

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

訂正版

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局

(43) 国際公開日  
2023年6月8日(08.06.2023)



(10) 国際公開番号

WO 2023/100829 A8

(51) 国際特許分類:

C12N 15/62 (2006.01) C07K 7/08 (2006.01)  
A61K 31/4745 (2006.01) C07K 16/18 (2006.01)  
A61K 39/395 (2006.01) C07K 19/00 (2006.01)  
A61K 45/00 (2006.01) C12N 9/64 (2006.01)  
A61K 47/68 (2017.01) C12N 15/13 (2006.01)  
A61P 35/00 (2006.01) C12P 21/02 (2006.01)  
A61P 43/00 (2006.01) C40B 40/10 (2006.01)

特願 2021-194701 2021年11月30日(30.11.2021) 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: 工藤 翔太(KUDO Shota); 〒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). 石塚 幹広(ISHIZUKA Mikihiro); 〒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). 亀井 玲子(KAMEI Reiko); 〒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). 寺内 智子(TERAUCHI Tomoko); 〒1038426 東京都中央区日本橋本町

(21) 国際出願番号: PCT/JP2022/043846

(22) 国際出願日: 2022年11月29日(29.11.2022)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

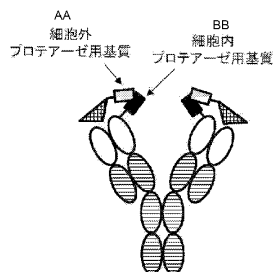
(30) 優先権データ:

(54) Title: PROTEASE-CLEAVABLE MASKED ANTIBODIES

(54) 発明の名称: プロテアーゼ分解性マスク抗体

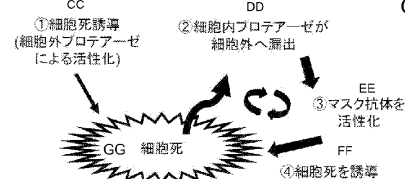
[図1]

A



AA Substrate for extracellular proteases  
BB Substrate for intracellular proteases  
CC Cell death induction (activation by extracellular proteases)  
DD Leakage of intracellular proteases to outside of cell  
EE Activate MuSK antibody  
FF Induce cell death  
GG Cell death

B



(57) Abstract: The present invention provides novel masked antibodies. The present invention provides a molecule which binds to a target antigen, and is characterized by comprising a region that binds to the target antigen, a first peptide that recognizes a binding site for the target antigen in the region, and a second peptide comprising an amino acid sequence that is cleaved by a protease, while being also characterized by having higher binding affinity to the target antigen after the cleavage of the second peptide by the protease in comparison to that before the cleavage.

[続葉有]

三丁目 5 番 1 号 第一三共株式会社内 Tokyo  
(JP). 佐伯 和徳 (SAEKI Kazunori); 〒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: 弁理士法人平木国際特許事務所  
(HIRAKI & ASSOCIATES); 〒1056232 東京都  
港区愛宕二丁目 5 - 1 愛宕グリーンヒルズ  
MOR I タワー 3 2 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, CV, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO,  
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT,  
HN, HR, HU, ID, IL, IN, IQ, IR, IS, IT, JM, JO, JP,  
KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK,  
LR, LS, LU, LY, MA, MD, 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, CV, GH, GM, KE, LR, LS,  
MW, MZ, NA, RW, SC, 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, ME, 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))

(48) この訂正版の公開日:  
2023年10月19日(19.10.2023)

(15) 訂正情報:  
2023年10月19日(19.10.2023) の更新情報  
(Notice) を参照

(57) 要約: 新規なマスク抗体を提供すること。 標的抗原に結合する部分、該部分に含まれる該標的抗原  
結合部位を認識する第1ペプチド、及び、プロテアーゼにより切断されるアミノ酸配列を含む第2ペプ  
チドを含んでなり、該第2ペプチドが該プロテアーゼにより切断された後には、該切断前と比較して、該  
標的抗原に対しより高い結合親和性を有することを特徴とする、該標的抗原に結合する分子。