

【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 28 年 6 月 30 日 (2016.6.30)

【公表番号】特表 2015-516405 (P2015-516405A)

【公表日】平成 27 年 6 月 11 日 (2015.6.11)

【年通号数】公開・登録公報 2015-038

【出願番号】特願 2015-510812 (P2015-510812)

【国際特許分類】

C 0 7 D 475/04 (2006.01)

A 6 1 K 51/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 475/04 C S P

A 6 1 K 49/02 C

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 29/00

【手続補正書】

【提出日】平成 28 年 5 月 2 日 (2016.5.2)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

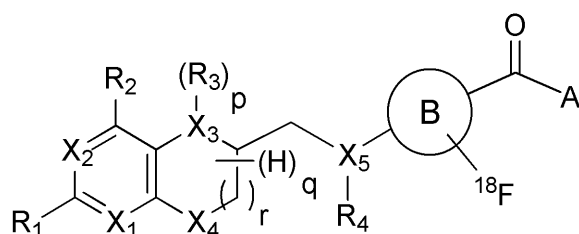
【補正対象項目名】0 0 1 7

【補正方法】変更

【補正の内容】

【 0 0 1 7 】

【化 1】



I

式中、

A は、アミノ酸であり、

B は、N、O および S から独立して選択される少なくとも 1 個のヘテロ原子を含む 5 員または 6 員ヘテロ環であり、

X₁ ~ X₅ は、互いに独立して、N または C であり、

R₁、R₂ は、互いに独立して、H、Hal、-OR₇、-NR₈R₉、C₁ ~ C₁₂ アルキル、C₁ ~ C₁₂ アルコキシ、C₁ ~ C₁₂ アルカノイル、C₂ ~ C₁₂ アルケニル、C₂ ~ C₁₂ アルキニル、(C₁ ~ C₁₂ アルコキシ) カルボニルおよび (C₁ ~ C₁₂ アルキルアミノ) カルボニルであり、R₇ は、H または C₁ ~ C₆ アルキルであり、R₈、R₉ は、互いに独立して、H、ホルミル、直鎖または分枝 C₁ ~ C₁₂ アルキルから

選択され、非置換であるかまたは少なくとも1つのCN、HalもしくはNO₂で置換されており、組み込まれた、隣接していないCH₂基の1つ以上は、独立して、-O-、-CO-、-CO-O-、-CO-NR'-、-CH=CH-、-C=C-で置き換えられていてもよく、R'は、HまたはC1～C6アルキルであり、

R₃、R₄は、互いに独立して、H、ホルミル、イミノメチル、ニトロソ、C1～C12アルキル、C1～C12アルコキシ、C1～C12アルカノイル、ハロ置換C1～C12アルカノイルであり、

pは、0、1または2であり、

qは、1～7の値を有し、

rは、0または1である。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

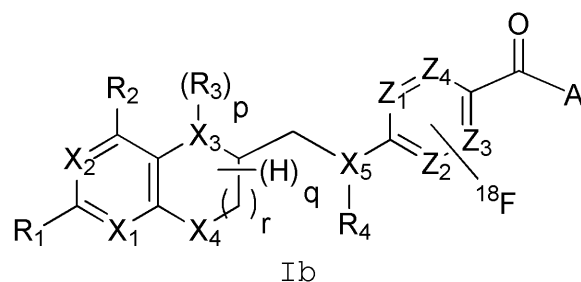
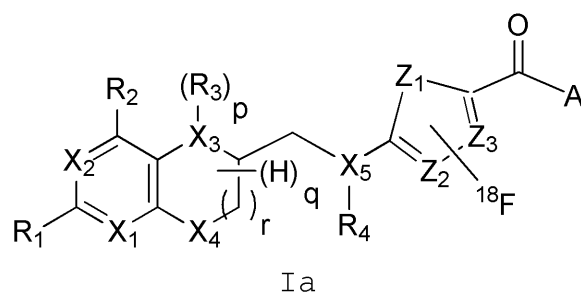
【補正対象項目名】0020

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0020】

【化2】



式中、

Aは、アミノ酸であり、

Z₁～Z₄は、互いに独立して、N、O、SまたはCであり、但し、式Iaでは、Z₁およびZ₄の少なくとも一方が、N、OまたはSであり、式Ibでは、Z₁、Z₂およびZ₃の少なくとも1つが、N、OまたはSであり、

X₁～X₅は、互いに独立して、NまたはCであり、

R₁、R₂は、互いに独立して、H、Hal、-OR₇、-NR₈R₉、C1～C12アルキル、C1～C12アルコキシ、C1～C12アルカノイル、C2～C12アルケニル、C2～C12アルキニル、(C1～C12アルコキシ)カルボニルおよび(C1～C12アルキルアミノ)カルボニルであり、R₇は、HまたはC1～C6アルキルであり、R₈、R₉は、互いに独立して、H、ホルミル、直鎖または分枝C1～C12アルキルから選択され、非置換であるかまたは少なくとも1つのCN、HalもしくはNO₂で置換されており、組み込まれた、隣接していないCH₂基の1つ以上は、独立して、-O-、-CO-、-CO-O-、-CO-NR'-、-CH=CH-、-C=C-で置き換えられていてもよく、R'は、HまたはC1～C6アルキルであり、

R₃、R₄は、互いに独立して、H、ホルミル、イミノメチル、ニトロソ、C1～C12アルキル、C1～C12アルコキシ、C1～C12アルカノイル、ハロ置換C1～C12アルカノイルであり、

p は、0、1または2であり、
 q は、1～7の値を有し、
 r は、0または1である。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

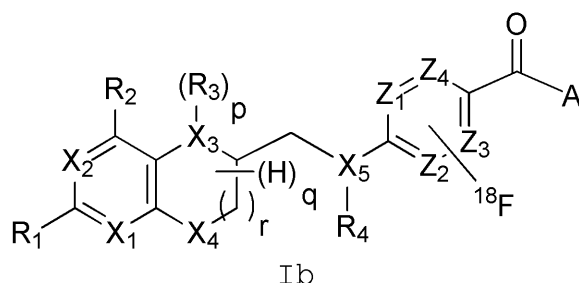
【補正対象項目名】0023

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0023】

【化3】



式中、

A は、アミノ酸であり、

Z₁～Z₄ は、互いに独立して、NまたはCであり、但し、Z₁およびZ₄の少なくとも一方は、Nであり、

X₁～X₅ は、互いに独立して、NまたはCであり、

R₁、R₂ は、互いに独立して、H、Hal、-OR₇、-NR₈R₉、C₁～C₁₂アルキル、C₁～C₁₂アルコキシ、C₁～C₁₂アルカノイル、C₂～C₁₂アルケニル、C₂～C₁₂アルキニル、(C₁～C₁₂アルコキシ)カルボニルおよび(C₁～C₁₂アルキルアミノ)カルボニルであり、R₇は、HまたはC₁～C₆アルキルであり、R₈、R₉は、互いに独立して、H、ホルミル、直鎖または分枝C₁～C₁₂アルキルから選択され、非置換であるかまたは少なくとも1つのCN、HalもしくはNO₂で置換されており、組み込まれた、隣接していないCH₂基の1つ以上は、独立して、-O-、-CO-、-CO-O-、-CO-NR'-、-CH=CH-、-C-C-で独立して置き換えられており、R'は、HまたはC₁～C₆アルキルであり、

R₃、R₄ は、互いに独立して、H、ホルミル、イミノメチル、ニトロソ、C₁～C₁₂アルキル、C₁～C₁₂アルコキシ、C₁～C₁₂アルカノイル、ハロ置換C₁～C₁₂アルカノイルであり、

p は、0、1または2であり、

q は、1～7の値であり、

r は、0または1である。

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

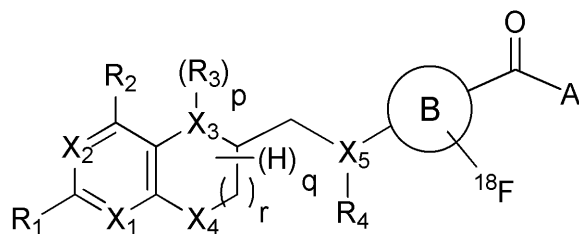
【補正対象項目名】0041

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0041】

【化 4】



I

式中、

A は、アミノ酸であり、

B は、N、O および S から独立して選択される少なくとも 1 個のヘテロ原子を含む 5 員または 6 員ヘテロ環であり、

X₁ ~ X₅ は、互いに独立して、N または C であり、

R₁、R₂ は、互いに独立して、H、Hal、-OR₇、-NR₈R₉、C₁ ~ C₁₂ アルキル、C₁ ~ C₁₂ アルコキシ、C₁ ~ C₁₂ アルカノイル、C₂ ~ C₁₂ アルケニル、C₂ ~ C₁₂ アルキニル、(C₁ ~ C₁₂ アルコキシ)カルボニルおよび(C₁ ~ C₁₂ アルキルアミノ)カルボニルであり、R₇ は、H または C₁ ~ C₆ アルキルであり、R₈、R₉ は、互いに独立して、H、ホルミル、直鎖または分枝 C₁ ~ C₁₂ アルキルから選択され、非置換であるかまたは少なくとも 1 つの CN、Hal もしくは NO₂ で置換されており、組み込まれた、隣接していない CH₂ 基の 1 つ以上は、独立して、-O-、-CO-、-CO-O-、-CO-NR'-、-CH=CH-、-C=C- で置き換えられていてもよく、R' は、H または C₁ ~ C₆ アルキルであり、

R₃、R₄ は、互いに独立して、H、ホルミル、イミノメチル、ニトロソ、C₁ ~ C₁₂ アルキル、C₁ ~ C₁₂ アルコキシ、C₁ ~ C₁₂ アルカノイル、ハロ置換 C₁ ~ C₁₂ アルカノイルであり、

p は、0、1 または 2 であり、

q は、1 ~ 7 の値を有し、

r は、0 または 1 である。

【手続補正 5】

【補正対象書類名】明細書

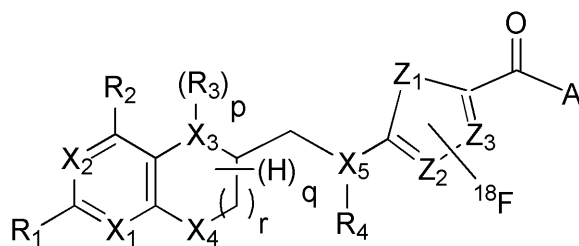
【補正対象項目名】0043

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0043】

【化 5】



Ia

式中、

A は、アミノ酸であり、

Z₁ ~ Z₃ は、互いに独立して、N、O、S または C であり、但し、Z₁、Z₂ および Z₃ の少なくとも 1 つは、N、O または S であり、

X₁ ~ X₅ は、互いに独立して、N または C であり、

R₁、R₂ は、互いに独立して、H、Hal、-OR₇、-NR₈R₉、C₁ ~ C₁₂ ア

ルキル、C 1 ~ C 1 2 アルコキシ、C 1 ~ C 1 2 アルカノイル、C 2 ~ C 1 2 アルケニル、C 2 ~ C 1 2 アルキニル、(C 1 ~ C 1 2 アルコキシ)カルボニルおよび(C 1 ~ C 1 2 アルキルアミノ)カルボニルであり、R₇は、HまたはC 1 ~ C 6 アルキルであり、R₈、R₉は、互いに独立して、H、ホルミル、直鎖または分枝C 1 ~ C 1 2 アルキルから選択され、非置換であるかまたは少なくとも1つのCN、HalもしくはNO₂で置換されており、組み込まれた、隣接していないCH₂基の1つ以上は、独立して、-O-、-CO-、-CO-O-、-CO-NR'-、-CH=CH-、-C=C-で置き換えられていてもよく、R'は、HまたはC 1 ~ C 6 アルキルであり、

R₃、R₄は、互いに独立して、H、ホルミル、イミノメチル、ニトロソ、C 1 ~ C 1 2 アルキル、C 1 ~ C 1 2 アルコキシ、C 1 ~ C 1 2 アルカノイル、ハロ置換C 1 ~ C 1 2 アルカノイルであり、

pは、0、1または2であり、

qは、1 ~ 7の値を有し、

rは、0または1である。

【手続補正6】

【補正対象書類名】明細書

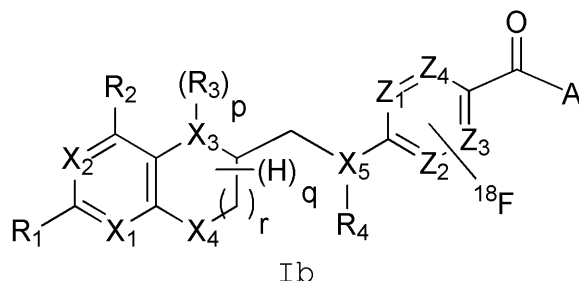
【補正対象項目名】0046

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0046】

【化6】



式中、

Aは、アミノ酸であり、

Z₁ ~ Z₄は、互いに独立して、NまたはCであり、但し、Z₁およびZ₄の少なくとも一方は、Nであり、

X₁ ~ X₅は、互いに独立して、NまたはCであり、

R₁、R₂は、互いに独立して、H、Hal、-OR₇、-NR₈R₉、C 1 ~ C 1 2 アルキル、C 1 ~ C 1 2 アルコキシ、C 1 ~ C 1 2 アルカノイル、C 2 ~ C 1 2 アルケニル、C 2 ~ C 1 2 アルキニル、(C 1 ~ C 1 2 アルコキシ)カルボニルおよび(C 1 ~ C 1 2 アルキルアミノ)カルボニルであり、R₇は、HまたはC 1 ~ C 6 アルキルであり、R₈、R₉は、互いに独立して、H、ホルミル、直鎖または分枝C 1 ~ C 1 2 アルキルから選択され、非置換であるかまたは少なくとも1つのCN、HalもしくはNO₂で置換されており、組み込まれた、隣接していないCH₂基の1つ以上は、独立して、-O-、-CO-、-CO-O-、-CO-NR'-、-CH=CH-、-C=C-で置き換えられていてもよく、R'は、HまたはC 1 ~ C 6 アルキルであり、

R₃、R₄は、互いに独立して、H、ホルミル、イミノメチル、ニトロソ、C 1 ~ C 1 2 アルキル、C 1 ~ C 1 2 アルコキシ、C 1 ~ C 1 2 アルカノイル、ハロ置換C 1 ~ C 1 2 アルカノイルであり、

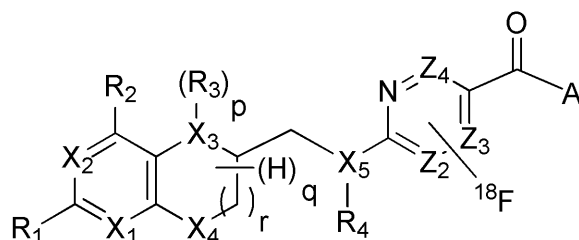
pは、0、1または2であり、

qは、1 ~ 7の値を有し、

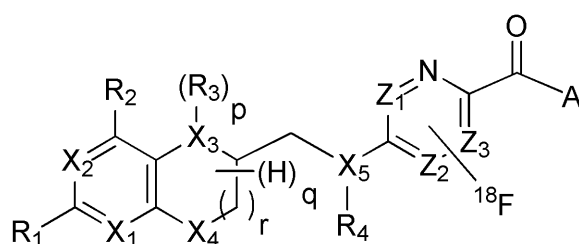
rは、0または1である。

【手続補正7】

【補正対象書類名】明細書
 【補正対象項目名】0049
 【補正方法】変更
 【補正の内容】
 【0049】
 【化7】



II



III

式中、

A は、アミノ酸であり、

Z₁ ~ Z₄ は、互いに独立して、N または C であり、

X₁ ~ X₅ は、互いに独立して、N または C であり、

R₁、R₂ は、互いに独立して、H、Hal、-OR₇、-NR₈R₉、C₁ ~ C₁₂ アルキル、C₁ ~ C₁₂ アルコキシ、C₁ ~ C₁₂ アルカノイル、C₂ ~ C₁₂ アルケニル、C₂ ~ C₁₂ アルキニル、(C₁ ~ C₁₂ アルコキシ)カルボニルおよび(C₁ ~ C₁₂ アルキルアミノ)カルボニルであり、R₇ は、H または C₁ ~ C₆ アルキルであり、R₈、R₉ は、互いに独立して、H、ホルミル、直鎖または分枝 C₁ ~ C₁₂ アルキルから選択され、非置換であるかまたは少なくとも1つのCN、Hal もしくはNO₂ で置換されており、組み込まれた、隣接していないCH₂ 基の1つ以上は、独立して、-O-、-CO-、-CO-O-、-CO-NR'-、-CH=CH-、-C-C-で置き換えられていてもよく、R' は、H または C₁ ~ C₆ アルキルであり、

R₃、R₄ は、互いに独立して、H、ホルミル、イミノメチル、ニトロソ、C₁ ~ C₁₂ アルキル、C₁ ~ C₁₂ アルコキシ、C₁ ~ C₁₂ アルカノイル、ハロ置換 C₁ ~ C₁₂ アルカノイルであり、

p は、0、1 または 2 であり、

q は、1 ~ 7 の値を有し、

r は、0 または 1 である。

【手続補正8】

【補正対象書類名】明細書

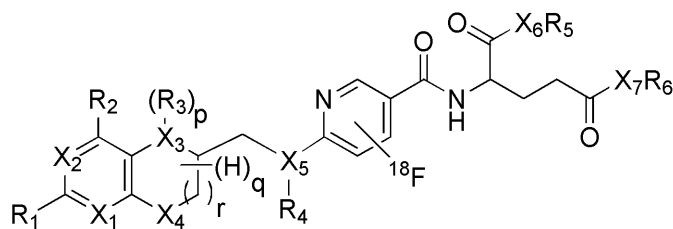
【補正対象項目名】0051

【補正方法】変更

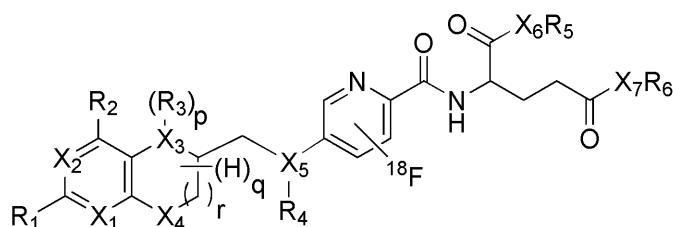
【補正の内容】

【0051】

【化 8】



IVa



IVb

式中、

$X_1 \sim X_5$ は、互いに独立して、N または C であり、

X_6 、 X_7 は、互いに独立して、C、N または O であり、

R_1 、 R_2 は、互いに独立して、H、Hal、 $-OR_7$ 、 $-NR_8R_9$ 、C1～C12 アルキル、C1～C12 アルコキシ、C1～C12 アルカノイル、C2～C12 アルケニル、C2～C12 アルキニル、(C1～C12 アルコキシ)カルボニルおよび(C1～C12 アルキルアミノ)カルボニルであり、 R_7 は、H または C1～C6 アルキルであり、 R_8 、 R_9 は、互いに独立して、H、ホルミル、直鎖または分枝 C1～C12 アルキルから選択され、非置換であるかまたは少なくとも1つのCN、Halもしくは NO_2 で置換されており、組み込まれた、隣接していない CH_2 基の1つ以上は、独立して、 $-O-$ 、 $-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-CO-NR'-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-C=C-$ で置き換えられていてもよく、 R' は、H または C1～C6 アルキルであり、

R_3 、 R_4 は、互いに独立して、H、ホルミル、イミノメチル、ニトロソ、C1～C12 アルキル、C1～C12 アルコキシ、C1～C12 アルカノイル、ハロ置換 C1～C12 アルカノイルであり、

R_5 、 R_6 は、互いに独立して、H または直鎖もしくは分枝 C1～C12 アルキルであり、非置換であるかまたは少なくとも1つのCN、Halもしくは NO_2 で置換されており、組み込まれた、隣接していない CH_2 基の1つ以上は、独立して、 $-O-$ 、 $-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-CO-NR'-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-C=C-$ で置き換えられていてもよく、 R' は、H または C1～C6 アルキルであり、

p は、0、1 または 2 であり、

q は、1～7 の値を有し、

r は、0 または 1 である。

【手続補正 9】

【補正対象書類名】明細書

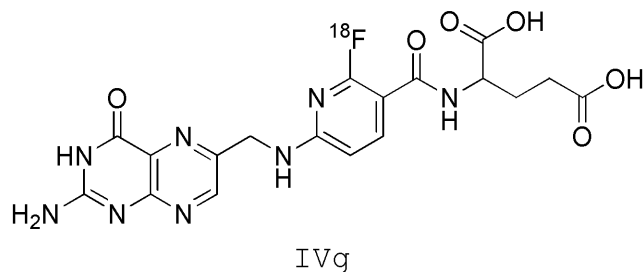
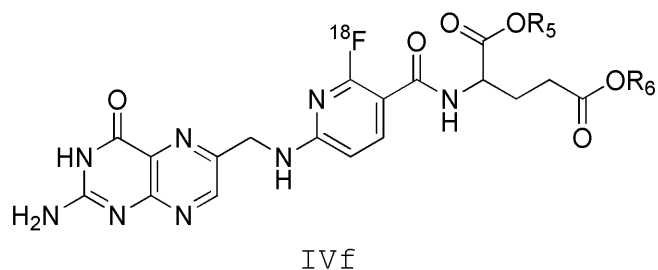
【補正対象項目名】0056

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0056】

【化 1 0】



式中、

R_5 、 R_6 は、互いに独立して、Hまたは直鎖もしくは分枝C 1 ~ C 12 アルキルであり、非置換であるか、または少なくとも1つのCN、Hal、もしくは NO_2 で置換されており、組み込まれた、隣接していない CH_2 基の1つ以上は、独立して、 $-O-$ 、 $-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-CO-NR'-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-C \equiv C-$ で置き換えられていてもよく、 R' は、HまたはC 1 ~ C 6 アルキルである。

【手続補正10】

【補正対象書類名】明細書

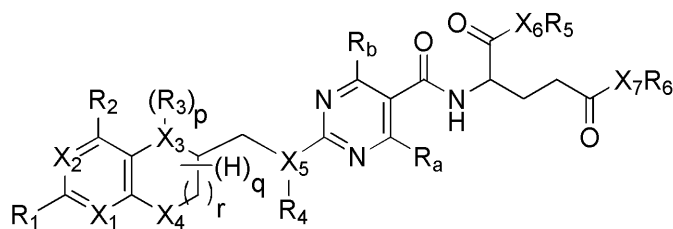
【補正対象項目名】0058

【補正方法】変更

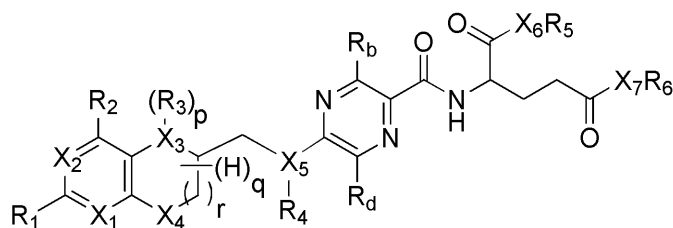
【補正の内容】

【0058】

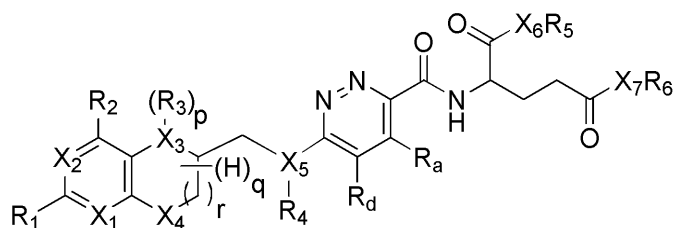
【化 1 1】



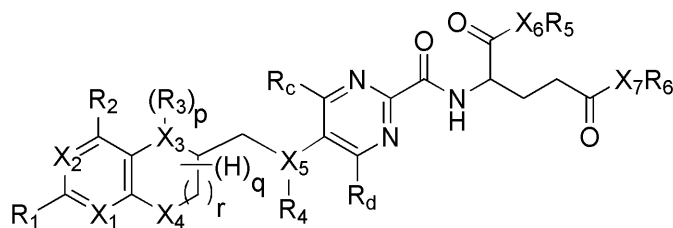
Va



Vb



Vc



Vd

式中、

$X_1 \sim X_5$ は、互いに独立して、NまたはCであり、

X_6 、 X_7 は、互いに独立して、C、NまたはOであり、

R_a 、 R_b 、 R_c 、 R_d は、互いに独立して、Hまたは ^{18}F であり、但し、 R_a 、 R_b 、 R_c 、 R_d のうち1つは、 ^{18}F であり、

R_1 、 R_2 は、互いに独立して、H、Hal、 $-OR_7$ 、 $-NR_8R_9$ 、C1～C12アルキル、C1～C12アルコキシ、C1～C12アルカノイル、C2～C12アルケニル、C2～C12アルキニル、(C1～C12アルコキシ)カルボニルおよび(C1～C12アルキルアミノ)カルボニルであり、 R_7 は、HまたはC1～C6アルキルであり、 R_8 、 R_9 は、互いに独立して、H、ホルミル、直鎖または分枝C1～C12アルキルから選択され、非置換であるかまたは少なくとも1つのCN、Halもしくは NO_2 で置換されており、組み込まれた、隣接していない CH_2 基の1つ以上は、独立して、 $-O-$ 、 $-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-CO-NR'-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-C \equiv C-$ で置き換えられていてもよく、 R' は、HまたはC1～C6アルキルであり、

R_3 、 R_4 は、互いに独立して、H、ホルミル、イミノメチル、ニトロソ、C1～C12

アルキル、C 1 ~ C 1 2 アルコキシ、C 1 ~ C 1 2 アルカノイル、ハロ置換 C 1 ~ C 1 2 アルカノイルであり、

R₅、R₆ は、互いに独立して、H または直鎖もしくは分枝 C 1 ~ C 1 2 アルキルであり、非置換であるかまたは少なくとも 1 つの C N、H a l もしくは N O₂ で置換されており、組み込まれた、隣接していない C H₂ 基の 1 つ以上は、独立して、- O -、- C O -、- C O - O -、- C O - N R' -、- C H = C H -、- C C - で置き換えられていてもよく、R' は、H または C 1 ~ C 6 アルキルであり、

p は、0、1 または 2 であり、

q は、1 ~ 7 の値を有し、

r は、0 または 1 である。

【手続補正 1 1】

【補正対象書類名】明細書

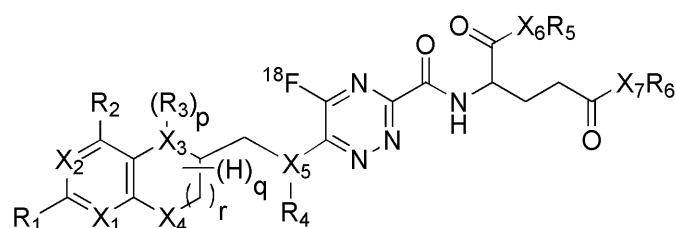
【補正対象項目名】0 0 6 0

【補正方法】変更

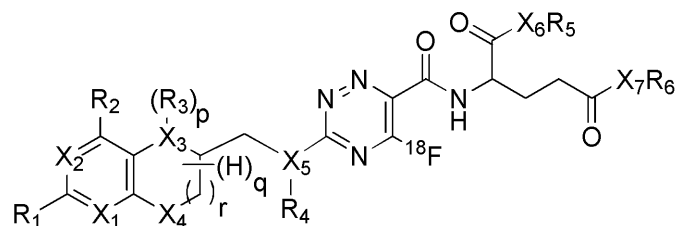
【補正の内容】

【0 0 6 0】

【化 1 2】



VIa



VIb

式中、

X₁ ~ X₅ は、互いに独立して、N または C であり、

X₆、X₇ は、互いに独立して、C、N または O であり、

R₁、R₂ は、互いに独立して、H、H a l、- O R₇、- N R₈ R₉、C 1 ~ C 1 2 アルキル、C 1 ~ C 1 2 アルコキシ、C 1 ~ C 1 2 アルカノイル、C 2 ~ C 1 2 アルケニル、C 2 ~ C 1 2 アルキニル、(C 1 ~ C 1 2 アルコキシ)カルボニルおよび(C 1 ~ C 1 2 アルキルアミノ)カルボニルであり、R₇ は、H または C 1 ~ C 6 アルキルであり、R₈、R₉ は、互いに独立して、H、ホルミル、直鎖または分枝 C 1 ~ C 1 2 アルキルから選択され、非置換であるかまたは少なくとも 1 つの C N、H a l もしくは N O₂ で置換されており、組み込まれた、隣接していない C H₂ 基の 1 つ以上は、独立して、- O -、- C O -、- C O - O -、- C O - N R' -、- C H = C H -、- C C - で置き換えられていてもよく、R' は、H または C 1 ~ C 6 アルキルであり、

R₃、R₄ は、互いに独立して、H、ホルミル、イミノメチル、ニトロソ、C 1 ~ C 1 2 アルキル、C 1 ~ C 1 2 アルコキシ、C 1 ~ C 1 2 アルカノイル、ハロ置換 C 1 ~ C 1 2 アルカノイルであり、

R₅、R₆ は、互いに独立して、H または直鎖もしくは分枝 C 1 ~ C 1 2 アルキルであり、非置換であるかまたは少なくとも 1 つの C N、H a l もしくは N O₂ で置換されており

、組み込まれた、隣接していない CH_2 基の1つ以上は、独立して、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{CO}-\text{O}-$ 、 $-\text{CO}-\text{NR}'-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{C}=\text{C}-$ で置き換えられていてもよく、 R' は、Hまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルであり、
 p は、0、1または2であり、
 q は、1～7の値を有し、
 r は、0または1である。

【手続補正12】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0062

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0062】

さらに詳細な実施形態では、基 R_5 、 R_6 は、本発明のすべての化合物において出現するとき、好ましくは、互いに独立して、Hまたは直鎖もしくは分枝 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{12}$ アルキルであり、非置換であるかまたは少なくとも1つの CN 、 Hal もしくは NO_2 で置換されており、組み込まれた、隣接していない CH_2 基の1つ以上は、独立して、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{CO}-\text{O}-$ 、 $-\text{CO}-\text{NR}'-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{C}=\text{C}-$ で置き換えられていてもよく、 R' は、Hまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルである。基 R_5 、 R_6 は、より好ましくは、互いに独立して、H、メチル、エチルまたは $\text{tert}-\text{ブチル}$ である。

【手続補正13】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項7

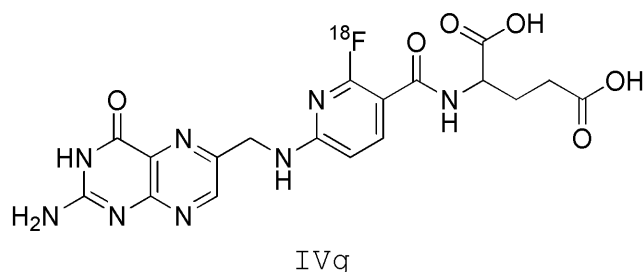
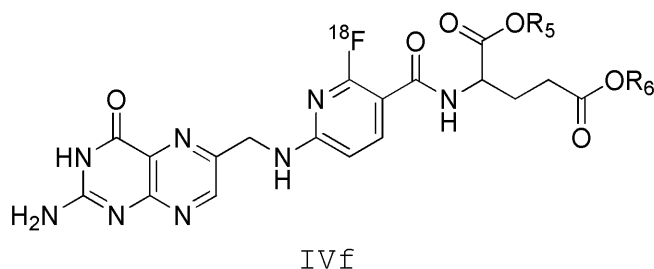
【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項7】

式IVfまたはIVg

【化6】



[式中、

R_5 、 R_6 は、互いに独立して、Hまたは直鎖状もしくは分枝状 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{12}$ アルキルであり、非置換であるかまたは少なくとも1つの CN 、 Hal もしくは NO_2 で置換されており、組み込まれた、隣接していない CH_2 基の1つ以上は、独立して、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{CO}-\text{O}-$ 、 $-\text{CO}-\text{NR}'-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{C}=\text{C}-$ で置き換えられていてもよく、 R' は、Hまたは $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルである]

を有する請求項1～6のいずれか一つに記載の化合物または薬学的に許容されるその塩。

【手続補正14】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項 1 0

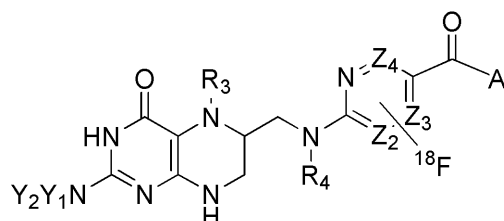
【補正方法】変更

【補正の内容】

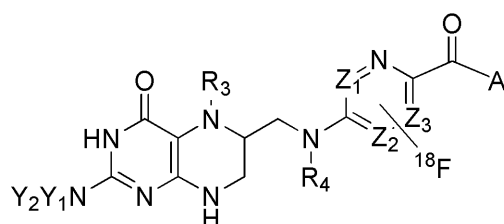
【請求項 1 0】

式 V I I および V I I I

【化 9】



VII



VIII

[式中、

A は、アミノ酸であり、

Z₁ ~ Z₄ は、互いに独立して、N または C であり、

R₃、R₄ は、互いに独立して、H、ホルミル、イミノメチル、ニトロソ、C₁ ~ C₁₂ アルキル、C₁ ~ C₁₂ アルコキシ、C₁ ~ C₁₂ アルカノイル、ハロ置換 C₁ ~ C₁₂ アルカノイルであり、

Y₁、Y₂ は、互いに独立して、H、ホルミル、直鎖状または分枝状 C₁ ~ C₁₂ アルキルから選択され、非置換であるかまたは少なくとも 1 つの CN、Hal もしくは NO₂ で置換されており、組み込まれた、隣接していない CH₂ 基の 1 つ以上は、独立して、-O-、-CO-、-CO-O-、-CO-NR'-、-CH=CH-、-C=C- で置き換えられていてもよく、R' は、H または C₁ ~ C₆ アルキルである]

を有する、請求項 1 ~ 9 のいずれか一つに記載の化合物 または薬学的に許容されるその塩。

【手続補正 1 5】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項 1 3

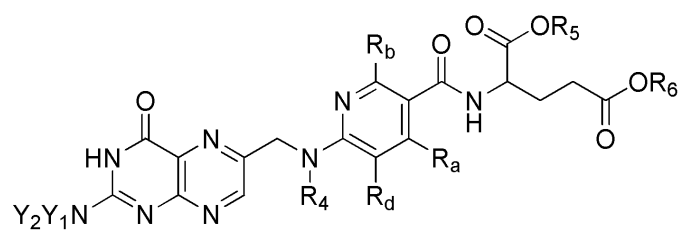
【補正方法】変更

【補正の内容】

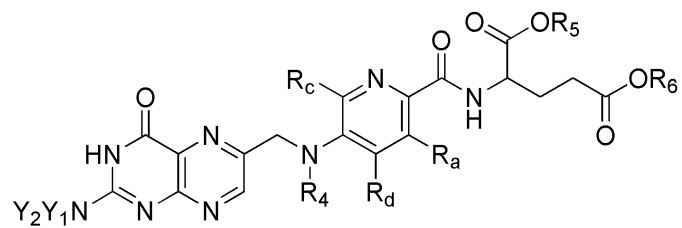
【請求項 1 3】

式 X I I a、X I I b、X I I c、X I I d、X I I e、X I I f

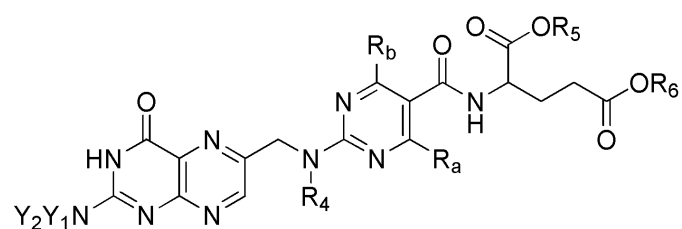
【化 1 2】



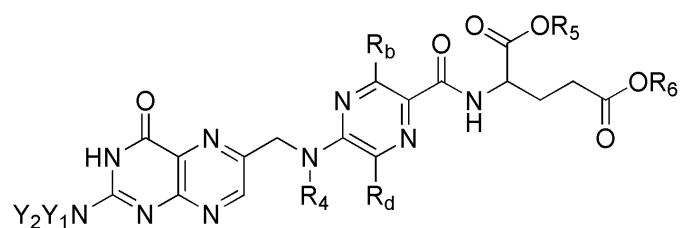
XIIa



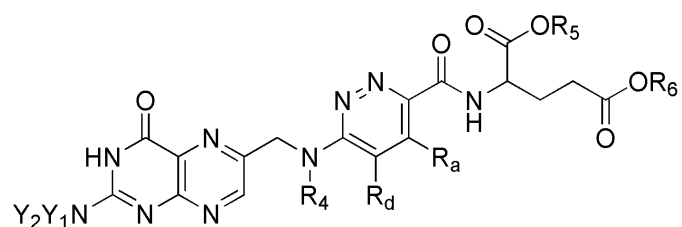
XIIb



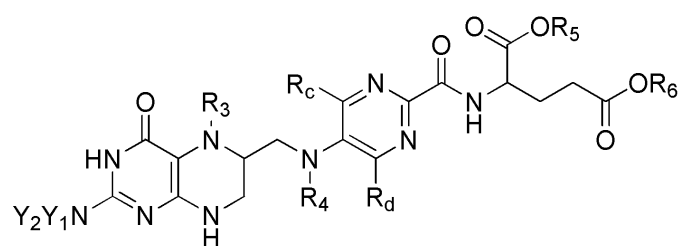
XIIc



XIId



XIIe



XIIIf

[式中、

R_a 、 R_b 、 R_c 、 R_d は、互いに独立して、 ^{18}F またはHであり、但し、 R_a 、 R_b 、 R_c 、 R_d のうち1つが ^{18}F であり、

R_3 、 R_4 は、互いに独立して、H、ホルミル、イミノメチル、ニトロソ、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_{12}$ アルカノイル、ハロ置換 $C_1 \sim C_{12}$ アルカノイルであり、

R_5 、 R_6 は、互いに独立して、Hまたは直鎖状もしくは分枝状 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルであり、非置換であるかまたは少なくとも1つのCN、Halもしくは NO_2 で置換されており、組み込まれた、隣接していない CH_2 基の1つ以上は、独立して、 $-O-$ 、 $-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-CO-NR'-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-C=C-$ で置き換えられていてもよく、 R' は、Hまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

Y_1 、 Y_2 は、互いに独立して、H、ホルミル、直鎖状または分枝状 $C_1 \sim C_{12}$ アルキルから選択され、非置換であるかまたは少なくとも1つのCN、Halもしくは NO_2 で置換されており、組み込まれた、隣接していない CH_2 基の1つ以上は、独立して、 $-O-$ 、 $-CO-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-CO-NR'-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-C=C-$ で置き換えられていてもよく、 R' は、Hまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである]

を有する請求項1～12のいずれか一つに記載の化合物または薬学的に許容されるその塩。