

【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21年9月24日(2009.9.24)

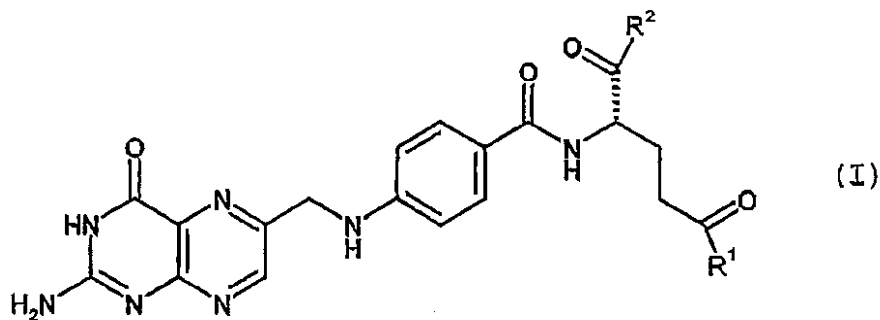
【公表番号】特表2009-504732(P2009-504732A)
 【公表日】平成21年2月5日(2009.2.5)
 【年通号数】公開・登録公報2009-005
 【出願番号】特願2008-526905(P2008-526905)
 【国際特許分類】

C 0 7 F 5/02 (2006.01)
 A 6 1 K 31/69 (2006.01)
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)
 A 6 1 P 35/04 (2006.01)
 A 6 1 K 51/00 (2006.01)
 A 6 1 K 31/519 (2006.01)
 A 6 1 N 5/10 (2006.01)

【F I】

C 0 7 F 5/02 C S P E
 A 6 1 K 31/69
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 35/04
 A 6 1 K 49/02 A
 A 6 1 K 31/519
 A 6 1 N 5/10 H

【手続補正書】
 【提出日】平成21年8月7日(2009.8.7)
 【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(I):
 【化1】



(ここで、
 R^1 および R^2 の一方が、 $-NH-X-Y-Z$ 、 $-O-X-Y-Z$ または $-S-X-Y-Z$ であり、そして他方が $-OH$ 、 $-NH-X-Y-Z$ 、 $-O-X-Y-Z$ または $-S-X-Y-Z$ であり、

ここで、

Xが、 $-(CH_2)_m-$ (mは0、1、2、3または4である)または $-(CH_2)_p-O-(CH_2)_q-$ (pおよびqは独立して、1、2、3または4である)であり；

Yが、ボランまたはカルボラン(少なくとも1つのホウ素原子は ^{10}B である)であり；
そして

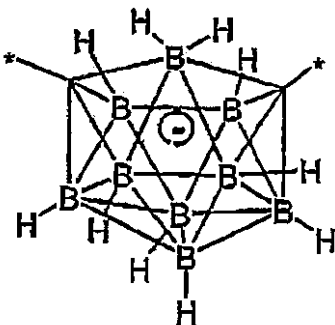
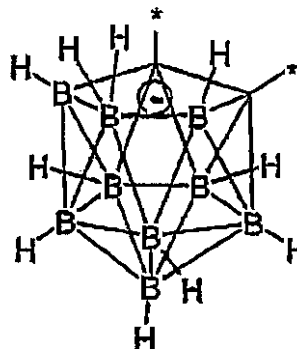
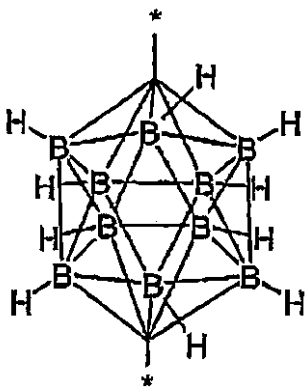
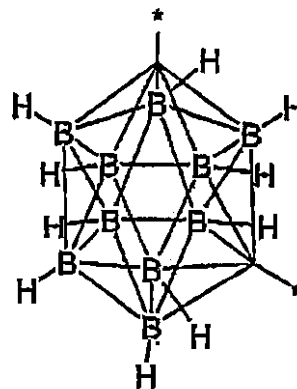
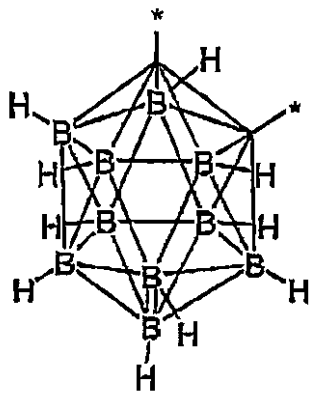
Zが、Hまたはアミノメチル、2-アミノエチル、3-アミノプロピル、1,3-プロパンジオール-2-イル-メトキシル、エチレングリコキシルもしくはジエチレングリコキシルのような親水性基である)

の化合物ならびにそれらの薬学的に受容可能な塩、溶媒和物および立体異性体。

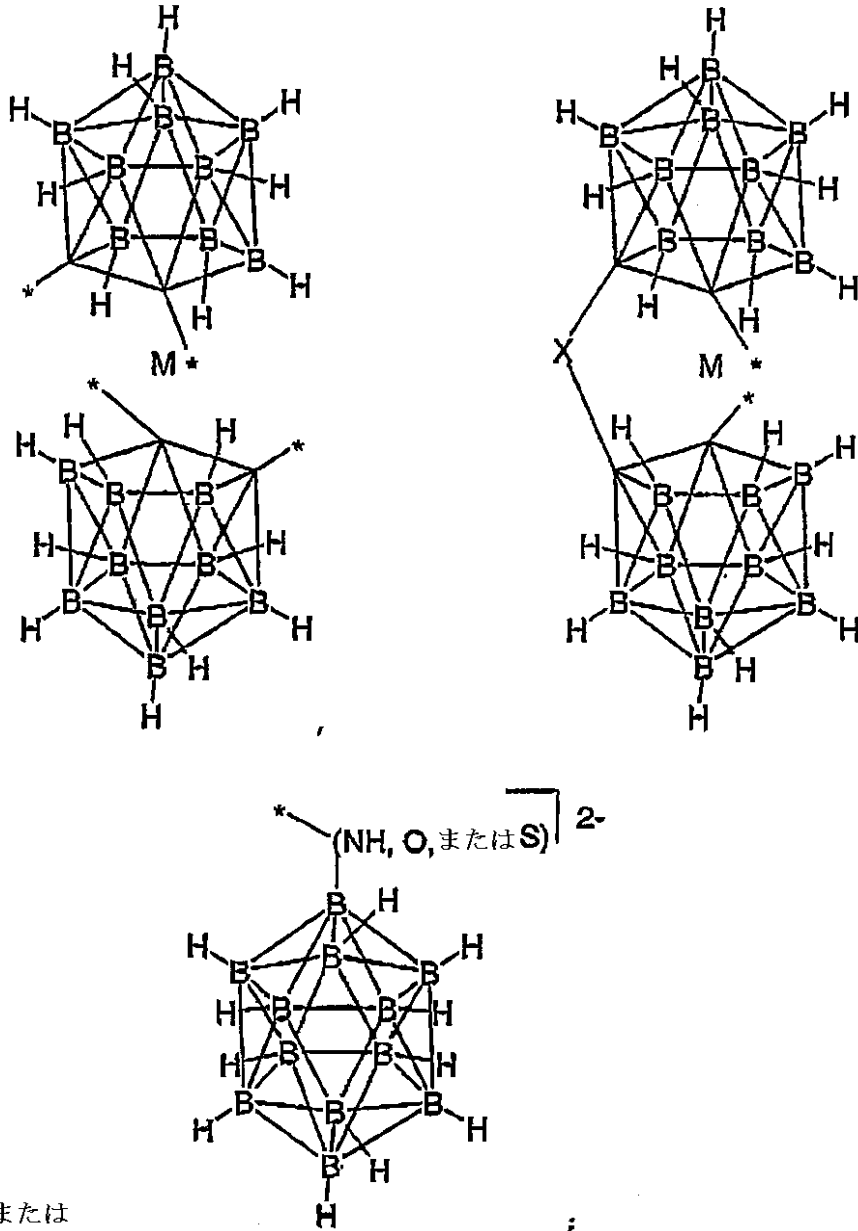
【請求項2】

Yが、以下：

【化2】



【化3】



または

(ここで、*はXまたはZに対する結合位置を示し；
Mはコバルト、コバルト - 57または鉄であり；そして
Xは請求項1に定義される通りである)
である請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

化合物が、 $N^2 - (4 - \{ [(2 - \text{アミノ} - 4 - \text{オキソ} - 3, 4 - \text{ジヒドロプテリジン} - 6 - \text{イル}) \text{メチル}] \text{アミノ} \} \text{ベンゾイル}) - N - \{ 3 - [(1R, 9S) - 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 10, 11, 12 - \text{デカボラビシクロ}[7.2.1] \text{ドデカ} - 1 - \text{イル}] \text{プロピル} \} - \text{グルタミン}$ または $N^2 - (4 - \{ [(2 - \text{アミノ} - 4 - \text{オキソ} - 3, 4 - \text{ジヒドロプテリジン} - 6 - \text{イル}) \text{メチル}] \text{アミノ} \} \text{ベンゾイル}) - N - [3 - (2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 10, 11, 12 - \text{デカボラビシクロ}[7.2.1] \text{ドデカ} - 1 - \text{イル}) \text{プロピル}] - L - \text{グルタミン}$ である、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

R^1 が $NH - X - Y - Z$ 、 $-O - X - Y - Z$ または $-S - X - Y - Z$ であり、そして R^2 が OH である、請求項1または2に記載の化合物。

【請求項5】

少なくとも1つの炭素原子が ^{11}C である、請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項6】

請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物を含有する、ホウ素中性子捕獲療法と併せて使用する腫瘍治療用医薬。

【請求項7】

請求項5に記載の化合物を含有する、陽電子放出断層撮影と併せて使用する腫瘍診断用医薬。。

【請求項8】

請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物および薬学的に受容可能な担体、希釈剤または補助剤を含有する医薬組成物。

【請求項9】

腫瘍治療に使用するための医薬を製造するための請求項1～5のいずれか1項に定義される式(I)に記載の化合物の使用。

【請求項10】

腫瘍治療が、腫瘍のホウ素中性子捕獲療法である、請求項9に記載の使用。

【請求項11】

腫瘍が、中枢神経系から発症する腫瘍、好ましくは、グリア芽腫、神経膠肉腫、未分化星状細胞腫、低悪性度星状細胞腫、毛様細胞性星状細胞腫、乏突起膠腫または脳幹膠腫のような神経膠腫；髄膜腫；末梢性神経上皮腫；未分化神経外胚葉性腫瘍；神経芽細胞腫；胚細胞腫；下垂体部腫瘍；転移性脳腫瘍；または動静脈奇形である、請求項9または10に記載の使用。

【請求項12】

腫瘍が、悪性腫瘍または転移性腫瘍過程、好ましくは、黒色腫、前立腺癌、肝癌、肺癌、乳癌または肉腫である、請求項9または10に記載の使用。

【請求項13】

陽電子放出断層撮影に使用するための医薬を製造するための請求項5に定義される式(I)に記載の化合物の使用。

【請求項14】

式 $\text{NH}_2 - \text{X} - \text{Y} - \text{Z}$ 、 $\text{OH} - \text{X} - \text{Y} - \text{Z}$ または $\text{SH} - \text{X} - \text{Y} - \text{Z}$ （ここで、X、YおよびZは請求項1～5のいずれか1項に定義される通りである）の化合物を、葉酸と反応させる、請求項1～5のいずれか1項に定義される式(I)に記載の化合物の製造方法。