

【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 1 部門第 1 区分

【発行日】令和 3 年 10 月 21 日 (2021.10.21)

【公表番号】特表 2020-530296 (P2020-530296A)

【公表日】令和 2 年 10 月 22 日 (2020.10.22)

【年通号数】公開・登録公報 2020-043

【出願番号】特願 2020-507074 (P2020-507074)

【国際特許分類】

C 1 2 N 15/13 (2006.01)

C 0 7 K 16/28 (2006.01)

C 1 2 N 1/15 (2006.01)

C 1 2 N 1/19 (2006.01)

C 1 2 N 1/21 (2006.01)

C 1 2 N 5/10 (2006.01)

A 6 1 K 39/395 (2006.01)

A 6 1 K 47/68 (2017.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 K 45/08 (2006.01)

【 F I 】

C 1 2 N 15/13

C 0 7 K 16/28 Z N A

C 1 2 N 1/15

C 1 2 N 1/19

C 1 2 N 1/21

C 1 2 N 5/10

A 6 1 K 39/395 N

A 6 1 K 39/395 V

A 6 1 K 47/68

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 31/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 K 45/08

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 9 月 7 日 (2021.9.7)

【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】

酸性 pH においてヒト F c R n に結合する I g G F c ドメインを含むポリペプチドで

あって、前記 F c ドメインが、以下：

( i ) 3 0 9 位におけるアスパラギン酸 ( L / V 3 0 9 D ) ；

( i i ) 3 1 1 位におけるヒスチジン ( Q 3 1 1 H ) ；および

( i i i ) 4 3 4 位におけるセリンまたはチロシンのいずれかの置換 ( N 4 3 4 Y または N 4 3 4 S )

( アミノ酸位置ナンバリングは、K a b a t システムにしたがう ) の置換を有する、ポリペプチド。

【請求項 2】

前記 4 3 4 位における置換が、セリン ( N 4 3 4 S ) である、請求項 1 に記載のポリペプチド。

【請求項 3】

前記 4 3 4 位における置換が、チロシン ( N 4 3 4 Y ) である、請求項 1 に記載のポリペプチド。

【請求項 4】

前記 F c ドメインが、グリコシル化されている、請求項 1 に記載のポリペプチド。

【請求項 5】

前記 F c ドメインが、野生型と比較して実質的に等しい、基本的に同じ、ほぼ同じ、または同じである F c R への結合を有する、請求項 4 に記載のポリペプチド。

【請求項 6】

前記 F c ドメインが、F c R I、F c R I I、および F c R I I I のうちの 1 つ、2 つ、または全てに対して野生型 F c ドメインと比較して実質的に等しい、基本的に同じである、ほぼ同じである、同じである、または等しい結合能を有する、請求項 4 に記載のポリペプチド。

【請求項 7】

前記 F c ドメインが、F c R n に酸性 p H において野生型 F c ドメインよりも高い親和性で結合する、請求項 1 に記載のポリペプチド。

【請求項 8】

前記 F c ドメインが、中性 p H では F c R n に検出可能もしくは選択的には結合しない、または F c R n への結合を示さないもしくは基本的に示さない、請求項 7 に記載のポリペプチド。

【請求項 9】

前記 F c ドメインが、F c R n に対して、野生型 F c ドメインと比較して、( i ) p H 5 . 8 では結合の増強を示し、かつ ( i i ) p H 7 . 4 では結合の低減を示すまたは検出可能な結合を示さない、請求項 8 に記載のポリペプチド。

【請求項 10】

前記 F c ドメインが、非グリコシル化されている、請求項 1 に記載のポリペプチド。

【請求項 11】

前記 F c ドメインが、2 6 4 位におけるグルタミン酸の置換 ( V 2 6 4 E ) をさらに含む、請求項 10 に記載のポリペプチド。

【請求項 12】

前記 I g G が、I g G 1 である、請求項 1 に記載のポリペプチド。

【請求項 13】

前記 I g G が、I g G 2 である、請求項 1 に記載のポリペプチド。

【請求項 14】

前記 I g G が、I g G 3 である、請求項 1 に記載のポリペプチド。

【請求項 15】

前記 I g G が、I g G 4 である、請求項 1 に記載のポリペプチド。

【請求項 16】

前記 F c ドメインが、以下：

V 2 6 4 E、L 3 0 9 D、Q 3 1 1 H、および N 4 3 4 S ；

V 2 6 4 E、L 3 0 9 D、Q 3 1 1 H、および N 4 3 4 Y ;  
V 2 6 4 E、V 3 0 9 D、Q 3 1 1 H、および N 4 3 4 S ;  
V 2 6 4 E、V 3 0 9 D、Q 3 1 1 H、および N 4 3 4 Y ;  
L 3 0 9 D、Q 3 1 1 H、および N 4 3 4 S ;  
V 3 0 9 D、Q 3 1 1 H、および N 4 3 4 S ;  
V 3 0 9 D、Q 3 1 1 H、および N 4 3 4 Y ; ならびに  
L 3 0 9 D、Q 3 1 1 H、および N 4 3 4 Y

からなる群から選択される置換を含む、またはそれからなる、請求項 1 に記載のポリペプチド。

【請求項 17】

前記 F c ドメインが、L 3 0 9 D、Q 3 1 1 H、および N 4 3 4 S ; または L 3 0 9 D、Q 3 1 1 H、および N 4 3 4 Y を含む、またはそれからなる、請求項 16 に記載のポリペプチド。

【請求項 18】

前記 F c ドメインが、F c R n に 5 5 0 n M 未満の  $K_D$  値で結合する、請求項 1 に記載のポリペプチド。

【請求項 19】

前記 F c ドメインが、F c R n に 2 5 0 n M 未満の  $K_D$  値で結合する、請求項 18 に記載のポリペプチド。

【請求項 20】

前記 F c ドメインが、F c R n に 1 2 5 n M 未満の  $K_D$  値で結合する、請求項 18 に記載のポリペプチド。

【請求項 21】

非 F c 受容体 ( 非 F c R ) 結合ドメインをさらに含む、請求項 1 に記載のポリペプチド。

【請求項 22】

前記非 F c R 結合ドメインが、I g 可変ドメインである、請求項 21 に記載のポリペプチド。

【請求項 23】

全長抗体である、請求項 22 に記載のポリペプチド。

【請求項 24】

前記抗体が、アゴニスト抗体である、請求項 23 に記載のポリペプチド。

【請求項 25】

前記抗体が、アンタゴニスト抗体である、請求項 23 に記載のポリペプチド。

【請求項 26】

前記抗体が、Her 2 / neu、CD 2 0、CD 4 0、IL - 1 0、4 - 1 B B、PD - 1、PD - L 1、CTLA - 4 O X 4 0、IL - 1、IL - 6、IL 6 R、TNF、RANKL、EGFR、c - Met、CD 1 1 a、VEGF - A、VEGFR 1、VEGFR 2、C 5、またはインテグリン - 4 に選択的に結合する、請求項 23 に記載のポリペプチド。

【請求項 27】

前記抗体が、毒素に化学的にコンジュゲートしているまたは共有結合している、請求項 23 に記載のポリペプチド。

【請求項 28】

前記非 F c R 結合領域が、抗体の抗原結合部位ではない、請求項 21 に記載のポリペプチド。

【請求項 29】

前記非 F c R 結合領域が、細胞表面タンパク質に結合する、請求項 21 に記載のポリペプチド。

【請求項 30】

前記非 F c R 結合領域が、可溶性タンパク質に結合する、請求項 2 1 に記載のポリペプチド。

【請求項 3 1】

薬学的に許容される担体中に、請求項 1 に記載のポリペプチドを含む医薬品製剤。

【請求項 3 2】

前記 F c ドメインが、配列番号 5 を含む、請求項 1 6 に記載のポリペプチド。

【請求項 3 3】

前記 F c ドメインが、V 2 6 4 E、L 3 0 9 D、Q 3 1 1 H、および N 4 3 4 S を含む、請求項 1 6 に記載のポリペプチド。

【請求項 3 4】

前記 F c ドメインが、V 2 6 4 E、L 3 0 9 D、Q 3 1 1 H、および N 4 3 4 Y を含む、請求項 1 6 に記載のポリペプチド。

【請求項 3 5】

前記 F c ドメインが、L 3 0 9 D、Q 3 1 1 H、および N 4 3 4 S を含む、請求項 1 6 に記載のポリペプチド。

【請求項 3 6】

前記 F c ドメインが、L 3 0 9 D、Q 3 1 1 H、および N 4 3 4 Y を含む、請求項 1 6 に記載のポリペプチド。

【請求項 3 7】

前記 F c ドメインが、V 3 0 9 D、Q 3 1 1 H、および N 4 3 4 S を含む、請求項 1 6 に記載のポリペプチド。

【請求項 3 8】

前記 F c ドメインが、V 3 0 9 D、Q 3 1 1 H、および N 4 3 4 Y を含む、請求項 1 6 に記載のポリペプチド。

【請求項 3 9】

前記 I g G F c ドメインが、ヒト I g G F c ドメインである、請求項 1 ~ 3 0 および 3 2 ~ 3 8 のいずれか一項に記載のポリペプチド。