

【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29年3月30日(2017.3.30)

【公表番号】特表2016-512830(P2016-512830A)

【公表日】平成28年5月9日(2016.5.9)

【年通号数】公開・登録公報2016-027

【出願番号】特願2016-501535(P2016-501535)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/785	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	27/12	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 K	31/787	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/785	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	27/12	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 K	31/787	

【手続補正書】

【提出日】平成29年2月24日(2017.2.24)

【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

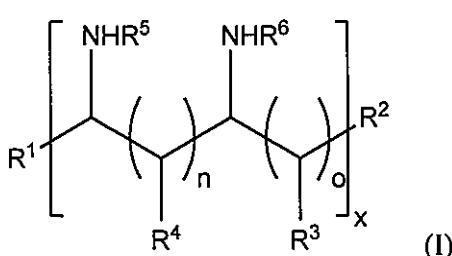
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの構造を含む化合物を含む医薬組成物：

【化1】



(式中：

nは0、1、または2であり；

○は0、1、または2であり；

×は2から25,000の整数であり；

R¹およびR²は、それぞれ独立に、医薬として許容される末端基、ポリマー、または-R^x-ポリマーであり、

ここでR^xは(C₁~C₁₀)アルキル、(C₂~C₉)ヘテロアルキル、(C₃~C₁₀)シクロアルキル、(C₂~C₉)ヘテロシクロアルキル、(C₆~C₁₄)アリール、(C₂~C₉)ヘテロアリール、(C₁~C₁₀)アルキルアミン、-O(O)C-(C₁~C₁₀)アルキル、(C₁~C₁₀)アルキル-COOH、(C₃~C₁₀)シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミド；から選択され、

R³およびR⁴はそれぞれ独立にH、ポリマー、または-R^x-ポリマーであり、ここでR^xは(C₁~C₁₀)アルキル、(C₂~C₉)ヘテロアルキル、(C₃~C₁₀)シクロアルキル、(C₂~C₉)ヘテロシクロアルキル、(C₆~C₁₄)アリール、(C₂~C₉)ヘテロアリール、(C₁~C₁₀)アルキルアミン、-O(O)C-(C₁~C₁₀)アルキル、(C₁~C₁₀)アルキル-COOH、(C₃~C₁₀)シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択され、

またはnが0の場合R⁴は不在であり、また○が0の場合R³は不在であり；

R⁵およびR⁶はそれぞれ独立にH、(C₁~C₁₀)アルキル、(C₂~C₉)ヘテロアルキル、(C₃~C₁₀)シクロアルキル、(C₂~C₉)ヘテロシクロアルキル、(C₆~C₁₄)アリール、(C₂~C₉)ヘテロアリール、(C₁~C₁₀)アルキルアミン、-O(O)C-(C₁~C₁₀)アルキル、(C₁~C₁₀)アルキル-COOH、(C₃~C₁₀)シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、-NH₂、-NH(C₁~C₁₀)アルキル、-N[(C₁~C₁₀)アルキル]₂であるかまたはR⁵およびR⁶はそれらが結合する窒素と一緒にになって6から20員環を形成する)。

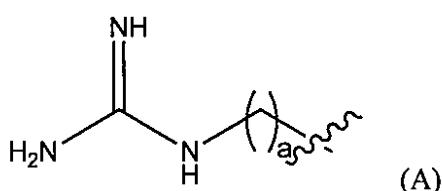
【請求項2】

R¹およびR²はそれぞれ独立に：

H、

(C₁~C₁₀)アルキル、(C₂~C₉)ヘテロアルキル、(C₃~C₁₀)シクロアルキル、(C₂~C₉)ヘテロシクロアルキル、(C₆~C₁₄)アリール、(C₂~C₉)ヘテロアリール、(C₁~C₁₀)アルキルアミン、-O(O)C-(C₁~C₁₀)アルキル、(C₁~C₁₀)アルキル-COOH、(C₃~C₁₀)シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミド、式(A)で表されるグアニジノ基

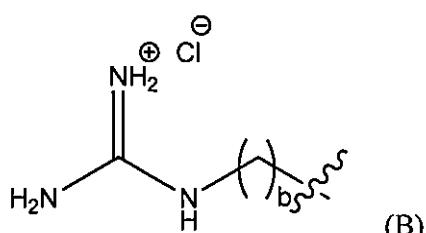
【化2】



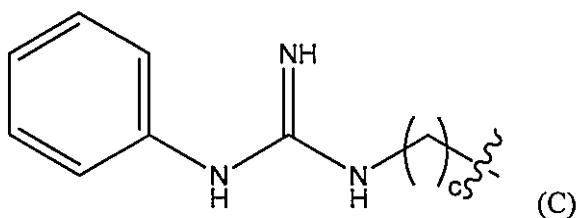
(式中aは0から25の整数)、

式(B)で表されるグアジニウムクロライド基

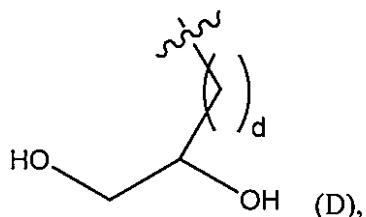
【化3】



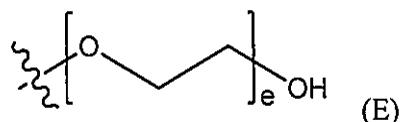
(式中 b は 0 から 25 の整数)、
式 (C) で表されるグアニジノベンゼン基
【化4】



(式中 c は 0 から 25 の整数)、
式 (D) で表されるジヒドロキシ基
【化5】



(式中 d は 0 から 25 の整数)、または
式 (E) で表されるポリエチレングリコール基
【化6】



(式中 e は 1 から 400 の整数)
から選択される基である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

n は 0 である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

n は 1 である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

n は 2 である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

o は 0 である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

o は 1 である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

o は 2 である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

n は 0 で o は 0 である。請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

n は 1 で o は 1 である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

化合物はポリマーである、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

ポリマーは架橋されている、請求項 1 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3】

ポリマーはエピクロロヒドリンで架橋されている、請求項 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

ポリマーはコポリマーである、請求項 1 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

コポリマーは架橋されている、請求項 1 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

コポリマーはエピクロロヒドリンで架橋されている、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

R¹ および R² はそれぞれ独立に H または (C₁ ~ C₁₀) アルキルである、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

R¹ および R² はそれぞれ独立に H または -CH₃ である、請求項 1 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

R₁ および R₂ はそれぞれ H である、請求項 1 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 0】

R³ および R⁴ はそれぞれ独立に H または (C₁ ~ C₁₀) アルキルである、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 1】

R³ および R⁴ は、それぞれ独立に H または -CH₃ である、請求項 2 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

R³ および R⁴ は H である、請求項 2 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

R⁵ および R⁶ はそれぞれ独立に H または (C₁ ~ C₁₀) アルキルである、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 4】

R⁵ および R⁶ は、それぞれ独立に H または -CH₃ である、請求項 2 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

R⁵ および R⁶ は H である、請求項 2 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

R⁵ および R⁶ は、それらが結合する窒素と一緒にになって 6 から 20 員環を形成する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 7】

R⁵ および R⁶ は、それらが結合する窒素と一緒にになって 14 員環を形成する、請求項 2 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 8】

n は 1 であり；

o は 1 であり；

R¹ および R² はそれぞれ独立に、医薬として許容される末端基であり；

R³ および R⁴ はそれぞれ H であり；

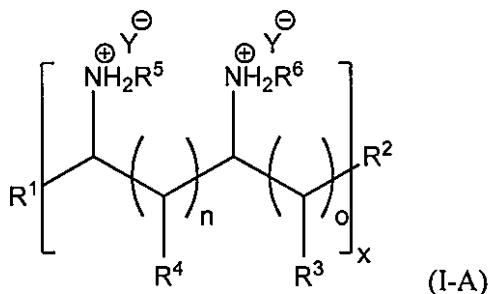
R⁵ および R⁶ はそれぞれ H である、

請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 9】

式 I - A の構造を含む化合物を含む医薬組成物：

【化7】



(式中：

nは0、1、または2であり；

oは0、1、または2であり；

xは2から25,000の整数であり；

Y⁻はそれぞれ独立に医薬として許容されるアニオンであり；R¹およびR²は、それぞれ独立に、医薬として許容される末端基、ポリマー、または-R^x-ポリマーであり、

ここでR^xは(C₁~C₁₀)アルキル、(C₂~C₉)ヘテロアルキル、(C₃~C₁₀)シクロアルキル、(C₂~C₉)ヘテロシクロアルキル、(C₆~C₁₄)アリール、(C₂~C₉)ヘテロアリール、(C₁~C₁₀)アルキルアミン、-O(O)C-(C₁~C₁₀)アルキル、(C₁~C₁₀)アルキル-COOH、(C₃~C₁₀)シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミド；から選択され、

R³およびR⁴はそれぞれ独立にH、ポリマー、または-R^x-ポリマーであり、

ここでR^xは(C₁~C₁₀)アルキル、(C₂~C₉)ヘテロアルキル、(C₃~C₁₀)シクロアルキル、(C₂~C₉)ヘテロシクロアルキル、(C₆~C₁₄)アリール、(C₂~C₉)ヘテロアリール、(C₁~C₁₀)アルキルアミン、-O(O)C-(C₁~C₁₀)アルキル、(C₁~C₁₀)アルキル-COOH、(C₃~C₁₀)シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミドから選択され、

またはnが0の場合R⁴は不在であり、またoが0の場合R³は不在であり；

R⁵およびR⁶はそれぞれ独立にH、(C₁~C₁₀)アルキル、(C₂~C₉)ヘテロアルキル、(C₃~C₁₀)シクロアルキル、(C₂~C₉)ヘテロシクロアルキル、(C₆~C₁₄)アリール、(C₂~C₉)ヘテロアリール、(C₁~C₁₀)アルキルアミン、-O(O)C-(C₁~C₁₀)アルキル、(C₁~C₁₀)アルキル-COOH、(C₃~C₁₀)シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、-NH₂、-NH(C₁~C₁₀)アルキル、-N[(C₁~C₁₀)アルキル]₂であるかまたはR⁵およびR⁶はそれらが結合する窒素と一緒にになって6から20員環を形成する)。

【請求項30】

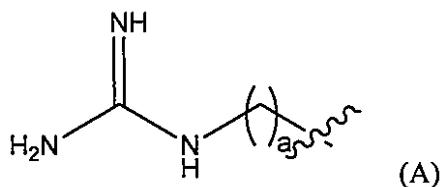
請求項29に記載の医薬組成物であって、

R¹およびR²はそれぞれ独立に：

H、

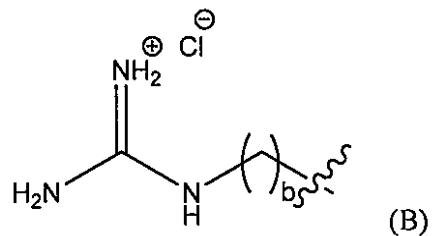
(C₁~C₁₀)アルキル、(C₂~C₉)ヘテロアルキル、(C₃~C₁₀)シクロアルキル、(C₂~C₉)ヘテロシクロアルキル、(C₆~C₁₄)アリール、(C₂~C₉)ヘテロアリール、(C₁~C₁₀)アルキルアミン、-O(O)C-(C₁~C₁₀)アルキル、(C₁~C₁₀)アルキル-COOH、(C₃~C₁₀)シクロアルキル-COOH、-(O)CH₃、-OH、アミド、式(A)で表されるグアニジノ基

【化 8】



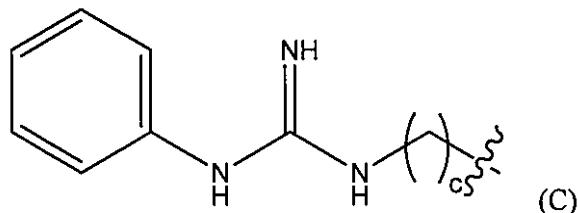
(式中 a は 0 から 2 5 の整数)、
式 (B) で表されるグアジニウムクロライド基

【化 9】



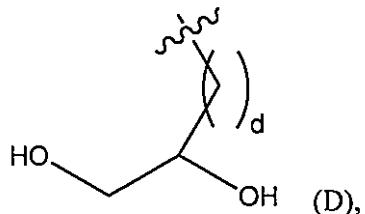
(式中 b は 0 から 2 5 の整数)、
式 (C) で表されるグアニジノベンゼン基

【化 10】



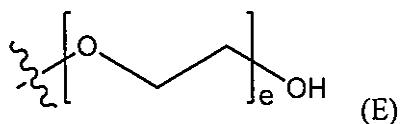
(式中 c は 0 から 2 5 の整数)、
式 (D) で表されるジヒドロキシ基

【化 11】



(式中 d は 0 から 2 5 の整数)、または
式 (E) で表されるポリエチレングリコール基

【化 12】



(式中 e は 1 から 4 0 0 の整数)
から選択される基である、請求項 2 9 に記載の前記医薬組成物。

【請求項 3 1】

Y⁻は独立に炭酸イオン、重炭酸イオンまたは塩素イオンである、請求項29に記載の医薬組成物。

【請求項32】

Y⁻は独立に炭酸イオンまたは重炭酸イオンである、請求項31に記載の医薬組成物。

【請求項33】

Y⁻は塩素イオンである、請求項31に記載の医薬組成物。

【請求項34】

nは0である、請求項29に記載の医薬組成物。

【請求項35】

nは1である、請求項29に記載の医薬組成物。

【請求項36】

nは2である、請求項29に記載の医薬組成物。

【請求項37】

oは0である、請求項29に記載の医薬組成物。

【請求項38】

oは1である、請求項29に記載の医薬組成物。

【請求項39】

oは2である、請求項29に記載の医薬組成物。

【請求項40】

nは0でoは0である、請求項29に記載の医薬組成物。

【請求項41】

nは1でoは1である、請求項29に記載の医薬組成物。

【請求項42】

化合物はポリマーである、請求項29に記載の医薬組成物。

【請求項43】

ポリマーは架橋されている、請求項42に記載の医薬組成物。

【請求項44】

ポリマーはエピクロロヒドリンで架橋されている、請求項43に記載の医薬組成物。

【請求項45】

ポリマーはコポリマーである、請求項42に記載の医薬組成物。

【請求項46】

コポリマーは架橋されている、請求項45に記載の医薬組成物。

【請求項47】

コポリマーはエピクロロヒドリンで架橋されている、請求項46に記載の医薬組成物。

【請求項48】

R¹およびR²はそれぞれ独立にHまたは(C₁~C₁₀)アルキルである、請求項29に記載の医薬組成物。

【請求項49】

R¹およびR²は、それぞれ独立にHまたは-CH₃である、請求項47に記載の医薬組成物。

【請求項50】

R¹およびR²はそれぞれHである、請求項49に記載の医薬組成物。

【請求項51】

R³およびR⁴はそれぞれ独立にHまたは(C₁~C₁₀)アルキルである、請求項29に記載の医薬組成物。

【請求項52】

R³およびR⁴は、それぞれ独立にHまたは-CH₃である、請求項51に記載の医薬組成物。

【請求項53】

R³およびR⁴はHである、請求項52に記載の医薬組成物。

【請求項 5 4】

R⁵ および R⁶ はそれぞれ独立に H または (C₁ ~ C₁₀) アルキルである、請求項 29 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 5】

R⁵ および R⁶ は、それぞれ独立に H または -CH₃ である、請求項 5 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 6】

R⁵ および R⁶ は H である、請求項 5 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 7】

R⁵ および R⁶ は、それらが結合する窒素と一緒にになって 6 から 20 員環を形成する、請求項 29 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 8】

R⁵ および R⁶ は、それらが結合する窒素と一緒にになって 14 員環を形成する、請求項 5 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 5 9】

n は 1 であり；

o は 1 であり；

R¹ および R² はそれぞれ独立に、医薬として許容される末端基であり；

R³ および R⁴ はそれぞれ独立に H である、

請求項 29 に記載の医薬組成物。

【請求項 6 0】

哺乳動物に請求項 1 に記載の医薬組成物を投与することを含む、哺乳動物において AGE 前駆体を結合する方法。

【請求項 6 1】

哺乳動物に請求項 1 に記載の医薬組成物を投与することを含む、哺乳動物において食物性ジカルボニルを結合する方法。

【請求項 6 2】

哺乳動物に請求項 29 に記載の医薬組成物を投与することを含む、哺乳動物において AGE 前駆体を結合する方法。

【請求項 6 3】

哺乳動物に請求項 29 に記載の医薬組成物を投与することを含む、哺乳動物において食物性ジカルボニルを結合する方法。