

【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3区分

【発行日】令和2年10月8日(2020.10.8)

【公表番号】特表2019-526671(P2019-526671A)

【公表日】令和1年9月19日(2019.9.19)

【年通号数】公開・登録公報2019-038

【出願番号】特願2019-511638(P2019-511638)

【国際特許分類】

C 0 8 F 220/36 (2006.01)

C 0 8 F 2/38 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/787 (2006.01)

A 6 1 P 39/04 (2006.01)

A 6 1 L 15/24 (2006.01)

A 6 1 L 15/44 (2006.01)

A 6 1 L 29/14 (2006.01)

A 6 1 L 31/14 (2006.01)

A 6 1 L 17/00 (2006.01)

A 6 1 L 29/08 (2006.01)

A 6 1 L 29/04 (2006.01)

A 6 1 L 29/16 (2006.01)

A 6 1 L 31/04 (2006.01)

A 6 1 L 31/10 (2006.01)

A 6 1 L 31/16 (2006.01)

A 6 1 K 31/43 (2006.01)

A 6 1 K 31/545 (2006.01)

A 6 1 K 31/407 (2006.01)

A 6 1 K 31/351 (2006.01)

A 6 1 K 31/397 (2006.01)

A 6 1 K 31/7048 (2006.01)

A 6 1 K 31/421 (2006.01)

A 6 1 K 31/165 (2006.01)

A 6 1 K 31/575 (2006.01)

A 6 1 K 31/395 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

A 6 1 K 31/522 (2006.01)

A 6 1 K 31/13 (2006.01)

A 6 1 K 31/49 (2006.01)

A 6 1 K 31/122 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

C 0 7 D 499/46 (2006.01)

C 0 7 D 501/00 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 309/10 (2006.01)

C 0 7 D 205/085 (2006.01)

C 0 7 H 17/04 (2006.01)

C 0 7 D	263/20	(2006.01)
C 0 7 D	407/06	(2006.01)
C 0 7 J	9/00	(2006.01)
C 0 7 D	498/08	(2006.01)
C 0 7 D	215/56	(2006.01)
C 0 7 D	239/49	(2006.01)
C 0 7 D	473/18	(2006.01)
C 0 7 D	453/04	(2006.01)

## 【 F I 】

C 0 8 F	220/36	
C 0 8 F	2/38	
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 K	31/787	
A 6 1 P	39/04	
A 6 1 L	15/24	1 0 0
A 6 1 L	15/44	1 0 0
A 6 1 L	29/14	3 0 0
A 6 1 L	31/14	3 0 0
A 6 1 L	17/00	1 0 0
A 6 1 L	29/08	1 0 0
A 6 1 L	29/04	1 0 0
A 6 1 L	29/16	
A 6 1 L	31/04	1 0 0
A 6 1 L	31/10	
A 6 1 L	31/16	
A 6 1 K	31/43	
A 6 1 K	31/545	
A 6 1 K	31/407	
A 6 1 K	31/351	
A 6 1 K	31/397	
A 6 1 K	31/7048	
A 6 1 K	31/421	
A 6 1 K	31/165	
A 6 1 K	31/575	
A 6 1 K	31/395	
A 6 1 K	31/496	
A 6 1 K	31/505	
A 6 1 K	31/522	
A 6 1 K	31/13	
A 6 1 K	31/49	
A 6 1 K	31/122	
A 6 1 K	9/08	
C 0 7 D	499/46	
C 0 7 D	501/00	
C 0 7 D	487/04	1 3 3
C 0 7 D	309/10	
C 0 7 D	205/085	1 0 4
C 0 7 H	17/04	

C 0 7 D 263/20  
 C 0 7 D 407/06  
 C 0 7 J 9/00  
 C 0 7 D 498/08 3 0 1  
 C 0 7 D 215/56  
 C 0 7 D 239/49  
 C 0 7 D 473/18  
 C 0 7 D 453/04

【手続補正書】

【提出日】令和2年8月20日(2020.8.20)

【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】

必須金属に対するキレート活性を有する、水性媒体に可溶性のキレート組成物であって

、

前記キレート組成物が、少なくとも第 1 および第 2 のモノマー単位から調製され、前記第 1 のモノマー単位が、それに組み込まれているかまたは付加されている 1 つまたは複数の好適な金属結合化学基を含み、

前記第 1 および第 2 のモノマー単位が、好適な付加開裂連鎖移動剤の使用による可逆的付加開裂連鎖移動機序により重合され、

得られたキレート組成物が、生細胞または生物の環境中にある 1 つまたは複数の必須金属と結合し、それにより前記生細胞または生物に影響を及ぼすキレート組成物。

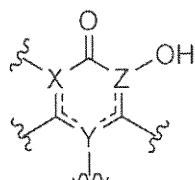
【請求項 2】

前記 1 つまたは複数の好適な金属結合化学基が、カルボキシル、ヒドロキシル、フェノレート、カテコレート、ヒドロキサメート、ヒドロキシピリジノン、およびヒドロキシフェニルトリアゾール化学タイプからなる群から独立して選択される、請求項 1 に記載のキレート組成物。

【請求項 3】

前記 1 つまたは複数の好適な金属結合化学基が、ヒドロキシピリジノン化学タイプであり、

【化 1】

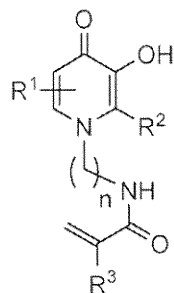


式中、X、Y、および Z は、独立して N または C であり、ただし  
 X が N である場合、Y および Z は C であり、  
 Y が N である場合、X および Z は C であり、  
 Z が N である場合、X および Y は C である、請求項 2 に記載のキレート組成物。

【請求項 4】

前記第 1 のモノマー単位が、化合物 (I)

## 【化 2】



化合物 ( I )、

(式中、 $R^1$  は、H、アルキル、および O、N、または S で置換されているアルキルからなる群から独立して選択され、

$R^2$  は、H、アルキル、および O、N、または S で置換されているアルキルからなる群から独立して選択され、

$R^3$  は、H、アルキル、および O、N、または S で置換されているアルキルからなる群から独立して選択され、

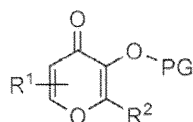
$n$  は、1 ~ 12 である)

により表される、請求項 1 に記載のキレート組成物。

## 【請求項 5】

前記化合物 ( I ) が、化合物 ( I a ) を、

## 【化 3】



化合物 ( I a )、

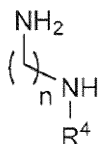
(式中、 $R^1$  は、H、アルキル、および O、N、または S で置換されているアルキルからなる群から独立して選択され、

$R^2$  は、H、アルキル、および O、N、または S で置換されているアルキルからなる群から独立して選択され

PG は、保護基である)

化合物 ( I b ) と重合させ、

## 【化 4】



化合物 ( I b )、

(式中、 $n$  は、1 ~ 12 であり、

$R^4$  は、 $\text{COCCCH}_2R^3$  または保護基である)

その後、

$R^4$  が  $\text{COCCCH}_2R^3$  の場合、PG を除去して、化合物 ( I ) を得るか、または

$R^4$  が保護基の場合、 $R^4$  を除去し、好適なアクリレート供給源と反応させ、PG を除去して化合物 ( I ) を得ることにより調製される、請求項 4 に記載のキレート組成物。

## 【請求項 6】

$R^1$  が、H であり

$R^2$  が、メチルであり、

$R^3$  が、メチルであり、

$n$  が、1～6である、請求項4または5に記載のキレート組成物。

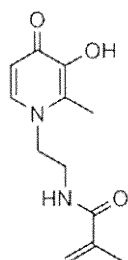
【請求項7】

$n$  が、少なくとも2である、請求項6に記載のキレート組成物。

【請求項8】

前記第1のモノマー単位が、化合物(II)

【化5】



化合物(II)

により表される、請求項1～7のいずれか一項に記載のキレート組成物。

【請求項9】

前記第2のモノマー単位が、1-ビニル-2-ピロリドン、アクリル酸、メタクリル酸メチル、N,N-ジメチル-アクリルアミド、メタクリル酸エチル、N-ビニルイミダゾール、およびスチレンからなる群から独立して選択される、請求項1～8のいずれか一項に記載のキレート組成物。

【請求項10】

前記第2のモノマー単位が、1-ビニル-2-ピロリドンである、請求項1～8のいずれか一項に記載のキレート組成物。

【請求項11】

前記第2のモノマー単位が、N,N-ジメチル-アクリルアミドである、請求項1～8のいずれか一項に記載のキレート組成物。

【請求項12】

前記好適な付加開裂連鎖移動剤が、2-エトキシチオカルボニルスルファニル-プロピオン酸エチルエステルおよび2-エトキシチオカルボニルスルファニル-2-メチル-プロピオン酸からなる群から独立して選択される、請求項1～11のいずれか一項に記載のキレート組成物。

【請求項13】

前記付加開裂連鎖移動剤の残基が、重合後に前記キレート組成物から全部または部分的に除去される、請求項1～12のいずれか一項に記載のキレート組成物。

【請求項14】

前記キレート組成物が、交互型、周期型、ジブロック型、トリブロック型、およびマルチブロック型からなる群から独立して選択される1つまたは複数の異なる構造アーキテクチャを含み、直鎖形、分岐鎖形、ブラシ形、櫛形、星形からなる群から独立して選択される1つまたは複数の形態を含む、請求項1～13のいずれか一項に記載のキレート組成物。

【請求項15】

前記キレート組成物が、1500ダルトン付近の下限分子量を有し、前記金属との結合前に水性媒体に依然として可溶性である限り、上限分子量を有さない、請求項1～14のいずれか一項に記載のキレート組成物。

【請求項16】

前記必須金属が、必須遷移系金属である、請求項1～15のいずれか一項に記載のキレート組成物。

【請求項17】

前記必須金属が、鉄、マンガン、銅、コバルト、マグネシウム、またはニッケルである、請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載のキレート組成物。

【請求項 18】

前記生細胞または生物は、その使用に利用可能な前記必須金属の量が不十分であることにより、その増殖または活性が影響を受ける、請求項 1 ~ 17 のいずれか一項に記載のキレート組成物。

【請求項 19】

治療有効量の請求項 1 ~ 18 のいずれか一項に記載のキレート組成物を投与することにより、魚またはヒトを含む動物の疾患を治療するための方法であって、前記疾患が、1 つもしくは複数の細胞または前記 1 つもしくは複数の細胞の活性により引き起こされ、前記疾患を引き起こす前記 1 つまたは複数の細胞が、微生物細胞、がん細胞、または単細胞もしくは多細胞寄生生物の 1 つまたは複数である方法。

【請求項 20】

前記キレート組成物が、抗細胞剤と共に投与され、前記抗細胞剤が、抗微生物剤、抗代謝剤、抗ウイルス剤、抗寄生生物剤、または抗がん剤の 1 つまたは複数である、請求項 19 に記載の方法。

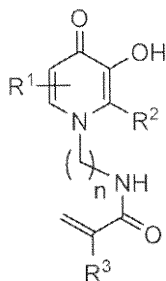
【請求項 21】

請求項 1 ~ 18 のいずれか一項に記載のキレート組成物および薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 22】

化合物 (I)

【化 6】



化合物 (I)

(式中、 $R^1$  は、H、アルキル、および O、N、または S で置換されているアルキルからなる群から独立して選択され、

$R^2$  は、H、アルキル、および O、N、または S で置換されているアルキルからなる群から独立して選択され、

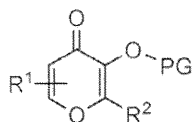
$R^3$  は、H、アルキル、および O、N、または S で置換されているアルキルからなる群から独立して選択され、

$n$  は、1 ~ 12 である)

により表される金属結合化合物であって、

化合物 (I) が、化合物 (Ia) を、

【化 7】



化合物 (Ia)、

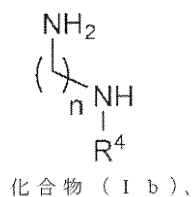
(式中、 $R^1$  は、H、アルキル、および O、N、または S で置換されているアルキルからなる群から独立して選択され、

$R^2$  は、H、アルキル、および O、N、または S で置換されているアルキルからなる群から独立して選択され、

PG は、保護基である)

化合物 (I b) と、

【化 8】



(式中、n は、1 ~ 12 であり、

$R^4$  は、 $\text{COCCCH}_2R^3$  または保護基である)

好適な付加開裂連鎖移動剤の使用による可逆的付加開裂連鎖移動機序により重合させ、その後、

$R^4$  が  $\text{COCCCH}_2R^3$  の場合、PG を除去して、化合物 (I) を得るか、または

$R^4$  が保護基の場合、 $R^4$  を除去し、好適なアクリレート供給源と反応させ、PG を除去して化合物 (I) を得ることにより調製され、

化合物 (I) が、1 つまたは複数の必須金属と結合する、金属結合化合物。

【請求項 23】

$R^1$  が、H であり

$R^2$  が、メチルであり、

$R^3$  が、メチルであり、

n が、1 ~ 6 である、請求項 22 に記載の金属結合化合物。

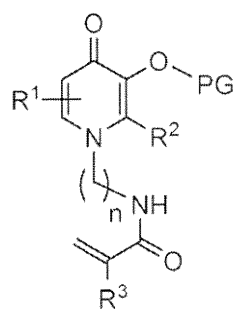
【請求項 24】

n が、少なくとも 2 である、請求項 23 に記載の金属結合化合物。

【請求項 25】

前記第 1 のモノマー単位が、化合物 (I I I)

【化 9】



(式中、 $R^1$  は、H、アルキル、および O、N、または S で置換されているアルキルからなる群から独立して選択され、

$R^2$  は、H、アルキル、および O、N、または S で置換されているアルキルからなる群から独立して選択され、

$R^3$  は、H、アルキル、および O、N、または S で置換されているアルキルからなる群から独立して選択され、

n は、1 ~ 12 であり、

PG は、保護基である)

により表される、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載のキレート組成物。

【請求項 26】

n が、少なくとも 2 である、請求項 2 5 に記載のキレート組成物。