

【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12月7日(2006.12.7)

【公表番号】特表2006-508084(P2006-508084A)

【公表日】平成18年3月9日(2006.3.9)

【年通号数】公開・登録公報2006-010

【出願番号】特願2004-546174(P2004-546174)

【国際特許分類】

A 6 1 K 51/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 43/00

A 6 1 K 49/02 B

【手続補正書】

【提出日】平成18年10月20日(2006.10.20)

【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

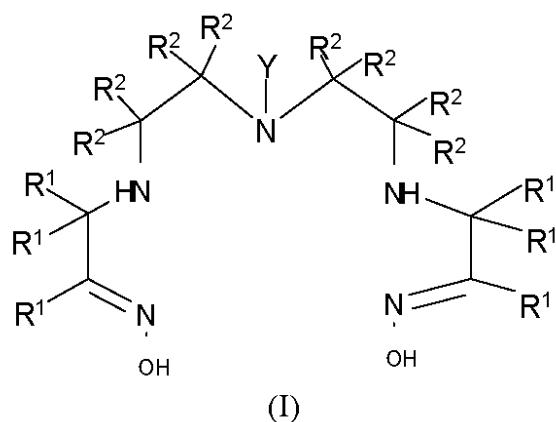
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

放射性同位体^xTcと以下の式(I)の配位子との金属錯体を含むテクネチウム錯体組成物であって、(i)テクネチウム錯体組成物中に存在する^xTc錯体の10%未満が式Iの配位子の過渡^xTc錯体であるとともに、(ii)テクネチウム錯体組成物中に存在する^xTc錯体の5%未満が式Iの配位子の親油性^xTc錯体である、テクネチウム錯体組成物。

【化1】



式中、R¹及びR²は各々独立にR基であり、

xは94m、99又は99mであり、

Yは-(A)_n-Zであるが、

式中、Zは分子量5000未満の生体標的部分であり、

- (A)_nはリンカーベ基であって、各Aは独立に-CO-、-CR₂-、-CR=CR-、

-CC-、-CR₂CO₂-、-CO₂CR₂-、-NR-、-NRCO、-CONR-、

-NR(C=O)NR-、-NR(C=S)NR-、-SO₂NR-、-NRSO₂-、-

CR₂OCCR₂-、-CR₂SCCR₂-、-CR₂NRCR₂-、C₄₋₈シクロヘテロアルキレン基、C₄₋₈シクロアルキレン基、C₅₋₁₂アリーレン基もしくはC₃₋₁₂ヘテロアリーレン

基又はポリアルキレングリコール、ポリ乳酸又はポリグリコール酸成分であり、
n は 0 ~ 10 の整数であり、

各 R 基は独立に H 又は C_{1~10}アルキル、C_{3~10}アルキルアリール、C_{2~10}アルコキシアルキル、C_{1~10}ヒドロキシアルキル、C_{1~10}フルオロアルキルであるか、或いは 2 以上の R 基がそれらに結合した原子と共に炭素環、複素環、飽和又は不飽和環を形成するものである。

【請求項 2】

Z が 3 ~ 20 個のアミノ酸からなるペプチドである、請求項 1 記載のテクネチウム錯体組成物。

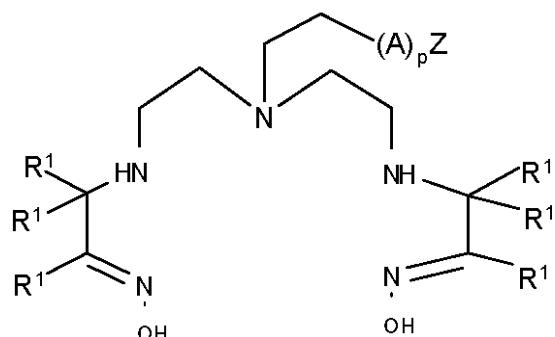
【請求項 3】

3 ~ 20 個のアミノ酸のペプチドが 2 - 抗プラスミンの断片である、請求項 2 記載のテクネチウム錯体組成物。

【請求項 4】

配位子が次の式 (II) の配位子である、請求項 1 乃至請求項 3 のいずれか 1 項記載のテクネチウム錯体組成物。

【化 2】



(II)

式中、R¹ は各々独立に C_{1~3}アルキル又は C_{1~3}フルオロアルキルであり、p は 0 ~ 3 の整数である。

【請求項 5】

(A)_p が -CO- 又は -NR- である、請求項 4 記載のテクネチウム錯体組成物。

【請求項 6】

R¹ が各々 CH₃ であり、(A)_p が NH であり、Z が Ac - Asn - Glu - Glu - Val - Ser - Pro - Xaa - Thr - Leu - Leu - Lys - Gly - (式中、Xaa が Tyr 又は I - Tyr であり、Ac が N - アセチルである) である、請求項 4 又は請求項 5 記載のテクネチウム錯体組成物。

【請求項 7】

請求項 1 乃至請求項 6 のいずれか 1 項記載のテクネチウム錯体組成物を哺乳類への投与に適した形態で含有する放射性医薬品。

【請求項 8】

以下の成分 (i) ~ (iii) を備える、請求項 7 記載のテクネチウム放射性医薬品の製造用キット。

- (i) 請求項 1 記載の式 (I) の配位子、
- (ii) 生体適合性還元剤、及び
- (iii) 弱有機酸又はその生体適合性カチオンとの塩。

【請求項 9】

以下の成分 (i) ~ (v) を備える、請求項 8 記載のキット。

- (i) 請求項 6 記載の式 II の配位子、
- (ii) 第一スズを含有する生体適合性還元剤、
- (iii) メチレンジホスホン酸を含む弱有機酸又はその生体適合性カチオンとの塩、

(i v) p - アミノ安息香酸又はその生体適合性の塩を含む放射線防護剤、
(v) 重炭酸ナトリウムを含む pH 調節剤。