

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2021年7月1日(01.07.2021)



(10) 国際公開番号

WO 2021/132166 A1

(51) 国際特許分類:

A61K 39/395 (2006.01) A61K 47/68 (2017.01)
A61P 35/00 (2006.01) C12N 15/13 (2006.01)
C07K 5/062 (2006.01) A61K 31/357 (2006.01)
C07K 16/28 (2006.01)

MANAGEMENT CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1128088
東京都文京区小石川四丁目6番1
0号 Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2020/047706

(22) 国際出願日: 2020年12月21日(21.12.2020)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2019-231938 2019年12月23日(23.12.2019) JP

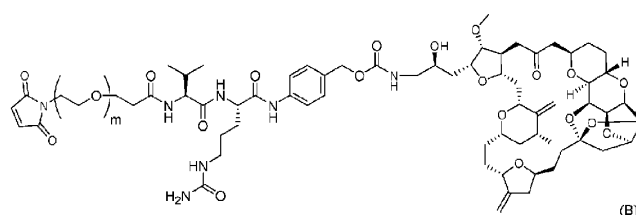
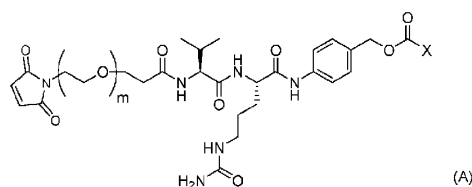
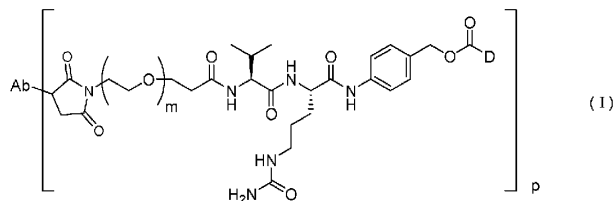
(71) 出願人: エーザイ・アール・アンド・デ
ィー・マネジメント株式会社 (EISAI R&D

(72) 発明者: 松尾 公博 (MATSUO Kimihiro);
〒3140255 茨城県神栖市砂山22番地 エーザイ
株式会社 鹿島事業所内 Ibaraki (JP). 中村 太樹
(NAKAMURA Taiju); 〒3140255 茨城県神栖市
砂山22番地 エーザイ株式会社 鹿島事業所内
Ibaraki (JP). 宮下 祐輔 (MIYASHITA Yusuke);
〒3140255 茨城県神栖市砂山22番地 エーザ
イ株式会社 鹿島事業所内 Ibaraki (JP).

(74) 代理人: 長谷川 芳樹, 外 (HASEGAWA Yoshiki
et al.); 〒1000005 東京都千代田区丸の内二
丁目1番1号丸の内 M Y P L A Z A

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING ERIBULIN-BASED ANTIBODY-DRUG CONJUGATE

(54) 発明の名称: エリブリンをベースとする抗体-薬物コンジュゲートの製造方法



(57) Abstract: The present invention provides a method for producing an antibody-drug conjugate represented by formula (1) [wherein: Ab represents an antibody or an antigen-binding fragment thereof; D represents eribulin; m is an integer of 1-10; and p is an integer of 1-8], said method comprising step 1 for reacting eribulin or a salt thereof with a compound represented by formula (A) [wherein: m is an integer of 1-10; and X represents a phenoxy group or a nitrophenoxy group] to give a compound represented by formula (B) [wherein m is an integer of 1-10], and step 2 for reacting the compound



WO 2021/132166 A1

[続葉有]

(明治安田生命ビル) 9階 創英国際特
許法律事務所 Tokyo (JP).

- (81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, IT, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, WS, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

- 国際調査報告 (条約第21条(3))
- 明細書の別個の部分として表した配列リスト (規則5.2(a))

represented by formula (B) with the Ab to give the antibody-drug conjugate represented by formula (I).

(57) 要約: 本発明は、式 (I) で表される抗体-薬物コンジュゲートを製造する方法であって、式 (I) [式中、A bは、抗体またはその抗原結合性断片であり、Dは、エリブリンであり、mは、1~10の整数であり、pは、1~8の整数である。] エリブリン又はその塩と式 (A) で表される化合物との反応により、式 (B) で表される化合物を得る工程1と、式 (A) [式中、mは、1~10の整数であり、Xは、フェノキシ基又はニトロフェノキシ基である。] 式 (B) [式中、mは、1~10の整数である。] 式 (B) で表される化合物及び前記A bの反応により、式 (I) で表される抗体-薬物コンジュゲートを得る工程2と、を含む、方法を提供する。