

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2007 年 11 月 29 日 (29.11.2007)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2007/135890 A1

- (51) 国際特許分類:  
C07D 471/04 (2006.01) C07D 487/04 (2006.01)  
A61K 51/00 (2006.01) C07F 7/22 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2007/059922
- (22) 国際出願日: 2007 年 5 月 15 日 (15.05.2007)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:  
特願 2006-140044 2006 年 5 月 19 日 (19.05.2006) JP  
特願 2006-324701  
2006 年 11 月 30 日 (30.11.2006) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本メジフィジックス株式会社 (NIHON MEDI-PHYSICS CO., LTD.) [JP/JP]; 〒6620918 兵庫県西宮市六湛寺町 9 番 8 号 Hyogo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 谷藤 樹之 (TANI-FUJI, Shigeyuki) [JP/JP]; 〒2990266 千葉県袖ヶ浦市北

袖 3-1 日本メジフィジックス株式会社内 Chiba (JP). 中村 大作 (NAKAMURA, Daisaku) [JP/JP]; 〒2990266 千葉県袖ヶ浦市北袖 3-1 日本メジフィジックス株式会社内 Chiba (JP). 高崎 新也 (TAKASAKI, Shinya) [JP/JP]; 〒2990266 千葉県袖ヶ浦市北袖 3-1 日本メジフィジックス株式会社内 Chiba (JP). 奥村 侑紀 (OKUMURA, Yuki) [JP/JP]; 〒2990266 千葉県袖ヶ浦市北袖 3-1 日本メジフィジックス株式会社内 Chiba (JP).

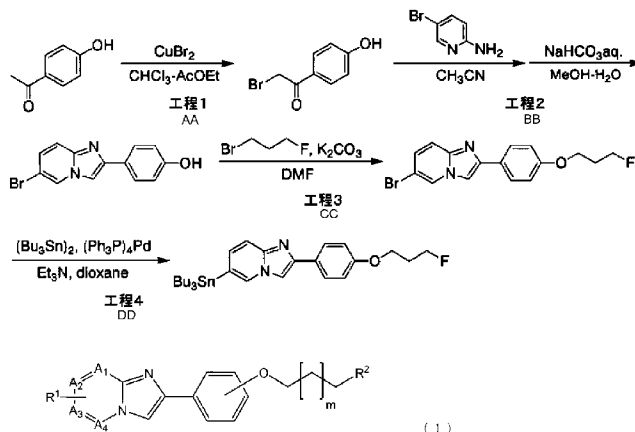
(74) 代理人: 井出正威, 外 (IDE, Masatake et al.); 〒1020076 東京都千代田区五番町 3-1 五番町グラントビル 9 階井出国際特許事務所 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL,

[ 続葉有 ]

(54) Title: NOVEL COMPOUND HAVING AFFINITY FOR AMYLOID

(54) 発明の名称: 新規アミロイド親和性化合物



AA STEP 1  
BB STEP 2  
CC STEP 3  
DD STEP 4

(57) Abstract: Disclosed is a compound having affinity for amyloid, showing fully rapid clearance from a normal tissue, and reduced in toxicities including mutagenicity. Specifically, disclosed is a compound represented by the formula (1) or a salt thereof. Also disclosed is a low-toxic diagnostic agent for Alzheimer's disease, comprising a compound represented by the formula (1) or a salt thereof. (1) wherein A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub>, A<sub>3</sub> and A<sub>4</sub> independently represent a carbon or a nitrogen; R<sup>1</sup> represents a halogen substituent; R<sup>2</sup> represents a halogen substituent; and m represents an integer ranging from 0 to 2, provided that at least one of R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> represents a radioactive halogen substituent, at least one of A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub>, A<sub>3</sub> and A<sub>4</sub> represents a carbon, and R<sup>1</sup> binds to A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub>, A<sub>3</sub> or A<sub>4</sub> which represents a carbon.

[ 続葉有 ]



WO 2007/135890 A1

SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,  
VC, VN, ZA, ZM, ZW.

TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK,

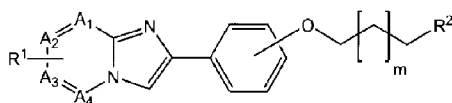
添付公開書類：  
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

アミロイドへの親和性を有し、正常組織からのクリアランスが十分に早く、かつ、変異原性等の毒性がおさえられた化合物を得る。

下記式(1)



(1)

で表される化合物(式中、 $A_1$ 、 $A_2$ 、 $A_3$ 及び $A_4$ はそれぞれ独立に炭素又は窒素、 $R^1$ はハロゲン置換基、 $R^2$ はハロゲン置換基、 $m$ は0～2の整数である。ただし、 $R^1$ 及び $R^2$ の少なくともいずれか一方は放射性ハロゲン置換基であり、かつ、 $A_1$ 、 $A_2$ 、 $A_3$ 及び $A_4$ のうちの少なくとも一つは炭素であって、 $R^1$ は、炭素である $A_1$ 、 $A_2$ 、 $A_3$ 又は $A_4$ に結合する。)又はその塩、並びに前記式で表される化合物又はその塩を含有してなる低毒性アルツハイマー病診断剤。

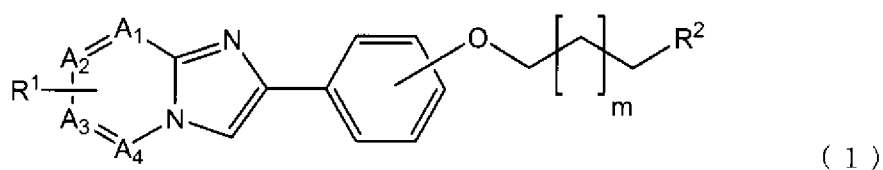
## 要 約 書

## 【要約】

【課題】アミロイドへの親和性を有し、正常組織からのクリアランスが十分に早く、かつ、変異原性等の毒性がおさえられた化合物を得る。

【解決手段】下記式(1)

【化11】



で表される化合物(式中、 $A_1$ 、 $A_2$ 、 $A_3$ 及び $A_4$ はそれぞれ独立に炭素又は窒素、 $R^1$ はハロゲン置換基、 $R^2$ はハロゲン置換基、 $m$ は0～2の整数である。ただし、 $R^1$ 及び $R^2$ の少なくともいずれか一方は放射性ハロゲン置換基であり、かつ、 $A_1$ 、 $A_2$ 、 $A_3$ 及び $A_4$ のうちの少なくとも一つは炭素であって、 $R^1$ は、炭素である $A_1$ 、 $A_2$ 、 $A_3$ 又は $A_4$ に結合する。)又はその塩、並びに前記式で表される化合物又はその塩を含有してなる低毒性アルツハイマー病診断剤。

【選択図】図1－1