

【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5年3月1日(2023.3.1)

【公開番号】特開2022-110118(P2022-110118A)

【公開日】令和4年7月28日(2022.7.28)

【年通号数】公開公報(特許)2022-137

【出願番号】特願2022-82105(P2022-82105)

【国際特許分類】

A 61K 47/54(2017.01)  
 A 61P 35/00(2006.01)  
 A 61K 49/00(2006.01)  
 A 61K 51/04(2006.01)  
 A 61K 31/407(2006.01)  
 A 61K 31/475(2006.01)  
 A 61K 31/337(2006.01)  
 A 61K 31/427(2006.01)  
 A 61K 31/4745(2006.01)

10

【F I】

A 61K 47/54  
 A 61P 35/00  
 A 61K 49/00  
 A 61K 51/04 200  
 A 61K 31/407  
 A 61K 31/475  
 A 61K 31/337  
 A 61K 31/427  
 A 61K 31/4745

20

【手続補正書】

30

【提出日】令和5年2月17日(2023.2.17)

【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】

PSMAのリガンド(B)、リンカー(L)及び薬剤(D)を含む式(I)：  
 B - L - D (I)

40

の化合物であって、

リンカーが薬剤と共有結合し、リンカーがリガンドと共有結合し、  
 Bが2つの天然のアミノ酸のウレアであり、  
 Lが7個の原子から20個の原子の範囲の原子鎖を含み、それぞれ適宜置換されている  
 、アルキル、シクロアルキル、アリール、およびアリールアルキルから選択される1つの  
 溶水性側鎖基を含む、化合物。

【請求項2】

アミノ酸に1以上の付加的なカルボン酸が含まれる、請求項1の化合物。

【請求項3】

原子鎖の一部が二価フラグメントで環化されている、請求項1に記載の化合物。

50

## 【請求項 4】

リンカーが、カルボニル、チオノカルボニル、アルキレン、シクロアルキレン、アルキレンシクロアルキル、アルキレンカルボニル、シクロアルキレンカルボニル、カルボニルアルキルカルボニル、1-アルキレンスクシンイミド-3-イル、1-(カルボニルアルキル)スクシンイミド-3-イル、アルキレンスルホキシル、スルホニルアルキル、アルキレンスルホキシルアルキル、アルキレンスルホニルアルキル、カルボニルテトラヒドロ-2H-ピラニル、カルボニルテトラヒドロフラニル、1-(カルボニルテトラヒドロ-2H-ピラニル)スクシンイミド-3-イル及び1-(カルボニルテトラヒドロフラニル)スクシンイミド-3-イルから選択されるスペーサーリンカーであり、ここで、スペーサーリンカーは、それぞれ適宜置換基X<sup>1</sup>で置換されていてもよく、

X<sup>1</sup>は、アルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アミノ、アミノアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、ハロ、ハロアルキル、スルフヒドリルアルキル、アルキルチオアルキル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、カルボキシ、カルボキシアルキル、アルキルカルボキシレート、アルキルアルカノエート、グアニジノアルキル、R<sup>4</sup>-カルボニル、R<sup>5</sup>-カルボニルアルキル、R<sup>6</sup>-アシルアミノ及びR<sup>7</sup>-アシルアミノアルキルであり、ここで、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は、それぞれ独立して、アミノ酸、アミノ酸誘導体及びペプチドから選択され、そしてR<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は、それぞれ独立して、アミノ酸、アミノ酸誘導体及びペプチドから選択される、

請求項1の化合物。

10

20

30

40

## 【請求項 5】

スペーサーリンカーが追加の窒素を含み、スペーサーリンカーが、アルキレンカルボニル、シクロアルキレンカルボニル、カルボニルアルキルカルボニル、1-(カルボニルアルキル)スクシンイミド-3-イルから選択され、ここで、スペーサーリンカーは、適宜置換基X<sup>1</sup>で置換されてもよく、スペーサーリンカーは、窒素と結合してアミドを形成する、請求項4の化合物。

## 【請求項 6】

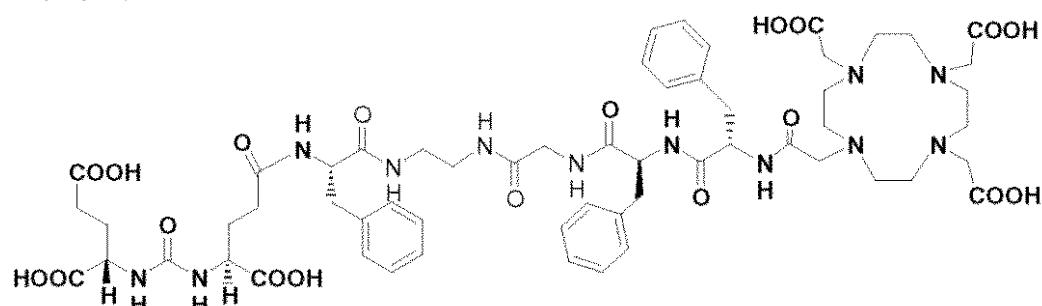
PSMA結合部位が、PSMAリガンドが薬剤又はリンカーに結合した後、少なくとも3つの遊離カルボン酸基を含む、請求項1の化合物。

## 【請求項 7】

薬物がキレート基に配位している金属の放射性同位体である、請求項1の化合物。

## 【請求項 8】

化学式：



で表される請求項1の化合物。

## 【請求項 9】

治療有効量の請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物、および担体、希釈剤及び/又は賦形剤から選択される成分を含む、医薬組成物。

## 【請求項 10】

PSMAを発現又は過剰発現する病原性細胞集団に関連する疾患及び疾患状態を治療するのに用いられる、請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物を含む医薬組成物。

50

**【請求項 1 1】**

疾患が前立腺癌である、請求項 1 0 の医薬組成物。

**【請求項 1 2】**

P S M A を発現又は過剰発現する病原性細胞集団に関連する疾患及び疾患状態をインピボで診断するのに用いられる、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む医薬組成物。

**【請求項 1 3】**

P S M A を発現又は過剰発現する病原性細胞集団に関連する疾患及び疾患状態を生体外で診断するのに用いられる、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む医薬組成物。

**【請求項 1 4】**

P S M A を発現又は過剰発現する病原性細胞集団に関連する組織及び / 若しくは細胞を画像化するのに用いられる、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む医薬組成物。

10

20

30

40

50