

【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 3 区分

【発行日】平成20年8月21日(2008.8.21)

【公表番号】特表2003-529632(P2003-529632A)

【公表日】平成15年10月7日(2003.10.7)

【出願番号】特願2001-552799(P2001-552799)

【国際特許分類】

C 0 9 B 23/00 (2006.01)

A 6 1 B 1/00 (2006.01)

A 6 1 K 51/00 (2006.01)

【F I】

C 0 9 B 23/00 L

A 6 1 B 1/00 3 0 0 D

A 6 1 K 49/02 Z

【手続補正書】

【提出日】平成20年5月20日(2008.5.20)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

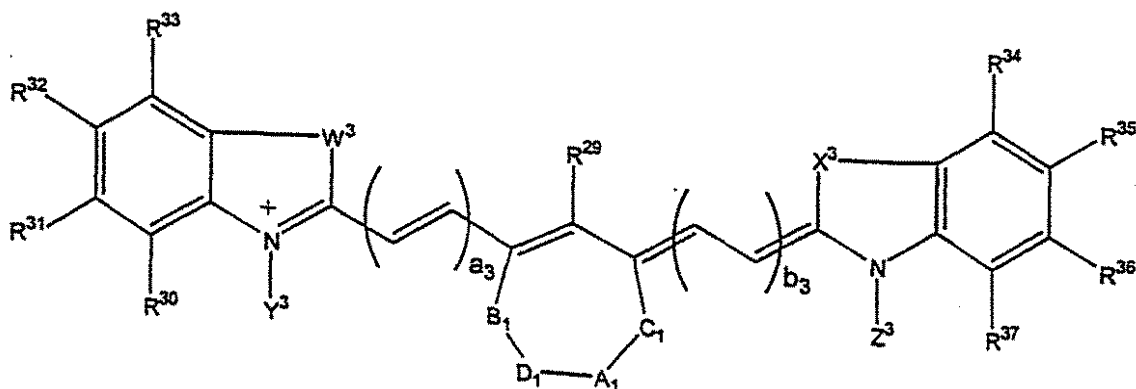
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 式

【化 1】



【式中、 W^3 および X^3 は、独立して $-CR^1R^2$ 、 $-O-$ 、 $-NR^3$ 、 $-S-$ または $-Se$ であり；

Y^3 は、 $-(CH_2)_a-CONH-Bm$ 、 $-CH_2-(CH_2OCH_2)_b-CH_2-CONH-Bm$ 、 $-(CH_2)_a-NHCO-Bm$ 、 $-CH_2-(CH_2OCH_2)_b-CH_2-NHCO-Bm$ 、 $-(CH_2)_a-N(R^3)-(CH_2)_b-CONH-Bm$ 、 $(CH_2)_a-N(R^3)-(CH_2)_c-NHCO-Bm$ 、 $-(CH_2)_a-N(R^3)-CH_2-(CH_2OCH_2)_b-CH_2-CONH-Bm$ 、 $-(CH_2)_a-N(R^3)-CH_2-(CH_2OCH_2)_b-CH_2-NHCO-Bm$ 、 $-CH_2-(CH_2OCH_2)_b-CH_2-N(R^3)-(CH_2)_a-CONH-Bm$ 、 $-CH_2-(CH_2OCH_2)_b-CH_2-N(R^3)-(CH_2)_a-NHCO-Bm$ 、 $-CH_2-(CH_2OCH_2)_b-CH_2-N(R^3)-CH_2-(CH_2OCH_2)_d-CONH-Bm$ 、 $-CH_2-(CH_2OCH_2)_b-CH_2-N$

$(R^3) - CH_2 - (CH_2 OCH_2)_d - NHCO - Bm$ 、 $-(CH_2)_a - NR^3 R^4$ または
 $-CH_2 (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 NR^3 R^4$ であり；

Z^3 は、 $-(CH_2)_a - CONH - Dm$ 、 $-CH_2 - (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 - CONH - Dm$ 、 $-(CH_2)_a - NHCO - Dm$ 、 $-CH_2 - (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 - NHCO - Dm$ 、 $-(CH_2)_a - N(R^3) - (CH_2)_b - CONH - Dm$ 、 $(CH_2)_a - N(R^3) - (CH_2)_c - NHCO - Dm$ 、 $-(CH_2)_a - N(R^3) - CH_2 - (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 - CONH - Dm$ 、 $-(CH_2)_a - N(R^3) - CH_2 - (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 - NHCO - Dm$ 、 $-CH_2 - (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 - N(R^3) - (CH_2)_a - CONH - Dm$ 、 $-CH_2 - (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 - N(R^3) - (CH_2)_a - NHCO - Dm$ 、 $-CH_2 - (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 - N(R^3) - CH_2 - (CH_2 OCH_2)_d - CONH - Dm$ 、 $-CH_2 - (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 - N(R^3) - CH_2 - (CH_2 OCH_2)_d - NHCO - Dm$ 、 $-(CH_2)_a - NR^3 R^4$ または
 $-CH_2 (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 NR^3 R^4$ であり；

A_1 は単結合または二重結合であり、 B_1 、 C_1 または D_1 は、独立して $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-Se-$ 、 $-P-$ 、 $-CR^1 R^2$ 、 $-CR^1$ 、アルキル、 $-NR^3$ または $-C=O$ であり；

A_1 、 B_1 、 C_1 および D_1 は、一緒になって 6 - ~ 12 - 員炭素環状環または所望により 1 個またはそれ以上の酸素、窒素または硫黄原子を含んでもよい 6 - ~ 12 - 員複素環状環を形成し得、 a_3 および b_3 は独立して 0 ~ 5 であり、 $R^1 \sim R^4$ および $R^{29} \sim R^{37}$ は、独立して水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_5 - C_{20}$ アリール、 $C_1 - C_{10}$ アルコキシル、 $C_1 - C_{10}$ ポリアルコキシアルキル、 $C_1 - C_{20}$ ポリヒドロキシアルキル、 $C_5 - C_{20}$ ポリヒドロキシアリール、 $C_1 - C_{10}$ アミノアルキル、シアノ、ニトロ、ハロゲン、サッカリド、ペプチド、 $-CH_2 (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 - OH$ 、 $-(CH_2)_a - CO_2 H$ 、 $-(CH_2)_a - CONH - Bm$ 、 $-CH_2 - (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 - CONH - Bm$ 、 $-(CH_2)_a - NHCO - Bm$ 、 $-CH_2 - (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 - NHCO - Bm$ 、 $-(CH_2)_a - OH$ または $-CH_2 - (CH_2 OCH_2)_b - CO_2 H$ であり；

各 Bm および Dm は、独立して生物活性ペプチド、タンパク質、細胞、抗体、抗体フラグメント、サッカリド、グリコペプチド、ペプチド擬似物質、薬剤、薬剤ミミック、ホルモン、金属キレート剤、放射性金属錯体または非放射性金属錯体、あるいはエコー源性剤であり；

a および c は、独立して 1 ~ 20 であり、そして
 b および d は独立して 1 ~ 100 の範囲で ある]
 で示される化合物。

【請求項 2】 W^3 および X^3 が、独立して $-C(CH_3)_2$ 、 $-C((CH_2)_a OH)CH_3$ 、 $-C((CH_2)_a OH)_2$ 、 $-C((CH_2)_a CO_2 H)CH_3$ 、 $-C((CH_2)_a CO_2 H)_2$ 、 $-C((CH_2)_a NH_2)CH_3$ 、 $C((CH_2)_a NH_2)_2$ 、 $C((CH_2)_a NR^3 R^4)_2$ 、 $-NR^3$ 、または $-S-$ であり；

Y^3 が、 $-(CH_2)_a - CONH - Bm$ 、 $-CH_2 - (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 - CONH - Bm$ 、 $-(CH_2)_a - NHCO - Bm$ 、 $-CH_2 - (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 - NHCO - Bm$ 、 $-(CH_2)_a - NR^3 R^4$ または $-CH_2 (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 NR^3 R^4$ であり；

Z^3 が、 $-(CH_2)_a - CONH - Dm$ 、 $-CH_2 - (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 - CONH - Dm$ 、 $-(CH_2)_a - NHCO - Dm$ 、 $-CH_2 - (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 - NHCO - Dm$ 、 $-(CH_2)_a - NR^3 R^4$ または $-CH_2 (CH_2 OCH_2)_b - CH_2 NR^3 R^4$ であり；

B_1 、 C_1 および D_1 が、独立して $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NR^3$ 、 $(CH_2)_a - CR^1 R^2$ 、または $-CR^1$ であり；

A_1 、 B_1 、 C_1 および D_1 が、一緒になって 6 - ~ 10 - 員炭素環状環または所望により 1 個またはそれ以上の酸素、窒素または硫黄原子を含んでもよい 6 - ~ 10 - 員

複素環状環を形成し得、

a_3 および b_3 が独立して 0 ~ 3 であり、

$R^1 \sim R^4$ および $R^{29} \sim R^{37}$ が、独立して水素、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_5 - C_{12}$ アリール、 $C_1 - C_{10}$ アルコキシル、 $C_1 - C_{10}$ ポリヒドロキシアルキル、 $C_5 - C_{12}$ ポリヒドロキシアリール、 $C_1 - C_{10}$ アミノアルキル、モノサッカリドまたはオリゴサッカリド、2 ~ 30 個のアミノ酸単位を有するペプチド、 $-CH_2(CH_2OCH_2)_b - CH_2 - OH$ 、 $-(CH_2)_a - CO_2H$ 、 $-(CH_2)_a - CONH - Bm$ 、 $-CH_2 - (CH_2OCH_2)_b - CH_2 - CONH - Bm$ 、 $-(CH_2)_a - NHCO - Bm$ 、 $-CH_2 - (CH_2OCH_2)_b - CH_2 - NHCO - Bm$ 、 $-(CH_2)_a - OH$ または $-CH_2 - (CH_2OCH_2)_b - CO_2H$ であり；

各 Bm および Dm が、独立して 2 ~ 30 個のアミノ酸単位を含む生物活性ペプチド、抗体、モノサッカリドまたはオリゴサッカリド、グリコペプチド、金属キレート剤、放射性金属錯体または非放射性金属錯体、あるいはエコー源性剤であり；

a および c が、独立して 1 ~ 10 であり、そして

b および d が独立して 1 ~ 30 である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】 W^3 および X^3 が各々 $C((CH_2)OH)_2$ であり、

Y^3 が $-(CH_2)_2 - CONH - Bm$ であり、

Z^3 が $-(CH_2)_2 - CONH - Dm$ であり、

A_1 が単結合であり、

A_1 、 B_1 、 C_1 および D_1 が一緒になって 6 員炭素環状環を形成し、

a_3 および b_3 が各々 1 であり、

R^{29} がガラクトースであり、

$R^{30} \sim R^{37}$ が各々水素であり、

Bm がオクトレオテートであり、

Dm がボンベシンである、

請求項 2 記載の化合物。

【請求項 4】 医学診断的処置において使用するための、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】 上記医学診断的処置が 350 - 1300 nm 領域の波長の光線を使用する、請求項 4 記載の化合物。

【請求項 6】 上記医学診断的処置が光学断層撮影法を含む、請求項 4 または 5 記載の化合物。

【請求項 7】 上記医学診断的処置が蛍光内視鏡検査法を含む、請求項 4 記載の化合物。

【請求項 8】 上記医学診断的処置がさらに蛍光、吸光度または光散乱により上記化合物の血液クリアランスプロフィールをモニターすることを含む、請求項 4 または 5 記載の化合物。

【請求項 9】 上記医学診断的処置がさらに造影を含み、上記造影が、吸収、光散乱、光音響または音蛍光技術を使用する、請求項 4 または 5 記載の化合物。

【請求項 10】 上記医学診断的処置が、アテローム硬化斑および血餅を診断するためのものである、請求項 4 または 5 記載の化合物。

【請求項 11】 医学診断的処置において使用するための組成物であって、

請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物；および

生物適合性有機溶媒であって、該組成物中の該生物適合性有機溶媒の濃度が、1 ~ 50 パーセント濃度である、生物適合性有機溶媒、
を含有する、組成物。

【請求項 12】 前記化合物が、1 ~ 50 パーセントのジメチルスルホキシドを含む媒質に溶けている、請求項 11 記載の組成物。