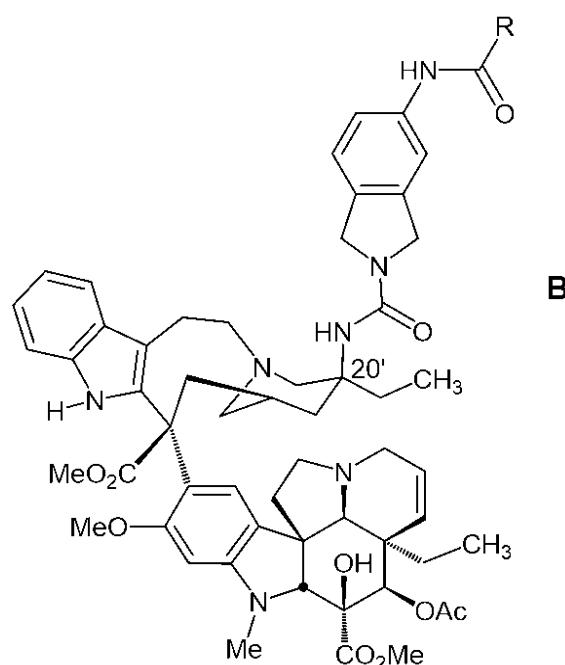
R<sup>b</sup>が、Hである、請求項 1 に記載の20' - ヒドロキシ-ビンカ誘導体又はその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 10】

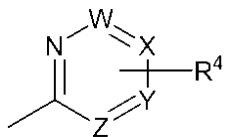
ビンプラスチンの誘導体である、請求項 1 に記載の20' - ヒドロキシ-ビンカ誘導体又はその医薬的に許容可能な塩。

【請求項 11】

下記構造式B、



(式中、  
Rは、下記式の置換基であり、



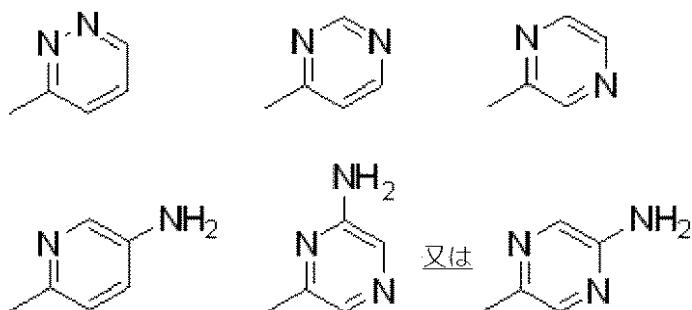
式中、  
Nは、窒素であり、  
W、X、Y及びZの1つは、窒素(N)であってもよく、窒素でないときには、W、X、Y及びZは、CHであるか又はW、X、Y及びZの1つが、CR<sup>4</sup>であり、  
R<sup>4</sup>は、ヒドリドであるか、又はC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ヒドロカルビル、アミノ、モノC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ヒドロカルビルアミノ、ジC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ヒドロカルビルアミノ及びC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ヒドロカルビルオキシ基の1つ以上から成る群より選択される)  
の20'-置換ビンプラスチン、又はその医薬的に許容可能な塩。

**【請求項12】**

R<sup>4</sup>が、アミノである、請求項11に記載の20'-置換ビンプラスチン又はその医薬的に許容可能な塩。

**【請求項13】**

Rが、以下の1つ以上の構造式を有する、請求項11に記載の20'-置換ビンプラスチン又はその医薬的に許容可能な塩。



**【請求項14】**

生理学的に許容可能な担体に溶解又は分散した癌性細胞増殖抑制量の請求項1に記載の20'-ヒドロキシ-ビンカ誘導体又はその医薬的に許容可能な塩を含むことを特徴とする医薬組成物。

**【請求項15】**

- a) W、X、Y及びZの1つが、窒素であり、
- b) R<sup>4</sup>が、アミノであり、かつ
- c) R<sup>b</sup>が、Hである、

請求項14に記載の医薬組成物。

**【請求項16】**

癌性細胞の成長を抑制するための医薬の製造における、請求項1に記載の20'-ヒドロキシ-ビンカ誘導体又はその医薬的に許容可能な塩の使用であって、前記癌性細胞を、前記20'-ヒドロキシ-ビンカ誘導体又はその医薬的に許容可能な塩と接触させることを特徴とする使用。

**【請求項17】**

前記癌性細胞を複数回接触させる、請求項16に記載の使用。

**【請求項18】**

前記癌性細胞をインビトロで接触させる、請求項16に記載の使用。

**【請求項 19】**

前記接触させる癌性細胞が、白血病細胞である、請求項16に記載の使用。

**【請求項 20】**

前記接触させる癌性細胞が、癌細胞である、請求項16に記載の使用。

**【請求項 21】**

前記接触させる癌細胞が、ビンプラスチンに耐性である、請求項20に記載の使用。