

【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6月13日(2025.6.13)

【国際公開番号】WO2022/246183
 【公表番号】特表2024-519970(P2024-519970A)
 【公表日】令和6年5月21日(2024.5.21)
 【年通号数】公開公報(特許)2024-092
 【出願番号】特願2023-572230(P2023-572230)

【国際特許分類】

10

- A 6 1 K 51/10(2006.01)
- A 6 1 K 31/555(2006.01)
- A 6 1 K 39/395(2006.01)
- A 6 1 K 33/24(2019.01)
- A 6 1 K 33/245(2019.01)
- A 6 1 K 9/08(2006.01)
- A 6 1 K 9/10(2006.01)
- A 6 1 P 43/00(2006.01)
- A 6 1 P 35/00(2006.01)
- A 6 1 P 35/04(2006.01)
- A 6 1 P 11/00(2006.01)
- A 6 1 P 15/00(2006.01)
- A 6 1 P 13/08(2006.01)
- A 6 1 P 25/00(2006.01)
- A 6 1 P 13/10(2006.01)
- A 6 1 P 1/18(2006.01)
- A 6 1 P 1/00(2006.01)
- A 6 1 K 47/68(2017.01)
- A 6 1 K 47/64(2017.01)
- A 6 1 K 47/61(2017.01)
- A 6 1 K 51/08(2006.01)
- A 6 1 K 51/04(2006.01)
- A 6 1 K 51/12(2006.01)
- C 0 7 K 16/18(2006.01)
- C 0 7 K 16/40(2006.01)
- C 0 7 K 16/20(2006.01)

20

30

【F I】

- A 6 1 K 51/10 1 0 0
- A 6 1 K 31/555
- A 6 1 K 39/395 C
- A 6 1 K 39/395 L
- A 6 1 K 33/24
- A 6 1 K 33/245
- A 6 1 K 9/08
- A 6 1 K 9/10
- A 6 1 P 43/00 1 0 5
- A 6 1 P 35/00
- A 6 1 P 35/04
- A 6 1 P 11/00
- A 6 1 P 15/00

40

50

A 6 1 P 13/08
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 13/10
 A 6 1 P 1/18
 A 6 1 P 1/00
 A 6 1 K 47/68
 A 6 1 K 47/64
 A 6 1 K 47/61
 A 6 1 K 51/08 1 0 0
 A 6 1 K 51/04 3 1 0
 A 6 1 K 51/12 1 0 0
 C 0 7 K 16/18
 C 0 7 K 16/40
 C 0 7 K 16/20

10

Z N A

【手続補正書】

【提出日】令和7年6月5日(2025.6.5)

【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

20

【補正方法】変更

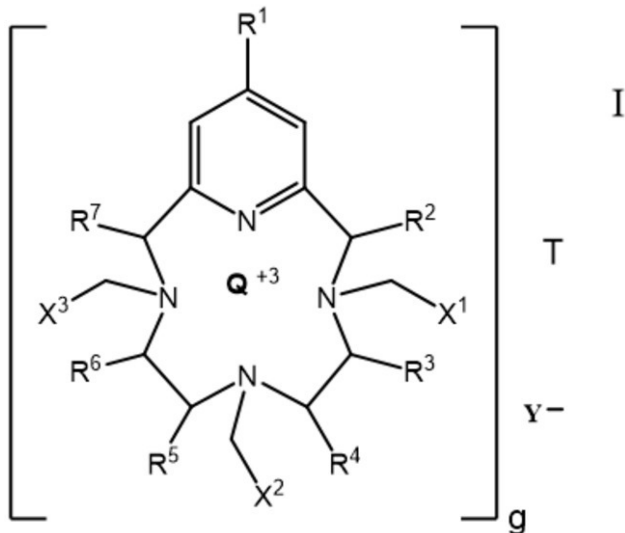
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

PCTAキレート化 Q^{+3} 放射性同位体イオンにチオ尿素結合した標的化種Tを含む標的放射性医薬品であって、前記標的放射性医薬品が、下式Iで示される一般構造式を有する標的放射性医薬品。

【化1】



30

40

(式中、

Q^{+3} は、 $^{225}\text{Ac}^{+3}$ 、 $^{213}\text{Bi}^{+3}$ 、又はその混合物の三価放射性同位体イオンであり、 R^1 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、及び R^7 はHであり、 R^3 は、前記標的化種Tとチオ尿素結合を形成する反応した官能基Zを含み、

「g」は、標的化種Tの各分子当たりのキレート化PCTAキレート化三価放射性イオン Q^{+3} の平均数を示す、平均値が4～8である数であり、

X^1 、 X^2 、及び X^3 は、前記 Q^{+3} 放射性同位体イオンに配位し得る、及び/又はイオ

50

ン電荷を中和するのに役立つ同じ又は異なる置換基であり、

前記標的化種 T が、チオ尿素結合した抗体又は抗体のパラトープ含有部分、チオ尿素結合したホルモン、チオ尿素結合した非抗体タンパク質、チオ尿素結合したサイトカイン、チオ尿素結合したアプタマー、チオ尿素結合した核酸又はオリゴヌクレオチド、直鎖又は環状オリゴペプチド、及び直鎖又は分岐オリゴ糖の 1 以上からなる群から選択され、そして

任意の陰イオン Y⁻は、イオン電荷のバランスをとるために必要な量で、任意に存在する。))

【請求項 2】

前記 X¹、X²、及び X³のそれぞれが、- (CH₂)_nCO₂M 又は -PO₃M₂ 置換基であり、n は、0 又は 1 であり、M は、H⁺ 又はアルカリ金属陽イオンである、請求項 1 に記載の標的放射性医薬品。 10

【請求項 3】

前記 X¹、X²、及び X³のそれぞれが、- (CH₂)_nCO₂M 置換基であり、n は、0 又は 1 であり、M は、H⁺ 又はアルカリ金属陽イオンである、請求項 2 に記載の標的放射性医薬品。

【請求項 4】

n が、0 である、請求項 3 に記載の標的放射性医薬品。

【請求項 5】

前記標的化種 T が、チオ尿素結合した抗体又は抗体のパラトープ含有部分である、請求項 1 に記載の標的放射性医薬品。 20

【請求項 6】

前記抗体又は抗体のパラトープ含有部分が、モノクローナル抗体 (mAb) 又はそのパラトープ含有部分である、請求項 5 に記載の標的放射性医薬品。

【請求項 7】

前記モノクローナル抗体又はそのパラトープ含有部分が、ATCC 受託番号 PTA - 8191 を有するハイブリドーマにより生産された ATN - 658 と呼称される mAb 又は ATN - 658 のパラトープ含有部分である、請求項 6 に記載の標的放射性医薬品。

【請求項 8】

前記 mAb が、ヒト化されている、請求項 6 に記載の標的放射性医薬品。 30

【請求項 9】

薬学上許容可能な希釈剤中に溶解又は分散したセラノスティック有効量の請求項 1 に記載の標的放射性医薬品を含む、医薬組成物。

【請求項 10】

前記薬学上許容可能な希釈剤が、周囲温度で水性液であり、非経口投与用に適合されている、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記組成物が、意図される哺乳動物種宿主レシピエントの血液と等張である、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

前記意図される哺乳動物種宿主レシピエントが、ヒトである、請求項 11 に記載の医薬組成物。 40

【請求項 13】

前記セラノスティック有効量が、前記標的放射性医薬品の細胞を殺す有効量である、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記標的放射性医薬品の前記細胞を殺す有効量が、哺乳動物宿主に、80 ~ 120 kg Bq / kg 体重を与えるのに十分な量である、請求項 13 に記載の医薬組成物。