

【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28日(2008.8.28)

【公表番号】特表2003-520288(P2003-520288A)

【公表日】平成15年7月2日(2003.7.2)

【出願番号】特願2001-552800(P2001-552800)

【国際特許分類】

C 0 9 B 23/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/4045 (2006.01)

A 6 1 K 49/00 (2006.01)

A 6 1 K 49/04 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

C 0 7 D 209/08 (2006.01)

C 0 7 D 209/12 (2006.01)

C 0 7 D 209/60 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 K 7/06 (2006.01)

C 0 9 K 11/06 (2006.01)

【 F I 】

C 0 9 B 23/00 Z N A L

A 6 1 K 31/4045

A 6 1 K 49/00 Z

A 6 1 K 49/04 A

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 9/10 1 0 1

C 0 7 D 209/08

C 0 7 D 209/12

C 0 7 D 209/60

C 0 7 D 405/14

C 0 7 K 7/06

C 0 9 K 11/06

【手続補正書】

【提出日】平成20年5月12日(2008.5.12)

【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

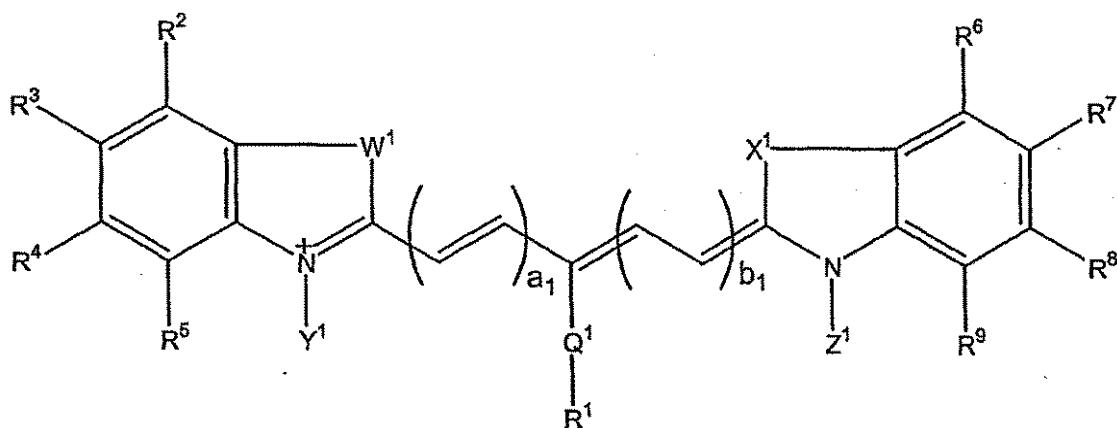
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 下式：

【化 1】



の化合物であって、式中、

a_1 および b_1 は 0 ないし 5 で変化し；

W^1 および X^1 は独立して、 $-CR^{10}R^{11}$ 、 $-O-$ 、 $-NR^{12}$ 、 $-S-$ または $-Se$ であり；

Q^1 は単結合であるかまたは $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-Se-$ または $-NR^{13}$ であり；

Y^1 および Z^1 は独立して、 $-(CH_2)_c-CO_2H$ 、 $-CH_2-(CH_2-O-CH_2)_d-CH_2-CO_2H$ 、 $-(CH_2)_e-NH_2$ 、 $-CH_2-(CH_2-O-CH_2)_f-CH_2-NH_2$ 、 $-(CH_2)_g-N(R^{14})-(CH_2)_h-CO_2H$ または $-(CH_2)_i-N(R^{15})-CH_2-(CH_2-O-CH_2)_j-CH_2-CO_2H$ であり；

R^1 および R^{10} ないし R^{15} は独立して、水素、 $C1-C10$ アルキル、 $C1-C10$ アリール、 $C1-C10$ アルコキシル、 $C1-C10$ ポリアルコキシアルキル、 $-CH_2(CH_2-O-CH_2)_c-CH_2-OH$ 、 $C1-C20$ ポリヒドロキシアルキル、 $C1-C10$ ポリヒドロキシアリール、 $-(CH_2)_d-CO_2H$ 、 $-CH_2-(CH_2-O-CH_2)_e-CH_2-CO_2H$ 、 $-(CH_2)_f-NH_2$ または $-CH_2-(CH_2-O-CH_2)_g-CH_2-NH_2$ であり；

c 、 e 、 g 、 h および i は独立して、1 ないし 10 で変化し；

d 、 f および j は独立して、1 ないし 100 で変化し；そして

R^2 ないし R^9 は独立して、水素、 $C1-C10$ アルキル、 $C1-C10$ アリール、ヒドロキシル、 $C1-C10$ ポリヒドロキシアルキル、 $C1-C10$ アルコキシル、アミノ、 $C1-C10$ アミノアルキル、シアノ、ニトロまたはハロゲンである、化合物。

【請求項 2】 a_1 および b_1 が 0 ないし 3 で変化し；

Q^1 が単結合であり；

R^1 ないし R^9 が水素であり；

W^1 および X^1 が独立して、 $-C(CH_3)_2$ 、 $-C((CH_2)_{zz}OH)CH_3$ 、 $-C((CH_2)_{zz}OH)_2$ 、 $-C((CH_2)_{zz}CO_2H)CH_3$ 、 $-C((CH_2)_{zz}CO_2H)_2$ 、 $-C((CH_2)_{zz}NH_2)CH_3$ 、 $-C((CH_2)_{zz}NH_2)_2$ 、 $-C((CH_2)_{zz}NR_{pp}R_{pz})CH_3$ または $-C((CH_2)_{zz}NR_{pp}R_{pz})_2$ であり；

Y^1 および Z^1 が独立して、 $-(CH_2)_c-CO_2H$ 、 $-CH_2-(CH_2-O-CH_2)_d-CH_2-CO_2H$ 、 $-(CH_2)_g-N(R^{14})-(CH_2)_h-CO_2H$ または $-(CH_2)_i-N(R^{15})-CH_2-(CH_2-O-CH_2)_j-CH_2-CO_2H$ であり；

R_{pp} および R_{pz} が独立して、 $-(CH_2)_c-CO_2H$ 、 $-CH_2-(CH_2-O-CH_2)_d-CH_2-CO_2H$ 、 $-(CH_2)_g-N(R^{14})-(CH_2)_h-CO_2H$ または $-(CH_2)_i-N(R^{15})-CH_2-(CH_2-O-CH_2)_j-CH_2-CO_2H$ であり；

c 、 e 、 g 、 h 、 i および zz が独立して、1 ないし 5 で変化し；

d、f および j は独立して、1 ないし 100 で変化し；そして

R^{14} および R^{15} が独立して、水素、C1 - C10 アルキル、C1 - C10 アリール、C1 - C10 アルコキシル、C1 - C10 ポリアルコキシアルキル、 $-CH_2-(CH_2-O-CH_2)_c-CH_2-OH$ 、C1 - C20 ポリヒドロキシアルキル、C1 - C10 ポリヒドロキシアリール、 $-(CH_2)_d-CO_2H$ 、 $-CH_2-(CH_2-O-CH_2)_e-CH_2-CO_2H$ 、 $-(CH_2)_f-NH_2$ または $-CH_2-(CH_2-O-CH_2)_g-CH_2-NH_2$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】 a_1 および b_1 が 3 であり；

Q^1 が単結合であり；

R^1 ないし R^9 が水素であり；

W^1 および X^1 が独立して、 $-C((CH_2)_{zz}OH)_2$ 、 $C((CH_2)_{zz}CO_2H)_2$ または $C((CH_2)_{zz}NR_{pp}R_{pz})_2$ であり；そして

Y^1 および Z^1 が同一であってかつ $-(CH_2)_c-CO_2H$ 、 $-CH_2-(CH_2-O-CH_2)_d-CH_2-CO_2H$ または $-(CH_2)_g-N(R^{14})-(CH_2)_h-CO_2H$ である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】 医学的診断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】 該医学的診断処置が、350 - 1300 nm の領域における波長の光を利用するものである、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】 該医学的診断処置が、光学的断層撮影法を含む、請求項 4 または 5 に記載の化合物。

【請求項 7】 該医学的診断処置が、蛍光内視鏡検査を含む、請求項 4 または 5 に記載の化合物。

【請求項 8】 該医学的診断処置が、該化合物の血液クリアランスプロファイルを蛍光、吸収または光散乱によってモニターすることを含み、350 - 1300 nm の領域における波長の光を利用するものである、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 9】 該医学的診断処置が、吸収、光散乱、フォトアコースティックおよび/または音波蛍光技法を利用する造影および治療段階を含む、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 10】 該医学的診断処置がアテローム性動脈硬化症ブランクおよび血液凝塊診断目的のものである、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 11】 請求項 1～3 のいずれか 1 項に記載の化合物を固相合成によりペプチドとコンジュゲートさせることを含む、バイオコンジュゲート製法。

【請求項 12】 請求項 1～3 のいずれか 1 項に記載の化合物を固相合成によりバイオ分子とコンジュゲートさせることを含む、バイオコンジュゲート製法。

【請求項 13】 請求項 1～3 のいずれか 1 項に記載の化合物に、生物適合性有機溶媒を 1 ないし 50 パーセント添加することによる、請求項 1～3 のいずれか 1 項に記載の化合物のインビボまたはインビトロの蛍光クエンチング防止方法。

【請求項 14】 該化合物を、ジメチルスルフォキシド(DMSO) 1 ないし 50 パーセントを含む媒体中に溶解させる、請求項 13 に記載の方法。