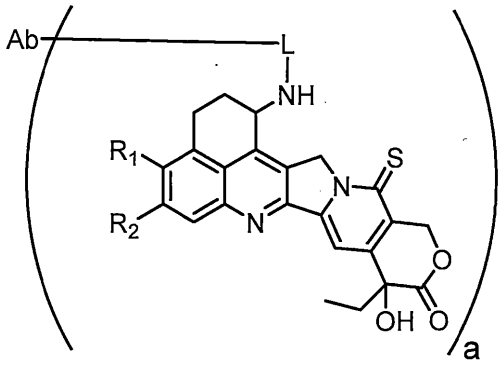
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和7年2月19日(2025.2.19)

【国際公開番号】WO2022/262789
【公表番号】特表2024-523422(P2024-523422A)
【公表日】令和6年6月28日(2024.6.28)
【年通号数】公開公報(特許)2024-120
【出願番号】特願2023-578035(P2023-578035)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ 47/68(2017.01)
Ｃ０７Ｄ491/22(2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00(2006.01)
Ａ６１Ｋ 39/395(2006.01)
Ｃ０７Ｋ 16/00(2006.01)
Ｃ０７Ｋ 16/28(2006.01)
Ｃ０７Ｋ 7/06(2006.01)
Ｃ１２Ｎ 15/13(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ 47/68
Ｃ０７Ｄ491/22 ＣＳＰ
Ａ６１Ｐ 35/00
Ａ６１Ｋ 39/395 Ｔ
Ｃ０７Ｋ 16/00 ＺＮＡ
Ｃ０７Ｋ 16/28
Ｃ０７Ｋ 7/06
Ｃ１２Ｎ 15/13

【手続補正書】
【提出日】令和7年2月10日(2025.2.10)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
リガンドコンジュゲートまたはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物であって、
前記リガンドコンジュゲートは、式（Ｉ）に示される構造を含み、

【化１】

式（Ｉ）：



ここで、R_1およびR_2は、それぞれ独立して、水素原子、重水素原子、ハロゲン、任意選択で置換されたC_1－C_8アルキル基、任意選択で置換されたC_1－C_8ハロアルキル基および任意選択で置換されたC_1－C_8重水素化アルキル基からなる群から選択されるか、

または、R_1およびR_2は、それらが結合している炭素原子と一緒になって、任意選択で置換された脂環式基、任意選択で置換された脂肪族複素環基、任意選択で置換されたアリール基および任意選択で置換されたヘテロアリール基からなる群から選択される構造を形成し、

Ｌは、任意選択で置換されたリンカーであり、

Ａｂは、リガンドであり、ａは、０よりも大きい数値であり、ａは、小数または整数であることを特徴とする、前記リガンドコンジュゲートまたはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。

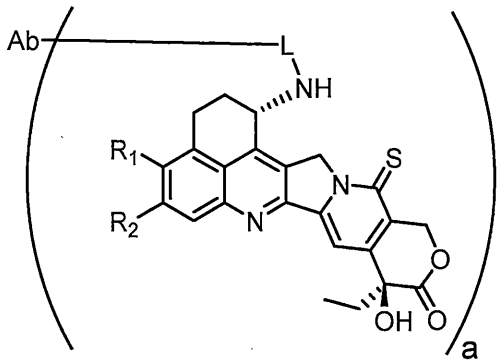
【請求項２】

請求項１に記載のリガンドコンジュゲートまたはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物であって、

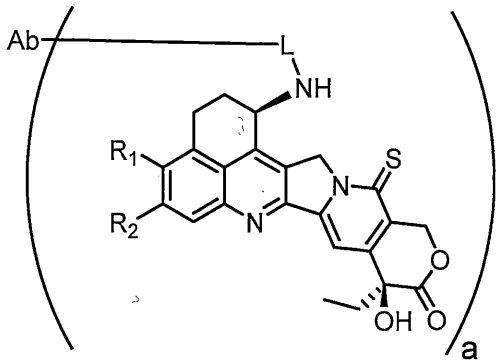
前記リガンドコンジュゲートは、式（Ｉ－ａ）または式（Ｉ－ｂ）に示される構造を含み、

【化２】

式（Ｉ－ａ）：



式（Ｉ－ｂ）：



ここで、Ｒ$_1$およびＲ$_2$は、それぞれ独立して、水素原子、重水素原子、ハロゲン、任意選択で置換されたＣ$_1$－Ｃ$_8$アルキル基、任意選択で置換されたＣ$_1$－Ｃ$_8$ハロアルキル基および任意選択で置換されたＣ$_1$－Ｃ$_8$重水素化アルキル基からなる群から選択されるか、

または、Ｒ$_1$およびＲ$_2$は、それらが結合している炭素原子と一緒になって、任意選択で置換された脂環式基、任意選択で置換された脂肪族複素環基、任意選択で置換されたアリール基および任意選択で置換されたヘテロアリール基からなる群から選択される構造を形成し、

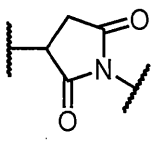
Ｌは、任意選択で置換されたリンカーであり、かつＬは、リンカー－Ｌ$_1$－Ｌ$_2$－Ｌ$_3$－Ｌ$_4$－Ｌ$_5$－であり、

Ａｂは、リガンドであり、ａは、０よりも大きい数値であり、ａは、小数または整数であることを特徴とする、前記リガンドコンジュゲートまたはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。

【請求項３】

前記Ｌ$_1$は、任意選択で置換された

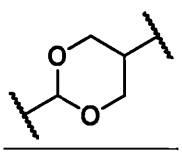
【化３】



であり、前記Ｌ$_1$は、前記Ａｂに直接連結されることを特徴とする

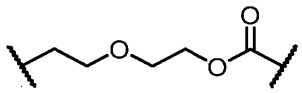
請求項２に記載のリガンドコンジュゲートまたはその互変異性体、メソマー、ラセミ体

、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。
【請求項４】
前記L_2は、任意選択で置換された－（CH_2）$_{m1}$－X_1－（CH_2）$_{m2}$－Ｃ（Ｏ）－、任意選択で置換された－（CH_2CH_2O）$_n$－Ｃ（Ｏ）－および任意選択で置換された－（CH_2）$_p$－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択される基であり、
X_1は、－Ｏ－、任意選択で置換された－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、任意選択で置換されたアリール基、任意選択で置換されたヘテロアリール基、任意選択で置換されたヘテロ脂環式基および任意選択で置換された脂環式基からなる群から選択され、
ここで、ｍ１、ｍ２およびｎは、それぞれ独立して、少なくとも０である整数から選択され、ｐは、２～８の整数から選択されることを特徴とする
請求項２または３に記載のリガンドコンジュゲートまたはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。
【請求項５】
前記L_2は、任意選択で置換された－（CH_2CH_2O）$_n$－Ｃ（Ｏ）－、任意選択で置換された－（CH_2）$_{m1}$－X_1－（CH_2）$_{m2}$－Ｃ（Ｏ）－、および任意選択で置換された－（CH_2）$_p$－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され、
好ましくは、ｎは２であり、
X_1は、－Ｏ－および任意選択で置換された－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－からなる群から選択され、
ｍ１は、好ましくは２であり、
好ましくは、ｍ２は、２であり、
あるいは、X_1は、任意選択で置換されたアリール基および任意選択で置換されたヘテロアリール基からなる群から選択され、
好ましくは、X_1は、任意選択で置換されたフェニル基または任意選択で置換されたピリジル基であり、
好ましくは、ｍ１は、０であり、
および／または、ｍ２は、１であり、
あるいは、X_1は、任意選択で置換された
【化４】



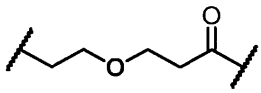
または任意選択で置換されたシクロヘキシル基であり、
好ましくは、ｍ１は、１であり、
および／または、ｍ２は、０であり、
好ましくは、ｐは、５であることを特徴とする
請求項２または３に記載のリガンドコンジュゲートまたはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。
【請求項６】
前記L_2は、任意選択で置換された

【化５】



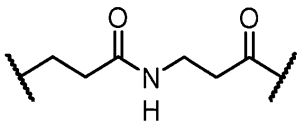
、任意選択で置換された

【化６】



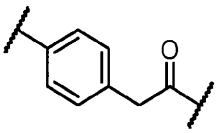
、任意選択で置換された

【化７】



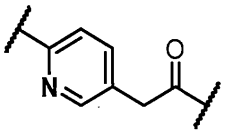
、任意選択で置換された

【化８】



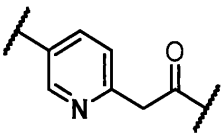
、任意選択で置換された

【化９】



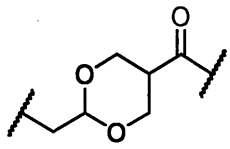
、任意選択で置換された

【化１０】

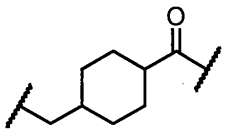


、任意選択で置換された

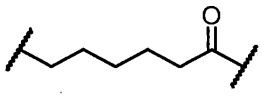
【化１１】



、任意選択で置換された
【化１２】

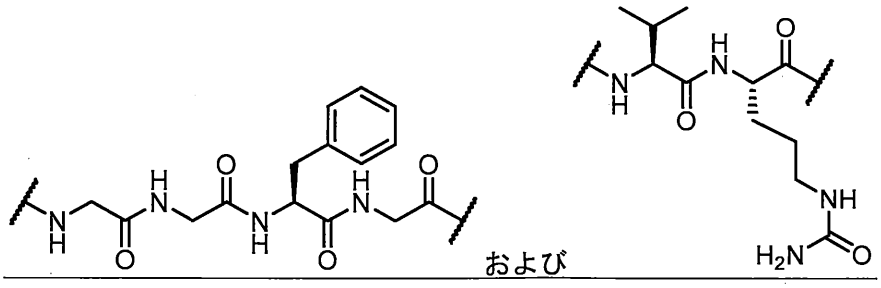


および任意選択で置換された
【化１３】



からなる群から選択される構造であることを特徴とする
請求項２または３に記載のリガンドコンジュゲートまたはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。
【請求項７】
前記Ｌ$_3$は、ペプチド残基であり、
好ましくは、前記Ｌ$_3$は、フェニルアラニン、イソロイシン、ロイシン、トリプトファン、バリン、メチオニン、チロシン、アラニン、スレオニン、ヒスチジン、セリン、グルタミン、アルギニン、リジン、アスパラギン、グルタミン酸、プロリン、シトルリン、アスパラギン酸およびグリシンからなる群から選択されるアミノ酸から構成されるペプチド残基であり、
より好ましくは、前記Ｌ$_3$は、グリシン、フェニルアラニン、バリンおよびシトルリンからなる群から選択されるアミノ酸から構成されるペプチド残基であり、
最も好ましくは、前記Ｌ$_3$は、－グリシン－フェニルアラニン－グリシン－（－Ｇｌｙ－Ｐｈｅ－Ｇｌｙ－）、－グリシン－グリシン－フェニルアラニン－グリシン－（－Ｇｌｙ－Ｇｌｙ－Ｐｈｅ－Ｇｌｙ－）および－バリン－シトルリン－（－Ｖａｌ－Ｃｉｔ－）からなる群から選択されるペプチド残基であり、
最も好ましくは、前記Ｌ$_3$は、

【化１４】



からなる群から選択される構造であることを特徴とする

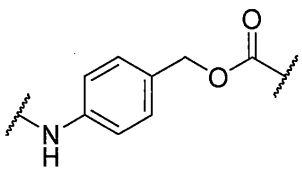
請求項２または３に記載のリガンドコンジュゲートまたはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。

【請求項８】

前記Ｌ$_4$は、任意選択で置換された－Ｌ$_{4a}$－ＮＲ$_4$－ＣＨ$_2$－Ｌ$_{4b}$－であり、

好ましくは、Ｌ$_{4a}$は、存在しないか、またはＬ$_{4a}$は、任意選択で置換された

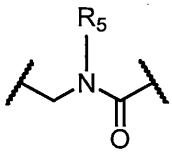
【化１５】



であり、

Ｌ$_{4b}$は、存在しないか、またはＬ$_{4b}$は、任意選択で置換された

【化１６】

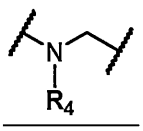


であり、

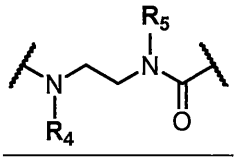
ＲおよびＲ$_5$は、それぞれ独立して、水素および任意選択で置換されたアルキル基（好ましくは、水素および任意選択で置換されたメチル基）からなる群から選択され、

好ましくは、前記Ｌ$_4$は、

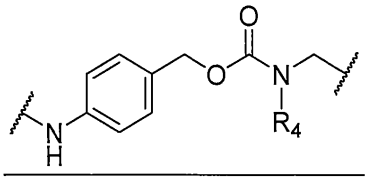
【化１７】



【化１８】

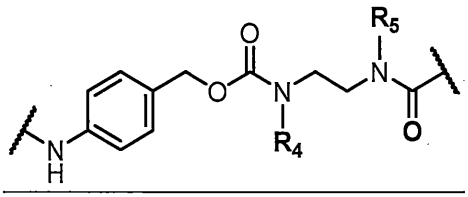


【化１９】



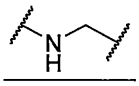
および

【化２０】



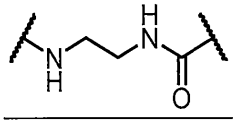
からなる群から選択される任意選択で置換された基であり、
より好ましくは、前記L_4は、任意選択で置換された

【化２１】



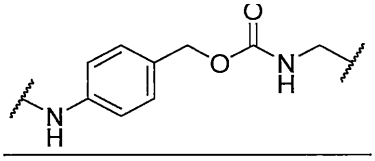
、任意選択で置換された

【化２２】



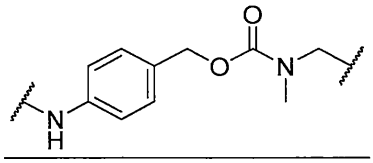
、任意選択で置換された

【化２３】



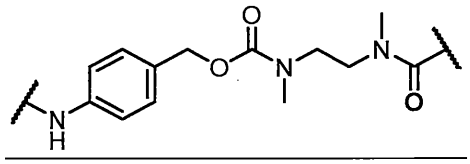
、任意選択で置換された

【化２４】



および任意選択で置換された

【化２５】



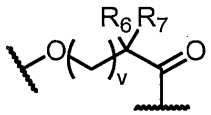
からなる群から選択される構造であることを特徴とする

請求項２または３に記載のリガンドコンジュゲートまたはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。

【請求項９】

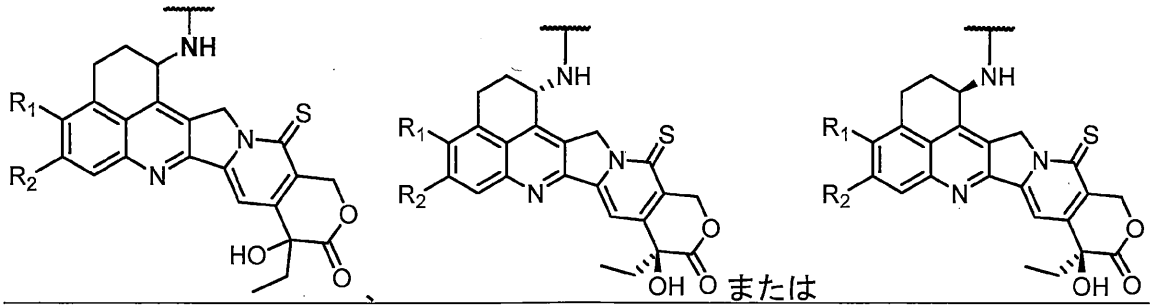
前記Ｌ$_5$は、任意選択で置換された

【化２６】



であり、前記Ｌ$_5$は、

【化２７】



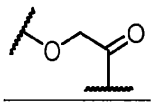
の式の構造に直接連結され、

Ｒ$_6$およびＲ$_7$は、それぞれ独立して、水素、重水素、任意選択で置換されたアルキル基、任意選択で置換されたハロアルキル基、任意選択で置換されたシクロアルキル基および任意選択で置換されたシクロアルキルアルキル基からなる群から選択されるか、またはＲ$_6$およびＲ$_7$は、それらが結合している原子と一緒になって、任意選択で置換されたシクロアルキル基を形成し、

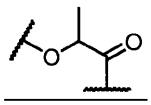
ここで、ｖは、少なくとも０であり、好ましくは０または１であり、

好ましくは、Ｒ$_6$は、水素または任意選択で置換されたメチル基（例えば、メチル基）、フッ素によって置換されたメチル基（例えば、トリフルオロメチル基）、任意選択で置換されたシクロアルキル基（例えば、シクロプロピル基）からなる群から選択され、および

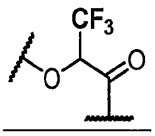
／または
R_7は、水素であり
またはR_6およびR_7は、それらが結合している原子と一緒になって、任意選択で置換されたシクロプロピル基または任意選択で置換されたシクロブチル基を形成し、
より好ましくは、前記L_5は、任意選択で置換された
【化２８】



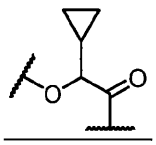
、任意選択で置換された
【化２９】



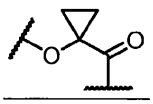
、任意選択で置換された
【化３０】



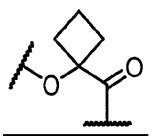
、任意選択で置換された
【化３１】



、任意選択で置換された
【化３２】

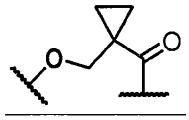


、任意選択で置換された
【化３３】



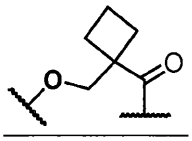
、任意選択で置換された

【化３４】



および任意選択で置換された

【化３５】



からなる群から選択される構造であることを特徴とする

請求項２または３に記載のリガンドコンジュゲートまたはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。

【請求項１０】

前記Ａｂは、抗体またはその抗原結合断片であり、

好ましくは、前記抗体は、マウス抗体、キメラ抗体、ヒト化抗体および完全ヒト抗体からなる群から選択され、

好ましくは、前記抗体は、モノクローナル抗体であり、

好ましくは、前記抗原結合断片は、Ｆａｂ、Ｆａｂ’、Ｆｖ断片、Ｆ（ａｂ’）$_2$、Ｆ（ａｂ）$_2$、ｓｃＦｖ、ｄｉ－ｓｃＦｖ、ＶＨＨおよびｄＡｂからなる群から選択されることを特徴とする

請求項１～３のいずれか１項に記載のリガンドコンジュゲートまたはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。

【請求項１１】

前記Ａｂは、ＨＥＲ２抗体および／またはＴＲＯＰ２抗体を含むことを特徴とする

請求項１～３のいずれか１項に記載のリガンドコンジュゲートまたはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。

【請求項１２】

前記Ａｂは、重鎖可変領域のＨＣＤＲ１、ＨＣＤＲ２およびＨＣＤＲ３を含み、前記ＨＣＤＲ１、ＨＣＤＲ２およびＨＣＤＲ３は、（１）または（２）に定義され、

（１）前記ＨＣＤＲ１のアミノ酸配列は、ＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：１に示されたとおりであり、前記ＨＣＤＲ２のアミノ酸配列は、ＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：２に示されたとおりであり、前記ＨＣＤＲ３のアミノ酸配列は、ＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：３に示されたとおりである、および／または

（２）前記ＨＣＤＲ１のアミノ酸配列は、ＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：１１に示されたとおりであり、前記ＨＣＤＲ２のアミノ酸配列は、ＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：１２に示されたとおりであり、前記ＨＣＤＲ３のアミノ酸配列は、ＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：１３に示されたとおりである、

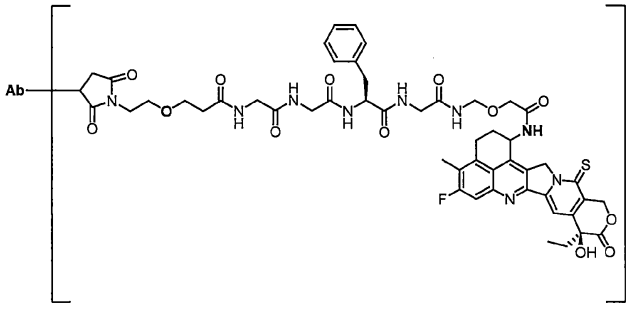
前記Ａｂは、軽鎖可変領域のＬＣＤＲ１、ＬＣＤＲ２およびＬＣＤＲ３を含み、前記ＬＣＤＲ１、ＬＣＤＲ２およびＬＣＤＲ３は、（ｉ）または（ｉｉ）に定義され、

（ｉ）前記ＬＣＤＲ１のアミノ酸配列は、ＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：４に示されたとおりであり、前記ＬＣＤＲ２のアミノ酸配列は、ＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：５に示されたとおりであり、前記ＬＣＤＲ３のアミノ酸配列は、ＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：６に示されたとおりである、

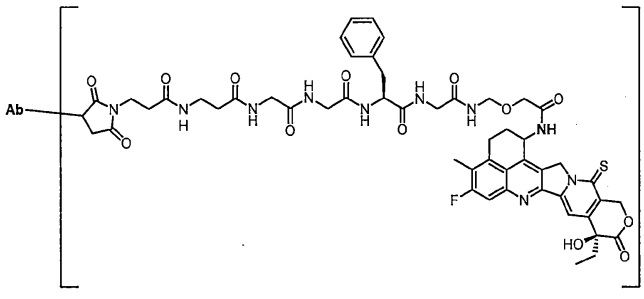
および／または
（ｉｉ）前記ＬＣＤＲ１のアミノ酸配列は、ＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：１４に示されたとおりであり、前記ＬＣＤＲ２のアミノ酸配列は、ＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：１５に示されたとおりであり、前記ＬＣＤＲ３のアミノ酸配列は、ＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：１６に示されたとおりである、
好ましくは、前記Ａｂは、重鎖可変領域を含み、前記重鎖可変領域のアミノ酸配列は、ＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：７、ＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：９、ＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：１７およびＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：１９からなる群から選択されるいずれかの配列に示されたとおりであり、および／または
前記Ａｂは、軽鎖可変領域を含み、前記軽鎖可変領域のアミノ酸配列は、ＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：８、ＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：１０、ＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：１８およびＳＥＱ　ＩＤ　ＮＯ：２０からなる群から選択されるいずれかの配列に示されたとおりであることを特徴とする
　請求項１～３のいずれか１項に記載のリガンドコンジュゲートまたはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。
【請求項１３】
前記リガンドコンジュゲートは、

【化３６】

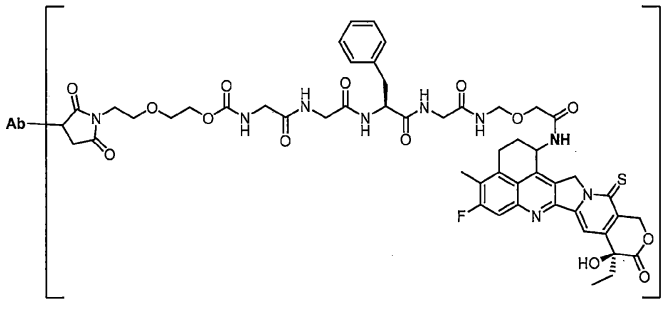
式（Ｉ－１）：



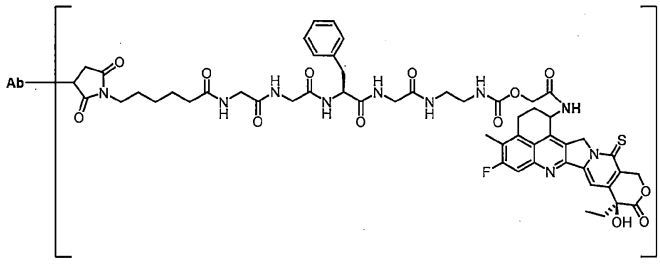
式（Ｉ－２）：



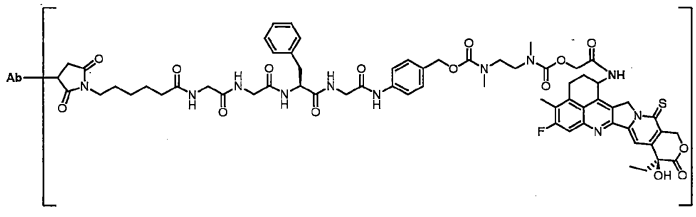
式（Ｉ－３）：



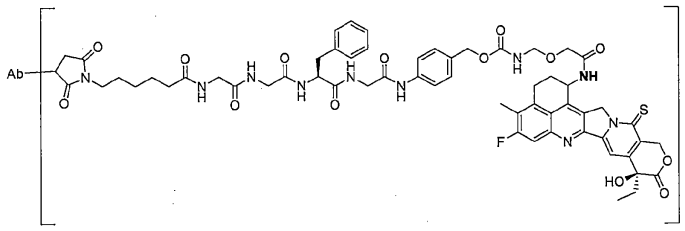
式（Ｉ－４）：



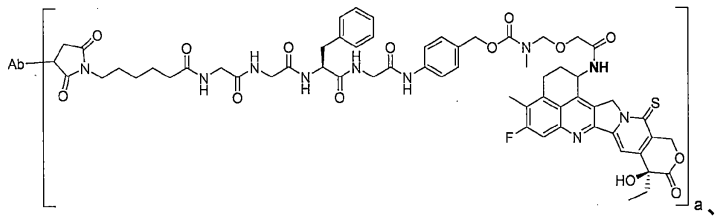
式（Ｉ－５）：



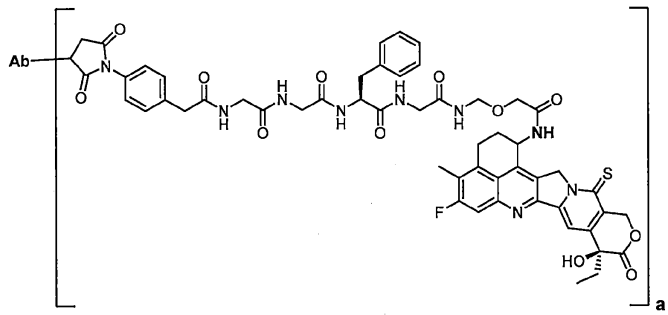
式（Ｉ－６）：



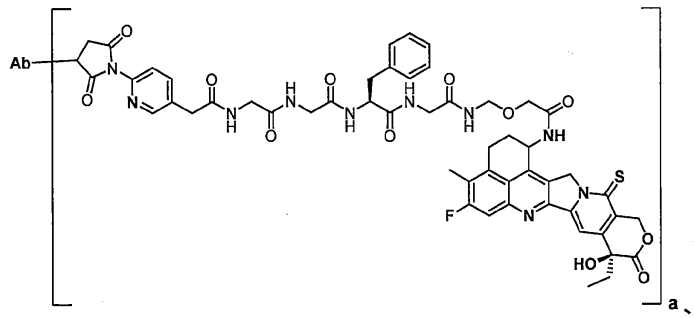
式（Ｉ－７）：



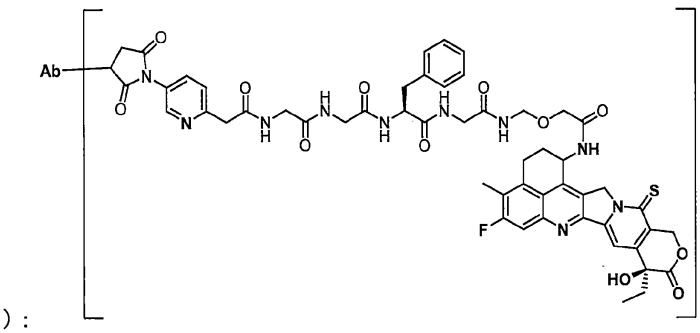
式（Ｉ－８）：



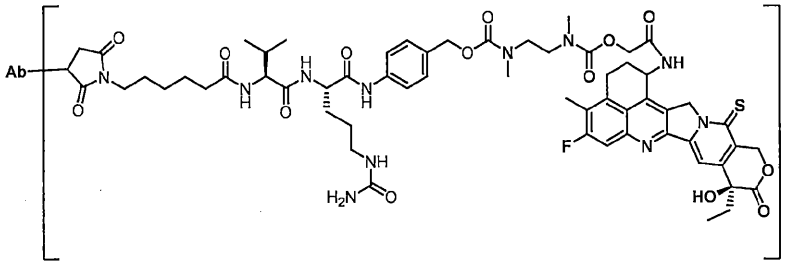
式（Ｉ－９）：



式（Ｉ－１０）：

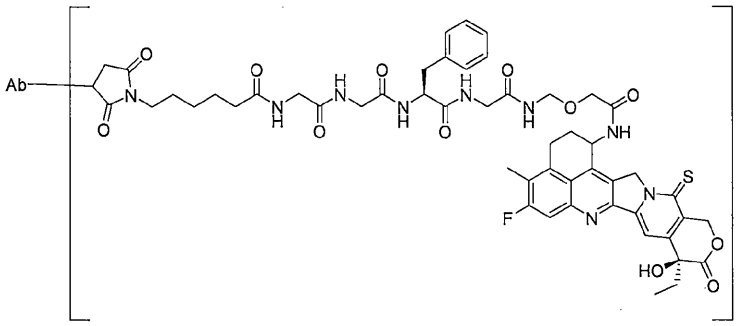


式（Ｉ－１１）：



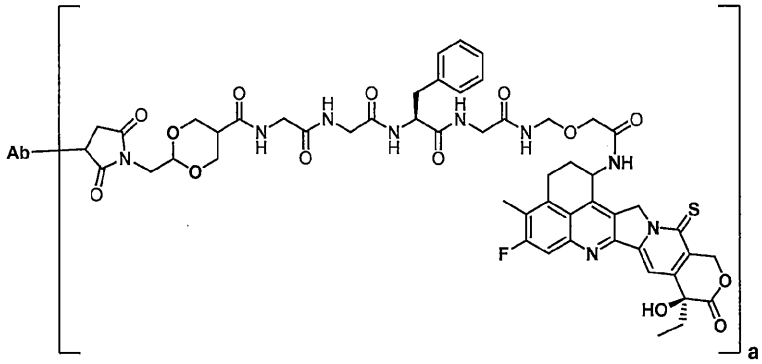
、

式（Ｉ－１２）：



および

式（Ｉ－１３）：



からなる群から選択される構造であり、

ここで、Ａｂは、リガンドであり、ａは、０より大きい数であり、ａは、小数または整数であることを特徴とする、請求項１～３のいずれか１項に記載のリガンドコンジュゲートまたはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。

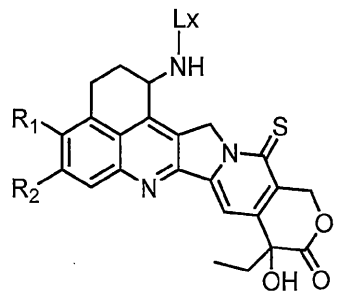
【請求項１４】

化合物またはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物であって、

前記化合物は、式（ＩＩ）に示される構造を含み、

【化３７】

式（ＩＩ）：



ここで、

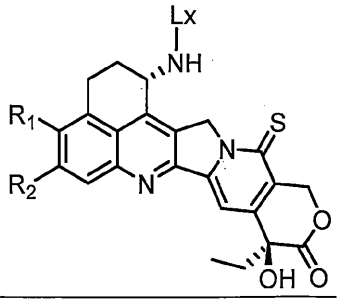
R_1およびR_2は、それぞれ独立して、水素原子、重水素原子、ハロゲン、任意選択で置換されたC_1-C_8アルキル基、任意選択で置換されたC_1-C_8ハロアルキル基および任意選択で置換されたC_1-C_8重水素化アルキル基からなる群から選択されるか、

または、R_1およびR_2は、それらが結合している炭素原子と一緒になって、任意選択で置換された脂環式基、任意選択で置換された脂肪族複素環基、任意選択で置換されたアリール基および任意選択で置換されたヘテロアリール基からなる群から選択される構造を形成し、

Lxは、連結基であり、前記Lxは、$L_{1x}-L_2-L_3-L_4-L_5-$であり、前記L_{1x}は、リガンドに直接連結されることができ、

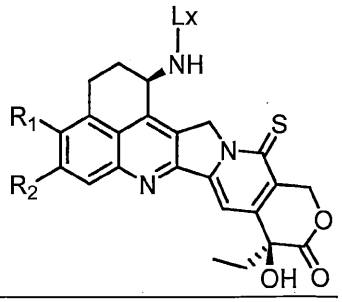
好ましくは、前記化合物は、式（ＩＩ－ａ）または式（ＩＩ－ｂ）に示される構造を含む

【化３８】



式（ＩＩ－ａ）：

【化３９】



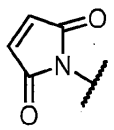
式（ＩＩ－ｂ）：

ことを特徴とする、前記化合物またはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。

【請求項１５】

前記L_{1x}は、任意選択で置換された

【化４０】



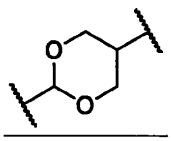
であることを特徴とする

請求項１４に記載の化合物またはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。

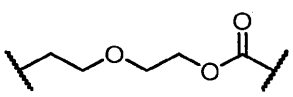
【請求項１６】

前記L_2は、任意選択で置換された$-(CH_2)_{m1}-X_1-(CH_2)_{m2}-C(O)$

－、任意選択で置換された－（ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$Ｏ）$_n$－Ｃ（Ｏ）－および任意選択で置換された－（ＣＨ$_2$）$_p$－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択される基を含み、
ここで、Ｘ$_1$は、－Ｏ－、任意選択で置換された－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－、任意選択で置換されたアリール基、任意選択で置換されたヘテロアリール基、任意選択で置換されたヘテロ脂環式基および任意選択で置換された脂環式基からなる群から選択され、
ｍ１、ｍ２およびｎは、それぞれ独立して、少なくとも０である整数から選択され、ｐは、２～８の整数から選択されることを特徴とする
請求項１４または１５に記載の化合物またはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。
【請求項１７】
前記Ｌ$_2$は、任意選択で置換された－（ＣＨ$_2$ＣＨ$_2$Ｏ）$_n$－Ｃ（Ｏ）－、－（ＣＨ$_2$）$_{m1}$－Ｘ$_1$－（ＣＨ$_2$）$_{m2}$－Ｃ（Ｏ）－、または－（ＣＨ$_2$）$_p$－Ｘ$_1$－Ｃ（Ｏ）－であり、
好ましくは、ｎは、２であり、
Ｘ$_1$は、－Ｏ－および任意選択で置換された－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－からなる群から選択され、
好ましくは、ｍ１は、２であり、
より好ましくは、ｍ２は、２であり、
あるいは、Ｘ$_1$は、任意選択で置換されたアリール基（好ましくは、任意選択で置換されたフェニル基）および任意選択で置換されたヘテロアリール基（好ましくは、任意選択で置換されたピリジル基）からなる群から選択され、
好ましくは、ｍ１は、０であり、
より好ましくは、ｍ２は、１であり、
あるいは、Ｘ$_1$は、任意選択で置換された
【化４１】

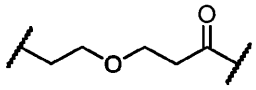


または任意選択で置換されたシクロヘキシル基であり、
好ましくは、ｍ１は、１であり、
より好ましくは、ｍ２は、０であり、
好ましくは、ｐは、５であることを特徴とする
請求項１４または１５に記載の化合物またはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。
【請求項１８】
前記Ｌ$_2$は、任意選択で置換された
【化４２】

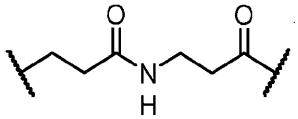


、任意選択で置換された

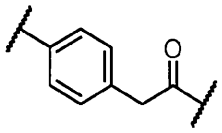
【化４３】



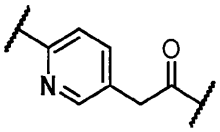
、任意選択で置換された
【化４４】



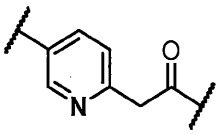
、任意選択で置換された
【化４５】



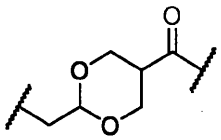
、任意選択で置換された
【化４６】



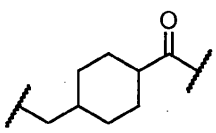
、任意選択で置換された
【化４７】



、任意選択で置換された
【化４８】

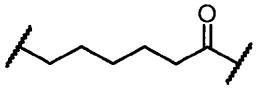


、任意選択で置換された
【化４９】



および任意選択で置換された

【化５０】



の構造から選択されることを特徴とする

請求項１４または１５に記載の化合物またはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。

【請求項１９】

前記Ｌ$_3$は、ペプチド残基であり、

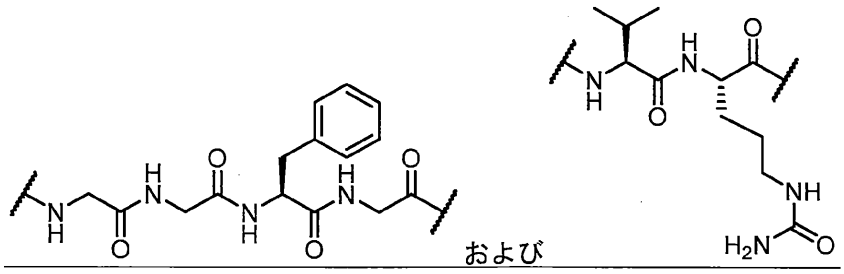
好ましくは、前記Ｌ$_3$は、フェニルアラニン、イソロイシン、ロイシン、トリプトファン、バリン、メチオニン、チロシン、アラニン、スレオニン、ヒスチジン、セリン、グルタミン、アルギニン、リジン、アスパラギン、グルタミン酸、プロリン、シトルリン、アスパラギン酸およびグリシンからなる群から選択されるアミノ酸から構成されるペプチド残基であり、

より好ましくは、前記Ｌ$_3$は、グリシン、フェニルアラニン、バリンおよびシトルリンからなる群から選択されるアミノ酸から構成されるペプチド残基であり、

最も好ましくは、前記Ｌ$_3$は、－グリシン－フェニルアラニン－グリシン－（－Ｇｌｙ－Ｐｈｅ－Ｇｌｙ－）、－グリシン－グリシン－フェニルアラニン－グリシン－（－Ｇｌｙ－Ｇｌｙ－Ｐｈｅ－Ｇｌｙ－）および－バリン－シトルリン－（－Ｖａｌ－Ｃｉｔ－）からなる群から選択されるペプチド残基であり、

最も好ましくは、前記Ｌ$_3$は、

【化５１】



からなる群から選択される構造であることを特徴とする

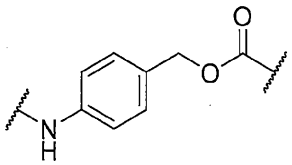
請求項１４または１５に記載の化合物またはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。

【請求項２０】

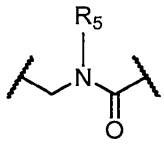
前記Ｌ$_4$は、任意選択で置換された－Ｌ$_{4a}$－ＮＲ$_4$－ＣＨ$_2$－Ｌ$_{4b}$－であり、

好ましくは、Ｌ$_{4a}$は、存在しないか、またはＬ$_{4a}$は、任意選択で置換された

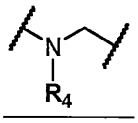
【化５２】



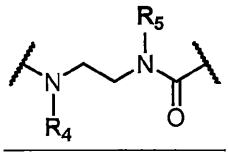
であり、
Ｌ４ｂは、存在しないか、またはＬ４ｂは、任意選択で置換された
【化５３】



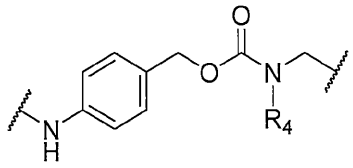
であり、
Ｒ４およびＲ５は、それぞれ独立して、水素および任意選択で置換されたアルキル基（好ましくは、水素または任意選択で置換されたメチル基）からなる群から選択され、
好ましくは、前記Ｌ４は、
【化５４】



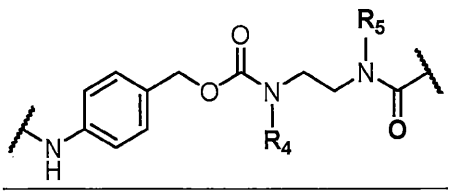
【化５５】



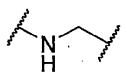
【化５６】



【化５７】

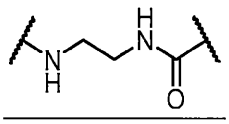


からなる群から選択される任意選択で置換された基であり、
より好ましくは、前記Ｌ４は、任意選択で置換された
【化５８】



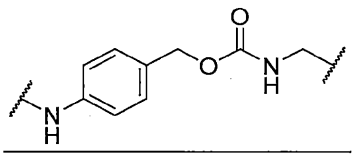
、任意選択で置換された

【化５９】



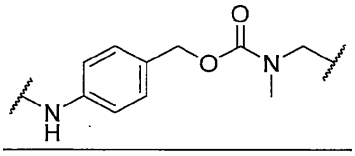
、任意選択で置換された

【化６０】



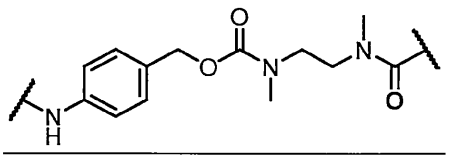
、任意選択で置換された

【化６１】



および任意選択で置換された

【化６２】



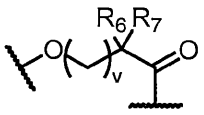
からなる群から選択される構造であることを特徴とする

請求項１４または１５に記載の化合物またはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。

【請求項２１】

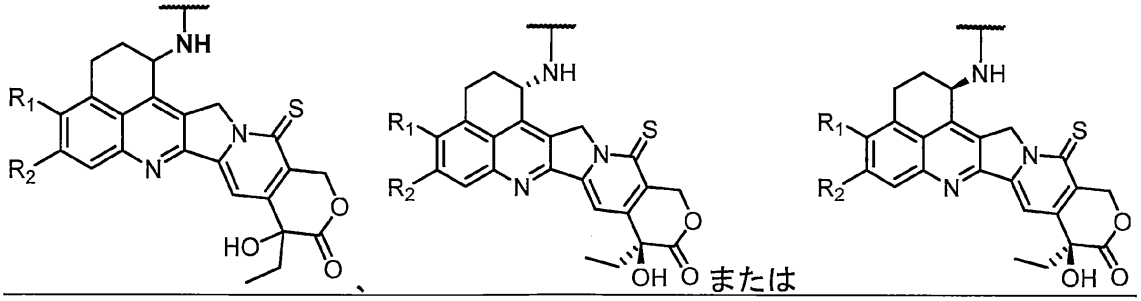
前記L_5は、任意選択で置換された

【化６３】



であり、前記L_5は、

【化６４】



の式の構造に直接連結され、

Ｒ$_6$およびＲ$_7$は、それぞれ独立して、水素、重水素、任意選択で置換されたアルキル基、任意選択で置換されたハロアルキル基、任意選択で置換されたシクロアルキル基および任意選択で置換されたシクロアルキルアルキル基からなる群から選択されるか、またはＲ$_6$およびＲ$_7$は、それらが結合している原子と一緒になって、任意選択で置換されたシクロアルキル基を形成し、

ここで、ｖは、少なくとも０であり、好ましくは、０または１であり、

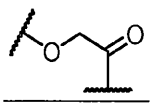
好ましくは、前記Ｒ$_6$は、水素、任意選択で置換されたメチル基、フッ素によって置換されたメチル基、トリフルオロメチル基、任意選択で置換されたシクロアルキル基（例えば、シクロプロピル基）からなる群から選択され、

および／または前記Ｒ$_7$は、水素であり、

または、Ｒ$_6$およびＲ$_7$は、それらが結合している原子と一緒になって、任意選択で置換されたシクロプロピル基、または任意選択で置換されたシクロブチル基からなる群から選択される基を形成し、

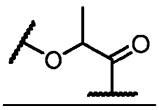
より好ましくは、前記Ｌ$_5$は、任意選択で置換された

【化６５】



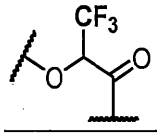
、任意選択で置換された

【化６６】



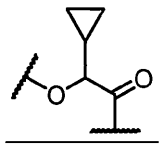
、任意選択で置換された

【化６７】



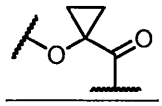
、任意選択で置換された

【化６８】



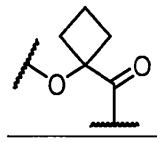
、任意選択で置換された

【化６９】



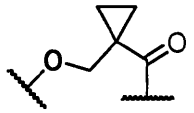
、任意選択で置換された

【化７０】



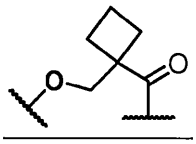
、任意選択で置換された

【化７１】



および任意選択で置換された

【化７２】



からなる群から選択される構造であることを特徴とする

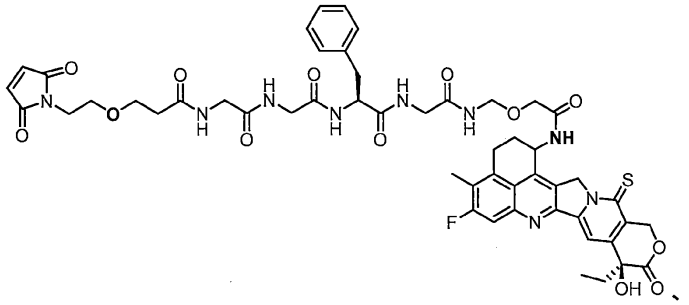
請求項１４または１５に記載の化合物またはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。

【請求項２２】

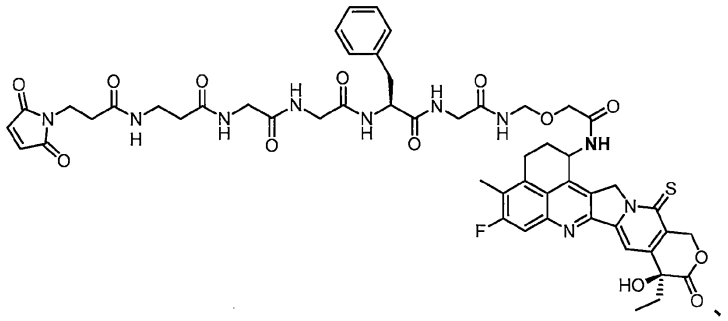
前記化合物は、

【化７３】

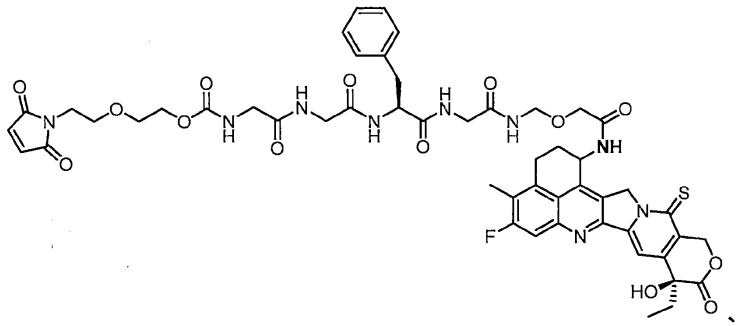
式（ＩＩ－１）：



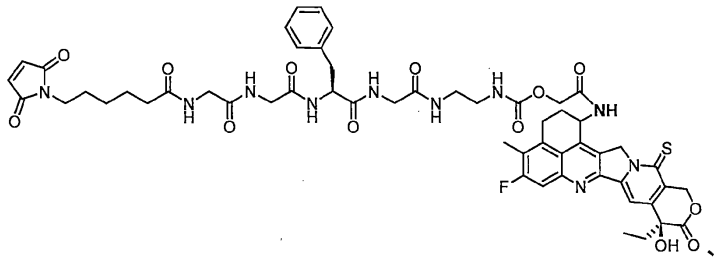
式（ＩＩ－２）：



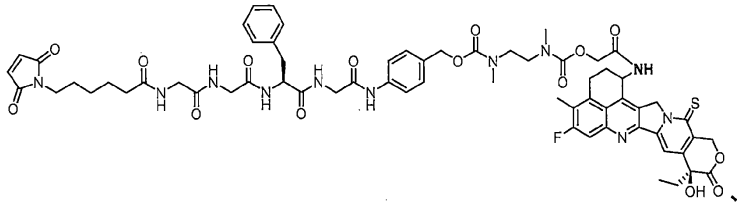
式（ＩＩ－３）：



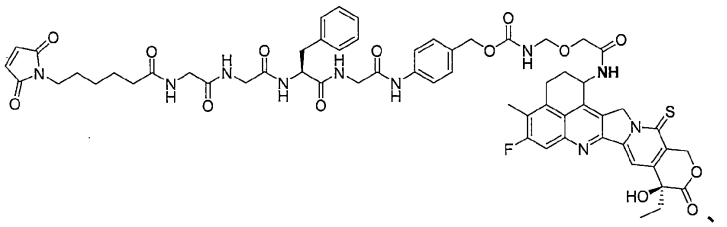
式（ＩＩ－４）：



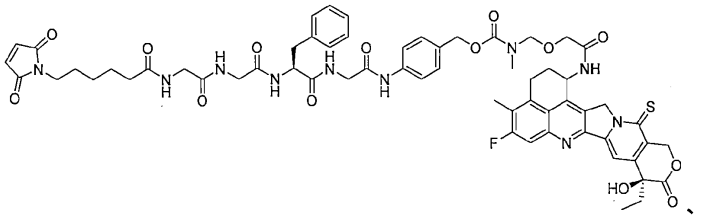
式（ＩＩ－５）：



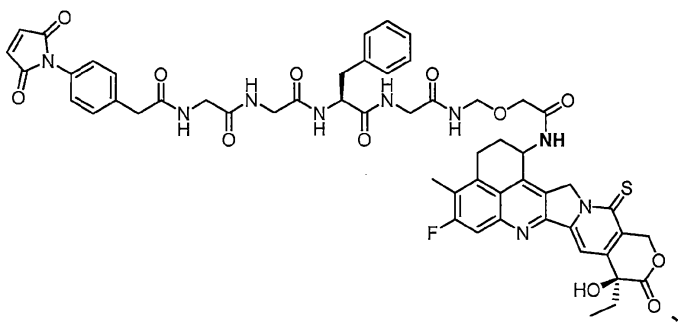
式（ＩＩ－６）：



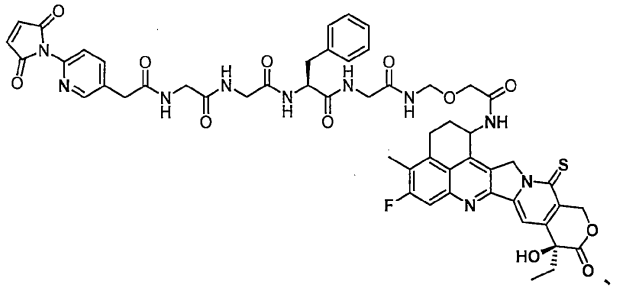
式（ＩＩ－７）：



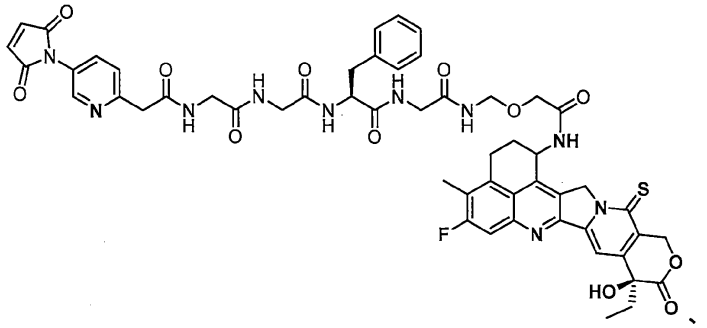
式（ＩＩ－８）：

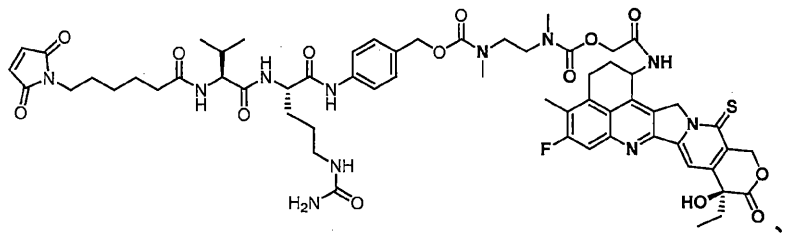


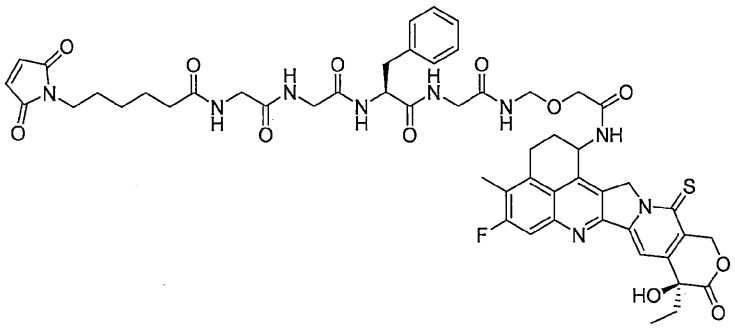
式（ＩＩ－９）：

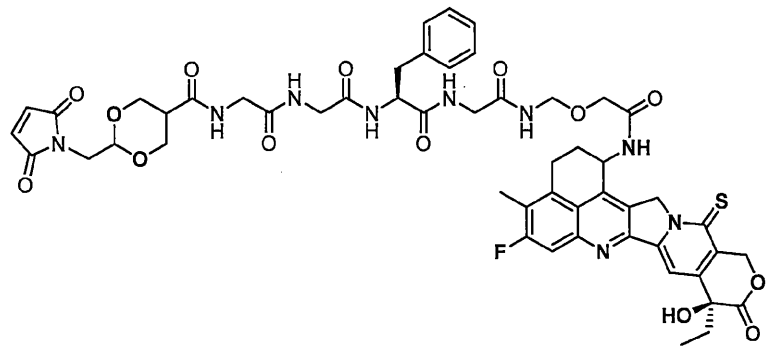


式（ＩＩ－１０）：



式（ＩＩ－１１）：、

式（ＩＩ－１２）：および

式（ＩＩ－１３）：

からなる群から選択されることを特徴とする、請求項１４または１５に記載の化合物またはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。

【請求項２３】

医薬組成物であって、

請求項１～３のいずれか１項に記載のリガンドコンジュゲート、またはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩、プロドラッグまたは溶媒和物、および／または請求項１４または１５に記載の化合物、ならびに任意選択で薬学的に許容される担体を含むことを特徴とする、前記医薬組成物。

【請求項２４】

腫瘍の治療および／または予防に使用するための、請求項１～３のいずれか１項に記載のリガンドコンジュゲート、またはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩、プロドラッグまたは溶媒和物、および／または請求項１４または１５に記載の化合物、またはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物であって、好ましくは、前記腫瘍は、ＨＥＲ２およびＴＲＯＰ２からなるターゲットの発現に関連する腫瘍から選択され、より好ましくは、前記ターゲット発現に関連する前記腫瘍は、ターゲットの発現が高い腫瘍および／またはターゲットが陽性である腫瘍を含み、より好ましくは、前記腫瘍は、固形腫瘍および／または血液腫瘍を含み、最も好ましくは、前記腫瘍は、乳がん、卵巣がん、子宮頸がん、子宮内膜がん、尿路上皮がん、肺がん、前立腺がん、結腸直腸がん、胃がん、食道がん、膀胱がん、腎臓がん、膵臓がん、甲状腺がんおよび頭頸部がんからな

る群から選択される、リガンドコンジュゲート、またはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩、プロドラッグまたは溶媒和物、および／または化合物、またはその互変異性体、メソマー、ラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー、またはその混合物形態、またはその薬学的に許容される塩または水和物。