

【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5月31日(2007.5.31)

【公表番号】特表2006-519810(P2006-519810A)

【公表日】平成18年8月31日(2006.8.31)

【年通号数】公開・登録公報2006-034

【出願番号】特願2006-504641(P2006-504641)

【国際特許分類】

C 0 7 F 5/02 (2006.01)

C 0 7 D 487/22 (2006.01)

A 6 1 K 31/555 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 41/00 (2006.01)

C 0 7 B 59/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 F 5/02 C S P E

C 0 7 D 487/22

A 6 1 K 31/555

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 41/00

C 0 7 B 59/00

【手続補正書】

【提出日】平成19年4月9日(2007.4.9)

【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

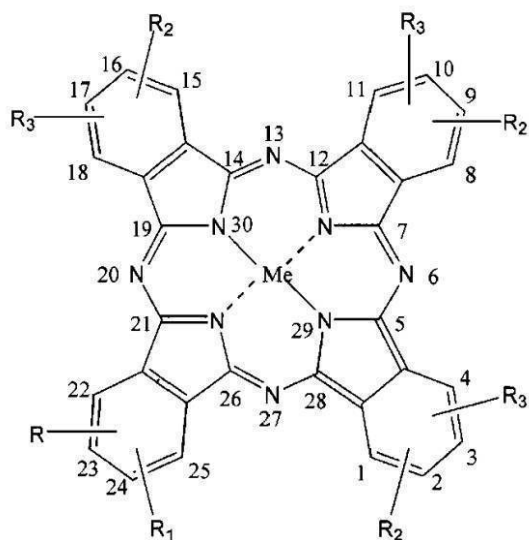
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記一般式(I)の化合物において、

【化1】



(I)

式 (I) 中、Me は、Zn、AlOR₄、及び Si(OR₄) からなる群から選択され、R₄ は、水素、及び C₁ ~ C₁₅ のアルキルからなる群から選択され；

R、R₁、R₂ 及び R₃ は、互いに独立に、水素、及び置換基 (G)_s - (X)_t - (Y - Z)_u からなる群から選択され；ここで

G は、O、S、SO、CH₂、及び N からなる群から選択され；

X は、フェニル、直鎖又は分岐の C₁ ~ C₁₀ のアルキル、C₁ ~ C₁₀ のアルケニル、及び C₁ ~ C₁₀ のアルキニルからなる群から選択され；

Y は、S、(CH₂)_n、フェニル、O - (CH₂)_n、(CH₂)_n - O -、(CH₂CH₂O)_n、CONH、NHCO、COO、COS、及び 3 -メルカプトピロリジン - 2, 5 - ジオンからなる群から選択され；

Z は、¹¹B - (o, m, p - カルボラン)、¹¹B - ウンデカヒドロドデカボロメルカプチル、¹¹B - ウンデカヒドロドデカボレート、¹⁰B - (o, m, p - カルボラン)、¹⁰B - ウンデカヒドロドデカボロメルカプチル、及び ¹⁰B - ウンデカヒドロドデカボレートからなる群から選択され；

n は、1 ~ 10 の整数であり；

s は、0 又は 1 であり；

t は、0 又は 1 であり；

u は、1 ~ 3 の整数であり；但し、

R、R₁、R₂ 及び R₃ の少なくとも 1 つが水素と異なり、また R、R₁、R₂ 及び R₃ の 1 つのみが水素と異なる場合、u は、1 と異なる；

ことを特徴とする、上記化合物及び

その薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2】

前記 R₁ 及び R₂ は、水素であり、

前記 R 及び R₃ は、水素ではなく、且つ互いに異なることを特徴とする請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

前記 Me は、Znであることを特徴とする請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

前記 G は、O であり、

前記 X は、フェニルであり、

前記 Y は、CH₂であることを特徴とする請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

1, 8 (11), 15 (18), 22 (25) - テトラキス - { [4 - (¹¹B - o - カルボラン - 1 - イル) メチル] フェノキシ } - 亜鉛フタロシアニネート (II)；

2, 9 (10), 16 (17), 23 (24) - テトラキス - { [4 - (¹¹B - o - カルボラン - 1 - イル) メチル] フェノキシ } - 亜鉛フタロシアニネート (II)；

1, 8 (11), 15 (18), 22 (25) - テトラキス - { [4 - (¹⁰B - o - カルボラン - 1 - イル) メチル] フェノキシ } - 亜鉛フタロシアニネート (II)；

2, 9 (10), 16 (17), 23 (24) - テトラキス - { [3, 5 - ビス - (¹¹B - o - カルボラン - 1 - イル) メチル] フェノキシ } - 亜鉛フタロシアニネート (II)；

1, 8 (11), 15 (18), 22 (25) - テトラキス - { [3, 5 - ビス - (¹¹B - o - カルボラン - 1 - イル) メチル] フェノキシ } - 亜鉛フタロシアニネート (II)；

1, 8 (11), 15 (18), 22 (25) - テトラキス - { [3, 5 - ビス - (¹⁰B - o - カルボラン - 1 - イル) メチル] フェノキシ } - 亜鉛フタロシアニネート (II)；

2, 9 (10), 16 (17), 23 (24) - テトラキス - { [3, 5 - ビス - (¹

⁰B - o - カルボラン - 1 - イル)メチル]フェノキシ} - 亜鉛フタロシアニネート (I I) ;

2, 3, 9, 10, 16, 17, 23, 24 - オクタキス - { [4 - (^{1 1}B - o - カルボラン - 1 - イル)メチル]フェノキシ} - 亜鉛フタロシアニネート (I I) ;

2, 3, 9, 10, 16, 17, 23, 24 - オクタキス - { [4 - (^{1 0}B - o - カルボラン - 1 - イル)メチル]フェノキシ} - 亜鉛フタロシアニネート (I I) ;

2, 9 (10), 16 (17), 23 (24) - テトラキス - { [4 - (^{1 0}B - o - カルボラン - 1 - イル)メチル]フェノキシ} - 亜鉛フタロシアニネート (I I) ;

2 - { 3, 5 - [ビス - (^{1 1}B - o - カルボラン - 1 - イル)メチル]フェノキシ} - 亜鉛フタロシアニネート (I I) ;

2 - { 3, 5 - [ビス - (^{1 0}B - o - カルボラン - 1 - イル)メチル]フェノキシ} - 亜鉛フタロシアニネート (I I) ;

1 - { 3, 5 - [ビス - (^{1 1}B - o - カルボラン - 1 - イル)メチル]フェノキシ} - 亜鉛フタロシアニネート (I I) ;

1 - { 3, 5 - [ビス - (^{1 0}B - o - カルボラン - 1 - イル)メチル]フェノキシ} - 亜鉛フタロシアニネート (I I) ;

2, 3 - ビス - { [4 - (^{1 1}B - o - カルボラン - 1 - イル)メチル]フェノキシ} - 亜鉛フタロシアニネート (I I) ;

2, 3 - ビス - { [4 - (^{1 0}B - o - カルボラン - 1 - イル)メチル]フェノキシ} - 亜鉛フタロシアニネート (I I) ;

2 - { 2, 4, 6 - [トリス (^{1 1}B - o - カルボラン - 1 - イル)メチル]フェノキシ} - 亜鉛フタロシアニネート (I I) ;

2 - { 2, 4, 6 - [トリス (^{1 0}B - o - カルボラン - 1 - イル)メチル]フェノキシ} - 亜鉛フタロシアニネート (I I) ;

1 - { 2, 4, 6 - [トリス (^{1 1}B - o - カルボラン - 1 - イル)メチル]フェノキシ} - 亜鉛フタロシアニネート (I I) ; 及び

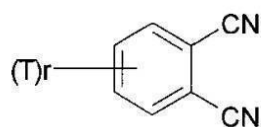
1 - { 2, 4, 6 - [トリス (^{1 0}B - o - カルボラン - 1 - イル)メチル]フェノキシ} - 亜鉛フタロシアニネート (I I) ;

から選択されることを特徴とする請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

一般式 (I I)

【化 2】



(II)

の化合物であって、

T は、置換基 (G)_s - (X)_t - (Y - Z)_u であり、G、X、Y、Z、s、t 及び u は、請求項 1 に記載の通りであり、r は、1 又は 2 であることを特徴とする化合物。

【請求項 7】

3 - { 4 - [(^{1 1}B - o - カルボラン - 1 - イル)メチル]フェノキシ}フタロニトリル ;

4 - { 4 - [(^{1 1}B - o - カルボラン - 1 - イル)メチル]フェノキシ}フタロニトリル ;

3 - { 4 - [(^{1 0}B - o - カルボラン - 1 - イル)メチル]フェノキシ}フタロニトリル ;

3 - { 3, 5 - [ビス - (^{1 1}B - o - カルボラン - 1 - イル)メチル]フェノキシ}

フタロニトリル；

4 - { 3 , 5 - [ビス - (^{11}B - o - カルボラン - 1 - イル) メチル] フェノキシ }
フタロニトリル；

3 - { 3 , 5 - [ビス - (^{10}B - o - カルボラン - 1 - イル) メチル] フェノキシ }
フタロニトリル；

4 - { 3 , 5 - [ビス - (^{10}B - o - カルボラン - 1 - イル) メチル] フェノキシ }
フタロニトリル；

4 - { 2 , 4 , 6 - [トリス (^{11}B - o - カルボラン - 1 - イル) メチル] フェノキシ }
フタロニトリル；

3 - { 2 , 4 , 6 - [トリス (^{11}B - o - カルボラン - 1 - イル) メチル] フェノキシ }
フタロニトリル；

4 - { 2 , 4 , 6 - [トリス (^{10}B - o - カルボラン - 1 - イル) メチル] フェノキシ }
フタロニトリル；

3 - { 2 , 4 , 6 - [トリス (^{10}B - o - カルボラン - 1 - イル) メチル] フェノキシ }
フタロニトリル；

4 , 5 - ビス - { 4 - [(^{11}B - o - カルボラン - 1 - イル) メチル] フェノキシ }
フタロニトリル；

4 , 5 - ビス - { 4 - [(^{10}B - o - カルボラン - 1 - イル) メチル] フェノキシ }
フタロニトリル；及び

4 - { 4 - [(^{10}B - o - カルボラン - 1 - イル) メチル] フェノキシ } フタロニトリル；

から選択されることを特徴とする請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

請求項 1 に記載の一般式 (I) の化合物の調製方法であって、

単独又はジシアノベンゼン存在下で、可能であれば、フタロシアニン核に金属を導入するのに適した反応剤の存在下、一般式 (I) の化合物を得るように、請求項 6 に記載の一般式 (I I) の機能化された化合物の 4 置換化を行う工程を有することを特徴とする方法。

【請求項 9】

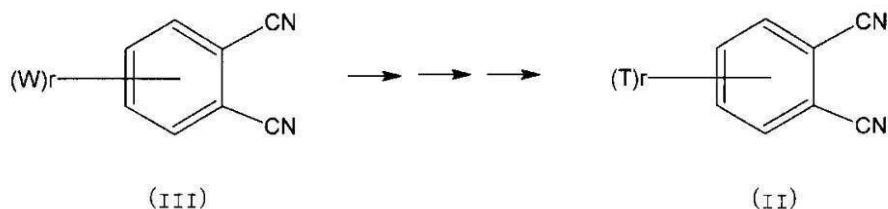
請求項 1 に記載の一般式 (I) の化合物の調製方法であって、

カップリング反応により、1 乃至 8 の機能性置換基を含む前もって機能化された金属 - フタロシアニンに、ホウ素鎖を導入する工程を有することを特徴とする方法。

【請求項 10】

請求項 6 に記載の一般式 (I I) の化合物の調製方法であって、下記一般式 (I I I)

【化 3】



の化合物を適切なホウ素クラスター誘導体と反応させて前記置換基 (W)_r を前記置換基 (T)_r で置き換える工程を有し、

T 及び r は、請求項 6 に定義した通りであり、

W は、NO₂、NH₂、Cl、Br、I、OH、及び (G)_s - (X)_t - (P)_u からなる群から選択され、G、X、s、t 及び u は、請求項 1 に定義した通りであり、P は、Br、Cl、I、C≡CH、CHO、COOH、NH₂、OH、メタンスルフォニルオキシ、トシルオキシ、及び Y からなる群から選択され、Y は、請求項 1 に定義した通りであることを特徴とする方法。

【請求項 11】

3 - [4 - (メタンスルフォニルメチル)フェノキシ]フタロニトリル；

4 - [4 - (メタンスルフォニルメチル)フェノキシ]フタロニトリル；

3 - [4 - (プロモメチル)フェノキシ]フタロニトリル；

4 - [4 - (プロモメチル)フェノキシ]フタロニトリル；

3 - [3, 5 - ビス - (プロモメチル)フェノキシ]フタロニトリル；及び

4 - [3, 5 - ビス - (プロモメチル)フェノキシ]フタロニトリル；

から選択されることを特徴とする請求項 10 に記載の一般式 (I I I) の化合物。

【請求項 12】

腫瘍、前癌状態及び細胞の過剰増殖を特徴とする病態の処置用の薬学的組成物であって、

活性本体として請求項 1 乃至 5 のいずれか一項に記載の一般式 (I) の化合物を少なくとも有し、或いは、その混合物であり、可能であれば、薬学的に許容可能な賦形剤及び/又は希釈剤を有することを特徴とする薬学的組成物。

【請求項 13】

光動態的治療を行う薬学的組成物の調製のための、請求項 1 乃至 5 のいずれか一項に記載の一般式 (I) の化合物の使用。

【請求項 14】

ホウ素中性子捕獲療法を行う薬学的組成物の調製のための、請求項 1 乃至 5 のいずれか一項に記載の一般式 (I) の化合物の使用。

【請求項 15】

光動態的治療とホウ素中性子捕獲療法とを連続して行う薬学的組成物の調製のための、請求項 1 乃至 5 のいずれか一項に記載の一般式 (I) の化合物の使用。

【請求項 16】

腫瘍、前癌状態及び細胞の過剰増殖を特徴とする病態の処置用の薬学的組成物の調製のための、請求項 13 乃至 15 のいずれか一項に記載の一般式 (I) の化合物の使用。

【請求項 17】

請求項 1 乃至 5 のいずれか一項に記載の一般式 (I) の化合物を活性本体として有し、可能であれば、薬学的許容可能なキャリアと組み合わせたことを特徴とする診断剤。

【請求項 18】

i n v i t r oでの診断用の、請求項 1 乃至 5 のいずれか一項に記載の一般式 (I) の化合物の使用。