

【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】令和7年3月26日(2025.3.26)

【公開番号】特開2025-38131(P2025-38131A)
 【公開日】令和7年3月18日(2025.3.18)
 【年通号数】公開公報(特許)2025-049
 【出願番号】特願2024-221293(P2024-221293)
 【国際特許分類】

C 0 7 K 7/00(2006.01) 10
 C 0 7 K 1/16(2006.01)
 A 6 1 K 38/12(2006.01)
 A 6 1 P 35/00(2006.01)
 A 6 1 K 33/24(2019.01)
 A 6 1 K 33/244(2019.01)
 A 6 1 K 33/34(2006.01)
 A 6 1 K 33/30(2006.01)
 A 6 1 K 33/32(2006.01)
 A 6 1 K 33/18(2006.01)
 A 6 1 K 33/16(2006.01) 20
 A 6 1 K 33/245(2019.01)
 A 6 1 K 47/64(2017.01)
 A 6 1 K 51/08(2006.01)

【 F I 】

C 0 7 K 7/00 Z N A
 C 0 7 K 1/16
 A 6 1 K 38/12
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 K 33/24
 A 6 1 K 33/244 30
 A 6 1 K 33/34
 A 6 1 K 33/30
 A 6 1 K 33/32
 A 6 1 K 33/18
 A 6 1 K 33/16
 A 6 1 K 33/245
 A 6 1 K 47/64
 A 6 1 K 51/08 2 0 0
 A 6 1 K 51/08 1 0 0
 C 0 7 K 7/00 40

【手続補正書】

【提出日】令和7年3月14日(2025.3.14)

【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

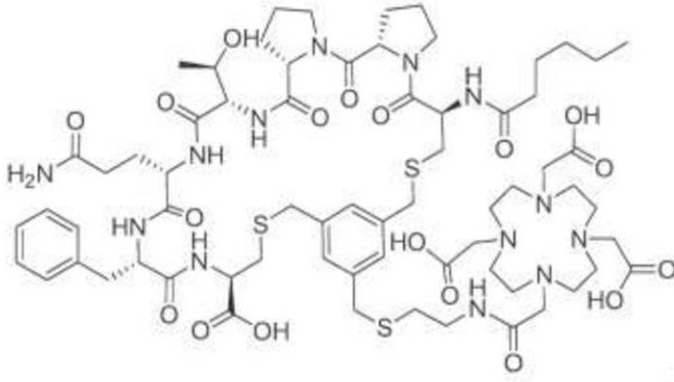
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

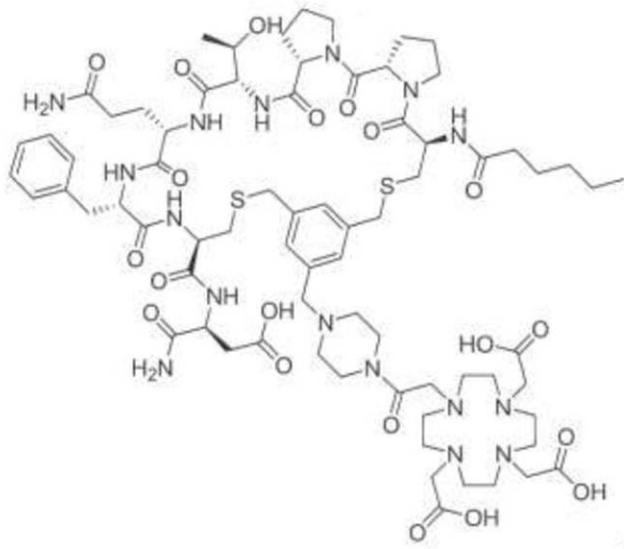
【化 1】



10

または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物；
ならびに、

【化 2】



20

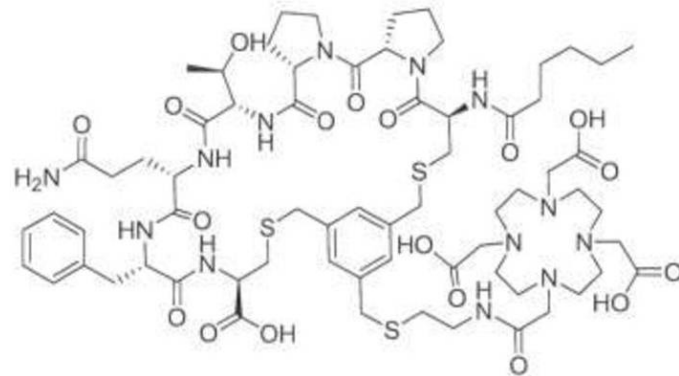
30

または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物、
からなる群から選択される化合物であって、診断的に活性な核種を含む化合物。

【請求項 2】

当該診断的に活性な核種を含む化合物が、

【化 3】



40

または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物であり、前記溶媒和物が水和物であ

50

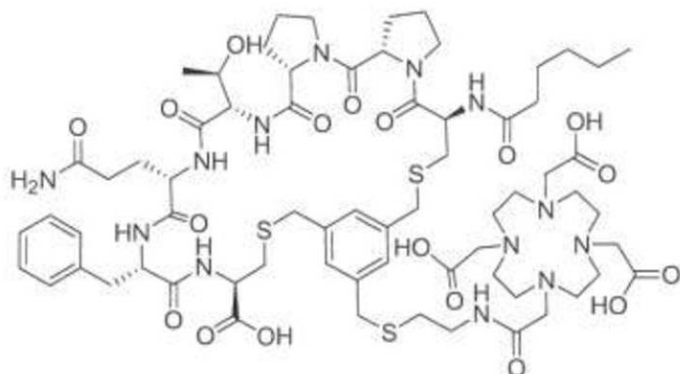
ってよい、

請求項 1 に記載の化合物、または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 3】

前記診断的に活性な核種を含む化合物が、

【化 4】



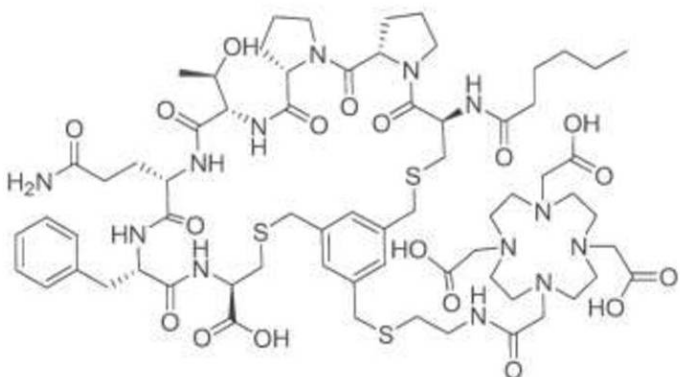
10

、または、その薬学的に許容される塩である、請求項 2 に記載の化合物、または、その薬学的に許容される塩。

【請求項 4】

前記診断的に活性な核種を含む化合物が、

【化 5】



30

である、請求項 3 に記載の化合物。

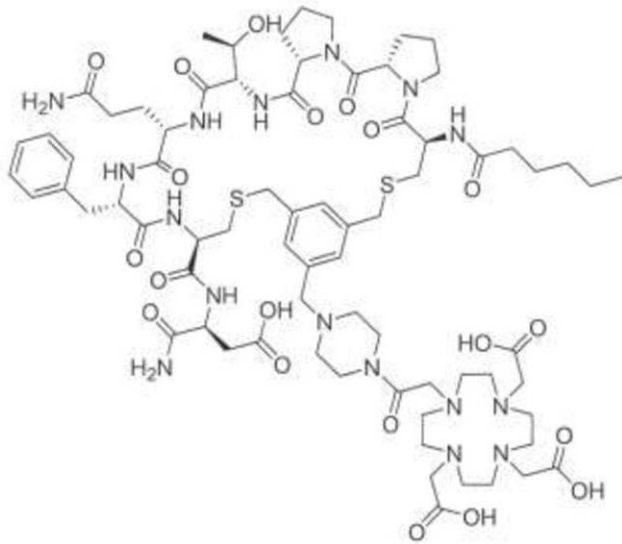
【請求項 5】

前記診断的に活性な核種を含む化合物が、

40

50

【化 6】



10

、または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物であり、前記溶媒和物が水和物であってよい、

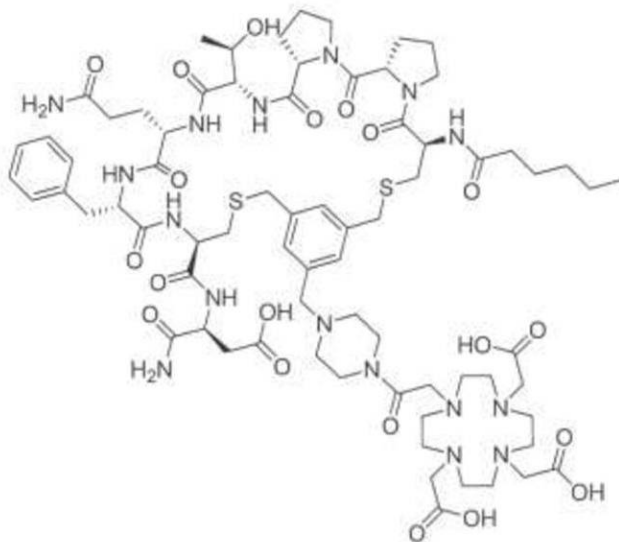
20

請求項 1 に記載の化合物、または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 6】

前記診断的に活性な核種を含む化合物が、

【化 7】



30

、または、その薬学的に許容される塩である、請求項 5 に記載の化合物、または、その薬学的に許容される塩。

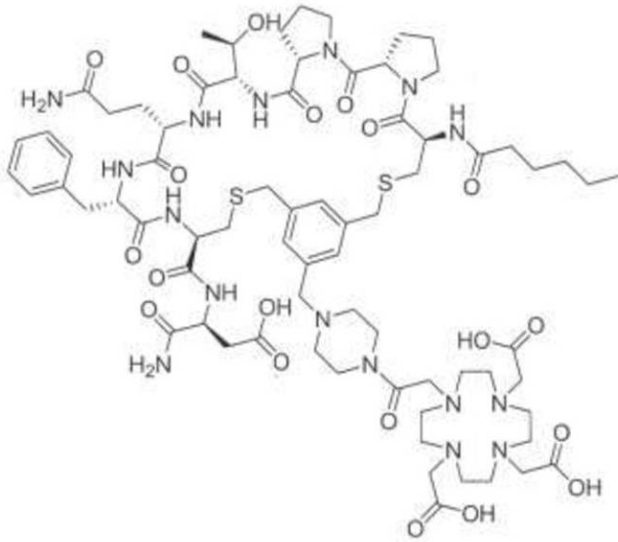
40

【請求項 7】

前記診断的に活性な核種を含む化合物が、

50

【化 8】



10

である、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

20

前記診断的に活性な核種が、診断的に活性な放射性核種である、請求項 1 から 7 のいずれか一項に記載の化合物、または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 9】

診断的に活性な放射性核種が診断的使用のための 発光同位体であり、 $0.004 \sim 10 \text{ MeV}$ の崩壊エネルギーを有するか、診断的に活性な放射性核種が診断的使用のための陽電子放出同位体であり、 $0.6 \sim 13.2 \text{ MeV}$ の崩壊エネルギーを有する、請求項 8 に記載の化合物、または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 10】

診断的に活性な放射性核種が診断的使用のための 発光同位体であり、 $0.05 \sim 4 \text{ MeV}$ の崩壊エネルギーを有するか、診断的に活性な放射性核種が診断的使用のための陽電子放出同位体であり、 $1 \sim 6 \text{ MeV}$ の崩壊エネルギーを有する、請求項 9 に記載の化合物、または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物。

30

【請求項 11】

前記診断的に活性な放射性核種が、 ^{43}Sc 、 ^{44}Sc 、 ^{51}Mn 、 ^{52}Mn 、 ^{64}Cu 、 ^{67}Ga 、 ^{68}Ga 、 ^{86}Y 、 ^{89}Zr 、 $^{94\text{m}}\text{Tc}$ 、 $^{99\text{m}}\text{Tc}$ 、 ^{111}In 、 ^{152}Tb 、 ^{155}Tb 、 ^{201}Tl 、 ^{203}Pb 、 ^{18}F 、 ^{76}Br 、 ^{77}Br 、 ^{123}I 、 ^{124}I 、および ^{125}I からなる群から選択される、請求項 8 から 10 のいずれか一項に記載の化合物、または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 12】

前記診断的に活性な放射性核種が、 ^{43}Sc 、 ^{44}Sc 、 ^{64}Cu 、 ^{67}Ga 、 ^{68}Ga 、 ^{86}Y 、 ^{89}Zr 、 $^{99\text{m}}\text{Tc}$ 、 ^{111}In 、 ^{152}Tb 、 ^{155}Tb 、 ^{203}Pb 、 ^{18}F 、 ^{76}Br 、 ^{77}Br 、 ^{123}I 、 ^{124}I および ^{125}I からなる群から選択される、請求項 11 に記載の化合物、または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物。

40

【請求項 13】

前記診断的に活性な放射性核種が、 ^{64}Cu 、 ^{68}Ga 、 ^{89}Zr 、 $^{99\text{m}}\text{Tc}$ 、 ^{111}In 、 ^{18}F 、 ^{123}I 、および ^{124}I からなる群から選択される、請求項 11 または 12 に記載の化合物、または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 14】

前記診断的に活性な放射性核種が、診断的に活性な放射性金属である、請求項 8 から 12 のいずれか一項に記載の化合物、または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物

50

。

【請求項 15】

前記診断的に活性な放射性核種が、 ^{64}Cu である、請求項 8 から 14 のいずれか一項に記載の化合物、または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 16】

前記診断的に活性な放射性核種が、 ^{68}Ga である、請求項 8 から 14 のいずれか一項に記載の化合物、または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物。

【請求項 17】

前記診断的に活性な核種が、1, 4, 7, 10 - テトラアザシクロドデカン - 1, 4, 7, 10 - テトラ酢酸 (DOTA) キレート剤に錯体化されている、請求項 1 から 16 のいずれか一項に記載の化合物、または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物。 10

【請求項 18】

請求項 8 から 16 のいずれか一項に定義されている化合物、または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物を含む、放射性核種キレート錯体であって、前記診断的に活性な放射性核種が、1, 4, 7, 10 - テトラアザシクロドデカン - 1, 4, 7, 10 - テトラ酢酸 (DOTA) キレート剤に錯体化されている、前記放射性核種キレート錯体。

【請求項 19】

請求項 1 から 17 のいずれか一項に記載の化合物、もしくは、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物、または、請求項 18 に記載の放射性核種キレート錯体；および、薬学的に許容される賦形剤、を含む組成物。 20

【請求項 20】

医薬組成物である、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 21】

疾患の診断のための方法で使用するための、請求項 19 または 20 に記載の組成物。

【請求項 22】

当該疾患が新生物である、請求項 21 に記載の組成物。

【請求項 23】

前記疾患が癌または腫瘍である、請求項 22 に記載の組成物。

【請求項 24】

前記疾患が、線維芽細胞活性化タンパク質 (FAP) の上方制御された発現を示す細胞が関与する疾患である、請求項 22 または 23 に記載の組成物。 30

【請求項 25】

前記疾患が、線維芽細胞活性化タンパク質 (FAP) の上方制御された発現を示す細胞を含む罹患した組織が関与する疾患である、請求項 24 に記載の組成物。

【請求項 26】

前記疾患が、腫瘍に伴う線維芽細胞が関与する疾患である、請求項 24 または 25 に記載の組成物。

【請求項 27】

前記疾患が、固形腫瘍、上皮腫瘍、膀胱がん、乳がん、頸がん、結腸直腸がん、胆管癌、子宮内膜がん、食道がん、胃がん、胃腸間質腫瘍、頭頸部がん、肝がん、肺がん、黒色腫、中皮腫、神経内分泌腫瘍および癌腫、卵巣がん、膵がん、前立腺がん、腎細胞癌、唾液腺癌、肉腫、扁平上皮癌、および甲状腺がんを含む群から選択される、請求項 21 から 26 のいずれか一項に記載の組成物。 40

【請求項 28】

前記疾患が、乳がん、結腸直腸がん、胆管癌、頭頸部がん、肺がん、中皮腫、神経内分泌腫瘍および癌腫、卵巣がん、膵がん、前立腺がん、肉腫、および扁平上皮癌を含む群から選択される、請求項 27 に記載の組成物。

【請求項 29】

前記疾患が、炎症性疾患、心臓血管系疾患、自己免疫疾患、または線維性疾患である、請求項 21 に記載の組成物。 50

- 【請求項 30】
前記疾患が、線維芽細胞活性化タンパク質（FAP）の上方制御された発現を示す細胞が関与するものである、請求項 29 に記載の組成物。
- 【請求項 31】
疾患が、線維芽細胞活性化タンパク質（FAP）の上方制御された発現を示す細胞を含む罹患した組織を伴う、請求項 30 に記載の組成物。
- 【請求項 32】
前記疾患が炎症性疾患である、請求項 29 から 31 のいずれか一項に記載の組成物。
- 【請求項 33】
前記疾患がアテローム硬化症、関節炎、またはリウマチ性関節炎である、請求項 32 に記載の組成物。 10
- 【請求項 34】
前記疾患が心臓血管系疾患である、請求項 29 から 31 のいずれか一項に記載の組成物。
- 【請求項 35】
前記疾患がアテローム硬化性プラークを伴う心臓血管系疾患である、請求項 34 に記載の組成物。
- 【請求項 36】
前記疾患がプラークの破壊、急性冠不全症候群、心筋梗塞、血栓症、または血管閉塞によって惹起されるアテローム硬化性病変である、請求項 35 に記載の組成物。 20
- 【請求項 37】
前記疾患が線維性疾患である、請求項 29 から 31 のいずれか一項に記載の組成物。
- 【請求項 38】
前記疾患が特発性肺線維症、クローン病、および肝線維症を含む群から選択される、請求項 37 に記載の組成物。
- 【請求項 39】
前記診断のための方法がイメージング法である、請求項 21 から 38 のいずれか一項に記載の組成物。
- 【請求項 40】
前記イメージング法がシンチグラフィ、単光子放出コンピュータ断層撮影（SPECT）、および陽電子放出断層撮影（PET）からなる群から選択される、請求項 39 に記載の組成物。 30
- 【請求項 41】
請求項 1 から 17 のいずれか一項に記載の化合物、または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物、請求項 18 に記載の放射性核種キレート錯体を含み、1つまたは複数の賦形剤、ならびに、1つまたは複数のデバイスを含んでよいキットであって、前記デバイスが標識付けデバイス、精製デバイス、取り扱いデバイス、放射線保護デバイス、分析デバイス、または投与デバイスである、前記キット。
- 【請求項 42】
(i) 請求項 1 から 17 のいずれか一項に記載の化合物、または、その薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物、または請求項 18 に記載の放射性核種キレート錯体、および (ii) 抗がん化合物を含む、組み合わせ。 40