

【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

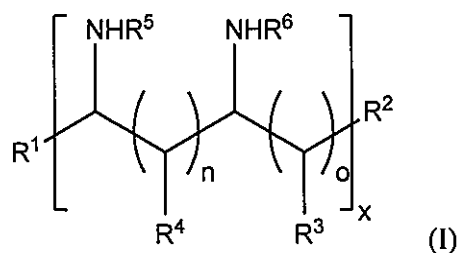
【補正の内容】

【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；

o は 0、1、または 2 であり；

x は 2 から 25，000 の整数であり；

R^1 および R^2 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 ($C_1 \sim C_{10}$) アルキル、($C_2 \sim C_9$) ヘテロアルキル、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル、($C_2 \sim C_9$) ヘテロシクロアルキル、($C_6 \sim C_{14}$) アリール、($C_2 \sim C_9$) ヘテロアリール、($C_1 \sim C_{10}$) アルキルアミン、- O(O)C - ($C_1 \sim C_{10}$) アルキル、($C_1 \sim C_{10}$) アルキル - COOH、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル - COOH、- (O)CH₃、- OH、アミド；から選択され、

R^3 および R^4 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 ($C_1 \sim C_{10}$) アルキル、($C_2 \sim C_9$) ヘテロアルキル、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル、($C_2 \sim C_9$) ヘテロシクロアルキル、($C_6 \sim C_{14}$) アリール、($C_2 \sim C_9$) ヘテロアリール、($C_1 \sim C_{10}$) アルキルアミン、- O(O)C - ($C_1 \sim C_{10}$) アルキル、($C_1 \sim C_{10}$) アルキル - COOH、($C_3 \sim C_{10}$) 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 R^4 は不在であり、また o が 0 の場合 R^3 は不在であり；

R^5 および R^6 はそれぞれ独立に H、($C_1 \sim C_{10}$) アルキル、($C_2 \sim C_9$) ヘテロアルキル、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル、($C_2 \sim C_9$) ヘテロシクロアルキル、($C_6 \sim C_{14}$) アリール、($C_2 \sim C_9$) ヘテロアリール、($C_1 \sim C_{10}$) アルキルアミン、- O(O)C - ($C_1 \sim C_{10}$) アルキル、($C_1 \sim C_{10}$) アルキル - COOH、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル - COOH、- (O)CH₃、- OH、- NH₂、- NH($C_1 \sim C_{10}$) アルキル、- N[($C_1 \sim C_{10}$) アルキル]₂ であるかまたは R^5 および R^6 はそれらが結合する窒素と一緒に 6 から 20 員環を形成する)。

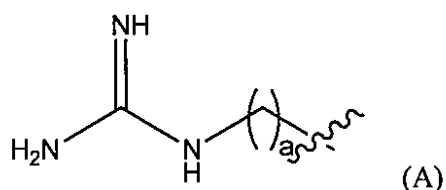
【請求項 2】

R^1 および R^2 はそれぞれ独立に：

H、

($C_1 \sim C_{10}$) アルキル、($C_2 \sim C_9$) ヘテロアルキル、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル、($C_2 \sim C_9$) ヘテロシクロアルキル、($C_6 \sim C_{14}$) アリール、($C_2 \sim C_9$) ヘテロアリール、($C_1 \sim C_{10}$) アルキルアミン、- O(O)C - ($C_1 \sim C_{10}$) アルキル、($C_1 \sim C_{10}$) アルキル - COOH、($C_3 \sim C_{10}$) 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

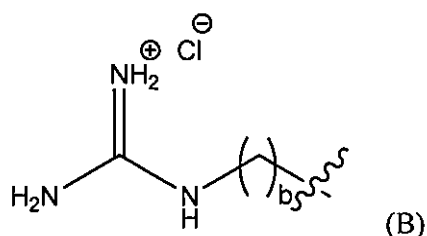
【化 2】



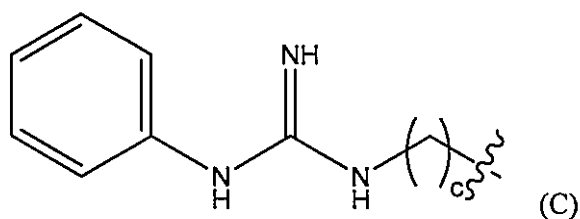
(式中 a は 0 から 25 の整数)、

式 (B) で表されるグアニニウムクロライド基

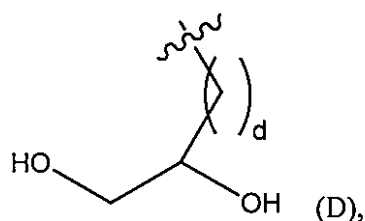
【化 3】



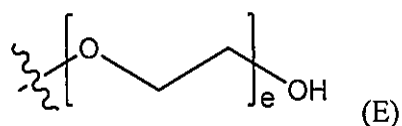
(式中 b は 0 から 25 の整数)、
式 (C) で表されるグアニジノベンゼン基
【化 4】



(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】

R^1 および R^2 はそれぞれ独立に H または ($C_1 \sim C_{10}$) 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】

R^1 および R^2 はそれぞれ独立に H または $-CH_3$ である、請求項 1 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

R_1 および R_2 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】

R^3 および R^4 はそれぞれ独立に H または ($C_1 \sim C_{10}$) 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】

R^3 および R^4 は、それぞれ独立に H または $-CH_3$ である、請求項 2 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

R^3 および R^4 は H である、請求項 2 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

R^5 および R^6 はそれぞれ独立に H または ($C_1 \sim C_{10}$) 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】

R^5 および R^6 は、それぞれ独立に H または $-CH_3$ である、請求項 2 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

R^5 および R^6 は H である、請求項 2 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

R^5 および R^6 は、それらが結合する窒素と一緒にあって 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】

R^5 および R^6 は、それらが結合する窒素と一緒にあって 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；

R^1 および R^2 はそれぞれ独立に、医薬として許容される末端基であり；

R^3 および R^4 はそれぞれ H であり；

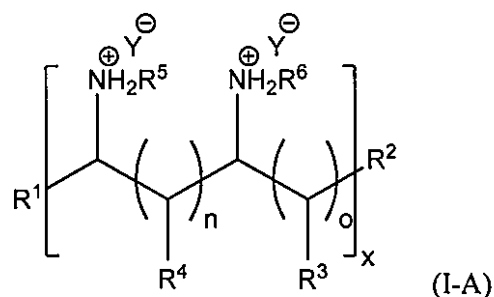
R^5 および R^6 はそれぞれ H である、

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；

R^1 および R^2 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 ($C_1 \sim C_{10}$) アルキル、($C_2 \sim C_9$) ヘテロアルキル、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル、($C_2 \sim C_9$) ヘテロシクロアルキル、($C_6 \sim C_{14}$) アリール、($C_2 \sim C_9$) ヘテロアリール、($C_1 \sim C_{10}$) アルキルアミン、- $O(O)C$ - ($C_1 \sim C_{10}$) アルキル、($C_1 \sim C_{10}$) アルキル - $COOH$ 、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル - $COOH$ 、- (O) CH_3 、- OH 、アミド；から選択され、

R^3 および R^4 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 ($C_1 \sim C_{10}$) アルキル、($C_2 \sim C_9$) ヘテロアルキル、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル、($C_2 \sim C_9$) ヘテロシクロアルキル、($C_6 \sim C_{14}$) アリール、($C_2 \sim C_9$) ヘテロアリール、($C_1 \sim C_{10}$) アルキルアミン、- $O(O)C$ - ($C_1 \sim C_{10}$) アルキル、($C_1 \sim C_{10}$) アルキル - $COOH$ 、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル - $COOH$ 、- (O) CH_3 、- OH 、アミドから選択され、

または n が 0 の場合 R^4 は不在であり、また o が 0 の場合 R^3 は不在であり；

R^5 および R^6 はそれぞれ独立に H 、($C_1 \sim C_{10}$) アルキル、($C_2 \sim C_9$) ヘテロアルキル、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル、($C_2 \sim C_9$) ヘテロシクロアルキル、($C_6 \sim C_{14}$) アリール、($C_2 \sim C_9$) ヘテロアリール、($C_1 \sim C_{10}$) アルキルアミン、- $O(O)C$ - ($C_1 \sim C_{10}$) アルキル、($C_1 \sim C_{10}$) アルキル - $COOH$ 、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル - $COOH$ 、- (O) CH_3 、- OH 、- NH_2 、- $NH(C_1 \sim C_{10})$ アルキル、- $N[(C_1 \sim C_{10})$ アルキル] $_2$ であるかまたは R^5 および R^6 はそれらが結合する窒素と一緒にあって 6 から 20 員環を形成する)。

【請求項 30】

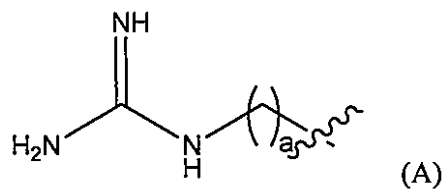
請求項 29 に記載の医薬組成物であって、

R^1 および R^2 はそれぞれ独立に：

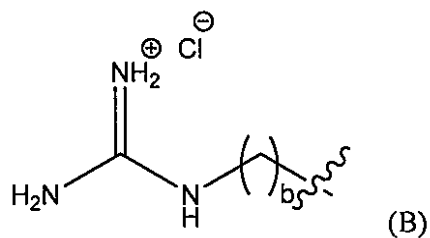
H 、

($C_1 \sim C_{10}$) アルキル、($C_2 \sim C_9$) ヘテロアルキル、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル、($C_2 \sim C_9$) ヘテロシクロアルキル、($C_6 \sim C_{14}$) アリール、($C_2 \sim C_9$) ヘテロアリール、($C_1 \sim C_{10}$) アルキルアミン、- $O(O)C$ - ($C_1 \sim C_{10}$) アルキル、($C_1 \sim C_{10}$) アルキル - $COOH$ 、($C_3 \sim C_{10}$) シクロアルキル - $COOH$ 、- (O) CH_3 、- OH 、アミド、式 (A) で表されるグアニジノ基

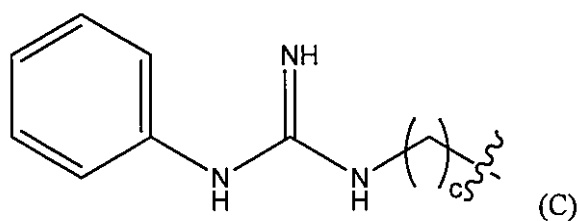
【化 8】



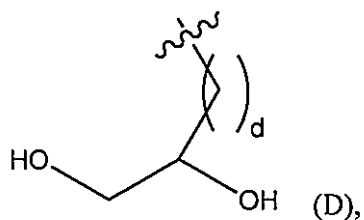
(式中 a は 0 から 25 の整数)、
式 (B) で表されるグアニウムクロライド基
【化 9】



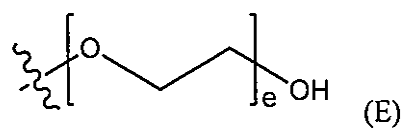
(式中 b は 0 から 25 の整数)、
式 (C) で表されるグアニジノベンゼン基
【化 10】



(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 11】



(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 12】



(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 29 に記載の前記医薬組成物。
【請求項 31】

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あって 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あって 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。