

【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 I :

$X-(Y)_n$ (I)

(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、

Chemical structures of various compounds, including polymers and small molecules, are shown. The structures include:

- Polymers with repeating units containing pyridine, benzene, and amine groups.
- Small molecules with various functional groups, including hydroxyl, amino, and ether groups.
- Compounds with complex ring systems, including fused heterocycles and substituted benzene rings.

および

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、

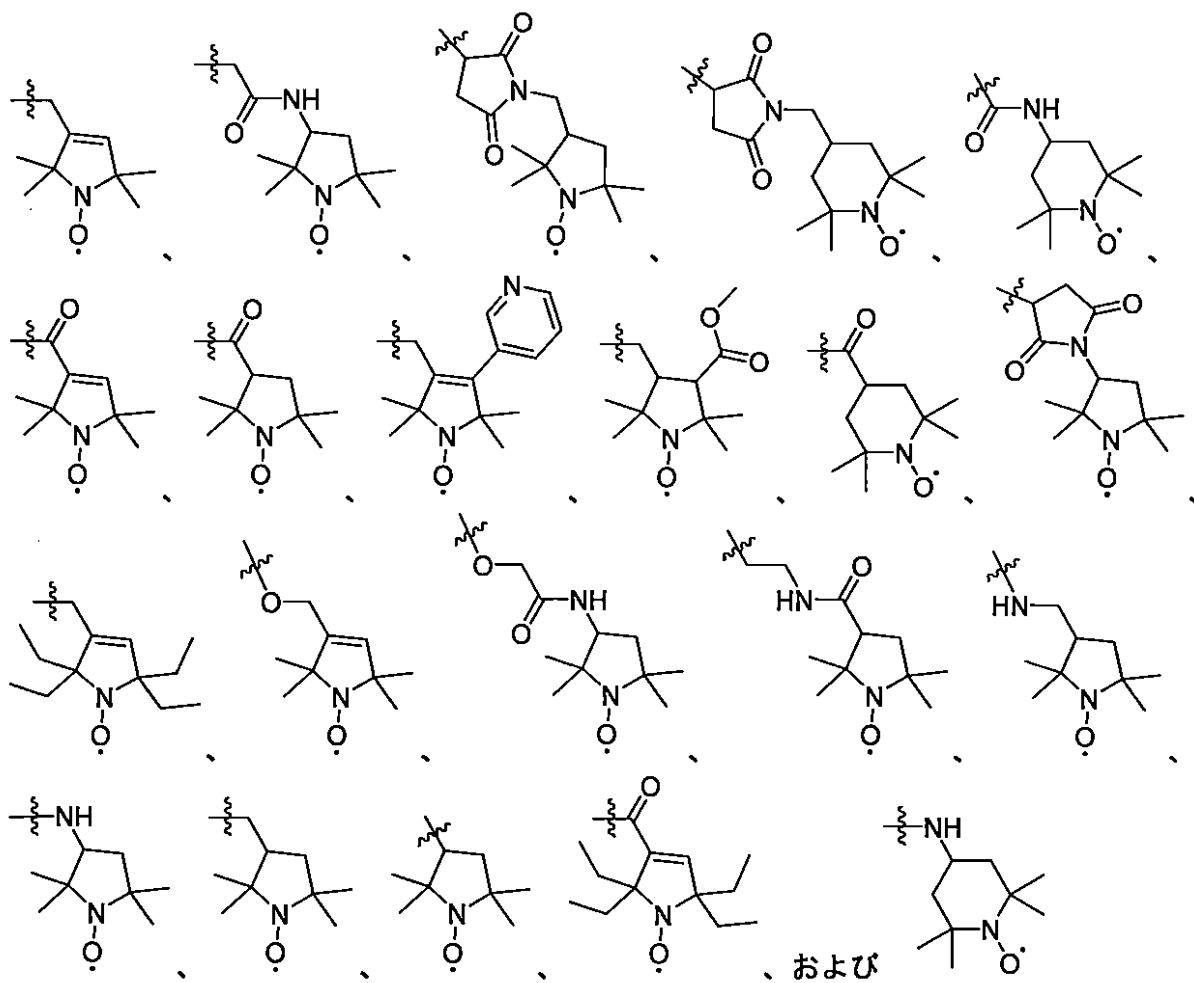
qは2～5の整数である)

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】

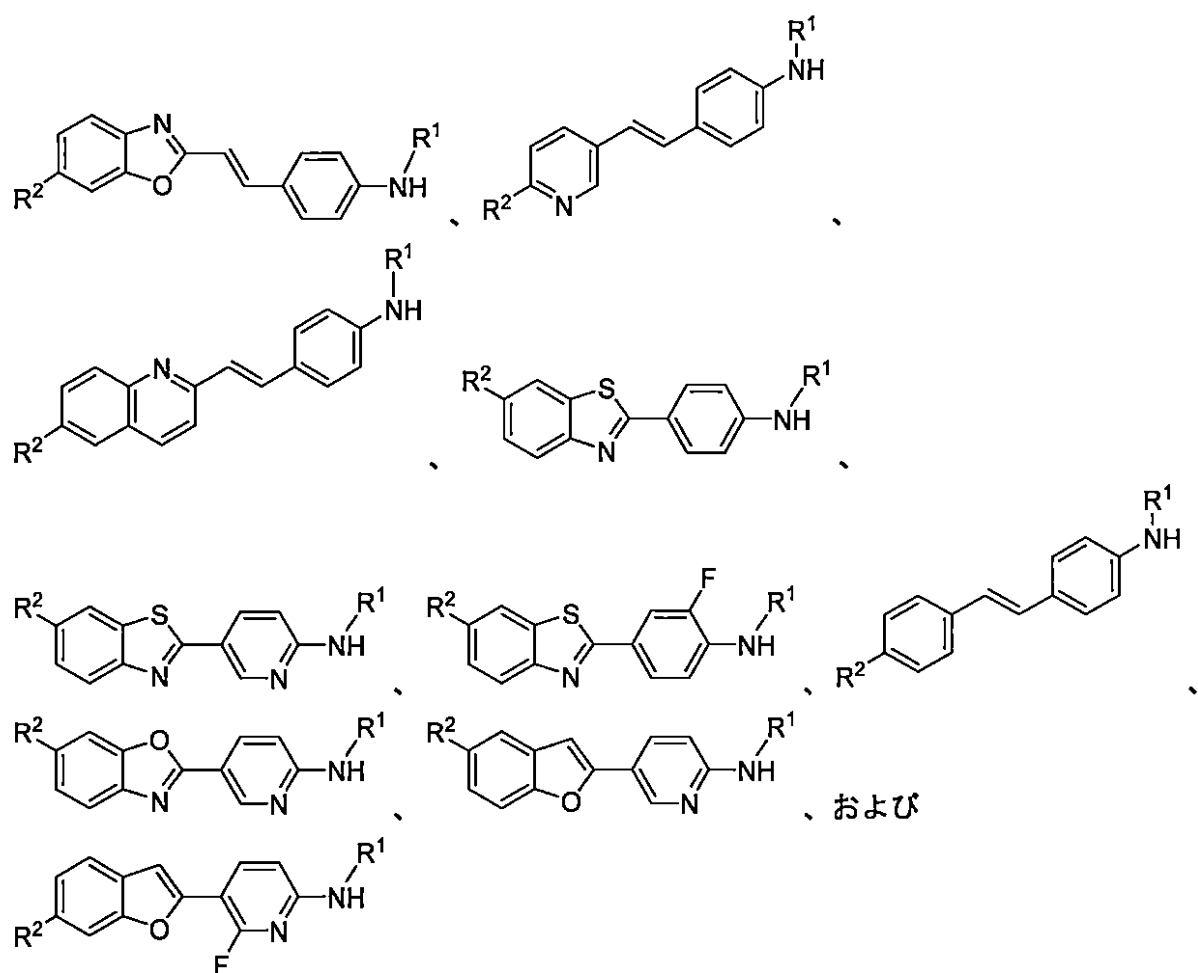


からなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

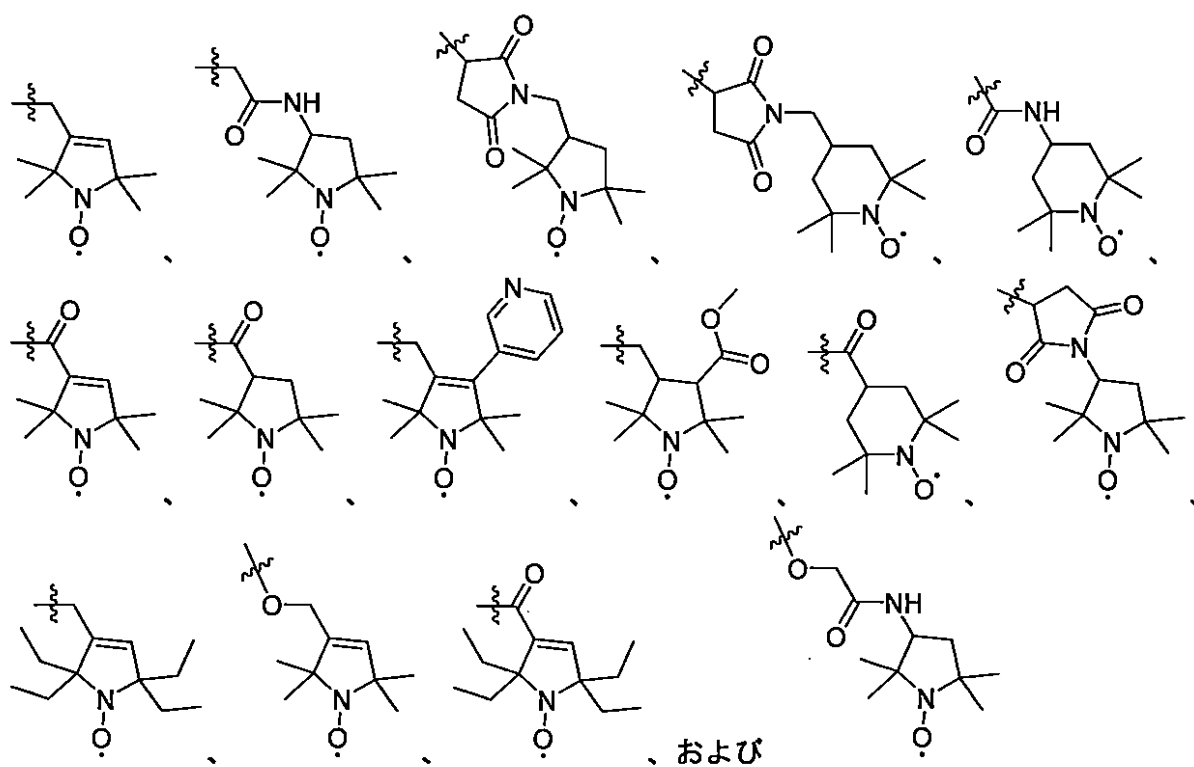
【請求項7】

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、

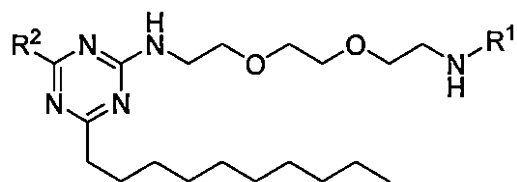
R^2 は、OH、 OCH_3 、 OCH_2CH_3 、 OCH_2CH_2F 、 CH_3 、および $(OCH_2CH_2)_3F$ からなる群より選択される)

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：

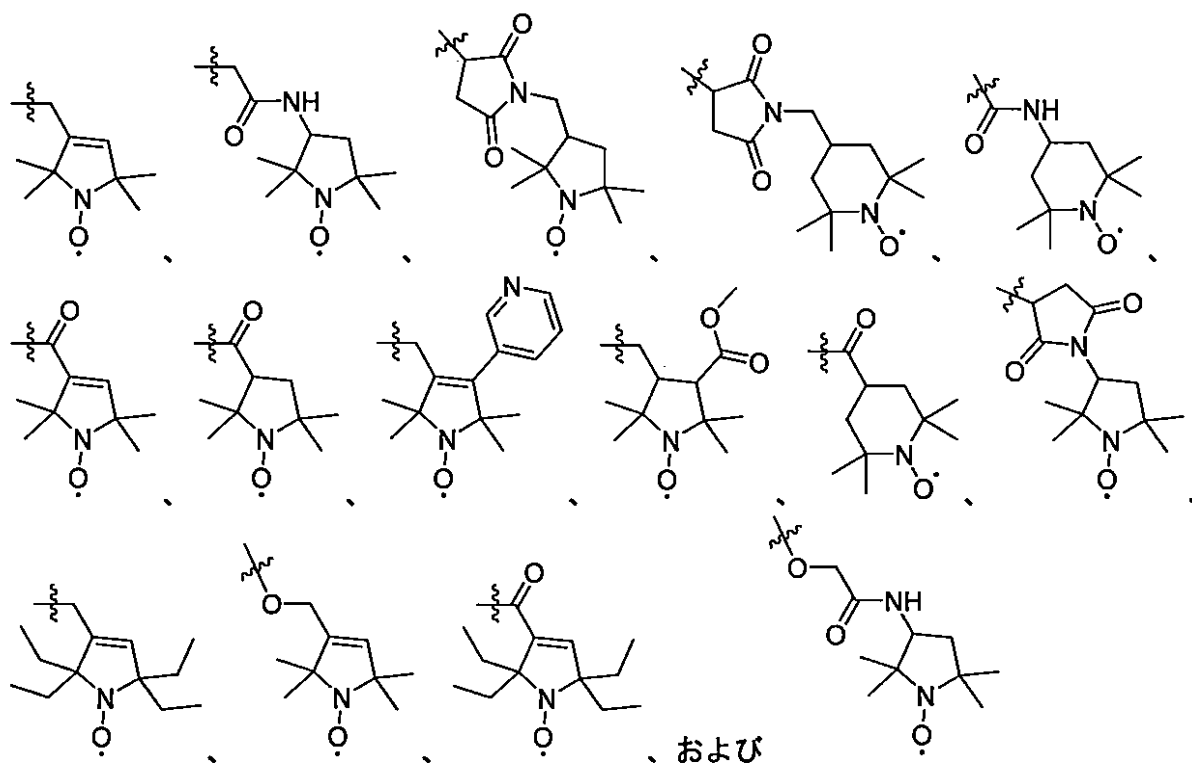
【化 5】



(式中、

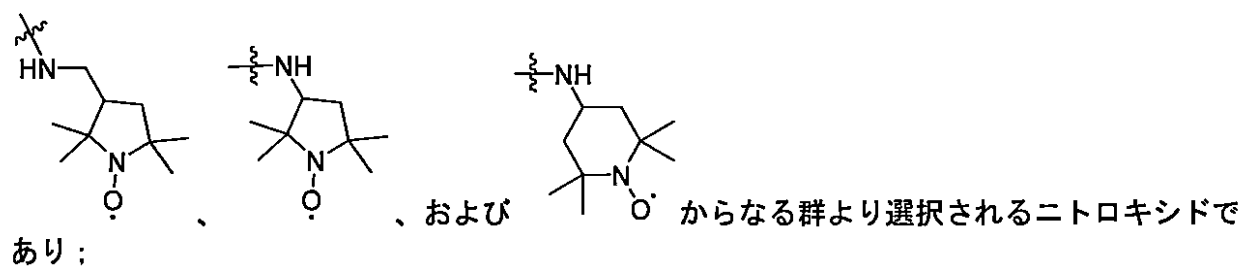
R^1 は、メチル又は

【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^2 は、プロピルアミン又は

【化 7】

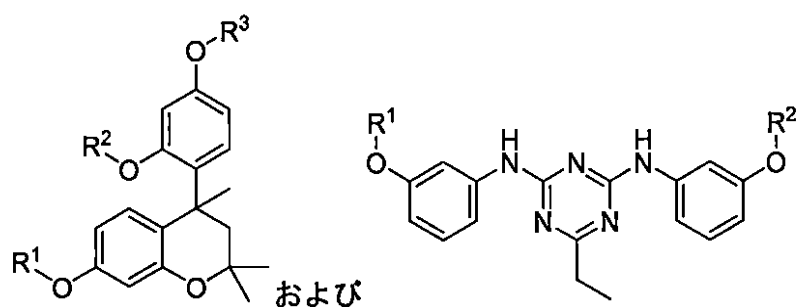


ここで、 R^1 および R^2 のうち少なくとも一方は、ニトロキシドである。)
 を有する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 9】

前記化合物は、

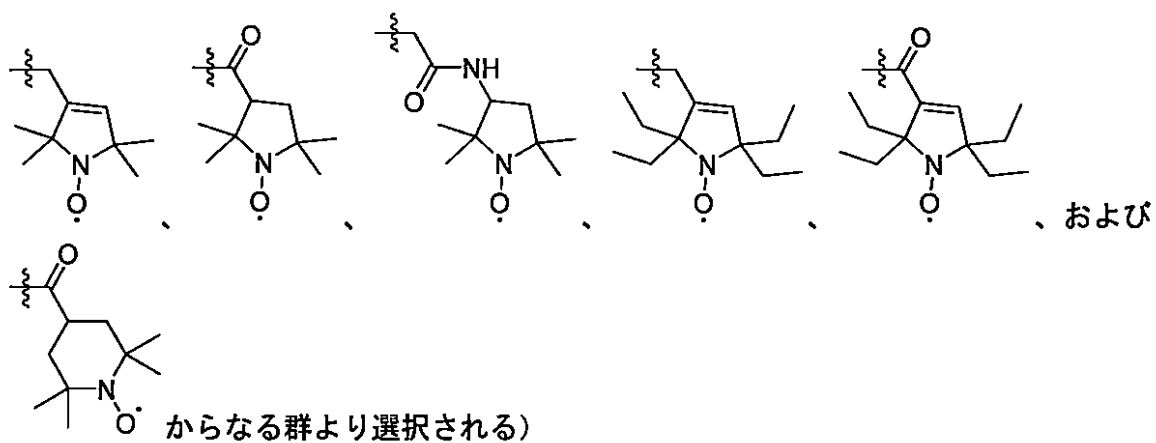
【化 8】



(式中、

 R^1 、 R^2 、および R^3 は、それぞれ独立して

【化 9】



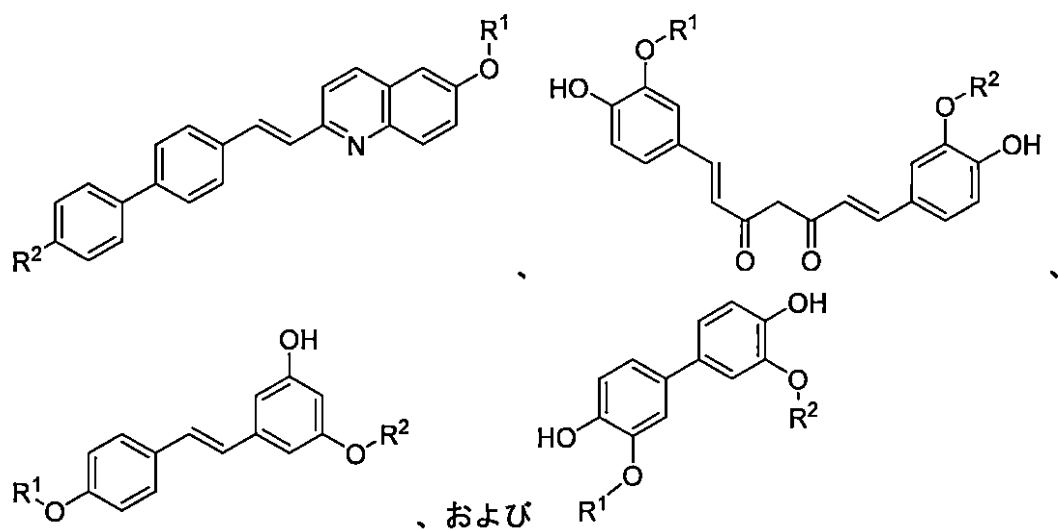
からなる群より選択される)

からなる群より選択される、請求項 1 に記載の組成物。

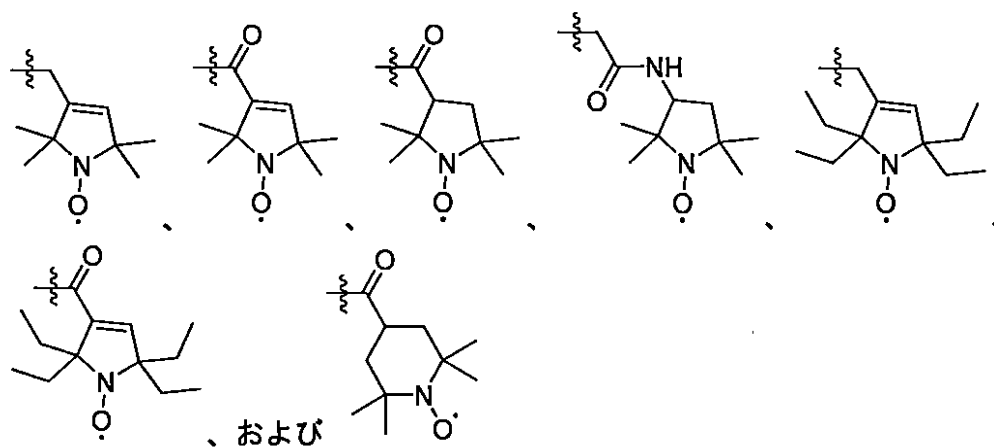
【請求項 10】

前記化合物は、

【化 10】



(式中、
 R^1 および R^2 はそれぞれ独立してH又は
 【化11】

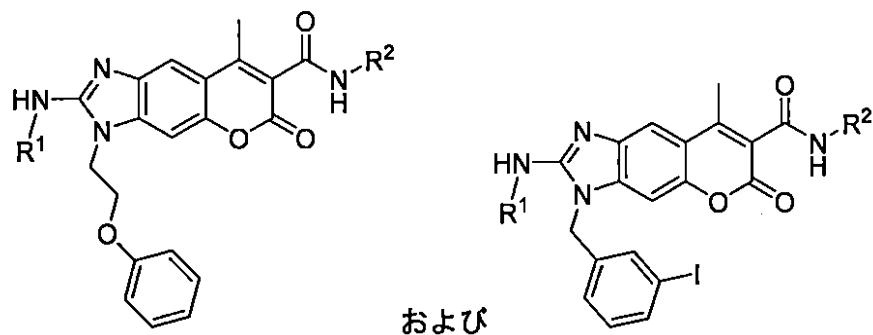


からなる群より選択されるニトロキシドであり、
 ここで、 R^1 および R^2 のうち少なくとも一方は、ニトロキシドである)
 からなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

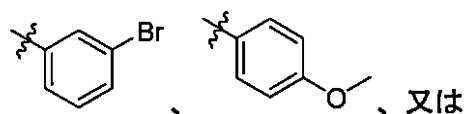
【請求項11】

前記化合物は、

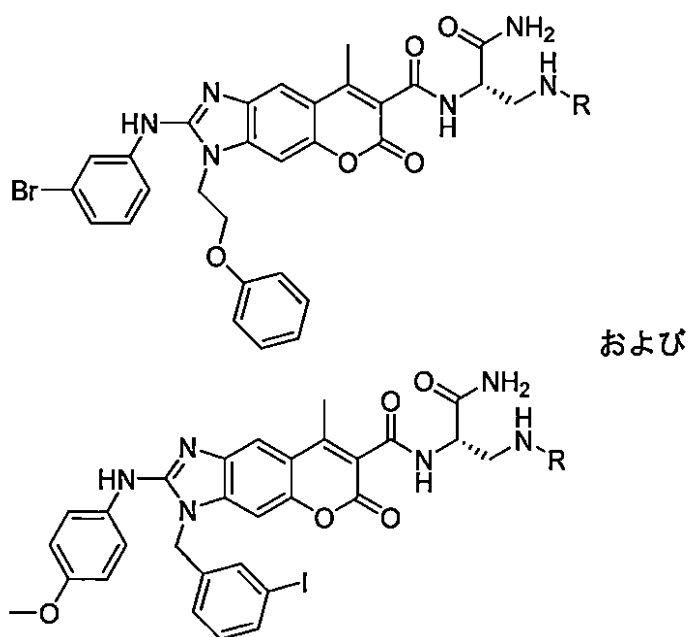
【化12】



(式中、
 R^1 および R^2 はそれぞれ独立してH、
 【化13】

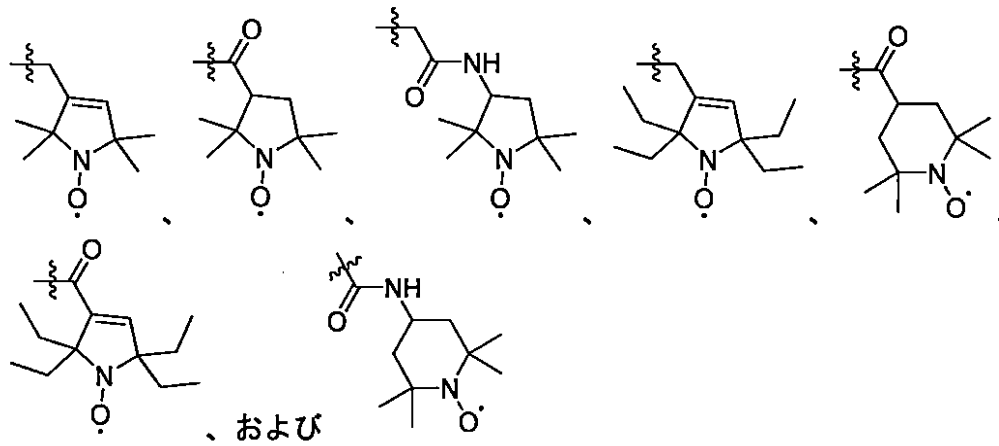


【化 1 5】



(式中、Rは、

【化 1 6】



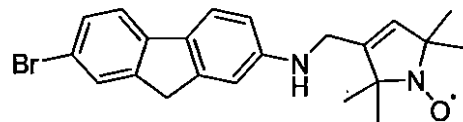
からなる群より選択される)

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 1 3】

前記化合物は、構造：

【化 1 7】

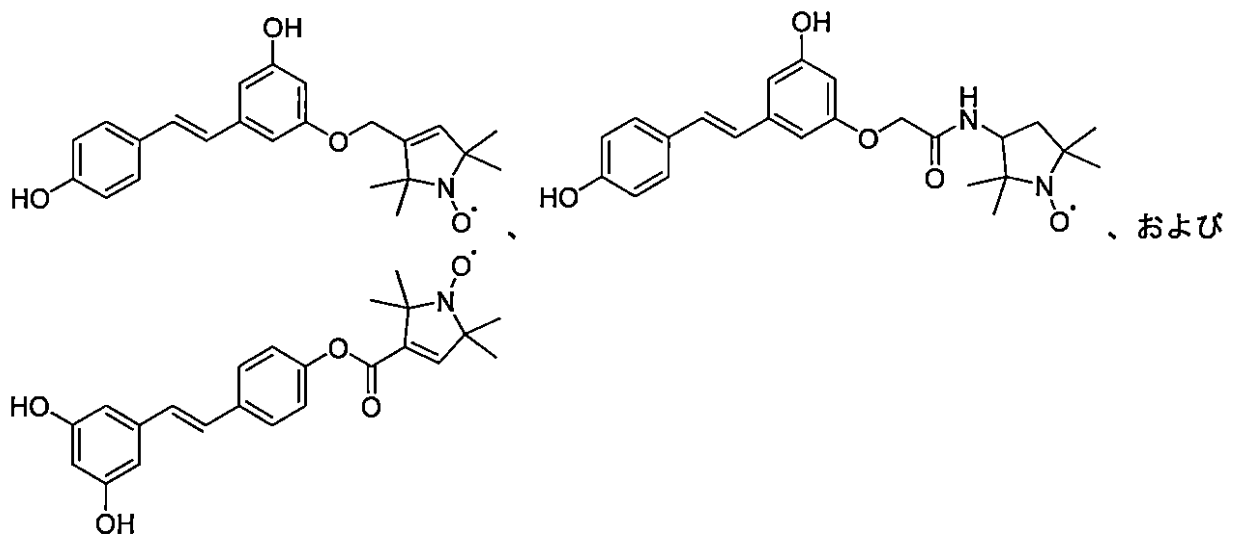


を有する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 1 4】

前記化合物は、

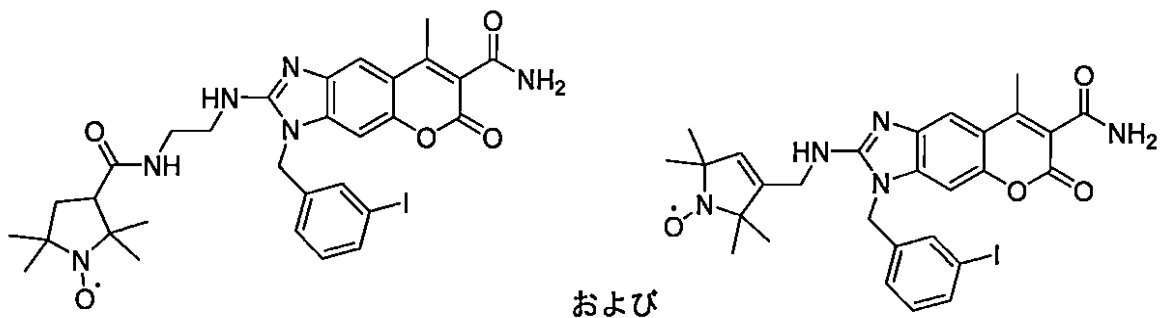
【化 1 8】



からなる群より選択される、請求項 1 に記載の組成物。

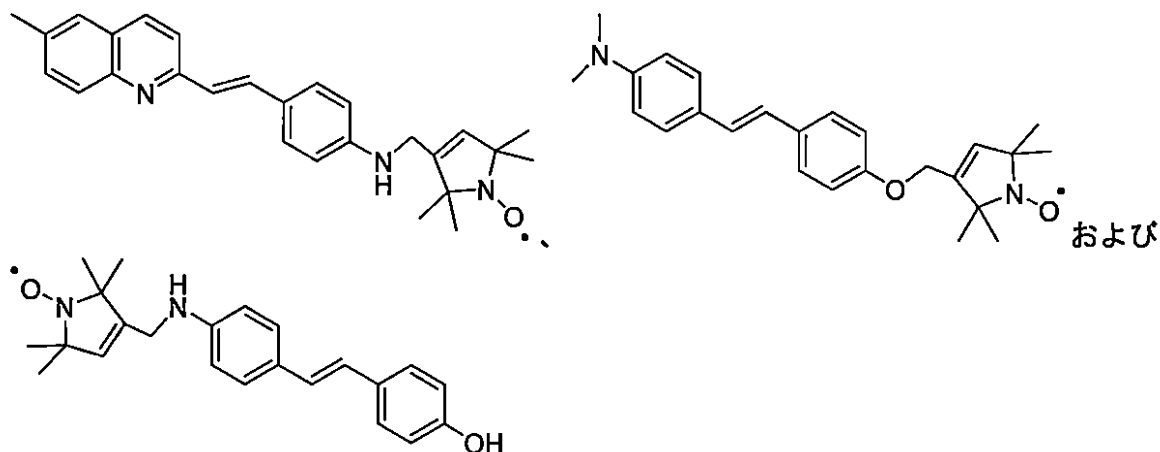
【請求項 1 5】

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】



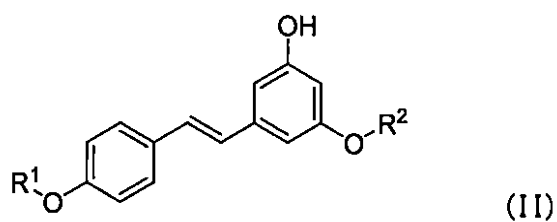
からなる群より選択される、請求項 1 に記載の組成物。
【請求項 17】

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】

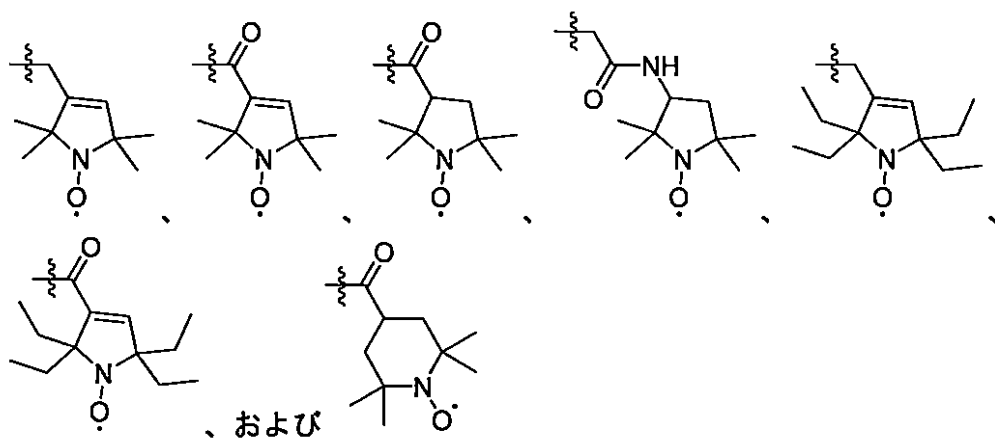
式 II :

【化 21】



(式中、
R¹およびR²はそれぞれ独立してH又は

【化 2 2】

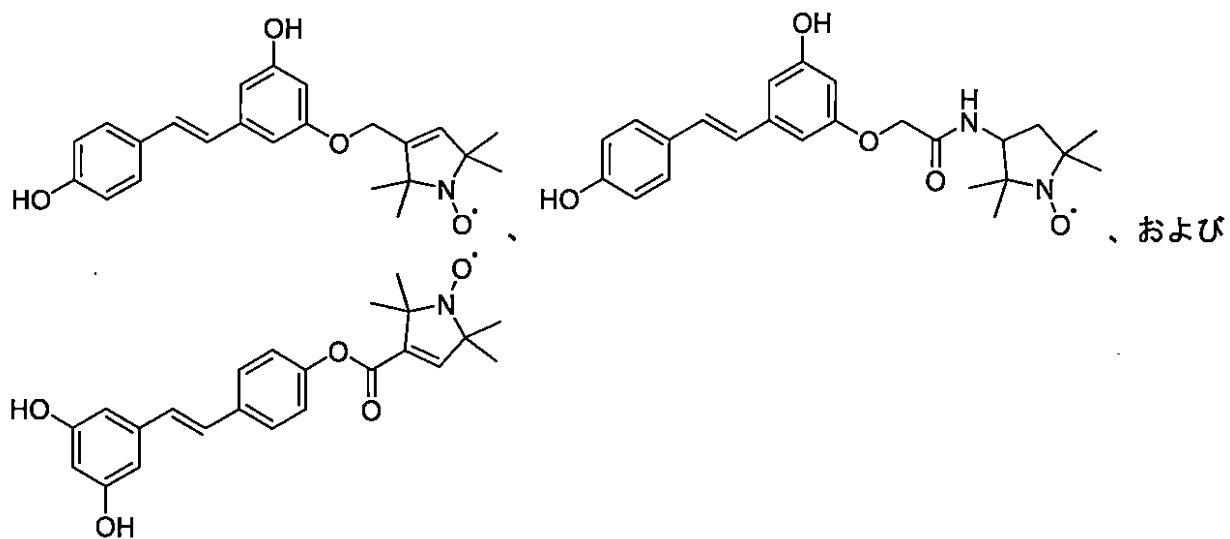


からなる群より選択されるニトロキシドであり、
 ここで、 R^1 および R^2 のうち少なくとも一方は、ニトロキシドである。)を有する化合物

【請求項 19】

前記化合物は、

【化 2 3】

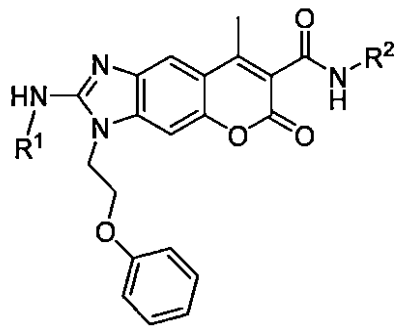


からなる群より選択される、請求項 18に記載の化合物。

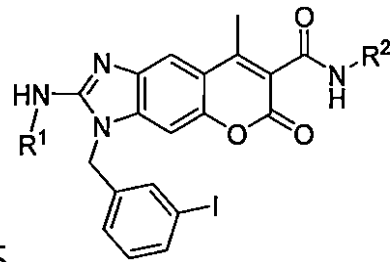
【請求項 20】

式：

【化 2 4】



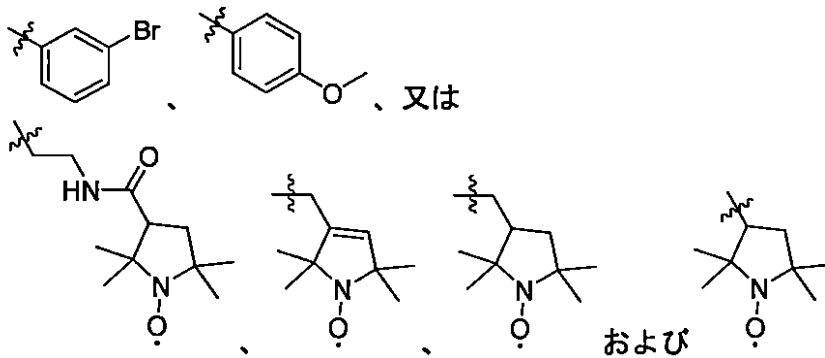
(III)、又は



(IV)

(式中、 R^1 および R^2 はそれぞれ独立して H、

【化 2 5】



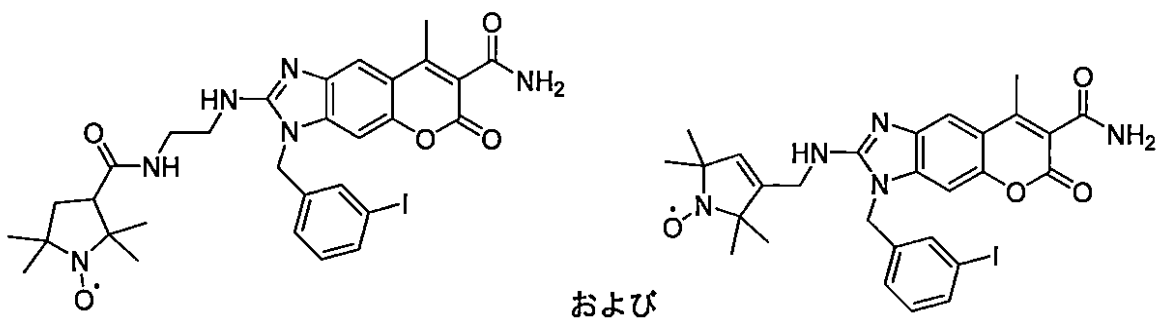
からなる群より選択されるニトロキシドであり、

ここで、 R^1 および R^2 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 2 1】

前記化合物は、

【化 2 6】



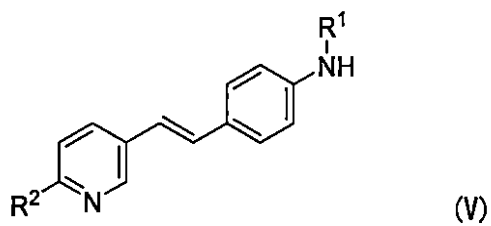
および

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 2 2】

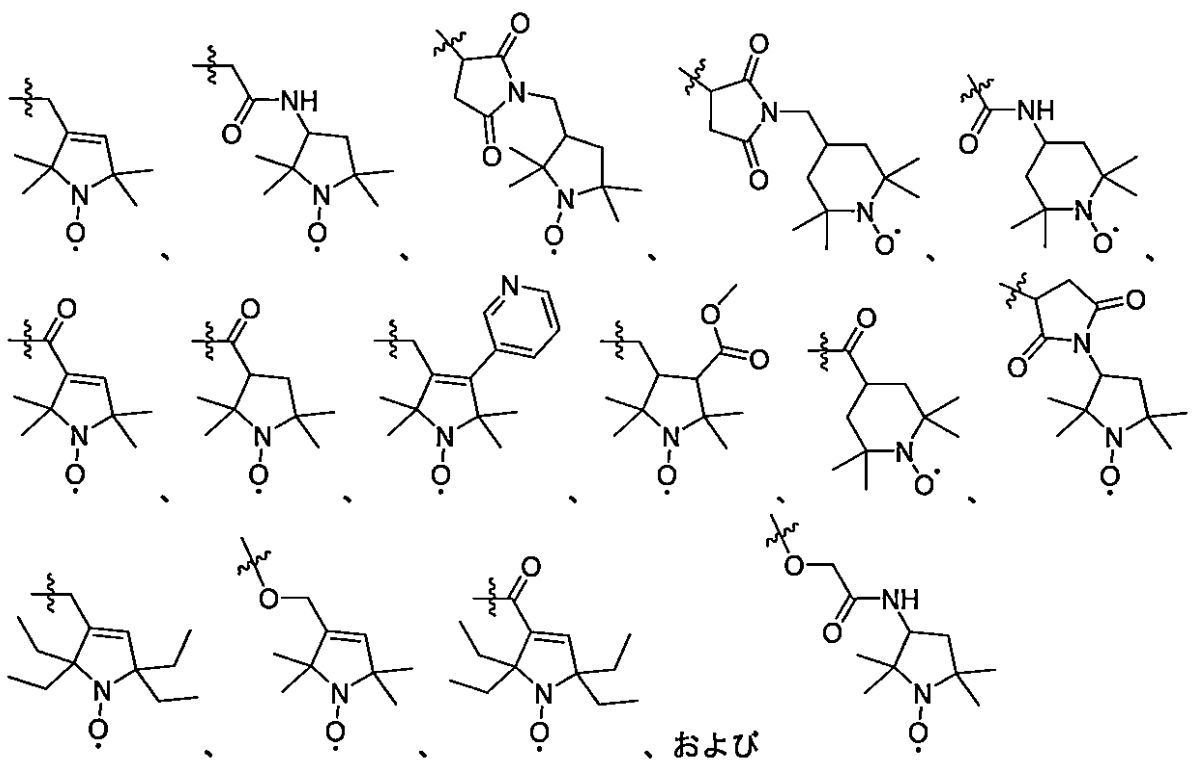
式：

【化 2 7】



(式中、R¹は、

【化 2 8】



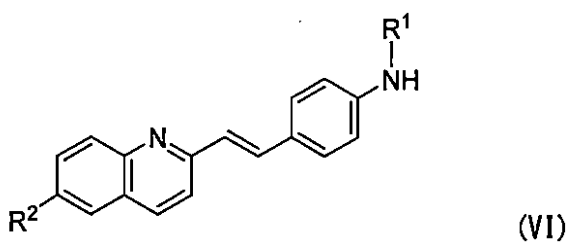
からなる群より選択され；かつ、

R²は、OH、OCH₃、OCH₂CH₃、OCH₂CH₂F、CH₃、および(OCH₂CH₂)₃Fからなる群より選択される)を有する化合物。

【請求項 2 3】

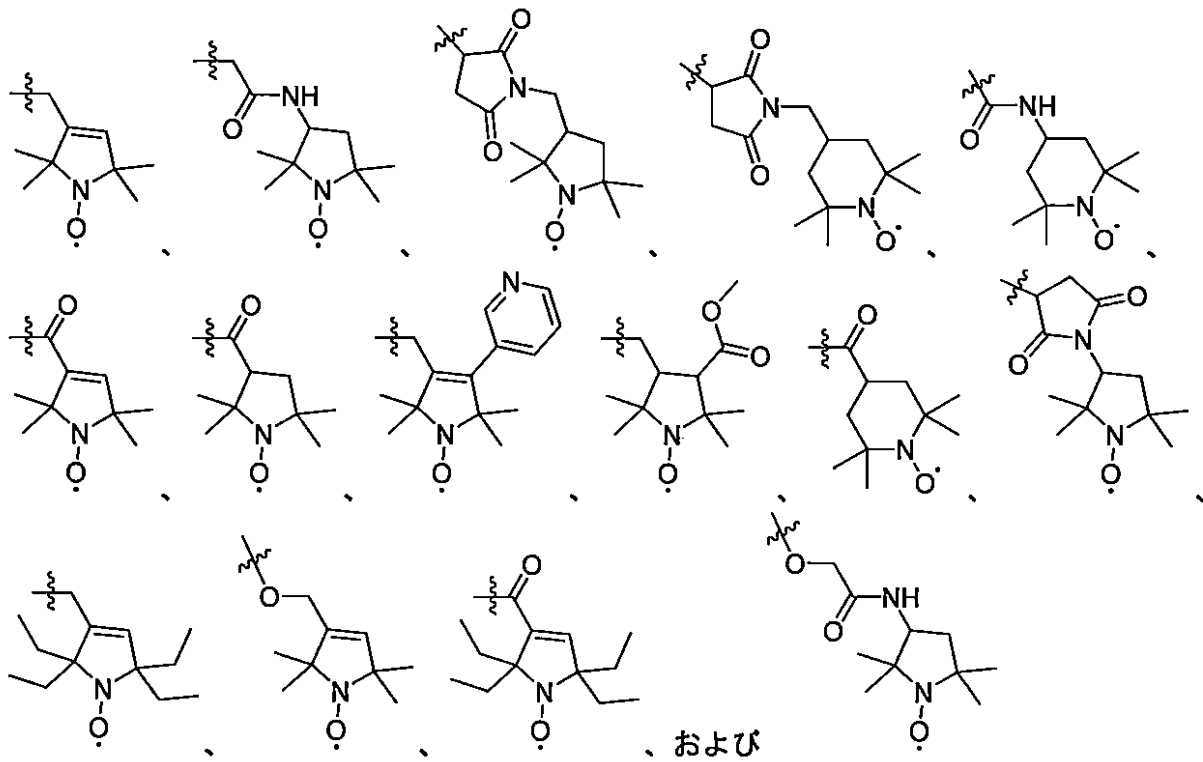
式：

【化 2 9】



(式中、R¹は、

【化 3 0】

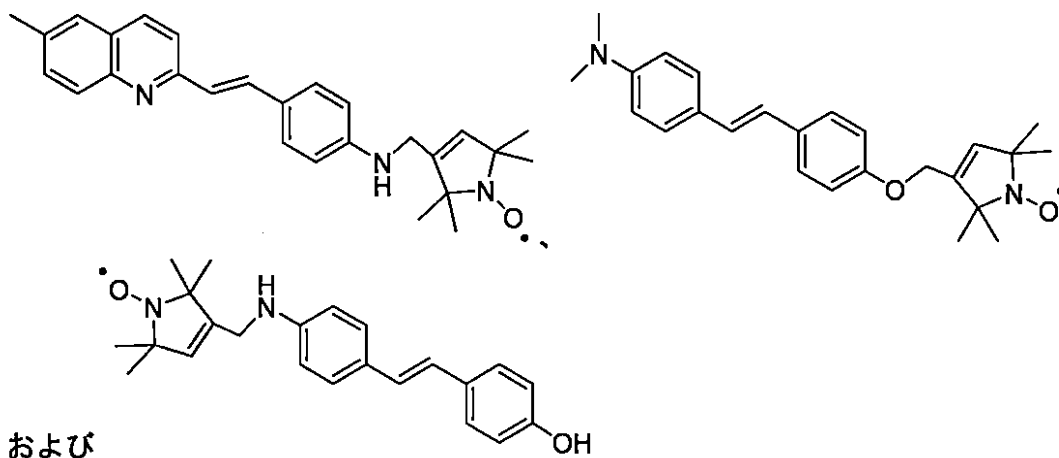


からなる群より選択され；かつ、

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 2 4】

【化 3 1】



からなる群より選択される化合物。

【請求項 2 5】

式 I :



(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。