

【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 2 年 6 月 18 日 (2020.6.18)

【公表番号】特表 2018-515498 (P2018-515498A)

【公表日】平成 30 年 6 月 14 日 (2018.6.14)

【年通号数】公開・登録公報 2018-022

【出願番号】特願 2017-557940 (P2017-557940)

【国際特許分類】

C 07 D 487/22 (2006.01)

A 61 K 31/409 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 19/00 (2006.01)

A 61 P 17/06 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 P 31/12 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

A 61 P 31/00 (2006.01)

A 61 P 33/02 (2006.01)

A 61 P 33/00 (2006.01)

A 61 P 33/14 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 17/00 (2006.01)

A 61 K 41/00 (2020.01)

A 61 K 49/06 (2006.01)

A 61 K 49/00 (2006.01)

A 61 Q 19/00 (2006.01)

A 61 Q 19/02 (2006.01)

A 61 Q 19/08 (2006.01)

A 61 K 8/49 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 487/22 C S P

A 61 K 31/409

A 61 P 35/00

A 61 P 19/00

A 61 P 17/06

A 61 P 27/02

A 61 P 31/12

A 61 P 31/04

A 61 P 31/00

A 61 P 33/02

A 61 P 33/00

A 61 P 33/14

A 61 P 9/00

A 61 P 9/10

A 61 P 17/00

A 61 K 41/00

A 61 K 49/06

A 61 K 49/00

A 6 1 Q 19/00
 A 6 1 Q 19/02
 A 6 1 Q 19/08
 A 6 1 K 8/49

【誤訳訂正書】

【提出日】 令和2年5月11日 (2020.5.11)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】 特許請求の範囲

【訂正対象項目名】 全文

【訂正方法】 変更

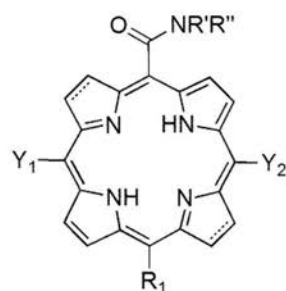
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式：

【化 1】



式(I)

のバクテリオクロリン誘導体若しくはクロリン誘導体であるカルボキサミドハロゲン化ポルフィリン誘導体、又はその薬学的に許容される塩：

(ここで、

【化 2】



は炭素と炭素の単結合又は炭素と炭素の二重結合を表し、但し、少なくとも一つの

【化 3】



は炭素と炭素の単結合を示し、

Y_1 、 Y_2 はそれぞれ独立して水素、炭素原子が六つ以下のハロゲン化アルキル若しくはハロゲン化シクロアルキル、又はハロゲン化フェニルから選択され、ここで、前記ハロゲンは独立して F、Cl 及び Br から選択され、但し、前記アルキル、前記シクロアルキル又は前記フェニルの少なくとも一つの位置はハロゲン化されており、但し、 Y_1 、 Y_2 の少なくとも一つは炭素原子が六つ以下のハロゲン化アルキル若しくはハロゲン化シクロアルキル、又はハロゲン化フェニルであり、ここで、前記ハロゲンは独立して F、Cl 及び Br から選択され、但し、前記アルキル、前記シクロアルキル、又は前記フェニルの少なくとも一つの位置はハロゲン化されており、

R_1 は H、I、Cl, Br 又は $-CONR'R''$ から選択され、

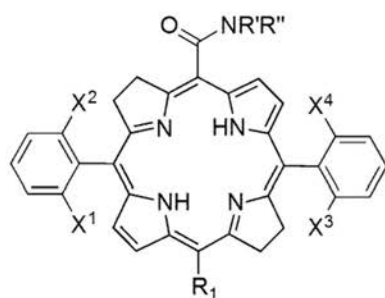
R' 及び R'' は独立して水素、炭素原子が六つ以下のアルキル、シクロプロピル、シクロ

ブチル、シクロペンチル、アルコール、第一級アミン、第二級アミン、第三級アミン、正電荷を帯びた第四級アミン、カルボン酸、エーテル又はエステルから選択される。)

【請求項 2】

式：

【化 4】



式 (II)

である請求項 1 に記載のカルボキサミドポルフィリン誘導体、又はその薬学的に許容される塩：

ここで、

X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 はそれぞれ独立してハロゲン (F、Cl、Br) 原子及び水素原子から選択され、但し、少なくとも X^1 及び X^3 はハロゲンであり、

R_1 は水素であり、

R' 及び R'' は独立して水素、炭素原子が三つ以下のアルキル、シクロプロピル、アルコール、第一級アミン、第二級アミン、第三級アミン、正電荷を帯びた第四級アミン、カルボン酸、エーテル又はエステルである。

【請求項 3】

式 (I I) において、

X^1 及び X^3 はフッ素原子であり、

X^2 及び X^4 は水素原子であり、

R_1 は水素であり、

R' 、 R'' は独立して水素、炭素原子が三つ以下のアルキルから選択される、請求項 2 に記載のカルボキサミドポルフィリン誘導体。

【請求項 4】

式 (I I) において、

X^1 、 X^2 、 X^3 及び X^4 はフッ素原子であり、

R_1 は水素であり、

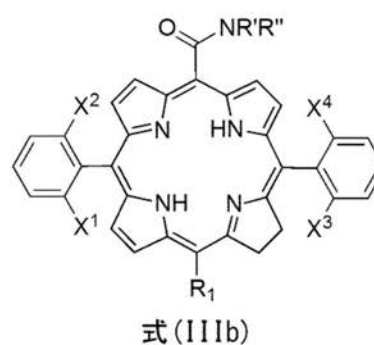
R' は水素であり、

R'' はメチルである、請求項 2 に記載のカルボキサミドポルフィリン誘導体。

【請求項 5】

前記クロリンは、式：

【化 5】



である、請求項 1 に記載のカルボキサミドポルフィリン誘導体：

ここで、 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 はそれぞれ独立してハロゲン（F、Cl、Br）原子及び水素原子から選択され、但し、少なくとも X^1 及び X^3 はハロゲンであり、

R_1 は水素であり、

R' 、 R'' は独立して水素、炭素原子が三つ以下のアルキル、シクロプロピル、アルコール、第一級アミン、第二級アミン、第三級アミン、正電荷を帯びた第四級アミン、カルボン酸、エーテル又はエステルから選択される。

【請求項 6】

式（IIIa）又は式（IIIb）において、

X^1 及び X^3 はフッ素原子であり、

X^2 及び X^4 は水素原子であり、

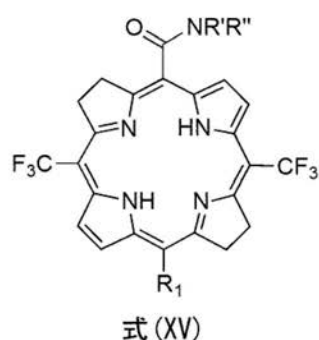
R_1 は水素であり、

R' 、 R'' は独立して水素、炭素原子が三つ以下のアルキルから選択される、請求項 5 に記載のカルボキサミドポルフィリン誘導体。

【請求項 7】

式：

【化 6】



である請求項 1 に記載のカルボキサミドポルフィリン誘導体、又はその薬学的に許容される塩：

ここで、

R_1 は H、Cl、Br 又は $-CONR'R''$ から選択され、

R' 及び R'' は独立して水素、炭素原子が六つ以下のアルキル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、アルコール、第一級アミン、第二級アミン、第三級アミン、正電荷を帯びた第四級アミン、カルボン酸、エーテル又はエステルから選択される。

【請求項 8】

式（XV）において、

R_1 は水素であり、

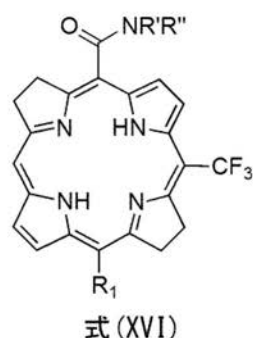
R' は水素であり、

R'' はメチルである、請求項 7 に記載のカルボキサミドポルフィリン誘導体。

【請求項 9】

式：

【化 7】



である請求項 1 に記載のカルボキサミドポルフィリン誘導体、又はその薬学的に許容された塩：

ここで、

R₁ は H、Cl、Br 又は -CONR'R'' から選択され、

R' 及び R'' は独立して水素、炭素原子が六つ以下のアルキル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、アルコール、第一級アミン、第二級アミン、第三級アミン、正電荷を帯びた第四級アミン、カルボン酸、エーテル又はエステルから選択される。

【請求項 10】

式 (XVI) において、

R₁ は水素であり、

R' は水素であり、

R'' はメチルである、請求項 9 に記載のカルボキサミドポルフィリン誘導体。

【請求項 11】

癌又は悪性腫瘍、骨髄腫、乾癬、黄斑変性を含むがそれに限定されない過剰増殖性疾患の治療における使用のための請求項 1 ～ 10 に記載のカルボキサミドポルフィリン誘導体。

【請求項 12】

ウイルス、バクテリア、リケッチア、マイコプラズマ、原生動物、菌類を含むがそれに限定されない微生物に起因する感染症、又は、一般に微視的な多細胞の無脊椎動物、若しくは非常に小さい多細胞の無脊椎動物を含むがそれに限定されない寄生体、又はその卵若しくは若年形に起因する感染症の治療に使用するための請求項 1 ～ 10 に記載のカルボキサミドポルフィリン誘導体。

【請求項 13】

狭窄症、アテローム斑、又は心臓の不整脈を含むがそれに限定されない循環器疾患の治療における使用のための請求項 1 ～ 10 に記載のカルボキサミドポルフィリン誘導体。

【請求項 14】

色素沈着過剰、皮膚のライトニング、皮膚のホワイトニング、ピーリングを含むがそれに限定されない皮膚の色素沈着症及び皮膚の再生の治療における化粧用途のための、請求項 1 ～ 10 のいずれか 1 項に記載のカルボキサミドポルフィリン誘導体。

【請求項 15】

請求項 1 ～ 10 のいずれか 1 項に記載の前記誘導体の少なくとも 1 種と、薬学的に許容されるキャリアとを含む医薬組成物。

【請求項 16】

前記キャリアは皮膚に一時的に浸透し、前記医薬組成物は様々な皮膚層を通して浸透可

能である、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

皮内治療及び経皮治療における使用のための請求項 1 5 又は 1 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

過剰増殖性異常及び／又は癌及び／又はバクテリア性感染及び／又はウイルス性感染及び／又は真菌性感染及び／又は循環器疾患及び／又は皮膚の色素沈着異常又は皮膚の若返り術における使用のための請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

過剰増殖性異常のセラノスティックにおける使用のためであって、ここで、標的組織と関連づけられている請求項 1 ～ 1 0 に記載の前記誘導体の少なくとも 1 種は画像処理技術によって視覚化されている、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 0】

画像処理技術は、請求項 1 ～ 1 0 に記載の前記誘導体を十分なエネルギーの光に暴露してそれと同じものを蛍光発光させる磁気共鳴画像処理（MRI）を含む、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 1】

画像処理技術は、請求項 1 ～ 8 に記載の前記誘導体をピコ秒又はナノ秒の持続期間、十分なエネルギーの光のパルスに暴露して、化合物に光音響波を放たせる、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

請求項 1 5 に記載の医薬組成物と、被験者に対する当該組成物の光線力学的治療／投与に関する指示とを含むキット。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 5 1

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 5 1】

本発明はまた、過剰増殖性異常のセラノスティックにおける上述した誘導体又はその薬学的に許容される塩の少なくとも 1 種を含む薬学的組成物の使用に関し、ここで、請求項 1 ～ 9 に記載の標的組織と関連する少なくとも 1 種の誘導体は、画像処理技術によって視覚化され、場合によって前記誘導体の照射によって標的組織内において所望の治療効果を引き出す。画像処理技術に磁気共鳴画像処理（MRI）が含まれる場合、式（I）の誘導体又はその薬学的に許容される塩に対し、それらが蛍光を発するのに十分なエネルギーの光を暴露するか、又は、式（I）の誘導体又はその薬学的に許容される塩に、ピコ秒又はナノ秒の期間、十分なエネルギーの光パルスを暴露することで、化合物に光音響波を発射させる。