

【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3年11月18日(2021.11.18)

【公表番号】特表2021-502372(P2021-502372A)

【公表日】令和3年1月28日(2021.1.28)

【年通号数】公開・登録公報2021-004

【出願番号】特願2020-525911(P2020-525911)

【国際特許分類】

C 07 F 5/02 (2006.01)

A 61 K 47/54 (2017.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

【F I】

C 07 F 5/02 C S P C

A 61 K 47/54

A 61 P 3/10

【手続補正書】

【提出日】令和3年10月4日(2021.10.4)

【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

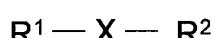
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I:

【化1】

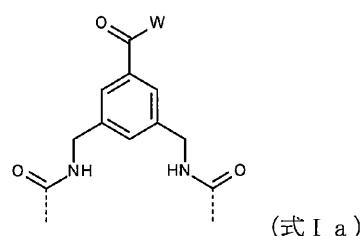


によって表されるジボロン化合物であって、

式I中、

Xが、式Iaのリンカーを表し、

【化2】



式中、

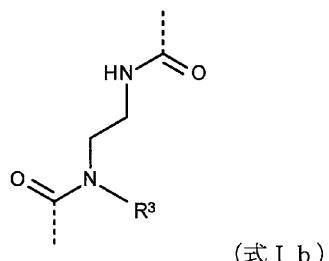
R¹もしくはR²に対する共有結合を表し、

Wが、-OH、-NHCH₂COOH、-NHCH₂CH₂COOH、-NHCH₂CH₂COOH、もしくは-NHCH(COOH)CH₂CH₂COOH(前記基は

L-ガンマ-G1uもしくはD-ガンマ-G1u残基を表す)を表すか、または

Xが、式Ibのリンカーを表し、

【化3】



式中、

- - - が、R¹もしくはR²に対する共有結合を表し、

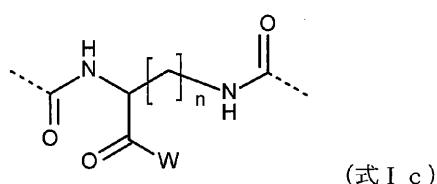
R³が、-(CH₂)_m(C=O)-Wを表し、

式中、mが、1~4の範囲の整数を表し、

Wが、OH、NHCH₂COOH、NHCH₂CH₂COOH、NHCH₂CH₂CH₂COOH、NHCH₂CH₂CH₂COOH、もしくはNHCH(COOH)CH₂CH₂COOH(前記基は、L-ガンマ-GluもしくはD-ガンマ-Glu残基を表す)を表すか、または

式中、Xが、式 I c のリンカーを表し、

【化4】



前記リンカーは、D-もしくはL-アミノ酸形態を表し、

式中、

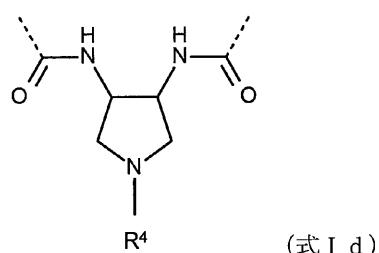
- - - が、R¹もしくはR²に対する共有結合を表し、

nは、1~4の範囲の整数を表し、

Wが、-OH、-NHCH₂COOH、-NHCH₂CH₂COOH、-NHCH₂CH₂CH₂COOH、もしくは-NHCH(COOH)CH₂CH₂COOH(前記基は、L-ガンマ-GluもしくはD-ガンマ-Glu残基を表す)を表すか、または

式中、Xが、式 I d のリンカーを表し、

【化5】



前記リンカーは、3,4-ジアミノ-ピロリジンのR₁, R₂、もしくはS₁, S₂、もしくはR₁, S₁、もしくはR₂, S₂立体異性体を表し、

式中、

- - - が、R¹もしくはR²に対する共有結合を表し、

R⁴が、-(C=O)(CH₂)_p(C=O)-Wを表し、

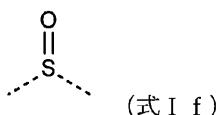
式中、pが、1~4の範囲の整数を表し、

Wが、-OH、-NHCH₂COOH、-NHC₂CH₂COOH、-NHC₂CH₂COOH、もしくは-NHCH(COOH)CH₂CH₂COOH(前記基は、L-ガンマ-GluもしくはD-ガンマ-Glu残基を表す)を表すか、または
·Xが、式Ieのリンカーを表し、
【化6】



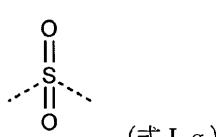
式中、

- - - - が、R¹もしくはR²に対する共有結合を表すか、または
·Xが、式Ifのリンカーを表し、
【化7】



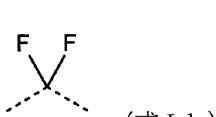
式中、

- - - - が、R¹もしくはR²に対する共有結合を表すか、または
·Xが、式Igのリンカーを表し、
【化8】



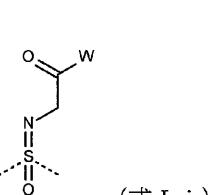
式中、

- - - - が、R¹もしくはR²に対する共有結合を表すか、または
·Xが、式Ihのリンカーを表し、
【化9】



式中、

- - - - が、R¹もしくはR²に対する共有結合を表すか、または
·Xが、式Iiのリンカーを表し、
【化10】

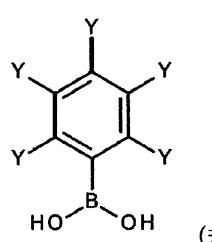


式中、

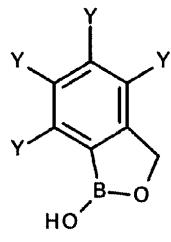
- - - - が、R¹もしくはR²に対する共有結合を表し、
Wが、-OH、-NHCH₂COOH、-NHCH₂CH₂COOH、-NHCH₂CH₂COOH、もしくは-NHCH(COOH)CH₂CH₂COOH(前記基は、L-ガンマ-GluもしくはD-ガンマ-Glu残基を表す)を表し、

R¹およびR²が、同一であっても異なっていてもよく、各々が式IIaまたはIIbの基を表し、

【化11】



(式IIa)、または



(式IIb)、

式中、

1~4つのYが、Hを表し、

Yが、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および/もしくはSO₂CF₃ではないか、または、Yのうちの1もしくは2つが、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および/もしくはSO₂CF₃を表し、

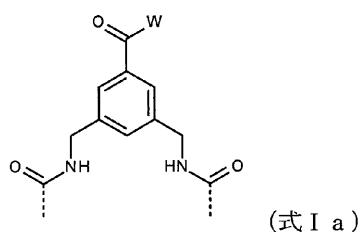
1つのYが、式IのXに対する付着点(を表す共有結合)を表し、

Xが式Ie、If、Ig、またはIhであるとき、R¹またはR²のいずれかにおける1つのYが、-(C=O)-Wを表し、式中、Wが、-OH、-NHCH₂COOH、-NHCH₂CH₂COOH、-NHCH₂CH₂CH₂COOH、または-NHCH(COOH)CH₂CH₂COOH(前記基は、L-ガンマ-GluもしくはD-ガンマ-Glu残基を表す)を表す、ジボロン化合物。

【請求項2】

式Iによって表される、請求項1に記載のジボロン化合物であって、式中、Xが、式Iaのリンカーを表し、

【化12】



(式Ia)

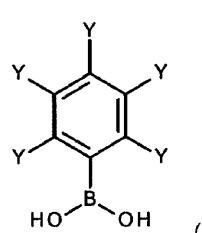
式中、

- - - - が、R¹またはR²に対する共有結合を表し、

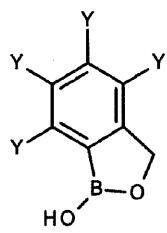
Wが、-OH、-NHCH₂COOH、-NHCH₂CH₂COOH、-NHCH₂CH₂COOH、または-NHCH(COOH)CH₂CH₂COOH(前記基は、L-ガンマ-GluもしくはD-ガンマ-Glu残基を表す)を表し、

R¹およびR²が、同一であっても異なっていてもよく、各々が式IIaまたはIIbの基を表し、

【化13】



(式IIa)、または



(式IIb)、

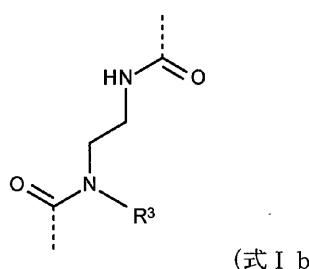
式中、

1つのYが、式IaのリンカーXに対する付着点（を表す共有結合）を表し、
 Yが、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および／もしくはSO₂CF₃ではないか、または、Yのうちの1もしくは2つが、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および／もしくはSO₂CF₃を表し、
 残りのYが、Hを表す、請求項1に記載のジボロン化合物。

【請求項3】

式Iによって表される、請求項1に記載のジボロン化合物であって、式中、Xが、式Ibのリンカーを表し、

【化14】

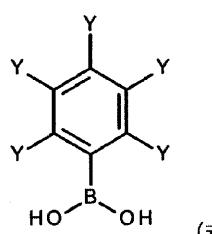


(式Ib)

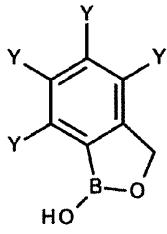
式中、

- - - - が、R¹またはR²に対する共有結合を表し、
 R³が、-(CH₂)_m(C=O)-Wを表し、
 式中、mが、1～4の範囲の整数を表し、
 Wが、OH、NHCH₂COOH、NHCH₂CH₂COOH、NHCH₂CH₂CH₂COOH、またはNHCH(COOH)CH₂CH₂COOH（前記基は、L-ガンマ-GluもしくはD-ガンマ-Glu残基を表す）を表し、
 R¹およびR²が、同一であっても異なっていてもよく、各々が式IIaまたはIIbの基を表し、

【化15】



(式IIa)、または



(式IIb)、

式中、

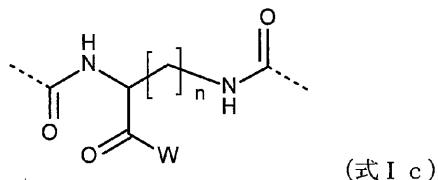
1つのYが、式IbのリンカーXに対する付着点（を表す共有結合）を表し、

Yが、F、C1、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および／もしくはSO₂CF₃ではないか、または、Yのうちの1もしくは2つが、F、C1、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および／もしくはSO₂CF₃を表し、残りのYが、Hを表す、請求項1に記載のジボロン化合物。

【請求項4】

式Iによって表される、請求項1に記載のジボロン化合物であって、式中、Xが、式Icのリンカーを表し、

【化16】



前記リンカーは、D-またはL-アミノ酸形態を表し、式中、

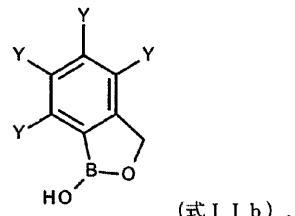
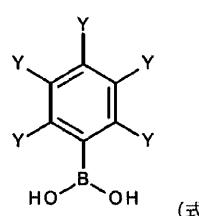
- - - - が、R¹またはR²に対する共有結合を表し、

nは、1～4の範囲の整数を表し、

Wが、-OH、-NHCH₂COOH、-NHCH₂CH₂COOH、-NHCH₂CH₂CH₂COOH、または-NHCH(COOH)CH₂CH₂COOH（前記基は、L-ガンマ-GluもしくはD-ガンマ-Glu残基を表す）を表し、

R¹およびR²が、同一であっても異なっていてもよく、各々が式IIaまたはIIbの基を表し、

【化17】



式中、

1つのYが、式IcのリンカーXに対する付着点（を表す共有結合）を表し、

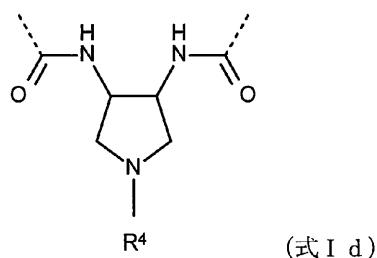
Yが、F、C1、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および／もしくはSO₂CF₃ではないか、または、Yのうちの1もしくは2つが、F、C1、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および／もしくはSO₂CF₃を表し、

残りのYが、Hを表す、請求項1に記載のジボロン化合物。

【請求項5】

式Iによって表される、請求項1に記載のジボロン化合物であって、式中、Xが、式Idのリンカーを表し、

【化 1 8】



前記リンカーは、3，4 - ディアミノ - ピロリジンのR¹，R²、またはS¹，S²、またはR³，S³、またはR⁴，S⁴立体異性体を表し、

式中、

- - - - が、R¹またはR²に対する共有結合を表し、

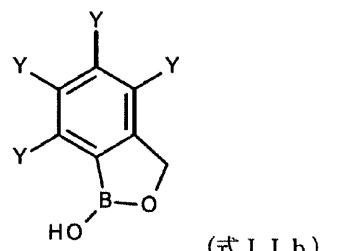
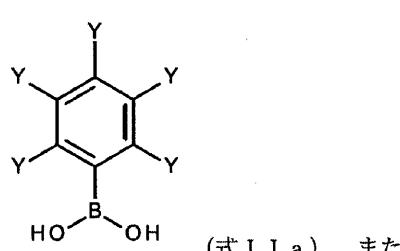
R⁴が、-(C=O)(CH₂)_p(C=O)-Wを表し、

式中、pが、1～4の範囲の整数を表し、

Wが、-OH、-NHCH₂COOH、-NHCH₂CH₂COOH、-NHCH₂CH₂CH₂COOH、-NHCH₂CH₂CH₂COOH、または-NHCH(COOH)CH₂CH₂CH₂COOH（前記基は、L-ガンマ-GルもしくはD-ガンマ-Gル残基を表す）を表し、

R¹およびR²が、同一であっても異なっていてもよく、各々が式IIaまたはIIbの基を表し、

【化 1 9】



式中、

1つのYが、式I dのリンカーXに対する付着点（を表す共有結合）を表し、

Yが、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および／もしくはSO₂CF₃ではないか、または、Yのうちの1もしくは2つが、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および／もしくはSO₂CF₃を表し、

残りのYが、Hを表す、請求項1に記載のジボロン化合物。

【請求項 6】

式Iによって表される、請求項1に記載のジボロン化合物であって、式中、Xが、式I eのリンカーを表し、

【化 2 0】



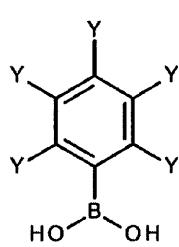
式中、

- - - - が、R¹またはR²に対する共有結合を表し、

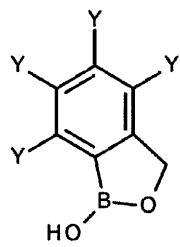
R¹およびR²が、同一であっても異なっていてもよく、各々が式IIaまたはIIb

の基を表し、

【化21】



(式IIa)、または



(式IIb)、

式中、

1つのYが、式Ieのリンカー-CO-に対する付着点(を表す共有結合)を表し、
R¹またはR²のいずれかにおける1つのYが、-(C=O)-Wを表し、式中、Wが
-OH、-NHCH₂COOH、-NHCH₂CH₂COOH、-NHCH₂CH₂CH₂COOH、または-NHCH(COOH)CH₂CH₂COOH(前記基は、L-ガ
ンマ-GluもしくはD-ガンマ-Glu残基を表す)を表し、

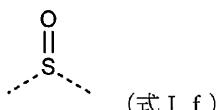
Yが、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および/もしく
はSO₂CF₃ではないか、または、Yのうちの1もしくは2つが、F、Cl、CF₂、
CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および/もしくはSO₂CF₃を表し、

Yの残りが、Hを表す、請求項1に記載のジボロン化合物。

【請求項7】

式Iによって表される、請求項1に記載のジボロン化合物であって、式中、Xが、式Ifのリンカーを表し、

【化22】

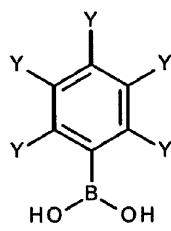


(式If)

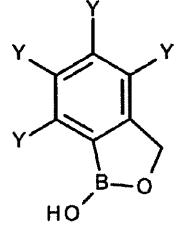
式中、

- - - - が、R¹またはR²に対する共有結合を表し、
R¹およびR²が、同一であっても異なっていてもよく、各々が式IIaまたはIIb
の基を表し、

【化23】



(式IIa)、または



(式IIb)、

式中、

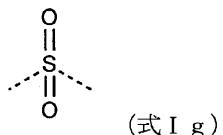
1つのYが、式Ifのリンカー-SO-に対する付着点(を表す共有結合)を表し、
R¹またはR²のいずれかにおける1つのYが、-(C=O)-Wを表し、式中、Wが
-OH、-NHCH₂COOH、-NHCH₂CH₂COOH、-NHCH₂CH₂CH₂COOH、または-NHCH(COOH)CH₂CH₂COOH(前記基は、L-ガ
ンマ-GluもしくはD-ガンマ-Glu残基を表す)を表し、

Yが、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および／もしくはSO₂CF₃ではないか、または、Yのうちの1もしくは2つが、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および／もしくはSO₂CF₃を表し、残りのYが、Hを表す、請求項1に記載のジボロン化合物。

【請求項8】

式Iによって表される、請求項1に記載のジボロン化合物であって、式中、Xが、式Igのリンカーを表し、

【化24】

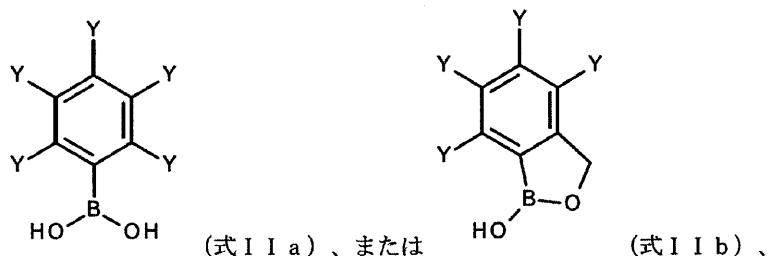


式中、

- - - が、R¹またはR²に対する共有結合を表し、

R¹およびR²が、同一であっても異なっていてもよく、各々が式IIaまたはIIbの基を表し、

【化25】



式中、

1つのYが、式Igのリンカー-(SO₂)-に対する付着点(を表す共有結合)を表し、

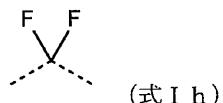
R¹またはR²のいずれかにおける1つのYが、-(C=O)-Wを表し、式中、Wが、-OH、-NHCH₂COOH、-NHCH₂CH₂COOH、-NHCH₂CH₂CH₂COOH、または-NHCH(COOH)CH₂CH₂COOH(前記基は、L-ガンマ-GluもしくはD-ガンマ-Glu残基を表す)を表し、

Yが、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および／もしくはSO₂CF₃ではないか、または、Yのうちの1もしくは2つが、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および／もしくはSO₂CF₃を表し、残りのYが、Hを表す、請求項1に記載のジボロン化合物。

【請求項9】

式Iによって表される、請求項1に記載のジボロン化合物であって、式中、Xが、式Ihのリンカーを表し、

【化26】

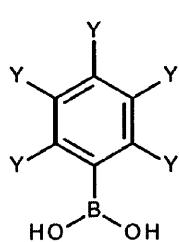


式中、

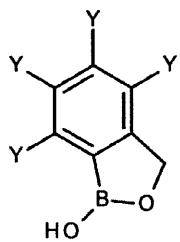
- - - が、R¹またはR²に対する共有結合を表し、

R^1 および R^2 が、同一であっても異なっていてもよく、各々が式 II a または II b の基を表し、

【化 27】



(式 II a) 、または



(式 II b) 、

式中、

1つのYが、式 I h のリンカー - (CF₂) - に対する付着点（を表す共有結合）を表し、

R^1 または R^2 のいずれかにおける1つのYが、- (C=O) - Wを表し、式中、Wが、- OH、- NHCH₂COOH、- NHCH₂CH₂COOH、- NHCH₂CH₂CH₂COOH、または- NHCH(COOH)CH₂CH₂CH₂COOH（前記基は、L- ガンマ- Glu もしくは D- ガンマ- Glu 残基を表す）を表し、

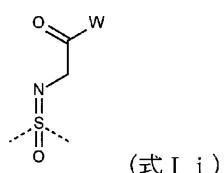
Yが、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および/もしくは SO₂CF₃ではないか、または、Yのうちの1もしくは2つが、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および/もしくは SO₂CF₃を表し、残りのYが、Hを表す、請求項1に記載のジボロン化合物。

【請求項10】

式 I によって表される、請求項1に記載のジボロン化合物であって、式中、

Xが、式 I i のリンカーを表し、

【化 28】



(式 I i)

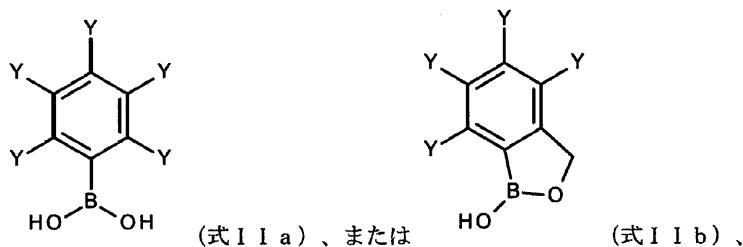
式中、

- - - - が、 R^1 または R^2 に対する共有結合を表し、

Wが、- OH、- NHCH₂COOH、- NHCH₂CH₂COOH、- NHCH₂CH₂CH₂COOH、または- NHCH(COOH)CH₂CH₂CH₂COOH（前記基は、L- ガンマ- Glu もしくは D- ガンマ- Glu 残基を表す）を表し、

R^1 および R^2 が、同一であっても異なっていてもよく、各々が式 II a または II b の基を表し、

【化29】



式中、

1つのYが、式Iiのリンカーエンジンに対する付着点（を表す共有結合）を表し、
Yが、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および／もしくは
SO₂CF₃ではないか、または、Yのうちの1もしくは2つが、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および／もしくはSO₂CF₃を表し、
残りのYが、Hを表す、請求項1に記載のジボロン化合物。

【請求項11】

3,5-ビス((4-ボロノ-2-フルオロベンズアミド)メチル)安息香酸、
3,5-ビス((4-ボロノ-3-フルオロベンズアミド)メチル)安息香酸、
N,N'-ビス(4-ボロノ-3-フルオロベンズアミド)-N-エチル-グリシンアミド、
(S)-2,4-ビス(4-ボロノ-3-フルオロベンズアミド)ブタン酸、
N-(7-フルオロ-1-ヒドロキシ-1,3-ジヒドロベンゾ[c][1,2]オキサボロール-6-カルボニル)-N-(2-(7-フルオロ-1-ヒドロキシ-1,3-ジヒドロベンゾ[c][1,2]オキサボロール-6-カルボキサミド)エチル)グリシン、
3,5-ビス((7-フルオロ-1-ヒドロキシ-1,3-ジヒドロベンゾ[c][1,2]オキサボロール-6-カルボキサミド)メチル)安息香酸、
N-(5-フルオロ-1-ヒドロキシ-1,3-ジヒドロベンゾ[c][1,2]オキサボロール-6-カルボニル)-N-(2-(5-フルオロ-1-ヒドロキシ-1,3-ジヒドロベンゾ[c][1,2]オキサボロール-6-カルボキサミド)エチル)グリシン、
N-(4-フルオロ-1-ヒドロキシ-1,3-ジヒドロベンゾ[c][1,2]オキサボロール-6-カルボニル)-N-(2-(4-フルオロ-1-ヒドロキシ-1,3-ジヒドロベンゾ[c][1,2]オキサボロール-6-カルボキサミド)エチル)グリシン、
N-(6-フルオロ-1-ヒドロキシ-1,3-ジヒドロベンゾ[c][1,2]オキサボロール-5-カルボニル)-N-(2-(6-フルオロ-1-ヒドロキシ-1,3-ジヒドロベンゾ[c][1,2]オキサボロール-5-カルボキサミド)エチル)グリシン、
N²,N⁶-ビス(6-フルオロ-1-ヒドロキシ-1,3-ジヒドロベンゾ[c][1,2]オキサボロール-5-カルボニル)-L-リジン、
3-ボロノ-5-((3-ボロノ-4-フルオロフェニル)スルホニル)-4-フルオロ安息香酸、
3-ボロノ-5-(3-ボロノ-5-フルオロベンゾイル)安息香酸、
3-ボロノ-5-(5-ボロノ-2,4-ジフルオロベンゾイル)安息香酸、
N⁶-(4-ボロノ-2-フルオロベンゾイル)-N²-(6-フルオロ-1-ヒドロキシ-1,3-ジヒドロベンゾ[c][1,2]-オキサボロール-5-カルボニル)-L-リジン、
(S)-2,3-ビス(7-フルオロ-1-ヒドロキシ-1,3-ジヒドロベンゾ[c]

[1 , 2] オキサボロール - 6 - カルボキサミド) - プロパン酸、
 (S) - 2 , 3 - ビス (5 - フルオロ - 1 - ヒドロキシ - 1 , 3 - ジヒドロベンゾ [c]
 [1 , 2] オキサボロール - 6 - カルボキサミド) - プロパン酸、
 (S) - 2 , 3 - ビス (4 - フルオロ - 1 - ヒドロキシ - 1 , 3 - ジヒドロベンゾ [c]
 [1 , 2] オキサボロール - 6 - カルボキサミド) - プロパン酸、
 (3 - ボロノ - 5 - ((3 - ボロノ - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル) ジフルオロ
 メチル) ベンゾイル) グリシン、
 (3 - ボロノ - 5 - (3 - ボロノ - 5 - (トリフルオロメチル) ベンゾイル) ベンゾイル
) グリシン、
 (3 - ボロノ - 5 - ((3 - ボロノ - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル) スルホニル
) グリシン、
 4 - ((3 S , 4 S) - 3 , 4 - ビス (7 - フルオロ - 1 - ヒドロキシ - 1 , 3 - ジヒド
 ロベンゾ [c] [1 , 2] オキサボロール - 6 - カルボキサミド) ピロリジン - 1 - イル
) - 4 - オキソブタン酸、
 (3 - ボロノ - 5 - (3 - ボロノ - 5 - フルオロベンゾイル) ベンゾイル) グリシン、
 (3 - (6 - ボロノ - 2 - (エトキシカルボニル) - 8 - フルオロ - 1 , 1 - ジオキシド
 - 4 H - ベンゾ [b] [1 , 4] チアジン - 4 - イル) - 5 - フルオロフェニル) ボロン
 酸、
 (3 - ボロノ - 5 - ((3 - ボロノ - 5 - フルオロフェニル) スルホニル) ベンゾイル)
 グリシン、
 N - (1 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) - 1 , 3 - ジヒドロベンゾ [c] [
 1 , 2] オキサボロール - 6 - カルボニル) - N - (2 - (1 - ヒドロキシ - 4 - (トリ
 フルオロメチル) - 1 , 3 - ジヒドロベンゾ [c] [1 , 2] オキサボロール - 6 - カル
 ボキサミド) - エチル) グリシン、
 (S) - 2 , 3 - ビス (1 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) - 1 , 3 - ジヒド
 ロベンゾ [c] [1 , 2] オキサボロール - 6 - カルボキサミド) プロパン酸、
 4 - ((3 S , 4 S) - 3 , 4 - ビス (1 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) -
 1 , 3 - ジヒドロベンゾ [c] [1 , 2] オキサボロール - 6 - カルボキサミド) ピロリ
 ジン - 1 - イル) - 4 - オキソブタン酸、
 (3 - ボロノ - 5 - ((3 - ボロノ - 5 - (ペンタフルオロ - ⁶ - スルファニル) フェ
 ニル) スルホニル) ベンゾイル) グリシン、
 2 - ((ビス (3 - ボロノ - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル) (オキソ) - 6 -
 スルファニリデン) アミノ) 酢酸、
 N - (4 - (ジフルオロメチル) - 1 - ヒドロキシ - 1 , 3 - ジヒドロベンゾ [c] [1
 , 2] オキサボロール - 6 - カルボニル) - N - (2 - (4 - (ジフルオロメチル) - 1
 - ヒドロキシ - 1 , 3 - ジヒドロベンゾ [c] [1 , 2] オキサボロール - 6 - カルボキ
 サミド) - エチル) グリシン、
 N - (4 - クロロ - 1 - ヒドロキシ - 1 , 3 - ジヒドロベンゾ [c] [1 , 2] オキサボ
 ロール - 6 - カルボニル) - N - (2 - (4 - クロロ - 1 - ヒドロキシ - 1 , 3 - ジヒド
 ロベンゾ [c] [1 , 2] オキサボロール - 6 - カルボキサミド) エチル) グリシン、
 3 - (2 , 3 - ビス (4 - クロロ - 1 - ヒドロキシ - 1 , 3 - ジヒドロベンゾ [c] [1
 , 2] オキサボロール - 6 - カルボキサミド) プロパンアミド) プロパン酸、
 2 - ((ビス (3 - ボロノ - 5 - (ジフルオロメチル) フェニル) (オキソ) - 6 -
 スルファニリデン) アミノ) 酢酸、
 2 - ((ビス (3 - ボロノ - 5 - クロロフェニル) (オキソ) - 6 - スルファニリデン
) アミノ) 酢酸、
 2 - ((ビス (3 - ボロノフェニル) (オキソ) - 6 - スルファニリデン) アミノ) 酢
 酸、
 N - (1 - ヒドロキシ - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 3 - ジヒドロベンゾ [c] [
 1 , 2] オキサボロール - 6 - カルボニル) - N - (2 - (1 - ヒドロキシ - 5 - (トリ

フルオロメチル) - 1 , 3 - ジヒドロベンゾ [c] [1 , 2] オキサボロール - 6 - カルボキサミド) - エチル) グリシン、
 2 - ((ビス(1 - ヒドロキシ - 4 - (トリフルオロメチル) - 1 , 3 - ジヒドロベンゾ [c] [1 , 2] オキサボロール - 6 - イル)(オキソ) - 6 - スルファニリデン)アミノ)酢酸、
 (3 - ボロノ - 5 - ((3 - ボロノフェニル)スルホニル)ベンゾイル)グリシン、
 (S) - 2 , 3 - ビス(1 - ヒドロキシ - 1 , 3 - ジヒドロベンゾ [c] [1 , 2] オキサボロール - 6 - カルボキサミド)プロパン酸、
 N - (1 - ヒドロキシ - 4 - (メチルスルホニル) - 1 , 3 - ジヒドロベンゾ [c] [1 , 2] オキサボロール - 6 - カルボニル) - N - (2 - (1 - ヒドロキシ - 4 - (メチルスルホニル) - 1 , 3 - ジヒドロベンゾ [c] [1 , 2] オキサボロール - 6 - カルボキサミド) - エチル)グリシン、
 N - (1 - ヒドロキシ - 4 - ((トリフルオロメチル)スルホニル) - 1 , 3 - ジヒドロベンゾ [c] [1 , 2] オキサボロール - 6 - カルボニル) - N - (2 - (1 - ヒドロキシ - 4 - ((トリフルオロメチル)スルホニル) - 1 , 3 - ジヒドロベンゾ [c] [1 , 2] オキサボロール - 6 - カルボキサミド)エチル)グリシン、
 4 - ボロノ - 2 - ((3 - ボロノ - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル)スルホニル) - 6 - (トリフルオロメチル)安息香酸、および
 2 - ((ビス(3 - ボロノ - 5 - (トリフルオロメトキシ)フェニル)(オキソ) - 6 - スルファニリデン)アミノ)酢酸からなる群から選択される、請求項1に記載のジボロン化合物。

【請求項12】

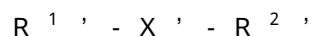
請求項1～11のいずれか一項に記載のジボロン化合物が、任意のリンカーを介して原薬にコンジュゲートしている、ジボロンコンジュゲート。

【請求項13】

前記ジボロン化合物が、前記ジボロン化合物のカルボン酸部分の誘導体化によって、任意のリンカーを介して前記原薬にコンジュゲートしている、請求項12に記載のジボロンコンジュゲート。

【請求項14】

一般式I' :

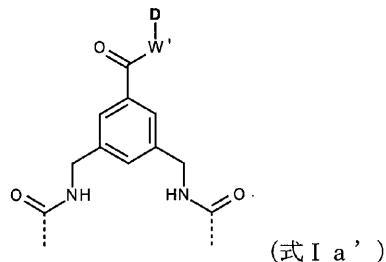


によって表される、ジボロンコンジュゲートであって、

式I' 中、

X' が、式Ia'のリンカーを表し、

【化30】



式中、

R¹' が、R²'もしくはR²に対する共有結合を表し、

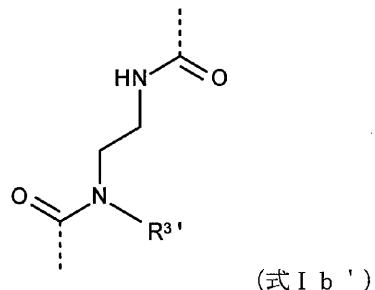
Dが、原薬を表し、

W'が、共有結合、もしくは-NHCH₂(C=O)-、-NHCH₂CH₂(C=O)-、-NHCH₂CH₂CH₂(C=O)-、および-NHCH(COOH)CH₂C

H_2 ($C = O$) - (前記基は、L-ガンマ-GluもしくはD-ガンマ-Glu残基を表す)からなる群から選択されるリンカーを表すか、または

$\cdot X'$ が、式Ib'のリンカーを表し、

【化31】



式中、

- - - が、 R^1 、もしくは R^2 に対する共有結合を表し、

R^3 、が、-(CH_2) m 、($C = O$) - W' - D を表し、式中、

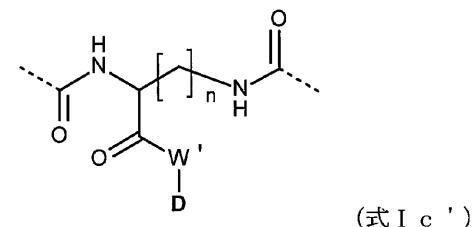
m が、1~4の範囲の整数を表し、

W' が、共有結合、もしくは- $NHCH_2(C = O)$ -、- $NHCH_2CH_2(C = O)$ -、- $NHCH_2CH_2CH_2(C = O)$ -、および- $NHCH(COOH)CH_2CH_2(C = O)$ - (前記基は、L-ガンマ-GluもしくはD-ガンマ-Glu残基を表す)からなる群から選択されるリンカーを表し、

D が、原薬を表すか、または

$\cdot X'$ が、式Ic'のリンカーを表し、

【化32】



前記リンカーは、 D -もしくはL-アミノ酸形態を表し、

式中、

- - - が、 R^1 、もしくは R^2 に対する共有結合を表し、

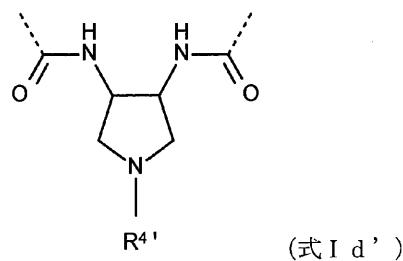
n が、1~4の範囲の整数を表し、

W' が、共有結合、もしくは- $NHCH_2(C = O)$ -、- $NHCH_2CH_2(C = O)$ -、- $NHCH_2CH_2CH_2(C = O)$ -、および- $NHCH(COOH)CH_2CH_2(C = O)$ - (前記基は、L-ガンマ-GluもしくはD-ガンマ-Glu残基を表す)からなる群から選択されるリンカーを表し、

D が、原薬を表すか、または

$\cdot X'$ が、式Id'のリンカーを表し、

【化33】



前記リンカーは、3，4-ジアミノ-ピロリジンのR，R、もしくはS，S、もしくはR，S、もしくはR，S立体異性体を表し、

式中、

- - - - が、R¹、もしくはR²、に対する共有結合を表し、

R⁴、が、-(C=O)(CH₂)_p、(C=O)-W'-Dを表し、式中、

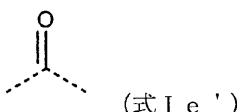
W'が、共有結合、もしくは-NHCH₂(C=O)-、-NHCH₂CH₂(C=O)-、-NHCH₂CH₂CH₂(C=O)-、および-NHCH(COOH)CH₂CH₂(C=O)-（前記基は、L-ガンマ-GluもしくはD-ガンマ-Glu残基を表す）からなる群から選択されるリンカーを表し、

式中、p'が、1~4の範囲の整数を表し、

Dが、原薬を表すか、または

·X'が、式I e'のリンカーを表し、

【化34】

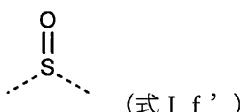


式中、

- - - - が、R¹、もしくはR²、に対する共有結合を表すか、または

·X'が、式I f'のリンカーを表し、

【化35】

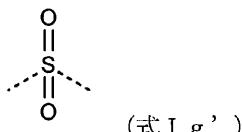


式中、

- - - - が、R¹、もしくはR²、に対する共有結合を表すか、または

·X'が、式I g'のリンカーを表し、

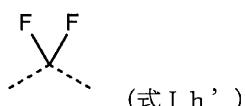
【化36】



式中、

- - - が、R¹、もしくはR²に対する共有結合を表すか、または
- X' が、式I h'のリンカーを表し、

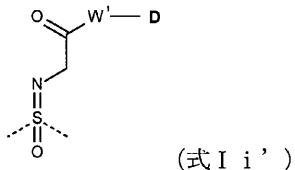
【化37】



式中、

- - - が、R¹、もしくはR²に対する共有結合を表すか、または
- X' が、式I i'のリンカーを表し、

【化38】

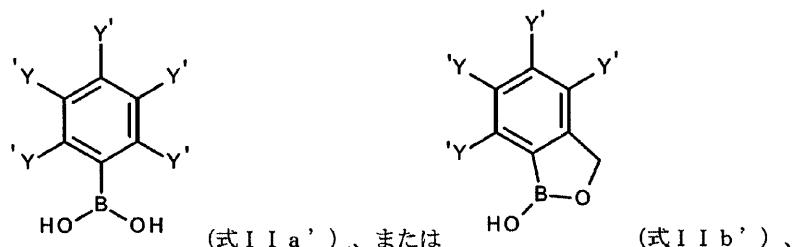


式中、

- - - が、R¹、もしくはR²に対する共有結合を表し、
W' が、共有結合、もしくは-NHCH₂(C=O)-、-NHCH₂CH₂(C=O)-、-NHCH₂CH₂CH₂(C=O)-、および-NHCH(COOH)CH₂CH₂(C=O)-（前記基は、L-ガンマ-GluもしくはD-ガンマ-Glu残基を表す）からなる群から選択されるリンカーを表し、

R¹、およびR²が、同一であっても異なっていてもよく、各々が式II a'または式II b'の基を表し、

【化39】



式中、

1~4つのY'が、Hを表し、

Y'が、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および/もしくはSO₂CF₃ではないか、または、1もしくは2つのY'が、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および/もしくはSO₂CF₃を表し、

1つのY'が、式I'のX'に対する付着点（を表す共有結合）を表し、

- X'が、式I e'、I f'、I g'、またはI h'であるとき、R¹またはR²のいずれかにおける1つのYが、-(C=O)-W'-Dを表し、式中、W'が、共有結合、もしくは-NHCH₂(C=O)-、-NHCH₂CH₂(C=O)-、-NHCH₂CH₂CH₂(C=O)-、および-NHCH(COOH)CH₂CH₂(C=O)-（前記基は、L-ガンマ-GluもしくはD-ガンマ-Glu残基を表す）からなる群から選択されるリンカーを表し、Dが、原薬を表す、

ジボロンコンジュゲート。

【請求項 1 5】

請求項 1 2 ~ 1 4 のいずれか一項に記載のジボロンコンジュゲートの製造のための中間化合物として使用するための、請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載のジボロン化合物。

【請求項 1 6】

請求項 1 2 ~ 1 4 のいずれか一項に記載のジボロンコンジュゲートを含む、医薬組成物

。