(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4月12日(12.04.2018)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2018/066626 A1

(51) 国際特許分類:
A61K 39/395 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
A61K 47/68 (2017.01)

(21) 国際出願番号： PCT/JP2017/036215

(22) 国際出願日： 2017年10月5日(05.10.2017)

(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 2016-199341 2016年10月7日(07.10.2016) JP
特願 2017-097589 2017年5月16日(16.05.2017) JP
特願 2017-172814 2017年9月8日(08.09.2017) JP

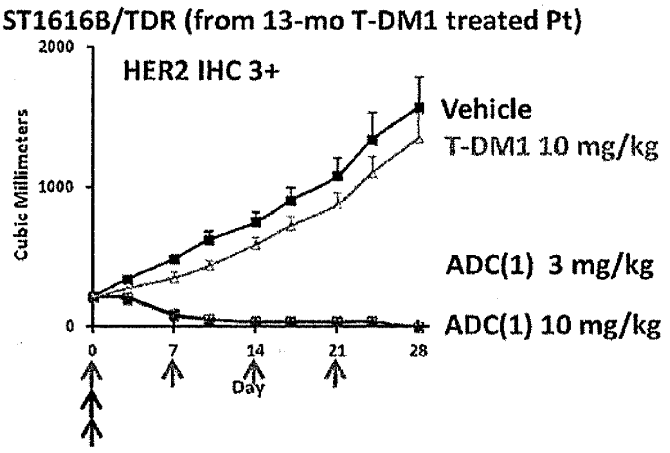
(71) 出願人：第一三共株式会社(**DAIICHI SANKYO COMPANY, LIMITED**) [JP/JP]； 〒1038426 東京都中央区日本橋本町三丁目５番１号 Tokyo (JP).

(72) 発明者：慈幸 貴洋(**JIKOH Takahiro**)； 〒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). 扇谷 祐輔(**OGITANI Yusuke**)； 〒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). 吉原 一孝(**YOSHIHARA Kazutaka**)； 〒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). 遠藤 聖子(**ENDO Seiko**)； 〒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). 藤崎 良彦(**FUJISAKI Yoshihiko**);

(54) **Title:** THERAPY FOR DRUG-RESISTANT CANCER BY ADMINISTRATION OF ANTI-HER2 ANTIBODY/DRUG CONJUGATE

(54) 発明の名称： 抗ＨＥＲ２抗体－薬物コンジュゲート投与による耐性癌の治療

[図3]



(57) **Abstract:** A therapeutic agent and therapeutic method for HER2 expression cancers, which are resistant to or are not easily cured by conventional anti-HER2 drugs, are provided in which use is made of an antibody/drug conjugate comprising a linker and a drug, which are represented by the formula – (Succinimid-3-yl-N)-CH $_2$CH$_2$CH$_2$CH$_2$-C(=O)-GGFG-NH-CH$_2$-O-CH$_2$-C(=O)-(NH-DX), and an anti-HER2 antibody bonded thereto. The therapeutic agent and method are effective against HER2 expression cancers, which are resistant to or are not easily cured by conventional

WO 2018/066626 A1

[続葉有]

〒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：大 野 聖 二，外 (**OHNO Seiji** et al.); 〒1000005 東京都千代田区丸の内一丁目６番５号 丸の内北口ビル２１階 大野総合法律事務所 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, 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)）

anti-HER2 drugs.

(57) 要約：既存の抗HER2薬に対し耐性又は難治性のHER2発現癌に対して有効な治療として、式：-(Succinimid-3-yl-N)-$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2$-C(=O)-GGFG-NH-CH_2-O-CH_2-C(=O)-(NH-DX)で示されるリンカー及び薬物と、抗HER2抗体と、が結合した抗体－薬物コンジュゲートを使用した、既存の抗HER2薬に対し耐性又は難治性のHER2発現癌の治療剤及び治療方法を提供する。