

【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26年10月2日 (2014.10.2)

【公表番号】特表2013-532664(P2013-532664A)

【公表日】平成25年8月19日 (2013.8.19)

【年通号数】公開・登録公報2013-044

【出願番号】特願2013-520904(P2013-520904)

【国際特許分類】

C 07 D 491/22 (2006.01)

A 61 K 31/409 (2006.01)

A 61 K 41/00 (2006.01)

A 61 K 45/00 (2006.01)

A 61 K 9/127 (2006.01)

A 61 K 38/00 (2006.01)

A 61 K 39/395 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 17/00 (2006.01)

A 61 P 31/12 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 K 49/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 491/22 C S P

A 61 K 31/409

A 61 K 41/00

A 61 K 45/00

A 61 K 9/127

A 61 K 37/02

A 61 K 39/395 A

A 61 K 39/395 H

A 61 P 35/00

A 61 P 19/02

A 61 P 17/00

A 61 P 31/12

A 61 P 31/04

A 61 P 27/02

A 61 K 49/00 A

【手続補正書】

【提出日】平成26年8月1日 (2014.8.1)

【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

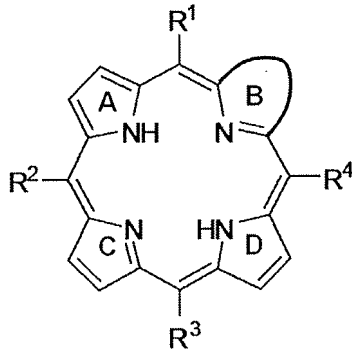
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

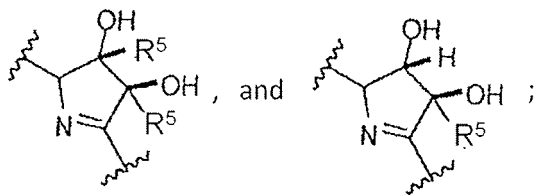
式

【化 1】



を含むテトラピロール化合物であり、
式中、B が、

【化 2】



からなる群から選択され、

式中、R 1、R 2、R 3 及び R 4 が、水素、1 ~ 15 個の炭素原子からなる置換されたアルキル基、1 ~ 15 個の炭素原子からなる非置換のアルキル基、1 ~ 15 個の炭素原子からなる置換されたフルオロアルキル基、1 ~ 15 個の炭素原子からなる非置換のフルオロアルキル基、置換された芳香族環および非置換の芳香族環からなる群から選択され、

式中、R 5 が、1 ~ 15 個の炭素原子からなる置換されたアルキル、1 ~ 15 個の炭素原子からなる非置換のアルキル、1 ~ 15 個の炭素原子からなる置換されたアルケニル、1 ~ 15 個の炭素原子からなる非置換のアルケニル、1 ~ 15 個の炭素原子からなる置換されたアルキニル、1 ~ 15 個の炭素原子からなる非置換のアルキニル、1 ~ 15 個の炭素原子からなる置換されたフルオロアルキル基、1 ~ 15 個の炭素原子からなる非置換のフルオロアルキル基、置換された芳香族環および非置換の芳香族環からなる群から選択される、テトラピロール化合物。

【請求項 2】

式中、前記 R 1、R 2、R 3 及び R 4 の芳香族環が、フェニル環、並びに 1 つ以上の置換基 X を有するフェニル環からなる群から選択され、

式中、前記 R 5 の芳香族環が、フェニル環および 1 つ以上の置換基 X を有するフェニル環からなる群から選択され、

前記フェニル環の前記置換基 X が、オルト - 、メタ - 又はパラ - 位のいずれかにあり、

式中、前記置換基 X は、OH、- COOH、- NH₂、- CF₃、- F、- COOY、- NHY、- OY、- NH - Z - COOH、及び - CO - Z - NH₂ からなる群から選択され、

式中、前記置換基 X の前記置換基 Y が、n = 1 ~ 30 で (CH₂CH₂O)_n 部分を含むポリエチレングリコール残基であり、

式中、前記置換基 X の前記置換基 Z が、ペプチド及びオリゴペプチドの群から選択される、請求項 1 に記載のテトラピロール化合物。

【請求項 3】

式中、R 5 の前記芳香族環が、1 つ以上の CF₃ - 基で置換されたフェニル環であり、

式中、前記 CF₃ - 基が、オルト - 、メタ - 又はパラ - 位のいずれかにある、請求項 1

または 2 に記載のテトラピロール化合物。

【請求項 4】

式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 が、4 ～ 15 個の炭素原子からなる置換されたアルキル基、4 ～ 15 個の炭素原子からなる非置換のアルキル基、4 ～ 15 個の炭素原子からなる置換されたフルオロアルキル基、4 ～ 15 個の炭素原子からなる非置換のフルオロアルキル基、および 1 つ以上の置換基 X を有するフェニル環からなる群から選択され、

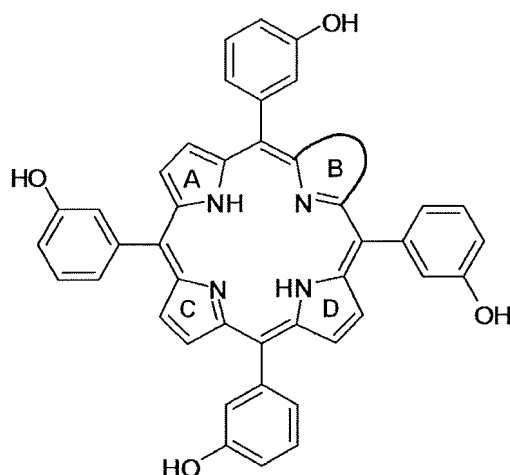
式中、前記置換基 X が、メタ - 又はパラ - 位のいずれかにあり、

式中、前記置換基 X が、 OH 、 $-COOH$ 、 $-NH_2$ からなる群から選択される、請求項 3 に記載のテトラピロール化合物。

【請求項 5】

式

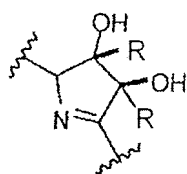
【化 3】



に特定のに基づき、

式中、 B が、

【化 4】



であり、

式中、 R が、1 ～ 15 個の炭素原子からなる置換されたアルキル、1 ～ 15 個の炭素原子からなる非置換のアルキル、1 ～ 15 個の炭素原子からなる置換されたアルケニル、1 ～ 15 個の炭素原子からなる非置換のアルケニル、1 ～ 15 個の炭素原子からなる置換されたアルキニル、1 ～ 15 個の炭素原子からなる非置換のアルキニル、1 ～ 15 個の炭素原子からなる置換されたフルオロアルキル基、1 ～ 15 個の炭素原子からなる非置換のフルオロアルキル基、フェニル環、並びに 1 つ以上の置換基 X を有するフェニル環からなる群から選択され、

式中、前記置換基 X が、オルト - 、メタ - 又はパラ - 位のいずれかにあり、

前記置換基 X が、 OH 、 $-COOH$ 、 $-NH_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-F$ 、 $-COOY$ 、 $-NHY$ 、 $-OY$ 、 $-NH-Z-COOH$ 、及び $-CO-Z-NH_2$ からなる群から選択され、

式中、前記置換基 X の前記置換基 Y が、 $n = 1 \sim 30$ で $(CH_2CH_2O)_n$ 部分を含

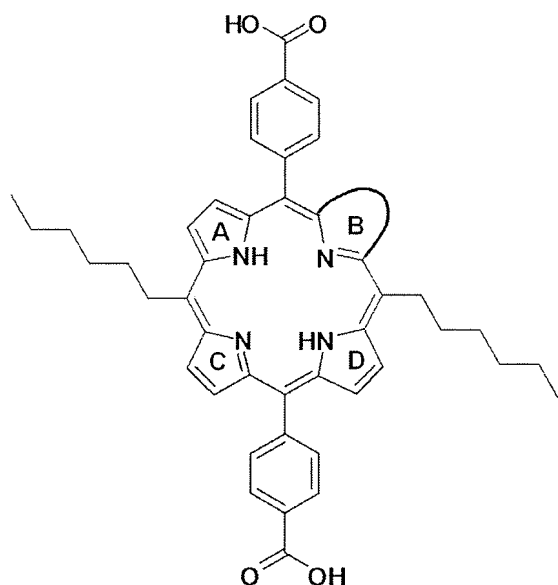
有するポリエチレングリコール残基、及び炭水化物部分からなる群から選択され、
 式中、前記置換基 X の前記置換基 Z が、ペプチド及びオリゴペプチドの群から選択される、

請求項 1 に記載のテトラピロール化合物。

【請求項 6】

式

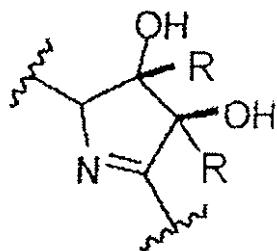
【化 5】



に特定のに基づき、

式中、B が、

【化 6】



であり、

式中、R が、1 ～ 15 個の炭素原子からなる置換されたアルキル、1 ～ 15 個の炭素原子からなる非置換のアルキル、1 ～ 15 個の炭素原子からなる置換されたアルケニル、1 ～ 15 個の炭素原子からなる非置換のアルケニル、1 ～ 15 個の炭素原子からなる置換されたアルキニル、1 ～ 15 個の炭素原子からなる非置換のアルキニル、1 ～ 15 個の炭素原子からなる置換されたフルオロアルキル基、1 ～ 15 個の炭素原子からなる非置換のフルオロアルキル基、フェニル環、並びに 1 つ以上の置換基 X を有するフェニル環からなる群から選択され、

式中、前記置換基 X が、オルト - 、メタ - 又はパラ - 位のいずれかにあり、

前記置換基 X が、OH、-COOH、-NH₂、-CF₃、-F、-COOY、-NHY

、 $-OY$ 、 $-NH-Z-COOH$ 、及び $-CO-Z-NH_2$ からなる群から選択され、

式中、前記置換基 X の前記置換基 Y が、 $n = 1 \sim 30$ で $(CH_2CH_2O)_n$ 部分を含むポリエチレングリコール残基、及び炭水化物部分からなる群から選択され、

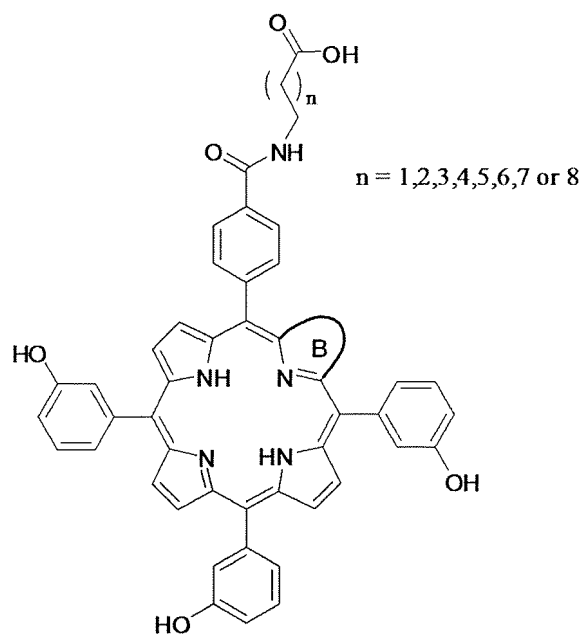
式中、前記置換基 X の前記置換基 Z が、ペプチド及びオリゴペプチドの群から選択される、

請求項 1 に記載のテトラピロール化合物。

【請求項 7】

式

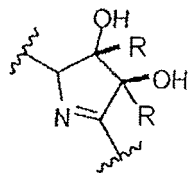
【化 7】



に特異的に基づき、

式中、 B が、

【化 8】



であり、

式中、 R が、1 ~ 15 個の炭素原子からなる置換されたアルキル、1 ~ 15 個の炭素原子からなる非置換のアルキル、1 ~ 15 個の炭素原子からなる置換されたアルケニル、1 ~ 15 個の炭素原子からなる非置換のアルケニル、1 ~ 15 個の炭素原子からなる置換されたアルキニル、1 ~ 15 個の炭素原子からなる非置換のアルキニル、1 ~ 15 個の炭素原子からなる置換されたフルオロアルキル基、1 ~ 15 個の炭素原子からなる非置換のフルオロアルキル基、フェニル環、並びに 1 つ以上の置換基 X を有するフェニル環からなる群から選択され、

式中、前記置換基 X が、オルト - 、メタ - 又はパラ - 位のいずれかにあり、

前記置換基 X が、OH、-COOH、-NH₂、-CF₃、-F、-COOY、-NHY、-OY、-NH-Z-COOH、及び-CO-Z-NH₂ からなる群から選択され、

式中、前記置換基 X の前記置換基 Y が、n = 1 ~ 30 で (CH₂CH₂O)_n 部分を含むポリエチレングリコール残基、及び炭水化物部分からなる群から選択され、

式中、前記置換基 X の前記置換基 Z が、ペプチド及びオリゴペプチドの群から選択される、

請求項 1 に記載のテトラピロール化合物。

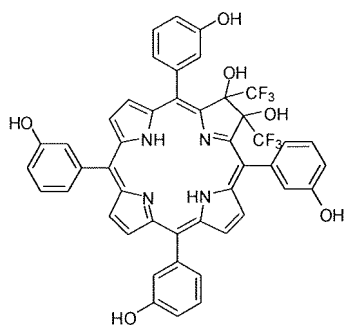
【請求項 8】

式中、R の前記フェニル環が、1 つ以上の CF₃-基で置換されたフェニル環からなる群から選択され、式中、前記 CF₃-基が、オルト-、メタ-又はパラ-位のいずれかにある、請求項 5 ~ 7 のいずれか 1 項に記載のテトラピロール化合物。

【請求項 9】

式

【化 9】

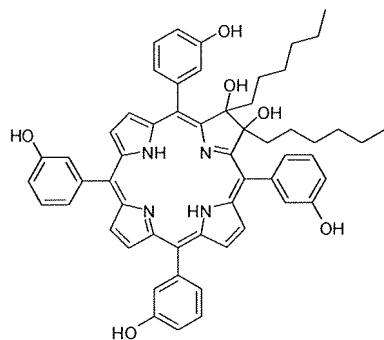


に特定のに基づく化合物か、又はその薬学的に許容可能な誘導体である、請求項 1 に記載のテトラピロール化合物。

【請求項 10】

式

【化 10】

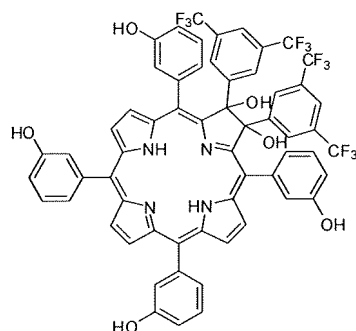


に特定のに基づく化合物か、又はその薬学的に許容可能な誘導体である、請求項 1 に記載のテトラピロール化合物。

【請求項 11】

式

【化 1 1】



に特定のに基づく化合物か、又はその薬学的に許容可能な誘導体である、請求項 1 に記載のテトラピロール化合物。

【請求項 1 2】

請求項 1 ~ 1 1 のいずれか 1 項に記載の化合物、又はその薬学的に許容可能な誘導体を活性成分として含む医薬組成物。

【請求項 1 3】

前記化合物又は前記その薬学的に許容可能な誘導体が、標的化薬剤に結合される、請求項 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

前記標的化薬剤が、抗体、抗体の断片及びペプチドからなる群から選択される、請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

前記医薬組成物が、リポソーム製剤である、請求項 1 2 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

前記活性成分が、従来型リポソーム、ペグ化リポソーム、ナノエマルジョン、ナノ結晶、ナノ粒子、脂肪エマルジョン、脂質製剤、自己微小乳化薬剤送達システム、 α -フェータンパク質 (AFP)、ウシ血清アルブミン (BSA)、ポリ(乳酸-コグリコール酸) (PLGA)、脂肪エマルジョン及び有機ナノ粒子、及び非有機ナノ粒子からなる群から選択される担体中に製剤化される、請求項 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

請求項 1 2 ~ 1 6 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物、又はその薬学的に許容可能な誘導体であって、光力学療法治療に使用され、かつ/または腫瘍、皮膚疾患、ウイルス感染症、細菌感染症、眼科疾患、泌尿器疾患、関節炎及び炎症性疾患からなる群から選択される疾患の治療に使用されることを特徴とする医薬組成物、又はその薬学的に許容可能な誘導体。