

(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9月10日(10.09.2021)



(10) 国際公開番号

WO 2021/177438 A1

(51) 国際特許分類:

A61K 47/68 (2017.01) A61P 35/02 (2006.01)

A61K 31/7084 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)

A61K 39/395 (2006.01) C07K 16/28 (2006.01)

A61P 35/00 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2021/008635

(22) 国際出願日: 2021年3月5日(05.03.2021)

(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 2020-038983 2020年3月6日(06.03.2020) JP

(71) 出願人: 第一三共株式会社(DAIICHI SANKYO
COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒1038426 東

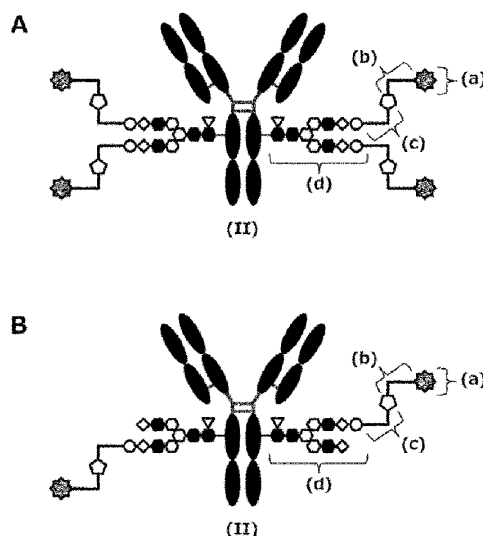
京 都 中 央 区 日 本 橋 本 町 三 丁 目 5 番
1 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 石 崎 雅 之 (ISHIZAKI Masayuki);
〒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). 鈴
木 督(SUZUKI Osamu); 〒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). 久徳 真梨子(KYUTOKU
Mariko); 〒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). 雪浦 弘志(YUKIURA Hiroshi); 〒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). 原 香生子
(HARA Kyoko); 〒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

(54) Title: ANTIBODY-DRUG CONJUGATE INCLUDING NOVEL CYCLIC DINUCLEOTIDE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 新規環状ジヌクレオチド誘導体を含む抗体薬物コンジュゲート

[図1]



(57) Abstract: [Problem] It is desired to develop an antibody-drug conjugate capable of being systemically administered and delivering a STING agonist specifically to a target cells or organ (for example, a tumor lesion), and a therapeutic agent and/or therapeutic method using the antibody-drug conjugate for diseases related to STING agonist activity, for example, diseases (for example, cancers) to which immunostimulation therapy can be applied. [Solution] The present invention provides a novel antibody-CDN derivative conjugate which can be systemically administered and exhibits an antitumor

[続葉有]



WO 2021/177438 A1

Tokyo (JP). 千原 正尚(CHIHARA Masataka);
〒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). 大塚
貴文(OTSUKA Takafumi); 〒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).

(74) 代理人: 特許業務法人川口国際特許事務所
(KAWAGUTI & PARTNERS); 〒1690074 東京
都新宿区北新宿二丁目 2 1 番 1 号新宿フ
ロントタワー 2 0階 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:

- 一 国際調査報告 (条約第21条(3))
- 一 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))

effect against an antigen-expressing tumor.

(57) 要約: 【課題】全身投与が可能であり、かつ、目的とする細胞や臓器(例えば、腫瘍部位)に特異的にS T I N Gアゴニストを送達することができる抗体薬物コンジュゲート及び該抗体薬物コンジュゲートを用いたS T I N Gアゴニスト活性が関連する疾患、例えば、免疫賦活化による治療が可能な疾患(例えば、がん)の治療剤及び／又は治療法の開発が望まれている。【解決手段】本発明により、全身投与することができ、かつ、抗原が発現している腫瘍で抗腫瘍効果を示す、新規抗体C D N誘導体コンジュゲートが提供される。