

【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12月20日(2018.12.20)

【公表番号】特表2018-502829(P2018-502829A)

【公表日】平成30年2月1日(2018.2.1)

【年通号数】公開・登録公報2018-004

【出願番号】特願2017-527921(P2017-527921)

【国際特許分類】

A 6 1 K 51/04 (2006.01)

A 6 1 B 34/00 (2016.01)

G 0 1 N 21/64 (2006.01)

A 6 1 B 1/313 (2006.01)

A 6 1 B 1/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 51/04 2 0 0

A 6 1 B 34/00

G 0 1 N 21/64 F

A 6 1 B 1/313

A 6 1 B 1/00 5 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成30年11月7日(2018.11.7)

【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】

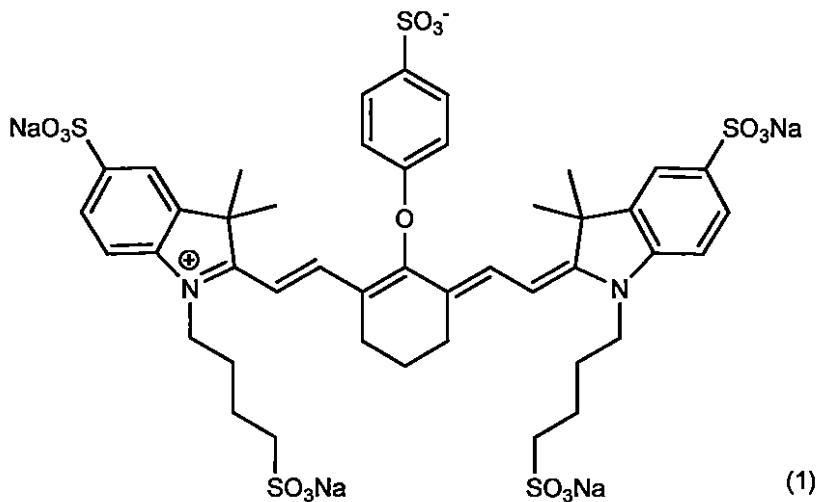
【特許請求の範囲】

【請求項1】

診断的有効量の式1の化合物である2-((E)-2-((E)-3-(2-((E)-3, 3-ジメチル-5-スルホナト-1-(4-スルホナトブチル)インドリン-2-イリデン)エチリデン)-2-(4-スルホナトフェノキシ)シクロヘキセ-1-エン-1-イル)ビニル)-3, 3-ジメチル-1-(4-スルホナトブチル)-3H-インドール-1-イウム-5-スルホネートまたはその溶媒和物もしくは多形体と、医薬的に許容されるカチオンを含む腎臓および尿管のイメージングのための医薬組成物であって、

式1の化合物は、以下の構造：

【化 1】



を有し、

投与は、処置前、処置中、処置後およびそれらの組み合わせからなる群より選択される 1 回または複数回実施され；

対象の腎臓系の組織が電磁放射線に曝され；そして

前記化合物からの蛍光放射線が検出される、前記医薬組成物。

【請求項 2】

前記投与は静脈内投与により実施される、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

前記医薬的に許容されるカチオンは、カリウムまたはナトリウムからなる群より選択される、請求項1又は2に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

前記化合物は、生理学的滅菌済み生理食塩水、滅菌済み水溶液、発熱物質を含まない水溶液、等張食塩水、及びリン酸緩衝液からなる群より選択される医薬的に許容される担体との組み合わせで投与される、請求項1～3のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

前記投与は、前記化合物の量が約3000.0  $\mu\text{g}/\text{kg}$ ～1500.0  $\mu\text{g}/\text{kg}$ の範囲にわたる診断的有効量で実施される、又は、

前記投与は、前記化合物の量が約1500.0  $\mu\text{g}/\text{kg}$ ～1000.0  $\mu\text{g}/\text{kg}$ の範囲にわたる診断的有効量で実施される、又は、

前記投与は、前記化合物の量が約1000.0  $\mu\text{g}/\text{kg}$ ～500.0  $\mu\text{g}/\text{kg}$ の範囲にわたる診断的有効量で実施される、又は、

前記投与は、前記化合物の量が約500.0  $\mu\text{g}/\text{kg}$ ～170.0  $\mu\text{g}/\text{kg}$ の範囲にわたる診断的有効量で実施される、又は、

前記投与は、前記化合物の量が約170.0  $\mu\text{g}/\text{kg}$ ～120.0  $\mu\text{g}/\text{kg}$ の範囲にわたる診断的有効量で実施される、又は、

前記投与は、前記化合物の量が約120.0  $\mu\text{g}/\text{kg}$ ～60.0  $\mu\text{g}/\text{kg}$ の範囲にわたる診断的有効量で実施される、請求項1～4のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

投与後の期間、対象の腎臓系の組織に残存する投与した化合物の蛍光強度が測定される、請求項1～5のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

測定した投与後の化合物の蛍光強度は、投与から約24時間後のバックグラウンド蛍光である、請求項1～6のいずれか1項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 8】

前記処置は、腹腔鏡下処置、ロボットによる処置、ロボットによる腹腔鏡下処置、および開腹処置からなる群より選択される、請求項1～7のいずれか1項に記載の医薬組成物。

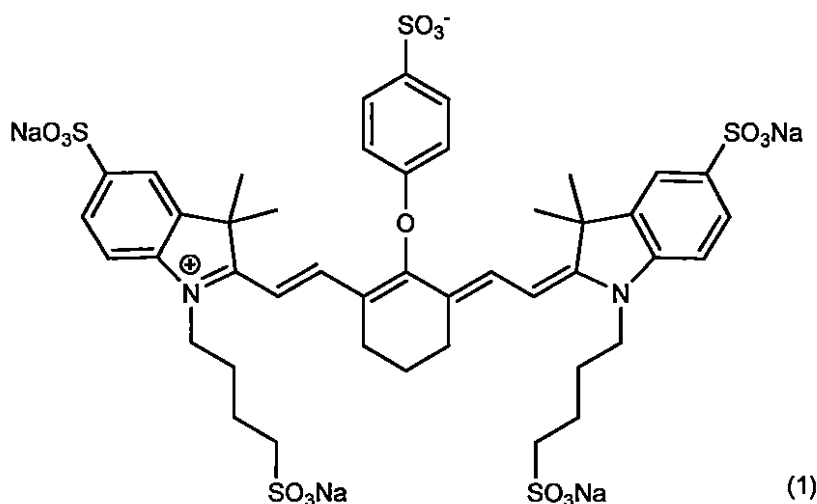
## 【請求項 9】

投与後約6時間まで、腎臓における投与した化合物の蛍光強度の測定値は、脾臓、腸、心臓、肺、筋肉の1つまたは複数あるいはそれらの組み合わせにおける投与した化合物の蛍光強度の測定値よりも高い、請求項6～8のいずれか1項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 10】

診断的イメージング量の下記式1の構造：

## 【化 2】



を有する化合物である2-((E)-2-((E)-3-(2-((E)-3, 3-ジメチル-5-スルホナト-1-(4-スルホナトブチル)インドリン-2-イリデン)エチリデン)-2-(4-スルホナトフェノキシ)シクロヘキセ-1-エン-1-イル)ビニル)-3, 3-ジメチル-1-(4-スルホナトブチル)-3H-インドール-1-イウム-5-スルホネート、医薬的に許容されるカチオン、及び医薬的に許容される担体を含む医薬組成物。

## 【請求項 11】

前記組成物は、静脈内（IV）バッグ内に含まれる、請求項10に記載の医薬組成物。

## 【請求項 12】

式1の形態Aである固体形態であって、

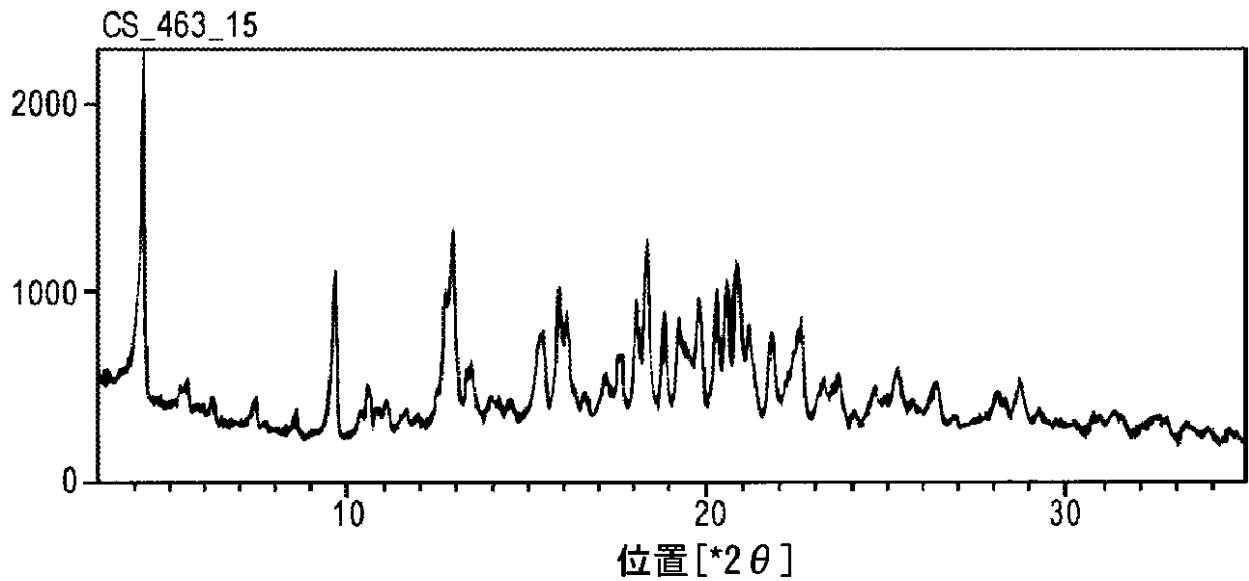
形態Aは、

2θによるピークが約4.3°にあることを含むX線粉末回折パターン、又は

2θによるピークが約4.3°、約9.6°、約12.9°、約18.3°、及び約20.8°にあることを含むX線粉末回折パターン、又は

以下の図：

【化 3】



に示すようなX線粉末回折パターンを有する、固体形態。

【請求項 1 3】

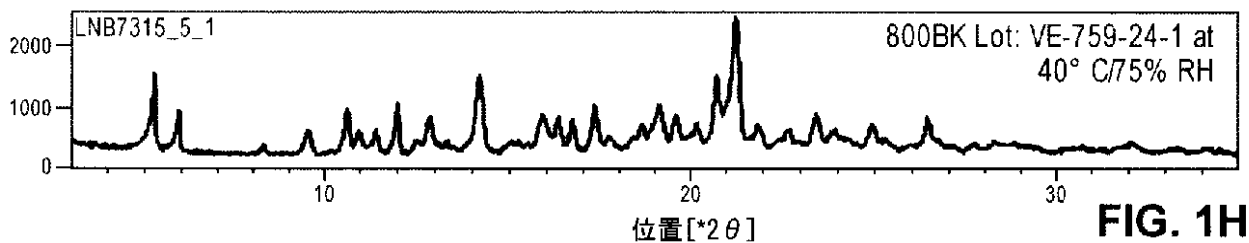
式 1 の形態Bである固体形態であって、

2θ によるピークが約21.2°にあることを含むX線粉末回折パターン、又は

2θ によるピークが約5.3°、約14.2°、約14.3°、約20.7°、及び約21.2°にあることを含むX線粉末回折パターン、又は

以下の図：

【化 4】



に示すようなX線粉末回折パターンを有する、固体形態。

|           |                                                                                                                                                           |         |            |
|-----------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------|------------|
| 专利名称(译)   | 用于荧光成像的IR染料                                                                                                                                               |         |            |
| 公开(公告)号   | <a href="#">JP2018502829A5</a>                                                                                                                            | 公开(公告)日 | 2018-12-20 |
| 申请号       | JP2017527921                                                                                                                                              | 申请日     | 2015-11-23 |
| [标]发明人    | ダニエルアールドラネイ<br>ウィリアムエムボルチェック<br>ケイティシエペ<br>バシルエリッツイン<br>ジョイコバー                                                                                            |         |            |
| 发明人       | ダニエル アール.ドラネイ<br>ウィリアム エム.ボルチェック<br>ケイティ シエペ<br>バシル エリッツイン<br>ジョイ コバー                                                                                     |         |            |
| IPC分类号    | A61K51/04 A61B34/00 G01N21/64 A61B1/313 A61B1/00                                                                                                          |         |            |
| CPC分类号    | A61K49/0032 C09B23/0025 C09B23/0066 C09B23/086 A61B5/0071 A61B5/0084 A61B5/20 A61B5/4244 C09B23/107                                                       |         |            |
| FI分类号     | A61K51/04.200 A61B34/00 G01N21/64.F A61B1/313 A61B1/00.511                                                                                                |         |            |
| F-TERM分类号 | 2G043/BA16 2G043/DA02 2G043/EA01 2G043/FA01 4C085/HH11 4C085/JJ01 4C085/KA27 4C085/KB56 4C085/LL05 4C085/LL11 4C161/AA15 4C161/AA24 4C161/QQ04 4C161/WW17 |         |            |
| 代理人(译)    | 青木 笃<br>石田 敬<br>渡边洋一<br>中岛胜                                                                                                                               |         |            |
| 优先权       | 62/084971 2014-11-26 US                                                                                                                                   |         |            |
| 其他公开文献    | JP2018502829A<br>JP6673917B2                                                                                                                              |         |            |

# 摘要(译)

诊断有效量的2-((E)-2-((E)-3-(2-((E)-3,3-二甲基-5-磺酰基--1-(4-磺酰基丁基))吡啶-2-(亚烷基)亚乙基)-2-苯氧基环己-1-烯-1-基)乙烯基)-3,3-二甲基-1-(4-磺酰基丁基)-3H-吡啶-1-基-5-磺酸盐或2-(((E)-2-((E)-3-(2-((E)-3,3-Dimethyl-5-sulfonato-1-(4-sulfonatobutyl)indoline-2-ylidene))ethidene))-2- 给受试者服用(4-磺酰基苯氧基)环己-1-烯-1-基)乙烯基)-3,3-二甲基-1-(4-磺酰基丁基)-3H-吡啶-1-基-5-磺酸 一种器官成像的方法,包括: 在一实施方案中,器官包括肾脏,膀胱,肝脏,胆囊,脾,肠,心脏,肺和肌肉中的一种或多种。

