

【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 7 月 5 日 (2007.7.5)

【公表番号】特表 2002-541255 (P2002-541255A)

【公表日】平成 14 年 12 月 3 日 (2002.12.3)

【出願番号】特願 2000-610851 (P2000-610851)

【国際特許分類】

C 0 7 D 225/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/395 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 225/06

A 6 1 K 31/395

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 4 月 26 日 (2007.4.26)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 0 8

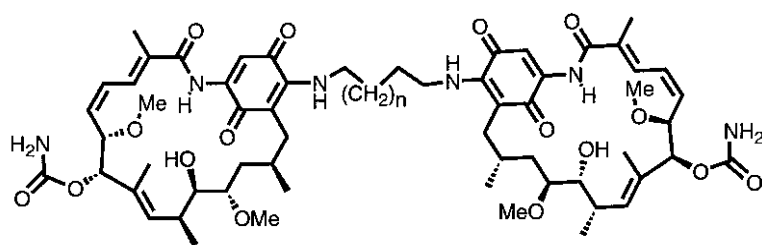
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 0 8】

(発明の開示)

我々はここに、アンサマイシン抗生物質が結合するポケット部分で h s p 9 0 に結合する 2 個の連結した h s p 結合部分を含有する二官能性分子が、H E R 族チロシンキナーゼの分解および / または阻害の誘発に有効であることを見出した。一例として、下記構造を有する組成物は、別種のキナーゼに実質的な影響を及ぼすことなく、H E R 族チロシンキナーゼの選択的分解および / または阻害を提供する：



ダイマー：n = 1-9

従って、これらの化合物は癌細胞を強力に殺滅するが、ゲルダナマイシンに比較して少数のタンパク質にしか影響しないことから、本発明の組成物は減少した毒性を伴って、H E R 陽性癌の治療に使用することができる。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】図面

【補正対象項目名】図 1

【補正方法】変更

【補正の内容】

ジアミン (0.49 当量)
 DMSO, 暗所, 2-24時間
 収率 > 80%

ゲルダナマイシン (GM)
 R-NH₂ (過剰)
 CHCl₃, 暗所

R =

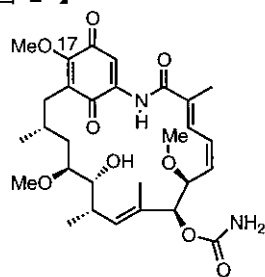
ゲルダナマイシン 4炭素
 ダイマー--セミアンサン環開裂

GM
 1) H₂N(CH₂)₇NH₂, CHCl₃
 2) HA, CHCl₃, 加熱, 2時間

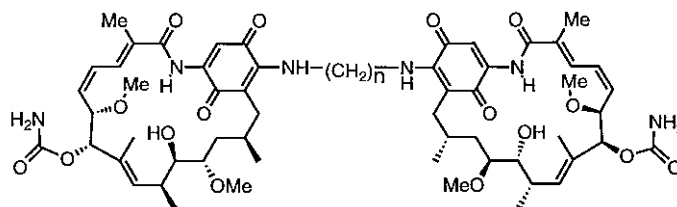
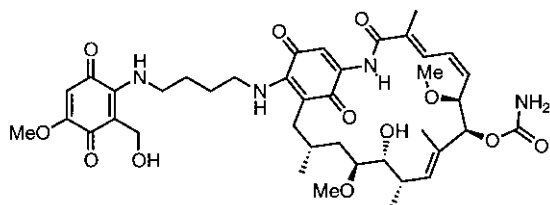
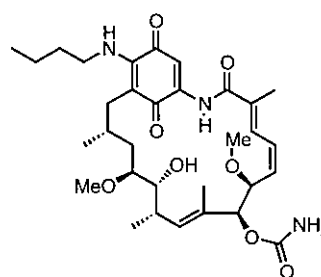
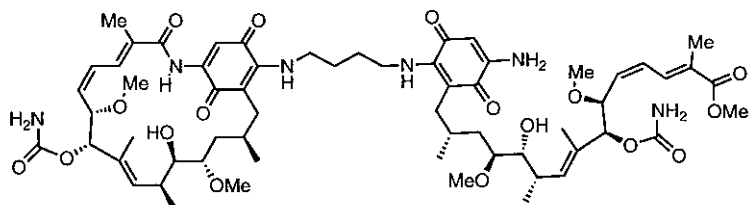
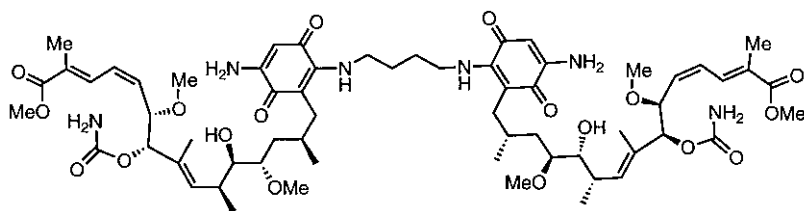
ヘルビマイシン A (HA)
 ゲルダナマイシン-ヘルビマイシン A ヘテロダイマー

【補正の内容】

【 図 2 】



ゲルダナマイシン (GM,O)

GM-ダイマー (GMD, $\text{O} \text{---} \text{O}$)n = 4: GMD-4C, $\text{O} \text{---} \text{O} \text{---} 4$ n = 7: GMD-7C, $\text{O} \text{---} \text{O} \text{---} 7$ n = 9: GMD-9C, $\text{O} \text{---} \text{O} \text{---} 9$ n = 12: GMD-12C, $\text{O} \text{---} \text{O} \text{---} 12$ GM-キノン, $\text{O} \text{---} 4 \text{---} \square$ GM-リンカー, $\text{O} \text{---} 4$ GMD-α, $\text{O} \text{---} 4 \text{---} \text{Y}$ GMD-αα, $\text{Y} \text{---} 4 \text{---} \text{Y}$