

【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3年6月10日(2021.6.10)

【公表番号】特表2020-517584(P2020-517584A)
 【公表日】令和2年6月18日(2020.6.18)
 【年通号数】公開・登録公報2020-024
 【出願番号】特願2019-553045(P2019-553045)
 【国際特許分類】

C 0 7 F 5/00 (2006.01)
 A 6 1 K 49/10 (2006.01)
 A 6 1 B 5/055 (2006.01)
 G 0 1 N 24/00 (2006.01)
 G 0 1 R 33/56 (2006.01)
 G 0 1 R 33/50 (2006.01)
 G 0 1 N 24/08 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 F 5/00 C S P D
 A 6 1 K 49/10
 A 6 1 B 5/055 3 8 3
 G 0 1 N 24/00 1 0 0 B
 G 0 1 R 33/56
 G 0 1 R 33/50
 G 0 1 N 24/08 5 1 0 L

【手続補正書】

【提出日】令和3年4月20日(2021.4.20)

【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

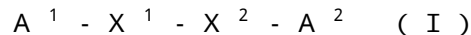
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物であって、



式中、

A¹は有機基であるか；またはA¹は親水性基もしくは水素原子であり；

A²はMRI造影剤部分であり；

X¹は疎水性基であり；

X²は直接結合、有機基、-O-、-S-、-S(=O)-、-S(=O)₂-、-S-S-、-N=、=N-、-N(H)-、-N=N-N(H)-、-N(H)-N=N-、-N(OH)-、または-N(=O)-である、前記化合物。

【請求項2】

A¹が、カルボン酸基、カルボン酸アニオン、またはカルボン酸エステルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

前記MRI造影剤部分が、1600Da以下、1500Da以下、または1400Da以下、または1300Da以下、または1200Da以下、または1100Da以下、または1000Da以下の分子量を有する、請求項1に記載の化合物。

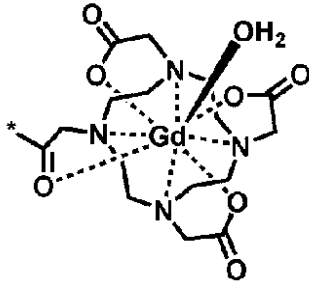
【請求項 4】

前記MRI造影剤部分が有機金属部分、ガドレル酸部分、ガドペンテト酸、またはこれらのいずれかの薬剂的に許容される塩である、請求項1に記載の化合物。

【請求項 5】

前記MRI造影剤部分が式：

【化 1】



の部分である、請求項1に記載の化合物。

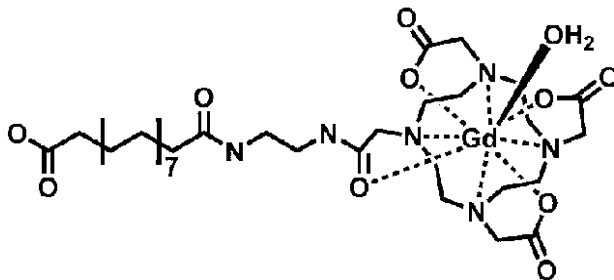
【請求項 6】

X^1 が置換されていてもよい C_{12-22} ヒドロカルビレン、 C_{12-22} アルキレン基、 $-(CH_2)_{12}-$ 、 $-(CH_2)_{14}-$ 、 $-(CH_2)_{16}-$ 、 $-(CH_2)_{18}-$ 、 $-(CH_2)_{20}-$ 、または $-(CH_2)_{22}-$ 、 $-(CH_2)_{16}-$ 、 $-C(=O)-$ からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項 7】

式：

【化 2】



の化合物またはその薬剂的に許容される塩である、請求項1に記載の化合物。

【請求項 8】

請求項1に記載の化合物；および

タンパク質であって、ヒト血清アルブミンであるか、または配列がヒト血清アルブミンの配列と50%以上同一であるタンパク質である、前記タンパク質、を含んでなる診断用組成物。

【請求項 9】

前記タンパク質がヒト血清アルブミンである、請求項8に記載の診断用組成物。

【請求項 10】

水を含む担体をさらに含んでなり、前記化合物および前記タンパク質が前記担体によって溶媒和されている、請求項8に記載の診断用組成物。

【請求項 11】

前記化合物および前記タンパク質が、 $10^2 M^{-1}$ 以上、または $10^3 M^{-1}$ 以上、または $10^4 M^{-1}$ 以上、または $10^5 M^{-1}$ 以上の結合定数 (K_b) で互いに非共有結合している、請求項8に記載の診断用組成物。

【請求項 12】

請求項8に記載の診断用組成物であって、前記組成物中90重量%以上、または95%

重量%以上、または97重量%以上、または99%重量%以上の前記化合物が 10^2 M^{-1} 以上、または 10^3 M^{-1} 以上、または 10^4 M^{-1} 以上、または 10^5 M^{-1} 以上の結合定数(K_b)でタンパク質に結合している、前記診断用組成物。

【請求項13】

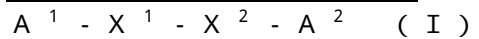
前記組成物中90重量%以上、または95重量%以上、または97重量%以上、または99重量%以上のタンパク質結合粒子が、5nm以下または4nm以下の動的光散乱で測定した半径を有する、請求項12に記載の診断用組成物。

【請求項14】

前記診断用組成物が、哺乳動物への非経口投与または静脈内投与に適している、請求項8に記載の診断用組成物。

【請求項15】

式(I)の化合物であって、



式中、

A^1 は有機基であるか；または A^1 は親水性基もしくは水素原子であり；

A^2 はMRI造影剤部分であり；

X^1 は疎水性基であり；

X^2 は直接結合、有機基、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{S}(=\text{O})-$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2-$ 、 $-\text{S}-\text{S}-$ 、 $-\text{N}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{H})-$ 、 $-\text{N}=\text{N}-\text{N}(\text{H})-$ 、 $-\text{N}(\text{H})-\text{N}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{OH})-$ 、または $-\text{N}(=\text{O})-$ であり、MRI造影剤部分およびタンパク質結合部分を含んでなる化合物と；

タンパク質であって、ヒト血清アルブミンであるか、または配列がヒト血清アルブミンの配列と50%以上同一であるタンパク質である、前記タンパク質と；

水を含んでなる担体と；

を含んでなる診断用組成物であって、

前記化合物および前記タンパク質が、 10^2 M^{-1} 以上、または 10^3 M^{-1} 以上、または 10^4 M^{-1} 以上、または 10^5 M^{-1} 以上の結合定数(K_b)で互いに非共有結合しており、

前記化合物および前記タンパク質が前記担体によって溶媒和されている、前記診断用組成物。

【請求項16】

前記タンパク質がヒト血清アルブミンである、請求項15に記載の診断用組成物。

【請求項17】

請求項15に記載の診断用組成物であって、前記組成物中90重量%以上、または95%重量%以上、または97重量%以上、または99%重量%以上の前記化合物が 10^2 M^{-1} 以上、または 10^3 M^{-1} 以上、または 10^4 M^{-1} 以上、または 10^5 M^{-1} 以上の結合定数(K_b)でタンパク質に結合している、前記診断用組成物。

【請求項18】

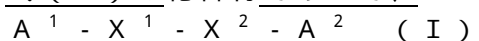
前記組成物中90重量%以上、または95重量%以上、または97重量%以上、または99重量%以上のタンパク質結合粒子が、5nm以下または4nm以下の動的光散乱で測定した半径を有する、請求項17に記載の診断用組成物。

【請求項19】

前記医薬組成物が、哺乳動物への非経口投与または静脈内投与に適している、請求項15に記載の診断用組成物。

【請求項20】

式(I)の化合物であって、



式中、

A^1 は有機基であるか；または A^1 は親水性基もしくは水素原子であり；

A^2 はMRI造影剤部分であり；

X¹ は疎水性基であり；

X² は直接結合、有機基、-O-、-S-、-S(=O)-、-S(=O)₂-、-S-S-、-N=、=N-、-N(H)-、-N=N-N(H)-、-N(H)-N=N-、-N(OH)-、または-N(=O)-である化合物を対象に投与することと；

癌性腫瘍の細胞外液中の、前記対象の1以上の組織の細胞外液中の、前記対象の脈管系中の、または前記対象の肝臓組織の細胞外液中の、前記化合物またはその代謝産物の存在または濃度を検出することと、
を含んでなる、癌診断法。