

【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5年1月26日(2023.1.26)

【国際公開番号】WO2020/161214

【公表番号】特表2022-523155(P2022-523155A)

【公表日】令和4年4月21日(2022.4.21)

【年通号数】公開公報(特許)2022-072

【出願番号】特願2021-546257(P2021-546257)

【国際特許分類】

A 6 1 K 39/395(2006.01)

A 6 1 P 11/00(2006.01)

A 6 1 P 35/00(2006.01)

A 6 1 P 43/00(2006.01)

A 6 1 K 45/00(2006.01)

A 6 1 K 47/68(2017.01)

A 6 1 K 31/537(2006.01)

C 0 7 K 16/46(2006.01)

C 1 2 N 15/13(2006.01)

10

【F I】

A 6 1 K 39/395 T

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 39/395 E

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 47/68

A 6 1 K 31/537

C 0 7 K 16/46 Z N A

C 1 2 N 15/13

20

30

【手続補正書】

【提出日】令和5年1月13日(2023.1.13)

【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】

それを必要としている対象において非扁平上皮非小細胞肺がん(NSQ NSCLC)を処置する際に使用するための、抗体または該抗体を含むイムノコンジュゲートを含む医薬組成物であって、

該抗体はhCEACAM5に特異的に結合し、ならびに該抗体はVHおよびVLを含み、

VHは3つの相補性決定領域、HCDR1、HCDR2、およびHCDR3を含み、ならびに

VLは3つのCDR、LCDR1、LCDR2、およびLCDR3を含み、

HCDR1は配列番号3のアミノ酸配列(GFVFSYD)を含み；HCDR2は配列番号4のアミノ酸配列(ISSGGIT)を含み；HCDR3は配列番号5のアミ

40

50

ノ酸配列 (A A H Y F G S S G P F A Y) を含み ;

L C D R 1 は配列番号 6 のアミノ酸配列 (E N I F S Y) を含み ; L C D R 2 は N T R のアミノ酸配列を含み ; および L C D R 3 は配列番号 7 のアミノ酸配列 (Q H H Y G T P F T) を含む、
前記医薬組成物。

【請求項 2】

対象は、癌胎児抗原関連細胞接着分子高発現者である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

対象は、非小細胞肺癌を処置するための薬剤または薬物を用いて事前処置された、請求項 1 または 2 に記載の医薬組成物。

10

【請求項 4】

薬剤または薬物は、化学療法剤、血管新生阻害剤、上皮増殖因子受容体 (E G F R) 阻害剤、未分化リンパ腫キナーゼ (A L K) 阻害剤、受容体型チロシンキナーゼ (R O S 1) 阻害剤、および免疫チェックポイント阻害剤からなる群から選択される、請求項 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

免疫チェックポイント阻害剤は、P D - 1 阻害剤および / または P D - L 1 阻害剤である、請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

V H は、配列番号 1

20

【化 1】

(EVQLQESGPGGLVKPGGSLSLSCAASGFVFSYDMSWVRQTPERGLEWV
AYISSGGGITYAPSTVKGRFTVSRDNAKNTLYLQMNSLTSEDTAVYYCA
AHYFGSSGPFAYWGQGLVTVSS)

を含む、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

重鎖は、配列番号 8

(EVQLQESGPGGLVKPGGSLSLSCAASGFVFSYDMSWVRQTPERGLEWVAYISSGGG
ITYAPSTVKGRFTVSRDNAKNTLYLQMNSLTSEDTAVYYCAAHYFGSSGPFAYWGQ
GTLVTVSSASTKGPSVFPLAPSSKSTSGGTAALGCLVKDYFPEPVTVSWNSGALTSG
VHTFPAVLQSSGLYSLSSVTVPSSSLGTQTYICNVNHKPSNTKVDKKVEPKSCDKT
HTCPPCPAPELLGGPSVFLFPPKPKDTLMISRTPEVTCVVVDVSHEDPEVKFNWYV
DGVEVHNAKTKPREEQYNSTYRVVSVLTVLHQDWLNGKEYKCKVSNKALPAPIEKT
ISKAKGQPREPQVYTLPPSRDELTKNQVSLTCLVKGFYPSDIAVEWESNGQPENNYK
TTPPVLDSDGSFFLYSKLTVDKSRWQQGNVFCFSVMHEALTHNHYTQKSLSLSPG)

を含む、請求項 6 に記載の医薬組成物。

40

【請求項 8】

V L は、配列番号 2

【化 2】

(DIQMTQSPASLSASVGDRVTITCRASENIFSYLAWYQQKPGKSPKLLVY
NTRLAEGVPSRFSGSGSGTDFSLTISSLQPEDFATYYCQH HYGTPFTFG
SGTKLEIK)

50

を含む、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

軽鎖は、配列番号 9

(DIQMTQSPASLSASVVGDRVTITCRASENIFSYLAWYQQKPGKSPKLLVYNTRTLAEG
VPSRFSGSGSGTDFSLTISSLPEDFATYYCQHHYGTPFTFGSGTKLEIKRTVAAPSV
FIFPPSDEQLKSGTASVVCLLNNFYPREAKVQWKVDNALQSGNSQESVTEQDSKDST
YLSLSSTLTLSKADYEKHKVYACEVTHQGLSSPVTKSFNRGEC)

を含む、請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

抗体は、少なくとも 1 つの増殖阻害剤とコンジュゲートまたはリンクしている、請求項 10 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記増殖阻害剤は細胞傷害剤である、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

前記増殖阻害剤は、化学療法剤、酵素、抗生物質、および毒素、例えば小分子毒素または酵素的に活性な毒素等、タキソイド、ビンカ、タキサン、マイタンシノイドまたはマイタンシノイドアナログ、トメイマイシンまたはピロロベンゾジアゼピン誘導体、クリプトフィシン誘導体、レプトマイシン誘導体、オーリスタチンまたはドラスタチンアナログ、プロドラッグ、トポイソメラーゼ II 阻害剤、DNA アルキル化剤、抗チューブリン剤、および CC-1065 または CC-1065 アナログからなる群から選択される、請求項 10 または 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

前記増殖阻害剤は、(N²' -デアセチル - N²' - (3 -メルカプト - 1 -オキソプロピル) -マイタンシン) DM1、または N²' -デアセチル - N - 2' (4 -メチル - 4 -メルカプト - 1 -オキソペンチル) -マイタンシン (DM4) である、請求項 10 または 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

抗体は、開裂可能リンカーまたは開裂不能リンカーを介して少なくとも 1 つの増殖阻害剤と共有結合的に連結している、請求項 10 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

前記リンカーは、N - スクシニミジルピリジルジチオブチレート (SPDB)、4 - (ピリジン - 2 - イルジスルファニル) - 2 - スルホ - 酪酸 (スルホ - SPDB)、およびスクシニミジル (N - マレイミドメチル) シクロヘキサン - 1 - カルボキシレート (SMCC) からなる群から選択される、請求項 14 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

対象は、腫瘍細胞集団において、パーセントスコアが 50 以上の hCEACAM5 発現 (強度 2 + および 3 + からなる) を有する、請求項 1 ~ 15 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

対象の体表面積に基づき、5、10、20、30、40、60、80、100、120、150、180、または 210 mg / m² の用量レベルで投与される、請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

14 日毎または 3 週間毎に投与される、請求項 1 ~ 17 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

それを必要としている対象において非扁平上皮非小細胞肺癌 (NSQ NSCLC) を処置する際に使用するための、抗体を含むイムノコンジュゲートを含む医薬組成物であって、

該抗体は hCEACAM5 に特異的に結合し、ならびに該抗体は VH および VL を含み

V H は、配列番号 1

【化 3】

(EVQLQESGPGGLVKPGGSLSLSCAASGFVFSYDMSWVRQTPERGLEWV
 AYISSGGGITYAPSTVKGRFTVSRDNAKNTLYLQMNSLTSEDVAVYYCA
 AHYFGSSGPFAYWGQGLVTVSS)

10

を含み、

V L は、配列番号 2

【化 4】

(DIQMTQSPASLSASVGDRTITCRASENIFSYLAWYQQKPGKSPKLLVY
 NTRTLAEGVPSRFSGSGSGTDFSLTISSLQPEDFATYYCQHHTGTPFTFG
 GTKLEIK)

20

を含み、

該イムノコンジュゲートは、対象の体表面積に基づき、80、100、120、150、または180 mg/m²の用量レベルで、14日毎または3週間毎に投与される、前記医薬組成物。

【請求項 20】

それを必要としている対象において非扁平上皮非小細胞肺癌（NSQ NSCLC）を処置するために使用するための、抗体を含むイムノコンジュゲートを含む医薬組成物であって、

該抗体は h C E A C A M 5 に特異的に結合し、ならびに該抗体は重鎖および軽鎖を含み

30

重鎖は、配列番号 8

(EVQLQESGPGGLVKPGGSLSLSCAASGFVFSYDMSWVRQTPERGLEWVAYISSGGG
 ITYAPSTVKGRFTVSRDNAKNTLYLQMNSLTSEDVAVYYCAAHYFGSSGPFAYWGQ
 GTLVTVSSASTKGPSVFPLAPSSKSTSGGTAALGCLVKDYFPEPVTVSWNSGALTSG
 VHTFPAVLQSSGLYSLSSVTVPSSSLGTQTYICNVNHKPSNTKVDKKEPKSCDKT
 HTCPCPAPPELLGGPSVFLFPPKPKDTLMISRTPEVTCVVVDVSHEDPEVKFNWYV
 DGVEVHNAKTKPREEQYNSTYRVVSVLTVLHQDWLNGKEYKCKVSNKALPAPIEKT
 ISKAKGQPREPQVYTLPPSRDELTKNQVSLTCLVKGFYPSDIAVEWESNGQPENNYK
 TTPPVLDSDGSFFLYSKLTVDKSRWQQGNVFCFSVMHEALTHNHYTQKSLSLSPG)

を含み、

40

軽鎖は、配列番号 9

(DIQMTQSPASLSASVGDRTITCRASENIFSYLAWYQQKPGKSPKLLVYNTRTLAEG
 VPSRFSGSGSGTDFSLTISSLQPEDFATYYCQHHTGTPFTFGSGTKLEIKRTVAAPSV
 FIFPPSDEQLKSGTASVVCLLNNFYPREAKVQWKVDNALQSGNSQESVTEQDSDKST
 YLSLSTLTLSKADYEKHKVYACEVTHQGLSSPVTKSFNRGEC)

を含み、

該イムノコンジュゲートは、対象の体表面積に基づき、80、100、120、150、または180 mg/m²の用量レベルで、14日毎または3週間毎に投与される、前記医薬組成物。

50