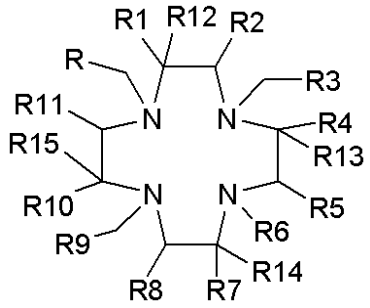
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成19年12月6日(2007.12.6)

【公表番号】特表2007-516288(P2007-516288A)
【公表日】平成19年6月21日(2007.6.21)
【年通号数】公開・登録公報2007-023
【出願番号】特願2006-547204(P2006-547204)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｆ　9/38　(2006.01)
Ｃ０７Ｆ　5/00　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　51/00　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　49/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　35/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　35/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　13/08　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｆ　9/38　ＣＳＰＣ
Ｃ０７Ｆ　9/38　Ｚ
Ｃ０７Ｆ　5/00　Ｄ
Ａ６１Ｋ　49/02　Ａ
Ａ６１Ｋ　43/00
Ａ６１Ｋ　49/00　Ｃ
Ａ６１Ｐ　35/00
Ａ６１Ｐ　35/04
Ａ６１Ｐ　13/08

【手続補正書】
【提出日】平成19年10月16日(2007.10.16)
【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】
ポリアザ大環状化合物および該ポリアザ大環状化合物の少なくとも一つのアザ基に置換されている少なくとも一つのホスホン酸基からなる化合物またはその塩形態。
【請求項２】
ポリアザ大環状化合物が一般式（ＩＩ）：

【化１】

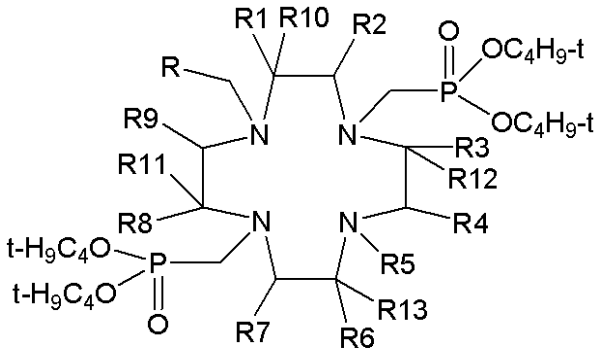


(II)

［式中、
$R^1 = R^2 = R^7 = R^8 = R^{10} = R^{11}$はＨであり；
R^{12}、R^{13}、R^{14}およびR^{15}はCH_3またはＨであり；
$R^4 = R^5$であり；
$R^{10} = R^{11}$はＨであるか、または一緒になって環状C_3－C_4アルケン基を形成する基であることができ；
R^6はＸ（ここに、ＸはＣＨ$_2$Ｐ（Ｏ）（ＯＨ）$_2$、ＣＨ$_2$Ｐ（Ｏ）（ＯC_4H_9－ｔ）$_2$、CH_3ＣＨＰ（Ｏ）（ＯＨ）$_2$、ＣＨＰ（Ｏ）（ＯＨ）$_2$－（ＣＨ$_2$）$_n$ＣＯ$_2$Ｈ、ＣＨＰ（Ｏ）（ＯＨ）$_2$、（ＣＨ$_2$）$_n$ＮＨ$_2$、ＣＨＰ（Ｏ）（ＯＨ）$_2$－アリール－ＣＯ$_2$Ｈ、ＣＨＰ（Ｏ）（ＯＨ）$_2$－アリール－ＮＨ$_2$またはＣＨＰ（Ｏ）（ＯＨ）$_2$－アリール－ＮＨＣＳ（ここに、ｎは１～１２である）である）であり；
Ｒ、R^3またはR^9はＣＯ$_2$Ｃ（ＣＨ）$_3$またはＣＯ$_2$Ｈである］
で示される化合物からなる、請求項１記載の化合物またはその塩形態。

【請求項３】
ポリアザ大環状化合物が一般式（ＩＶ）：

【化２】



(IV)

［式中、
$R^1 = R^2 = R^3 = R^4 = R^6 = R^7 = R^8 = R^9$はＨであり；
$R^3 = R^4$および$R^8 = R^9$はＨであるか、または一緒になって環状C_3－C_4アルケン基を形成する基であることができ；
R^{10}、R^{11}、R^{12}およびR^{13}はCH_3またはＨであり；
Ｒは$CO_2C(CH_3)_3$であり；
R^5はＣＨ$_2$Ｐ（Ｏ）（ＯＨ）$_2$、ＣＨ$_2$Ｐ（Ｏ）（ＯC_4H_9－ｔ）$_2$、CH_3ＣＨＰ（Ｏ）（ＯＨ）$_2$、ＣＨＰ（Ｏ）（ＯＨ）$_2$－（ＣＨ$_2$）$_n$ＣＯ$_2$Ｈ、ＣＨＰ（Ｏ）（ＯＨ）$_2$、（ＣＨ$_2$）$_n$ＮＨ$_2$、ＣＨＰ（Ｏ）（ＯＨ）$_2$－アリール－ＣＯ$_2$Ｈ、ＣＨＰ（Ｏ）（ＯＨ）$_2$－アリール－ＮＨ$_2$またはＣＨＰ（Ｏ）（ＯＨ）$_2$－アリール－ＮＨＣＳ（ここに、ｎは１～１２である）である］

で示される化合物からなる、請求項１記載の化合物またはその塩形態。
【請求項４】
式：
１０－ホスホノメチル－１，４，７，１０－テトラアザシクロドデカン－１，４，７－三酢酸（ＭＰＤＯ３Ａ）；
１０－（１－ホスホノエチル）－１，４，７，１０－テトラアザシクロドデカン－１，４，７－三酢酸；
１０－［［ビス（１，１－ジメチルエトキシ）ホスフィニル］メチル］－１，４，７，１０－テトラアザシクロドデカン－１，４，７－三酢酸１，７－ビス（１，１－ジメチルエチル）エステル；
１０－［［ビス（１，１－ジメチルエトキシ）ホスフィニル］メチル］－α’－（カルボキシメチル）－１，４，７，１０－テトラアザシクロドデカン－１，４，７－三酢酸α，α’，α”－トリス（１，１－ジメチルエチル）エステル；
１０－［［１－［ビス（１，１－ジメチルエトキシ）ホスフィニル］－３－カルボキシ］プロピル］－１，４，７，１０－テトラアザシクロドデカン－１，４，７－三酢酸α，α’，α”－トリス（１，１－ジメチルエチル）エステル；または
４，１０－ビス［［ビス（１，１－ジメチルエトキシ）ホスフィニル］メチル］－１，４，７，１０－テトラアザシクロドデカン－１，７－二酢酸（１，１－ジメチルエチル）エステル
の化合物またはその塩形態。
【請求項５】
請求項１～４のいずれかに記載の化合物のホモ二量体、ヘテロ二量体、ホモ多量体またはヘテロ多量体からなる化合物。
【請求項６】
常磁性金属または放射性核種金属と錯体化した請求項１～４のいずれかに記載の化合物またはその塩形態からなる錯体。
【請求項７】
請求項１～４のいずれかに記載の化合物を常磁性金属または放射性核種金属とコンジュゲートさせることを特徴とする、錯体を製造する方法。
【請求項８】
常磁性金属または放射性核種金属と錯体化した請求項１～４のいずれかに記載の化合物からなる診断用イメージング剤。
【請求項９】
請求項１～４のいずれかに記載の化合物からなる物質を注射用媒体に加えることを特徴とする、診断用イメージング剤を製造する方法。
【請求項１０】
請求項１～４のいずれかに記載の化合物からなる診断用イメージング剤を製造するためのキット。
【請求項１１】
請求項１～４のいずれかに記載の化合物からなる放射線治療薬を製造するためのキット。
【請求項１２】
治療用放射性核種と錯体化した請求項１～４のいずれかに記載の化合物からなる放射線治療薬。
【請求項１３】
請求項１～４のいずれかに記載の少なくとも一つの化合物からなる物質を注射用治療媒体に加えることを特徴とする、放射線治療薬を製造する方法。
【請求項１４】
連結基、標的部分、診断部分および／または治療部分をさらに含む、請求項１～４のいずれかに記載の化合物。

【請求項１５】
連結基、標的部分、診断部分および／または治療部分をさらに含む、請求項６記載の錯体。
【請求項１６】
カップリング剤によりポリアザ大環状化合物をリンカー、標的部分、診断部分または治療部分にコンジュゲートさせることを特徴とする、リンカー、標的部分、診断部分または治療部分に結合したポリアザ大環状化合物（ここに、カップリング剤はＤＣＣ、ＨＯＢＴおよびＨＡＴＵからなる群から選択され、ポリアザ大環状化合物は一つのカルボキシル基および／または少なくとも一つのアミノ基を含み、リンカー、標的部分、診断部分または治療部分は少なくとも一つのアミノまたは酸官能基を含む）を製造する方法。