

【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9月16日(2022.9.16)

【国際公開番号】WO2020/059772

【出願番号】特願2020-548575(P2020-548575)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/68(2017.01)

A 6 1 K 45/00(2006.01)

A 6 1 P 35/00(2006.01)

A 6 1 K 31/437(2006.01)

A 6 1 K 47/65(2017.01)

A 6 1 K 39/395(2006.01)

A 6 1 P 15/00(2006.01)

A 6 1 P 11/00(2006.01)

A 6 1 P 1/00(2006.01)

A 6 1 P 25/00(2006.01)

A 6 1 P 17/00(2006.01)

C 0 7 K 16/30(2006.01)

C 1 2 N 15/13(2006.01)

10

20

【F I】

A 6 1 K 47/68

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 31/437

A 6 1 K 47/65

A 6 1 K 39/395 L

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 17/00

C 0 7 K 16/30 Z N A

C 1 2 N 15/13

30

【手続補正書】

【提出日】令和4年9月8日(2022.9.8)

【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

40

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

抗HER3抗体－薬物コンジュゲートを有効成分として含有する、HER3変異がんの治療剤。

【請求項2】

HER3変異がんにおけるHER3変異が、V104L、V104M、A232V、P262H、G284R、D297Y、G325R、T355I、Q809R、S846I、及びE928G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

50

療剤。

【請求項 3】

HER3 変異がんにおける HER3 変異が、Q809R である、請求項 1 に記載の治療剤。

【請求項 4】

HER3 変異がんが、HER2 を過剰発現している、請求項 1～3 のいずれか 1 項に記載の治療剤。

【請求項 5】

HER3 変異がんが、HER2 を過剰発現していない、請求項 1～3 のいずれか 1 項に記載の治療剤。

10

【請求項 6】

抗 HER3 抗体－薬物コンジュゲートのリソソーム移行性が、野生型 HER3 発現細胞と、変異型 HER3 発現細胞との間で実質的に異なる、請求項 1～5 のいずれか 1 項に記載の治療剤。

【請求項 7】

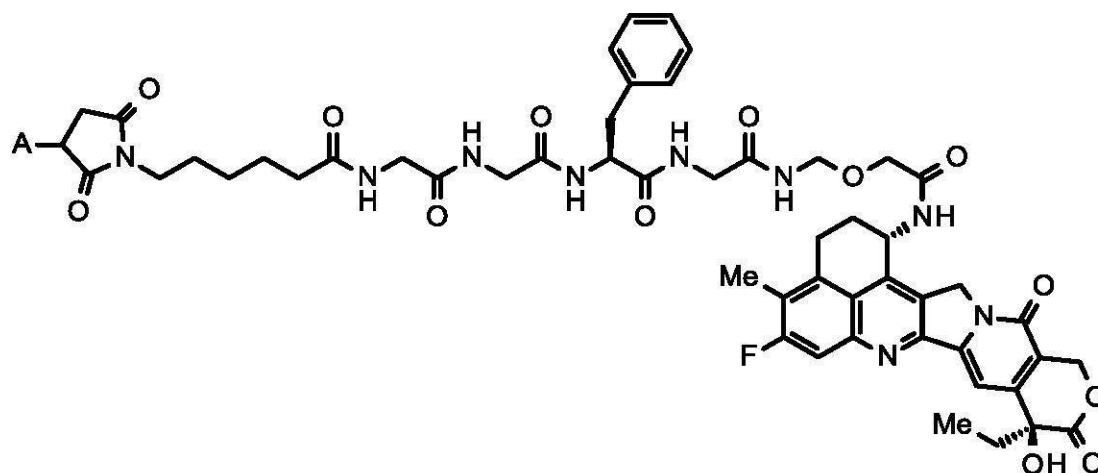
抗 HER3 抗体－薬物コンジュゲートのリソソーム移行性が、HER2 を過剰発現している HER3 発現細胞と、HER2 を過剰発現していない HER3 発現細胞との間で実質的に異なる、請求項 1～6 のいずれか 1 項に記載の治療剤。

【請求項 8】

抗 HER3 抗体－薬物コンジュゲートが、式

20

【化 1】



30

(式中、A は抗 HER3 抗体との結合位置を示す)

で示される薬物リンカーと、抗 HER3 抗体とがチオエーテル結合によって結合した抗 HER3 抗体－薬物コンジュゲートである、請求項 1～7 のいずれか 1 項に記載の治療剤。

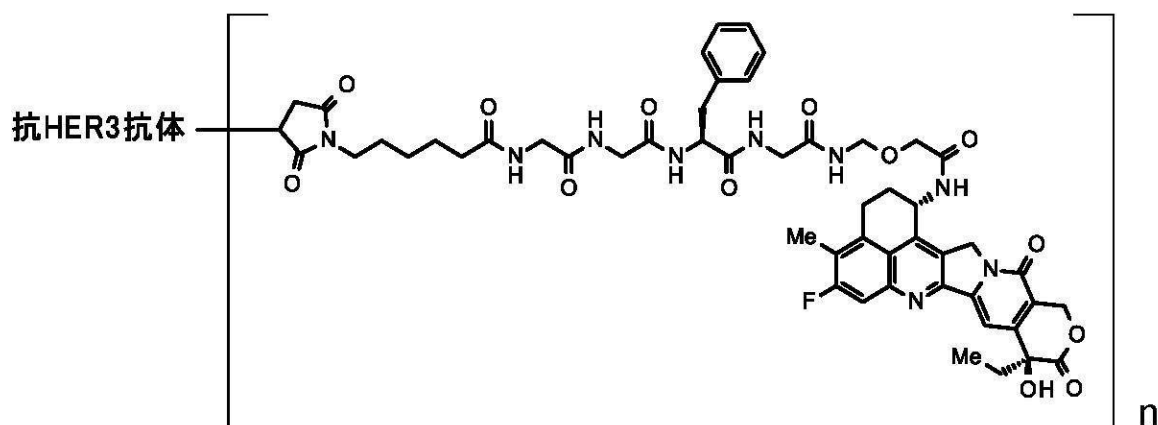
【請求項 9】

抗 HER3 抗体－薬物コンジュゲートが、式

40

50

【化 2】



10

(式中、薬物リンカーは抗HER3抗体とチオエーテル結合によって結合しており、 n は1抗体あたりの薬物リンカーの平均結合数を示す)

で示される抗HER3抗体-薬物コンジュゲートである、請求項1～7のいずれか1項に記載の治療剤。

【請求項10】

抗HER3抗体が、配列番号1で示されるアミノ酸配列からなるCDRH1、配列番号2で示されるアミノ酸配列からなるCDRH2、及び配列番号3で示されるアミノ酸配列からなるCDRH3を含む重鎖、並びに、配列番号4で示されるアミノ酸配列からなるCDRL1、配列番号5で示されるアミノ酸配列からなるCDRL2、及び配列番号6で示されるアミノ酸配列からなるCDRL3を含む軽鎖、を含む抗体である、請求項1～9のいずれか1項に記載の治療剤。

20

【請求項11】

抗HER3抗体が、配列番号7で示されるアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖、及び配列番号8で示されるアミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、を含む抗体である、請求項1～9のいずれか1項に記載の治療剤。

【請求項12】

抗HER3抗体が、配列番号9で示されるアミノ酸配列からなる重鎖、及び配列番号10で示されるアミノ酸配列からなる軽鎖、を含む抗体である、請求項1～9のいずれか1項に記載の治療剤。

30

【請求項13】

抗HER3抗体の、重鎖カルボキシル末端のリシン残基が欠失している、請求項12に記載の治療剤。

【請求項14】

抗HER3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1～13のいずれか1項に記載の治療剤。

【請求項15】

抗HER3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1～13のいずれか1項に記載の治療剤。

40

【請求項16】

がんが、乳がん、肺がん、大腸がん、胃がん、卵巣がん、頭頸部がん、多形神経膠芽腫、メラノーマ、腎がん、尿路上皮がん、前立腺がん、膵がん、膀胱がん、胃腸間質腫瘍、子宮頸がん、食道がん、扁平上皮がん、腹膜がん、多形グリア芽細胞腫、肝臓がん、肝細胞がん、子宮内膜がん、子宮がん、唾液腺がん、外陰部がん、甲状腺がん、肝癌腫、肛門癌腫、及び陰茎がん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1～15のいずれか1項に記載の治療剤。

【請求項17】

50

がんが、乳がん、非小細胞肺癌、大腸がん、胃がん、卵巣がん、頭頸部がん、多形神経膠芽腫、及びメラノーマ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 ～ 15 のいずれか 1 項に記載の治療剤。

10

20

30

40

50