(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
2022年1月27日(27.01.2022)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2022/019259 A1

(51) 国際特許分類:
A61K 47/68 (2017.01) *A61P 35/02* (2006.01)
A61K 31/4745 (2006.01) *A61P 43/00* (2006.01)
A61K 39/395 (2006.01) *C07K 16/30* (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01) *C12N 15/13* (2006.01)

(21) 国際出願番号： PCT/JP2021/026932

(22) 国際出願日： 2021年7月19日(19.07.2021)

(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 2020-123564 2020年7月20日(20.07.2020) 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: 鎌井 泰樹(**KAMAI Yasuki**); 〒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).

(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).

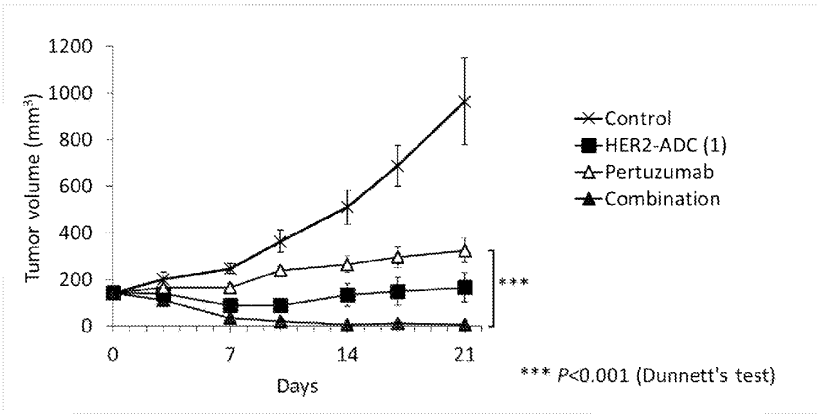
(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, IT, JO, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, 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,

WO 2022/019259 A1

(54) **Title:** COMBINATION OF (ANTI-HER2 ANTIBODY)-DRUG CONJUGATE AND HER DIMERIZATION INHIBITOR

(54) 発明の名称： 抗ＨＥＲ２抗体－薬物コンジュゲートとＨＥＲ二量体化阻害剤の組み合わせ

[図13]



(57) **Abstract:** A pharmaceutical composition characterized in that a combination of an (anti-HER2 antibody)-drug conjugate and a HER dimerization inhibitor is administered, in which the (anti-HER2 antibody)-drug conjugate comprises a drug linker represented by the formula shown below (wherein A represents a binding position to an anti-HER2 antibody) and an anti-HER2 antibody bonded to each other through a thioether bond; and/or a treatment method characterized in that a combination of the (anti-HER2 antibody)-drug conjugate and the HER dimerization inhibitor is administered to an individual.

[続葉有]

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))

(57) 要約:下式(式中、Ａは抗ＨＥＲ２抗体との結合位置を示す)で示される薬物リンカーと抗ＨＥＲ２抗体とがチオエーテル結合によって結合した抗ＨＥＲ２抗体－薬物コンジュゲートと、ＨＥＲ二量体化阻害剤が、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／又は、該抗ＨＥＲ２抗体－薬物コンジュゲートとＨＥＲ二量体化阻害剤が組み合わされて個体に投与されることを特徴とする治療方法。