(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2004 年4 月8 日 (08.04.2004)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2004/029080 A1

(51) 国際特許分類[7]: C07K 7/02, A61K 38/00, 49/00, 51/00, A61N 5/10, A61P 37/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2003/012362

(22) 国際出願日: 2003 年9 月26 日 (26.09.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2002-282229 2002 年9 月27 日 (27.09.2002) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本メジフィジックス株式会社 (NIHON MEDI-PHYSICS CO., LTD.) [JP/JP]; 〒662-0918 兵庫県 西宮市 六湛寺町9番8号 Hyogo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 関 育也 (SEKI,Ikuya) [JP/JP]; 〒299-0266 千葉県 袖ケ浦市 北袖3番地1 日本メジフィジックス株式会社 創薬研究所内 Chiba (JP). 川口 敬義 (KAWAGUCHI,Takayoshi) [JP/JP]; 〒299-0266 千葉県 袖ケ浦市 北袖3番地1 日本メジフィジックス株式会社 創薬研究所内 Chiba (JP). 白神 宜史 (SHIRAKAMI,Yoshifumi) [JP/JP]; 〒299-0266 千葉県 袖ケ浦市 北袖3番地1 日本メジフィジックス株式会社 創薬研究所内 Chiba (JP).

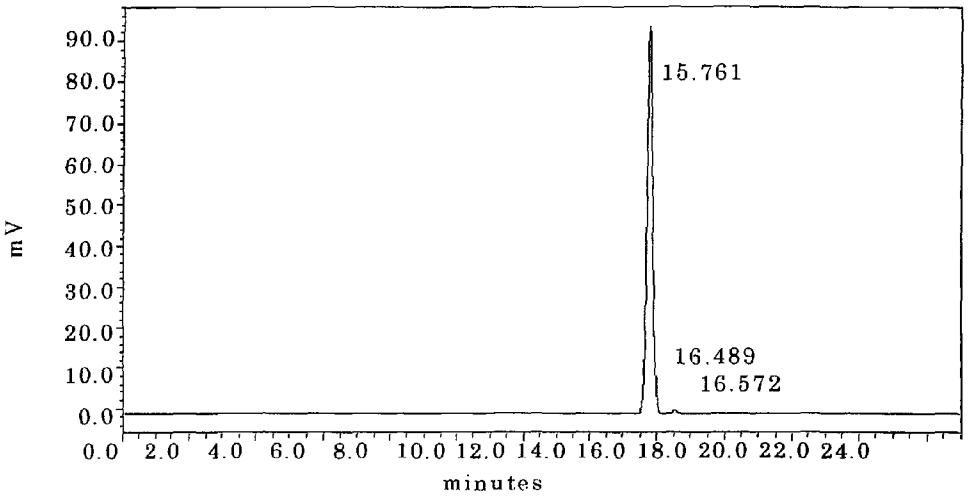
(74) 代理人: 浅村 皓, 外 (ASAMURA,Kiyoshi et al.); 〒100-0004 東京都 千代田区 大手町2丁目2番1号 新大手町ビル331 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,

[続葉有]

(54) Title: COMPOUND BINDING TO LEUKOCYTES AND MEDICINAL COMPOSITION CONTAINING THE COMPOUND IN LABELED STATE AS THE ACTIVE INGREDIENT

(54) 発明の名称: 白血球結合性化合物およびその標識化合物を有効成分とする医薬組成物



Ｔｃ９９ｍ-ペプチド４のＨＰＬＣチャート

HPLC CHROMATOGRAM OF Tc99m-PEPTIDE 4

(57) Abstract: A compound binding to leukocytes, which comprises Met or Nle-Leu-Phe serving as the leukocyte-binding site of a formyl peptide receptor (FPR), a binding part comprising Ser or Thr elevating the binding ratios to monocytes and lymphocytes in all leukocytes, a group which can be labeled with a radioactive metal or a paramagnetic metal, and a spacer binding them shows binding properties specific to all leukocytes, i.e., neutrophilic leukocytes, monocytes and lymphocytes both *in vivo* and *in vitro* and

[続葉有]

WO 2004/029080 A1

LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

２文字コード及び他の略語については、定期発行される各*PCT*ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

can be labeled with a radioactive metal or a paramagnetic metal. Owing to these characteristics, this compound is highly useful in SPECT image diagnosis, PET image diagnosis, MRI image diagnosis and so on wherein imaging is performed in a site with vigorous leukocyte infiltration accompanied by an immune reaction in an individual.

(57) 要約: 白血球のホルミルペプチド受容体ＦＰＲとの結合部位であるＭｅｔまたはＮｌｅ−Ｌｅｕ−Ｐｈｅ−、全白血球中の単球、リンパ球への結合率を向上させるＳｅｒまたはＴｈｒからなる結合部分、放射性金属または常磁性金属で標識可能な基、およびこれらを結合する役割を荷うスペーサーから構成される白血球結合性化合物は、生体内外ですべての白血球、すなわち好中球、単球、リンパ球に対して特異的な結合性を示し、かつ放射性金属または常磁性金属で標識可能であり、従って個体の免疫応答反応を伴う白血球浸潤の盛んな部位のイメージングを行うＳＰＥＣＴ画像診断、ＰＥＴ画像診断、ＭＲＩ画像診断などに極めて有用である。