

【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 0 7 F 5/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/54 (2017.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

【F I】

C 0 7 F 5/02 C S P C

A 6 1 K 47/54

A 6 1 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】

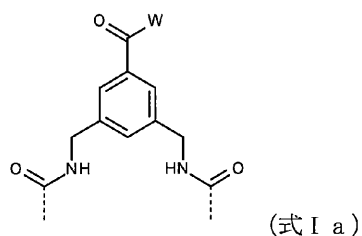


によって表されるジボロン化合物であって、

・式 I 中、

・X が、式 I a のリンカーを表し、

【化 2】



式中、

- - - が、 R^1 もしくは R^2 に対する共有結合を表し、

W が、 $-OH$ 、 $-NHCH_2COOH$ 、 $-NHCH_2CH_2COOH$ 、 $-NHCH_2CH_2CH_2COOH$ 、もしくは $-NHCH(COOH)CH_2CH_2COOH$ (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 I b のリンカーを表し、

CC(=O)NCCN(C)C(=O)C

(式 I b)

・ X が、式 I c のリンカーを表し、

$$\text{---} \text{C}(=\text{O})\text{NH} \text{---} \text{CH}(\text{C}(=\text{O})\text{W}) \text{---} [\text{CH}_2]_n \text{---} \text{NH} \text{C}(=\text{O}) \text{---}$$

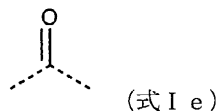
(式 I c)

・式中、Xが、式I dのリンカーを表し、

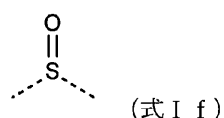
(式 I d)

式中、 p が、 $1 \sim 4$ の範囲の整数を表し、

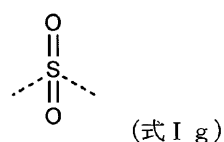
Wが、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NHCH}_2\text{COOH}$ 、 $-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{COOH}$ 、 $-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{COOH}$ 、もしくは $-\text{NHCH}(\text{COOH})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{COOH}$ （前記基は、L-ガンマ-GluもしくはD-ガンマ-Glu残基を表す）を表すか、または
 ・Xが、式I eのリンカーを表し、
 【化6】



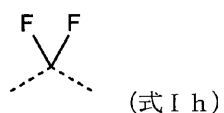
式中、
 - - - が、 R^1 もしくは R^2 に対する共有結合を表すか、または
 ・Xが、式I fのリンカーを表し、
 【化7】



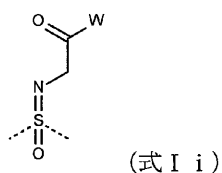
式中、
 - - - が、 R^1 もしくは R^2 に対する共有結合を表すか、または
 ・Xが、式I gのリンカーを表し、
 【化8】



式中、
 - - - が、 R^1 もしくは R^2 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9】

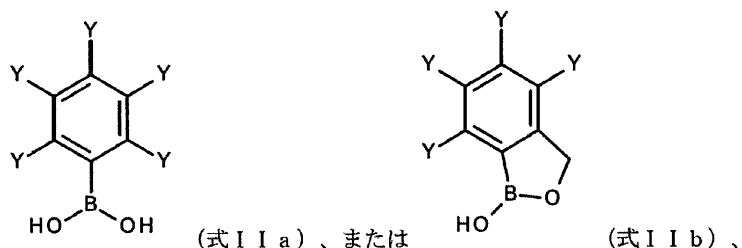


式中、
 - - - が、 R^1 もしくは R^2 に対する共有結合を表すか、または
 ・Xが、式I iのリンカーを表し、
 【化10】



式中、

- - - が、 R^1 もしくは R^2 に対する共有結合を表し、
 W が、 $-OH$ 、 $-NHCH_2COOH$ 、 $-NHCH_2CH_2COOH$ 、 $-NHCH_2CH_2CH_2COOH$ 、もしくは $-NHCH(COOH)CH_2CH_2COOH$ (前記基は、 L -ガンマ- $Gl u$ もしくは D -ガンマ- $Gl u$ 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もよく、各々が式 $II a$ または $II b$ の基を表し、
 【化 1 1】



式中、

1 ~ 4 つの Y が、 H を表し、

Y が、 F 、 Cl 、 CF_2 、 CF_3 、 SF_5 、 OCF_3 、 SO_2CH_3 、および / もしくは SO_2CF_3 ではないか、または、 Y のうちの 1 もしくは 2 つが、 F 、 Cl 、 CF_2 、 CF_3 、 SF_5 、 OCF_3 、 SO_2CH_3 、および / もしくは SO_2CF_3 を表し、

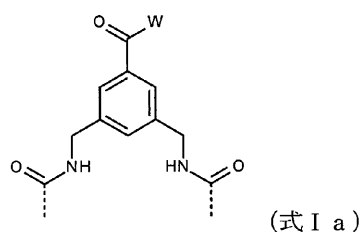
1 つの Y が、式 I の X に対する付着点 (を表す共有結合) を表し、

X が式 $I e$ 、 $I f$ 、 $I g$ 、または $I h$ であるとき、 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、 $-OH$ 、 $-NHCH_2COOH$ 、 $-NHCH_2CH_2COOH$ 、 $-NHCH_2CH_2CH_2COOH$ 、または $-NHCH(COOH)CH_2CH_2COOH$ (前記基は、 L -ガンマ- $Gl u$ もしくは D -ガンマ- $Gl u$ 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 $I a$ のリンカーを表し、

【化 1 2】



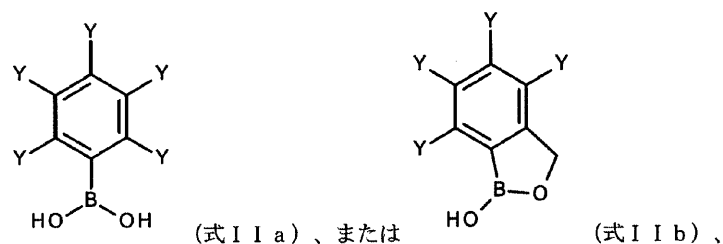
式中、

- - - が、 R^1 または R^2 に対する共有結合を表し、

W が、 $-OH$ 、 $-NHCH_2COOH$ 、 $-NHCH_2CH_2COOH$ 、 $-NHCH_2CH_2CH_2COOH$ 、または $-NHCH(COOH)CH_2CH_2COOH$ (前記基は、 L -ガンマ- $Gl u$ もしくは D -ガンマ- $Gl u$ 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もよく、各々が式 $II a$ または $II b$ の基を表し、

【化 1 3】



式中、

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

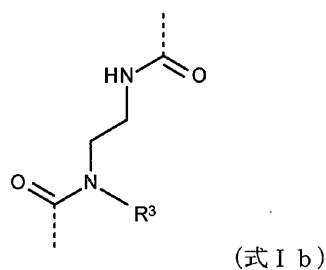
Yが、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および/もしくは SO₂CF₃ ではないか、または、Yのうちの1もしくは2つが、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および/もしくは SO₂CF₃ を表し、

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 I b のリンカーを表し、

【化 1 4】



式中、

- - - が、R¹ または R² に対する共有結合を表し、

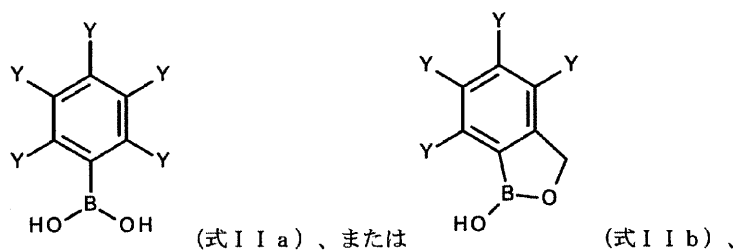
R³ が、- (CH₂)_m (C=O) - W を表し、

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(CH₂COOH)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もよく、各々が式 I I a または I I b の基を表し、

【化 1 5】



式中、

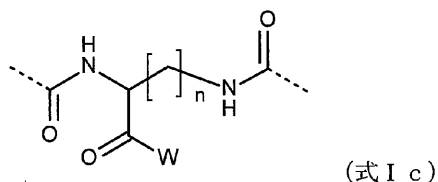
1つのYが、式 I b のリンカー X に対する付着点（を表す共有結合）を表し、

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 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 I c 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、

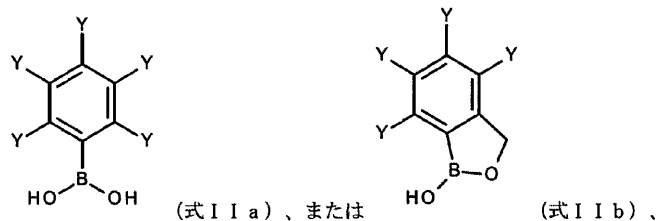
- - - が、R¹ または R² に対する共有結合を表し、

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もよく、各々が式 I I a または I I b の基を表し、

【化 17】



式中、

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

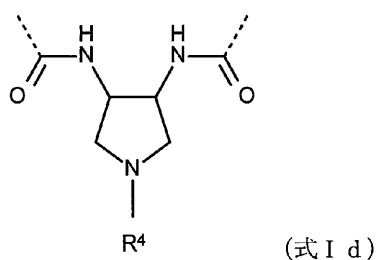
Y が、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および/もしくは SO₂CF₃ ではないか、または、Y のうちの 1 もしくは 2 つが、F、Cl、CF₂、CF₃、SF₅、OCF₃、SO₂CH₃、および/もしくは SO₂CF₃ を表し、

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 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 I d のリンカーを表し、

【化 1 8】



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

式中、

- - - が、 R^1 または R^2 に対する共有結合を表し、

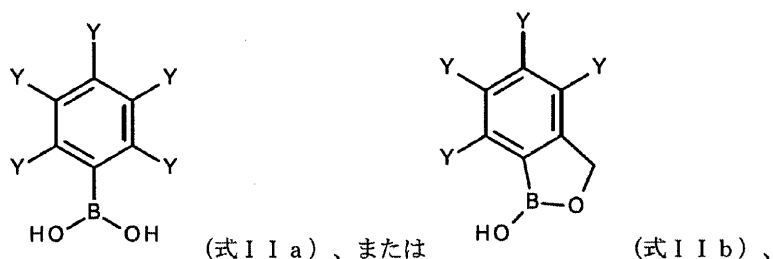
R^4 が、 $-(C=O)(CH_2)_p(C=O)-W$ を表し、

式中、 p が、1 ~ 4 の範囲の整数を表し、

W が、 $-OH$ 、 $-NHCH_2COOH$ 、 $-NHCH_2CH_2COOH$ 、 $-NHCH_2CH_2CH_2COOH$ 、または $-NHCH(COOH)CH_2CH_2COOH$ (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もよく、各々が式 I I a または I I b 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、

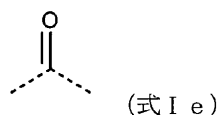
Y が、F、Cl、 CF_2 、 CF_3 、 SF_5 、 OCF_3 、 SO_2CH_3 、および / もしくは SO_2CF_3 ではないか、または、 Y のうちの 1 もしくは 2 つが、F、Cl、 CF_2 、 CF_3 、 SF_5 、 OCF_3 、 SO_2CH_3 、および / もしくは SO_2CF_3 を表し、

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】



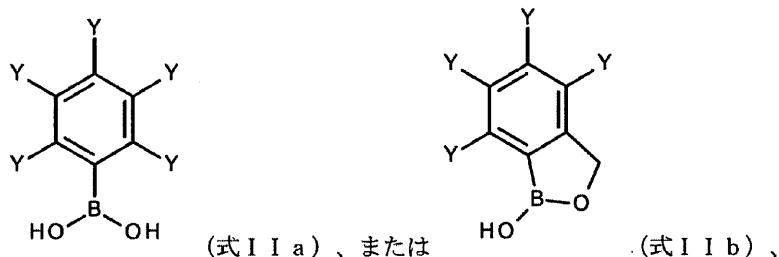
式中、

- - - が、 R^1 または R^2 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もよく、各々が式 I I a または I I b

の基を表し、

【化 2 1】



式中、

1つのYが、式 I e のリンカー - C O - 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)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 I f のリンカーを表し、

【化 2 2】

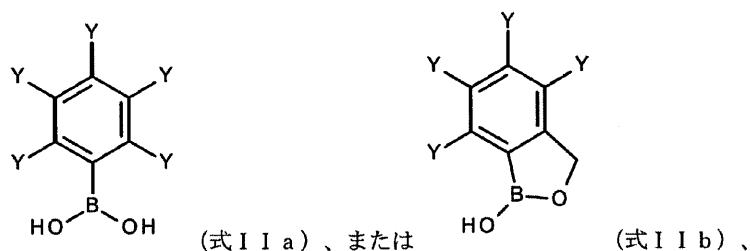


式中、

- - - が、 R^1 または R^2 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もよく、各々が式 I I a または I I b の基を表し、

【化 2 3】



式中、

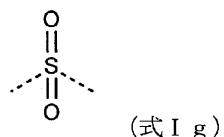
1つのYが、式 I f のリンカー - S O - に対する付着点（を表す共有結合）を表し、
 R^1 または R^2 のいずれかにおける1つのYが、- (C = O) - Wを表し、式中、Wが
 - OH、- NHCH₂COOH、- NHCH₂CH₂COOH、- NHCH₂CH₂CH₂COOH、または - NHCH(COOH)CH₂CH₂COOH（前記基は、L - ガンマ - Glu もしくは D - ガンマ - Glu 残基を表す）を表し、

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 I g のリンカーを表し、

【化 2 4】

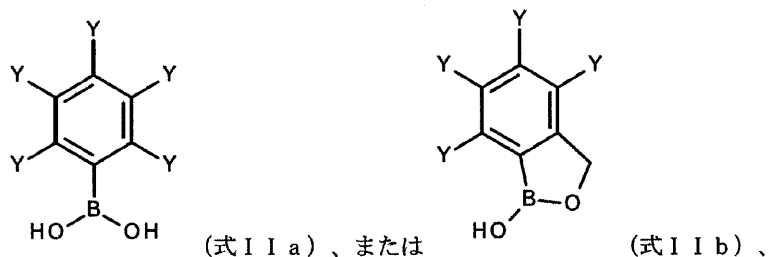


式中、

- - - 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もよく、各々が式 I I a または I I b の基を表し、

【化 2 5】



式中、

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

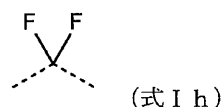
R¹ または R² のいずれかにおける 1 つの Y が、- (C=O) - W を表し、式中、W が、- OH、- NHCH₂COOH、- NHCH₂CH₂COOH、- NHCH₂CH₂CH₂COOH、または - NHCH(COOH)CH₂CH₂COOH (前記基は、L - ガンマ - Glu もしくは D - ガンマ - Glu 残基を表す) を表し、

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 I h のリンカーを表し、

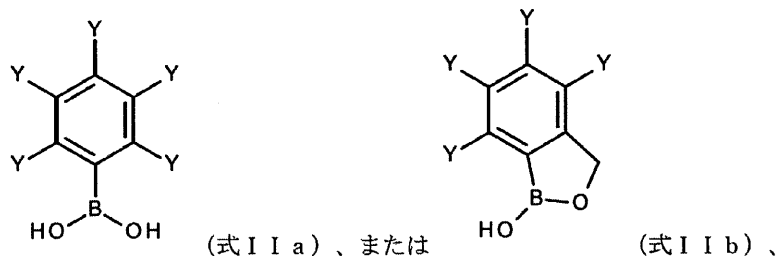
【化 2 6】



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もよく、各々が式 I I a または I I b の基を表し、
【化 2 7】



式中、

1 つの Y が、式 I h のリンカー - (CF_2) - 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、 $-OH$ 、 $-NHCH_2COOH$ 、 $-NHCH_2CH_2COOH$ 、 $-NHCH_2CH_2CH_2COOH$ 、または $-NHCH(COOH)CH_2CH_2COOH$ (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 、 CF_2 、 CF_3 、 SF_5 、 OCF_3 、 SO_2CH_3 、および / もしくは SO_2CF_3 ではないか、または、 Y のうちの 1 もしくは 2 つが、 F 、 Cl 、 CF_2 、 CF_3 、 SF_5 、 OCF_3 、 SO_2CH_3 、および / もしくは SO_2CF_3 を表し、

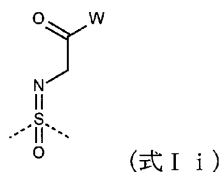
残りの Y が、 H を表す、請求項 1 に記載のジボロン化合物。

【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 2 8】



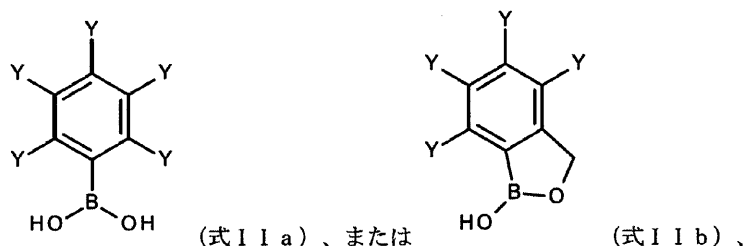
式中、

- - - が、 R^1 または R^2 に対する共有結合を表し、

W が、 $-OH$ 、 $-NHCH_2COOH$ 、 $-NHCH_2CH_2COOH$ 、 $-NHCH_2CH_2CH_2COOH$ 、または $-NHCH(COOH)CH_2CH_2COOH$ (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もよく、各々が式 I I a または I I b の基を表し、

【化 2 9】



式中、

1つのYが、式I i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 - グリシニアミド、
 (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 1 2】

請求項 1 ~ 1 1 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 1 3】

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 1 2 に記載のジボロンコンジュゲート。

【請求項 1 4】

一般式 I' :

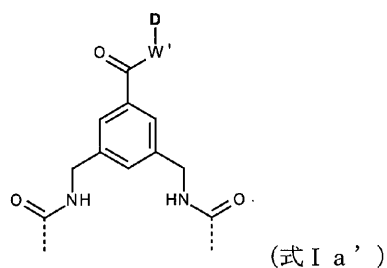
$R^{1'} - X' - R^{2'}$

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 I a' のリンカーを表し、

【化 3 0】



式中、

- - - が、 $R^{1'}$ もしくは $R^{2'}$ 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

・ X ' が、式 I b ' のリンカーを表し、

NC(=O)CCN(C(=O)*)

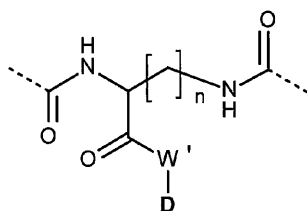
(式 I b')

- - - が、 R^1 、もしくは R^2 、に対する共有結合を表し、

m' が、1 ~ 4 の範囲の整数を表し、

D が、原薬を表すか、または

【化 3 2】



(式 I c ')

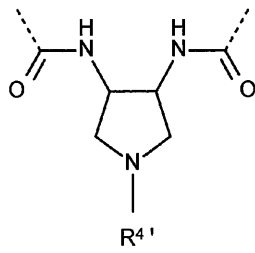
式中、

n' 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 $I d'$ のリンカーを表し、

【化 3 3】



(式 I d')

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、 R^1 、もしくは R^2 に対する共有結合を表し、

R^4 が、 $-(C=O)(CH_2)_p-(C=O)-W'-D$ を表し、式中、

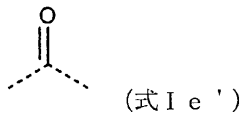
W' が、共有結合、もしくは $-NHCH_2(C=O)-$ 、 $-NHCH_2CH_2(C=O)-$ 、 $-NHCH_2CH_2CH_2(C=O)-$ 、および $-NHCH(COOH)CH_2CH_2(C=O)-$ (前記基は、L - ガンマ - Glu もしくは D - ガンマ - Glu 残基を表す) からなる群から選択されるリンカーを表し、

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 3 4】



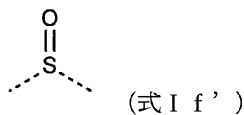
(式 I e')

式中、

- - - が、 R^1 、もしくは R^2 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 3 5】



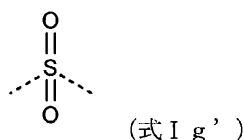
(式 I f')

式中、

- - - が、 R^1 、もしくは R^2 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、

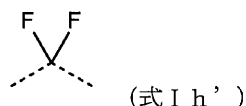
【化 3 6】



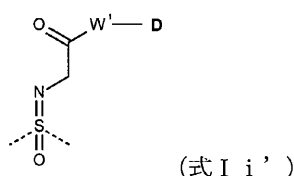
(式 I g')

式中、

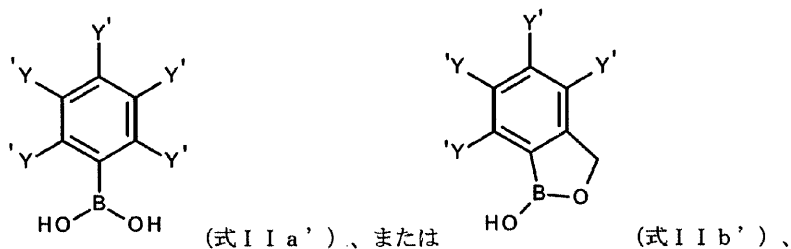
- - - が、 R^1 、もしくは R^2 に対する共有結合を表すか、または
 ・X'が、式I h'のリンカーを表し、
 【化37】



式中、
 - - - が、 R^1 、もしくは R^2 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、 R^1 、もしくは R^2 に対する共有結合を表し、
 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、
 R^1 、および R^2 が、同一であっても異なってもよく、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、 CF_2 、 CF_3 、 SF_5 、 OCF_3 、 SO_2CH_3 、および/もしくは SO_2CF_3 ではないか、または、1もしくは2つのY'が、F、Cl、 CF_2 、 CF_3 、 SF_5 、 OCF_3 、 SO_2CH_3 、および/もしくは SO_2CF_3 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、 R^1 または R^2 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 $-NHCH_2(C=O)-$ 、 $-NHCH_2CH_2(C=O)-$ 、 $-NHCH_2CH_2CH_2(C=O)-$ 、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、

ジボロンコンジュゲート。

【請求項 15】

請求項 12 ~ 14 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 ~ 11 のいずれか一項に記載のジボロン化合物。

【請求項 16】

請求項 12 ~ 14 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

。