

【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】令和1年9月26日(2019.9.26)

【公表番号】特表2018-523657(P2018-523657A)

【公表日】平成30年8月23日(2018.8.23)

【年通号数】公開・登録公報2018-032

【出願番号】特願2018-504871(P2018-504871)

【国際特許分類】

A 6 1 K	49/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 K	31/40	(2006.01)
C 0 7 D	207/46	(2006.01)
C 0 7 D	491/052	(2006.01)
C 0 7 D	401/12	(2006.01)
A 6 1 K	51/04	(2006.01)
A 6 1 K	49/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/54	(2017.01)

【F I】

A 6 1 K	49/00	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 K	31/40	
C 0 7 D	207/46	C S P
C 0 7 D	491/052	
C 0 7 D	401/12	
A 6 1 K	51/04	2 0 0
A 6 1 K	49/10	
A 6 1 K	47/54	

【手続補正書】

【提出日】令和1年8月19日(2019.8.19)

【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1：

X-(Y)<sub>n</sub> (1)

(式中、

Xは、アミロイド 結合性化合物であり；

Yはニトロキシドであり；かつ、

nは1～3の整数である)

の構造を有する化合物の有効量を含む、アミロイドを画像化するための組成物であって

、該組成物は対象に投与されると、前記がアミロイドに結合し、前記化合物に結合したアミロイドが画像化され、画像化されたアミロイドが検出される、組成物。

【請求項2】

前記検出は、前記投与に続き少なくとも60分行われる、請求項1に記載の組成物。

**【請求項3】**

前記検出は、核磁気共鳴画像法(MRI)、電子常磁性共鳴(EPR)、陽電子放射断層撮影(PET)、又は電子スピン共鳴顕微鏡法(ESRM)の少なくとも1つを含む、請求項1に記載の組成物。

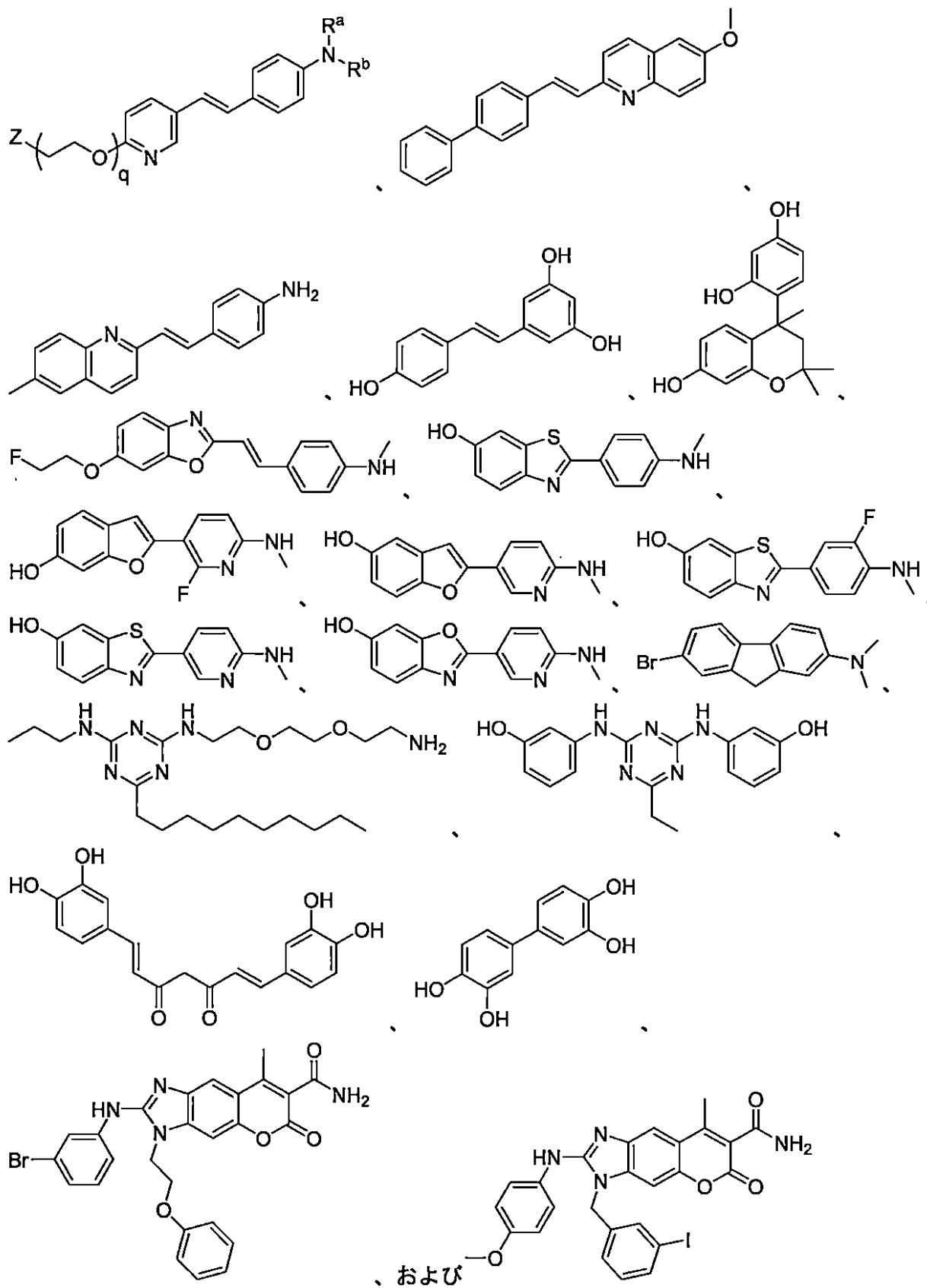
**【請求項4】**

前記アミロイドは、アミロイド 凝集体を含む、請求項1に記載の組成物。

**【請求項5】**

前記アミロイド 結合性化合物は、

【化 1】



(式中、

$R^a$  および  $R^b$  はそれぞれ独立して H 又は  $C_{1-4}$  アルキルであり；  
 Z は I、 $^{123}I$ 、 $^{125}I$ 、 $^{131}I$ 、Br、 $^{76}Br$ 、 $^{77}Br$ 、F、 $^{18}F$ 、および -O- トシルからなる群より選択され；かつ、

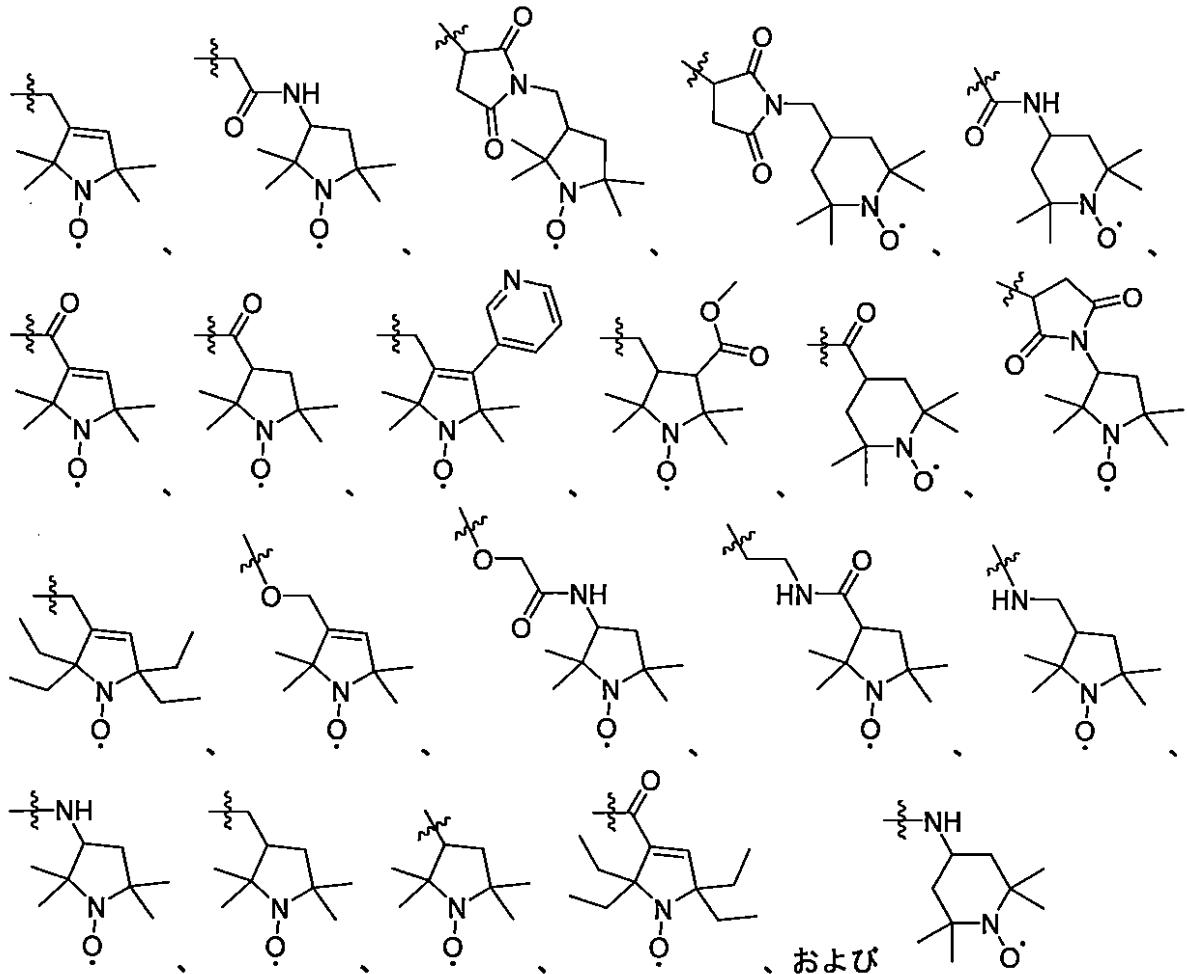
qは2～5の整数である)

からなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項6】

前記ニトロキシドは、

【化2】

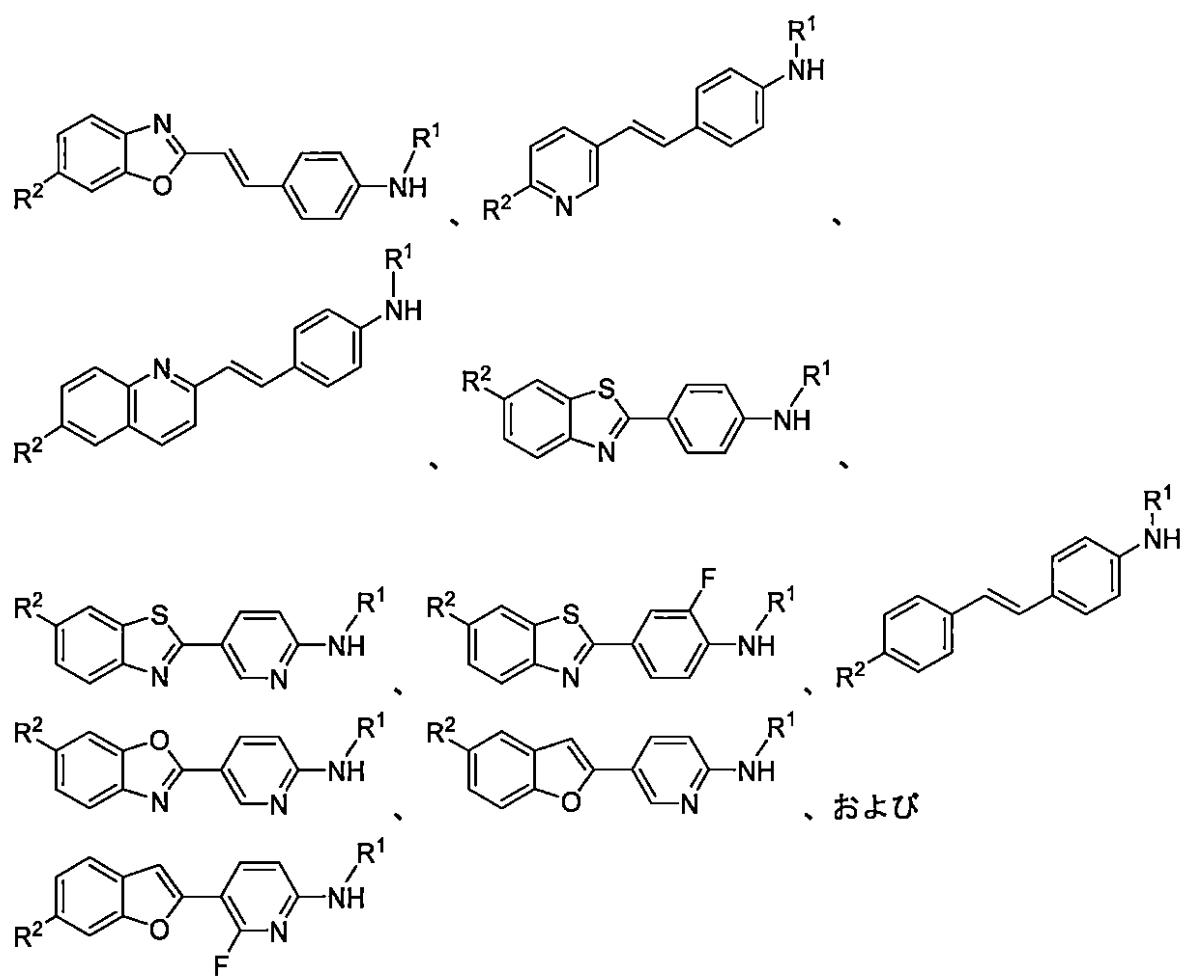


からなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

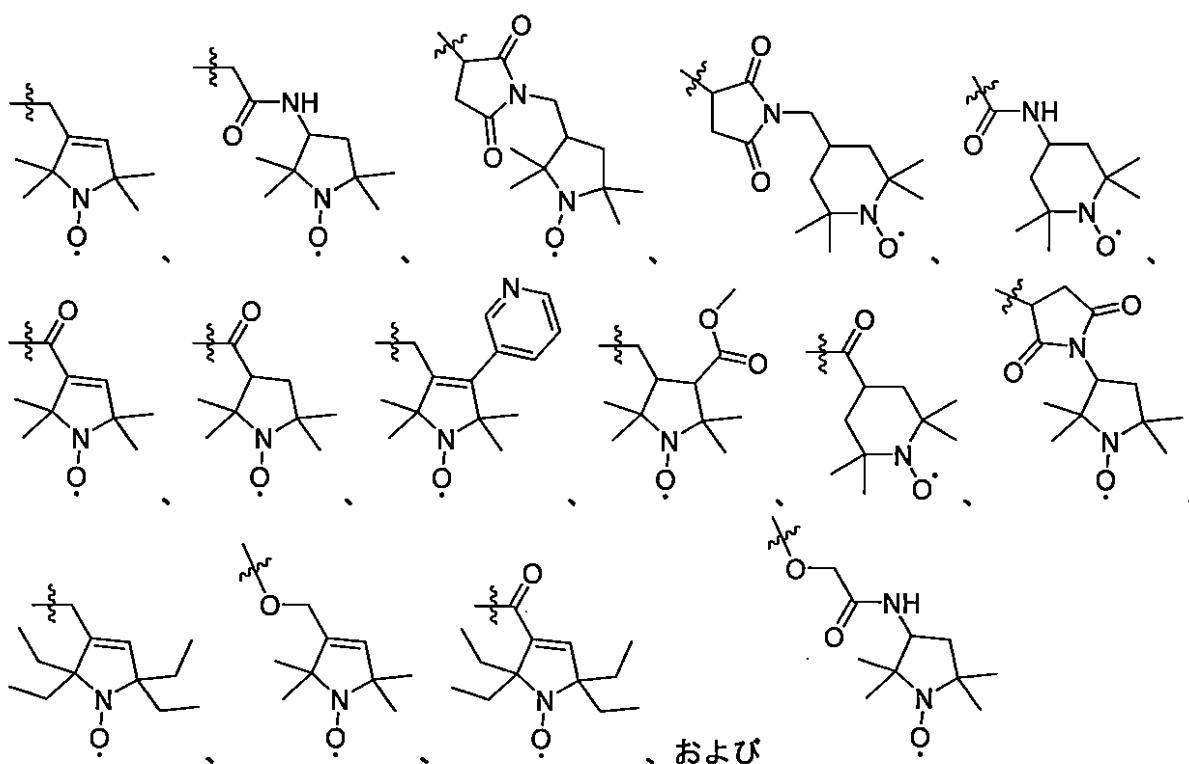
【請求項7】

前記化合物は、

【化 3】

(式中、 $R^1$ は、

【化 4】



からなる群より選択され；かつ、

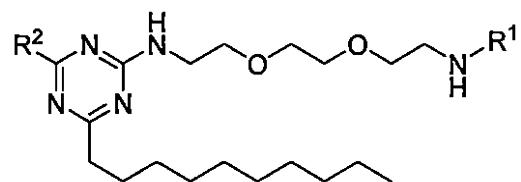
R<sup>2</sup>は、OH、OCH<sub>3</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F、CH<sub>3</sub>、および(OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>Fからなる群より選択される)

からなる群より選択される、請求項 1 に記載の組成物。

### 【請求項 8】

前記化合物は、構造：

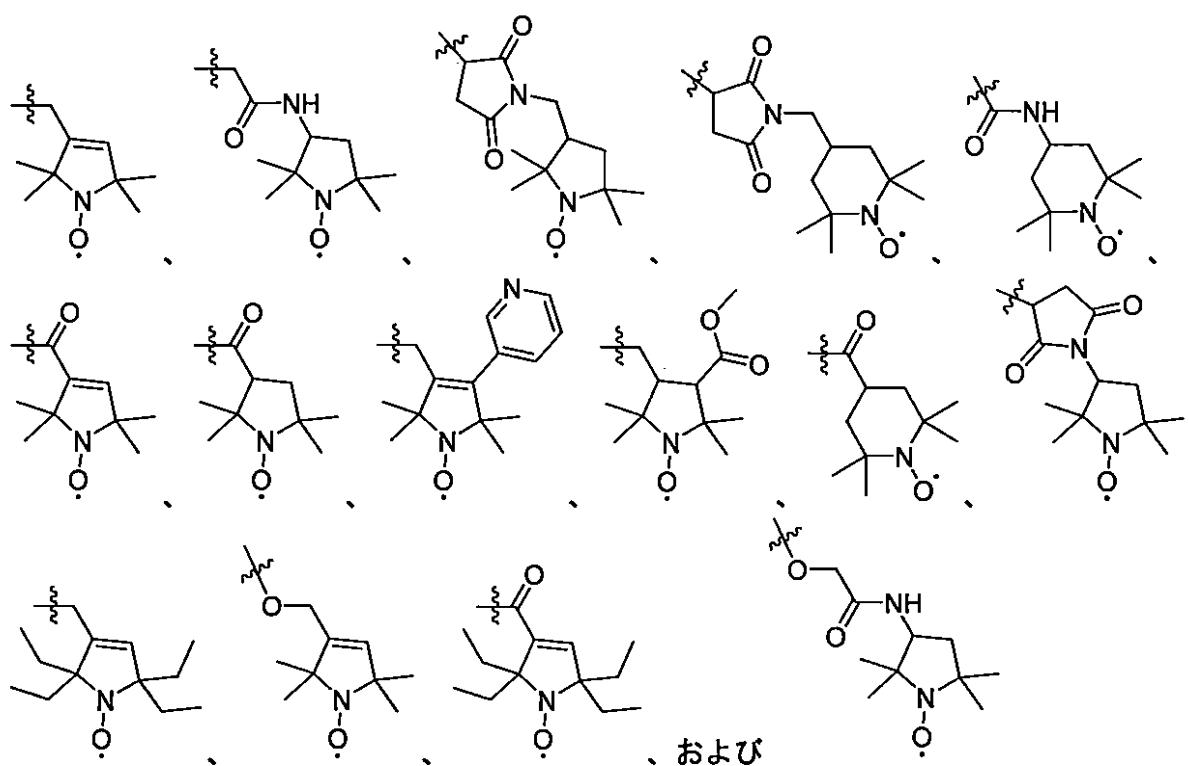
【化 5】



(式中、

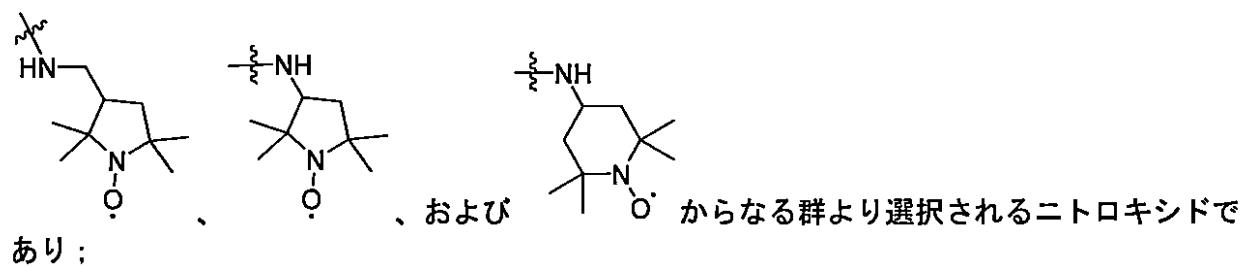
R<sup>1</sup>は、メチル又は

【化6】



からなる群より選択されるニトロキシドであり；かつ、  
R<sup>2</sup>は、プロピルアミン又は

【化7】

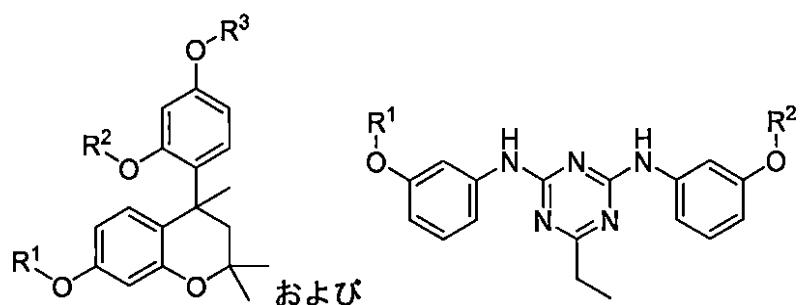


ここで、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>のうち少なくとも一方は、ニトロキシドである。 )  
を有する、請求項1に記載の組成物。

【請求項9】

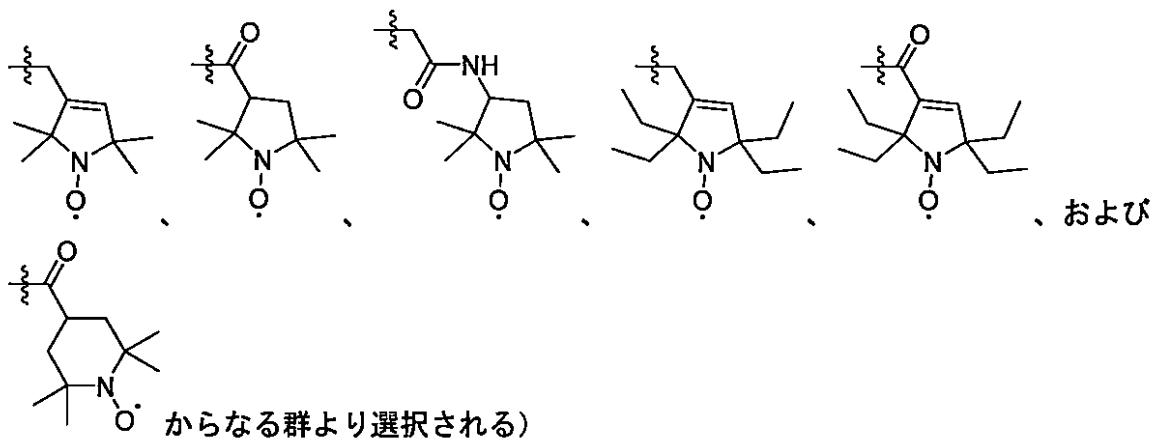
前記化合物は、

【化 8】



(式中、  
R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、およびR<sup>3</sup>は、それぞれ独立して

【化 9】

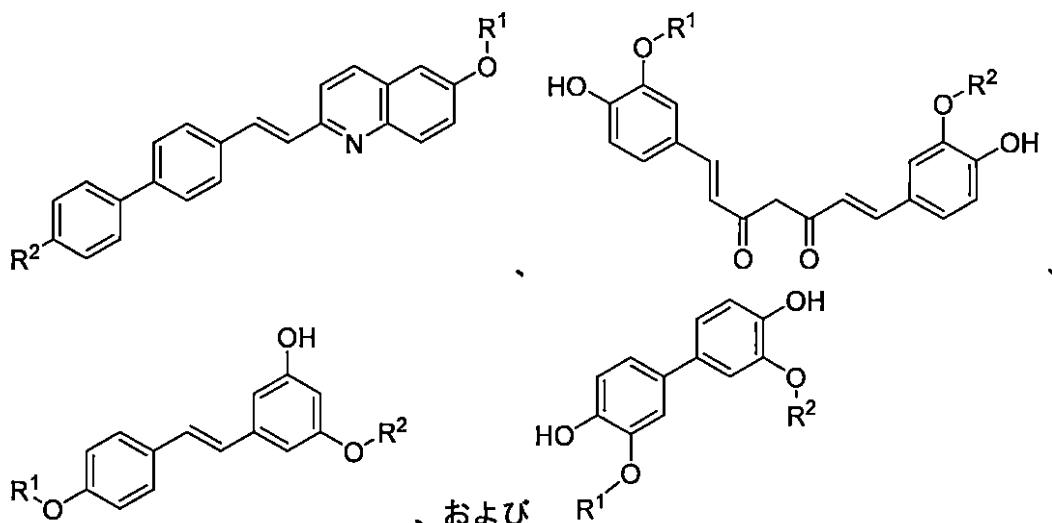


からなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

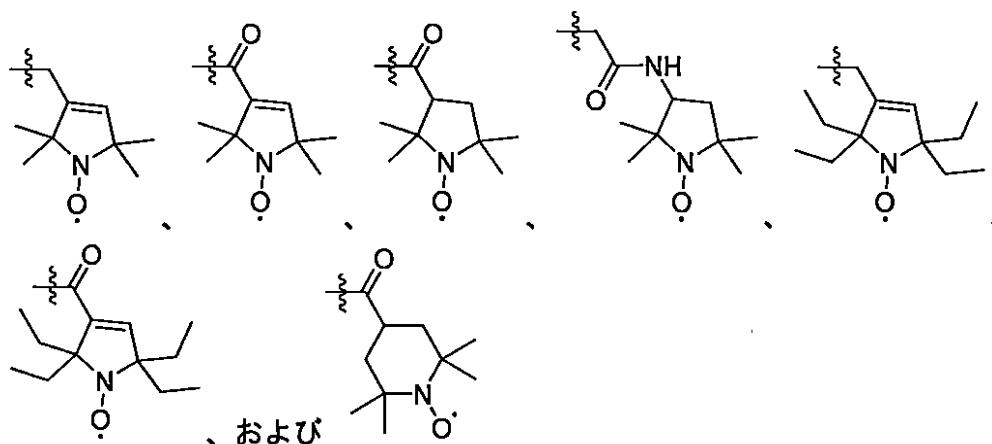
【請求項10】

前記化合物は、

【化10】



(式中、  
 R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>はそれぞれ独立してH又は  
 【化11】)

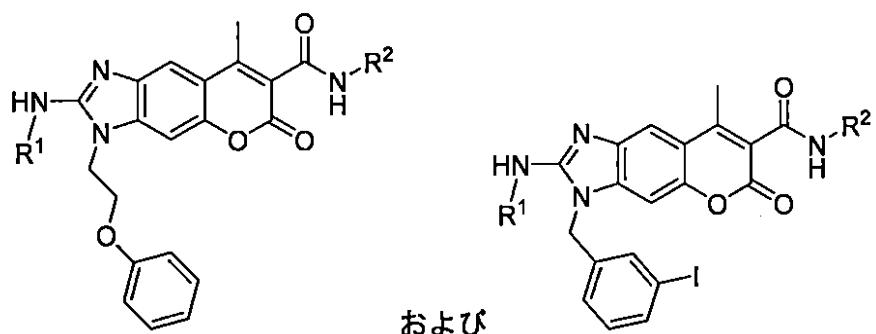


からなる群より選択されるニトロキシドであり、  
 ここで、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>のうち少なくとも一方は、ニトロキシドである)  
 からなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

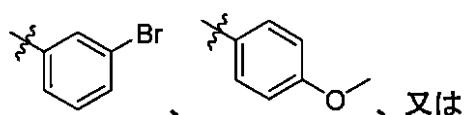
【請求項11】

前記化合物は、

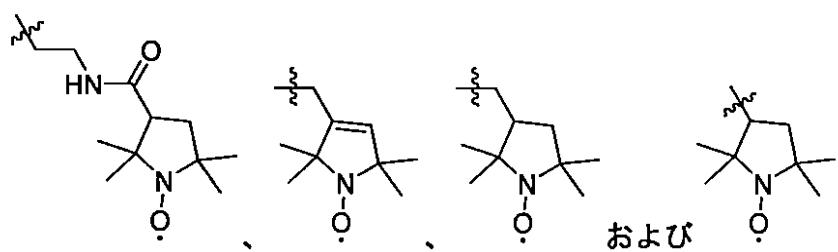
【化12】



(式中、  
 R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>はそれぞれ独立してH、  
 【化13】)



【化14】

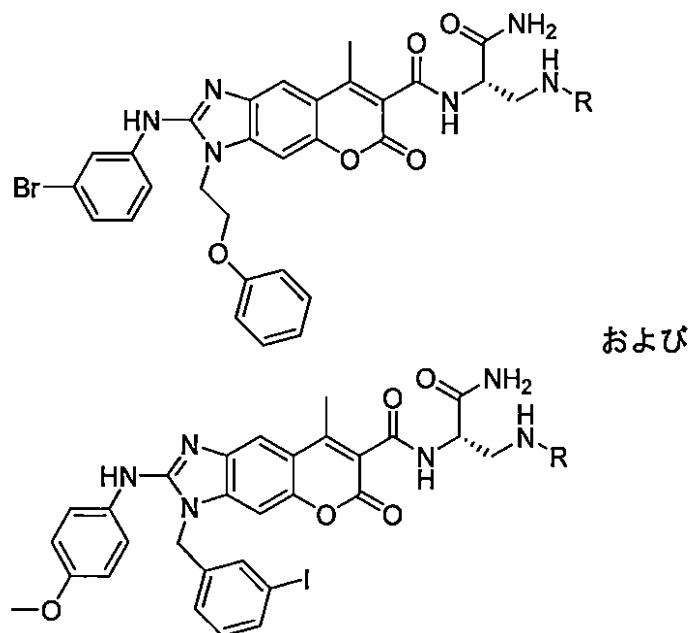


からなる群より選択されるニトロキシドであり、  
 ここで、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>のうち少なくとも一方は、ニトロキシドである )  
 からなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項12】

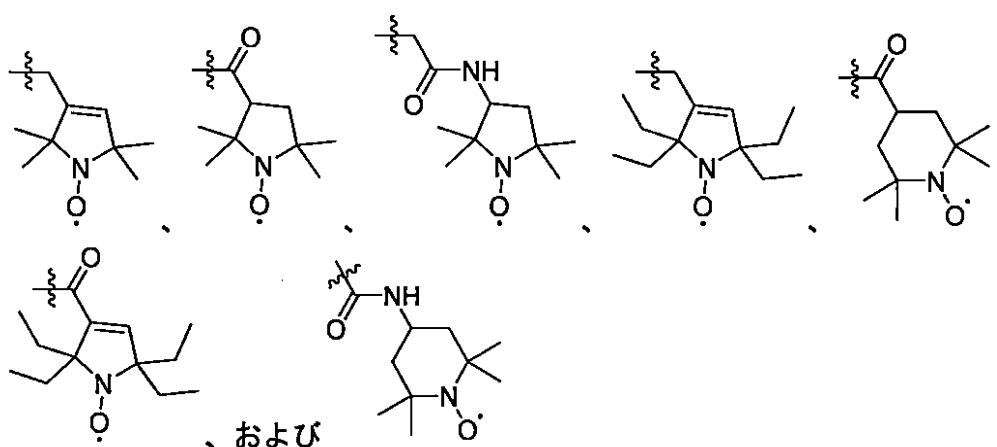
前記化合物は、

【化15】



(式中、Rは、

【化16】



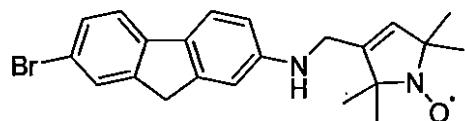
からなる群より選択される。)

からなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項13】

前記化合物は、構造：

【化17】

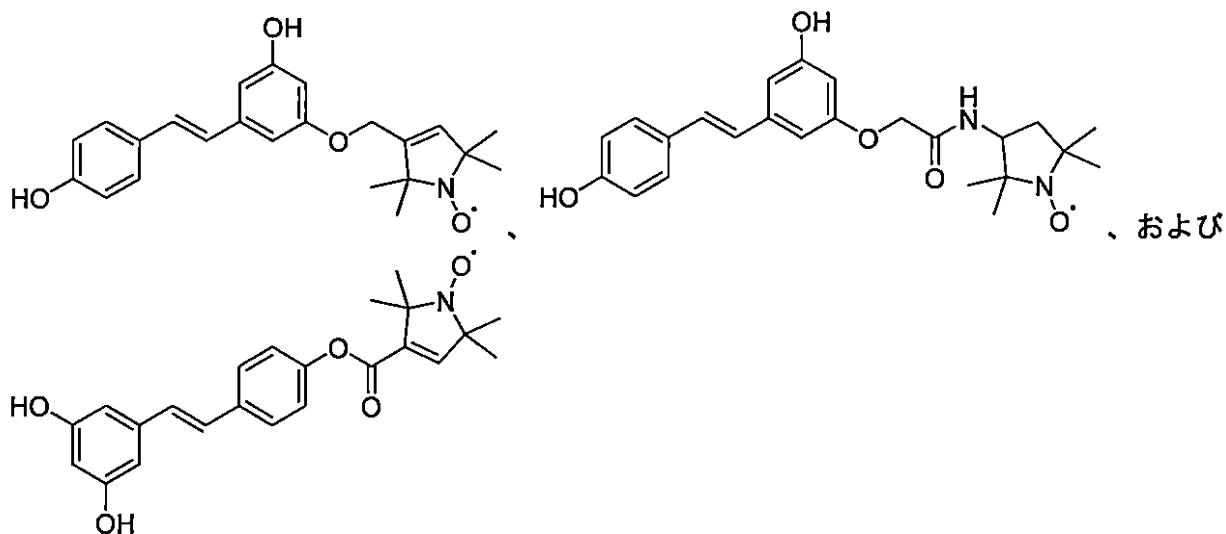


を有する、請求項1に記載の組成物。

【請求項14】

前記化合物は、

【化18】

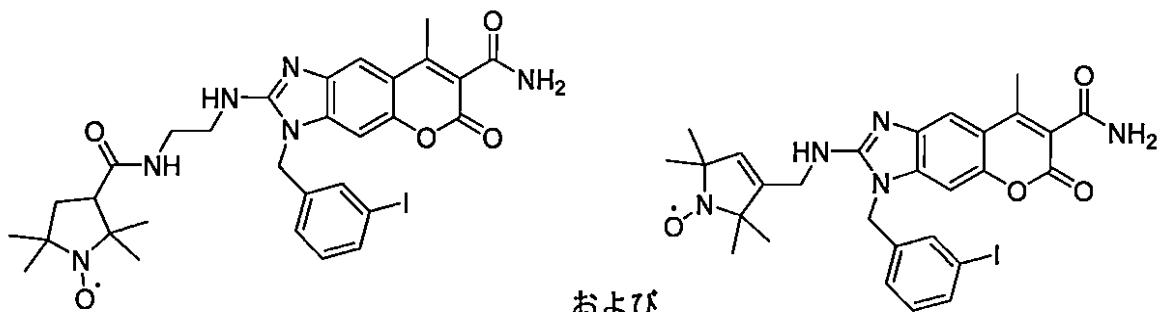


からなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項15】

前記化合物は、

【化 19】

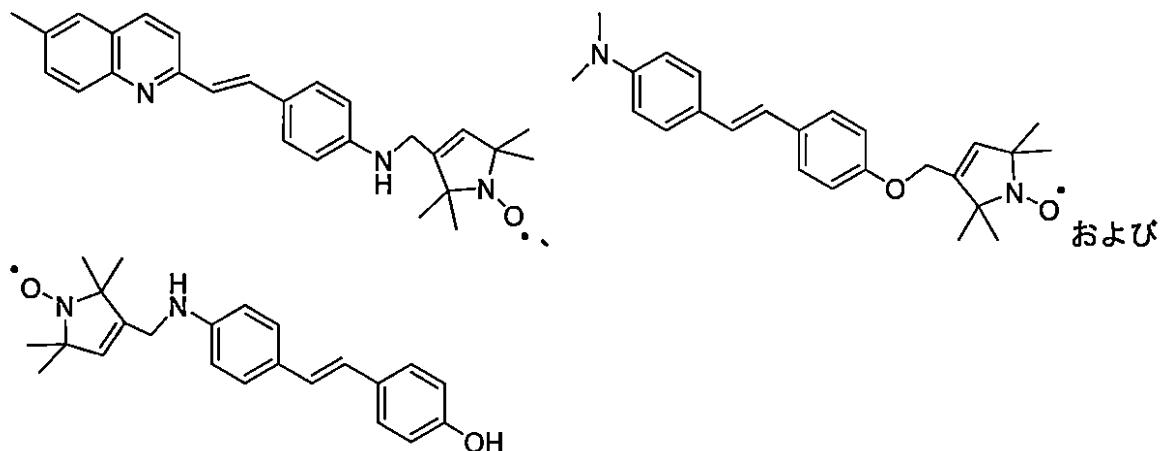


からなる群より選択される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 16】

前記化合物は、

【化 20】



からなる群より選択される、請求項 1 に記載の組成物。

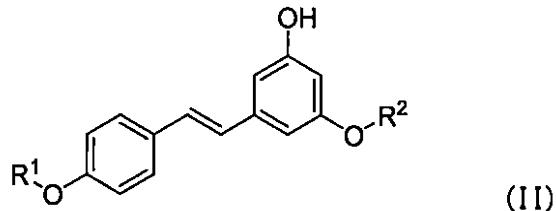
【請求項 17】

前記対象は、治療目的で前記化合物を受けていない、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 18】

式II：

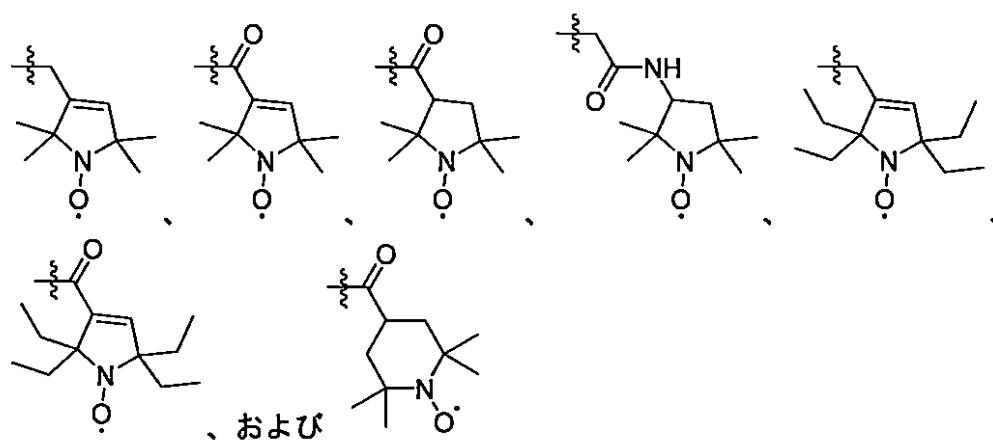
【化 21】



(式中、

$R^1$  および  $R^2$  はそれぞれ独立して H 又は

【化 2 2】

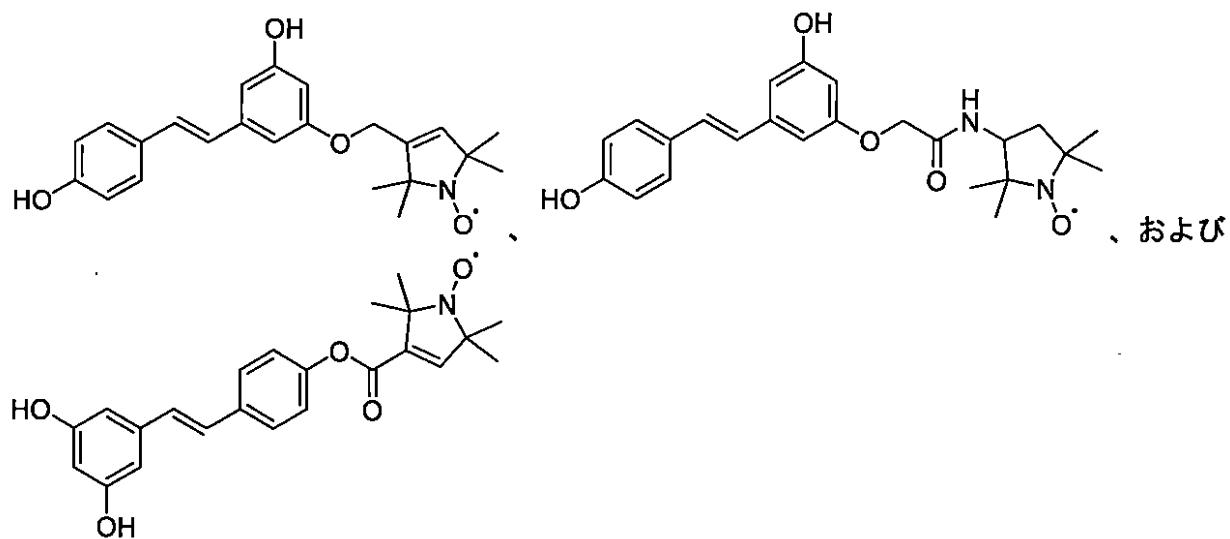


からなる群より選択されるニトロキシドであり、  
ここで、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>のうち少なくとも一方は、ニトロキシドである。)を有する化合物。

【請求項 1 9】

前記化合物は、

【化 2 3】

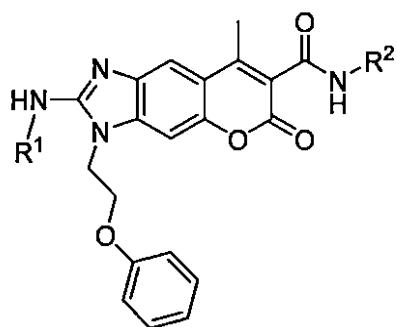


からなる群より選択される、請求項 1 8に記載の化合物。

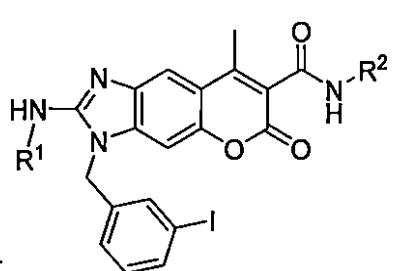
【請求項 2 0】

式：

【化24】



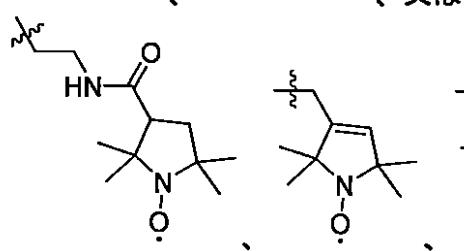
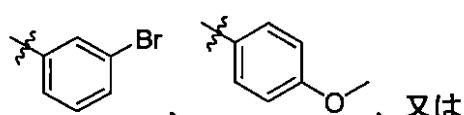
(III)、又は



(IV)

(式中、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>はそれぞれ独立してH、

【化25】



および

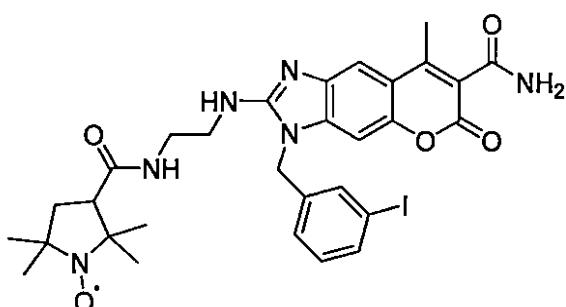
からなる群より選択されるニトロキシドであり、

ここで、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>のうち少なくとも一方は、ニトロキシドである)を有する化合物。

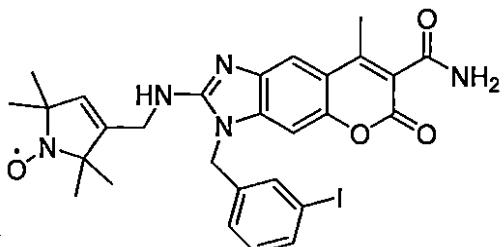
【請求項21】

前記化合物は、

【化26】



および

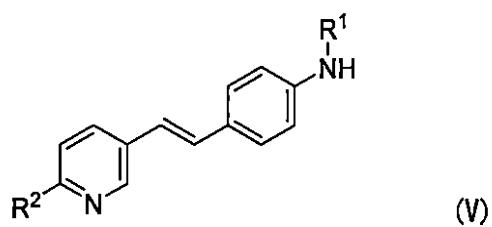


からなる群より選択される、請求項20に記載の化合物。

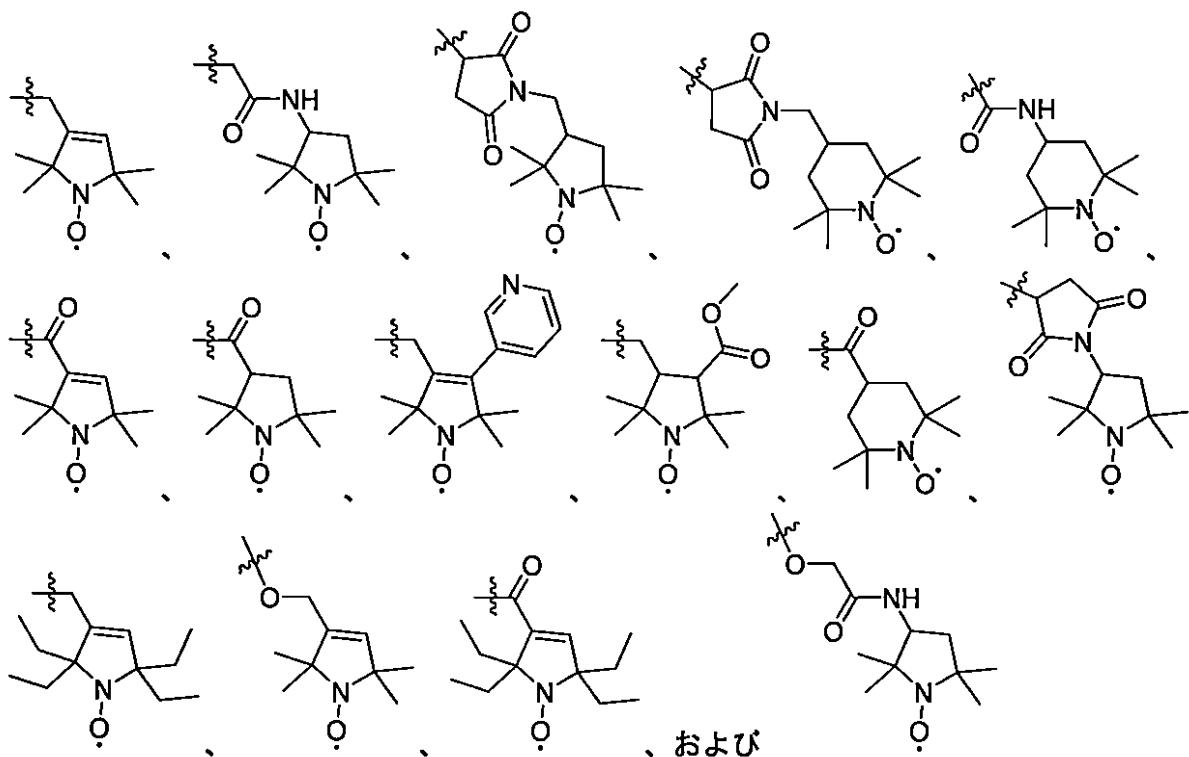
【請求項22】

式：

【化27】



(式中、R<sup>1</sup>は、  
【化28】

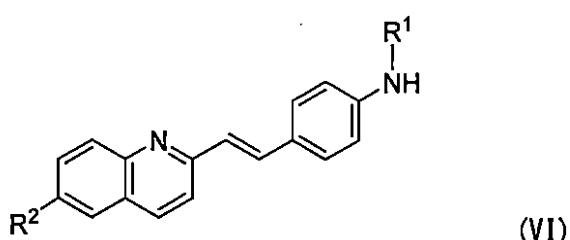


からなる群より選択され；かつ、  
R<sup>2</sup>は、OH、OCH<sub>3</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F、CH<sub>3</sub>、および(OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>Fからなる群より選択される）を有する化合物。

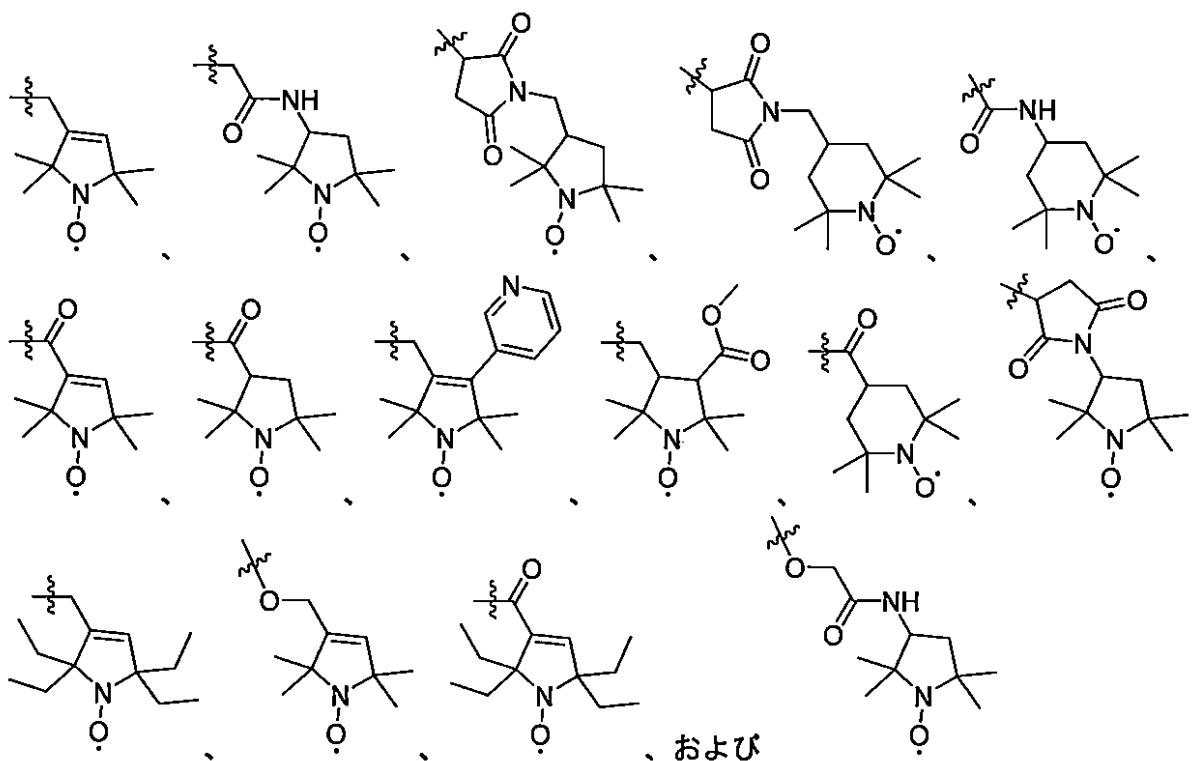
【請求項23】

式：

【化29】

(式中、R<sup>1</sup>は、

【化30】

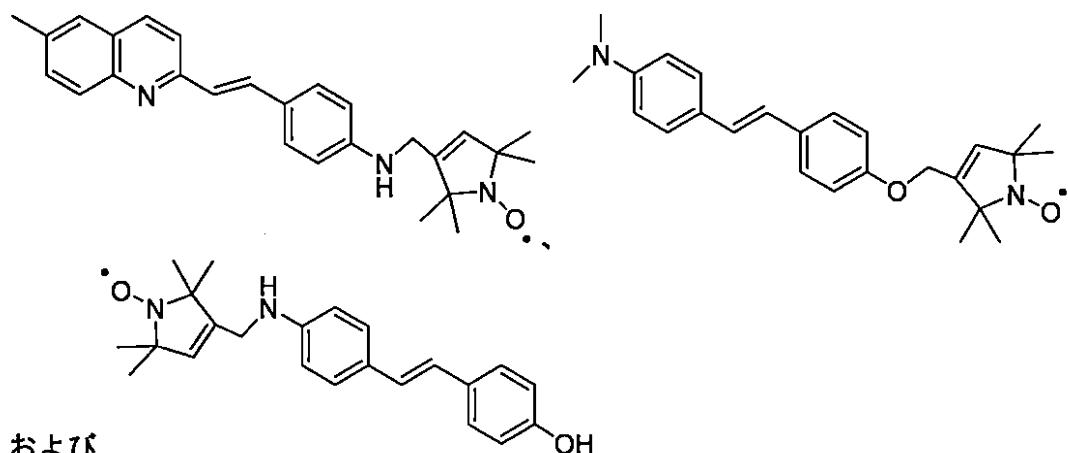


からなる群より選択され；かつ、

 $R^2$ は、OH、 $OCH_3$ 、 $OCH_2CH_3$ 、 $OCH_2CH_2F$ 、 $CH_3$ 、および $(OCH_2CH_2)_3F$ からなる群より選択される）を有する化合物。

【請求項24】

【化31】



からなる群より選択される化合物。

【請求項25】

式1：

 $X-(Y)_n \quad (1)$ 

（式中、

Xは、アミロイド結合性化合物であり；

Yはニトロキシドであり；かつ、  
nは1～3の整数である)  
の化合物を含む、アミロイドを画像化するための診断用組成物。

【請求項26】

請求項18～23のいずれか1項に記載の化合物を含む、疾患を治療するための医薬組成物。

【請求項27】

前記疾患は、アルツハイマー病である、請求項26に記載の医薬組成物。