

【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18年6月15日(2006.6.15)

【公表番号】特表2006-501149(P2006-501149A)

【公表日】平成18年1月12日(2006.1.12)

【年通号数】公開・登録公報2006-002

【出願番号】特願2004-500925(P2004-500925)

【国際特許分類】

A 6 1 K 51/00 (2006.01)

C 0 7 K 5/027 (2006.01)

C 1 2 Q 1/04 (2006.01)

G 2 1 G 4/08 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 49/02 B

C 0 7 K 5/027

C 1 2 Q 1/04

G 2 1 G 4/08 T

A 6 1 K 49/02 C

【手続補正書】

【提出日】平成18年4月19日(2006.4.19)

【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

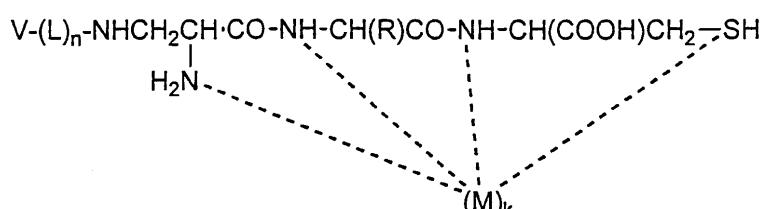
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下式

【化1】



の化合物であって、

Vは、in vivoにおいてレセプターが媒介する膜貫通輸送の基質であるビタミン、または、ビタミンレセプターに結合するその誘導体もしくはそのアナログであり、

Lは、2価のリンカーであり、

Rは、アミノ酸側鎖であり、

Mは、放射性核種の陽イオンであり、

nは、1または0であり、かつ、

kは、1または0であること、

を特徴とする化合物。

【請求項2】

Vが、葉酸塩、リボフラビン、チアミン、ビタミンB_{1,2}、および、ビオチンからなる

群から選択されるビタミン、または、そのビタミンレセプターに結合するその誘導体もしくはそのアナログであることを特徴とする請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

前記放射性核種が、ガリウム、インジウム、銅、テクネチウムおよびレニウムの同位元素からなる群から選択されることを特徴とする請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

前記放射性核種が、テクネチウムの同位元素であることを特徴とする、請求項3に記載の化合物。

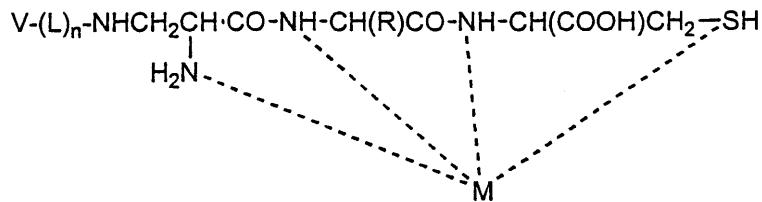
【請求項5】

Vが、葉酸塩、または、葉酸レセプターに結合するそのアナログもしくはその誘導体であることを特徴とする、請求項1～4のいずれかに記載の化合物。

【請求項6】

下式

【化2】



の化合物、およびその化合物に対して薬学的に受容可能なキャリアを含有する画像診断用組成物であって、

Vは、in vivoにおいて、レセプターが媒介する膜貫通輸送の基質であるビタミン、または、ビタミンレセプターに結合するその誘導体もしくはそのアナログであり、

Lは、2価のリンカーであり、

Rは、アミノ酸側鎖であり、

Mは、放射性核種の陽イオンであり、

nは、1または0であること、

を特徴とする画像診断用組成物。

【請求項7】

前記化合物中のVが、葉酸塩、リボフラビン、チアミン、ビタミンB_{1,2}およびビオチンからなる群から選択されるビタミン、または、ビタミンレセプターに結合するその誘導体もしくはそのアナログであることを特徴とする請求項6に記載の組成物。

【請求項8】

前記化合物中の前記放射性核種が、ガリウム、インジウム、銅、テクネチウムおよびレニウムの同位元素からなる群から選択されることを特徴とする請求項6または7に記載の組成物。

【請求項9】

前記化合物中の前記放射性核種が、テクネチウムの同位元素であることを特徴とする請求項8に記載の組成物。

【請求項10】

非経口投与に適応した請求項6～9のいずれかに記載の組成物。

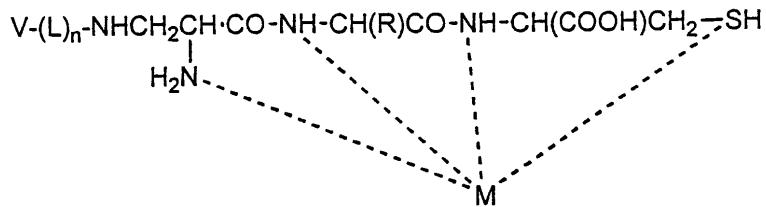
【請求項11】

Vが、葉酸塩、または、葉酸レセプターに結合するそのアナログもしくはその誘導体であることを特徴とする請求項6～10のいずれかに記載の化合物。

【請求項12】

動物における細胞集団を画像化するための組成物を製造するための、下式

【化3】



の化合物の使用方法であって、

該細胞は、該細胞表面上のビタミンレセプターによって特徴付けられ、

Vは、該細胞表面ビタミンレセプターに対して特異的なビタミン、または、ビタミンレセプターに結合するその誘導体もしくはそのアナログであり、

Lは、2価のリンカーであり、

R は、アミノ酸側鎖であり、

Mは、放射性核種の陽イオンであり、

これは、1または0であること、

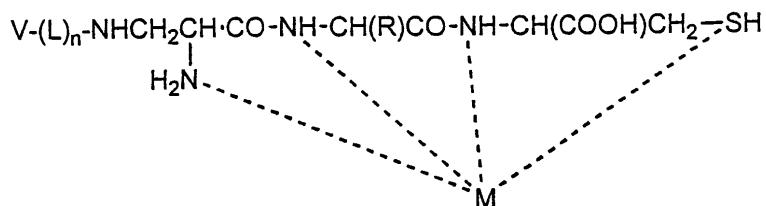
を特徴とする使用方法。

【請求項 13】

動物における細胞集団の前記画像化は、

下式

【化 4】



の化合物、およびその化合物に対して薬学的に受容可能なキャリアを含有する組成物の有効量を該動物に投与する工程と、

動物における該化合物の生体分布をモニターする工程とを含み、

Lは、2価のリンカーであり、

Rは、アミノ酸側鎖であり、

Mは、放射性核種の陽イオンであり、

n は、1 または 0 であること、

を特徴とする請求項 1 2 に記載の使用方法。

【請求項14】

前記化合物中のVが、葉酸塩、リボフラビン、チアミン、ビタミンB₁、ビタミンB₂およびビオチンからなる群から選択されるビタミン、または、ビタミンレセプターに結合するその誘導体もしくはそのアナログであることを特徴とする請求項1-2または1-3に記載の使用方法

○ 請求項 1

【請求項13】 前記化合物中の前記放射性核種が、ガリウム、インジウム、銅、テクネチウムおよびレニウムの同位元素からなる群から選択されることを特徴とする請求項12～14のいずれかに記載の使用方法

記載の使用

【請求項 10】 前記化合物中の前記放射性核種が、テクネチウムの同位元素であることを特徴とする、請求項 1-5 に記載の使用方法。

【請求項 17】

前記組成物が、動物に対して非経口的に投与されることを特徴とする請求項12～16のいずれかに記載の使用方法。

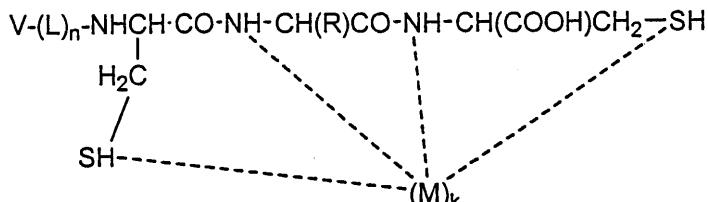
【請求項 18】

Vが、葉酸塩、または、葉酸レセプターに結合するそのアナログまたはその誘導体であることを特徴とする請求項12～17のいずれかに記載の使用方法。

【請求項 19】

下式

【化 5 】



の化合物であって、

Vは、in vivoにおいて、レセプターが媒介する膜貫通輸送の基質であるビタミン、または、ビタミンレセプターに結合するその誘導体もしくはそのアナログであり、

しは、2価のリンクーであり、

Rは、アミノ酸側鎖であり、

Mは、放射性核種の陽イオンであり、

n は、1 または 0 であり、かつ

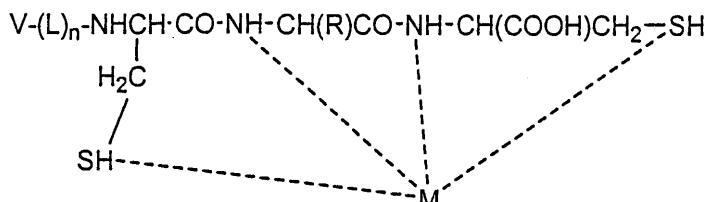
k は、1または0であること

を特徴とする化合物。

【請求項 20】

下式

【化 6】



の化合物、およびその化合物に対して薬学的に受容可能なキャリアを含有する画像診断用組成物であって、

Vは、in vivoにおいて、レセプターが媒介する膜貫通輸送の基質であるビタミン、または、ビタミンレセプターに結合するその誘導体もしくはそのアナログであり、

上は、2価のリンカーであり、

Rは、アミノ酸側鎖であり

Mは、放射性核種の陽イオンであり、

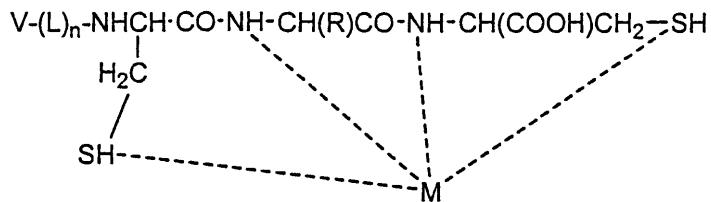
n は、1 または 0 であること、

を特徴とする画像診断用組成物。

【請求項 21】

動物における細胞集団を画像化するための組成物を製造するための、下式

【化7】



の化合物の使用方法であって、

該細胞は、該細胞表面上のビタミンレセプターによって特徴付けられ、

Vは、該細胞表面ビタミンレセプターに対して特異的なビタミン、または、ビタミンレセプターに結合するその誘導体もしくはそのアナログであり、

Lは、2価のリンカーであり、

Rは、アミノ酸側鎖であり、

Mは、放射性核種の陽イオンであり、

nは、1または0であること、

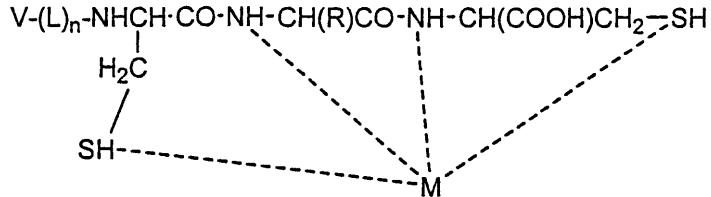
を特徴とする使用方法。

【請求項22】

動物における細胞集団の前記画像化は、

下式

【化8】



の化合物、およびその化合物に対して薬学的に受容可能なキャリアを含有する組成物の有効量を該動物に投与する工程と、

動物における該化合物の生体分布をモニターする工程と
を含み、

Vは、該細胞表面ビタミンレセプターに対して特異的なビタミン、または、ビタミンレセプターに結合するその誘導体もしくはそのアナログであり、

Lは、2価のリンカーであり、

Rは、アミノ酸側鎖であり、

Mは、放射性核種の陽イオンであり、

nは、1または0であること、

を特徴とする請求項21に記載の使用方法。