

【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 18 年 1 月 5 日 (2006.1.5)

【公表番号】特表 2001-521530 (P2001-521530A)
【公表日】平成 13 年 11 月 6 日 (2001.11.6)
【出願番号】特願平 10-544715

【国際特許分類】

C 07 D 209/08 (2006.01)
A 61 K 41/00 (2006.01)
A 61 K 49/00 (2006.01)
A 61 P 35/00 (2006.01)
C 07 D 493/10 (2006.01)
C 07 H 15/252 (2006.01)

【F I】

C 07 D 209/08
A 61 K 41/00
A 61 K 49/00 Z
A 61 K 49/00 A
A 61 P 35/00
C 07 D 493/10 C
C 07 H 15/252

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 8 月 1 日 (2005.8.1)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】補正の内容のとおり

【補正方法】変更

【補正の内容】

手 続 補 正 書



平成 17 年 8 月 1 日

特 許 庁 長 官 殿

1. 事件の表示

平成 10 年 特 許 願 第 544715 号



2. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

名 称 インスティトゥート フュア ディアグノスティックフォル
シュング ゲゼルシャフト ミット ベシュレンクテル ハ
フツング アン デア フライエン ウニヴェルジテート
ベルリン

3. 代 理 人

住 所 東京都千代田区丸の内1丁目6番2号
新丸の内センタービルディング
ゾンデルホフ&アインゼル法律特許事務所
電話 03 (5220) 6500 (代表)

氏 名 (6181) 弁理士 矢 野 敏 雄



4. 補正により増加する請求項の数 0

5. 補正対象書類名

請求の範囲

6. 補正対象項目名

請求の範囲

7. 補正の内容

別紙の通り

方 式 査
審

請 求 の 範 囲

1. 一般式 (I) :



[式中、

Fは少なくとも1個の600～1200nmの吸収最大値を有するシアニン染料分子、スクアリリウム(Squarilium)染料分子、クロコニウム(Croconium)染料分子、メロシアニン染料分子またはオキソノール染料分子を表わし、

Lはカテプシン、ペプチダーゼ、カルボキシペプチダーゼ、 α -グルコシダーゼおよび β -グルコシダーゼ、脂肪分解酵素、ホスホリパーゼ、ホスファターゼ、ホスホジエステラーゼ、蛋白質分解酵素、エラスターゼ、スルファターゼ、還元酵素および細菌性酵素により分割される酵素的に分割可能な結合を含有するリンカー構造体を表わし、

mは1～80の数値であり、

(ここで、mが1～3の数値である場合には、

Aは少なくとも1個の600～1200nmの吸収最大値を有する染料分子、抗生作用分子または抗細胞増殖抑制効果分子、生体分子、非生物巨大分子、または化合物：B-(L-W)。またはD-(L-W)。を表わし、この場合、

Dは非生物学的巨大分子を表わし、

Bは生体分子を表わし、

Lは前記の意味を表わし、

Wは抗生作用分子または抗細胞増殖抑制効果分子を表わし、

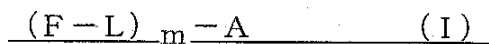
oは1～20の数値である、

および、ここで、mが4～80の数値である場合には、

Aは生体分子、非生物巨大分子、または化合物：B-(L-W)。またはD-(L-W)。を表わし、この場合、

D、B、L、Wおよびoは、前記の意味を表わす]で示される化合物。

2. 一般式 (I) :



[式中、

Fは少なくとも1個の600～1200nmの吸収最大値を有するシアニン染料分子、スクアリリウム(Squarilium)染料分子、クロコニウム(Croconium)染料分子、メロシアニン染料分子またはオキソノール染料分子を表わし、
Lは短鎖ペプチド配列から成る酵素的に分割可能な結合を含有するリンカー構造体を表わし、

mは1～80の数値であり、

(ここで、mが1～3の数値である場合には、

Aは少なくとも1個の600～1200nmの吸収最大値を有する染料分子、
抗生物質分子または抗細胞増殖抑制効果分子、生体分子、非生物巨大分子、
または化合物：B-(L-W)_oまたはD-(L-W)_oを表わし、こ
の場合、

Dは非生物学的巨大分子を表わし、

Bは生体分子を表わし、

Lは前記の意味を表わし、

Wは抗生物質分子または抗細胞増殖抑制効果分子を表わし、

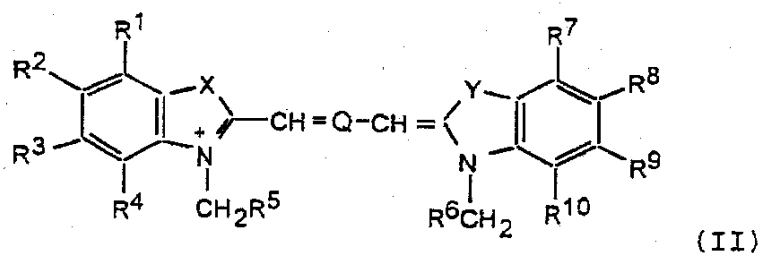
oは1～20の数値である、

および、ここで、mが4～80の数値である場合には、

Aは生体分子、非生物巨大分子、または化合物：B-(L-W)_oまたは
D-(L-W)_oを表わし、この場合、

D、B、L、Wおよびoは、前記の意味を表わす]で示される化合物。

3. 一般式(I)中、Aがポリメチン染料、テトラピロール染料、テトラアザピロール染料、キサンチン染料、フェノキサジン染料またはフェノチアジン染料を表わす、請求項1または2記載の化合物。
4. 一般式(I)中でAが、シアニン染料、スクアリリウム染料、クロコニウム染料、メロシアニン染料またはオキソノール染料を表わす、請求項1から3までのいずれか1項記載の化合物。
5. 一般式(I)中、Fおよび/またはAが一般式(II)：



[式中、

$R^1 \sim R^4$ および $R^7 \sim R^{10}$ は互いに無関係にフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子またはニトロ基を表わすか、または基： $-\text{COOE}^1$ 、 $-\text{CONE}^1\text{E}^2$ 、 $-\text{NHCOE}^1$ 、 $-\text{NHCONHE}^1$ 、 $-\text{NE}^1\text{E}^2$ 、 $-\text{OE}^1$ 、 $-\text{OSO}_3\text{E}^1$ 、 $-\text{SO}_3\text{E}^1$ 、 $-\text{SO}_2\text{NHE}^1$ 、 $-\text{E}^1$ を表わし、

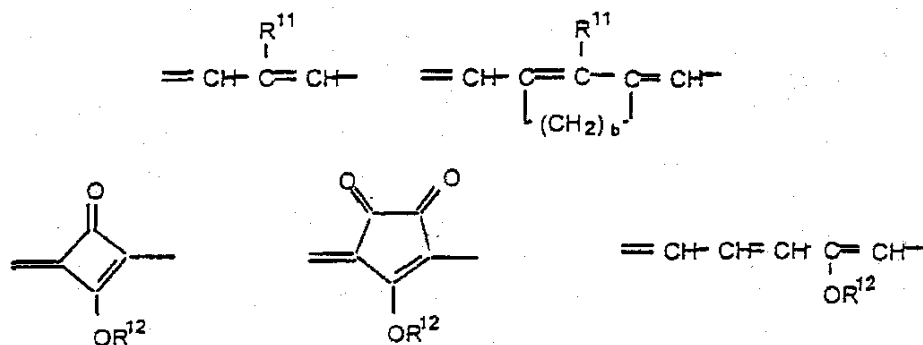
(ここで、 E^1 および E^2 は互いに無関係に水素原子、飽和または不飽和の、分枝鎖状または直鎖状 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{50}$ -アルキル鎖を表わし、この場合、鎖またはこれらの鎖の一部は、場合によっては1つまたは複数の芳香族または飽和環状 $\text{C}_5 \sim \text{C}_6$ 単位または二環状の C_{10} 単位を形成してよく、かつこの場合、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{50}$ -アルキル鎖は酸素原子0～15個および／またはカルボニル基0～3個によって中断されており、および／またはヒドロキシ基0～5個、エステル基0～5個、カルボキシ基0～3個、もしくはアミノ基0～3個で置換されている)、

およびここで、それぞれ隣接した基 $R^1 \sim R^4$ および／または $R^7 \sim R^{10}$ は6員の芳香族炭素環の形成下に互いに結合してよく、

R^5 および R^6 は互いに無関係に、前記の意味を有する基： $-\text{E}^1$ 、または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ -スルホアルキル鎖を表わし、

および／または $R^1 \sim R^{10}$ はLとの結合を表わし、

Qは断片：



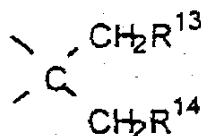
(ここで、

R¹¹ は水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子またはヨウ素原子またはニトロ基を表わすか、またはE¹ およびE² が前記の意味を表わす場合に、基：-NE¹E²、-OE¹ または-E¹ を表わすか、またはLとの結合を表わし、

R¹² は水素原子、または前記の意味を表わす基：E¹ を表わし、

bは数値0、2または3である) を表わし、

XおよびYは互いに無関係に基：O、S、-CH=CH-または断片：



(ここで、R¹³ およびR¹⁴ は互いに無関係に水素を表わすか、または飽和または不飽和の、分枝鎖状または直鎖状で、5個までの酸素原子によって中断されていてよい、および/または5個までのヒドロキシ基で置換されていてよいC₁~C₁₀-アルキル鎖を表わし、かつここで、基R¹³ およびR¹⁴ は5員環または6員環の形成下に互いに結合してよい) を表わす] で示されるシアニン染料を表わす、請求項1から4までのいずれか1項記載の化合物。

6. 一般式(I) 中で、WまたはAが抗生物質、葉酸類似体、ピリミジン類似体、プリン類似体、ホルモン作用物質ならびに他の細胞増殖抑制効果物質を表わす、請求項1から5までのいずれか1項記載の化合物。

7. 一般式(I) 中、Lが、カテプシン、ペプチダーゼ、カルボキシペプチダーゼ、α-グルコシダーゼおよびβ-グルコシダーゼ、脂肪分解酵素、ホスホリパーゼ、ホスファターゼ、ホスホジエステラーゼ、蛋白質分解酵素、エ

ラスターゼ、スルファターゼ、還元酵素および細菌性酵素によって分割される短鎖ペプチド配列から成る酵素的に分割可能な結合を含有するリンカー構造体を表わす、請求項2記載の化合物。

8. 一般式 (I) 中、Aおよび/またはBが抗体、抗体の接合体および断片、特異ペプチドおよびタンパク質、受容体、酵素、酵素基質、ヌクレオチド、天然または合成のリボ核酸またはデオキシリボ核酸、またはこれらの化学変性物、例えばアプタマー (Aptamer) またはアンチセンスオリゴヌクレオチド、リポタンパク質、レクチン、炭水化物、単糖類、二糖類または三糖類、線状または分枝鎖状オリゴ糖または多糖またはオリゴ糖誘導体または多糖誘導体、またはデキストランを表わす、請求項1から7までのいずれか1項記載の化合物。

9. 一般式 (I) 中、Dがポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、ポリリシンまたはポリリシンデンドリマー (Dendrimer) またはこれらの誘導体を表わす、請求項1から8までのいずれか1項記載の化合物。

10. 少なくとも1つの請求項1による化合物と一緒に常用の助剤および/または担体物質ならびに希釈剤を含有する、NIR線を用いた、発病した組織範囲の生体内診断法のための視覚による診断薬。

11. 一般式 (I) 中、Lが短鎖ペプチド配列から成る酵素的に分割可能な結合を含有するリンカー構造体を表わす、請求項1記載の化合物。