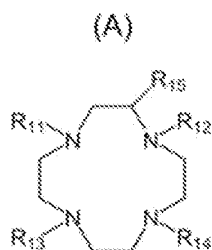


### 請求の範囲

- [請求項1] 放射性核種がキレートしたキレート剤と、抗体との複合体であって、
- 、
- 前記放射性核種が $\alpha$ 線またはポジトロンを放出する金属核種であり、
- 、
- 前記抗体が、ムチンサブタイプ5 A Cに特異的に結合するヒト化抗体である、複合体。
- [請求項2] 前記抗体が、
- (1) 配列番号1で示されるアミノ酸配列(H O 1)、
- (2) 配列番号2で示されるアミノ酸配列(H O 2)、
- (3) 配列番号3で示されるアミノ酸配列(H O 3)、又は
- (4) 配列番号4で示されるアミノ酸配列(H O 4)
- からなる重鎖可変領域と、
- (5) 配列番号5で示されるアミノ酸配列(L O 1)、
- (6) 配列番号6で示されるアミノ酸配列(L O 2)、
- (7) 配列番号7で示されるアミノ酸配列(L O 3)、又は
- (8) 配列番号8で示されるアミノ酸配列(L O 4)
- からなる軽鎖可変領域と、
- を有するヒト化抗体である、請求項1に記載の複合体。
- [請求項3] 前記抗体が、
- (1) 配列番号1で示されるアミノ酸配列(H O 1)からなる重鎖可変領域と、
- (7) 配列番号7で示されるアミノ酸配列(L O 3)からなる軽鎖可変領域と、
- を有するヒト化抗体である、請求項2に記載の複合体。
- [請求項4]  $\alpha$ 線を放出する前記金属核種が、アクチニウム-225であり、ポジトロンを放出する金属核種がZr-89である、請求項1～3のいずれか1項に記載の複合体。

- [請求項5] 前記抗体 1 分子に対し、前記キレート剤を 1 分子以上 8 分子以下備える、請求項 1 ～ 4 のいずれか 1 項に記載の複合体。
- [請求項6] 前記キレート剤が、リンカーを介して、前記抗体の F c 領域を部位特異的に修飾している、請求項 1 ～ 5 のいずれか 1 項に記載の複合体。
- [請求項7] 前記リンカーが、下記式 (i) で表される、13 以上 17 以下のアミノ酸残基からなるペプチドを含み、架橋剤で修飾された前記ペプチドと前記抗体の架橋反応によって形成されている、請求項 6 に記載の複合体。
- $$(Xa)-Xaa1-(Xb)-Xaa2-(Xc)-Xaa3-(Xd) \cdots (i)$$
- (式中、X a、X b、X c 及び X d は、それぞれ、連続する a 個の X、連続する b 個の X、連続する c 個の X、及び連続する d 個の X を表し、
- X は、側鎖にチオール基及びハロアセチル基のいずれも有しないアミノ酸残基であり、
- a、b、c 及び d はそれぞれ独立に 1 以上 5 以下の整数で、かつ  $a + b + c + d \leq 14$  を満たし、
- X a a 1 及び X a a 3 は、それぞれ独立に、
- 側鎖にチオール基を有するアミノ酸に由来するアミノ酸残基を表し、又は、
- 一方が、側鎖にチオール基を有するアミノ酸に由来するアミノ酸残基を表し、他方が、側鎖にハロアセチル基を有するアミノ酸に由来するアミノ酸残基を表し、X a a 1 と X a a 3 とが連結しており、
- X a a 2 は、リシン残基、アルギニン残基、システイン残基、アスパラギン酸残基、グルタミン酸残基、2-アミノスベリン酸、又はジアミノプロピオン酸であり、前記架橋剤で修飾されている。)
- [請求項8] 前記キレート剤が、下記式 (A) で表される化合物又はその塩に由来する構造を有する、請求項 1 ～ 7 のいずれか 1 項に記載の複合体。

[化1]



(式 (A) 中、 $R_{11}$ 、 $R_{13}$  及び  $R_{14}$  は、それぞれ独立して、 $-(CH_2)_pCOOH$ 、 $-(CH_2)_pC_5H_5N$ 、 $-(CH_2)_pPO_3H_2$ 、 $-(CH_2)_pCONH_2$  若しくは、 $-(CHCOOH)(CH_2)_pCOOH$  からなる基であり、 $R_{12}$  又は  $R_{15}$  の一方が、水素原子、カルボキシル基、又は、炭素数 2 若しくは 3 のカルボキシアルキル基であり、他方が、前記抗体と複合体化するための置換基であり、 $p$  が 0 以上 3 以下の整数であり、 $R_{12}$  が前記抗体と複合体化するための置換基であるとき  $R_{15}$  は水素原子であり、 $R_{12}$  が前記抗体と複合体化するための置換基でないとき  $R_{15}$  は前記抗体と複合体化するための置換基である。)

- [請求項9] 請求項 1～8 のいずれか 1 項に記載の複合体を有効成分として含有する、放射性医薬。
- [請求項10] 前記放射性核種が  $\alpha$  線を放出する金属核種であり、がんの R I 内用療法に用いられる、請求項 9 に記載の放射性医薬。
- [請求項11] 前記 R I 内用療法において、対象に対し 1 回あたり  $250\text{ kBq/kg}$  以下の投与量で投与されるための、請求項 10 に記載の放射性医薬。
- [請求項12] 前記投与量が、1 回あたり  $80\text{ kBq/kg}$  以下である、請求項 11 に記載の放射性医薬。
- [請求項13] 前記放射性核種がポジトロンを放出する金属核種であり、がんの診断に用いられる、請求項 9 に記載の放射性医薬。
- [請求項14] 放射性核種がキレートしたキレート剤と、抗体との複合体を含有す

る放射性医薬であって、  
前記抗体が、ムチンサブタイプ5 A Cに特異的に結合するヒト化抗体  
である、  
請求項10～12いずれか一項に記載の放射性医薬を用いたR I内用  
療法におけるがんの診断用放射性医薬。