

【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17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2002-516612(P2002-516612A)

【公表日】平成14年6月4日(2002.6.4)

【出願番号】特願平11-502818

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 51/00

A 6 1 K 39/395

A 6 1 P 37/00

【F I】

A 6 1 K 49/02 B

A 6 1 K 39/395 M

A 6 1 P 37/00

A 6 1 K 49/02 C

A 6 1 K 43/00

【手続補正書】

【提出日】平成17年5月27日(2005.5.27)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】補正の内容のとおり

【補正方法】変更

【補正の内容】

手 続 補 正 書

平成17年5月27日

特許庁長官 小 川 洋 殿

1. 事件の表示

平成11年特許願第502818号

2. 補正をする者

名称 コールター ファーマシューティカル, インコーポレイティド

3. 代 理 人

住所 〒105-8423 東京都港区虎ノ門三丁目5番1号 虎ノ門37森ビル
青和特許法律事務所 電話 03-5470-1900

氏名 弁理士(7751)石 田 敬



4. 補正により増加する請求項の数 13

5. 補正対象書類名

請求の範囲

6. 補正対象項目名

請求の範囲

7. 補正の内容

請求の範囲を別紙の通り変更する。

8. 添付書類の目録

請求の範囲

1通



請求の範囲

1. 放射性標識ペプチド、及びポビドンを含む安定なペプチド-放射性同位体組成物であって、ここで、
当該ポビドンが、放射能による当該ペプチドの分解を軽減するために十分な量で存在する、前記組成物。
2. アスコルビン酸、ベンジル・アルコール、システアミン、シスタミン、プロピレン・グリコール、デキストラン、及びゲンチシン酸から成る群から選ばれる二次安定化剤を更に含む、請求項1 に記載の組成物。
3. 前記二次安定化剤がアスコルビン酸である、請求項2 に記載の組成物。
4. 前記アスコルビン酸が前記組成物中10mg/ml 以下で存在する、請求項3 に記載の組成物。
5. 前記アスコルビン酸が前記組成物中 0.9~1.3mg/mlの範囲で存在する、請求項4 に記載の組成物。
6. 前記放射性標識ペプチドは、600mCi超の総放射能場、且つ5mCi/ml 超の活性濃度を供給する、請求項2 に記載の組成物。
7. 前記ポビドンが前記組成物中 0.5~10% (w/v) の範囲内で存在する、請求項1 に記載の組成物。
8. 前記ポビドンが前記組成物中5 ~6% (w/v)の範囲内で存在する、請求項7 に記載の組成物。
9. 前記放射性標識ペプチドは、10mCi/ml以下の活性濃度を供給する、請求項1 に記載の組成物。
10. 前記ポビドンのK 値が17である、請求項1 に記載の組成物。
11. 前記ポビドンの粘度平均分量が 6~38kDの範囲内にあり、且つ、その重量平均分子量が10~50kDの範囲内にある、請求項1 に記載の組成物。
12. 前記放射性標識ペプチドが抗体である、請求項1 に記載の組成物。
13. 前記抗体が、CD20抗原に結合する、請求項12に記載の組成物。
14. 前記放射性標識ペプチドが、 β 粒子、光量子、 α 粒子、オージェ電子、及び内部変換電子から成る群から選ばれるものを放射する放射性同位体によって放射性標識されている、請求項1 に記載の組成物。

15. 前記放射性標識ペプチドが、 ^{111}In 、 ^{67}Ga 、 ^{90}Y 、 ^{131}I 、 ^{125}I 、 ^{123}I 、 ^{32}P 、 ^{47}Sc 、 ^{67}Cu 、 ^{90}Y 、 ^{109}Pd 、 ^{111}Ag 、 ^{153}Sm 、 ^{166}Ho 、 ^{177}Lu 、 ^{186}Re 、 ^{188}Re 、 ^{199}Au 、 ^{211}At 、 ^{212}Bi 、 ^{223}Ra 、 ^{25}Ac 、 ^{213}Bi 、及び $^{99\text{m}}\text{Tc}$ から成る群から選ばれる放射性同位体によって放射性標識されている、請求項1に記載の組成物。

16. 前記放射性同位体が ^{131}I である、請求項15に記載の組成物。

17. 前記放射性同位体が、 ^{131}I によって放射性標識された抗CD20抗体であり、そして組成物中、当該抗体が1.5~2.5mg/mlの濃度で存在し、ポビドンが5~6% (w/v)の濃度で存在し、且つ、アスコルビン酸が0.9~1.3mg/mlの濃度で存在する、請求項3に記載の組成物。

18. 前記 ^{131}I の放射能レベルが8~12mCiである、請求項17に記載の組成物。

19. 前記 ^{131}I の放射能レベルが112~166mCiである、請求項17に記載の組成物。

20. 前記組成物中、8.5~9.5mg/mlの濃度の塩化ナトリウム、1.11~1.35mg/mlの濃度且つpH 7.0~7.2のリン酸カリウム、及び1~2% (w/v)の濃度のマルトースを更に含む、請求項17に記載の組成物。

21. 放射性標識ペプチドを含む組成物の放射能による分解を軽減する方法であって、分解軽減量のポビドンを前記組成物と接触させるステップを含む前記方法。

22. アスコルビン酸、ベンジル・アルコール、システアミン、シスタミン、プロピレン・グリコール、デキストラン、及びゲンチシン酸から成る群から選ばれる二次安定化剤を前記組成物と接触させることを更に含む、請求項21に記載の方法。

23. 前記二次安定化剤がアスコルビン酸であり、そしてこれが前記組成物中10mg/ml以下の最終濃度を達成するために十分な量で提供される、請求項22に記載の方法。

24. 前記組成物は、600mCi超の総放射能、且つ、5mCi/ml超の活性濃度を供給する、請求項22に記載の方法。

25. 前記ポビドンが前記組成物中0.5~10% (w/v)の範囲内の最終濃度を達成するために十分な量で提供される、請求項21に記載の方法。

26. 前記ポビドンが前記組成物中 5~6% (w/v)の範囲内の最終濃度を達成するために十分な量で提供される、請求項25に記載の方法。

27. 前記組成物は、10mCi/ml以下の活性濃度を供給する、請求項21に記載の方法。

28. 前記ポビドンのK 値が17である、請求項21に記載の方法。

29. 前記ポビドンの粘度平均分量が 6~38kDの範囲内にあり、且つ、その重量平均分子量が10~50kDの範囲内にある、請求項21に記載の方法。

30. 前記放射性標識ペプチドが抗体である、請求項21に記載の方法。

31. 前記抗体が、CD20抗原に結合する、請求項30に記載の方法。

32. 前記放射性標識ペプチドが、 β 粒子、光量子、 α 粒子、オージェ電子、及び内部変換電子から成る群から選ばれるものを放射する放射性同位体によって放射性標識されている、請求項21に記載の方法。

33. 前記放射性標識ペプチドが、 ^{111}In 、 ^{67}Ga 、 ^{90}Y 、 ^{131}I 、 ^{125}I 、 ^{123}I 、 ^{32}P 、 ^{47}Sc 、 ^{67}Cu 、 ^{109}Pd 、 ^{111}Ag 、 ^{153}Sm 、 ^{166}Ho 、 ^{177}Lu 、 ^{186}Re 、 ^{188}Re 、 ^{199}Au 、 ^{211}At 、 ^{212}Bi 、 ^{223}Ra 、 ^{225}Ac 、 ^{213}Bi 、及び $^{99\text{m}}\text{Tc}$ から成る群から選ばれる放射性同位体によって放射性標識されている、請求項21に記載の方法。

34. 前記ヨウ素の放射性同位体が ^{131}I である、請求項33に記載の方法。

35. 放射性標識ペプチドと接触させられ得る安定化剤溶液を含む放射性標識ペプチドのための放射線保護剤であって、当該安定化剤溶液がポビドンと、アスコルビン酸、ベンジル・アルコール、システアミン、シスタミン、プロピレン・グリコール、デキストラン及びゲンチシン酸から成る群から選ばれる二次安定化剤とを含む、前記保護剤。

36. 前記二次安定化剤がアスコルビン酸であり、そしてこれが、放射性標識ペプチド及び前記安定化剤溶液を含有する組成物中10mg/ml 以下で存在する、請求項35に記載の放射線保護剤。

37. 前記安定化剤溶液が、600mCi超の総放射能場、且つ、5mCi/ml 超の活性濃度を提供する放射性標識ペプチドを含む組成物を、安定化させる、請求項35に記載の放射線保護剤。

38. 前記ポビドンが、放射性標識ペプチド及び前記ポビドンを含有する組成物

中 0.5～10% (w/v) の範囲内で存在する、請求項35に記載の放射線保護剤。

39. 前記安定化剤溶液が、10mCi/ml以下の活性濃度を供給する放射性標識ペプチドを含む組成物を、安定化させる、請求項35に記載の放射線保護剤。

40. 前記ポビドンが 6～38kDの範囲内の分子量を、且つ、10～50kDの範囲内の重量平均分子量をもつ、請求項35に記載の放射線保護剤。

41. 前記安定化剤溶液が、放射性標識抗体を含む組成物を安定化させる、請求項35に記載の放射線保護剤。

42. 前記安定化剤溶液が、CD20抗原に結合する放射性標識抗体を含む組成物を安定化させる、請求項41に記載の放射線保護剤。

43. 前記安定化剤溶液が、 β 粒子、光子、 α 粒子、オージェ電子、及び内部変換電子から成る群から選ばれるものを放射する放射性同位体によって放射性標識されている放射性標識ペプチドを含む組成物を安定化させる、請求項35に記載の放射線保護剤。

44. 前記安定化剤溶液が、 ^{111}In 、 ^{67}Ga 、 ^{90}Y 、 ^{131}I 、 ^{125}I 、 ^{123}I 、 ^{32}P 、 ^{47}Sc 、 ^{67}Cu 、 ^{109}Pd 、 ^{111}Ag 、 ^{153}Sm 、 ^{166}Ho 、 ^{177}Lu 、 ^{186}Re 、 ^{188}Re 、 ^{199}Au 、 ^{211}At 、 ^{212}Bi 、 ^{223}Ra 、 ^{225}Ac 、 ^{213}Bi 、及び $^{90\text{m}}\text{Tc}$ から成る群から選ばれる放射性同位体によって放射性標識されている放射性標識ペプチドを含む組成物を安定化させる、請求項35に記載の放射線保護剤。

45. 安定化剤溶液が、放射性同位体 ^{131}I により放射性標識されている放射性標識ペプチドを含む組成物を安定化させる、請求項44に記載の放射線保護剤。

46. ポビドンを含有する安定化剤、及び

当該安定化剤を放射性標識ペプチドと接触させることによって、放射能による当該放射性標識ペプチドの分解を軽減させるための、当該安定化剤の使用説明書、
を含む物品。

47. 前記安定化剤がアスコルビン酸を更に含む、請求項46に記載の物品。

48. 前記放射性標識ペプチドが、約70Ci以下の総放射能場を提供する、請求項1に記載の組成物。

49. 前記放射性標識ペプチドが、共有結合標識付けにより放射性標識されてい

る、請求項1に記載の組成物。

50. 前記放射性標識ペプチドが、直接置換法により放射性標識されている、請求項1に記載の組成物。

51. 前記放射性標識ペプチドが、キレート形成法により放射性標識されている、請求項1に記載の組成物。

52. 前記放射性標識ペプチドが、前記ペプチドと放射性同位体との物理的混合物として存在する、請求項1に記載の組成物。

53. 前記組成物が、患者への投与のために好適である、請求項1に記載の組成物。

54. 安定化ペプチド-放射性同位体組成物の製造方法であって、以下のステップ:

ペプチドを放射性同位体で標識付けし、そして

前記標識化ステップの直後に、当該標識されたペプチドをポビドンと接触させる、

を含む前記方法。

55. 前記標識されたペプチドを、アスコルビン酸、ベンジル・アルコール、システアミン、シスタミン、プロピレン・グリコール、デキストラン、及びゲンチシン酸から成る群から選ばれる二次安定化剤と接触させるステップをさらに含む、請求項54に記載の方法。

56. 前記二次安定化剤がアスコルビン酸である、請求項55に記載の方法。

57. 前記アスコルビン酸が、前記組成物中0.9~1.3mg/mlの範囲内の最終濃度を達成するために十分な量で提供される、請求項56に記載の方法。

58. 前記組成物が、600mCi超の総放射能場、及び5mCi/ml超の活性濃度を提供する、請求項55に記載の方法。

59. 前記ポビドンが、前記組成物中5~6% (w/v) の範囲内の最終濃度を達成するために十分な量で提供される、請求項54に記載の方法。

60. 前記組成物が、10mCi/ml以下の活性濃度を提供する、請求項54に記載の方法。