

【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24年10月25日 (2012.10.25)

【公表番号】特表2012-502014(P2012-502014A)

【公表日】平成24年1月26日 (2012.1.26)

【年通号数】公開・登録公報2012-004

【出願番号】特願2011-525613(P2011-525613)

【国際特許分類】

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/14 (2006.01)

C 0 7 D 491/113 (2006.01)

A 6 1 K 51/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/404 (2006.01)

A 6 1 K 31/4192 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 403/12 C S P

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 403/14

C 0 7 D 491/113

A 6 1 K 49/02 C

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/4192

A 6 1 K 31/506

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成24年9月4日 (2012.9.4)

【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

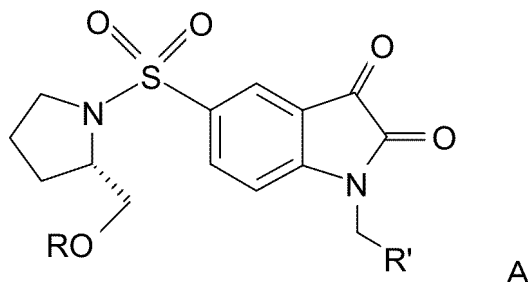
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式 A を有する化合物、またはこの塩、水和物もしくはプロドラッグ：
【化 1】



ただし、R は、フェニル、3-フルオロフェニル、2,4-ジフルオロフェニル、3,5-ジフルオロフェニル、置換されてもよいテトラヒドロピラン、置換されてもよいジアジンまたは置換されてもよいトリアゾールであり；

R' は、置換されてもよいフェニルまたは置換されてもよいトリアゾールであり；

この際、R がフェニルである場合には、R' は、置換されてもよいトリアゾールである。

【請求項 2】

前記置換されてもよいフェニル、置換されてもよいテトラヒドロピランおよび／または置換されてもよいジアジンは、1 以上の電子求引基で置換される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

前記電子求引基は、フッ素である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

前記置換されてもよいトリアゾールは、置換されたアルキル基で置換される、請求項 1～3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】

前記置換されたアルキル基は C₁ - 4 のフルオロアルキルである、請求項 4 に記載の化合物。

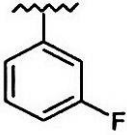
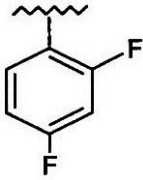
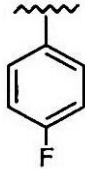
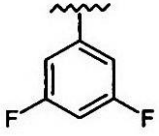
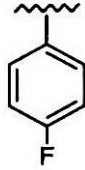
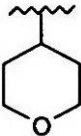
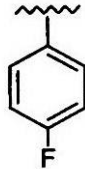
【請求項 6】

前記 C₁ - 4 のフルオロアルキルは 2-フルオロエチルである、請求項 5 に記載の化合物。

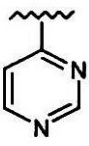
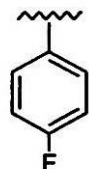
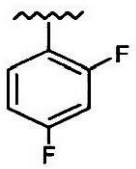
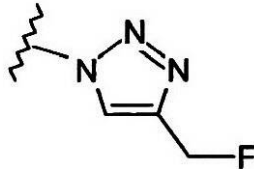
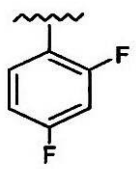
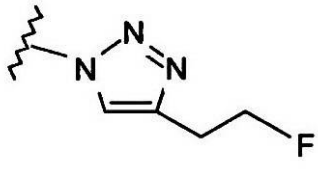
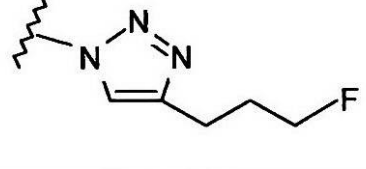
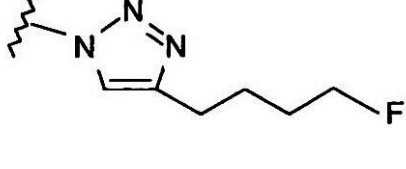
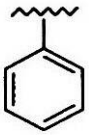
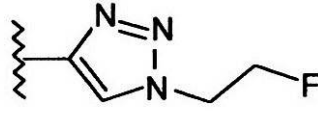
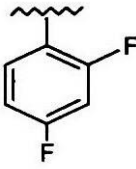
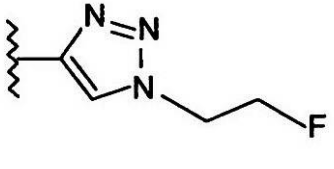
【請求項 7】

前記 R および R' は下記に定義される、請求項 1～6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

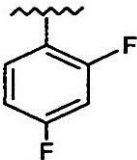
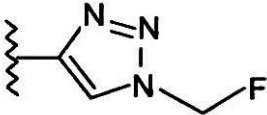
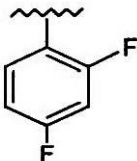
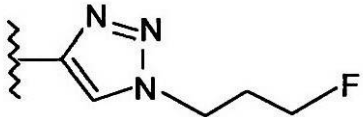
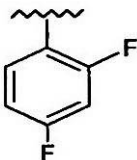
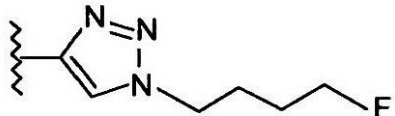
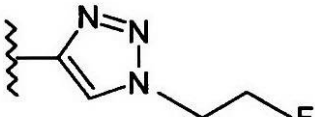
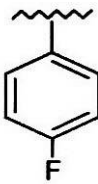
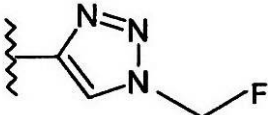
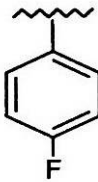
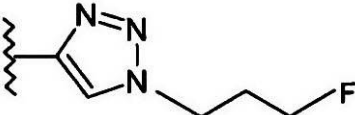
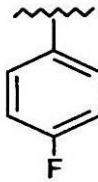
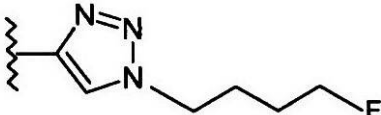
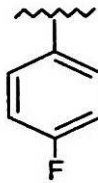
【表 1 - 1】

化合物 No.	R	R'
1		
2		
3		
4		

【表 1 - 2】

5		
6		
7		
8		
9		
10		
11		

【表 1 - 3】

29		
30		
31		
12		
32		
33		
34		

【請求項 8】

Rは、3-フルオロフェニル、2, 4-ジフルオロフェニルおよび3, 5-ジフルオロフェニルを含む群より選択され、R'は、2-フルオロエチルで置換されたトリアゾールである、請求項1～7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 9】

さらに画像化部分(imaging moiety)を有する、請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 10】

前記画像化部分(imaging moiety)は放射性標識である、請求項 9 に記載の化合物。

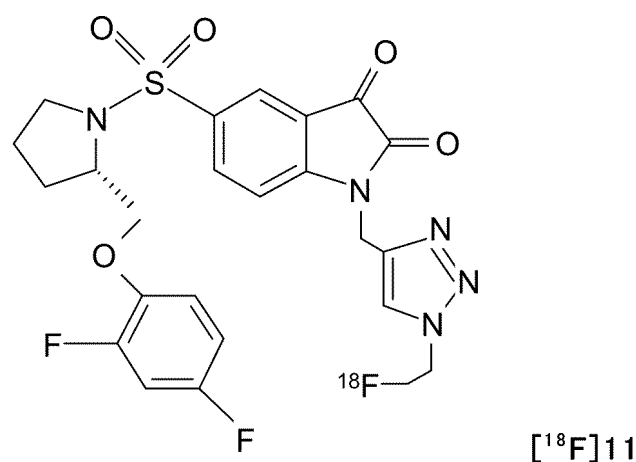
【請求項 11】

前記放射性標識は ^{18}F である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

下記式 [^{18}F] 11 を有する、請求項 11 に記載の化合物。

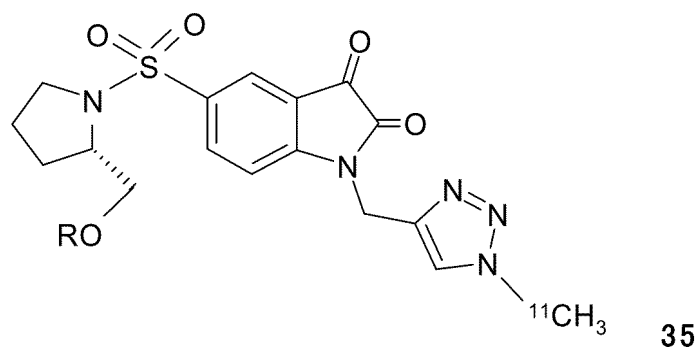
【化 2】



【請求項 13】

下記式 35 を有する、請求項 10 に記載の化合物。

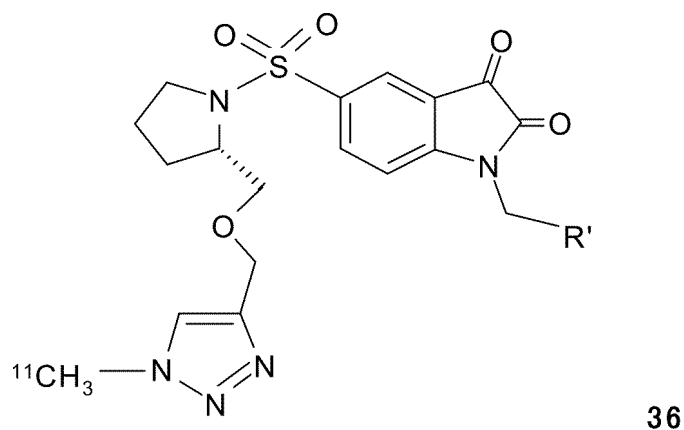
【化 3】



【請求項 14】

下記式 36 を有する、請求項 10 に記載の化合物。

【化 4】



【請求項 15】

請求項 1～8 のいずれか 1 項に記載の化合物および 1 以上の別の活性成分、製薬上許容できる賦形剤、担体または希釈剤を含む、薬剤組成物。

【請求項 16】

請求項 9～14 のいずれか 1 項に記載の化合物および 1 以上の別の活性成分、製薬上許

容できる賦形剤、担体または希釈剤を含む、薬剤組成物。

【請求項 17】

分子画像化剤として使用されるための、請求項 9～14 のいずれか 1 項に記載の化合物または請求項 16 に記載の薬剤組成物。

【請求項 18】

前記分子画像化剤がカスパーゼ活性の可視化および定量化を目的とする、請求項 17 に記載の化合物または薬剤組成物。

【請求項 19】

a) ヒト以外の哺乳動物の細胞または組織を請求項 9～14 のいずれか 1 項に記載の化合物または請求項 16 に記載の薬剤組成物と接触させ；

b) 前記哺乳動物の細胞または組織を検出装置の検出域に置き；

c) 前記被検者における前記化合物を前記検出装置で検出し；さらに

d) 段階 a)、b) および c) を繰り返す、

ことを有する、哺乳動物の細胞または組織におけるカスパーゼ活性への試験物質の治療効果の評価方法。

【請求項 20】

カスパーゼ活性の阻害に使用される、請求項 1～8 のいずれか 1 項に記載の化合物または請求項 15 に記載の組成物。

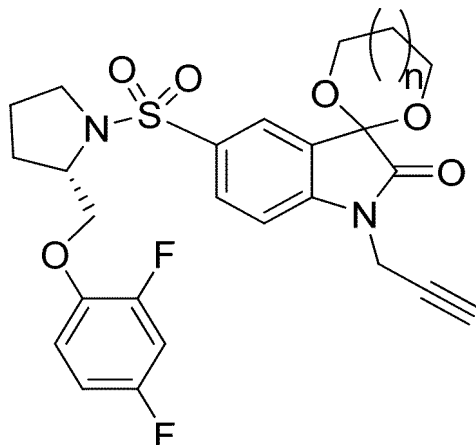
【請求項 21】

過剰なまたは不適切なアポトーシスによって引き起こされるまたは前記アポトーシスと関連のある疾患または障害の診断に使用される、請求項 9～14 のいずれか 1 項に記載の化合物または請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 22】

下記式 38 (ただし、 $n = 0 \sim 6$) を有する化合物。

【化 5】

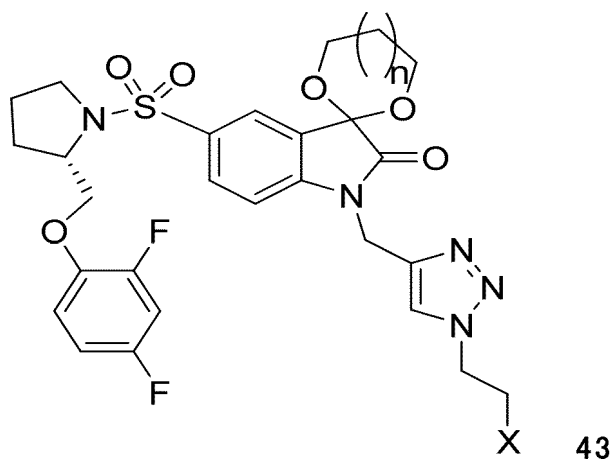


38

【請求項 23】

下記式 43 (ただし、 $n = 0 \sim 6$ および $x =$ 脱離基) を有する化合物。

【化 6】



【請求項 2 4】

請求項 2 2 または 2 3 に記載の化合物を使用することを有する請求項 1 2 に記載の化合物の製造方法。