(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
2020年6月18日(18.06.2020)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2020/122034 A1

(51) 国際特許分類:
A61K 31/4184 (2006.01) *A61K 45/00* (2006.01)
A61K 31/454 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
A61K 31/4745 (2006.01) *A61P 43/00* (2006.01)
A61K 31/502 (2006.01) *C07K 16/28* (2006.01)
A61K 31/5025 (2006.01) *A61K 47/68* (2017.01)
A61K 31/55 (2006.01) *C12N 15/13* (2006.01)

(21) 国際出願番号： PCT/JP2019/048171

(22) 国際出願日： 2019年12月10日(10.12.2019)

(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 2018-231948 2018年12月11日(11.12.2018) JP

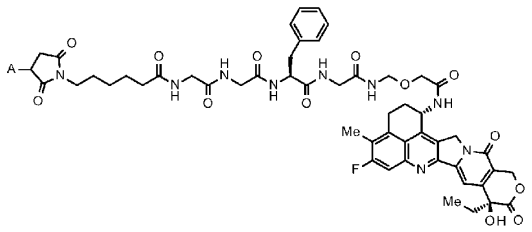
(71) 出願人: 第一三共株式会社(**DAIICHI SANKYO COMPANY, LIMITED**) [JP/JP]; 〒1038426 東京都中央区日本橋本町三丁目５番１号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 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). 岡嶌大祐(**OKAJIMA Daisuke**); 〒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). 橋本 悠里(**HASHIMOTO Yuuri**); 〒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 宏和(**SUZUKI Hirokazu**); 〒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).

(54) **Title:** COMBINATION OF ANTIBODY-DRUG CONJUGATE WITH PARP INHIBITOR

(54) 発明の名称： 抗体－薬物コンジュゲートとＰＡＲＰ阻害剤の組み合わせ



[図1]

記列番号１：抗ＨＥＲ２抗体重鎖のアミノ酸配列 AA

EVQLVESGGGLVQPGGSLRLSCAASGFNIKDTYIHWVR
QAPGKGLEWVARIYPTNGYTRYADSVKGRFTISADTSK
NTAYLQMNSLRAEDTAVYYCSRWGGDGFYAMDYWGQGT
LVTVSSASTKGPSVFPLAPSSKSTSGGTAALGCLVKDY
FPEPVTVSWNSGALTSGVHTFPAVLQSSGLYSLSSVVT
VPSSSLGTQTYICNVNHKPSNTKVDKKVEPKSCDKTHT
CPPCPAPELLGGPSVFLFPPKPKDTLMISRTPEVTCVV
VDVSHEDPEVKFNWYVDGVEVHNAKTKPREEQYNSTYR
VVSVLTVLHQDWLNGKEYKCKVSNKALPAPIEKTISKA
KGQPREPQVYTLPPSREEMTKNQVSLTCLVKGFYPSDI
AVEWESNGQPENNYKTTPPVLDSDGSFFLYSKLTVDKS
RWQQGNVFSCSVMHEALHNHYTQKSLSLSPGK

AA Sequence identification number 1: amino acid sequence of anti-HER2 antibody heavy chain

(57) **Abstract:** A pharmaceutical composition characterized in that an antibody-drug conjugate, in which a drug linker represented by the formula (wherein A represents an antibody binding site) is bonded to an antibody via a thioether bond, is combined with a PARP inhibitor and administered, and/or a therapeutic method characterized in that the antibody-drug conjugate is combined with a PARP inhibitor and administered to an individual.

WO 2020/122034 A1

［続葉有］

(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))

(57) 要約: 下式 (式中、Ａは抗体との結合位置を示す) で示される薬物リンカーと抗体とがチオエーテル結合によって結合した抗体－薬物コンジュゲートと、ＰＡＲＰ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、該抗体－薬物コンジュゲートとＰＡＲＰ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。