

(19)



SUOMI - FINLAND  
(FI)

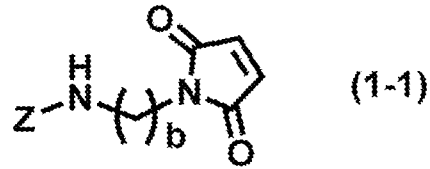
PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS  
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN  
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

- (10) **FI/EP3666787 T3**
- (12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS  
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT  
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**
- (45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - **15.03.2024**  
Translation available to the public
- (97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för **21.02.2024**  
det europeiska patentet - Date of grant of European patent
- (51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -  
International patent classification  
**C07K 5/065** (2006 . 01 )  
**A61K 38/06** (2006 . 01 )  
**A61K 38/08** (2019 . 01 )  
**A61K 39/395** (2006 . 01 )  
**A61K 47/65** (2017 . 01 )  
**A61K 47/68** (2017 . 01 )  
**A61P 35/00** (2006 . 01 )  
**A61P 43/00** (2006 . 01 )  
**C07K 5/072** (2006 . 01 )  
**C07K 5/078** (2006 . 01 )  
**C07K 5/093** (2006 . 01 )  
**C07K 16/28** (2006 . 01 )  
**C07K 5/02** (2006 . 01 )
- (96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - **EP18843388.2**  
European patent application
- (22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **10.08.2018**
- (97) Patenttihakemuksen julkiseksitulosopäivä - Patentansökans **17.06.2020**  
publiceringsdag - Patent application available to the public
- (86) Kansainvälinen hakemus - Internationell **10.08.2018 PCT/JP2018030143**  
ansökan - International application
- (30) Etuoikeus - Prioritet - Priority  
10.08.2017 JP JP2017155990

- (73) Haltija - Innehavare - Holder  
**1• Sumitomo Pharma Co., Ltd.**, 6-8, Doshomachi 2-chome Chuo-ku , Osaka-shi, Osaka 541-0045 , (JP)
- (72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor  
**1• BAN Hitoshi**, c/o Sumitomo Dainippon Pharma Co. Ltd. 1-98 Kasugadenaka 3-chome Konohana-ku , Osaka-shi Osaka 554-0022 , (JP)  
**2• SUWA Atsushi**, c/o Sumitomo Dainippon Pharma Co. Ltd. 1-98 Kasugadenaka 3-chome Konohana-ku , Osaka-shi Osaka 554-0022 , (JP)  
**3• TAKANASHI Yosuke**, c/o Sumitomo Dainippon Pharma Co. Ltd. 1-98 Kasugadenaka 3-chome Konohana-ku , Osaka-shi Osaka 554-0022 , (JP)
- (74) Asiamies - Ombud - Agent  
**Berggren Oy**, P.O. Box 16 Eteläinen Rautatiekatu 10 A , 00101 Helsinki , (FI)
- (54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention  
**Hemiassterliinjohdannaisen sisältäviä vasta-aine-lääkekonjugaatteja**  
**ANTIBODY-DRUG CONJUGATES INCLUDING HEMIASSTERLIN DERIVATIVE**

## Patenttivaatimukset

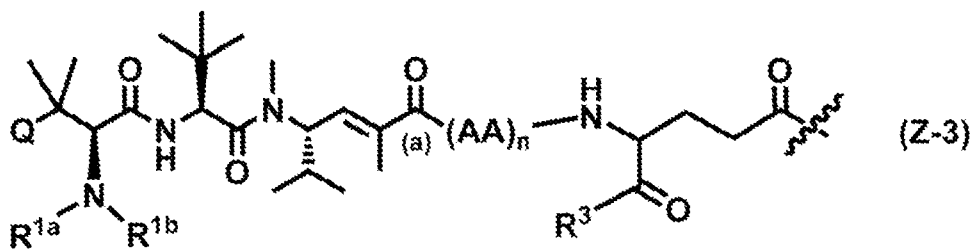
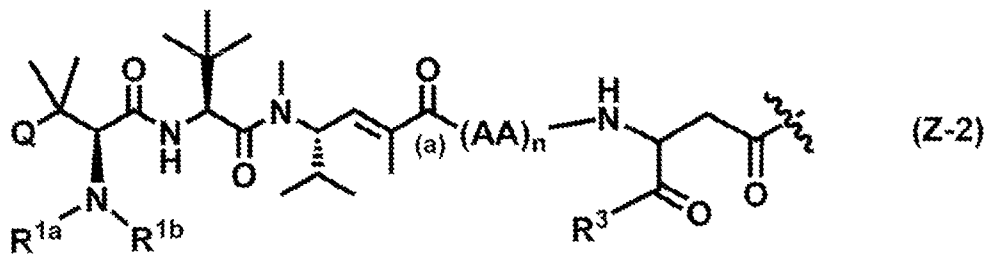
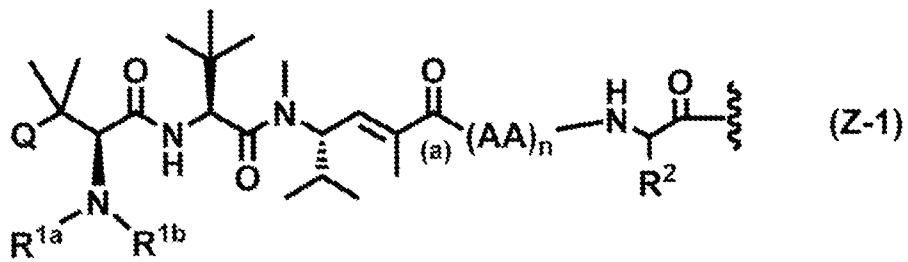
1. Yhdiste, jota esittää kaava (1-1):



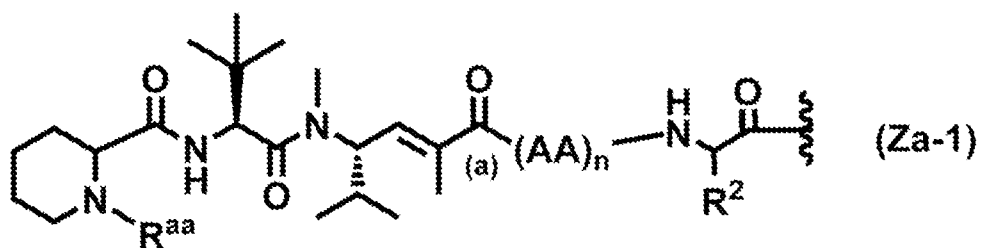
jossa

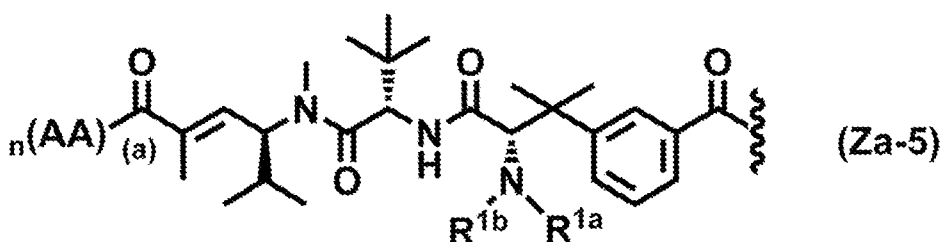
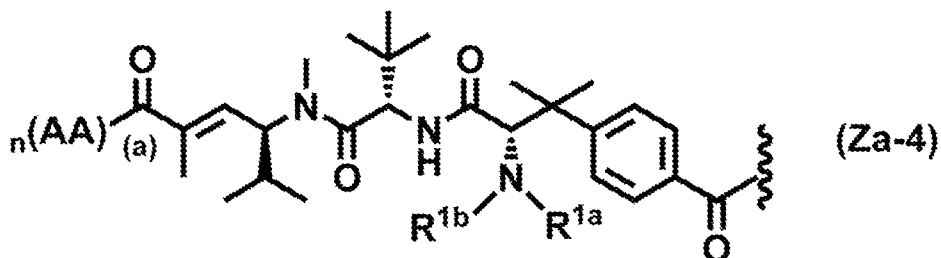
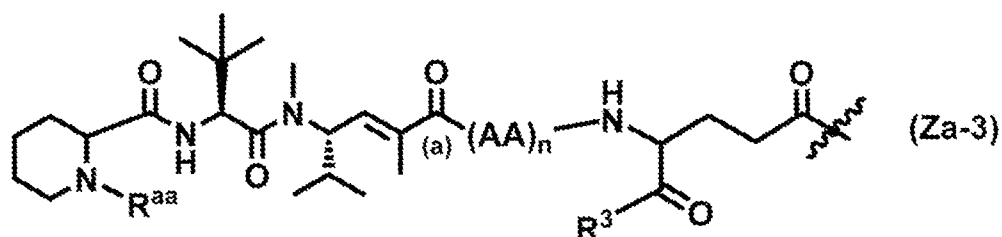
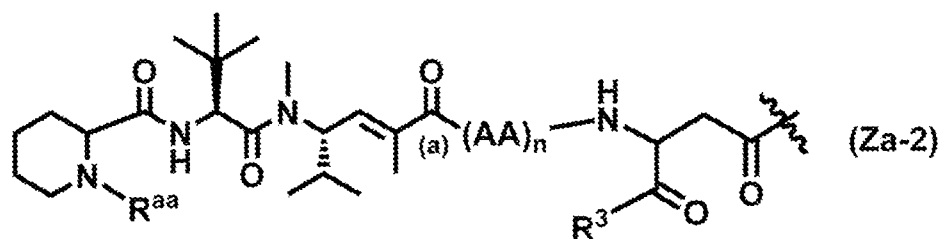
5 b esittää kokonaislukua 1-5; ja

Z on kaavan (Z-1), kaavan (Z-2), kaavan (Z-3), kaavan (Za-1), kaavan (Za-2), kaavan (Za-3), kaavan (Za-4) tai kaavan (Za-5) esittämä ryhmä:



10





5 joissa

n esittää kokonaislukua 0-4, jolloin n on kokonaisluku 1-4, kun Z on kaavan (Za-4) tai kaavan (Za-5) esittämä ryhmä;

AA esittää glutamiinihappotähdettä (Glu), asparagiinihappotähdettä (Asp) tai lysiinihappotähdettä (Lys), ja kun AA-ryhmiä on useita, kukin AA voi olla sama tai toisistaan erilainen ja AA-ryhmät ovat sitoutuneet toisiinsa amidisidoksen välityksellä;

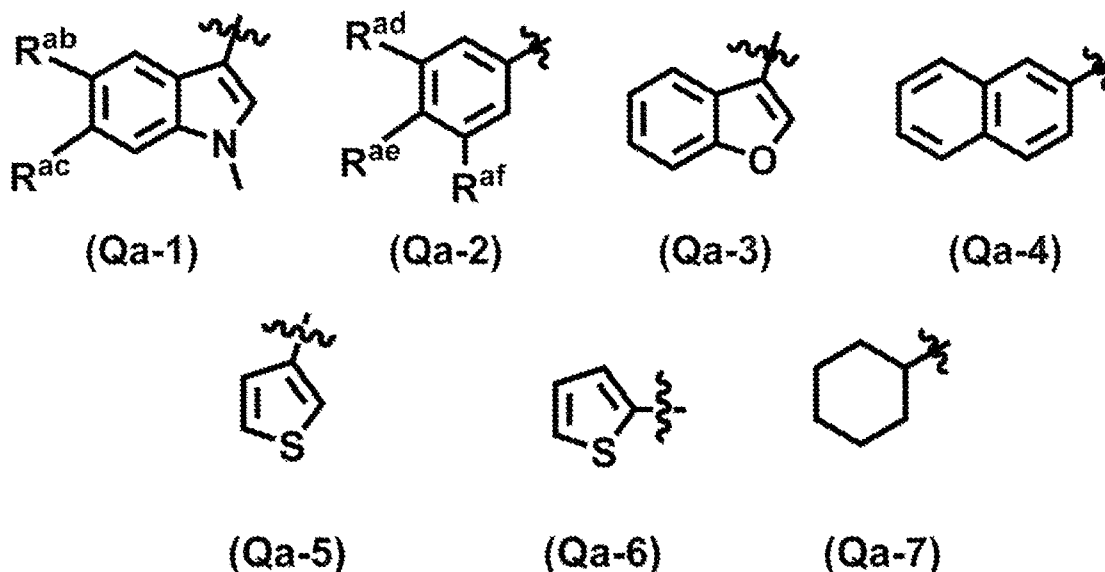
10

ryhmän (AA)<sub>n</sub> N-terminaalinen typpi atomi muodostaa amidisidoksen yhdessä karbonyyliryhmän (a) kanssa;

R<sup>aa</sup> esittää C<sub>1-6</sub>-alkyyli ryhmää;

Q esittää kaavan (Qa-1), kaavan (Qa-2), kaavan (Qa-3), kaavan (Qa-4), kaavan (Qa-5), kaavan (Qa-6) tai kaavan (Qa-7) esittämää ryhmää;

15



joissa

5  $R^{ab}$  ja  $R^{ac}$  esittävät kumpikin riippumattomasti vetyatomia, halogeeniatomia,  $C_{1-6}$ -alkyyliryhmää tai  $C_{1-6}$ -alkoksiryhmää; ja

$R^{ad}$ ,  $R^{ae}$  ja  $R^{af}$  esittävät kukin riippumattomasti vetyatomia, halogeeniatomia, hydroksiryhmää, syanoryhmää, aminoryhmää, karboksyyliiryhmää, fenyyliiryhmää, tai  $C_{1-6}$ -alkyyliryhmää,  $C_{1-6}$ -alkoksiryhmää tai  $C_{1-6}$ -alkyyliesteriryhmää valinnaisesti substituotuna 1-3 fluoriatomilla;

10  $R^{1a}$  ja  $R^{1b}$  esittävät kumpikin riippumattomasti vetyatomia tai metyyliiryhmä;

$R^2$  esittää ryhmää  $-(CH_2)_u-COR^4$ ;

u esittää lukua 1 tai 2;

$R^3$  ja  $R^4$  esittävät kumpikin riippumattomasti ryhmää  $-OH$  tai  $-(AB)_p$ ;

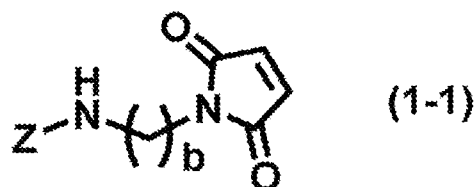
15 AB esittää tähdettä Glu, Asp tai Lys, ja kun AB-ryhmiä on useita, kukin AB voi olla sama tai toisistaan erilainen ja AB-ryhmät ovat sitoutuneet toisiinsa amidisidoksen välityksellä; ja

p esittää kokonaislukua 1-4;

sillä edellytyksellä, että kun  $R^3$  tai  $R^4$  on  $-(AB)_p$ , tekijöiden n ja p summa on kokonaisluku 1-5,

20 tai sen suola.

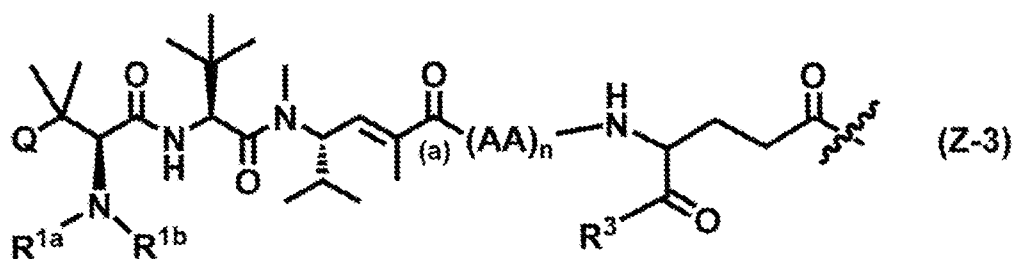
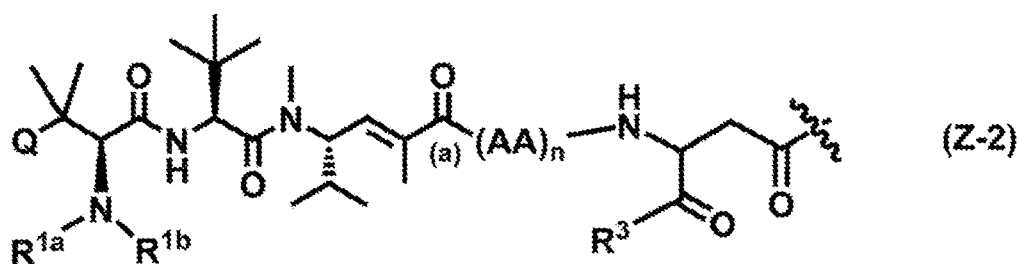
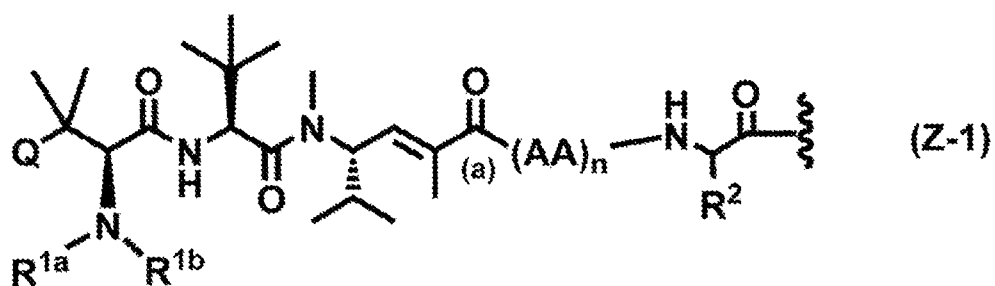
2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jota esittää kaava (1-1):



jossa

b esittää kokonaislukua 1-5; ja

5 Z on kaavan (Z-1), kaavan (Z-2) tai kaavan (Z-3) esittämä ryhmä:



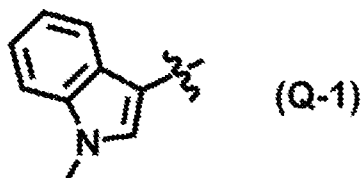
joissa

10 n esittää kokonaislukua 0-4;

AA esittää glutamiinihappotähdettä (Glu), asparagiinihappotähdettä (Asp) tai lysiinihappotähdettä (Lys), ja kun AA-ryhmiä on useita, kukin AA voi olla sama tai toisistaan erilainen ja AA-ryhmät ovat sitoutuneet toisiinsa amidisidoksen välityksellä;

ryhmän  $(AA)_n$  N-terminaalinen typpi atomi muodostaa amidisidoksen yhdessä karbonyyliryhmän (a) kanssa;

Q esittää substituomatonta fenyyli ryhmää tai kaavan (Q-1) esittämää ryhmää:



5  $R^{1a}$  ja  $R^{1b}$  esittävät kumpikin riippumattomasti vetyatomia tai metyyli ryhmää;

$R^2$  esittää ryhmää  $-(CH_2)_u-COR^4$ ;

u esittää lukua 1 tai 2;

$R^3$  ja  $R^4$  esittävät kumpikin riippumattomasti ryhmää  $-OH$  tai  $-(AB)_p$ ;

AB esittää tähdettä Glu, Asp tai Lys, ja kun AB-ryhmiä on useita, kukin AB voi olla

10 sama tai toisistaan erilainen ja AB-ryhmät ovat sitoutuneet toisiinsa amidisidoksen välityksellä; ja

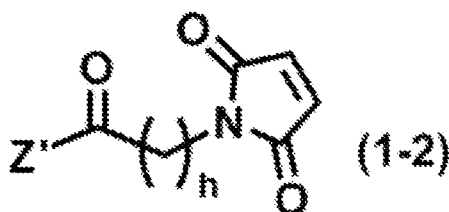
p esittää kokonaislukua 1-4;

sillä edellytyksellä, että kun  $R^3$  tai  $R^4$  on  $-(AB)_p$ , tekijöiden n ja p summa on kokonaisluku 1-5,

15 tai sen suola.

3. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen yhdiste, jossa b on 2, tai sen suola.

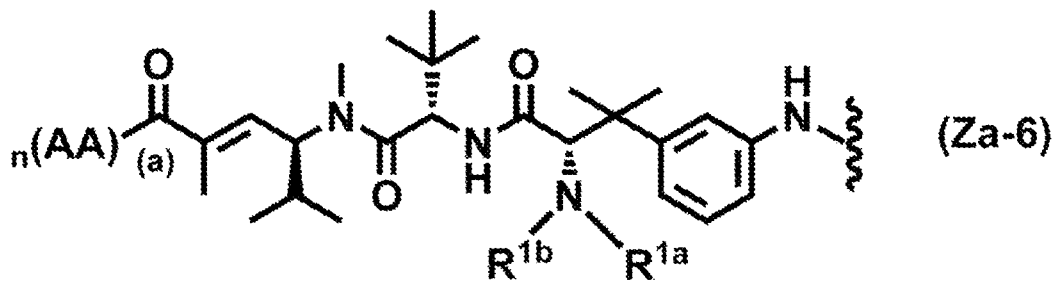
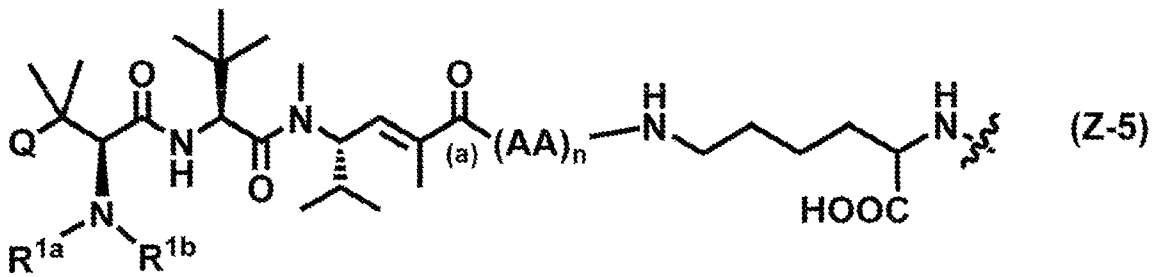
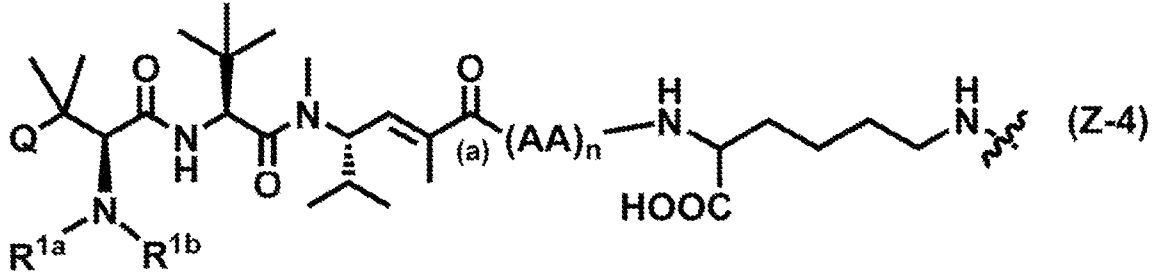
4. Yhdiste, jota esittää kaava (1-2):



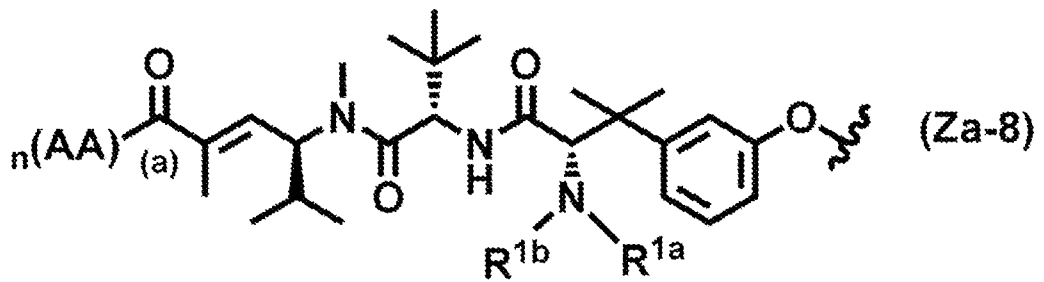
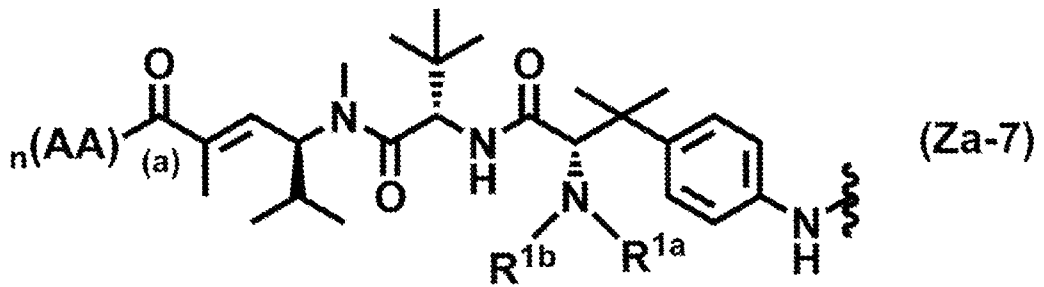
jossa

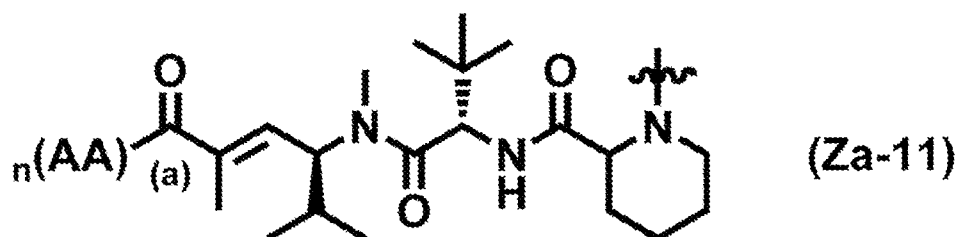
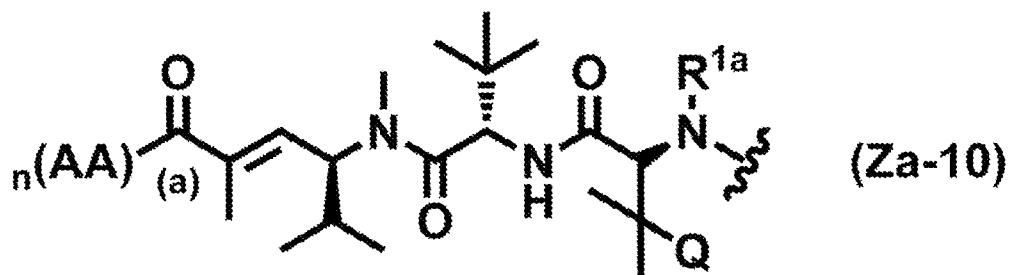
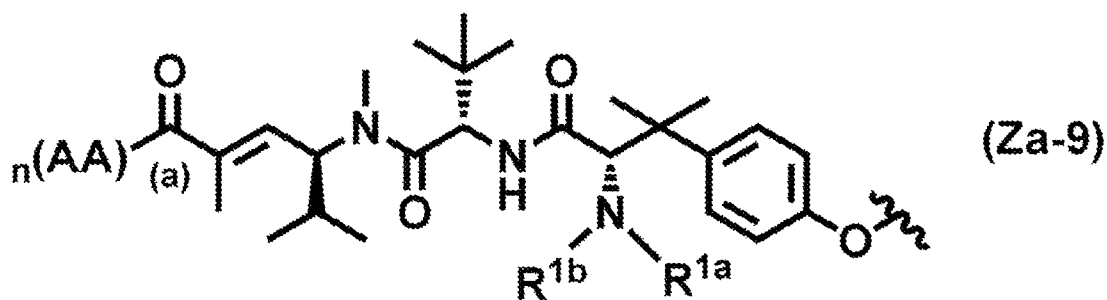
20 h esittää kokonaislukua 1-5; ja

Z' on kaavan (Z-4), kaavan (Z-5), kaavan (Za-6), kaavan (Za-7), kaavan (Za-8), kaavan (Za-9), kaavan (Za-10) tai kaavan (Za-11) esittämä ryhmä:



5





joissa

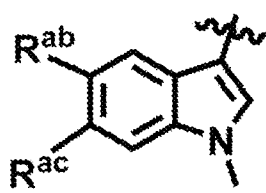
- 5 n esittää kokonaislukua 0-4, jolloin n on kokonaisluku 1-4, kun Z on kaavan (Za-6), kaavan (Za-7), kaavan (Za-8), kaavan (Za-9), kaavan (Za-10) tai kaavan (Za-11) esittämä ryhmä;

AA esittää glutamiinihappotähdettä (Glu), asparagiinihappotähdettä (Asp) tai lysiinihappotähdettä (Lys), ja kun AA-ryhmiä on useita, kukin AA voi olla sama tai toisistaan erilainen ja AA-ryhmät ovat sitoutuneet toisiinsa amidisidoksen välityksellä;

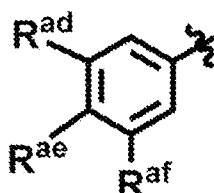
10

ryhmän (AA)<sub>n</sub> N-terminaalinen typpi atomi muodostaa amidisidoksen yhdessä karbonyyliryhmän (a) kanssa;

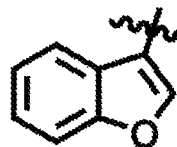
Q esittää kaavan (Qa-1), kaavan (Qa-2), kaavan (Qa-3), kaavan (Qa-4), kaavan (Qa-5), kaavan (Qa-6) tai kaavan (Qa-7) mukaista ryhmää:



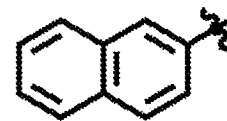
(Qa-1)



(Qa-2)



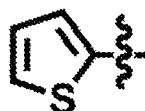
(Qa-3)



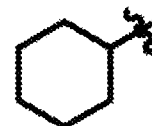
(Qa-4)



(Qa-5)



(Qa-6)



(Qa-7)

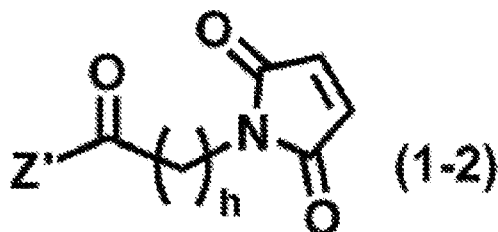
joissa

5  $R^{ab}$  ja  $R^{ac}$  esittävät kumpikin riippumattomasti vetyatomia, halogeeniatomia,  $C_{1-6}$ -alkyyliryhmää tai  $C_{1-6}$ -alkoksiryhmää; ja

$R^{ad}$ ,  $R^{ae}$  ja  $R^{af}$  esittävät kukin riippumattomasti vetyatomia, halogeeniatomia, hydroksiryhmää, syanoryhmää, aminoryhmää, karboksyyliiryhmää, fenyyliiryhmää, tai  $C_{1-6}$ -alkyyliryhmää,  $C_{1-6}$ -alkoksiryhmää tai  $C_{1-6}$ -alkyyliesteriryhmää valinnaisesti substituotuna 1-3 fluoriatomilla; ja

10  $R^{1a}$  ja  $R^{1b}$  esittävät kumpikin riippumattomasti vetyatomia tai metyyliiryhmää, tai sen suola.

5. Patenttivaatimuksen 4 mukainen yhdiste, jota esittää kaava (1-2):

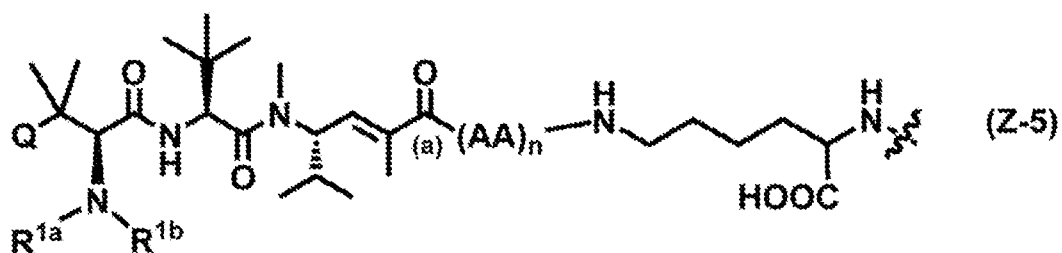
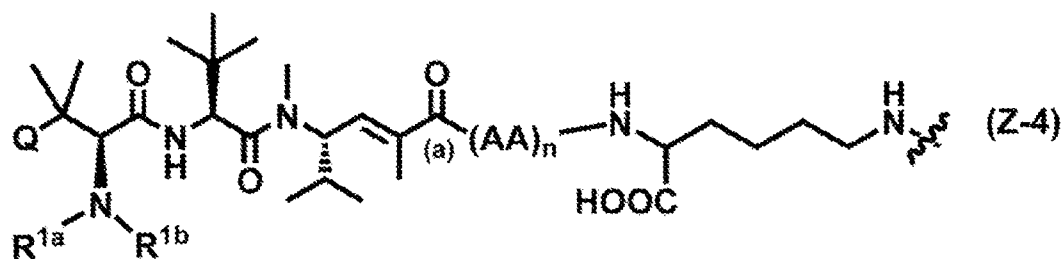


(1-2)

joissa

15 h esittää kokonaislukua 1-5; ja

Z' on kaavan (Z-4) tai kaavan (Z-5) esittämä ryhmä:



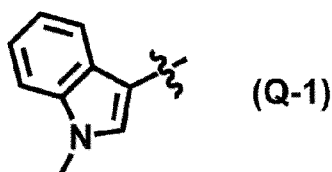
joissa

n esittää kokonaislukua 0-4;

- 5 AA esittää glutamiinihappotähdettä (Glu), asparagiinihappotähdettä (Asp) tai lysiinihappotähdettä (Lys), ja kun AA-ryhmiä on useita, kukin AA voi olla sama tai toisistaan erilainen ja AA-ryhmät ovat sitoutuneet toisiinsa amidisidoksen välityksellä;

ryhmän (AA)<sub>n</sub> N-terminaalinen typpi atomi muodostaa amidisidoksen yhdessä karbonyyliryhmän (a) kanssa;

- 10 Q esittää substituimatonta fenyyliryhmää tai kaavan (Q-1) esittämää ryhmää:



ja

R<sup>1a</sup> ja R<sup>1b</sup> esittävät kumpikin riippumattomasti vetyatomia tai metyyliryhmää, tai sen suola.

- 15 6. Patenttivaatimuksen 4 tai 5 mukainen yhdiste, jossa h on 5, tai sen suola.

7. Patenttivaatimuksen 1 tai 4 mukainen yhdiste, jossa

Q on kaavan (Qa-1) tai kaavan (Qa-2) esittämä ryhmä;

$R^{ab}$  ja  $R^{ac}$  ovat kumpikin riippumattomasti vetyatomi, fluoriatomi, klooriatomi, bromiatomi,  $C_{1-6}$ -alkyyliiryhmä tai  $C_{1-6}$ -alkoksiryhmä; ja

$R^{ad}$ ,  $R^{ae}$  ja  $R^{af}$  ovat kukin riippumattomasti vetyatomi, fluoriatomi, klooriatomi, bromiatomi, tai  $C_{1-6}$ -alkyyliiryhmä tai  $C_{1-6}$ -alkoksiryhmä valinnaisesti substituotuna 1-3 fluoriatomilla, tai sen suola.

8. Patenttivaatimuksista 1-7 minkä tahansa mukainen yhdiste, jossa n on kokonaisluku 0-2, tai sen suola.

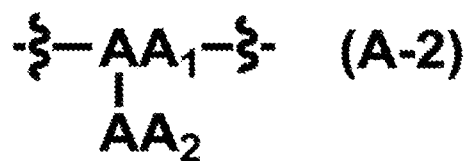
9. Patenttivaatimuksista 1-3 minkä tahansa mukainen yhdiste, jossa  $R^3$  tai  $R^4$  on  $-(AB)_p$  ja tekijöiden n ja p summa on 1 tai 2, tai sen suola.

10. Patenttivaatimuksen 2 tai 5 mukainen yhdiste, jossa  $(AA)_n$  on kaavan (A-1) esittämä ryhmä:



jossa ryhmiä  $AA_1$  ja  $AA_2$  kumpaakin esittävät riippumattomasti Glu, Asp tai Lys, tai sen suola.

15. Patenttivaatimuksen 2 tai 5 mukainen yhdiste, jossa  $(AA)_n$  on kaavan (A-2) esittämä ryhmä:



jossa ryhmiä  $AA_1$  ja  $AA_2$  kumpaakin esittävät riippumattomasti Glu, Asp tai Lys, tai sen suola.

20. Patenttivaatimuksista 1-3 minkä tahansa mukainen yhdiste, jossa

$R^3$  ja  $R^4$  ovat -OH; ja

n on kokonaisluku 0-2,

tai sen suola.

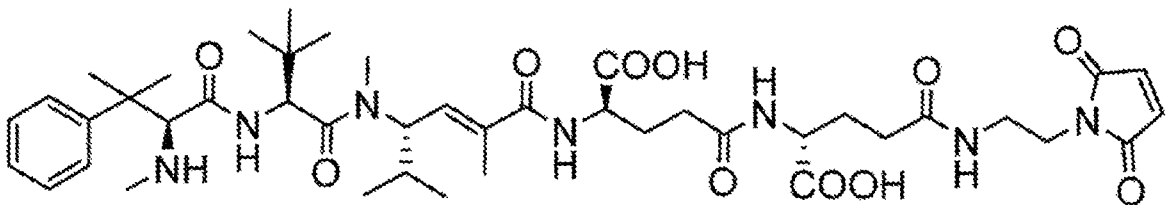
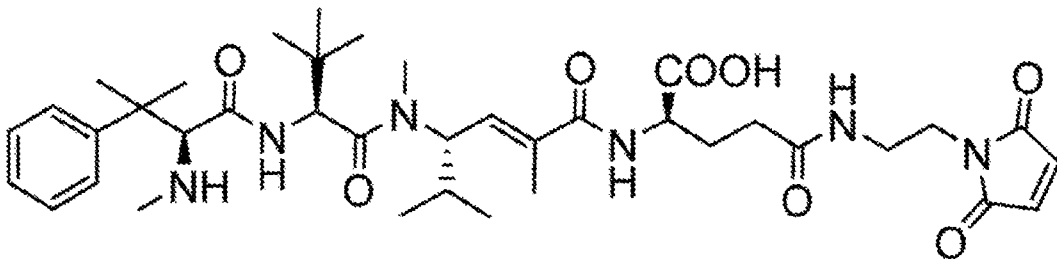
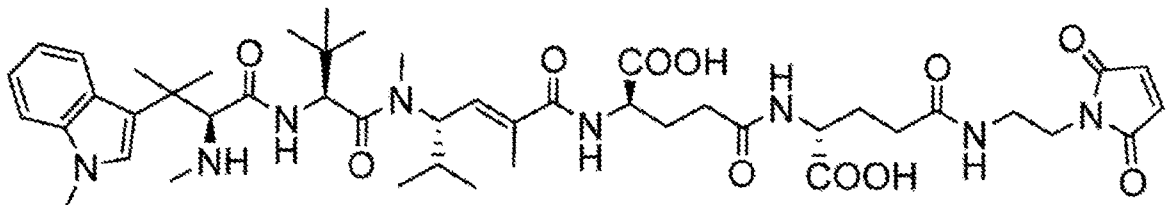
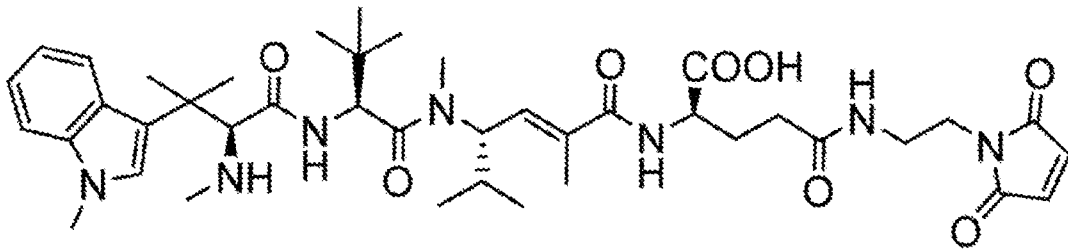
13. Patenttivaatimuksista 1-3 minkä tahansa mukainen yhdiste, jossa

$R^3$  ja  $R^4$  ovat  $-(AB)_p$ ; ja

$n$  on 0 ja  $p$  on 2, tai  $n$  ja  $p$  ovat kumpikin 1,

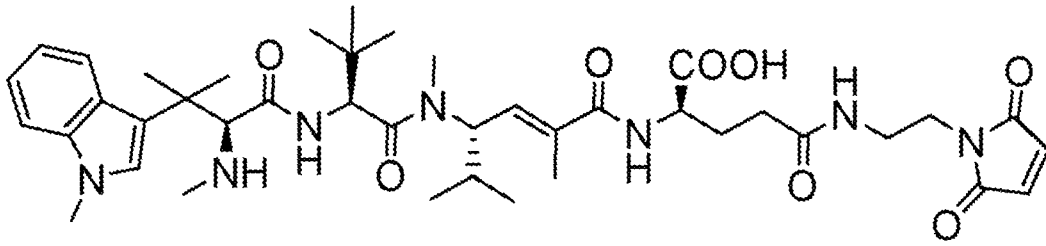
tai sen suola.

14. Patenttivaatimuksista 1-3 minkä tahansa mukainen yhdiste valittuna seuraavista yhdisteistä:



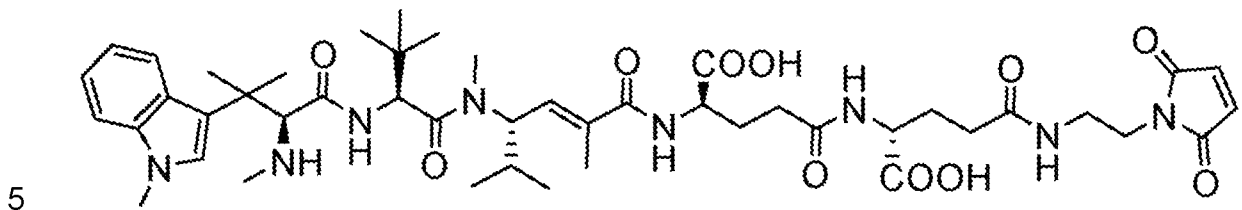
- 10 tai sen suola.

15. Patenttivaatimuksista 1-3 minkä tahansa mukainen yhdiste, jolloin yhdiste on seuraava yhdiste,



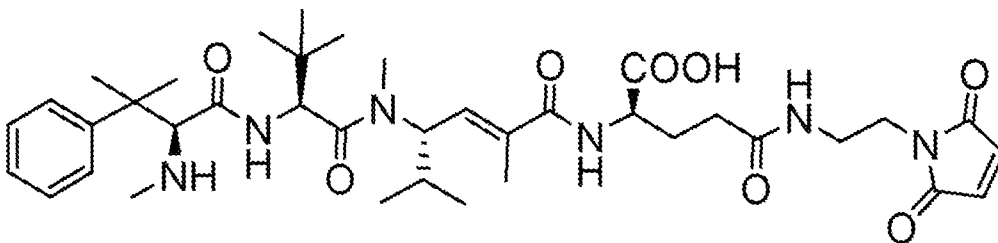
tai sen suola.

16. Patenttivaatimuksista 1-3 minkä tahansa mukainen yhdiste, jolloin yhdiste on seuraava yhdiste,



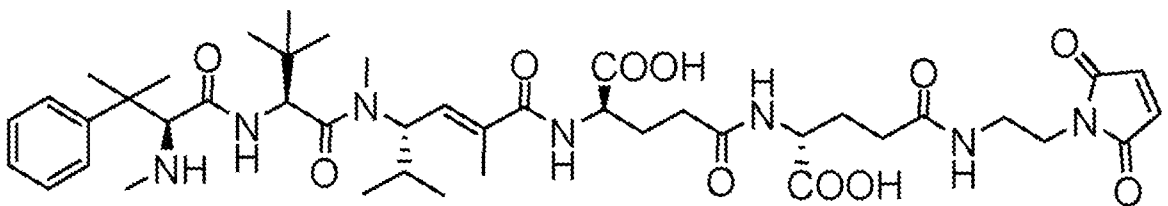
tai sen suola.

17. Patenttivaatimuksista 1-3 minkä tahansa mukainen yhdiste, jolloin yhdiste on seuraava yhdiste,



10 tai sen suola.

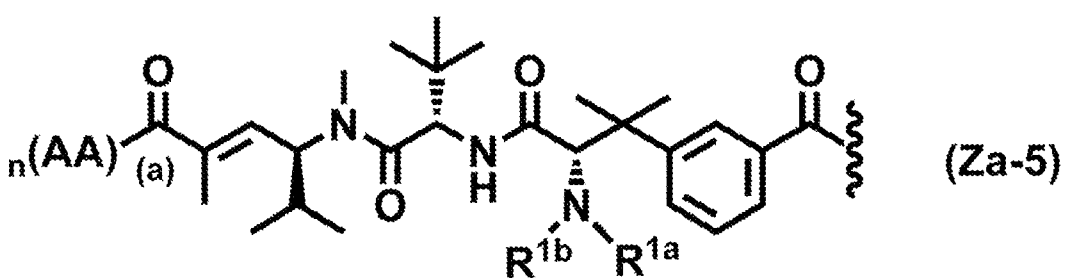
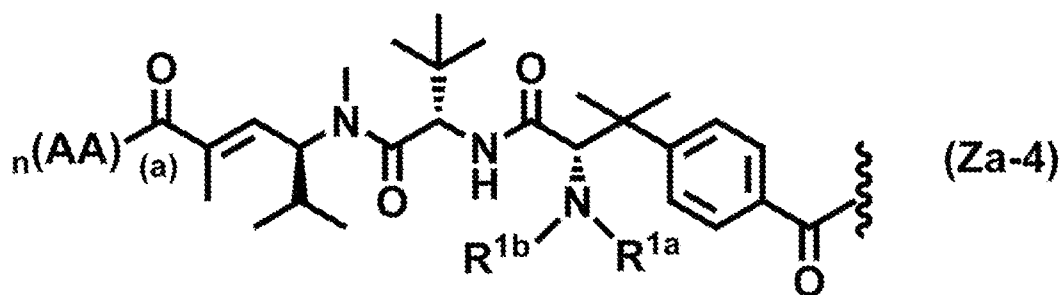
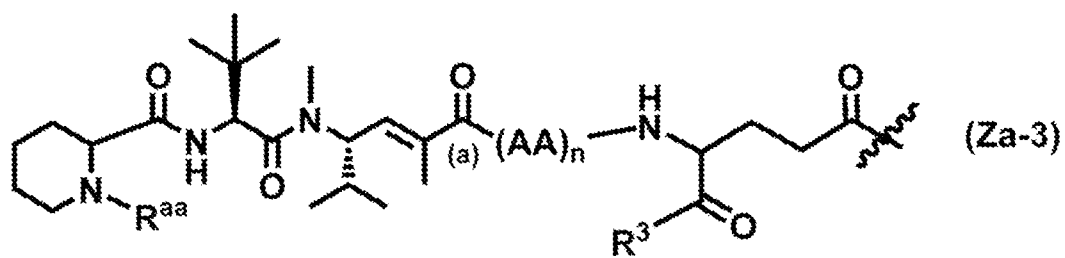
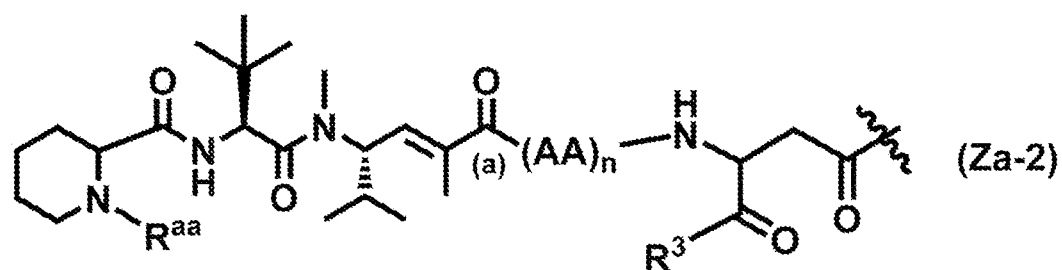
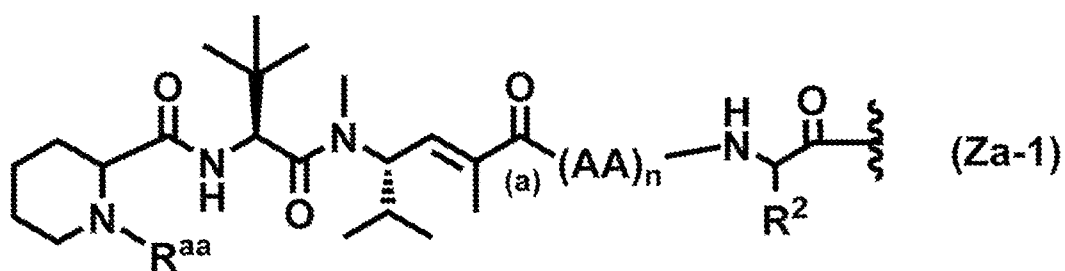
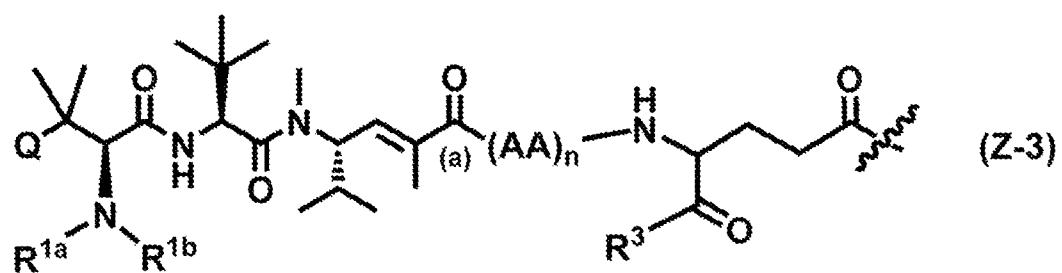
18. Patenttivaatimuksista 1-3 minkä tahansa mukainen yhdiste, jolloin yhdiste on seuraava yhdiste,



tai sen suola.

15 19. Patenttivaatimuksista 4-6 minkä tahansa mukainen yhdiste, jolloin yhdiste on seuraava yhdiste,





joissa

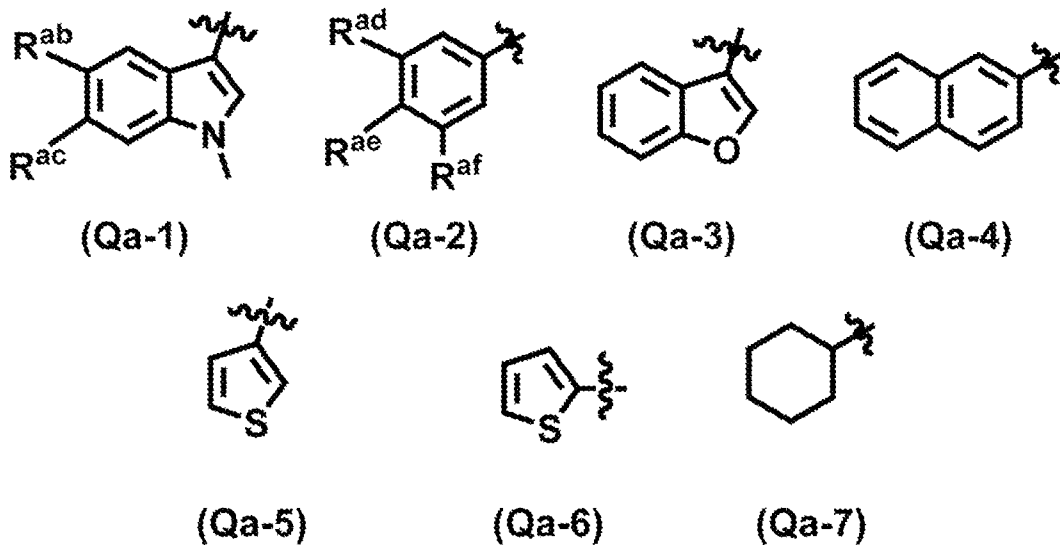
n esittää kokonaislukua 0-4, jolloin n on kokonaisluku 1-4, kun Z on kaavan (Za-4) tai kaavan (Za-5) esittämä ryhmä;

- 5 AA esittää glutamiinihappotähdettä (Glu), asparagiinihappotähdettä (Asp) tai lysiinihappotähdettä (Lys), ja kun AA-ryhmiä on useita, kukin AA voi olla sama tai toisistaan erilainen ja AA-ryhmät ovat sitoutuneet toisiinsa amidisidoksen välityksellä;

ryhmän (AA)<sub>n</sub> N-terminaalinen typpi atomi muodostaa amidisidoksen yhdessä karbonyyliryhmän (a) kanssa;

R<sup>aa</sup> esittää C<sub>1-6</sub>-alkyyliryhmää;

- 10 Q esittää kaavan (Qa-1), kaavan (Qa-2), kaavan (Qa-3), kaavan (Qa-4), kaavan (Qa-5), kaavan (Qa-6) tai kaavan (Qa-7) esittämää ryhmää:



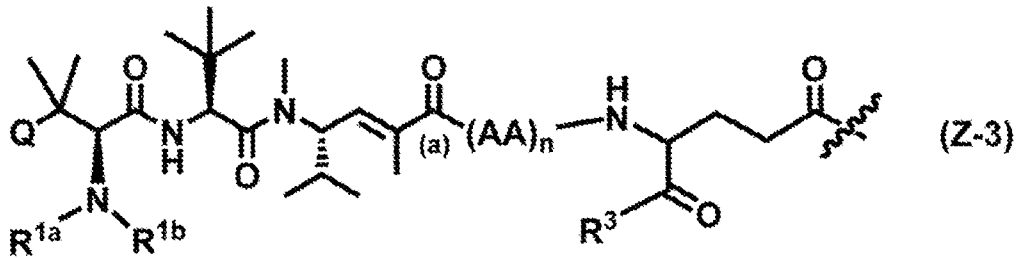
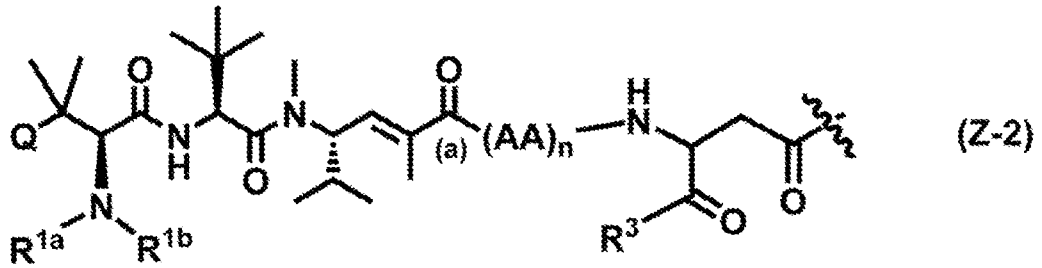
joissa

- 15 R<sup>ab</sup> ja R<sup>ac</sup> esittävät kumpikin riippumattomasti vetyatomia, halogeeniatomia, C<sub>1-6</sub>-alkyyliryhmää tai C<sub>1-6</sub>-alkoksyryhmää; ja

- R<sup>ad</sup>, R<sup>ae</sup> ja R<sup>af</sup> esittävät kukin riippumattomasti vetyatomia, halogeeniatomia, hydroksiryhmää, syanoryhmää, aminoryhmää, karboksyyliiryhmää, fenyyliryhmää, tai C<sub>1-6</sub>-alkyyliryhmää, C<sub>1-6</sub>-alkoksyryhmää tai C<sub>1-6</sub>-alkyyliesteriryhmää valinnaisesti substituotuna 1-3 fluoriatomilla;
- 20

R<sup>1a</sup> ja R<sup>1b</sup> esittävät kumpikin riippumattomasti vetyatomia tai metyyliryhmää;





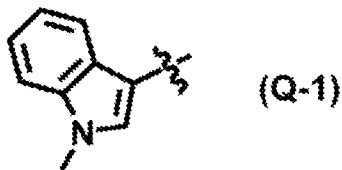
joissa

n esittää kokonaislukua 0-4;

- 5 AA esittää glutamiinihappotähdettä (Glu), asparagiinihappotähdettä (Asp) tai lyysiinihappotähdettä (Lys), ja kun AA-ryhmiä on useita, kukin AA voi olla sama tai toisistaan erilainen ja AA-ryhmät ovat sitoutuneet toisiinsa amidisidoksen välityksellä;

ryhmän (AA)<sub>n</sub> N-terminaalinen typpi atomi muodostaa amidisidoksen yhdessä karbonyyliryhmän (a) kanssa;

- 10 Q esittää substituimatonta fenyyliryhmää tai kaavan (Q-1) esittämää ryhmää:



R<sup>1a</sup> ja R<sup>1b</sup> esittävät kumpikin riippumattomasti vetyatomia tai metyyliryhmää;

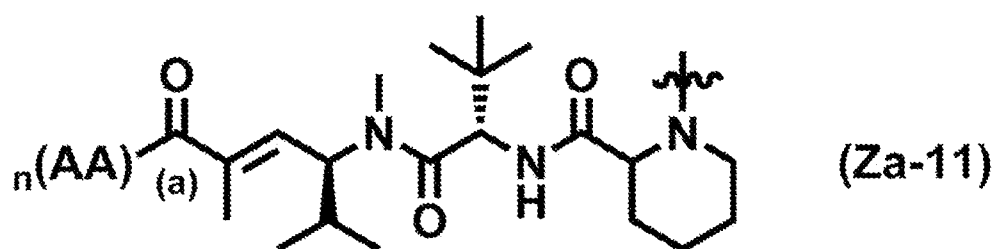
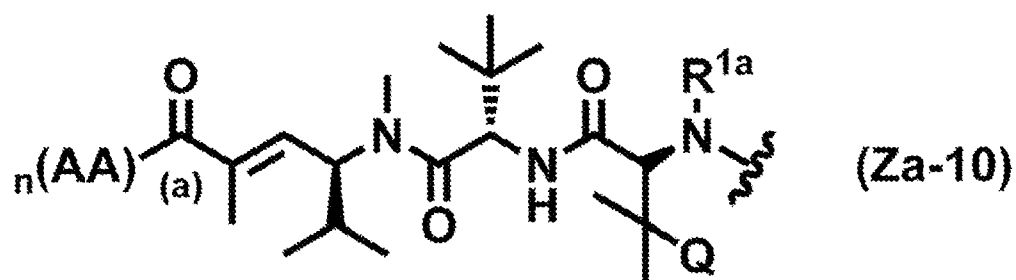
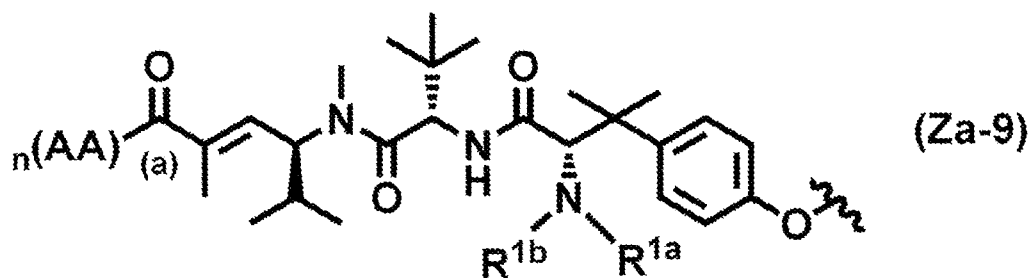
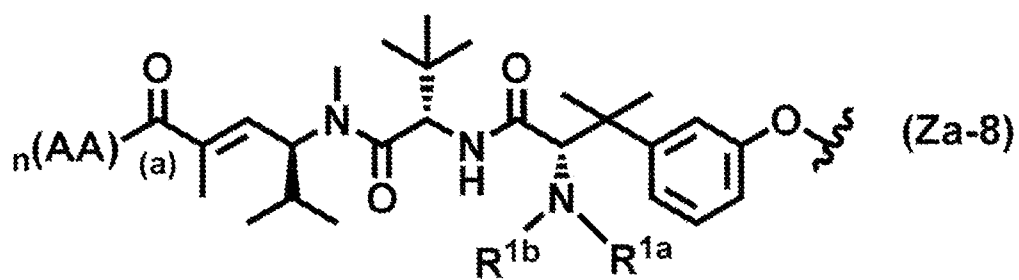
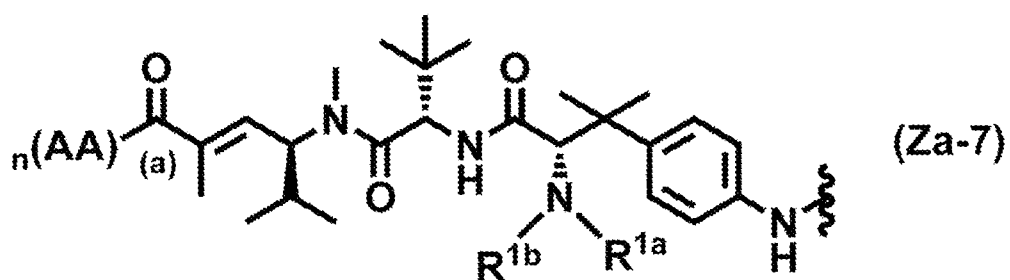
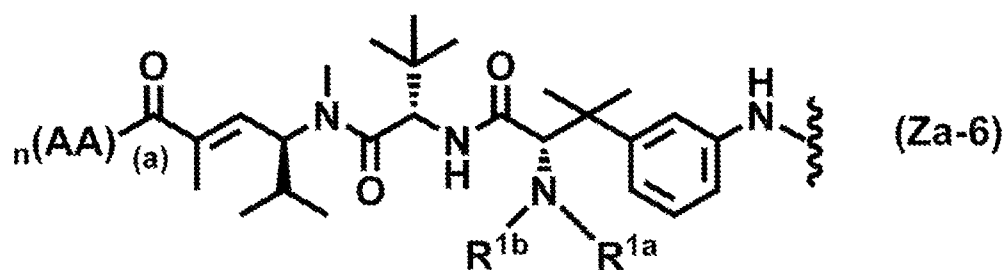
R<sup>2</sup> esittää ryhmää -(CH<sub>2</sub>)<sub>u</sub>-COR<sup>4</sup>;

u esittää lukua 1 tai 2;

- 15 R<sup>3</sup> ja R<sup>4</sup> esittävät kumpikin riippumattomasti ryhmää -OH tai -(AB)<sub>p</sub>;

AB esittää tähdettä Glu, Asp tai Lys, ja kun AB-ryhmiä on useita, kukin AB voi olla sama tai toisistaan erilainen ja AB-ryhmät ovat sitoutuneet toisiinsa amidisidoksen välityksellä; ja





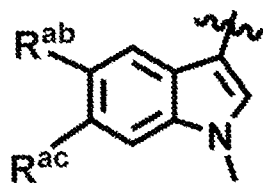
joissa

n esittää kokonaislukua 0-4, jolloin n on kokonaisluku 1-4, kun Z on kaavan (Za-6), kaavan (Za-7), kaavan (Za-8), kaavan (Za-9), kaavan (Za-10) tai kaavan (Za-11) esittämä ryhmä;

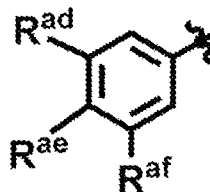
- 5 AA esittää glutamiinihappotähdettä (Glu), asparagiinihappotähdettä (Asp) tai lysiinihappotähdettä (Lys), ja kun AA-ryhmiä on useita, kukin AA voi olla sama tai toisistaan erilainen ja AA-ryhmät ovat sitoutuneet toisiinsa amidisidoksen välityksellä;

ryhmän (AA)<sub>n</sub> N-terminaalinen typpi atomi muodostaa amidisidoksen yhdessä karbonyyliryhmän (a) kanssa;

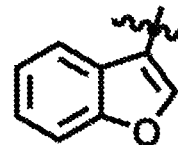
- 10 Q esittää kaavan (Qa-1), kaavan (Qa-2), kaavan (Qa-3), kaavan (Qa-4), kaavan (Qa-5), kaavan (Qa-6) tai kaavan (Qa-7) esittämää ryhmää:



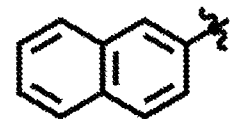
(Qa-1)



(Qa-2)



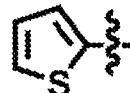
(Qa-3)



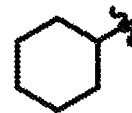
(Qa-4)



(Qa-5)



(Qa-6)



(Qa-7)

joissa

- 15 R<sup>ab</sup> ja R<sup>ac</sup> esittävät kumpikin riippumattomasti vetyatomia, a halogeeniatomia, C<sub>1-6</sub>-alkyyliiryhmää tai C<sub>1-6</sub>-alkoksiryhmää; ja

R<sup>ad</sup>, R<sup>ae</sup> ja R<sup>af</sup> esittävät kukin riippumattomasti vetyatomia, halogeeniatomia, hydroksiryhmää, syanoryhmää, aminoryhmää, karboksyyliiryhmää, fenyyliiryhmää, tai C<sub>1-6</sub>-alkyyliiryhmää, C<sub>1-6</sub>-alkoksiryhmää tai C<sub>1-6</sub>-alkyyliesteriryhmää valinnaisesti substituotuna 1-3 fluoriatomilla; ja

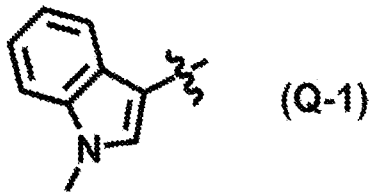
20

R<sup>1a</sup> ja R<sup>1b</sup> esittävät kumpikin riippumattomasti vetyatomia tai metyyliiryhmää,

tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.



Q esittää substituimatonta fenyyliryhmää tai kaavan (Q-1) esittämää ryhmää:



ja

R<sup>1a</sup> ja R<sup>1b</sup> esittävät kumpikin riippumattomasti vetyatomia tai metyyliryhmää,

5 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

25. Patenttivaatimuksen 23 tai 24 mukainen vasta-aine-lääkekonjugaatti, jossa h on 5, tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

26. Patenttivaatimuksen 20 tai 23 mukainen vasta-aine-lääkekonjugaatti, jossa

Q on kaavan (Qa-1) tai kaavan (Qa-2) esittämä ryhmä;

10 R<sup>ab</sup> ja R<sup>ac</sup> ovat kumpikin riippumattomasti vetyatomi, fluoriatomi, klooriatomi, bromiatomi, C<sub>1-6</sub>-alkyyliiryhmä tai C<sub>1-6</sub>-alkoksiryhmä; ja

R<sup>ad</sup>, R<sup>ae</sup> ja R<sup>af</sup> ovat kukin riippumattomasti vetyatomi, fluoriatomi, klooriatomi, bromiatomi, tai C<sub>1-6</sub>-alkyyliiryhmä tai C<sub>1-6</sub>-alkoksiryhmä valinnaisesti substituotuna 1-3 fluoriatomilla,

15 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

27. Patenttivaatimuksista 20-26 minkä tahansa mukainen vasta-aine-lääkekonjugaatti, jossa n on kokonaisluku 0-2, tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

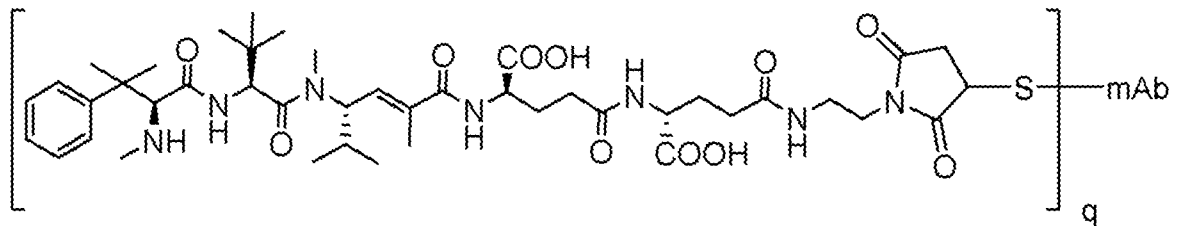
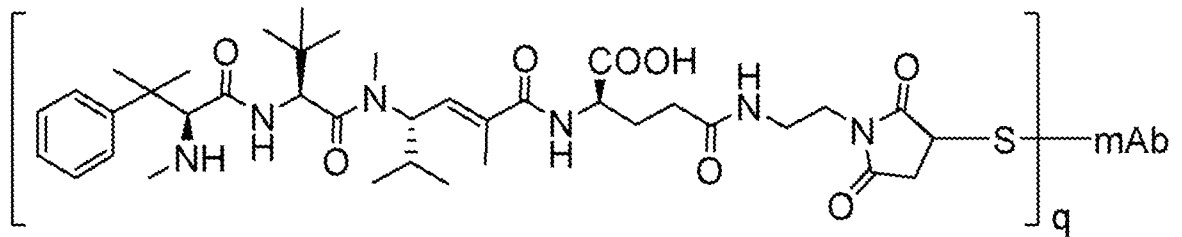
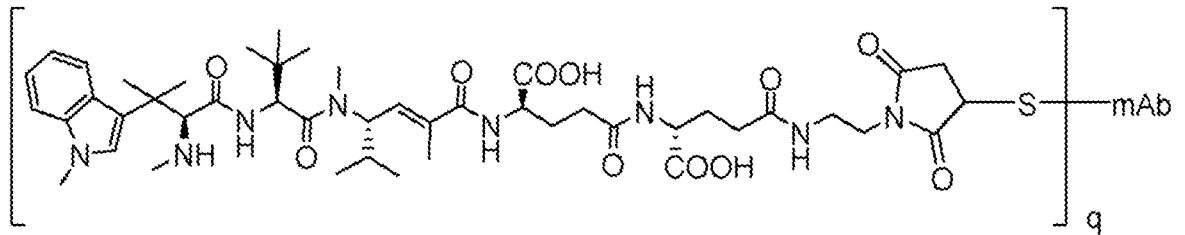
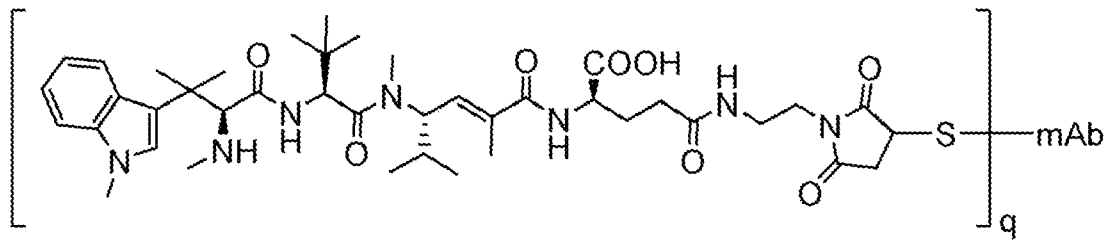
28. Patenttivaatimuksista 20-22 minkä tahansa mukainen vasta-aine-lääkekonjugaatti, jossa

20 R<sup>3</sup> ja R<sup>4</sup> ovat -OH; ja

n on kokonaisluku 0-2,

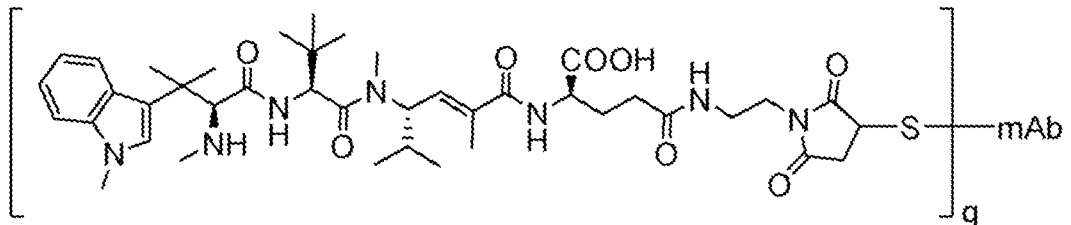
tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

29. Patenttivaatimuksista 20-22 minkä tahansa mukainen vasta-aine-lääkekonjugaatti valittuna seuraavista vasta-aine-lääkekonjugaateista:



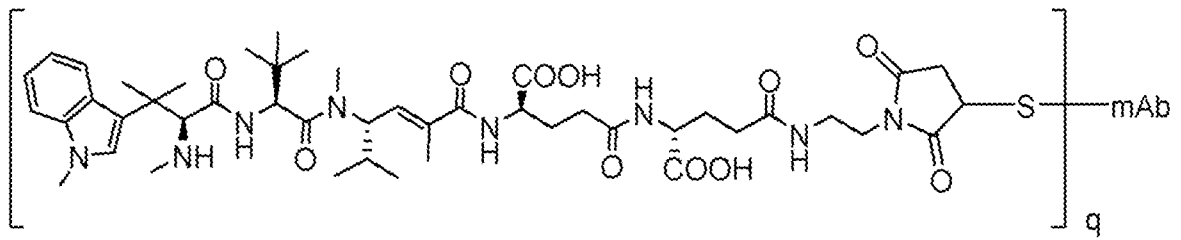
5 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

30. Patenttivaatimuksista 20-22 minkä tahansa mukainen vasta-aine-lääkekonjugaatti, jolloin vasta-aine-lääkekonjugaatti on seuraava vasta-aine-lääkekonjugaatti,



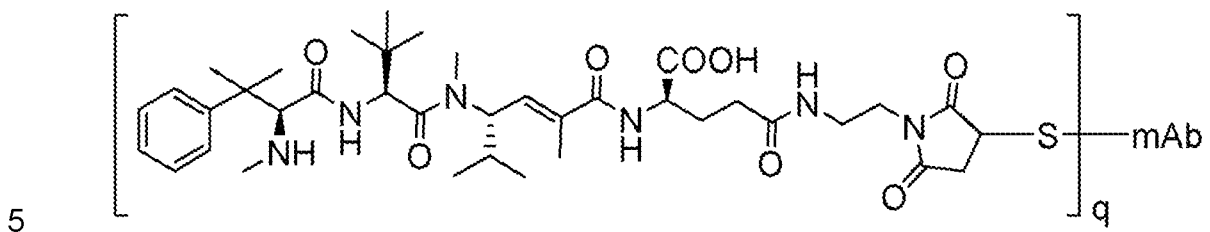
tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

10 31. Patenttivaatimuksista 20-22 minkä tahansa mukainen vasta-aine-lääkekonjugaatti, jolloin vasta-aine-lääkekonjugaatti on seuraava vasta-aine-lääkekonjugaatti,



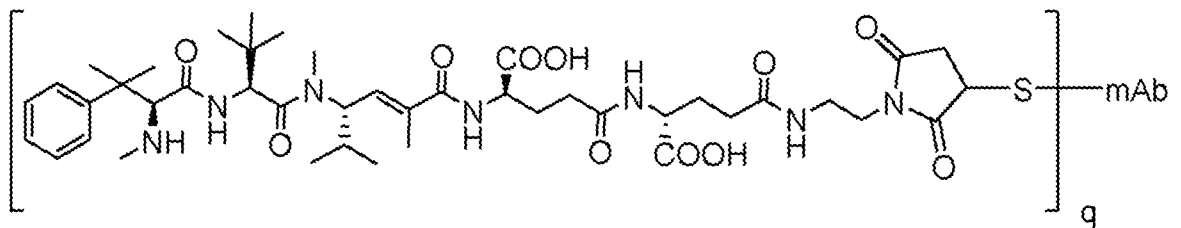
tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

32. Patenttivaatimuksista 20-22 minkä tahansa mukainen vasta-aine-lääkekonjugaatti, jolloin vasta-aine-lääkekonjugaatti on seuraava vasta-aine-lääkekonjugaatti,



tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

33. Patenttivaatimuksista 20-22 minkä tahansa mukainen vasta-aine-lääkekonjugaatti, jolloin vasta-aine-lääkekonjugaatti on seuraava vasta-aine-lääkekonjugaatti,



10 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

34. Farmaseuttinen koostumus, joka sisältää patenttivaatimuksista 20-33 minkä tahansa mukaisen vasta-aine-lääkekonjugaatin tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävän suolan.

35. Farmaseuttinen koostumus, joka sisältää:

15 patenttivaatimuksista 20-33 minkä tahansa mukaisen vasta-aine-lääkekonjugaatin tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävän suolan; ja yhden tai useampia syövän kasvua hillitseviä yhdisteitä valittuna ryhmästä, joka koostuu syövän kasvua hillitsevästä alkyloivasta aineesta, syövän kasvua hillitsevästä antimetaboliitista, syövän kasvua hillitsevästä antibiootista, syövän kasvua hillitsevästä platinakoordinaatioyhdisteestä, syövän kasvua hillitsevästä kamptotesiinijohdannaisesta, syövän kasvua

20

5 hillitsevästä tyrosiinikinaasin estäjästä, syövän kasvua hillitsevästä seriini-treoniini-  
kinaasin estäjästä, syövän kasvua hillitsevästä fosfolipidikinaasin estäjästä, syövän  
kasvua hillitsevästä monoklonaalisesta vasta-aineesta, interferonista, biologisen  
vasteen modifioijasta, hormonaalisesta aineesta, immuunijärjestelmän tarkastus-  
pisteen estäjästä, epigenetiikkaan liittyvän molekyylin estäjästä ja posttranslato-  
naalisen proteiininmuokkauksen estäjästä, tai niiden farmaseuttisesti hyväksyttävistä  
suoloista.

36. Patenttivaatimuksista 1-19 minkä tahansa mukainen yhdiste tai sen suola käytettäväksi syövän hoidossa.

10 37. Patenttivaatimuksista 20-33 minkä tahansa mukainen vasta-aine-lääkekonjugaatti tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käytettäväksi syövän hoidossa.

15 38. Vasta-aine-lääkekonjugaatti tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käytettäväksi patenttivaatimuksen 37 mukaisesti, jolloin syöpä on rintasyöpä, mahasyöpä, keuhkasyöpä, maksasyöpä, kohdunkaulan syöpä, paksusuolisyöpä, peräsuolisyöpä, koolonsyöpä, gliooma, lymfooma, munasarjasyöpä, haimasyöpä, eturauhassyöpä, munuaissyöpä, uroteelisyöpä, ihosyöpä, kilpirauhassyöpä, virtsarakkasyöpä, pään ja kaulan alueen syöpä, endometriumsyöpä, mesoteliooma, melanooma, multippeli myelooma tai leukemia.

20 39. Patenttivaatimuksista 20-33 minkä tahansa mukainen vasta-aine-lääkekonjugaatti tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käytettäväksi syövän hoidossa yhdessä yhden tai useamman syövän kasvua hillitsevän yhdisteen kanssa valittuna ryhmästä, joka koostuu syövän kasvua hillitsevästä alkyloivasta aineesta, syövän kasvua hillitsevästä antimetaboliitista, syövän kasvua hillitsevästä antibiootista, syövän kasvua hillitsevästä platinakoordinaatioyhdisteestä, syövän kasvua hillitsevästä kamptotesiinijohdannaisesta, syövän kasvua hillitsevästä tyrosiinikinaasin estäjästä, syövän kasvua hillitsevästä seriini-treoniinikinaasin estäjästä, syövän kasvua hillitsevästä fosfolipidikinaasin estäjästä, syövän kasvua hillitsevästä monoklonaalisesta vasta-aineesta, interferonista, biologisen vasteen modifioijasta, hormonaalisesta aineesta, immuunijärjestelmän tarkastuspisteen estäjästä, epigenetiikkaan  
25 liittyvän molekyylin estäjästä ja posttranslato-naalisen proteiininmuokkauksen estä-  
30 jästä, tai niiden farmaseuttisesti hyväksyttävistä suoloista.