

【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27年4月16日(2015.4.16)

【公表番号】特表2015-506990(P2015-506990A)

【公表日】平成27年3月5日(2015.3.5)

【年通号数】公開・登録公報2015-015

【出願番号】特願2014-556894(P2014-556894)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/343	(2006.01)
A 6 1 K	9/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/48	(2006.01)
A 6 1 K	47/14	(2006.01)
A 6 1 K	47/24	(2006.01)
A 6 1 K	47/28	(2006.01)
A 6 1 K	47/34	(2006.01)
A 6 1 K	47/18	(2006.01)
A 6 1 K	47/12	(2006.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/22	(2006.01)
A 6 1 K	47/16	(2006.01)
A 6 1 K	47/36	(2006.01)
A 6 1 K	47/42	(2006.01)
A 6 1 K	47/04	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	3/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/04	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/343
A 6 1 K	9/10
A 6 1 K	47/48
A 6 1 K	47/14
A 6 1 K	47/24
A 6 1 K	47/28
A 6 1 K	47/34
A 6 1 K	47/18
A 6 1 K	47/12
A 6 1 K	47/32
A 6 1 K	47/26
A 6 1 K	47/10
A 6 1 K	47/22
A 6 1 K	47/16
A 6 1 K	47/36
A 6 1 K	47/42
A 6 1 K	47/04

A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	3/00	
A 6 1 P	43/00	1 0 5
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	35/04	

【手続補正書】

【提出日】平成27年2月16日(2015.2.16)

【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

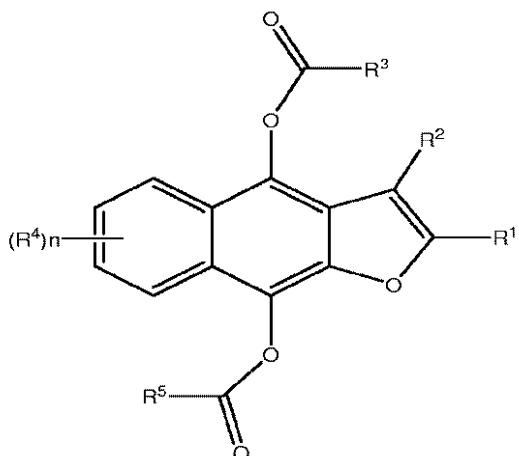
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I :

【化9】



I

(式中:

nは0~4であり;

R¹は、独立して、ハロゲン；-NO₂；-CN；-OR；-SR；-N⁺(R)₃；-N(R)₂；-C(O)R；-CO₂R；-C(O)C(O)R；-C(O)CH₂C(O)R；-S(O)R；-S(O)₂R；-C(O)N(R)₂；-SO₂N(R)₂；-OC(O)R；-N(R)C(O)R；-N(R)N(R)₂；-N(R)C(=N)R)N(R)₂；-C(=N)R)N(R)₂；-C=NOR；-N(R)C(O)N(R)₂；-N(R)SO₂N(R)₂；-N(R)SO₂R；-OC(O)N(R)₂；またはC_{1~12}脂肪族、3~14員のカルボシクリル；3~14員のヘテロシクリル；6~14員のアリール；もしくは5~14員のヘテロアリールから選択される任意選択で置換されている基であるか；あるいは

R¹とR²が、これらの介在原子と一体となって、3~14員の炭素環、または3~14員の複素環、または6~14員のアリール、または5~14員のヘテロアリールから選択される任意選択で置換されている環を形成しており；

R²は、独立して、水素；ハロゲン；-NO₂；-OR；-SR；-N⁺(R)₃；-

N (R)₂ ; - C (O) R ; - CO₂ R ; - C (O) C (O) R ; - C (O) CH₂ C (O) R ; - S (O) R ; - S (O)₂ R ; - C (O) N (R)₂ ; - SO₂ N (R)₂ ; - OC (O) R ; - N (R) C (O) R ; - N (R) N (R)₂ ; - N (R) C (= NR) N (R)₂ ; - C (= NR) N (R)₂ ; - C = NOR ; - N (R) C (O) N (R)₂ ; - N (R) SO₂ N (R)₂ ; - N (R) SO₂ R ; - OC (O) N (R)₂ ; または C_{1~12} 脂肪族 ; 3~14 員のカルボシクリル ; 3~14 員のヘテロシクリル ; 6~14 員のアリール ; もしくは 5~14 員のヘテロアリールから選択される任意選択で置換されている基であるか ; あるいは

R¹ と R² が、これらの介在原子と一体となって、3~14 員の炭素環、または 3~14 員の複素環、または 6~14 員のアリール、または 5~14 員のヘテロアリールから選択される任意選択で置換されている環を形成しており ;

R³ および R⁵ は各々、独立して、C_{1~2} 脂肪族から選択される任意選択で置換されている基であり ;

各 R⁴ は、独立して、ハロゲン ; - NO₂ ; - CN ; - OR ; - SR ; - N⁺ (R)₃ ; - N (R)₂ ; - C (O) R ; - CO₂ R ; - C (O) C (O) R ; - C (O) CH₂ C (O) R ; - S (O) R ; - S (O)₂ R ; - C (O) N (R)₂ ; - SO₂ N (R)₂ ; - OC (O) R ; - N (R) C (O) R ; - N (R) N (R)₂ ; - N (R) C (= NR) N (R)₂ ; - C (= NR) N (R)₂ ; - C = NOR ; - N (R) C (O) N (R)₂ ; - N (R) SO₂ N (R)₂ ; - N (R) SO₂ R ; - OC (O) N (R)₂ ; または C_{1~12} 脂肪族 ; 3~14 員のカルボシクリル ; 3~14 員のヘテロシクリル ; 6~14 員のアリール ; もしくは 5~14 員のヘテロアリールから選択される任意選択で置換されている基であるか、あるいは :

隣接している炭素原子上の 2 つの R⁴ 基が、これらの介在原子と一体となって、3~14 員の炭素環 ; 3~14 員の複素環 ; 6~14 員のアリール環 ; または 5~14 員のヘテロアリール環から選択される任意選択で置換されている環を形成しており ;

各 R は、独立して、水素であるか、または C_{1~12} 脂肪族 ; 3~14 員のカルボシクリル ; 3~14 員のヘテロシクリル ; 6~14 員のアリール ; もしくは 5~14 員のヘテロアリールから選択される任意選択で置換されている基である)

に示す式 I の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の水性ナノ粒子懸濁液を調製する方法であって ;

(1) 式 I の化合物および任意選択で、薬学的に許容され得る界面活性剤 (1 種類または複数種) を水混和性有機溶媒に溶解させ、有機溶液を形成すること ; (2) 任意選択で、薬学的に許容され得る薬剤 (1 種類もしくは複数種) および / または任意選択で、薬学的に許容され得る界面活性剤 (1 種類もしくは複数種) を水に溶解させ、水溶液を形成すること ; ならびに (3) 該有機溶液と該水溶液を混合し、粒子が約 10 nm ~ 約 5000 nm の範囲の中央粒径 (D₅₀) を有するナノ粒子懸濁液を形成することを含む方法。