(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
2018年6月21日(21.06.2018)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2018/110515 A1

(51) 国際特許分類:
A61K 39/395 (2006.01) *A61K 47/68* (2017.01)
A61K 31/4745 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
A61K 45/00 (2006.01) *A61P 35/02* (2006.01)
A61K 47/20 (2006.01) *A61P 43/00* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2017/044426

(22) 国際出願日: 2017年12月11日(11.12.2017)

(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 2016-240442 2016年12月12日(12.12.2016) JP
特願 2017-097067 2017年5月16日(16.05.2017) JP
特願 2017-183149 2017年9月25日(25.09.2017) JP

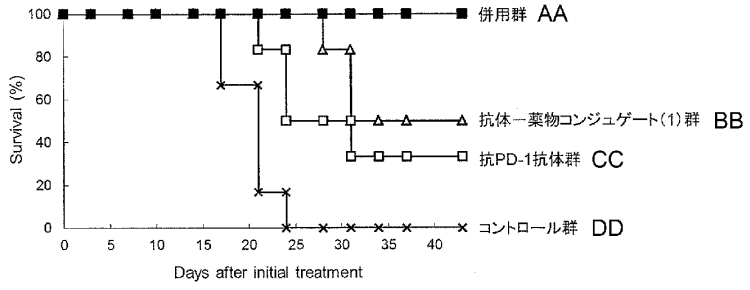
(71) 出願人: 第一三共株式会社(**DAIICHI SANKYO COMPANY, LIMITED**) [JP/JP]; 〒1038426 東京都中央区日本橋本町三丁目5番1号 Tokyo (JP).

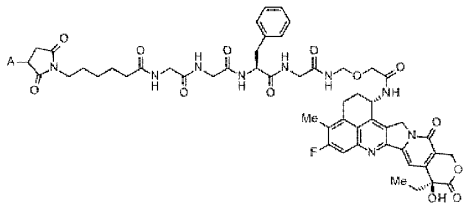
(72) 発明者: 岩田 知美(**IWATA Tomomi**); 〒1038426 東京都中央区日本橋本町三丁目5番1号 第一三共株式会社内 Tokyo (JP). 石井 千晶(**ISHII Chiaki**); 〒1038426 東京都中央区日本橋本町三丁目5番1号 第一三共株式会社内 Tokyo (JP). 和田 悌司(**WADA Teiji**); 〒1038426 東京都中央区日本橋本町三丁目5番1号 第一三共株式会社内 Tokyo (JP). 石田 さおり(**ISHIDA Saori**); 〒1038426 東京都中央区日本橋本町三丁目5番1号 第一三共株式会社内 Tokyo (JP). 鎌井 泰樹(**KAMAI Yasuki**); 〒1038426 東

(54) **Title:** COMBINATION OF ANTIBODY-DRUG CONJUGATE AND IMMUNE CHECKPOINT INHIBITOR

(54) 発明の名称: 抗体－薬物コンジュゲートと免疫チェックポイント阻害剤の組み合わせ

[図3]





AA Combination group
BB Antibody-drug conjugate (1) group
CC Anti-PD-1 antibody group
DD Control group

(57) **Abstract:** A pharmaceutical composition and a treatment method, each of which is characterized in that an antibody-drug conjugate and an immune checkpoint inhibitor are administered in combination, wherein the antibody-drug conjugate is formed by bonding a drug linker represented by formula (1) (wherein A represents an antibody-bonding position) to an antibody through a thioether bond; and a pharmaceutical composition and a treatment method, each of which is characterized in that the antibody-drug conjugate is contained and is also characterized by being used for the treatment of a disease that can be ameliorated through an anti-tumor immunity activation effect.

WO 2018/110515 A1

[続葉有]

京都中央区日本橋本町三丁目５番１号 第一三共株式会社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人：石橋 公樹，外(ISHIBASHI Koki et al.); 〒1400005 東京都品川区広町一丁目２番５８号 第一三共株式会社内 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, 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, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, 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)）

(57) 要約：下式（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と、免疫チェックポイント阻害剤が、組み合わされて投与されることを特徴とする、医薬組成物及び治療方法、並びに、該抗体－薬物コンジュゲートを含有する、抗腫瘍免疫を活性化する作用により改善される疾患の治療に用いることを特徴とする医薬組成物及び治療方法。