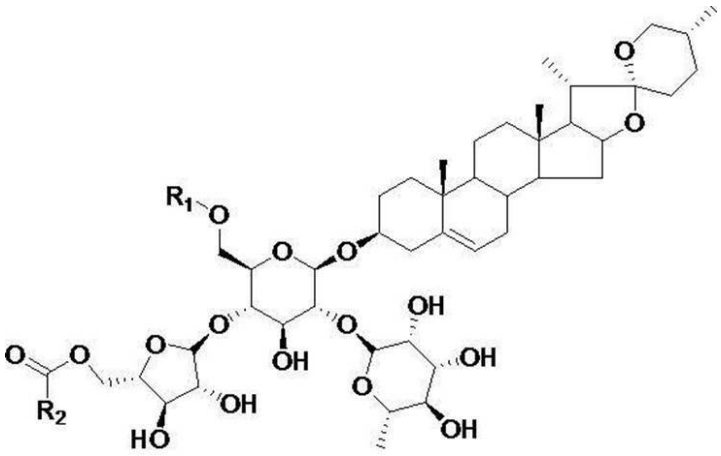
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成28年7月7日(2016.7.7)

【公表番号】特表2015-523349(P2015-523349A)
【公表日】平成27年8月13日(2015.8.13)
【年通号数】公開・登録公報2015-051
【出願番号】特願2015-516430(P2015-516430)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｊ　71/00　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/7048　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　35/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　35/02　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｊ　71/00　ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ　31/7048
Ａ６１Ｐ　35/00
Ａ６１Ｐ　35/02

【手続補正書】
【提出日】平成28年5月17日(2016.5.17)
【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に示される、５’－アシル化アラビノフラノシル基を有するポリフィリンＩ誘導体
【化１】



Ｉ

（式中、
R_1は、Ｈ、置換若しくは非置換のC_1－C_6アルキル、置換若しくは非置換のC_2－C_6アルケニル、置換若しくは非置換のC_3－C_7シクロアルキル、置換若しくは非置換のC_3－C_7シクロアルケニル、置換若しくは非置換のアリールC_1－C_6アルキル、置

換若しくは非置換のヘテロシクリル、置換若しくは非置換のヘテロアリール、置換若しくは非置換のC_1－C_6アルキルアシル、又は置換若しくは非置換のアリールアシルから選択され；

R_2は、H、置換若しくは非置換のC_1－C_6アルキル、置換若しくは非置換のC_2－C_6アルケニル、置換若しくは非置換のC_3－C_7シクロアルキル、置換若しくは非置換のC_3－C_7シクロアルケニル、置換若しくは非置換のアリール、置換若しくは非置換のヘテロシクリル、又は置換若しくは非置換のヘテロアリールから選択され；

前述の置換された基における置換基は、ハロゲン、アミノ、－NH_{2-n}（C_1－C_6アルキル）$_n$、－NH_{2-n}（C_3－C_7シクロアルキル）$_n$、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、トリフルオロメチル、C_1－C_6アルコキシ、チオール又はC_1－C_6アルキルチオから選択される１種又は２種以上であり；ｎは、１又は２から選択される整数である）；

又は薬学的に許容されるその付加物、錯体若しくは塩。

【請求項２】

R_1がＨである、請求項１に記載の５’－アシル化アラビノフラノシルを有するポリフィリンＩ誘導体又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項３】

R_2が、置換又は非置換のアリールであり、前記アリールがフェニルである、請求項１又は２に記載の５’－アシル化アラビノフラノシルを有するポリフィリンＩ誘導体又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項４】

R_2が、置換又は非置換のヘテロアリールであり、前記ヘテロアリールが、窒素、酸素又は硫黄ヘテロ原子を含有する５員又は６員の芳香族環ラジカルである、請求項１又は２に記載の５’－アシル化アラビノフラノシルを有するポリフィリンＩ誘導体又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項５】

ヘテロアリールが、フラニル、チエニル又はピリジルである、請求項４に記載の５’－アシル化アラビノフラノシルを有するポリフィリンＩ誘導体又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項６】

R_2が、置換若しくは非置換のC_1－C_6アルキル、置換若しくは非置換のC_2－C_6アルケニル、置換若しくは非置換のC_3－C_7シクロアルキル、置換若しくは非置換のC_3－C_7シクロアルケニルである、請求項１又は２に記載の５’－アシル化アラビノフラノシルを有するポリフィリンＩ誘導体又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項７】

R_2が、シクロプロピル又はメチルである、請求項６に記載の５’－アシル化アラビノフラノシルを有するポリフィリンＩ誘導体又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項８】

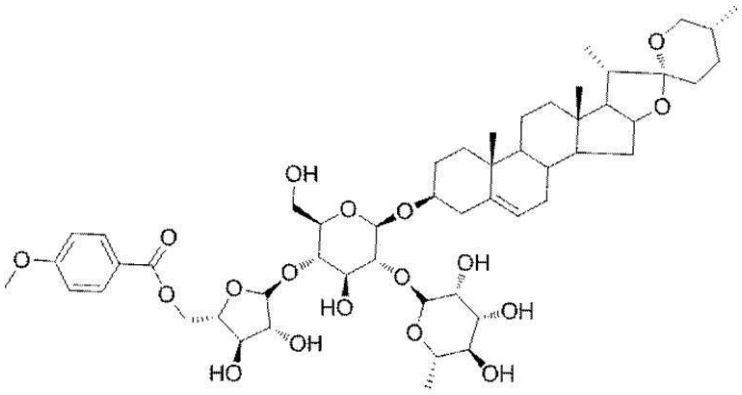
R_2が、ハロゲン、アミノ、－NH_{2-n}（C_1－C_6アルキル）$_n$、－NH_{2-n}（C_3－C_7シクロアルキル）$_n$、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、トリフルオロメチル、C_1－C_6アルコキシ、チオール又はC_1－C_6アルキルチオから選択される１種又は２種以上の置換基で置換されており、ｎが、１又は２から選択される整数である、請求項３～５のいずれかに記載の５’－アシル化アラビノフラノシルを有するポリフィリンＩ誘導体又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項９】

置換基が、フルオロ、クロロ、メトキシル、トリフルオロメチル又はジメチルアミノである、請求項８に記載の５’－アシル化アラビノフラノシルを有するポリフィリンＩ誘導体又は薬学的に許容されるその塩。

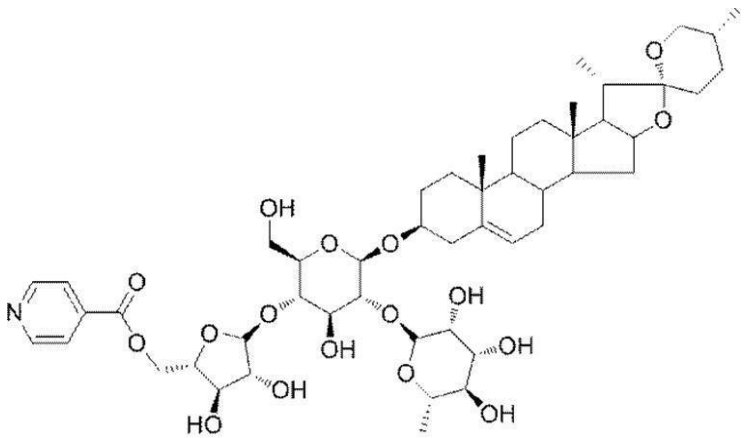
【請求項１０】

【化２】



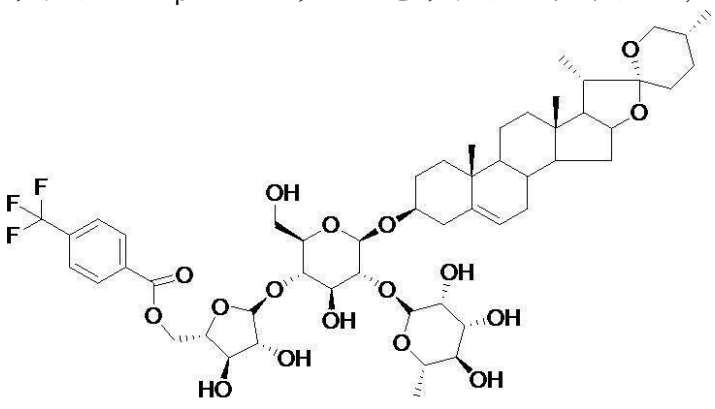
BS-PP-03

４－Ｏ－（５’－Ｏ－（４－メトキシベンゾイル）アラビノフラノシル－２－Ｏ－ラムノピラノシル－β－Ｄ－グルコピラノシルジオシン；



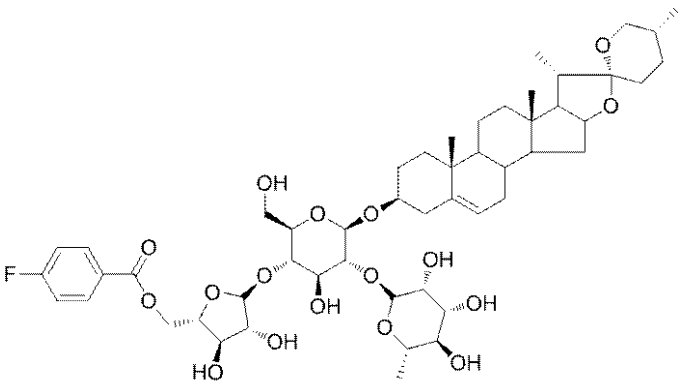
BS-PP-04

４－Ｏ－（５’－Ｏ－（４－ピリジンホルミル）アラビノフラノシル－２－Ｏ－ラムノピラノシル－β－Ｄ－グルコピラノシルジオシン；



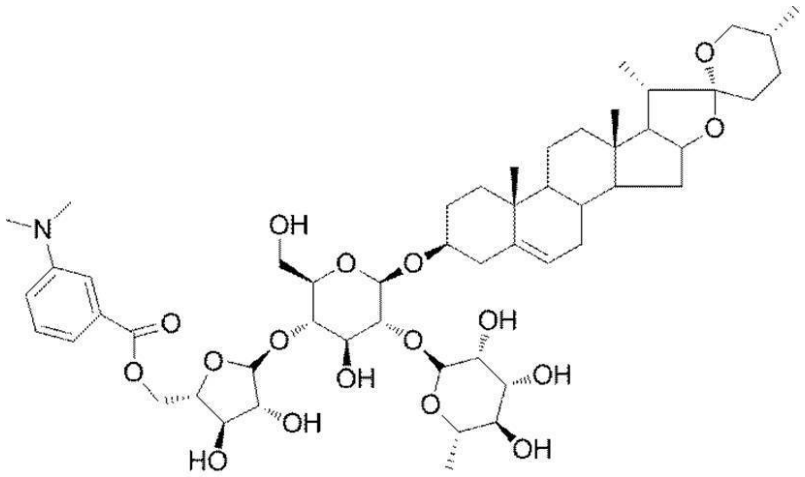
BS-PP-05

４－Ｏ－（５’－Ｏ－（４－トリフルオロメチルベンゾイル）アラビノフラノシル－２－Ｏ－ラムノピラノシル－β－Ｄ－グルコピラノシルジオシン；



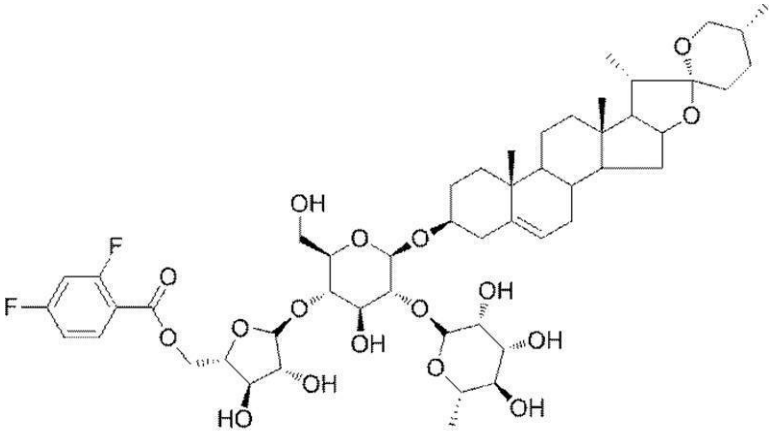
BS-PP-06

４－Ｏ－（５’－Ｏ－（４－フルオロベンゾイル）アラビノフラノシル－２－Ｏ－ラムノピラノシル－β－Ｄ－グルコピラノシルジオシン；



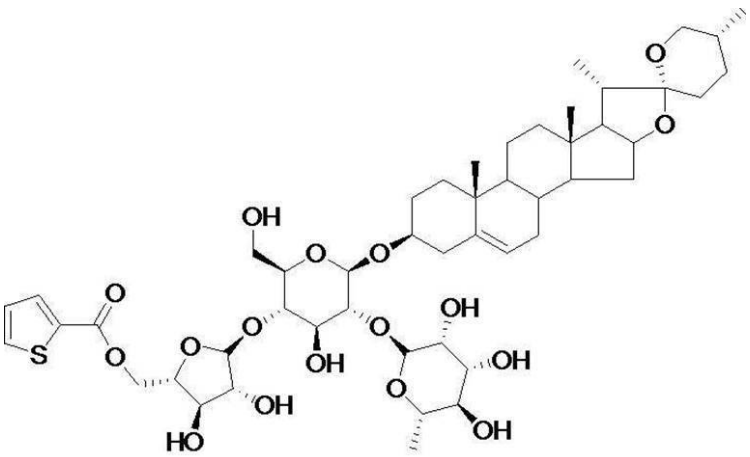
BS-PP-07

４－Ｏ－（５’－Ｏ－（４－ジメチルアミノベンゾイル）アラビノフラノシル－２－Ｏ－ラムノピラノシル－β－Ｄ－グルコピラノシルジオシン；



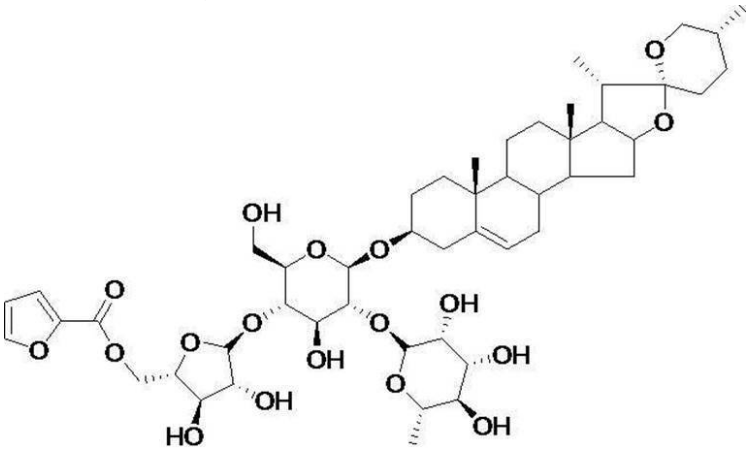
BS-PP-08

４－Ｏ－（５’－Ｏ－（２，４－ジフルオロベンゾイル）アラビノフラノシル－２－Ｏ－ラムノピラノシル－β－Ｄ－グルコピラノシルジオシン；



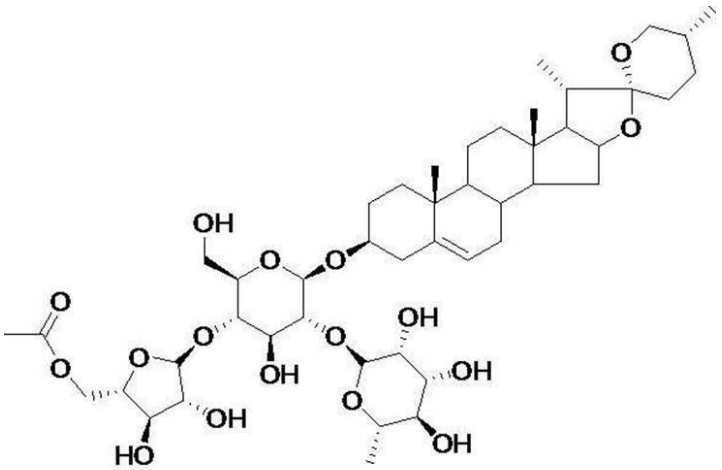
BS-PP-09

４－Ｏ－（５’－Ｏ－（２－チオフェンホルミル）アラビノフラノシル－２－Ｏ－ラムノピラノシル－β－Ｄ－グルコピラノシルジオシン；



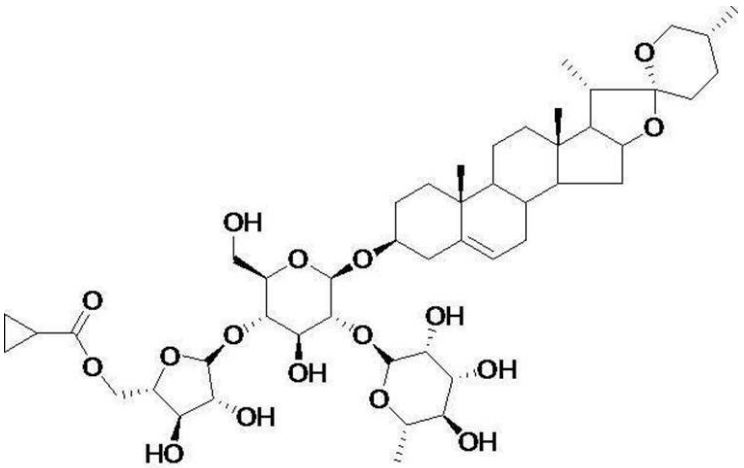
BS-PP-10

４－Ｏ－（５’－Ｏ－（２－フランホルミル）アラビノフラノシル－２－Ｏ－ラムノピラノシル－β－Ｄ－グルコピラノシルジオシン；



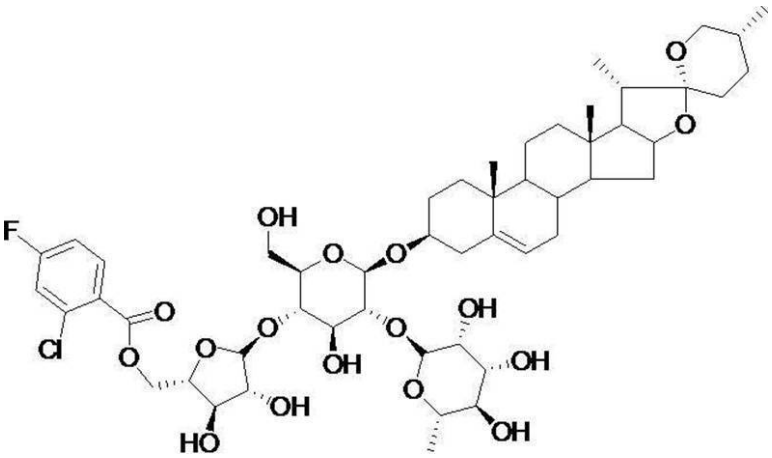
BS-PP-11

４－Ｏ－（５’－Ｏ－アセチル）アラビノフラノシル－２－Ｏ－ラムノピラノシル－β－Ｄ－グルコピラノシルジオシン；



BS-PP-12

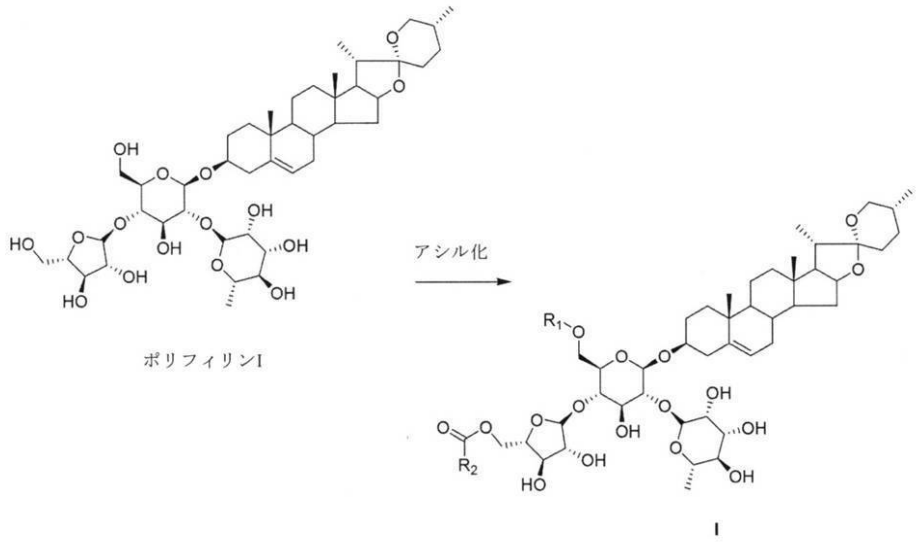
４－Ｏ－（５’－Ｏ－シクロプロピルホルミル）アラビノフラノシル－２－Ｏ－ラムノピラノシル－β－Ｄ－グルコピラノシルジオシン；及び



BS-PP-15

４－Ｏ－（５’－Ｏ－（２－クロロ－４－フルオロベンゾイル）アラビノフラノシル－２－Ｏ－ラムノピラノシル－β－Ｄ－グルコピラノシルジオシン
からなる群から選択される化合物である、請求項１に記載の５’－アシル化アラビノフラノシルを有するポリフィリンＩ誘導体又は薬学的に許容されるその塩。
【請求項１１】
請求項１～１０のいずれかに記載の式（Ｉ）の化合物を調製するための方法であって、

【化３】



縮合剤若しくは触媒の存在下でポリフィリンＩ及び対応する有機酸R_2CO_2Hを縮合エステル化させて、又は縮合剤若しくはアルカリ性試薬の存在下でポリフィリンＩ及び対応する有機アシル塩化物R_2COCl若しくは有機無水物$(R_2CO)_2O$を縮合エステル化させて、５’－アシル化アラビノフラノシルを有するポリフィリンＩ誘導体を生成することを含み、式（Ｉ）中のR_2、前記有機酸R_2CO_2H中のR_2、及び前記有機アシル塩化物R_2COCl中のR_2が、請求項１～１０のいずれかにより定義される、方法。

【請求項１２】

請求項１～１０のいずれかに記載の５’－アシル化アラビノフラノシルを有するポリフィリンＩ誘導体又は薬学的に許容されるその塩を含み、薬学的に許容される賦形剤を含んでもよい、医薬組成物。

【請求項１３】

抗腫瘍薬の製造における、請求項１～１０のいずれかに記載の５’－アシル化アラビノフラノシルを有するポリフィリンＩ誘導体又は薬学的に許容されるその塩の使用。

【請求項１４】

腫瘍が、白血病、多発性骨髄腫、リンパ腫、肝癌、胃癌、乳癌、胆管細胞癌腫、膵癌、肺癌、結腸直腸癌、骨肉腫、ヒト子宮頸癌、神経膠腫、上咽頭癌腫、咽頭癌腫、食道癌、中耳腫瘍、黒色腫及び前立腺癌から選択される、請求項１３に記載の使用。

【請求項１５】

請求項１～１０のいずれかに記載の５’－アシル化アラビノフラノシルを有するポリフィリンＩ誘導体又は薬学的に許容されるその塩を含む、腫瘍を患う対象の治療剤。

【請求項１６】

腫瘍が、白血病、多発性骨髄腫、リンパ腫、肝癌、胃癌、乳癌、胆管細胞癌腫、膵癌、肺癌、結腸直腸癌、骨肉腫、ヒト子宮頸癌、神経膠腫、上咽頭癌腫、咽頭癌腫、食道癌、中耳腫瘍、黒色腫及び前立腺癌から選択される、請求項１５に記載の治療剤。

【請求項１７】

抗腫瘍剤としての使用のための、請求項１～１０のいずれかに記載の５’－アシル化アラビノフラノシルを有するポリフィリンＩ誘導体又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項１８】

腫瘍が、白血病、多発性骨髄腫、リンパ腫、肝癌、胃癌、乳癌、胆管細胞癌腫、膵癌、肺癌、結腸直腸癌、骨肉腫、ヒト子宮頸癌、神経膠腫、上咽頭癌腫、咽頭癌腫、食道癌、中耳腫瘍、黒色腫及び前立腺癌から選択される、請求項１７に記載の５’－アシル化アラビノフラノシルを有するポリフィリンＩ誘導体又は薬学的に許容されるその塩。