

【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21年6月18日(2009.6.18)

【公表番号】特表2008-539299(P2008-539299A)

【公表日】平成20年11月13日(2008.11.13)

【年通号数】公開・登録公報2008-045

【出願番号】特願2008-508806(P2008-508806)

【国際特許分類】

C 0 8 G 73/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

【F I】

C 0 8 G 73/02

A 6 1 K 47/34

【手続補正書】

【提出日】平成21年4月24日(2009.4.24)

【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

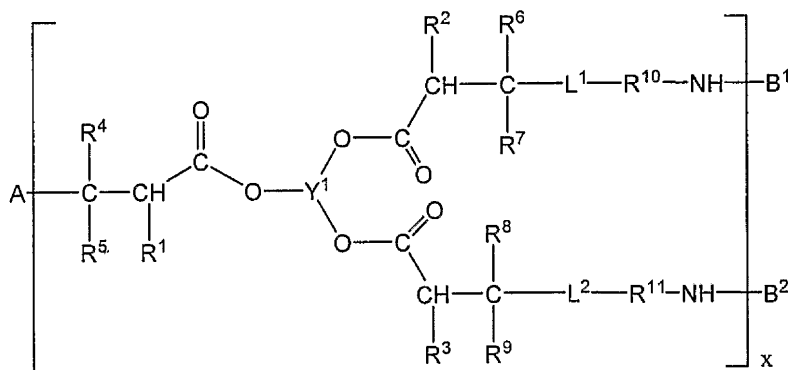
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式を有する、分岐したポリ(アミノエステル)化合物：



式中、 $x$ は1～約10,000の間の整数であり；

$R^1$ 、 $R^2$ および $R^3$ の各々は、独立して、水素、ジューテリウム、トリチウム、およびヒドロカルビルからなる群より選択され；

$R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ および $R^9$ の各々は、独立して、水素、ジューテリウム、トリチウムおよびヒドロカルビルからなる群より選択され；

$L^1$ および $L^2$ の各々は、独立して、 $NR^{12}$ および $N(-R^{13}-)(-R^{14}-)Z$ からなる群より選択され、 $R^{12}$ は、ヒドロカルビルであり、ならびに $R^{13}$ および $R^{14}$ はNおよびZに結合して環状構造を形成し、および $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{13}$ および $R^{14}$ の各々は、独立して、置換されてもよい $C_{1-30}$ アルキレン、置換されてもよい $C_{2-30}$ アルケニレン、置換されてもよい $C_{2-30}$ アルキニレン、置換されてもよい $C_{3-8}$ シクロアルキレンおよび置換されてもよい $C_{6-18}$ アリーレンからなる群より選択され；ならびにZは、独立して、N、CH、およびC-ヒドロカルビルおよびC( $R^a R^b$ )からなる群より選択され、 $R^a$ および $R^b$ は、C接合と一緒にあって4～12-員の炭素環または複素環を形成し、但し、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ および $R^{12}$ は第一級アミノ基、第二級アミノ基、またはカルボニル基にコンジュゲートされた炭素-炭素二重結合を有することはできず；

$Y^1$ はCH、C-ヒドロカルビル、 $R^e(R^f-)_3$ 、シリル、(アルキレン) $_3SiR^e$ 、および金属からなる群より選択され、 $R^e$ はアルキルまたはアリールであり、 $R^e$ は芳香族環であり、 $R^f$ は $C_{1-8}$ アルキレンであり；

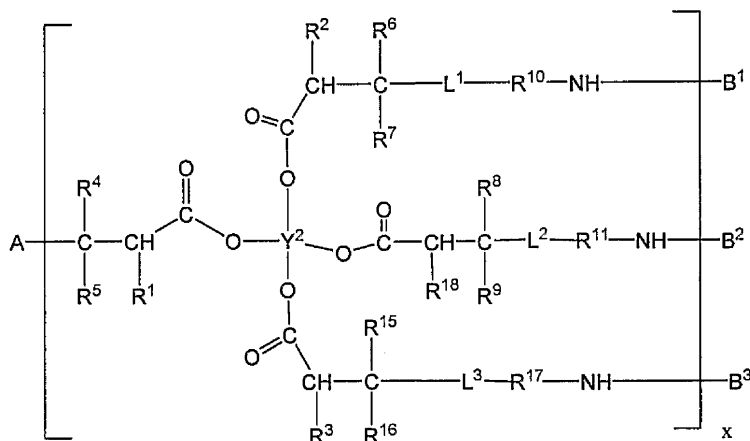
AはH、 $NH_2$ 、シリル、チオール、アルキルチオール、アリールチオール、ヒドロキシル、アリールオキシ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリール、ジアルキルアミノ、ジアリールアミノ、カルバモイル-アミノ、カルバモイル-オキシ、チオカルバモイル、カルボニルジオキシおよびシアノからなる群より選択され；

$B^1$ および $B^2$ の各々は、独立して、H、アルキル、カルバモイル、アルカノイル、アロイル、アルコキシカルボニル、アロキシカルボニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロアルキル、トシル、メシルおよびアクリロイルからなる群より選択され；

該ヒドロカルビルはヒドロキシアルキル、アミノアルキル、アミジルアルキル、チオアルキル、カルボキシアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シリルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アリールスルホニルアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アリールスルフェニルアルキル、シクロアルキル、環状芳香族、およびヘテロシクロアルキルからなる群より選択され、その各々は、分岐したおよび分岐していないアルキル、分岐したおよび分岐していないアルケニル、分岐したおよび分岐していないアルキニル、アリール、ヘテロアリール、カルバモイル、カルバモイル-アミノ、カルバモイル-オキシ、チオカルバモイル、アルコキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、カルボニルジオキシ、シアノ、アルクノイル、アロイル、シクロアルキル、環状芳香族、ヘテロシクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ジアリールアミノ、アルキルアリールアミノ、アルキルチオ、アリールチオ、カルボキシル、アミジル、アルキルシリル、アリールシリル、ヘテロアリール、スルホニル、スルフィニル、スルホンアミド、スルホネート、アルキルスルホニルオキシ、カルボニルジオキシ、ウレイド、チオウレイド、イソシナチル、ヒドロキシル、チオ、アミノおよびシリルからなる群より選択される一つまたは複数のメンバーで置換されてもよい。

#### 【請求項 2】

下記式を有する、分岐したポリ(アミノエステル)化合物：



式中、 $x$ は独立して1～約10,000の間の整数であり；

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ および $R^{18}$ の各々は、独立して、水素、ジューテリウム、トリチウムからなる群より選択され；

$R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{15}$ および $R^{16}$ の各々は、独立して、水素、ジューテリウム、トリチウムおよびヒドロカルビルからなる群より選択され；

$L^1$ 、 $L^2$ および $L^3$ の各々は、独立して、 $NR^{12}$ および $N(-R^{13}-)(-R^{14}-)Z$ からなる群より選択され、 $R^{12}$ はヒドロカルビルであり、ならびに $R^{13}$ および $R^{14}$ はNおよびZに結合して環状構造を形成し、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ および $R^{17}$ の各々は、独立して、置換されてもよい $C_{1-30}$ アルキレン、置換されてもよい $C_{2-30}$ アルケニレン、置換されてもよい $C_{2-30}$ アルキニレン、置換されてもよい $C_{3-8}$ シクロアルキレンおよび置換されてもよい $C_{6-18}$ アリーレンから

なる群より選択され；ならびにZは、N、CH、およびC-ヒドロカルビルおよびC(R<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)からなる群より選択され、R<sup>a</sup>およびR<sup>b</sup>は、C接合と一緒にあって4-~12-員の炭素環または複素環を形成し、但し、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>15</sup>、R<sup>16</sup>およびR<sup>18</sup>は第一級アミノ基、第二級アミノ基、またはカルボニル基にコンジュゲートした炭素-炭素二重結合を有することができず；

Y<sup>2</sup>がC、Si、R<sup>h</sup>(R<sup>i</sup>)<sub>4</sub>および金属からなる群より選択され、R<sup>h</sup>はC、Si、または芳香族環であり、R<sup>i</sup>はC<sub>1-30</sub>アルキレンまたはC<sub>1-30</sub>アリールアルキレンであり；

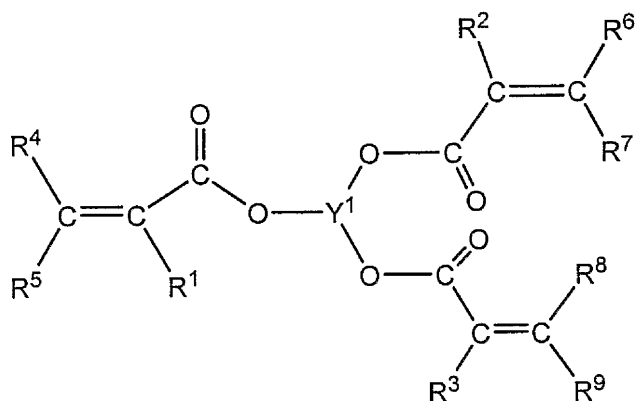
AはH、NH<sub>2</sub>、シリル、チオール、アルキルチオール、アリールチオール、ヒドロキシル、アリールオキシ、アルキルアミノ、アリールアミノ、ヘテロアリール、ジアルキルアミノ、ジアリールアミノ、カルバモイル-アミノ、カルバモイル-オキシ、チオカルバモイル、カルボニルジオキシおよびシアノからなる群より選択され；

B<sup>1</sup>、B<sup>2</sup>およびB<sup>3</sup>の各々は、独立して、H、アルキル、カルバモイル、アルカノイル、アロイル、アルコキシカルボニル、アロキシカルボニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロアルキル、トシル、メシルおよびアクリロイルからなる群より選択され；

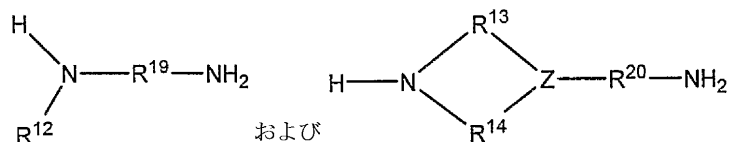
該ヒドロカルビルはヒドロキシアリール、アミノアルキル、アミジルアルキル、チオアルキル、カルボキシアリール、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シリルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アリールスルホニルアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アリールスルフェニルアルキル、シクロアルキル、環状芳香族、およびヘテロシクロアルキルからなる群より選択され、その各々は、分岐したおよび分岐していないアルキル、分岐したおよび分岐していないアルケニル、分岐したおよび分岐していないアルキニル、アリール、ヘテロアリール、カルバモイル、カルバモイル-アミノ、カルバモイル-オキシ、チオカルバモイル、アルコキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、カルボニルジオキシ、シアノ、アルクノイル、アロイル、シクロアルキル、環状芳香族、ヘテロシクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ジアリールアミノ、アルキルアリールアミノ、アルキルチオ、アリールチオ、カルボキシル、アミジル、アルキルシリル、アリールシリル、ヘテロアリール、スルホニル、スルフィニル、スルホンアミド、スルホネート、アルキルスルホニルオキシ、カルボニルジオキシ、ウレイド、チオウレイド、イソシナチル、ヒドロキシル、チオ、アミノおよびシリルからなる群より選択される一つまたは複数のメンバーで置換されてもよい。

【請求項3】

式：



を有するアクリレートモノマーを以下からなる群より選択される式を有するジアミンモノマーと反応させる段階を含む、分岐したポリ(アミノエステル)を調製する方法：



式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>の各々は、独立して、水素、ジューテリウム、トリチウムからなる

群より選択され；

$R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ および $R^9$ の各々は、独立して、水素、ジューテリウム、トリチウムおよびヒドロカルビルからなる群より選択され；

$R^{12}$ はヒドロカルビルであり；

$R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{19}$ および $R^{20}$ の各々は、独立して、置換されてもよい $C_{1-30}$ アルキレン、置換されてもよい $C_{2-30}$ アルケニレン、置換されてもよい $C_{2-30}$ アルキニレン、置換されてもよい $C_{3-8}$ シクロアルキレンおよび置換されてもよい $C_{6-18}$ アリーレンからなる群より選択され；

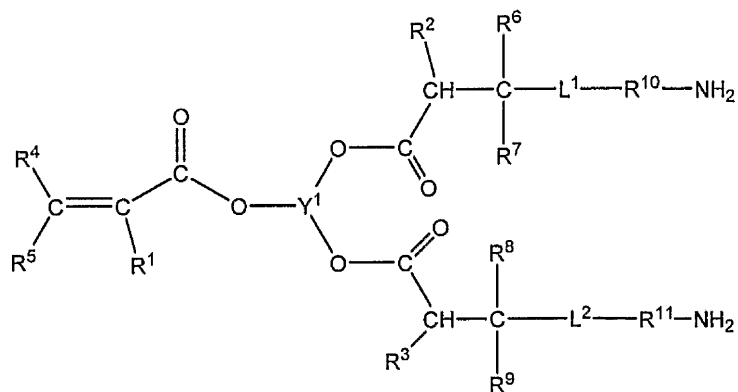
$Y^1$ はCH、C-ヒドロカルビル、 $R^e(R^f-)_3$ 、シリル、(アルキレン) $_3SiR^c$ 、および金属からなる群より選択され、 $R^c$ はアルキルまたはアリールであり、 $R^e$ は芳香族環であり、 $R^f$ は $C_{1-8}$ アルキレンであり；

Zは、N、CH、C-ヒドロカルビルおよび $C(R^aR^b)$ からなる群より選択され、 $R^a$ および $R^b$ は、C接合と一緒にあって4-~12-員の炭素環または複素環を形成し、但し、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ および $R^{12}$ は第一級アミノ基、第二級アミノ基、またはカルボニル基にコンジュゲートされた炭素-炭素二重結合を有することはできず；ならびに

該ヒドロカルビルはヒドロキシアルキル、アミノアルキル、アミジルアルキル、チオアルキル、カルボキシアルキル、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、シリルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アリールスルホニルアルキル、アルキルスフィニルアルキル、アリールスルフェニルアルキル、シクロアルキル、環状芳香族、およびヘテロシクロアルキルからなる群より選択され、その各々は、分岐したおよび分岐していないアルキル、分岐したおよび分岐していないアルケニル、分岐したおよび分岐していないアルキニル、アリール、ヘテロアリール、カルバモイル、カルバモイル-アミノ、カルバモイル-オキシ、チオカルバモイル、アルコキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、カルボニルジオキシ、シアノ、アルクノイル、アロイル、シクロアルキル、環状芳香族、ヘテロシクロアルキル、アルコキシ、アリールオキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ジアリールアミノ、アルキルアリールアミノ、アルキルチオ、アリールチオ、カルボキシル、アミジル、アルキルシリル、アリールシリル、ヘテロアリール、スルホニル、スルフィニル、スルホンアミド、スルホネート、アルキルスルホニルオキシ、カルボニルジオキシ、ウレイド、チオウレイド、イソシナチル、ヒドロキシル、チオ、アミノおよびシリルからなる群より選択される一つまたは複数のメンバーで置換されてもよい。

#### 【請求項4】

下記式を有するモノマーをホモ重合する段階を含む、分岐したポリ(アミノエステル)を調製する方法：



式中、 $R^1$ 、 $R^2$ および $R^3$ の各々は、独立して、水素、ジューテリウム、トリチウム、およびヒドロカルビルからなる群より選択され；

$R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ および $R^9$ の各々は、独立して、水素、ジューテリウム、トリチウムおよびヒドロカルビルからなる群より選択され；

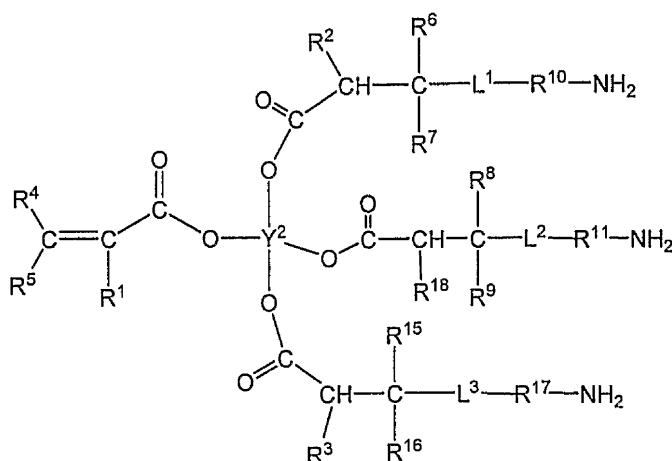
$L^1$ および $L^2$ の各々は、独立して、 $NR^{12}$ および $N(-R^{13}-)(-R^{14}-)Z$ からなる群より選択され

、 $R^{13}$ および $R^{14}$ の各々はNおよびZに結合して環状構造を形成し、 $R^{12}$ はヒドロカルビルであり； $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{10}$ および $R^{11}$ の各々は、独立して、置換されてもよい $C_{1-30}$ アルキレン、置換されてもよい $C_{2-30}$ アルケニレン、置換されてもよい $C_{2-30}$ アルキニレン、置換されてもよい $C_{3-8}$ シクロアルキレンおよび置換されてもよい $C_{6-18}$ アリーレンからなる群より選択され；ならびにZは、N、CH、およびC-ヒドロカルビルおよび $C(R^a R^b)$ からなる群より選択され、 $R^a$ および $R^b$ は、C接合と一緒にあって4-~12-員の炭素環または複素環を形成し、但し、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ および $R^9$ は第一級アミノ基、第二級アミノ基、またはカルボニル基にコンジュゲートされた炭素-炭素二重結合を有することができず；ならびに

$Y^1$ は、CH、C-ヒドロカルビル、 $R^e(R^f-)_3$ 、シリル、(アルキレン) $_3$ Si $R^c$ 、および金属からなる群より選択され； $R^c$ は、アルキルまたはアリールであり、 $R^e$ は芳香族環であり、 $R^f$ は $C_{1-8}$ アルキレンである。

【請求項5】

下記式を有するモノマーをホモ重合する段階を含む、分岐したポリ(アミノエステル)を調製する方法：



式中、 $x$ は独立して1~約10,000の間の整数であり；

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ および $R^{18}$ の各々は、独立して、水素、ジューテリウム、トリチウム、ヒドロキシル、チオヒドロキシルおよびヒドロカルビルからなる群より選択され；

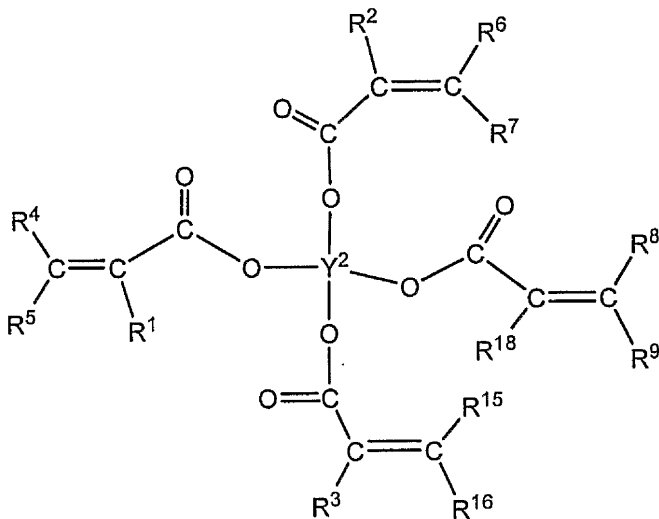
$R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{15}$ および $R^{16}$ の各々は、独立して、水素、ジューテリウム、トリチウムおよびヒドロカルビルからなる群より選択され；

$L^1$ 、 $L^2$ および $L^3$ の各々は、独立して、 $NR^{12}$ および $N(-R^{13}-)(-R^{14}-)Z$ からなる群より選択され、 $R^{12}$ はヒドロカルビルであり；ならびに $R^{13}$ および $R^{14}$ はNおよびZに結合して環状構造を形成し、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ および $R^{17}$ の各々は、独立して、置換されてもよい $C_{1-30}$ アルキレン、置換されてもよい $C_{2-30}$ アルケニレン、置換されてもよい $C_{2-30}$ アルキニレン、置換されてもよい $C_{3-8}$ シクロアルキレンおよび置換されてもよい $C_{6-18}$ アリーレンからなる群より選択され；ならびにZは、独立して、N、CH、およびC-ヒドロカルビルおよび $C(R^a R^b)$ からなる群より選択され、 $R^a$ および $R^b$ は、C接合と一緒にあって4-~12-員の炭素環または複素環を形成し、但し、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{15}$ 、 $R^{16}$ および $R^{18}$ は第一級アミノ基、第二級アミノ基、またはカルボニル基にコンジュゲートされた炭素-炭素二重結合を有することができず；ならびに

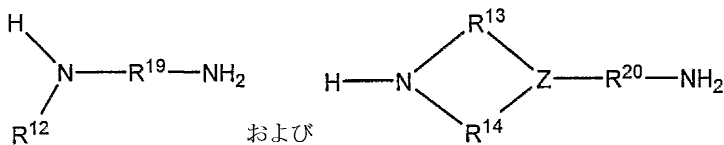
$Y^2$ はC、Si、 $R^h(R^i-)_4$ および金属からなる群より選択され； $R^h$ はC、Si、または芳香族環であり、 $R^i$ は $C_{1-30}$ アルキレンまたは $_{1-30}$ アリールアルキレンである。

【請求項6】

式：



を有するアクリレートモノマーを、以下からなる群より選択される式を有するジアミンモノマーと反応させる段階を含む、分岐したポリ(アミノエステル)を調製する方法：



式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ および $R^{18}$ の各々は、独立して、水素、ジューテリウム、トリチウム、およびヒドロカルビルからなる群より選択され；

$R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{15}$ および $R^{16}$ の各々は、独立して、水素、ジューテリウム、トリチウムおよびヒドロカルビルからなる群より選択され；

$R^{12}$ は、ヒドロカルビルであり；

$R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{19}$ および $R^{20}$ の各々は、独立して、置換されてもよい $C_{1-30}$ アルキレン、置換されてもよい $C_{2-30}$ アルケニレン、置換されてもよい $C_{2-30}$ アルキニレン、置換されてもよい $C_{3-8}$ シクロアルキレンおよび置換されてもよい $C_{6-18}$ アリーレンからなる群より選択され；

$Y^2$ はC、Si、 $R^h(R^i-)_4$ および金属からなる群より選択され； $R^h$ はC、Si、または芳香族環であり、 $R^i$ は $C_{1-30}$ アルキレンまたは $C_{1-30}$ アリールアルキレンであり；ならびに

ZはN、CH、C-ヒドロカルビルおよび $C(R^aR^b)$ からなる群より選択され、 $R^a$ および $R^b$ は、C接合と一緒にあって4-~12-員の炭素環または複素環を形成し、但し、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{15}$ 、 $R^{16}$ および $R^{18}$ は第一級アミノ基、第二級アミノ基、またはカルボニル基にコンジュゲートされた炭素-炭素二重結合を有することができない。

【請求項 7】

生理活性剤および請求項1または2記載の化合物を含む、薬学的組成物。

【請求項 8】

請求項1または2記載の化合物もしくはその塩と複合体化されたDNA分子またはその塩を含む、細胞をトランスフェクトするための組成物。

【請求項 9】

細胞を請求項8記載の組成物と接触させる段階を含む、細胞をトランスフェクトする方法。

【請求項 10】

治療的有効量の請求項7記載の組成物をそれを必要とする対象に投与する段階を含む、遺伝子治療を用いて疾患を治療する方法。

【請求項 11】

造影剤の調製における、請求項1または2記載の化合物を含むイメージング用の組成物の使用。