

【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2年3月26日(2020.3.26)

【公開番号】特開2020-19787(P2020-19787A)
 【公開日】令和2年2月6日(2020.2.6)
 【年通号数】公開・登録公報2020-005
 【出願番号】特願2019-181469(P2019-181469)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 47/68 (2017.01)
 A 6 1 K 39/395 (2006.01)
 A 6 1 K 31/357 (2006.01)
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)
 C 0 7 K 16/30 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 47/68 Z N A
 A 6 1 K 39/395 L
 A 6 1 K 39/395 N
 A 6 1 K 39/395 T
 A 6 1 K 31/357
 A 6 1 P 35/00
 C 0 7 K 16/30

【手続補正書】
 【提出日】令和2年2月13日(2020.2.13)
 【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(I)の抗体-薬物コンジュゲート:



[式中、

(i) A bは、K a b a tナンバリングシステムにより定義すると、配列番号71(H C D R 1)、配列番号72(H C D R 2)、及び配列番号73(H C D R 3)のアミノ酸配列を含む3つの重鎖相補性決定領域(H C D R); ならびに配列番号74(L C D R 1)、配列番号75(L C D R 2)、及び配列番号76(L C D R 3)のアミノ酸配列を含む3つの軽鎖相補性決定領域(L C D R); またはI M G Tナンバリングシステムにより定義すると、配列番号191(H C D R 1)、配列番号192(H C D R 2)、及び配列番号193(H C D R 3)のアミノ酸配列を含む3つの重鎖相補性決定領域(H C D R); ならびに配列番号194(L C D R 1)、配列番号195(L C D R 2)、及び配列番号196(L C D R 3)のアミノ酸配列を含む3つの軽鎖相補性決定領域(L C D R)を含む内在化型抗ヒト上皮成長因子受容体2(H E R 2)抗体またはその内在化型抗原結合性断片であり;

(i i) Dは、エリブリンであり;

(i i i) Lは、M a l - (P E G)₂ - V a l - C i t - p A B

(式中、M a lはマレイミドであり、M a l中の窒素原子がP E Gに結合している;

p A Bはp-アミノベンジルオキシカルボニルであり、p A B中のアミノ基がC i tに結

合している)

を含む切断可能なリンカーであり;

(i v) p は、1 ~ 8の整数である]。

【請求項 2】

前記抗体または抗原結合性断片が、配列番号 27 のアミノ酸配列を含む重鎖可変領域、及び配列番号 28 のアミノ酸配列を含む軽鎖可変領域を含む、請求項 1 に記載の抗体 - 薬物コンジュゲート。

【請求項 3】

前記抗体または抗原結合性断片が、ヒト I g G 1 重鎖定常ドメインを含む、請求項 1 または請求項 2 に記載の抗体 - 薬物コンジュゲート。

【請求項 4】

前記抗体または抗原結合性断片が、ヒト I g カッパ軽鎖定常ドメインを含む、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の抗体 - 薬物コンジュゲート。

【請求項 5】

p が 1 ~ 4 である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の抗体 - 薬物コンジュゲート。

【請求項 6】

請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の抗体 - 薬物コンジュゲートの多数のコピーを含む組成物であって、前記組成物中の前記抗体 - 薬物コンジュゲートの平均 p が約 3 . 2 ~ 約 4 . 4 である、前記組成物。

【請求項 7】

患者におけるヒト上皮成長因子受容体 2 (H E R 2) を発現するがんを治療するための、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の抗体 - 薬物コンジュゲートを含む組成物または請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 8】

前記がんが、乳癌、胃癌、卵巣癌、肺癌、結腸直腸癌、子宮内膜癌、肺類癌、骨肉腫、膀胱癌、または尿路上皮細胞癌である、請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 9】

前記がんが、三重陰性乳癌、漿液性卵巣癌、明細胞卵巣癌、非小細胞肺癌、または漿液性子宮内膜癌である、請求項 7 または請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 10】

患者におけるヒト上皮成長因子受容体 2 (H E R 2) 発現性腫瘍の増殖を減少させる、または阻害するための、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の抗体 - 薬物コンジュゲートを含む組成物または請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 11】

前記腫瘍が、乳癌、胃癌、卵巣癌、肺癌、結腸直腸癌、子宮内膜癌、肺類癌、骨肉腫、膀胱癌、または尿路上皮細胞癌である、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】

前記腫瘍が、三重陰性乳癌、漿液性卵巣癌、明細胞卵巣癌、非小細胞肺癌、または漿液性子宮内膜癌である、請求項 10 または請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 13】

請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の抗体 - 薬物コンジュゲートまたは請求項 6 に記載の組成物、及び薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 14】

コンジュゲーションを可能にする条件下で、抗体または抗原結合性断片を、エリブリンに接続している切断可能なリンカーと反応させることを含む、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の抗体 - 薬物コンジュゲートまたは請求項 6 に記載の組成物を生産する方法。