

【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 4 年 6 月 6 日(2022.6.6)

【国際公開番号】W O 2 0 1 9 / 2 3 0 6 4 5

【出願番号】特願 2020-522178(P2020-522178)

【国際特許分類】

A 6 1 K 4 7 / 6 8 (2017.01)

A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2006.01)

A 6 1 K 3 9 / 3 9 5 (2006.01)

C 0 7 K 1 6 / 2 8 (2006.01)

10

【F I】

A 6 1 K 4 7 / 6 8 Z N A

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 K 3 9 / 3 9 5 L

A 6 1 K 3 9 / 3 9 5 Y

C 0 7 K 1 6 / 2 8

【手続補正書】

【提出日】令和 4 年 5 月 27 日(2022.5.27)

20

【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

【補正方法】変更

【補正の内容】

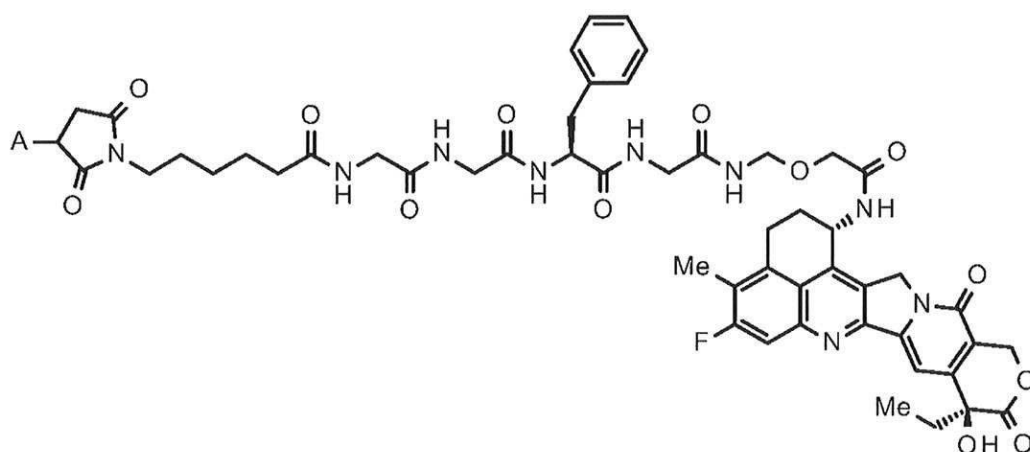
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式

【化 1】

30



40

(式中、A は抗 H E R 2 抗体との結合位置を示す)

で示される薬物リンカーと、抗 H E R 2 抗体とがチオエーテル結合によって結合した抗 H E R 2 抗体-薬物コンジュゲートを有効成分として含有する、H E R 2 変異がんの治療剤。

【請求項 2】

H E R 2 変異がんにおける H E R 2 変異が、Y 7 7 2 _ A 7 7 5 d u p、G 7 7 8 _ P 7 8 0 d u p、G 7 7 6 d e l i n s V C、L 7 5 5 S、V 7 7 7 L、V 6 5 9 E、G 6 6

50

0D、S310F、A20T、A21S、R143Q、K200N、A242V、D277Y、A293P、N302K、V308M、S310Y、N319Y、S335C、R340P、S418T、W452C、V541M、I613V、P627H、A644V、R647G、I654V、I655V、I661V、R678Q、Q680H、V697L、G704R、Q709L、Q711H、G727A、T733I、E744G、N745D、L755P、L755A、L755F、S760F、D769H、D769N、D769Y、E770__A771insAYVM、A771__Y772insYVMA、M774__A775insAYVM、A775__G776insYVMA、A775G、G776delinsLC、G776C、G776delinsAVGC、G776delinsVV、G776__V777insL、G776L、G776__V777insVC、G776__V777insVGC、V777__G778insCG、V777__G778insG、G778__S779insG、S779P、S779__P780insVGS、P780__Y781insGSP、R784C、R784H、L785R、L786V、T791I、G804S、L807F、S819F、I829T、V842I、L846F、T862I、R868W、L869R、T875I、W906*、T917S、Q943*、S1007*、及びS1151Lからなる群より選択される少なくとも一つである、請求項1に記載の治療剤。

10

【請求項3】

HER2変異がんにおけるHER2変異が、Y772__A775dup、G778__P780dup、G776delinsVC、L755S、V777L、及びS310Fからなる群より選択される少なくとも一つである、請求項2に記載の治療剤。

20

【請求項4】

HER2変異がんにおけるHER2変異が、Exon 20 insertion変異である、請求項1に記載の治療剤。

【請求項5】

Exon 20 insertion変異が、Y772__A775dup、G778__P780dup、G776delinsVC、E770__A771insAYVM、A771__Y772insYVMA、M774__A775insAYVM、A775__G776insYVMA、G776delinsLC、G776delinsAVGC、G776delinsVV、G776__V777insL、G776__V777insVC、G776__V777insVGC、V777__G778insCG、V777__G778insG、G778__S779insG、S779__P780insVGS、及びP780__Y781insGSPからなる群より選択される少なくとも一つである、請求項4に記載の治療剤。

30

【請求項6】

Exon 20 insertion変異が、Y772__A775dup、G778__P780dup、及びG776delinsVCからなる群より選択される少なくとも一つである、請求項5に記載の治療剤。

【請求項7】

HER2変異がんにおけるHER2変異が、HER2蛋白の膜貫通ドメインにおけるSingle base pair substitution変異である、請求項1に記載の治療剤。

40

【請求項8】

HER2蛋白の膜貫通ドメインにおけるSingle base pair substitution変異が、V659E、G660D、I654V、I655V、及びI661Vからなる群より選択される少なくとも一つである、請求項7に記載の治療剤。

【請求項9】

HER2蛋白の膜貫通ドメインにおけるSingle base pair substitution変異が、G660Dである、請求項8に記載の治療剤。

【請求項10】

50

HER2変異がんにおけるHER2変異が、HER2蛋白の細胞外ドメインにおけるSingle base pair substitution変異である、請求項1に記載の治療剤。

【請求項11】

HER2蛋白の細胞外ドメインにおけるSingle base pair substitution変異が、S310F、A20T、A21S、R143Q、K200N、A242V、D277Y、A293P、N302K、V308M、S310Y、N319Y、S335C、R340P、S418T、W452C、V541M、I613V、P627H、A644V、及びR647Gからなる群より選択される少なくとも一つである、請求項10に記載の治療剤。

10

【請求項12】

HER2蛋白の細胞外ドメインにおけるSingle base pair substitution変異が、S310Fである、請求項11に記載の治療剤。

【請求項13】

HER2変異がんにおけるがんが、非小細胞肺がん、乳がん、胃がん、大腸がん、食道がん、唾液腺がん、胃食道接合部腺がん、胆道がん、ページェット病、膵臓がん、卵巣がん、及び子宮がん肉腫からなる群より選択される少なくとも一つである、請求項1～12のいずれか1項に記載の治療剤。

【請求項14】

HER2変異がんにおけるがんが、非小細胞肺がんである、請求項1～12のいずれか1項に記載の治療剤。

20

【請求項15】

非小細胞肺がんが、切除不能及び／又は転移性の非小細胞肺がんである、請求項14に記載の治療剤。

【請求項16】

抗HER2抗体が、配列番号1においてアミノ酸番号1乃至449に記載のアミノ酸配列からなる重鎖及び配列番号2においてアミノ酸番号1乃至214に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖を含んでなる抗体である、請求項1～15のいずれか1項に記載の治療剤。

【請求項17】

抗HER2抗体が、配列番号1に記載のアミノ酸配列からなる重鎖及び配列番号2に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖を含んでなる抗体である、請求項1～15のいずれか1項に記載の治療剤。

30

【請求項18】

抗HER2抗体－薬物コンジュゲートにおける1抗体あたりの薬物リンカーの平均結合数が7から8個の範囲である、請求項1～17のいずれか1項に記載の治療剤。

【請求項19】

抗HER2抗体－薬物コンジュゲートにおける1抗体あたりの薬物リンカーの平均結合数が7.5から8個の範囲である、請求項1～17のいずれか1項に記載の治療剤。

【請求項20】

抗HER2抗体－薬物コンジュゲートの1回あたりの投与量が5.4mg/kgから8mg/kgの範囲である、請求項1～19のいずれか1項に記載の治療剤。

40

【請求項21】

抗HER2抗体－薬物コンジュゲートの1回あたりの投与量が5.4mg/kgである、請求項1～19のいずれか1項に記載の治療剤。

【請求項22】

抗HER2抗体－薬物コンジュゲートの1回あたりの投与量が6.4mg/kgである、請求項1～19のいずれか1項に記載の治療剤。

【請求項23】

抗HER2抗体－薬物コンジュゲートが3週に1回の間隔で投与される、請求項1～22のいずれか1項に記載の治療剤。

50