

【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4月1日(2021.4.1)

【公表番号】特表2020-507608(P2020-507608A)

【公表日】令和2年3月12日(2020.3.12)

【年通号数】公開・登録公報2020-010

【出願番号】特願2019-544029(P2019-544029)

【国際特許分類】

C 0 7 H 15/252 (2006.01)

C 0 7 H 19/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/704 (2006.01)

A 6 1 K 31/7056 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 H 15/252 C S P

C 0 7 H 19/04

A 6 1 K 31/704

A 6 1 K 31/7056

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

【手続補正書】

【提出日】令和3年2月16日(2021.2.16)

【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

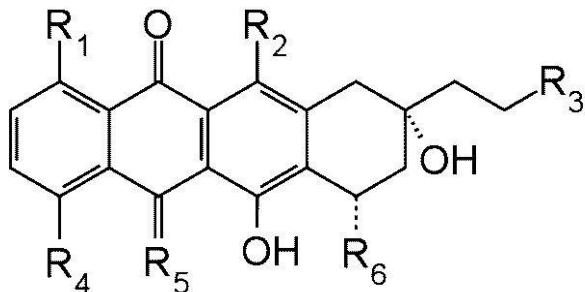
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式：

【化14】



により表される化合物、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であって、式中、

R₁、R₂、およびR₃はそれぞれ個別に、HまたはOHであり、

R₄は、H、OH、アルキル、およびO-アルキルからなる群から選択され、

R₅は、OまたはNHであり、

R₆は、2-ピロリノ-ダウノサミンまたは2-ピロリノ-エピダウノサミンである、

化合物、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体

、その溶媒和物、およびその混合物。

【請求項 2】

前記化合物が、2 - ピロリノ - 13 - デオキシドキシソルピシン、2 - ピロリノ - 13 - デオキシダウノルピシン、2 - ピロリノ - 13 - デオキシエピルピシン、2 - ピロリノ - 13 - デオキシカルミノマイシンおよび2 - ピロリノ - 13 - デオキシイダルピシン、ならびにそれらの5 - イミノ類似体からなる群から選択されるアントラサイクリンの誘導体である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

請求項 1 に記載の化合物と薬学的に許容される担体または賦形剤とを含む医薬組成物。

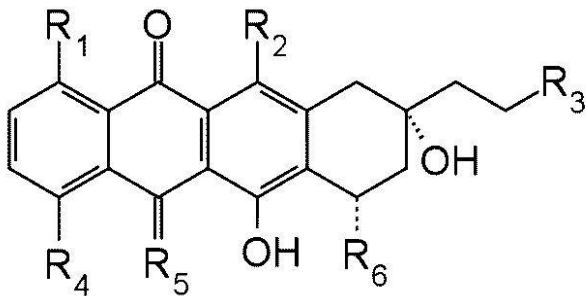
【請求項 4】

請求項 2 に記載の化合物と薬学的に許容される担体または賦形剤とを含む医薬組成物。

【請求項 5】

細胞の増殖を抑制するための、2 - ピロリノ - 13 - デオキシアントラサイクリン、またはその薬学的に許容される塩もしくはプロドラッグを含む化合物、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物の治療有効量を含む医薬組成物であって、前記 2 - ピロリノ - 13 - デオキシアントラサイクリンは、式：

【化 15】



を有し、式中、

R_1 、 R_2 、および R_3 はそれぞれ個別に、H または OH であり、

R_4 は、H、OH、アルキル、および O - アルキルからなる群から選択され、

R_5 は、O または NH であり、

R_6 は、2 - ピロリノ - ダウノサミンまたは 2 - ピロリノ - エピダウノサミンである、医薬組成物。

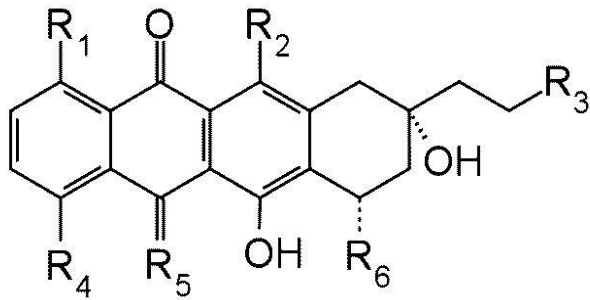
【請求項 6】

前記化合物が、2 - ピロリノ - 13 - デオキシドキシソルピシン、2 - ピロリノ - 13 - デオキシダウノルピシン、2 - ピロリノ - 13 - デオキシエピルピシン、2 - ピロリノ - 13 - デオキシカルミノマイシンおよび2 - ピロリノ - 13 - デオキシイダルピシン、ならびにそれらの5 - イミノ類似体からなる群から選択されるアントラサイクリンの誘導体である、請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

第 1 の化合物と第 2 の化合物とを含む治療有効量の相乗的組合せ調製物であって、前記第 1 の化合物が、式：

【化 16】



を有する 2 - ピロリノ - 13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であって、式中、

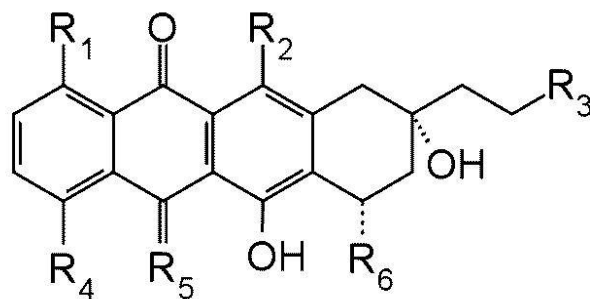
R₁、R₂、および R₃ はそれぞれ個別に、H または OH であり、

R₄ は、H、OH、アルキル、および O - アルキルからなる群から選択され、

R₅ は、O または NH であり、

R₆ は、2 - ピロリノ - ダウノサミンまたは 2 - ピロリノ - エピダウノサミンである、2 - ピロリノ - 13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であり、前記第 2 の化合物が、式：

【化 17】



を有する 13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であって、式中、

R₁、R₂ および R₃ はそれぞれ独立して、H および OH からなる群から選択され、

R₄ は、H、OH、アルキル、および O - アルキルからなる群から選択され、

R₅ は、O および NH からなる群から選択され、

R₆ は、糖部分である、

13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であり、前記治療有効量が、細胞の増殖を抑制する、相乗的組合せ調製物。

【請求項 8】

前記第 1 の化合物が、2 - ピロリノ - 13 - デオキシドキシソルピシン、2 - ピロリノ - 13 - デオキシダウノルピシン、2 - ピロリノ - 13 - デオキシエピルピシン、2 - ピロリノ - 13 - デオキシカルミノマイシン、および 2 - ピロリノ - 13 - デオキシイダルピシンからなる群から選択されるアントラサイクリンの誘導体、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物およびその混合物、ならびにそれらの 5 - イミノ類似体であり、前記第 2 の化合物が、13 - デオキシドキシソルピシン、13 - デオキシダウノルピシン、13 - デオキシエピルピシン、13 - デオキ

シカルミノマイシン、13-デオキシイダルピシン、13-デオキシアナマイシンおよび13-デオキシアムルピシン、ならびにそれらの5-イミノ類似体からなる群から選択されるアントラサイクリンの誘導体、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物である、請求項7に記載の相乗的組合せ調製物。

【請求項9】

薬学的に許容される担体または賦形剤をさらに含む、請求項7に記載の相乗的組合せ調製物。

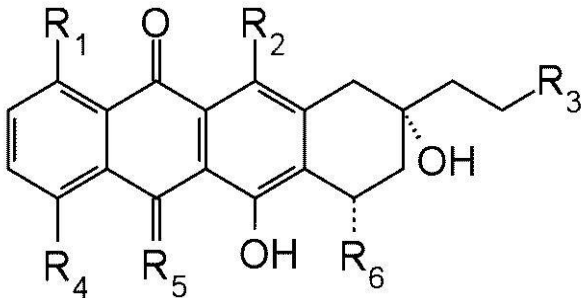
【請求項10】

薬学的に許容される担体または賦形剤をさらに含む請求項8に記載の相乗的組合せ調製物。

【請求項11】

細胞の増殖を抑制する方法における使用のための第1の化合物および第2の化合物を含む組み合わせ物であって、前記方法は、それを必要とする哺乳動物に前記第1の化合物および前記第2の化合物を投与するステップを含み、前記第1の化合物が、式：

【化18】



を有する2-ピロリノ-13-デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であって、式中、

R₁、R₂、およびR₃はそれぞれ個別に、HまたはOHであり、

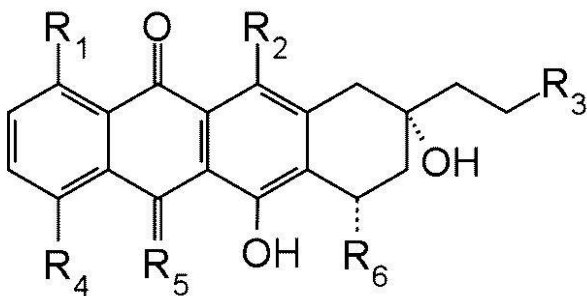
R₄は、H、OH、アルキル、およびO-アルキルからなる群から選択され、

R₅は、OまたはNHであり、

R₆は、2-ピロリノ-ダウノサミンまたは2-ピロリノ-エピダウノサミンである、

2-ピロリノ-13-デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であり、前記第2の化合物が、式：

【化19】



を有する13-デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であって、式中、

R₁、R₂ および R₃ はそれぞれ独立して、H および OH からなる群から選択され、
R₄ は、H、OH、アルキル、および O-アルキル からなる群から選択され、
R₅ は、O および NH からなる群から選択され、
R₆ は、糖部分である、

13-デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であり、
前記治療有効量が、前記細胞の増殖を抑制する、組み合わせ物。

【請求項 12】

前記第 1 の化合物が、2-ピロリノ-13-デオキシドキシソルピシン、2-ピロリノ-13-デオキシダウノルピシン、2-ピロリノ-13-デオキシエピルピシン、2-ピロリノ-13-デオキシカルミノマイシンおよび 2-ピロリノ-13-デオキシイダルピシン、ならびにそれらの 5-イミノ類似体からなる群から選択されるアントラサイクリンの誘導体、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であり、前記第 2 の化合物が、13-デオキシドキシソルピシン、13-デオキシダウノルピシン、13-デオキシエピルピシン、13-デオキシカルミノマイシン、13-デオキシイダルピシン、13-デオキシアナマイシンおよび 13-デオキシアムルピシン、ならびにそれらの 5-イミノ類似体からなる群から選択されるアントラサイクリンの誘導体、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物である、請求項 11 に記載の 組み合わせ物。

【請求項 13】

前記第 2 の化合物が、その治療有効量より少ない量で存在する、請求項 7 に記載の相乗的組合せ調製物。

【請求項 14】

前記第 2 の化合物対前記第 1 の成分の重量比が、約 0.005 ~ 約 0.10 : 1 である、請求項 13 に記載の相乗的組合せ調製物。

【請求項 15】

前記第 1 の化合物が、その治療有効量より少ない量で存在する、請求項 7 に記載の相乗的組合せ調製物。

【請求項 16】

前記第 1 の化合物対前記第 2 の成分の重量比が、約 0.005 ~ 約 0.10 : 1 である、請求項 15 に記載の相乗的組合せ調製物。

【請求項 17】

前記第 2 の化合物が、その治療有効量より少ない量で投与される、請求項 11 に記載の 組み合わせ物。

【請求項 18】

前記第 2 の化合物対前記第 1 の成分の重量比が、約 0.005 ~ 約 0.10 : 1 である、請求項 17 に記載の 組み合わせ物。

【請求項 19】

前記第 1 の化合物が、その治療有効量より少ない量で投与される、請求項 11 に記載の 組み合わせ物。

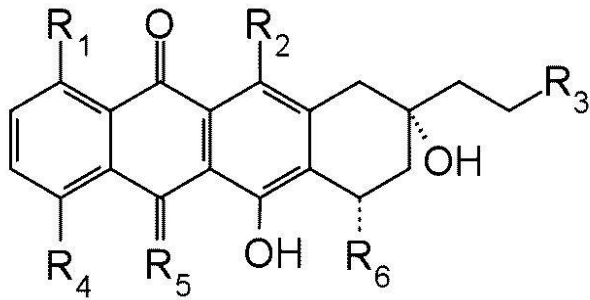
【請求項 20】

前記第 1 の化合物対前記第 2 の成分の重量比が、約 0.005 ~ 約 0.10 : 1 である、請求項 19 に記載の 組み合わせ物。

【請求項 21】

第 1 の化合物を含む組成物であって、前記第 1 の化合物は、式：

【化 16】



を有する 2 - ピロリノ - 13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であって、式中、

R_1 、 R_2 、および R_3 はそれぞれ個別に、H または OH であり、

R_4 は、H、OH、アルキル、および O - アルキルからなる群から選択され、

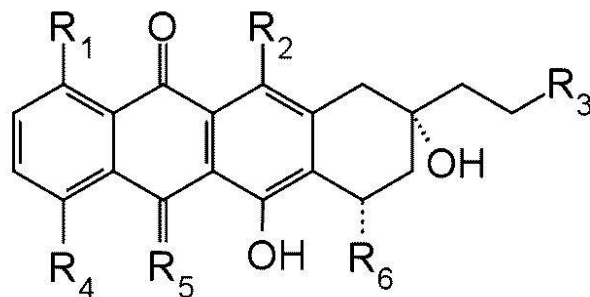
R_5 は、O または NH であり、

R_6 は、2 - ピロリノ - ダウノサミンまたは 2 - ピロリノ - エピダウノサミンである、

2 - ピロリノ - 13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であり、

前記組成物は、第 2 の化合物と組み合わせて投与されることを特徴とし、前記第 2 の化合物は、式：

【化 17】



を有する 13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であって、式中

R_1 、 R_2 および R_3 はそれぞれ独立して、H および OH からなる群から選択され、

R_4 は、H、OH、アルキル、および O - アルキルからなる群から選択され、

R_5 は、O および NH からなる群から選択され、

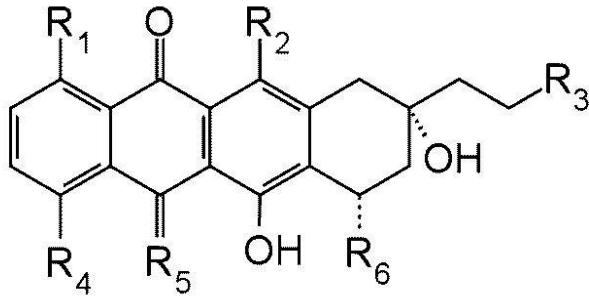
R_6 は、糖部分である、

13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物である、組成物。

【請求項 22】

第 2 の化合物を含む組成物であって、前記第 2 の化合物は、式：

【化 17】



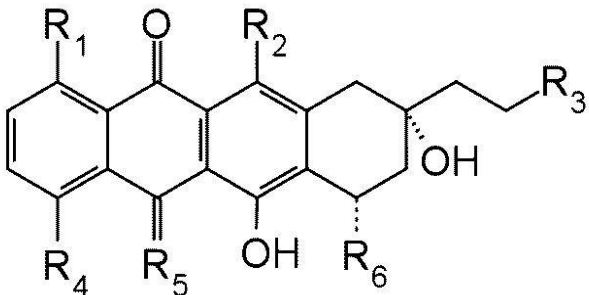
を有する 13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であって、式中

R₁、R₂ および R₃ はそれぞれ独立して、H および OH からなる群から選択され、
R₄ は、H、OH、アルキル、および O - アルキル からなる群から選択され、
R₅ は、O および NH からなる群から選択され、
R₆ は、糖部分である、

13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であり、

前記組成物は、第 1 の化合物と組み合わせて投与されることを特徴とし、前記第 1 の化合物は、式：

【化 16】



を有する 2 - ピロリノ - 13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であって、式中、

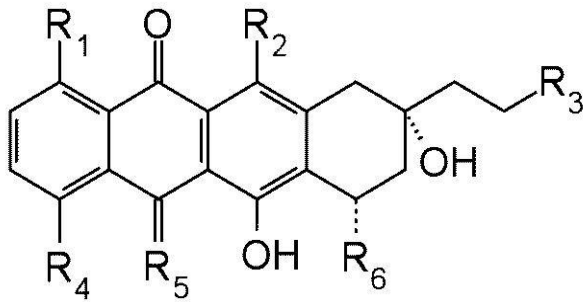
R₁、R₂、および R₃ はそれぞれ個別に、H または OH であり、
R₄ は、H、OH、アルキル、および O - アルキル からなる群から選択され、
R₅ は、O または NH であり、

R₆ は、2 - ピロリノ - ダウノサミン または 2 - ピロリノ - エピダウノサミン である、
2 - ピロリノ - 13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物である、
組成物。

【請求項 23】

細胞の増殖を抑制するための第 1 の化合物を含む組成物であって、前記第 1 の化合物は、式：

【化 18】



を有する 2 - ピロリノ - 13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であって、式中、

R_1 、 R_2 、および R_3 はそれぞれ個別に、H または OH であり、

R_4 は、H、OH、アルキル、および O - アルキルからなる群から選択され、

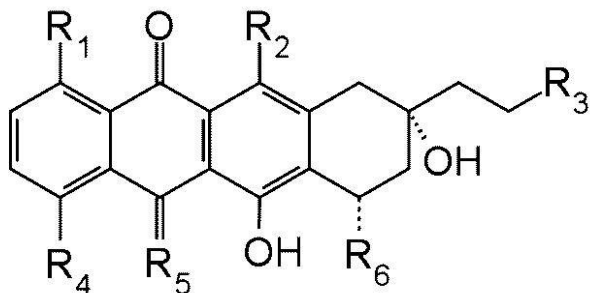
R_5 は、O または NH であり、

R_6 は、2 - ピロリノ - ダウノサミンまたは 2 - ピロリノ - エピダウノサミンである、

2 - ピロリノ - 13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であり、

前記組成物は、第 2 の化合物と組み合わせて投与されることを特徴とし、前記第 2 の化合物は、式：

【化 19】



を有する 13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であって、式中

R_1 、 R_2 および R_3 はそれぞれ独立して、H および OH からなる群から選択され、

R_4 は、H、OH、アルキル、および O - アルキルからなる群から選択され、

R_5 は、O および NH からなる群から選択され、

R_6 は、糖部分である、

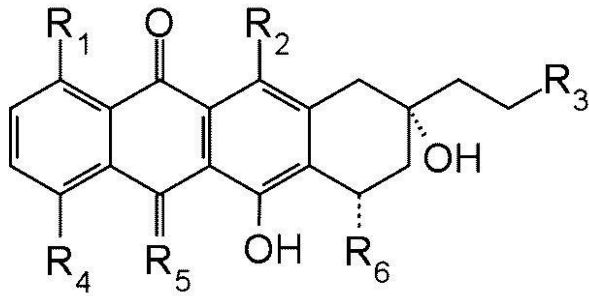
13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物である、

組成物。

【請求項 24】

細胞の増殖を抑制するための第 2 の化合物を含む組成物であって、前記第 2 の化合物は、式：

【化 19】



を有する 13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であって、式中

R₁、R₂ および R₃ はそれぞれ独立して、H および OH からなる群から選択され、

R₄ は、H、OH、アルキル、および O - アルキル からなる群から選択され、

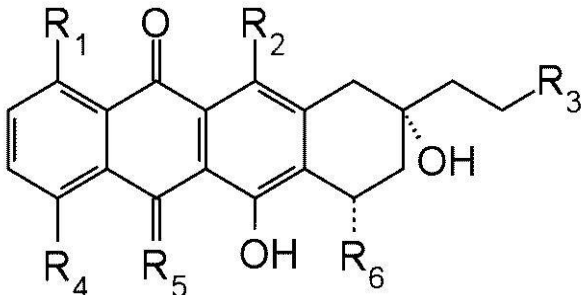
R₅ は、O および NH からなる群から選択され、

R₆ は、糖部分である、

13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であり、

前記組成物は、第 1 の化合物と組み合わせて投与されることを特徴とし、前記第 1 の化合物は、式：

【化 18】



を有する 2 - ピロリノ - 13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であって、式中、

R₁、R₂、および R₃ はそれぞれ個別に、H または OH であり、

R₄ は、H、OH、アルキル、および O - アルキル からなる群から選択され、

R₅ は、O または NH であり、

R₆ は、2 - ピロリノ - ダウノサミン または 2 - ピロリノ - エピダウノサミン である、

2 - ピロリノ - 13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物である、組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】 0017

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【0017】

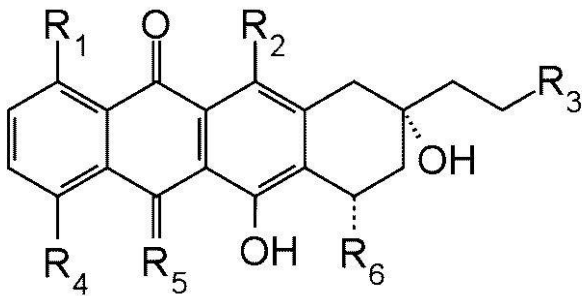
本開示のさらに他の目的および利点は、好ましい実施形態だけが、単に最良の態様の例示として示され、説明されているにすぎない以下の詳細な説明から当業者に容易に明らかになる。理解されるように、本開示は、他のおよび異なる実施形態が可能であり、そのいくつかの詳細は、本開示から逸脱することなく、様々な明らかな点で改変可能である。したがって、説明は、本質的に例示するものであって、限定するものでないものとみなされるべきである。

本発明の実施形態において、例えば以下の項目が提供される。

(項目1)

式：

【化14】



により表される化合物、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であって、式中、

R_1 、 R_2 、および R_3 はそれぞれ個別に、HまたはOHであり、

R_4 は、H、OH、アルキル、およびO-アルキルからなる群から選択され、

R_5 は、OまたはNHであり、

R_6 は、2-ピロリノ-ダウノサミンまたは2-ピロリノ-エピダウノサミンである、

化合物、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物。

(項目2)

前記化合物が、2-ピロリノ-13-デオキシドキシソルピシン、2-ピロリノ-13-デオキシダウノルピシン、2-ピロリノ-13-デオキシエピルピシン、2-ピロリノ-13-デオキシカルミノマイシンおよび2-ピロリノ-13-デオキシイダルピシン、ならびにそれらの5-イミノ類似体からなる群から選択されるアントラサイクリンの誘導体である、項目1に記載の化合物。

(項目3)

項目1に記載の化合物と薬学的に許容される担体または賦形剤とを含む医薬組成物。

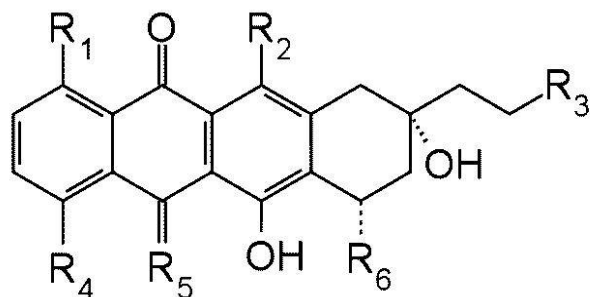
(項目4)

項目2に記載の化合物と薬学的に許容される担体または賦形剤とを含む医薬組成物。

(項目5)

細胞の増殖を抑制する方法であって、前記方法は、それを必要とする哺乳動物に、2-ピロリノ-13-デオキシアントラサイクリン、またはその薬学的に許容される塩もしくはプロドラッグを含む化合物、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物の治療有効量を投与するステップを含み、前記2-ピロリノ-13-デオキシアントラサイクリンは、式：

【化 1 5】



を有し、式中、

R_1 、 R_2 、および R_3 はそれぞれ個別に、H または OH であり、

R_4 は、H、OH、アルキル、および O-アルキルからなる群から選択され、

R_5 は、O または NH であり、

R_6 は、2-ピロリノ-ダウノサミンまたは 2-ピロリノ-エピダウノサミンである、
方法。

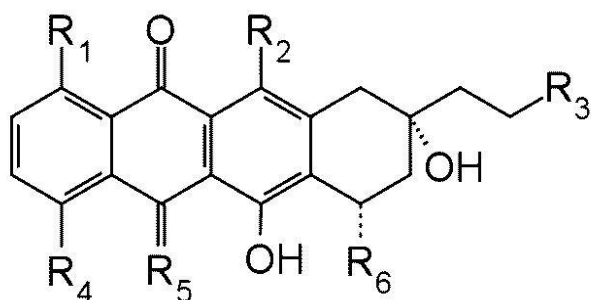
(項目 6)

前記化合物が、2-ピロリノ-13-デオキシドキシソルピシン、2-ピロリノ-13-デオキシダウノルピシン、2-ピロリノ-13-デオキシエピルピシン、2-ピロリノ-13-デオキシカルミノマイシンおよび 2-ピロリノ-13-デオキシイダルピシン、ならびにそれらの 5-イミノ類似体からなる群から選択されるアントラサイクリンの誘導体である、項目 5 に記載の方法。

(項目 7)

第 1 の化合物と第 2 の化合物とを含む治療有効量の相乗的組合せ調製物であって、前記第 1 の化合物が、式：

【化 1 6】



を有する 2-ピロリノ-13-デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であって、式中、

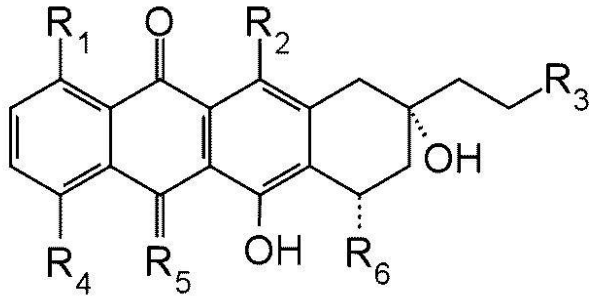
R_1 、 R_2 、および R_3 はそれぞれ個別に、H または OH であり、

R_4 は、H、OH、アルキル、および O-アルキルからなる群から選択され、

R_5 は、O または NH であり、

R_6 は、2-ピロリノ-ダウノサミンまたは 2-ピロリノ-エピダウノサミンである、
2-ピロリノ-13-デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であり、
前記第 2 の化合物が、式：

【化 17】



を有する 13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であって、式中

R₁、R₂ および R₃ はそれぞれ独立して、H および OH からなる群から選択され、
R₄ は、H、OH、アルキル、および O - アルキル からなる群から選択され、
R₅ は、O および NH からなる群から選択され、
R₆ は、糖部分である、

13 - デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であり、
前記治療有効量が、細胞の増殖を抑制する、相乗的組合せ調製物。

(項目 8)

前記第 1 の化合物が、2 - ピロリノ - 13 - デオキシドキシソルピシン、2 - ピロリノ - 13 - デオキシダウノルピシン、2 - ピロリノ - 13 - デオキシエビルピシン、2 - ピロリノ - 13 - デオキシカルミノマイシン、および 2 - ピロリノ - 13 - デオキシイダルピシンからなる群から選択されるアントラサイクリンの誘導体、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物およびその混合物、ならびにそれらの 5 - イミノ類似体であり、前記第 2 の化合物が、13 - デオキシドキシソルピシン、13 - デオキシダウノルピシン、13 - デオキシエビルピシン、13 - デオキシカルミノマイシン、13 - デオキシイダルピシン、13 - デオキシアナマイシンおよび 13 - デオキシアムルピシン、ならびにそれらの 5 - イミノ類似体からなる群から選択されるアントラサイクリンの誘導体、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物である、項目 7 に記載の相乗的組合せ調製物。

(項目 9)

項目 7 に記載の相乗的組合せ調製物と薬学的に許容される担体または賦形剤とを含む医薬組成物。

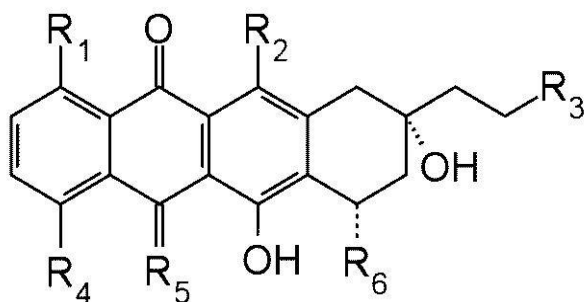
(項目 10)

項目 8 に記載の相乗的組合せ調製物と薬学的に許容される担体または賦形剤とを含む医薬組成物。

(項目 11)

細胞の増殖を第 1 の化合物と第 2 の化合物の相乗的組合せ調製物で抑制する方法であって、前記方法は、それを必要とする哺乳動物に治療有効量の前記相乗的組合せ調製物を投与するステップを含み、前記第 1 の化合物が、式：

【化18】



を有する2-ピロリノ-13-デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であって、式中、

R_1 、 R_2 、および R_3 はそれぞれ個別に、HまたはOHであり、

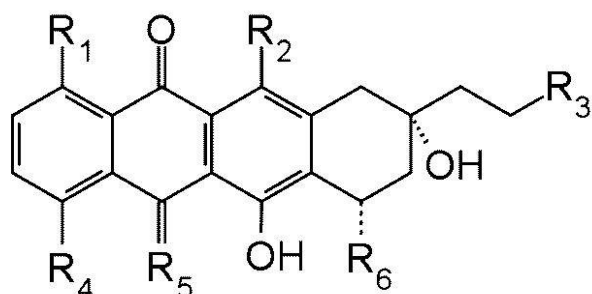
R_4 は、H、OH、アルキル、およびO-アルキルからなる群から選択され、

R_5 は、OまたはNHであり、

R_6 は、2-ピロリノ-ダウノサミンまたは2-ピロリノ-エピダウノサミンである、

2-ピロリノ-13-デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であり、前記第2の化合物が、式：

【化19】



を有する13-デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であって、式中

R_1 、 R_2 および R_3 はそれぞれ独立して、HおよびOHからなる群から選択され、

R_4 は、H、OH、アルキル、およびO-アルキルからなる群から選択され、

R_5 は、OおよびNHからなる群から選択され、

R_6 は、糖部分である、

13-デオキシアントラサイクリン、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であり、

前記治療有効量が、前記細胞の増殖を抑制する、方法。

(項目12)

前記第1の化合物が、2-ピロリノ-13-デオキシドキシソルピシン、2-ピロリノ-13-デオキシダウノルピシン、2-ピロリノ-13-デオキシエビルピシン、2-ピロリノ-13-デオキシカルミノマイシンおよび2-ピロリノ-13-デオキシイダルピシン、ならびにそれらの5-イミノ類似体からなる群から選択されるアントラサイクリンの誘導体、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物であり、前記第2の化合物が、13-デオキシドキシソルピシン、13-デオキシダウノルピシン、13-デオキシエビルピシン、13-デオキ

シカルミノマイシン、13-デオキシイダルピシン、13-デオキシアナマイシンおよび13-デオキシアムルピシン、ならびにそれらの5-イミノ類似体からなる群から選択されるアントラサイクリンの誘導体、その薬学的に許容される塩、その重水素化形態、そのプロドラッグ、その異性体、その溶媒和物、およびその混合物である、項目11に記載の方法。

(項目13)

前記第2の化合物が、その治療有効量より少ない量で存在する、項目7に記載の相乗的組合せ調製物。

(項目14)

前記第2の化合物対前記第1の成分の重量比が、約0.005~約0.10:1である、項目13に記載の相乗的組合せ調製物。

(項目15)

前記第1の化合物が、その治療有効量より少ない量で存在する、項目7に記載の相乗的組合せ調製物。

(項目16)

前記第1の化合物対前記第2の成分の重量比が、約0.005~約0.10:1である、項目15に記載の相乗的組合せ調製物。

(項目17)

前記第2の化合物が、その治療有効量より少ない量で投与される、項目11に記載の方法。

(項目18)

前記第2の化合物対前記第1の成分の重量比が、約0.005~約0.10:1である、項目17に記載の方法。

(項目19)

前記第2の化合物が、その治療有効量より少ない量で投与される、項目11に記載の方法。

(項目20)

前記第1の化合物対前記第2の成分の重量比が、約0.005~約0.10:1である、項目19に記載の方法。