

(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
2020年7月16日(16.07.2020)



(10) 国際公開番号

WO 2020/145227 A1

- (51) 国際特許分類:
A61K 39/395 (2006.01) *A61K 47/68* (2017.01)
A61P 35/00 (2006.01) *A61K 49/16* (2006.01)
C07K 16/30 (2006.01) *C12N 15/13* (2006.01)
A61K 47/52 (2017.01) *A61K 51/10* (2006.01)
A61K 47/54 (2017.01) *G01N 33/53* (2006.01)
A61K 47/65 (2017.01) *G01N 33/574* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2020/000036

(22) 国際出願日: 2020年1月6日(06.01.2020)

(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 2019-000530 2019年1月7日(07.01.2019) JP
特願 2019-206560 2019年11月14日(14.11.2019) JP

(71) 出願人: アステラス製薬株式会社 (ASTELLAS PHARMA INC.) [JP/JP]; 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 赤岩 路則 (AKAIWA, Michinori); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 石田 淳也 (ISHIDA, Junya); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 戸谷 博希 (TOYA, Hiroki); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 浅野 亨 (ASANO, Toru); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 吉川 友章 (YOSHIKAWA, Tomoaki); 〒1038411 東京都中

央区日本橋本町二丁目5番1号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 佐野 頼方 (SANO, Yorikata); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP). 菅野 幸人 (SUGANO, Yukihito); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 アステラス製薬株式会社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 濱井 康丞, 外 (HAMAI, Kousuke et al.); 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目5番1号 アステラス製薬株式会社 イノベーション知財室内 Tokyo (JP).

(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS,

(54) Title: COMPLEX COMPRISING LIGAND, SPACER, PEPTIDE LINKER, AND BIOMOLECULE

(54) 発明の名称: 配位子、スペーサー、ペプチドリンカーおよび生物分子からなる複合体

(57) Abstract: [Problem] To provide a complex comprising a ligand, spacer, and peptide linker useful in internal diagnostics and internal radiation therapy that uses an anti-human MUC1 antibody Fab fragment the binding activity of which is not weakened even by labeling by a metal, fluorescent dye, or the like. [Solution] A complex comprising a 3-arm DOTA, a specific spacer, a specific peptide linker, and a biomolecule containing an anti-human MUC1 antibody Fab fragment can be used as a diagnostic composition and/or pharmaceutical composition the binding activity of which is not weakened even by labeling by a metal, fluorescent dye, or the like.

(57) 要約: 【課題】 金属や蛍光色素等による標識によっても結合活性が減弱しない抗ヒトMUC1抗体Fabフラグメントを用いた、体内診断薬および放射線内用療法に有用な配位子、スペーサー、及びペプチドリンカーからなる複合体の提供。【解決手段】 3armDOTA、特定のスペーサー、特定のペプチドリンカーおよび抗ヒトMUC1抗体Fabフラグメント含む生物分子からなる複合体は、金属や蛍光色素等による標識によっても結合活性が減弱せず、診断用組成物及び/又は医薬組成物として使用できる。

[続葉有]

WO 2020/145227 A1

SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM,
GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類：

- 国際調査報告（条約第21条(3)）
- 明細書の別個の部分として表した配列リスト
（規則5.2(a)）