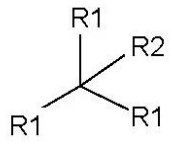
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成23年5月26日(2011.5.26)

【公表番号】特表2009-536943(P2009-536943A)
【公表日】平成21年10月22日(2009.10.22)
【年通号数】公開・登録公報2009-042
【出願番号】特願2009-509471(P2009-509471)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｃ 271/28　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 295/18　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 49/04　(2006.01)
Ｃ０７Ｃ 275/42　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｃ 271/28　ＣＳＰ
Ｃ０７Ｄ 295/18　Ｚ
Ａ６１Ｋ 49/04　Ｋ
Ｃ０７Ｃ 275/42

【手続補正書】
【提出日】平成22年4月9日(2010.4.9)
【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】
次の式（Ｉ）の化合物及びその塩又は光学活性異性体。
【化１】



式(I)

（式中、
各R^1は同一又は異なるものであって、－$(CX_2)_n$－R^3－Ｒ部分を表し、
R^2は水素及びC_1～C_4アルキルを表し、アルキル基はヒドロキシル基で置換されていてもよいし、或いは酸素原子で中断されていてもよく、
各R^3は同一又は異なるものであって、式－Ｚ－ＣＹ－ＮR^5－部分（式中、R^5はR^2の意味を有する。）を表し、
Ｙは酸素及び硫黄を表し、
Ｘは水素及びヒドロキシルを表し、
Ｚは酸素又はＮＨ基を表し、
ｎは１～４の整数であり、
各Ｒは独立に同一又は異なるものであって、さらに２つのR^4基で置換された三ヨウ素化フェニル基を表し、ここで各R^4は同一又は異なるものであって、式（Ｉ）の化合物中の

少なくとも１つのR^4基が親水性部分であることを条件にして水素原子又は非イオン性の親水性部分を表す。）
【請求項２】
各R^1が同一又は異なるものであって、$(CH_2)_n-R^3-R$部分（式中、R^3、Ｒ及びｎは請求項１で定義した通りである。）を表す、請求項１記載の化合物。
【請求項３】
各R^3が同一又は異なるものであって、式－ＮＨ－ＣＯ－ＮR^5－部分（式中、R^5はR^2の意味を有する。）を表す、請求項２記載の化合物。
【請求項４】
各R^3が式－ＮＨ－ＣＯ－ＮＨ－部分を表す、請求項３記載の化合物。
【請求項５】
各R^3が式－ＮＨ－ＣＯ－Ｎ(CH_3)－部分を表す、請求項３記載の化合物。
【請求項６】
各R^3が式－Ｏ－ＣＯ－ＮＨ－部分を表す、請求項２記載の化合物。
【請求項７】
ｎが１又は２の整数を表す、請求項１乃至請求項６のいずれか１項記載の化合物。
【請求項８】
R^2が水素又はメチルを表す、請求項１乃至請求項７のいずれか１項記載の化合物。
【請求項９】
各Ｒが同一又は異なるものであって、さらに２つのR^4基で置換された２，４，６－三ヨウ素化フェニル基を表す、請求項１乃至請求項８のいずれか１項記載の化合物。
【請求項１０】
各R^4が同一又は異なるものであって、エステル、アミド及びアミン部分を含み、任意にはさらに直鎖又は枝分れC_{1-10}アルキル基で置換され、任意には１以上のCH_2又はＣＨ部分が酸素又は窒素原子で置き換えられ、任意にはオキソ、ヒドロキシル、アミノ又はカルボキシル誘導体並びにオキソ置換硫黄及びリン原子から選択される１以上の基で置換された非イオン性の親水性部分を表す、請求項１乃至請求項９のいずれか１項記載の化合物。
【請求項１１】
R^4が同一又は異なるものであって、エステル、アミド及びアミン部分を含み、任意にはさらに直鎖又は枝分れC_{1-5}アルキル基（好ましくはC_{1-5}アルキル基）で置換され、任意には１以上のCH_2又はＣＨ部分が酸素又は窒素原子で置き換えられ、任意にはオキソ、ヒドロキシル、アミノ又はカルボキシル誘導体並びにオキソ置換硫黄及びリン原子から選択される１以上の基で置換された非イオン性の親水性部分を表す、請求項１０記載の化合物。
【請求項１２】
R^4が同一又は異なるものであって、エステル、アミド及びアミン部分を含み、さらに１～３のヒドロキシ基で置換された直鎖又は枝分れC_{1-5}アルキル基で置換された非イオン性の親水性部分を表す、請求項１１記載の化合物。
【請求項１３】
各R^4が同一又は異なるものであって、アミド結合を介してヨウ素化フェニル基に結合したポリヒドロキシC_{1-5}アルキル、炭素原子数１～５のヒドロキシアルコキシアルキル及び炭素原子数１～５のヒドロキシポリアルコキシアルキルである、請求項１２記載の化合物。
【請求項１４】
各R^4が同一又は異なるものであって、以下の式の基から選択される、請求項１乃至請求項１３のいずれか１項記載の化合物。
－ＣＯＮＨ－CH_2－CH_2ＯＨ、
－ＣＯＮＨ－CH_2－ＣＨＯＨ－CH_2ＯＨ、
－ＣＯＮ$(CH_3)$$CH_2$－ＣＨＯＨ－$CH_2$ＯＨ、

－ＣＯＮＨ－ＣＨ－$(CH_2OH)_2$、
－ＣＯＮ－$(CH_2-CH_2OH)_2$、
－ＣＯＮ－$(CH_2-CH_2OH-CH_2OH)_2$、
－$CONH_2$、
－ＣＯＮＨＣＨ$_3$、
－ＮＨＣＯＣＨ$_2$ＯＨ、
－Ｎ$(COCH_3)$Ｈ、
－Ｎ$(COCH_3)$－C_{1-3}アルキル、
－Ｎ$(COCH_3)$－モノ、ビス又はトリス－ヒドロキシC_{1-4}アルキル、
－Ｎ$(COCH_2OH)$－水素、モノ、ビス又はトリス－ヒドロキシC_{1-4}アルキル、
－Ｎ$(CO-CHOH-CH_2OH)$－水素、モノ、ビス又はトリヒドロキシル化C_{1-4}アルキル、
－Ｎ$(CO-CHOH-CHOH-CH_2OH)$－水素、モノ、ビス又はトリヒドロキシル化C_{1-4}アルキル、
－Ｎ$(COCH_2OH)_2$、
－ＣＯＮ$(CH_2-CHOH-CH_2OH)(CH_2-CH_2OH)$、
－ＣＯＮＨ－Ｃ$(CH_2OH)_3$、
－ＣＯＮＨ－ＣＨ$(CH_2OH)(CHOH-CH_2OH)$、及び
－モルホリン－４－カルボニル。

【請求項１５】
各R^4が同一又は異なるものであって、式－ＣＯＮ$(CH_3)CH_2$－ＣＨＯＨ－ＣＨ$_2$ＯＨ、－ＣＯＮＨ－ＣＨ$_2$－ＣＨＯＨ－ＣＨ$_2$ＯＨ、－ＣＯＮＨ－ＣＨ－$(CH_2OH)_2$、－ＣＯＮ－$(CH_2-CH_2OH)_2$、－ＣＯＮ－$(CH_2-CH_2OH-CH_2OH)_2$、－ＮＨＣＯＣＨ$_2$ＯＨ及び－Ｎ$(COCH_2OH)$－モノ、ビス又はトリス－ヒドロキシC_{1-4}アルキルの基から選択される、請求項１４記載の化合物。

【請求項１６】
各R^4が同一である、請求項１乃至請求項１５のいずれか１項記載の化合物。

【請求項１７】
各R^4が－ＣＯＮＨ－ＣＨ$_2$－ＣＨＯＨ－ＣＨ$_2$ＯＨを表す、請求項１６記載の化合物。

【請求項１８】
以下のいずれかの化合物である、請求項１乃至請求項１７のいずれか１項記載の化合物。
Ｎ，Ｎ′－ビス（２，３－ジヒドロキシ－プロピル）－５－［３－（３－｛３－［Ｎ，Ｎ′－ビス（２，３－ジヒドロキシ－プロピル）－２，４，６－トリヨード－フェニル］－ウレイド｝－２－｛３－［Ｎ，Ｎ′－ビス（２，３－ジヒドロキシ－プロピル）－２，４，６－トリヨード－フェニル］－ウレイドメチル｝－２－メチル－プロピル）－ウレイド］－２，４，６－トリヨードイソフタルアミド、
Ｎ，Ｎ′－ビス（２，３－ジヒドロキシ－プロピル）－５－（３－｛３－｛３－［３，５－ビス（２，３－ジヒドロキシ－プロピルカルバモイル）－２，４，６－トリヨード－フェニル］－ウレイド｝－２－ヒドロキシメチル－２－［３，５－ビス（２，３－ジヒドロキシ－プロピルカルバモイル）－２，４，６－トリヨード－フェニル］－ウレイド）－メチル］プロピル｝－ウレイド）－２，４，６－トリヨード－イソフタルアミド、
トリス（Ｎ，Ｎ，Ｎ′，Ｎ′－テトラキス（２，３－ジヒドロキシ－プロピル）－５－（３，３－ジメチル－ウレイド）－２，４，６－トリヨード－イソフタルアミド）エタン、
トリス（エチル－３－［２，４，６－トリヨード－３，５－ビス（モルホリン－４－カルボニル）－フェニル］－尿素）メタン、
トリス（Ｎ，Ｎ′－ビス（２，３－ジヒドロキシ－プロピル）－５－（３－エチル－ウレイド）－２，４，６－トリヨード－Ｎ，Ｎ′－ジメチル－イソフタルアミド）メタン、
トリス（Ｎ，Ｎ，Ｎ′，Ｎ′－テトラキス（２，３－ジヒドロキシ－プロピル）－２，４，６－トリヨード－５－（３－メチル－３－プロピル－ウレイド）－イソフタルアミド）メタン、

トリス｛３－［３，５－ビス（２，３－ジヒドロキシプロピルカルバモイル）－２，４，６－トリヨード－フェニルカルバモイルオキシ－プロピル｝メタン、及び
トリス（［３，５－ビス（２，３－ジヒドロキシ－プロピルカルバモイル）－２，４，６－トリヨード－フェニル］カルバミン酸メチルエステル）エタン。
【請求項１９】
請求項１乃至請求項１８のいずれか１項記載の式（Ｉ）の化合物を含んでなる診断剤。
【請求項２０】
請求項１乃至請求項１８のいずれか１項記載の式（Ｉ）の化合物を薬学的に許容できる担体又は賦形剤と共に含んでなる診断用組成物。
【請求項２１】
請求項１乃至請求項１８のいずれか１項記載の式（Ｉ）の化合物を薬学的に許容できる担体又は賦形剤と共に含んでなるＸ線診断用組成物。
【請求項２２】
Ｘ線造影剤として使用するための診断用組成物の製造における、請求項１乃至請求項１８のいずれか１項記載の式（Ｉ）の化合物の使用。