

【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 6 年 9 月 30 日(2024.9.30)

【公開番号】特開 2024-75676(P2024-75676A)
【公開日】令和 6 年 6 月 4 日(2024.6.4)
【年通号数】公開公報(特許)2024-102
【出願番号】特願 2024-43606(P2024-43606)
【国際特許分類】

A 6 1 K 39/395(2006.01)
A 6 1 P 35/00(2006.01)
A 6 1 P 11/00(2006.01)
A 6 1 P 15/00(2006.01)
A 6 1 K 45/00(2006.01)
A 6 1 P 43/00(2006.01)
A 6 1 K 31/4745(2006.01)
A 6 1 P 1/00(2006.01)
C 0 7 K 16/28(2006.01)

10

【F I】

A 6 1 K 39/395 D Z N A
A 6 1 K 39/395 N
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 15/00
A 6 1 K 45/00
A 6 1 P 43/00 1 2 1
A 6 1 K 31/4745
A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 P 1/00
C 0 7 K 16/28

20

30

【手続補正書】
【提出日】令和 6 年 9 月 18 日(2024.9.18)
【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】

40

対象における腫瘍転移又は腫瘍の再生の防止に使用するための、
配列番号 17 を有する C D R 1、配列番号 19 を有する C D R 2、及び配列番号 21 を有する C D R 3 を含む、E G F R の細胞外部分に結合する可変ドメイン、ならびに
配列番号 69 を有する C D R 1、配列番号 71 を有する C D R 2、及び配列番号 73 を有する C D R 3 を含む、L G R 5 の細胞外部分に結合する可変ドメイン
を含む抗体又はその機能性部分を含む組成物であって、
前記抗体又はその機能性部分が、アミノ酸配列 Q S I S S Y を含む L C D R 1、アミノ酸配列 A A S を含む L C D R 2、及びアミノ酸配列 Q Q S Y S T P を含む L C D R 3 を含む軽鎖を含み、
前記抗体が、トボテカン、イリノテカン、ギマテカン、ラメラリン D、カンプトテシン、

50

9 - ニトロ - カンプトテシン及び PNU - 166148 から選択されるヒトトポイソメラーゼ I 阻害剤と共に、同時に、別々に又は連続投与され、
前記腫瘍が EGFR 及び / 又は LGR5 を発現する、組成物。

【請求項 2】

対象における腫瘍転移又は腫瘍の再生を防止するための医薬の製造に使用するための、
配列番号 17 を有する CDR 1、配列番号 19 を有する CDR 2、及び配列番号 21 を有する CDR 3 を含む、EGFR の細胞外部分に結合する可変ドメイン、ならびに
配列番号 69 を有する CDR 1、配列番号 71 を有する CDR 2、及び配列番号 73 を有する CDR 3 を含む、LGR5 の細胞外部分に結合する可変ドメイン
を含む抗体又はその機能性部分を含む組成物であって、

10

前記腫瘍が EGFR 及び / 又は LGR5 を発現し、
前記抗体が、トポテカン、イリノテカン、ギマテカン、ラメラリン D、カンプトテシン、
9 - ニトロ - カンプトテシン及び PNU - 166148 から選択されるヒトトポイソメラーゼ I 阻害剤と共に、同時に、別々に又は連続投与される、組成物。

【請求項 3】

トポテカン、イリノテカン、ギマテカン、ラメラリン D、カンプトテシン、9 - ニトロ - カンプトテシン及び PNU - 166148 から選択されるヒトトポイソメラーゼ I 阻害剤と組み合わせて使用するための、対象における腫瘍転移又は腫瘍再生防止用組成物であって、

前記組成物が、

20

配列番号 17 を有する CDR 1、配列番号 19 を有する CDR 2、及び配列番号 21 を有する CDR 3 を含む、EGFR の細胞外部分に結合する可変ドメイン、ならびに
配列番号 69 を有する CDR 1、配列番号 71 を有する CDR 2、及び配列番号 73 を有する CDR 3 を含む、LGR5 の細胞外部分に結合する可変ドメイン
を含む抗体又はその機能性部分を含み、

前記抗体又はその機能性部分が、アミノ酸配列 QSISSY を含む LCDR 1、アミノ酸配列 AAS を含む LCDR 2、及びアミノ酸配列 QQSYSTP を含む LCDR 3 を含む軽鎖を含み、

前記腫瘍が EGFR 及び / 又は LGR5 を発現する、組成物。

【請求項 4】

30

抗体又はその機能性部分を含む組成物が、ヒトトポイソメラーゼ I 阻害剤とともに、同時に、別々に又は連続して使用するためのものである、請求項 3 に記載の組成物。

【請求項 5】

EGFR 及び / 又は LGR5 を発現する腫瘍の腫瘍転移又は腫瘍再生を防止するための、
i) 配列番号 17 を有する CDR 1、配列番号 19 を有する CDR 2、及び配列番号 21 を有する CDR 3 を含む、EGFR の細胞外部分に結合する可変ドメイン、ならびに
配列番号 69 を有する CDR 1、配列番号 71 を有する CDR 2、及び配列番号 73 を有する CDR 3 を含む、LGR5 の細胞外部分に結合する可変ドメイン
を含む抗体又はその機能性部分であって、

アミノ酸配列 QSISSY を含む LCDR 1、アミノ酸配列 AAS を含む LCDR 2、及びアミノ酸配列 QQSYSTP を含む LCDR 3 を含む軽鎖を含む抗体又はその機能性部分、ならびに

40

ii) トポテカン、イリノテカン、ギマテカン、ラメラリン D、カンプトテシン、9 - ニトロ - カンプトテシン及び PNU - 166148 から選択されるヒトトポイソメラーゼ I 阻害剤
を含む組み合わせ物。

【請求項 6】

前記腫瘍が、結腸直腸癌、肺癌、胃腸癌又は卵巣癌である、請求項 5 に記載の組み合わせ物。

【請求項 7】

50

前記腫瘍が結腸直腸癌である、請求項 6 に記載の組み合わせ物。

【請求項 8】

前記抗体又はその機能性部分、及び、前記ヒトトポイソメラーゼ I 阻害剤が、対象に同時に投与される、請求項 5 または 6 に記載の組み合わせ物。

【請求項 9】

前記抗体又はその機能性部分が、前記ヒトトポイソメラーゼ I 阻害剤に先立って前記対象に投与される、請求項 5 ～ 8 のいずれか一項に記載の組み合わせ物。

【請求項 10】

配列番号 17 を有する C D R 1、配列番号 19 を有する C D R 2、及び配列番号 21 を有する C D R 3 を含む、E G F R の細胞外部分に結合する可変ドメイン、ならびに

10

配列番号 69 を有する C D R 1、配列番号 71 を有する C D R 2、及び配列番号 73 を有する C D R 3 を含む、L G R 5 の細胞外部分に結合する可変ドメイン

を含む抗体又はその機能性部分であって、

アミノ酸配列 Q S I S S Y を含む L C D R 1、アミノ酸配列 A A S を含む L C D R 2、及びアミノ酸配列 Q Q S Y S T P を含む L C D R 3 を含む軽鎖を含む抗体又はその機能性部分、

トポテカン、イリノテカン、ギマテカン、ラメラリン D、カンプトテシン、9 - ニトロ - カンプトテシン及び P N U - 166148 から選択されるヒトトポイソメラーゼ I 阻害剤、ならびに

E G F R 及び / 又は L G R 5 を発現する腫瘍の腫瘍転移又は腫瘍再生の防止において抗体及びヒトトポイソメラーゼ I 阻害剤を使用するための指示

20

を含むキット。

【請求項 11】

前記抗体又はその機能性部分が、E G F R の細胞外部分に結合する可変ドメイン、及び L G R 5 の細胞外部分に結合する可変ドメインを含み、前記ヒトトポイソメラーゼ I 阻害剤が、単剤で提供される、請求項 1 ～ 10 のいずれか一項に記載の組成物、組み合わせ物、又はキット。

【請求項 12】

前記抗体又はその機能性部分が、E G F R の細胞外部分に結合する可変ドメイン、及び L G R 5 の細胞外部分に結合する可変ドメインを含み、前記ヒトトポイソメラーゼ I 阻害剤が、別個の製剤で提供される、請求項 1 ～ 10 のいずれか一項に記載の組成物、組み合わせ物、又はキット。

30

【請求項 13】

E G F R に結合する前記可変ドメインの V H 鎖が、図 8 に表される V H 鎖 M F 3 7 5 5 のアミノ酸配列、あるいは最大 15 個、好ましくは多くて 10 個、9 個、8 個、7 個、6 個、5 個、4 個、3 個、2 個、1 個、好ましくは多くて 5 個、4 個、3 個、2 個、又は 1 個の、前記 V H に対する挿入、欠失、置換、又はこれらの組合せを含むアミノ酸修飾を有する、図 8 に表される V H 鎖 M F 3 7 5 5 のアミノ酸配列を含み、

L G R 5 に結合する前記可変ドメインの V H 鎖が、図 8 に表される V H 鎖 M F 5 8 1 6 のアミノ酸配列、あるいは最大 15 個、好ましくは多くて 10 個、9 個、8 個、7 個、6 個、5 個、4 個、3 個、2 個、1 個、好ましくは多くて 5 個、4 個、3 個、2 個、又は 1 個の、前記 V H に対する挿入、欠失、置換、又はこれらの組合せを含むアミノ酸修飾を有する、図 8 に表される V H 鎖 M F 5 8 1 6 のアミノ酸配列を含み、

40

アミノ酸の挿入、欠失、及び置換が、C D R 1、C D R 2、及び C D R 3 領域に存在しない、請求項 1 ～ 12 のいずれか一項に記載の組成物、組み合わせ物、又はキット。

【請求項 14】

E G F R に結合する前記可変ドメインの V H 鎖が、図 8 に表される V H 鎖 M F 3 7 5 5 のアミノ酸配列を含み、L G R 5 に結合する前記可変ドメインの V H 鎖が、図 8 に表される V H 鎖 M F 5 8 1 6 のアミノ酸配列を含む、請求項 1 ～ 13 のいずれか一項に記載の組成物、組み合わせ物、又はキット。

50

【請求項 15】

前記腫瘍が、結腸直腸癌、肺癌、胃腸癌又は卵巣癌である、請求項 1 ～ 14 のいずれか一項に記載の組成物、組み合わせ物、又はキット。

【請求項 16】

前記腫瘍が結腸直腸癌である、請求項 15 に記載の組成物、組み合わせ物、又はキット。

【請求項 17】

前記ヒトトポイソメラーゼⅠ阻害剤がカンプトテシンである、請求項 1 ～ 16 のいずれか一項に記載の組成物、組み合わせ物、又はキット。

【請求項 18】

ヒトトポイソメラーゼⅠ阻害剤が、イリノテカン又はトポテカンである、請求項 1 ～ 17 のいずれか一項に記載の組成物、組み合わせ物、又はキット。

10

【請求項 19】

前記抗体が ADC 増強型である、請求項 1 ～ 18 のいずれか一項に記載の組成物、組み合わせ物、又はキット。

【請求項 20】

前記抗体がアフコシル化されている、請求項 1 ～ 19 のいずれか一項に記載の組成物、組み合わせ物、又はキット。

20

30

40

50