

【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30年10月11日 (2018.10.11)

【公表番号】特表2017-529340(P2017-529340A)

【公表日】平成29年10月5日 (2017.10.5)

【年通号数】公開・登録公報2017-038

【出願番号】特願2017-511926(P2017-511926)

【国際特許分類】

A 6 1 K 51/04 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 51/04 2 0 0

C 0 7 D 471/04 1 0 8 Q

C 0 7 D 519/00 3 0 1

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 21/02

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/28

【手続補正書】

【提出日】平成30年8月28日 (2018.8.28)

【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

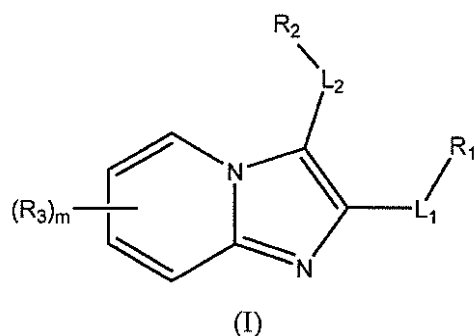
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物

【化 1】



又は薬学的に許容されるその塩

(式中、

L₁ は -CH=CH- であるか、又は L₁ は存在せず、

R_1 は、フェニル又はヘテロアリールから選択され、これらのそれぞれは、
シアノ、
ハロ、
ヘテロアリール、
低級アルキル、

ヘテロアリールにより置換されている低級アルコキシ
から独立して選択される1つ又は2つの置換基により置換されている低級アルキル、
-C(O)O-低級アルキル、
ヒドロキシル、
低級アルキニルオキシ、
低級アルコキシ、及び

ハロ、
ヘテロシクロアルキル、
ヘテロアリール、
低級アルコキシにより置換されているヘテロアリール、
場合により置換されているアミノ、
ヘテロアリールにより置換されているアルキル、及び

低級アルコキシにより置換されているヘテロアリールにより置換されているアルキル

から独立して選択される1つ又は2つの置換基により置換されている低級アルコキシ
から独立して選択される1つ、2つ又は3つの基により場合により置換されているか、又は、

R_1 は、2つの基により置換されているフェニルであり、この2つの基は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、ヘテロシクロアルケニル環を形成し、前記フェニルは、
ハロ、

ヘテロアリール、及び
場合により置換されているアミノ

から選択される置換基により場合によりさらに置換されており、

L_2 は-N(R_4)-であるか、又は L_2 は存在せず、

R_2 は、

水素、
低級アルキル、及び

低級アルコキシ、アミノ、(アルキル)アミノ、(ジアルキル)アミノ又はヒドロキシにより置換されている低級アルキル

から選択され、

R_3 は、出現毎に、

ハロ、
シアノ、
低級アルコキシ、

アミノ、(アルキル)アミノ又はジ(アルキル)アミノにより場合により置換されている低級アルキル、及び

トリ(アルキル)シリルにより場合により置換されているエチニル

から独立して選択され、

R_4 は、水素及び低級アルキルから選択され、

m は、0、1又は2である)

を含むイメージング剤であって、

式Iの化合物又は薬学的に許容されるその塩が、1種以上のポジトロン放出放射性核種により標識されている、イメージング剤。

【請求項2】

L_1 が存在しない、請求項1に記載のイメージング剤。

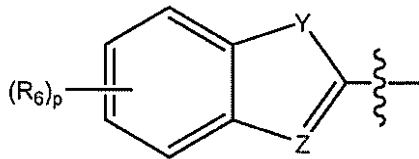
【請求項 3】

L_1 が $-\text{CH}=\text{CH}-$ である、請求項1に記載のイメージング剤。

【請求項 4】

R_1 が、

【化 2】



(式中、

Y は、 O 、 NR_7 及び S から選択され、

R_7 は、水素及び低級アルキルから選択され、

Z は、 CH 及び N から選択され、

R_6 は、出現毎に、ハロ、ヒドロキシル、低級アルコキシ、及びハロ、ヘテロアリール又は場合により置換されているアミノにより置換されている低級アルコキシから選択され、 p は、 0 、 1 及び 2 から選択される)

である、請求項1から3のいずれか一項に記載のイメージング剤。

【請求項 5】

Y が NR_7 であり、 Z が N である、請求項4に記載のイメージング剤。

【請求項 6】

R_7 が、水素及びメチルから選択される、請求項4又は5に記載のイメージング剤。

【請求項 7】

Y が O であり、 Z が CH である、請求項4に記載のイメージング剤。

【請求項 8】

Y が S であり、 Z が N である、請求項4に記載のイメージング剤。

【請求項 9】

Y が O であり、 Z が N である、請求項4に記載のイメージング剤。

【請求項 10】

p が 1 である、請求項4から9のいずれか一項に記載のイメージング剤。

【請求項 11】

R_6 が、プロモ、フルオロ、メトキシ、ヒドロキシル、2-フルオロエトキシ、ピリジン-3-イルメトキシ、アミノメトキシ、(メチルアミノ)エトキシ及び(ジメチルアミノ)エトキシから選択される、請求項10に記載のイメージング剤。

【請求項 12】

p が 0 である、請求項4から9のいずれか一項に記載のイメージング剤。

【請求項 13】

R_1 が、(5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ、5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ、5-(tert-ブトキシカルボニル)又は(5-メトキシピリジン-2-イル)メトキシにより置換されているヘテロアリールである、請求項1から3のいずれか一項に記載のイメージング剤。

【請求項 14】

R_1 が、5-フルオロ-1-ベンゾフラン-2-イル、5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル、5-ヒドロキシ-1-ベンゾフラン-2-イル、5-(2-フルオロエトキシ)-1-ベンゾフラン-2-イル、6-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル、5-プロモ-1-ベンゾフラン-2-イル、5-メトキシ-1-メチル-1H-1,3-ベンゾジアゾール-2-イル、5-メトキシ-1H-1,3-ベンゾジアゾール-2-イル、6-メトキシ-1-メチル-1H-1,3-ベンゾジアゾール-2-イル、5-(ピリジン-3-イル)メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル、6-メトキシ-1,3-ベンゾチアゾール-2-イル、5-メトキシ-1,3-ベンゾオキサゾール-2-イル、5-[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-1-ベンゾフラン-2-イル、及び5-[(5-メトキシピリジン-2-イル)メトキシ]ピラジン-2-イルから選択される、請求項1から3のいずれか一項に記載のイメージング剤。

【請求項 15】

R_1 が、

シアノ、

ハロ、

ヘテロシクロアルキル、

ヘテロアリール、

低級アルキル、

ヘテロアリールにより置換されている低級アルコキシ

から独立して選択される1つ又は2つの置換基により置換されている低級アルキル、

-C(O)O-低級アルキル、

ヒドロキシル、

低級アルキルオキシ、

低級アルコキシ、及び

ハロ、

ヘテロアリール、

低級アルコキシにより置換されているヘテロアリール、

場合により置換されているアミノ、

ヘテロアリールにより置換されているアルキル、及び

低級アルコキシにより置換されているヘテロアリールにより置換されているアルキ

ル

から独立して選択される1つ又は2つの置換基により置換されている低級アルコキシ、

から独立して選択される1つ、2つ又は3つの基により場合により置換されているフェニルから選択される、請求項1から3のいずれか一項に記載のイメージング剤。

【請求項 16】

R_1 が、メトキシ、ピリジン-3-イルメトキシ、ピラジン-2-イル、シアノ、(5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ、(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)、5H,6H-イミダゾ[2,1-b][1,3]チアゾール-3-イルメトキシ及び[(5-メトキシピリジン-2-イル)メチル]アミノから独立して選択される1つ、2つ又は3つの基により場合により置換されているフェニルである、請求項15に記載のイメージング剤。

【請求項 17】

R_1 が、4-メトキシフェニル、3-(ピリジン-3-イルメトキシ)フェニル、4-(ピリジン-3-イルメトキシ)フェニル、3-(ピラジン-2-イル)フェニル、4-(ピラジン-2-イル)フェニル、4-シアノフェニル、4-[(5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ]フェニル及び4-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニルである、請求項16に記載のイメージング剤。

【請求項 18】

R_1 が、5-(tert-ブトキシカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロフロ[3,2-c]ピリジン-2-イル、2,3-ジヒドロ-1,4,-ベンゾジオキシン-6-イル、5-プロモフラン-2-イル、1-ベンゾフラン-5-イル、11-メトキシ-7-チア-2,5-ジアザトリシクロ[6.4.0.0^{2,6}]ドデカ-1(12),3,5,8,10-ペンタエン-4-イル及び10-メトキシ-7-チア-2,5-ジアザトリシクロ[6.4.0.0^{2,6}]ドデカ-1(12),3,5,8,10-ペンタエン-4-イルから選択される、請求項1から3のいずれか一項に記載のイメージング剤。

【請求項 19】

L_2 が存在しない、請求項1から18のいずれか一項に記載のイメージング剤。

【請求項 20】

R_2 が水素である、請求項19に記載のイメージング剤。

【請求項 21】

R_2 が、低級アルキル、又は低級アルコキシ、アミノ、(アルキル)アミノ若しくは(ジアルキル)アミノにより置換されている低級アルキルである、請求項19に記載のイメージング剤。

【請求項 22】

L_2 が $-N(R_4)-$ である、請求項1から18のいずれか一項に記載のイメージング剤。

【請求項 2 3】

R_4 が水素又はメチルである、請求項22に記載のイメージング剤。

【請求項 2 4】

R_2 が、水素、低級アルキル、及びヒドロキシ、低級アルコキシ、アミノ、(アルキル)アミノ又は(ジアルキル)アミノにより置換されている低級アルキルから選択される、請求項22又は23に記載のイメージング剤。

【請求項 2 5】

R_2 が、水素、メチル、2-メトキシエチル、2-ヒドロキシエチル及び2-(ジメチルアミノ)エチルから選択される、請求項24に記載のイメージング剤。

【請求項 2 6】

m が1である、請求項1から25のいずれか一項に記載のイメージング剤。

【請求項 2 7】

R_3 が、ブromo、クロロ、フルオロ、アミノメチル、2-(トリメチルシリル)エチニル、エチニル、メトキシ及びシアノから選択される、請求項26に記載のイメージング剤。

【請求項 2 8】

R_3 が、ブromo、クロロ、フルオロ、メトキシ及びシアノから選択される、請求項27に記載のイメージング剤。

【請求項 2 9】

R_3 がシアノである、請求項28に記載のイメージング剤。

【請求項 3 0】

m が0である、請求項1から25のいずれか一項に記載のイメージング剤。

【請求項 3 1】

化合物が、

- 2-(5-フルオロ-1-ベンゾフラン-2-イル)- N -メチルイミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-アミン;
- 2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)- N -メチルイミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-アミン;
- 6-フルオロ-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)- N -メチルイミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-アミン;
- 7-フルオロ-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)- N -メチルイミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-アミン;
- 2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2- a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-[6-フルオロ-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2- a]ピリジン-2-イル]-1-ベンゾフラン-5-オール;
- 2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)- N -(2-メトキシエチル)イミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-アミン;
- 2-[7-フルオロ-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2- a]ピリジン-2-イル]-1-ベンゾフラン-5-オール;
- 2-{3-[(2-ヒドロキシエチル)アミノ]イミダゾ[1,2- a]ピリジン-2-イル}-1-ベンゾフラン-5-オール;
- 2-(5-ヒドロキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2- a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-[5-(2-フルオロエトキシ)-1-ベンゾフラン-2-イル]-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2- a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(4-メトキシフェニル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2- a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(6-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2- a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 7-メトキシ-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)- N -メチルイミダゾ[1,2- a]ピリジン-3-アミン;

- 3-(メチルアミノ)-2-[3-(ピリジン-3-イルメトキシ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 3-(メチルアミノ)-2-[4-(ピリジン-3-イルメトキシ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 7-クロロ-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;
- 7-ブromo-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;
- 2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボニトリル;
- 2-(5-ブromo-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 3-(メチルアミノ)-2-[3-(ピラジン-2-イル)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 3-(メチルアミノ)-2-[4-(ピラジン-2-イル)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-[(E)-2-(4-メトキシフェニル)エテニル]-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-[(2-メトキシエチル)アミノ]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシ-6-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(5-ブromoフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(4-シアノフェニル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(1-ベンゾフラン-5-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 3-(メチルアミノ)-2-[4-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(5-フルオロ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-{3-[(5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ]フェニル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-{5-[(5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ]ピリジン-2-イル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 3-(ジメチルアミノ)-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(5-メトキシ-1-メチル-1H-1,3-ベンゾジアゾール-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(6-メトキシ-1,3-ベンゾチアゾール-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(5-メトキシ-1,3-ベンゾオキサゾール-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(5-メトキシ-1H-1,3-ベンゾジアゾール-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(6-メトキシ-1-メチル-1H-1,3-ベンゾジアゾール-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 3-(メチルアミノ)-2-[5-(ピリジン-3-イルメトキシ)-1-ベンゾフラン-2-イル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

3-アミノ-2-[5-(2-フルオロエトキシ)-1-ベンゾフラン-2-イル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

3-アミノ-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メトキシメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

3-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-{5-[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-1-ベンゾフラン-2-イル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

3-(メチルアミノ)-2-{4-[(ピリジン-3-イルメトキシ)メチル]フェニル}イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

3-{[2-(ジメチルアミノ)エチル]アミノ}-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル

tert-ブチル2-[7-シアノ-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]-4H,5H,6H,7H-フロ[3,2-c]ピリジン-5-カルボキシレート;

7-(アミノメチル)-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;

3-(メチルアミノ)-2-{3-[(ピリジン-3-イルメトキシ)メチル]フェニル}イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-{4-[(5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ]フェニル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-{6-[(5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ]ピリジン-3-イル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチル-7-[2-(トリメチルシリル)エチニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;

7-エチニル-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;

2-(4-{[(5-メトキシピリジン-2-イル)メチル]アミノ}フェニル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(4-{5H,6H-イミダゾ[2,1-b][1,3]チアゾール-3-イルメトキシ}フェニル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-{10-メトキシ-7-チア-2,5-ジアザトリシクロ[6.4.0.0^{2,6}]ドデカ-1(12),3,5,8,10-ペンタエン-4-イル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-{11-メトキシ-7-チア-2,5-ジアザトリシクロ[6.4.0.0^{2,6}]ドデカ-1(12),3,5,8,10-ペンタエン-4-イル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;及び

2-{5-[(5-メトキシピリジン-2-イル)メトキシ]ピラジン-2-イル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル

から選択される、請求項1に記載のイメージング剤又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項 3 2】

¹¹C、¹³N、¹⁵O及び¹⁸Fから選択される、1種以上のポジトロン放出放射性核種を含有する、請求項1から31のいずれか一項に記載のイメージング剤。

【請求項 3 3】

有効量の請求項1から32のいずれか一項に記載のイメージング剤を個体に投与するステップ、及び前記個体の少なくとも一部の画像を生成するステップを含む、個体において診断画像を生成する方法。

【請求項 3 4】

前記個体の少なくとも一部の画像を生成するステップが、前記個体の脳におけるハンチントンタンパク質(HTTタンパク質)モノマー若しくは凝集体の存在又は非存在を検出するための画像を生成するステップ、及び病理過程の存在又は非存在を検出するステップを含

む、請求項33に記載の方法。

【請求項 35】

前記HTTタンパク質モノマー又は凝集体が、前記個体の前記脳の大脳基底核に存在している、請求項34に記載の方法。

【請求項 36】

病理過程が神経変性疾患である。請求項34に記載の方法。

【請求項 37】

神経変性疾患が、アルツハイマー病、筋萎縮性側索硬化症、ハンチントン病、パーキンソン病、プリオン病及び脊髄小脳失調から選択される、請求項36に記載の方法。

【請求項 38】

神経変性疾患がハンチントン病(HD)である、請求項37に記載の方法。

【請求項 39】

前記イメージング剤の前記有効量が、約0.1～約20mCiを含む、請求項33から38のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 40】

前記イメージング剤の前記有効量が約10mCiを含む、請求項39に記載の方法。

【請求項 41】

前記画像を生成するステップが、ポジトロン断層法(PET)イメージング、同時コンピュータ断層撮影法イメージングとのPET(PET/CT)、同時磁気共鳴イメージングとのPET(PET/MRI)、又はそれらの組合せを含む、請求項33から40のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 42】

前記画像を生成するステップが、PETイメージングを含む、請求項41に記載の方法。

【請求項 43】

2-(5-フルオロ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;
2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;
6-フルオロ-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;
7-フルオロ-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;
2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
2-[6-フルオロ-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]-1-ベンゾフラン-5-オール;
2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-(2-メトキシエチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;
2-[7-フルオロ-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]-1-ベンゾフラン-5-オール;
2-[3-[(2-ヒドロキシエチル)アミノ]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]-1-ベンゾフラン-5-オール;
2-(5-ヒドロキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
2-[5-(2-フルオロエトキシ)-1-ベンゾフラン-2-イル]-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
2-(4-メトキシフェニル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
2-(6-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
7-メトキシ-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;
3-(メチルアミノ)-2-[3-(ピリジン-3-イルメトキシ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン

ン-7-カルボニトリル;

3-(メチルアミノ)-2-[4-(ピリジン-3-イルメトキシ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジ

ン-7-カルボニトリル;

7-クロロ-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-
3-アミン;

7-プロモ-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-
3-アミン;

2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6
-カルボニトリル;

2-(5-プロモ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-
カルボニトリル;

3-(メチルアミノ)-2-[3-(ピラジン-2-イル)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カル
ボニトリル;

3-(メチルアミノ)-2-[4-(ピラジン-2-イル)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カル
ボニトリル;

2-[(E)-2-(4-メトキシフェニル)エテニル]-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン
-7-カルボニトリル;

2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-[(2-メトキシエチル)アミノ]イミダゾ[1,2-
a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピ
リジン-7-カルボニトリル;

2-(5-プロモフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニト
リル;

2-(4-シアノフェニル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(1-ベンゾフラン-5-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニト
リル;

3-(メチルアミノ)-2-[4-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリ
ジン-7-カルボニトリル;

2-(5-フルオロ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7
-カルボニトリル;

2-{3-[(5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ]フェニル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1
,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-{5-[(5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ]ピリジン-2-イル}-3-(メチルアミノ)イ
ミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

3-(ジメチルアミノ)-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン
-7-カルボニトリル;

2-(5-メトキシ-1-メチル-1H-1,3-ベンゾジアゾール-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダ
ゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(6-メトキシ-1,3-ベンゾチアゾール-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリ
ジン-7-カルボニトリル;

2-(5-メトキシ-1,3-ベンゾオキサゾール-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピ
リジン-7-カルボニトリル;

2-(5-メトキシ-1H-1,3-ベンゾジアゾール-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]
ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(6-メトキシ-1-メチル-1H-1,3-ベンゾジアゾール-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダ
ゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

3-(メチルアミノ)-2-[5-(ピリジン-3-イルメトキシ)-1-ベンゾフラン-2-イル]イミダゾ
[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

3-アミノ-2-[5-(2-フルオロエトキシ)-1-ベンゾフラン-2-イル]イミダゾ[1,2-a]ピリジ

ン-7-カルボニトリル;

3-アミノ-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メトキシメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

3-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-{5-[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-1-ベンゾフラン-2-イル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

3-(メチルアミノ)-2-{4-[(ピリジン-3-イルメトキシ)メチル]フェニル}イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

3-{[2-(ジメチルアミノ)エチル]アミノ}-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル

tert-ブチル2-[7-シアノ-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]-4H,5H,6H,7H-フロ[3,2-c]ピリジン-5-カルボキシレート;

7-(アミノメチル)-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;

3-(メチルアミノ)-2-{3-[(ピリジン-3-イルメトキシ)メチル]フェニル}イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-{4-[(5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ]フェニル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-{6-[(5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ]ピリジン-3-イル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチル-7-[2-(トリメチルシリル)エチニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;

7-エチニル-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;

2-(4-{[(5-メトキシピリジン-2-イル)メチル]アミノ}フェニル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(4-{5H,6H-イミダゾ[2,1-b][1,3]チアゾール-3-イルメトキシ}フェニル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-{10-メトキシ-7-チア-2,5-ジアザトリシクロ[6.4.0.0^{2,6}]ドデカ-1(12),3,5,8,10-ペンタエン-4-イル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-{11-メトキシ-7-チア-2,5-ジアザトリシクロ[6.4.0.0^{2,6}]ドデカ-1(12),3,5,8,10-ペンタエン-4-イル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;及び

2-{5-[(5-メトキシピリジン-2-イル)メトキシ]ピラジン-2-イル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル

から選択される化合物又は薬学的に許容されるその塩。

【**手続補正2**】

【**補正対象書類名**】明細書

【**補正対象項目名**】0262

【**補正方法**】変更

【**補正の内容**】

【**0262**】

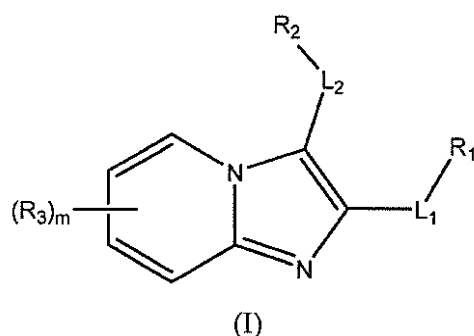
本明細書において説明されている例示的な実施例に対する様々な修正、追加、置き換え及び改変は、上記の記載から当業者に明白になろう。こうした修正もまた、特許請求の範囲内に収まるものと意図される。

本明細書は以下の態様を含む。

[**項1**]

式Iの化合物

【化 2 4】



又は薬学的に許容されるその塩

(式中、

L_1 は $-\text{CH}=\text{CH}-$ であるか、又は L_1 は存在せず、

R_1 は、フェニル又はヘテロアリールから選択され、これらのそれぞれは、

シアノ、

ハロ、

ヘテロアリール、

低級アルキル、

ヘテロアリールにより置換されている低級アルコキシ

から独立して選択される1つ又は2つの置換基により置換されている低級アルキル、

$-\text{C}(\text{O})\text{O}-$ 低級アルキル、

ヒドロキシル、

低級アルキニルオキシ、

低級アルコキシ、及び

ハロ、

ヘテロシクロアルキル、

ヘテロアリール、

低級アルコキシにより置換されているヘテロアリール、

場合により置換されているアミノ、

ヘテロアリールにより置換されているアルキル、及び

低級アルコキシにより置換されているヘテロアリールにより置換されているアルキ

ル

から独立して選択される1つ又は2つの置換基により置換されている低級アルコキシ

から独立して選択される1つ、2つ又は3つの基により場合により置換されているか、又は、

R_1 は、2つの基により置換されているフェニルであり、この2つの基は、それらが結合している炭素原子と一緒に、ヘテロシクロアルケニル環を形成し、前記フェニルは、

ハロ、

ヘテロアリール、及び

場合により置換されているアミノ

から選択される置換基により場合によりさらに置換されており、

L_2 は $-\text{N}(\text{R}_4)-$ であるか、又は L_2 は存在せず、

R_2 は、

水素、

低級アルキル、及び

低級アルコキシ、アミノ、(アルキル)アミノ、(ジアルキル)アミノ又はヒドロキシにより置換されている低級アルキル

から選択され、

R_3 は、出現毎に、

ハロ、

シアノ、
 低級アルコキシ、
 アミノ、(アルキル)アミノ又はジ(アルキル)アミノにより場合により置換されている
 低級アルキル、及び
 トリ(アルキル)シリルにより場合により置換されているエチニル
 から独立して選択され、
 R_4 は、水素及び低級アルキルから選択され、
 m は、0、1又は2である)
 を含むイメージング剤であって、
 式1の化合物又は薬学的に許容されるその塩が、1種以上のポジトロン放出放射性核種に
 より標識されている、イメージング剤。

[項 2]

L_1 が存在しない、項1に記載のイメージング剤。

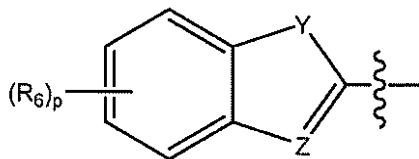
[項 3]

L_1 が $-\text{CH}=\text{CH}-$ である、項1に記載のイメージング剤。

[項 4]

R_1 が、

【化 2 5】



(式中、

Y は、O、 NR_7 及びSから選択され、

R_7 は、水素及び低級アルキルから選択され、

Z は、CH及びNから選択され、

R_6 は、出現毎に、ハロ、ヒドロキシル、低級アルコキシ、及びハロ、ヘテロアリール又は場合により置換されているアミノにより置換されている低級アルコキシから選択され、
 p は、0、1及び2から選択される)

である、項1から3のいずれか一項に記載のイメージング剤。

[項 5]

Y が NR_7 であり、 Z がNである、項4に記載のイメージング剤。

[項 6]

R_7 が、水素及びメチルから選択される、項4又は5に記載のイメージング剤。

[項 7]

Y がOであり、 Z がCHである、項4に記載のイメージング剤。

[項 8]

Y がSであり、 Z がNである、項4に記載のイメージング剤。

[項 9]

Y がOであり、 Z がNである、項4に記載のイメージング剤。

[項 1 0]

p が1である、項4から9のいずれか一項に記載のイメージング剤。

[項 1 1]

R_6 が、プロモ、フルオロ、メトキシ、ヒドロキシル、2-フルオロエトキシ、ピリジン-3-イルメトキシ、アミノメトキシ、(メチルアミノ)エトキシ及び(ジメチルアミノ)エトキシから選択される、項10に記載のイメージング剤。

[項 1 2]

p が0である、項4から9のいずれか一項に記載のイメージング剤。

[項 1 3]

R₁が、(5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ、5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ、5-(tert-ブトキシカルボニル)又は(5-メトキシピリジン-2-イル)メトキシにより置換されているヘテロアリールである、項1から3のいずれか一項に記載のイメージング剤。

[項 1 4]

R₁が、5-フルオロ-1-ベンゾフラン-2-イル、5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル、5-ヒドロキシ-1-ベンゾフラン-2-イル、5-(2-フルオロエトキシ)-1-ベンゾフラン-2-イル、6-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル、5-プロモ-1-ベンゾフラン-2-イル、5-メトキシ-1-メチル-1H-1,3-ベンゾジアゾール-2-イル、5-メトキシ-1H-1,3-ベンゾジアゾール-2-イル、6-メトキシ-1-メチル-1H-1,3-ベンゾジアゾール-2-イル、5-(ピリジン-3-イル)メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル、6-メトキシ-1,3-ベンゾチアゾール-2-イル、5-メトキシ-1,3-ベンゾオキサゾール-2-イル、5-[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-1-ベンゾフラン-2-イル、及び5-[(5-メトキシピリジン-2-イル)メトキシ]ピラジン-2-イルから選択される、項1から3のいずれか一項に記載のイメージング剤。

[項 1 5]

R₁が、

シアノ、

ハロ、

ヘテロシクロアルキル、

ヘテロアリール、

低級アルキル、

ヘテロアリールにより置換されている低級アルコキシ

から独立して選択される1つ又は2つの置換基により置換されている低級アルキル、

-C(O)O-低級アルキル、

ヒドロキシル、

低級アルキニルオキシ、

低級アルコキシ、及び

ハロ、

ヘテロアリール、

低級アルコキシにより置換されているヘテロアリール、

場合により置換されているアミノ、

ヘテロアリールにより置換されているアルキル、及び

低級アルコキシにより置換されているヘテロアリールにより置換されているアルキル

ル

から独立して選択される1つ又は2つの置換基により置換されている低級アルコキシ、

から独立して選択される1つ、2つ又は3つの基により場合により置換されているフェニルから選択される、項1から3のいずれか一項に記載のイメージング剤。

[項 1 6]

R₁が、メトキシ、ピリジン-3-イルメトキシ、ピラジン-2-イル、シアノ、(5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ、(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)、5H,6H-イミダゾ[2,1-b][1,3]チアゾール-3-イルメトキシ及び[(5-メトキシピリジン-2-イル)メチル]アミノから独立して選択される1つ、2つ又は3つの基により場合により置換されているフェニルである、項15に記載のイメージング剤。

[項 1 7]

R₁が、4-メトキシフェニル、3-(ピリジン-3-イルメトキシ)フェニル、4-(ピリジン-3-イルメトキシ)フェニル、3-(ピラジン-2-イル)フェニル、4-(ピラジン-2-イル)フェニル、4-シアノフェニル、4-[(5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ]フェニル及び4-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニルである、項16に記載のイメージング剤。

[項 1 8]

R₁が、5-(tert-ブトキシカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロフロ[3,2-c]ピリジン-2-イル、2,3-ジヒドロ-1,4,-ベンゾジオキシシ-6-イル、5-プロモフラン-2-イル、1-ベンゾフ

ラン-5-イル、11-メトキシ-7-チア-2,5-ジアザトリシクロ[6.4.0.0^{2,6}]ドデカ-1(12),3,5,8,10-ペンタエン-4-イル及び10-メトキシ-7-チア-2,5-ジアザトリシクロ[6.4.0.0^{2,6}]ドデカ-1(12),3,5,8,10-ペンタエン-4-イルから選択される、項1から3のいずれか一項に記載のイメージング剤。

[項 1 9]

L₂が存在しない、項1から18のいずれか一項に記載のイメージング剤。

[項 2 0]

R₂が水素である、項19に記載のイメージング剤。

[項 2 1]

R₂が、低級アルキル、又は低級アルコキシ、アミノ、(アルキル)アミノ若しくは(ジアルキル)アミノにより置換されている低級アルキルである、項19に記載のイメージング剤。

[項 2 2]

L₂が-N(R₄)-である、項1から18のいずれか一項に記載のイメージング剤。

[項 2 3]

R₄が水素又はメチルである、項22に記載のイメージング剤。

[項 2 4]

R₂が、水素、低級アルキル、及びヒドロキシ、低級アルコキシ、アミノ、(アルキル)アミノ又は(ジアルキル)アミノにより置換されている低級アルキルから選択される、項22又は23に記載のイメージング剤。

[項 2 5]

R₂が、水素、メチル、2-メトキシエチル、2-ヒドロキシエチル及び2-(ジメチルアミノ)エチルから選択される、項24に記載のイメージング剤。

[項 2 6]

mが1である、項1から25のいずれか一項に記載のイメージング剤。

[項 2 7]

R₃が、ブロモ、クロロ、フルオロ、アミノメチル、2-(トリメチルシリル)エチニル、エチニル、メトキシ及びシアノから選択される、項26に記載のイメージング剤。

[項 2 8]

R₃が、ブロモ、クロロ、フルオロ、メトキシ及びシアノから選択される、項27に記載のイメージング剤。

[項 2 9]

R₃がシアノである、項28に記載のイメージング剤。

[項 3 0]

mが0である、項1から25のいずれか一項に記載のイメージング剤。

[項 3 1]

化合物が、

2-(5-フルオロ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン；

2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン；

6-フルオロ-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン；

7-フルオロ-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン；

2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル；

2-[6-フルオロ-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]-1-ベンゾフラン-5-オール；

2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-(2-メトキシエチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン；

2-[7-フルオロ-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]-1-ベンゾフラン-5

- オール;

2-{3-[(2-ヒドロキシエチル)アミノ]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル}-1-ベンゾフラン-5-オール;

2-(5-ヒドロキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-[5-(2-フルオロエトキシ)-1-ベンゾフラン-2-イル]-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(4-メトキシフェニル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(6-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

7-メトキシ-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;

3-(メチルアミノ)-2-[3-(ピリジン-3-イルメトキシ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

3-(メチルアミノ)-2-[4-(ピリジン-3-イルメトキシ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

7-クロロ-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;

7-ブromo-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;

2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボニトリル;

2-(5-ブromo-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

3-(メチルアミノ)-2-[3-(ピラジン-2-イル)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

3-(メチルアミノ)-2-[4-(ピラジン-2-イル)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-[(E)-2-(4-メトキシフェニル)エテニル]-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-[(2-メトキシエチル)アミノ]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(5-ブromoフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(4-シアノフェニル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(1-ベンゾフラン-5-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

3-(メチルアミノ)-2-[4-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-(5-フルオロ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-{3-[(5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ]フェニル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

2-{5-[(5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ]ピリジン-2-イル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

3-(ジメチルアミノ)-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;

- 2-(5-メトキシ-1-メチル-1H-1,3-ベンゾジアゾール-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(6-メトキシ-1,3-ベンゾチアゾール-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(5-メトキシ-1,3-ベンゾオキサゾール-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(5-メトキシ-1H-1,3-ベンゾジアゾール-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(6-メトキシ-1-メチル-1H-1,3-ベンゾジアゾール-2-イル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 3-(メチルアミノ)-2-[5-(ピリジン-3-イルメトキシ)-1-ベンゾフラン-2-イル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 3-アミノ-2-[5-(2-フルオロエトキシ)-1-ベンゾフラン-2-イル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 3-アミノ-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-3-(メトキシメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 3-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-{5-[2-(ジメチルアミノ)エトキシ]-1-ベンゾフラン-2-イル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 3-(メチルアミノ)-2-{4-[(ピリジン-3-イルメトキシ)メチル]フェニル}イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 3-{[2-(ジメチルアミノ)エチル]アミノ}-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル
- tert-ブチル-2-[7-シアノ-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル]-4H,5H,6H,7H-フロ[3,2-c]ピリジン-5-カルボキシレート;
- 7-(アミノメチル)-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;
- 3-(メチルアミノ)-2-{3-[(ピリジン-3-イルメトキシ)メチル]フェニル}イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-{4-[(5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ]フェニル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-{6-[(5-メトキシピラジン-2-イル)メトキシ]ピリジン-3-イル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチル-7-[2-(トリメチルシリル)エチニル]イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;
- 7-エチニル-2-(5-メトキシ-1-ベンゾフラン-2-イル)-N-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-アミン;
- 2-(4-{[(5-メトキシピリジン-2-イル)メチル]アミノ}フェニル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-(4-{5H,6H-イミダゾ[2,1-b][1,3]チアゾール-3-イルメトキシ}フェニル)-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-{10-メトキシ-7-チア-2,5-ジアザトリシクロ[6.4.0.0^{2,6}]ドデカ-1(12),3,5,8,10-ペンタエン-4-イル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;
- 2-{11-メトキシ-7-チア-2,5-ジアザトリシクロ[6.4.0.0^{2,6}]ドデカ-1(12),3,5,8,10-ペンタエン-4-イル}-3-(メチルアミノ)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル;及び
- 2-{5-[(5-メトキシピリジン-2-イル)メトキシ]ピラジン-2-イル}-3-(メチルアミノ)イ

ミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル

から選択される、項1に記載のイメージング剤又は薬学的に許容されるその塩。

[項 3 2]

^{11}C 、 ^{13}N 、 ^{15}O 及び ^{18}F から選択される、1種以上のポジトロン放出放射性核種を含有する、項1から31のいずれか一項に記載のイメージング剤。

[項 3 3]

有効量の項1から32のいずれか一項に記載のイメージング剤を個体に投与するステップ、及び前記個体の少なくとも一部の画像を生成するステップを含む、個体において診断画像を生成する方法。

[項 3 4]

前記個体の少なくとも一部の画像を生成するステップが、前記個体の脳におけるハンチントンタンパク質(HTTタンパク質)モノマー若しくは凝集体の存在又は非存在を検出するための画像を生成するステップ、及び病理過程の存在又は非存在を検出するステップを含む、項33に記載の方法。

[項 3 5]

前記HTTタンパク質モノマー又は凝集体が、前記個体の前記脳の大脳基底核に存在している、項34に記載の方法。

[項 3 6]

病理過程が神経変性疾患である。項34に記載の方法。

[項 3 7]

神経変性疾患が、アルツハイマー病、筋萎縮性側索硬化症、ハンチントン病、パーキンソン病、プリオン病及び脊髄小脳失調から選択される、項36に記載の方法。

[項 3 8]

神経変性疾患がハンチントン病(HD)である、項37に記載の方法。

[項 3 9]

前記イメージング剤の前記有効量が、約0.1～約20mCiを含む、項33から38のいずれか一項に記載の方法。

[項 4 0]

前記イメージング剤の前記有効量が約10mCiを含む、項39に記載の方法。

[項 4 1]

前記画像を生成するステップが、ポジトロン断層法(PET)イメージング、同時コンピュータ断層撮影法イメージングとのPET(PET/CT)、同時磁気共鳴イメージングとのPET(PET/MRI)、又はそれらの組合せを含む、項33から40のいずれか一項に記載の方法。

[項 4 2]

前記画像を生成するステップが、PETイメージングを含む、項41に記載の方法。