

【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1月9日(2014.1.9)

【公表番号】特表2013-512221(P2013-512221A)

【公表日】平成25年4月11日(2013.4.11)

【年通号数】公開・登録公報2013-017

【出願番号】特願2012-540429(P2012-540429)

【国際特許分類】

C 0 7 D 323/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/357 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

C 0 7 D 493/20 (2006.01)

C 0 7 D 493/22 (2006.01)

C 0 7 D 493/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

G 0 1 N 33/15 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 323/00 C S P

A 6 1 K 31/357

A 6 1 K 45/00

C 0 7 D 493/20

C 0 7 D 493/22

C 0 7 D 493/10 G

A 6 1 K 47/22

G 0 1 N 33/15 Z

【手続補正書】

【提出日】平成25年11月12日(2013.11.12)

【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

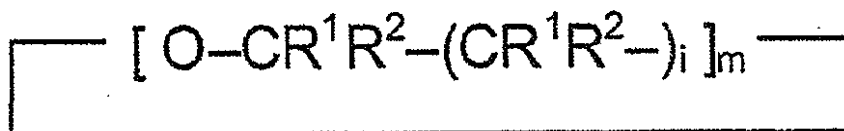
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) のクラウンエーテル。

【化 1】



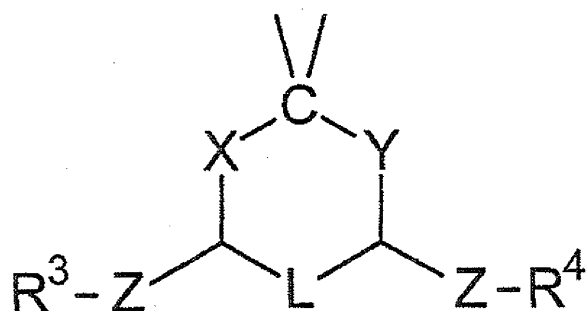
(式中、

m は、4、5、6、7 または 8 であり、各々の i は独立して、1 または 2 であり；
各々の R¹ および R² は、水素；直鎖状もしくは分枝状の、置換もしくは非置換の C₁ ~ C₁₀ アルキル、アルケニル および アルキニル；ならびに 10 個迄の原子で構成された環を有する置換もしくは非置換のアリールから独立して選択され；または R¹ および R² は、一緒になってオキソ基を形成し；

クラウンエーテル内の少なくとも 1 つの R¹、R² と、R¹ および R² が結合しかつ式 (I)

のエーテル酸素に直接結合している炭素とは、一緒になって、式 (I I)

【化 2】



の基を形成し、式中、

L は、存在しないか、または共有結合および $(C R^5 R^6)_n$ から選択されるリンカーであり、各々の R^5 および R^6 は、水素；直鎖状または分枝状の、置換または非置換の $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、アルケニルおよびアルキニル；ならびに 10 個迄の原子で構成された環を有する置換または非置換のアリールから独立して選択され、n は、1、2 または 3 であり；X および Y は、互いに独立して O および S から選択され；

各々の Z は、独立して、存在しないか、または電子吸引基であり；

各々の R^3 および R^4 は、独立して、水素；直鎖状または分枝状の、置換または非置換の $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、アルケニルおよびアルキニル；10 個迄の原子で構成された環を有する置換または非置換のアリール； $H(OCH_2CH_2)_k$ および $H(OCH_2CH_2)_kO$ から選択され、式中、k は、1 ~ 10 迄の整数であり；

置換基は、存在する場合、OH、 $O-CH_3$ およびハロゲンから選択される。）

【請求項 2】

クラウンエーテル内の少なくとも 1 つの R^1 および R^2 が、一緒になってオキソ基を形成する、請求項 1 に記載のクラウンエーテル。

【請求項 3】

前記クラウンエーテルの環構造が、18 - クラウン - 6、12 - クラウン - 4、13 - クラウン - 4、14 - クラウン - 4、15 - クラウン - 5、16 - クラウン - 5、17 - クラウン - 5、20 - クラウン - 6、21 - クラウン - 7 または 24 - クラウン - 8 により提供される、請求項 1 または 2 に記載のクラウンエーテル。

【請求項 4】

一つまたは二つのオキソ基が存在する、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載のクラウンエーテル。

【請求項 5】

環内のエーテル酸素原子の数が偶数であり、一つ置きのエーテル酸素原子に隣接して一つのオキソ基が存在する、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載のクラウンエーテル。

【請求項 6】

全ての R^1 および R^2 が、オキソ基または式 (I I) の基を形成しない範囲において水素である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載のクラウンエーテル。

【請求項 7】

(a) 一つの式 (I I) の基および二つのオキソ基が存在し；または
(b) 二つの式 (I I) の基および一つのオキソ基が存在し；または
(c) 三つの式 (I I) の基が存在し、オキソ基は存在しない、
請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載のクラウンエーテル。

【請求項 8】

(a) 一つの式 (I I) の基および二つのオキソ基が存在し、クラウンエーテルの環構造の一部である前記式 (I I) の基の炭素原子が、オキソ基を有する炭素原子に直接結合し；または

(b) 二つの式 (I I) の基が存在し、クラウンエーテルの環構造の一部である前記二つ

の式 (I I) の基の二つの炭素原子が、互いに結合している、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載のクラウンエーテル。

【請求項 9】

L が共有結合である、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載のクラウンエーテル。

【請求項 10】

(a) X および Y の両方が O、及び / 又は

(b) Z が - O - C (= O) - 、 - C (= O) - O - および - C (= O) - から選択される、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載のクラウンエーテル。

【請求項 11】

R³ および R⁴ が、水素、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピル、2 , 3 - ジヒドロキシ - プロピル、および H (O C H₂ C H₂)₅ - から独立して選択される、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載のクラウンエーテル。

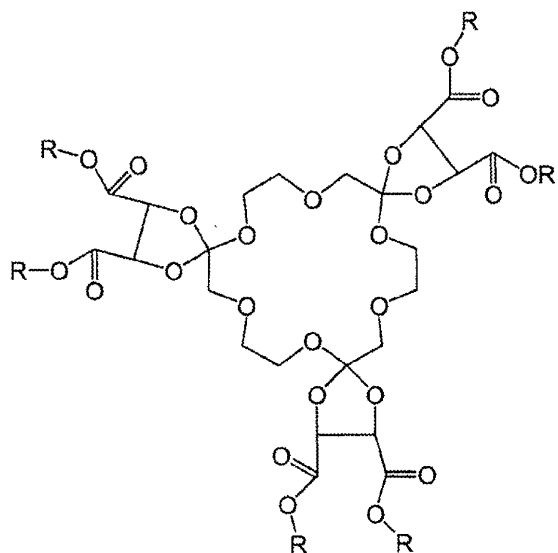
【請求項 12】

R³ - Z および独立して R⁴ - Z が、エチル - オキシ - カルボニル - 、2 , 3 - ジヒドロキシ - プロピル - オキシ - カルボニル - , および H (O C H₂ C H₂)₅ - O - C (= O) - から選択される、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載のクラウンエーテル。

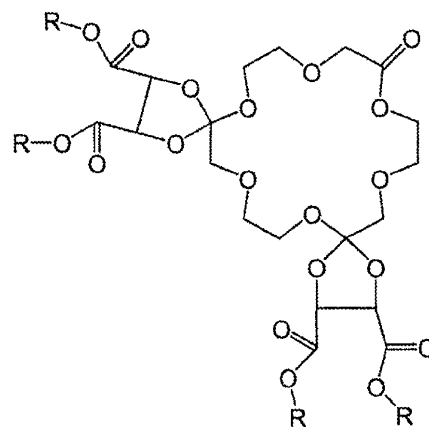
【請求項 13】

前記クラウンエーテルが、以下の式：

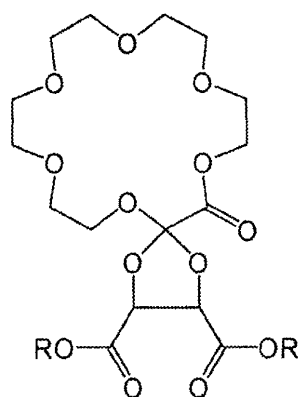
【化 3】



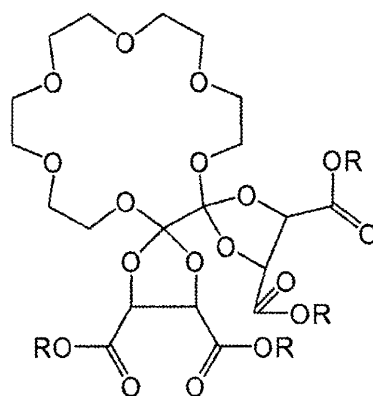
式(III)



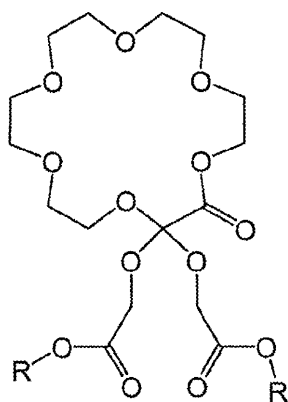
式(IV)



式(V)

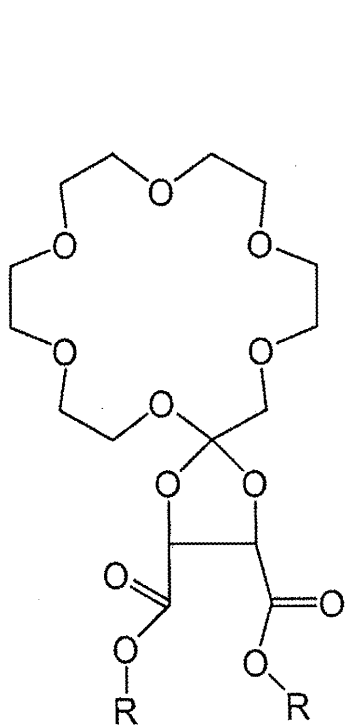


式(VI)

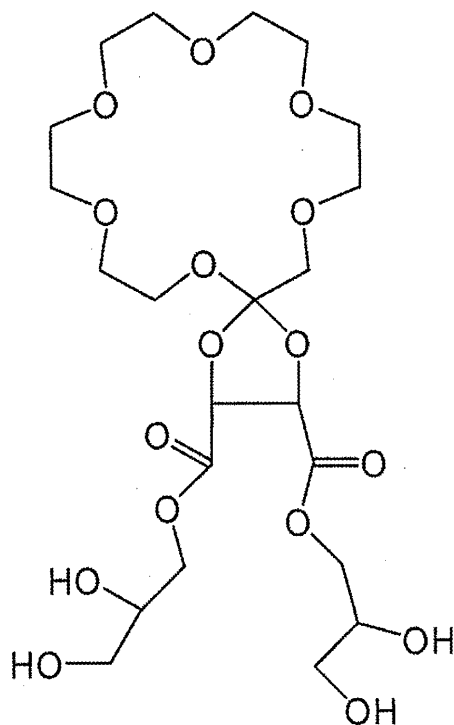


式(VII)

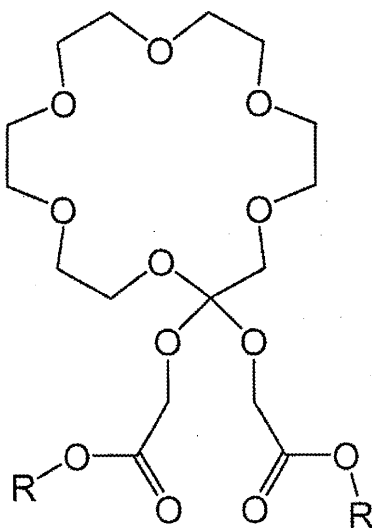
【化 4】



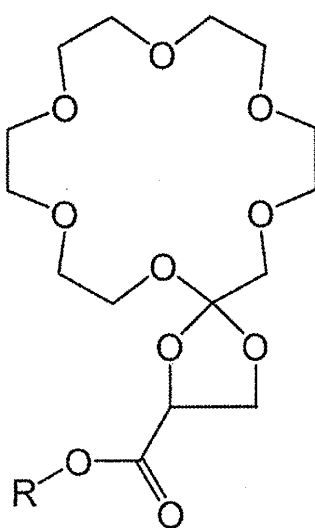
式(VIII)



式(IX)



式(X)



式(XI)

(式中、各々のRは、独立して、水素；直鎖状または分枝状の、置換または非置換の $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、アルケニルおよびアルキニル；10個迄の原子で構成された環を有する置換または非置換のアリール；ならびに $H(OCH_2CH_2)_k-$ (式中、 k は1～10の整数である)から選択され；置換基は、存在する場合、OHおよびハロゲンから選択される。)のうちの一つを有する、請求項1～12のいずれか一項に記載のクラウンエーテル。

【請求項14】

請求項1～13のいずれか一項に記載の一つ以上のクラウンエーテルと、医薬的または診断的活性薬剤とを含有する医薬または診断組成物であって、前記医薬的もしくは診断的活性薬剤が、一つ以上の第一級および/もしくは第二級プロトン化アミノ基ならびに/またはプロトン化グアニジニウム基を含み、ならびに/または前記医薬的もしくは診断的活

性薬剤が、金属イオンもしくはアンモニウムイオンとの塩である、医薬または診断組成物。

【請求項 15】

経皮および／または粘膜貫通送達用に調合されている、請求項 14 に記載の医薬または診断組成物。

【請求項 16】

前記活性薬剤が、ペプチド、ポリペプチド、タンパク質、小分子、単糖、多糖、および核酸、好ましくはRNAi剤からなる群から選択される、請求項 14 または 15 に記載の医薬 または診断組成物。