(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
2014 年 10 月 9 日(09.10.2014)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2014/163101 A1

(51) 国際特許分類:
C07K 16/00 (2006.01) *A61P 37/00* (2006.01)
A61K 39/395 (2006.01) *A61P 37/06* (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01) *C07K 19/00* (2006.01)
A61P 31/12 (2006.01) *C12N 15/00* (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2014/059706

(22) 国際出願日: 2014 年 4 月 2 日(02.04.2014)

(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 2013-077239 2013 年 4 月 2 日(02.04.2013) JP

(71) 出願人: 中外製薬株式会社(CHUGAI SEIYAKU KABUSHIKI KAISHA) [JP/JP]; 〒1158543 東京都北区浮間５丁目５番１号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 味元　風太(MIMOTO, Futa); 〒4128513 静岡県御殿場市駒門１丁目１３５番地　中外製薬株式会社内 Shizuoka (JP). 堅田　仁(KATADA, Hitoshi); 〒4128513 静岡県御殿場市駒門１丁目１３５番地　中外製薬株式会社内 Shizuoka (JP). 井川　智之(IGAWA, Tomoyuki); 〒4128513 静岡県御殿場市駒門１丁目１３５番地　中外製薬株式会社内 Shizuoka (JP).

(74) 代理人: 春名　雅夫, 外(HARUNA, Masao et al.); 〒3000847 茨城県土浦市卸町１－１－１　関鉄つくばビル６階 Ibaraki (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, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, 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, 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).

規則 4.17 に規定する申立て:

— 出願し及び特許を与えられる出願人の資格に関する申立て (規則 4.17(ii))

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))

WO 2014/163101 A1

(54) **Title**: FC REGION VARIANT

(54) 発明の名称 : Ｆｃ領域改変体

(57) **Abstract**: It is found that a polypeptide, which contains an antibody Fc region variant that comprises an amino acid sequence composed of a combination of an alteration of an amino acid residue located at position-238 as numbered in accordance with the EU index and an alteration of another specific amino acid residue, has a reduced binding activity to all of active FcγR's, especially to FcγRIIa (type R), compared with polypeptides each containing a naturally occurring IgG Fc region, while maintaining the binding activity thereof to FcγRIIb.

(57) 要約: EU ナンバリング 238 番目のアミノ酸改変と、他の特定のアミノ酸改変が組み合わされているアミノ酸配列を含む抗体 Fc 領域改変体を含むポリペプチドは、天然型 IgG の Fc 領域を含むポリペプチドと比較して、FcγRIIb に対する結合活性を維持しつつ、すべての活性型 FcγR、中でも FcγRIIa(R 型)に対する結合活性を減少することを見出した。