

【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8月15日(2022.8.15)

【国際公開番号】WO2020/031936

【出願番号】特願2020-535747(P2020-535747)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/06(2006.01)

A 6 1 K 31/337(2006.01)

A 6 1 K 31/357(2006.01)

A 6 1 K 31/4745(2006.01)

A 6 1 K 47/68(2017.01)

A 6 1 P 35/00(2006.01)

A 6 1 P 43/00(2006.01)

A 6 1 K 39/395(2006.01)

C 0 7 K 16/30(2006.01)

C 0 7 K 5/10(2006.01)

10

【F I】

A 6 1 K 45/06

A 6 1 K 31/337

A 6 1 K 31/357

A 6 1 K 31/4745

A 6 1 K 47/68

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 39/395 E

A 6 1 K 39/395 L

C 0 7 K 16/30 Z N A

C 0 7 K 5/10

20

30

【手続補正書】

【提出日】令和4年8月4日(2022.8.4)

【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】

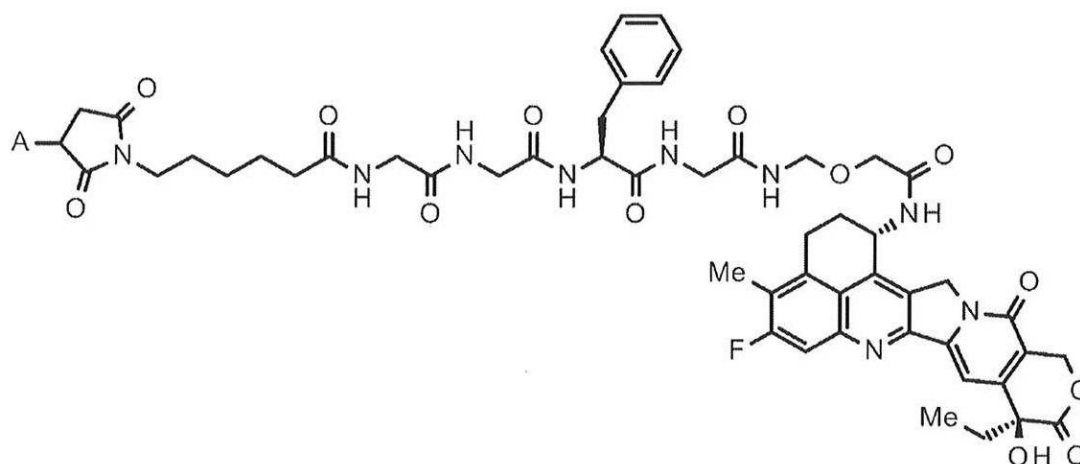
【特許請求の範囲】

【請求項1】

抗体-薬物コンジュゲートと、チューブリン阻害剤が、組み合わされて投与されることを特徴とする医薬組成物であって、
該抗体-薬物コンジュゲートは、式

40

【化 1】



10

(式中、Aは抗体との結合位置を示す)

で示される薬物リンカーと、抗体とがチオエーテル結合によって結合した抗体・薬物コンジュゲートである、医薬組成物。

【請求項 2】

抗体・薬物コンジュゲートにおける抗体が、抗HER2抗体、抗HER3抗体、抗TROP2抗体、抗B7-H3抗体、抗GPR20抗体、又は抗CDH6抗体である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

20

【請求項 3】

抗体・薬物コンジュゲートにおける抗体が、抗HER2抗体である、請求項 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

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 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

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 3 に記載の医薬組成物。

30

【請求項 6】

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 3 から 5 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

抗体・薬物コンジュゲートにおける抗体が、抗HER3抗体である、請求項 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

抗HER3抗体が、配列番号 3 に記載のアミノ酸配列からなる重鎖及び配列番号 4 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 7 に記載の医薬組成物。

40

【請求項 9】

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 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

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 7 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

抗体・薬物コンジュゲートにおける抗体が、抗TROP2抗体である、請求項 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

50

抗 T R O P 2 抗体が、配列番号 5 においてアミノ酸番号 2 0 乃至 4 7 0 に記載のアミノ酸配列からなる重鎖及び配列番号 6 においてアミノ酸番号 2 1 乃至 2 3 4 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 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3】

抗 T R O P 2 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 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

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 3 . 5 から 4 . 5 個の範囲である、請求項 1 1 から 1 3 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

抗体 - 薬物コンジュゲートにおける抗体が、抗 B 7 - H 3 抗体である、請求項 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

抗 B 7 - H 3 抗体が、配列番号 7 においてアミノ酸番号 2 0 乃至 4 7 1 に記載のアミノ酸配列からなる重鎖及び配列番号 8 においてアミノ酸番号 2 1 乃至 2 3 3 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 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

抗 B 7 - H 3 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 1 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

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 3 . 5 から 4 . 5 個の範囲である、請求項 1 5 から 1 7 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

抗体 - 薬物コンジュゲートにおける抗体が、抗 G P R 2 0 抗体である、請求項 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 0】

抗 G P R 2 0 抗体が、配列番号 9 においてアミノ酸番号 2 0 乃至 4 7 2 に記載のアミノ酸配列からなる重鎖及び配列番号 1 0 においてアミノ酸番号 2 1 乃至 2 3 4 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 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 1】

抗 G P R 2 0 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 2 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

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 9 から 2 1 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

抗体 - 薬物コンジュゲートにおける抗体が、抗 C D H 6 抗体である、請求項 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 4】

抗 C D H 6 抗体が、配列番号 1 1 においてアミノ酸番号 2 0 乃至 4 7 1 に記載のアミノ酸配列からなる重鎖及び配列番号 1 2 においてアミノ酸番号 2 1 乃至 2 3 3 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 2 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

抗 C D H 6 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 2 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

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 2 3 から 2 5 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 7】

チューブリン阻害剤が、パクリタキセル、ドセタキセル、カバジタキセル、若しくはこ

10

20

30

40

50

これらの薬理上許容される塩、又はn a b - パクリタキセルである、請求項 1 から 2 6 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 8】

チューブリン阻害剤が、パクリタキセルである、請求項 2 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 9】

チューブリン阻害剤が、エリブリン若しくはその薬理上許容される塩、又はエリブリンと抗体とをリンカーを介して結合した抗体 - 薬物コンジュゲートである、請求項 1 から 2 6 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 3 0】

チューブリン阻害剤が、エリブリンメシル酸塩である、請求項 2 9 に記載の医薬組成物 10
。

【請求項 3 1】

抗体 - 薬物コンジュゲートと、チューブリン阻害剤が、それぞれ別異の製剤に有効成分として含有され、同時に又は異なる時間に投与されることを特徴とする、請求項 1 から 3 0 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 3 2】

乳がん、胃がん、大腸がん、肺がん、食道がん、唾液腺がん、胃食道接合部腺がん、胆道がん、ペーজেット病、膵臓がん、卵巣がん、膀胱がん、前立腺がん、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の治療のための、請求項 1 から 3 1 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。 20

【請求項 3 3】

乳がんの治療のための、請求項 3 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 4】

胃がんの治療のための、請求項 3 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 5】

肺がんの治療のための、請求項 3 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 6】

卵巣がんの治療のための、請求項 3 2 に記載の医薬組成物。

30

40

50