

【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】平成30年9月27日(2018.9.27)

【公表番号】特表2014-513717(P2014-513717A)

【公表日】平成26年6月5日(2014.6.5)

【年通号数】公開・登録公報2014-029

【出願番号】特願2014-510930(P2014-510930)

【国際特許分類】

A 6 1 K	47/50	(2017.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/704	(2006.01)
A 6 1 K	47/42	(2017.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	47/16	(2006.01)
A 6 1 K	39/395	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	47/48	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 K	31/704	
A 6 1 K	47/42	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	43/00	1 2 3
A 6 1 K	47/16	
A 6 1 K	39/395	C
A 6 1 K	39/395	L

【誤訳訂正書】

【提出日】平成30年8月10日(2018.8.10)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

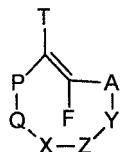
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

プロドラッグ化合物とアクチベータ化合物とを含むプロドラッグキットであって、前記プロドラッグ化合物は、トリガー部分 T^R に結合された薬物 D^D を含み、前記トリガー部分は、ジエノフィルを含み、前記アクチベータ化合物は、前記ジエノフィルと反応可能であるジエンを含み、前記ジエノフィルは、下記式(1a)を含み：

【化70】



(1a)

(式(1a)中、T、Fは、各々独立して、H又はアルキル、F、Cl、Br又はIから構成される群から選択される置換基を意味し；記号A、P、Q、X、Y及びZの意味は、下記(1)～(6)から構成される群から選択され、

(1) 結合PQ、QP、QX、XQ、XZ、ZX、ZY、YZ、YA、AYの1つは、-CR^aX^D-CR^aY^D-から構成され、それ以外のA、Y、Z、X、Q、Pによって構成される基は、CR^a₂であり、O-O、O-S及びS-Sから構成される群から選択された隣接原子ペアは存在せず；X^DはO-C(O)-(L^D)_n-(D^D)、S-C(O)-(L^D)_n-(D^D)、O-C(S)-(L^D)_n-(D^D)、S-C(S)-(L^D)_n-(D^D)、NR^c-C(O)-(L^D)_n-(D^D)、NR^c-C(S)-(L^D)_n-(D^D)であり；かつY^DはNHR^c、OH、SHであり；又はX^DはC(O)-(L^D)_n-(D^D)、C(S)-(L^D)_n-(D^D)であり；かつY^DはCR^c₂NHR^c、CR^c₂OH、CR^c₂SH、NH-NH₂、O-NH₂又はNH-OHである；

(2) AはCR^aX^DでありかつZはCR^aY^Dである、又はZはCR^aX^DでありかつAはCR^aY^Dである、又は、PはCR^aX^DでありかつXはCR^aY^Dである、又はXはCR^aX^DでありかつPはCR^aY^Dであり、X^D及びY^Dは互いに関連してトランス型に配置され；それ以外のA、Y、Z、X、Q、及びPによって構成される基は、CR^a₂であり、O-O、O-S及びS-Sから構成される群から選択された隣接原子ペアは存在せず；X^Dは、O-C(O)-(L^D)_n-(D^D)、S-C(O)-(L^D)_n-(D^D)、O-C(S)-(L^D)_n-(D^D)、S-C(S)-(L^D)_n-(D^D)、NR^c-C(O)-(L^D)_n-(D^D)、NR^c-C(S)-(L^D)_n-(D^D)であり、かつY^DはNHR^c、OH、SH、CR^c₂NHR^c、CR^c₂OH、CR^c₂SH、NH-NH₂、O-NH₂又はNH-OHである；又はX^DはCR^c₂-O-C(O)-(L^D)_n-(D^D)、CR^c₂-S-C(O)-(L^D)_n-(D^D)、CR^c₂-O-C(S)-(L^D)_n-(D^D)、CR^c₂-S-C(S)-(L^D)_n-(D^D)、CR^c₂-NR^c-C(O)-(L^D)_n-(D^D)、CR^c₂-NR^c-C(S)-(L^D)_n-(D^D)であり、かつY^DはNHR^c、OH、SHである；又はX^DはC(O)-(L^D)_n-(D^D)、C(S)-(L^D)_n-(D^D)であり；かつY^DはCR^c₂NHR^c、CR^c₂OH、CR^c₂SH、NH-NH₂、O-NH₂、NH-OHである；

(3) AはCR^aY^Dであり、かつ、P、Q、X、Zの1つはCR^aX^Dであり、又は、PはCR^aY^Dであり、かつ、A、Y、Z、Xの1つはCR^aX^Dである、又はYはCR^aY^Dであり、かつX又はPはCR^aX^Dである、又は、QはCR^aY^Dであり、かつ、Z又はAはCR^aX^Dである、又は、Z又はXのいずれかはCR^aY^Dであり、かつ、A又はPはCR^aX^Dであり、X^D及びY^Dは互いに関連してトランス型に配置され；それ以外のA、Y、Z、X、Q及びPによって構成される基は、CR^a₂であり、O-O、O-S及びS-Sを構成する群から選択された隣接原子ペアは存在せず；X^Dは(O-C(O))_p-(L^D)_n-(D^D)、S-C(O)-(L^D)_n-(D^D)、O-C(S)-(L^D)_n-(D^D)、S-C(S)-(L^D)_n-(D^D)であり、Y^DはCR^c₂NHR^c、CR^c₂OH、CR^c₂SH、NH-NH₂、O-NH₂、NH-OHであり；pは0又は1である；

(4) P は CR^aY^D であり、かつ、Y は CR^aX^D である、又は A は CR^aY^D であり、かつ、Q は CR^aX^D である、又は Q は CR^aY^D であり、かつ、A は CR^aX^D である、又は Y は CR^aY^D であり、かつ P は CR^aX^D であり、 X^D 及び Y^D は、互いに関連してトランス型に配置され；それ以外の A、Y、Z、X、Q 及び P から構成される基は、 CR^a_2 であり、O - O、O - S 及び S - S から構成される群から選択された隣接原子ペアは存在せず； X^D は $(O - C(O))_p - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $S - C(O) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $O - C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $S - C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ であり； Y^D は NHR^c 、 OH 、 SH であり；p は 0 又は 1 である；

(5) Y は Y^D であり、かつ、P は CR^aX^D である、又は Q は Y^D であり、かつ、A は CR^aX^D であり；それ以外の A、Y、Z、X、Q 及び P によって構成される基は、 CR^a_2 であり、O - O、O - S 及び S - S から構成される群から選択された隣接原子ペアは存在せず； X^D は $(O - C(O))_p - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $S - C(O) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $O - C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $S - C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $NR^c - C(O) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $NR^c - C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $C(O) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ であり； Y^D は NH であり；p は 0 又は 1 である；

(6) Y は Y^D であり、かつ、P 又は Q は X^D である、又は、Q は Y^D であり、かつ、A 又は Y は X^D であり；それ以外の A、Y、Z、X、Q 及び P によって構成される基は、 CR^a_2 であり、O - O、O - S、及び S - S から構成される群から選択された隣接原子ペアは存在せず； X^D は $N - C(O) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $N - C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ であり； Y^D は NH であり；

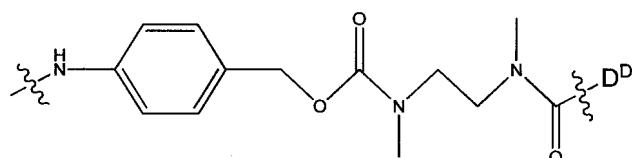
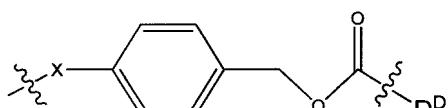
ここで、各々の R^a は、H であり；

各々の R^c は、H であり；

及び $(L^D)_n$ は、S、N、NH 又は O を介して T^R に結合された、 $n = 0$ 又は 1 を有するリンカーであり、ここで、これら S、N、NH 又は O 原子はリンカーの一部であり、直鎖状に及び / 又は分枝状に配置された複数のユニットを構成しても良く； D^D は、S、N、NH 又は O を介して結合された 1 つ以上の薬物であり、ここでこれら S、N、NH 又は O 原子は、治療的部の一部であり；

L^D は、

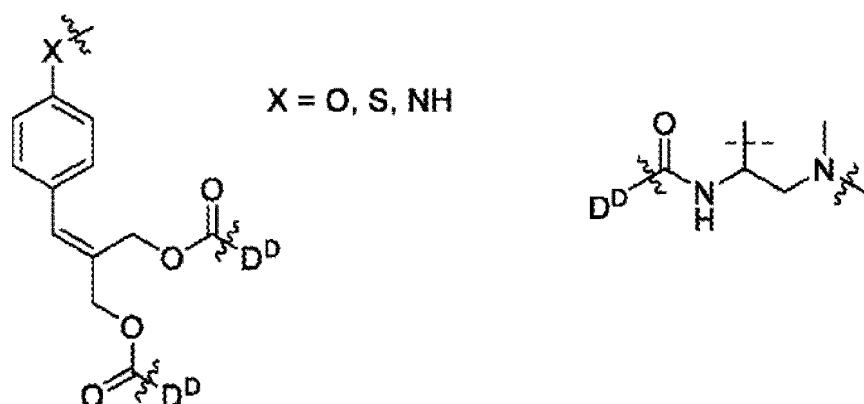
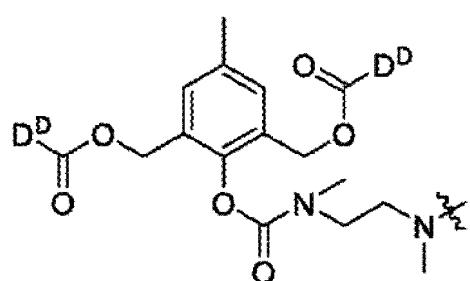
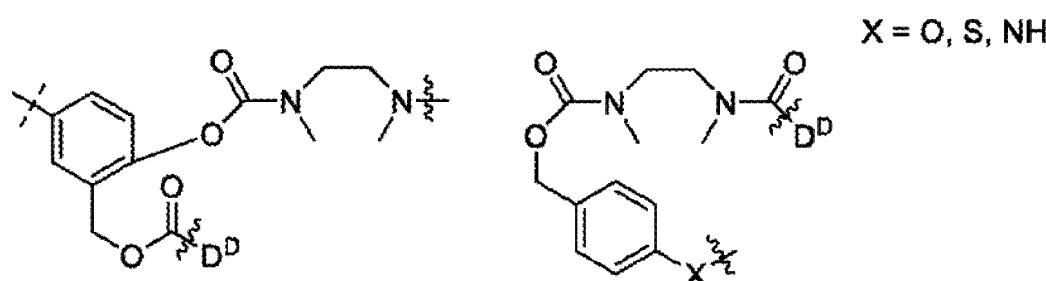
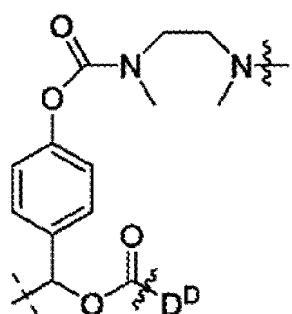
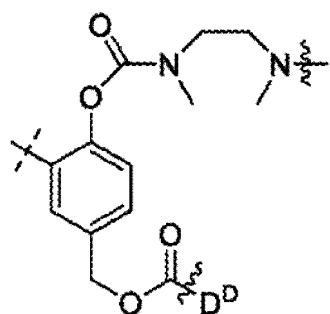
【化 7】



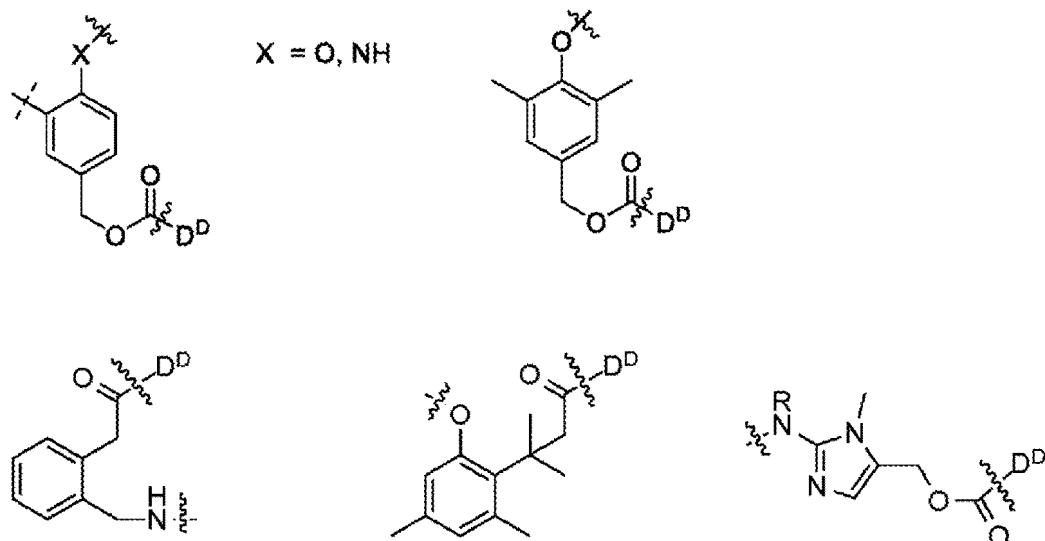
$X = O$ or S or NH or NR with $R = \text{alkyl}$ or aryl

(式中、X は O 又は S 又は NH 又は NR であり、ここで R はアルキル又はアリールである)

【化 8 0】



【化 8 1】



(式中、波線は結合されたトリガー又はD^Dであり、
破線は、結合されたT^T又はS^P-T^T又はM^M又はS^P-M^Mである)

から選択され、

式中、スペーサーS^Pは、アルキル、ポリエチレングリコール、ペプチド、又はポリラクチドであり、

標的化試薬T^Tは、抗体、抗体断片、タンパク質、又はペプチドであり、

マスキング部分M^Mは、タンパク質、ペプチド、ポリマー、ポリエチレングリコール、又は炭水化物であり；

式中、前記薬物D^Dは、抗体、抗体誘導体、抗体断片F_ab₂、抗体断片F_ab、抗体断片s_cF_V、二重特異性抗体、三重特異性抗体、抗体断片融合体、二重特異性m_Ab断片、三重特異性m_Ab断片、タンパク質、アプタマー、オリゴペプチド、オリゴヌクレオチド、オリゴ糖、ペプチド、ペプトイド、ステロイド、有機薬物化合物、トキシン、ホルモン、ウイルス、ファージ、リシンAの免疫トキシン、ジフテリアトキシン、コレラトキシン、アウリストチン、メイタンシン、カリケアマイシン、デュオカルマイシン、メイタンシノイドDM1及びDM4、アウリストチンMMAE、CC1065、カンプトテシン、SN-38、抗増殖/抗腫瘍薬、抗生物質、サイトカイン、抗炎症性薬、抗ウイルス剤、降圧剤、化学増感剤及び放射線増感剤、ジヒドロ葉酸レダクターゼインヒビター、及びチミジル酸シンターゼインヒビター、DNAアルキル化剤、放射線増感剤、DNAインターラーカー、DNA開裂剤、抗チューブリン剤、トポイソメラーゼインヒビター、白金系薬物、アントラサイクリン、ビンカ薬物、ブレオマイシン、細胞毒性ヌクレオシド、タキサン、レキシトロブシン、ブテリジン、ジイネン、ポドフィロトキシン、ドラスタチン、メイタンシノイド、分化誘導剤、タキソール、メトトレキサート、メトブテリン、ジクロロメトトレキサート、5-フルオロウラシル、DNAマイナーグループバインダー、6-メルカプトブリン、シトシンアラビノシド、メルファラン、ロイロシン(lurosine)、ロイロシダイン(lurosideine)、アクチノマイシン、ダウノルビシン、ドキソルビシン、マイトマイシンC、マイトマイシンA、カミノマイシン、アミノブテリン、タリソマイシン、エトポシド、エトポシドフォスフェート、ビンプラスチン、ビンクリスチン、ビンデシン、タキソテール、レチノイン酸、酪酸、N8-アセチルスペルミジン、カンプトテシン、エスペラミシン、エンジイン、マイトマイシン、アントラサイクリン、1-(2-クロロエチル)1,2-ジメタンスルフォニルヒドラジド、シタラビン、アングイジン、及び6-メルカプトブリンの群から選択される)；

前記アクチベータ化合物は、式(4)に記載のテトラジンを含む：

【化74】



(4)

(式(4)中、R¹及びR²は、各々独立して、H、アルキル、アリール、CF₃、CF₂-R'、NO、NO₂、OR'、SR'、CN、C(=O)R'、C(=S)R'、OC(=O)R'''、SC(=O)R'''、OC(=S)R'''、SC(=S)R'''、S(=O)R'、S(=O)₂R'''、S(=O)₂OR'、PO₃R'R'、S(=O)₂NR'R'、C(=O)O-R'、C(=O)S-R'、C(=S)O-R'、C(=S)S-R'、C(=O)NR'R'、C(=S)NR'R'、NR'R'、NR'C(=O)R'、NR'C(=S)R'、NR'C(=O)OR'、NR'C(=S)OR'、NR'C(=O)SR'、NR'C(=S)SR'、OC(=O)NR'R'、SC(=O)NR'R'、OC(=S)NR'R'、SC(=S)NR'R'、NR'C(=O)NR'R'、NR'C(=S)NR'R'から構成される群から選択され、ここで、各々のR'及び各々のR'''は、独立して、H、アリール又はアルキルであり、R'''は、独立して、アリール又はアルキルであり；

AはNであり；

BはNであり；

Xは、Nであり；

Yは、Nである；)

プロドラッグキット。

【請求項2】

A、P、Q、X、Y、及びZは、結合PQ、QP、QX、XQ、XZ、ZX、ZY、YZ、YA、AYの1つが-CR^aX^D-CR^aY^D-から構成されるように選択され、それ以外のA、Y、Z、X、Q、Pによって構成される基は、CR^a₂であり、O-O、O-S及びS-Sから構成される群から選択された隣接原子ペアは存在せず；X^DはO-C(O)-(L^D)_n-(D^D)、S-C(O)-(L^D)_n-(D^D)、O-C(S)-(L^D)_n-(D^D)、S-C(S)-(L^D)_n-(D^D)、NR^c-C(O)-(L^D)_n-(D^D)、NR^c-C(S)-(L^D)_n-(D^D)、NR^c-C(S)-(L^D)_n-(D^D)であり；かつY^DはNHR^c、OH、SHである；又はX^DがC(O)-(L^D)_n-(D^D)、C(S)-(L^D)_n-(D^D)であり；かつY^DがCR^c₂NHR^c、CR^c₂OH、CR^c₂SH、NH-NH₂、O-NH₂又はNH-OHである。

請求項1に記載のプロドラッグキット。

【請求項3】

PQ、QP、AY又はYAが、-CR^aX^D-CR^aY^D-であり、X^D及びY^Dが互いに関連してトランスに位置する。

請求項2に記載のプロドラッグキット。

【請求項4】

ZX又はXZが-CR^aX^D-CR^aY^D-であり、X^D及びY^Dが互いに関連してシスに位置する。

請求項2に記載のプロドラッグキット。

【請求項5】

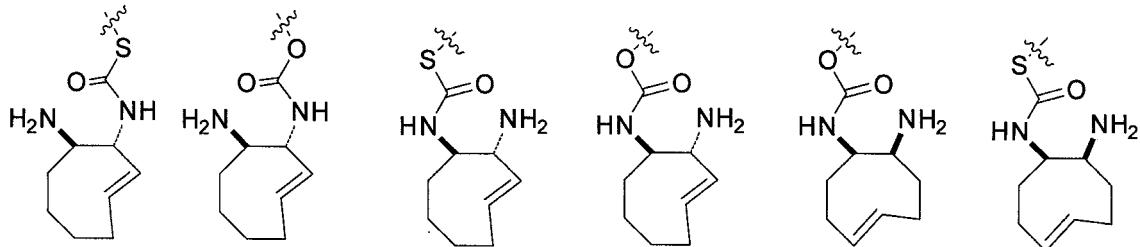
X^DがNR^c-C(O)-(L^D)_n-(D^D)であり、Y^DがNHR^cである、

請求項 1 乃至 4 のいずれか一項に記載のプロドラッグキット。

【請求項 6】

前記ジエノフィルが、次構造から選択される化合物である、
請求項 5 に記載のプロドラッグキット。

【化 7 1】

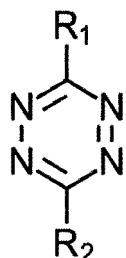


(ただし、波線は、結合された D^D 、 $L^D - D^D$ の残りであり、場合により、 T^T 又は $S^P - T^T$ 又は M^M 又は $S^P - M^M$ を含む。)

【請求項 7】

前記ジエンは、式(7)を満たし、 R_1 及び R_2 でパラ置換されたテトラジンである、
請求項 1 に記載のプロドラッグキット。

【化 7 5】



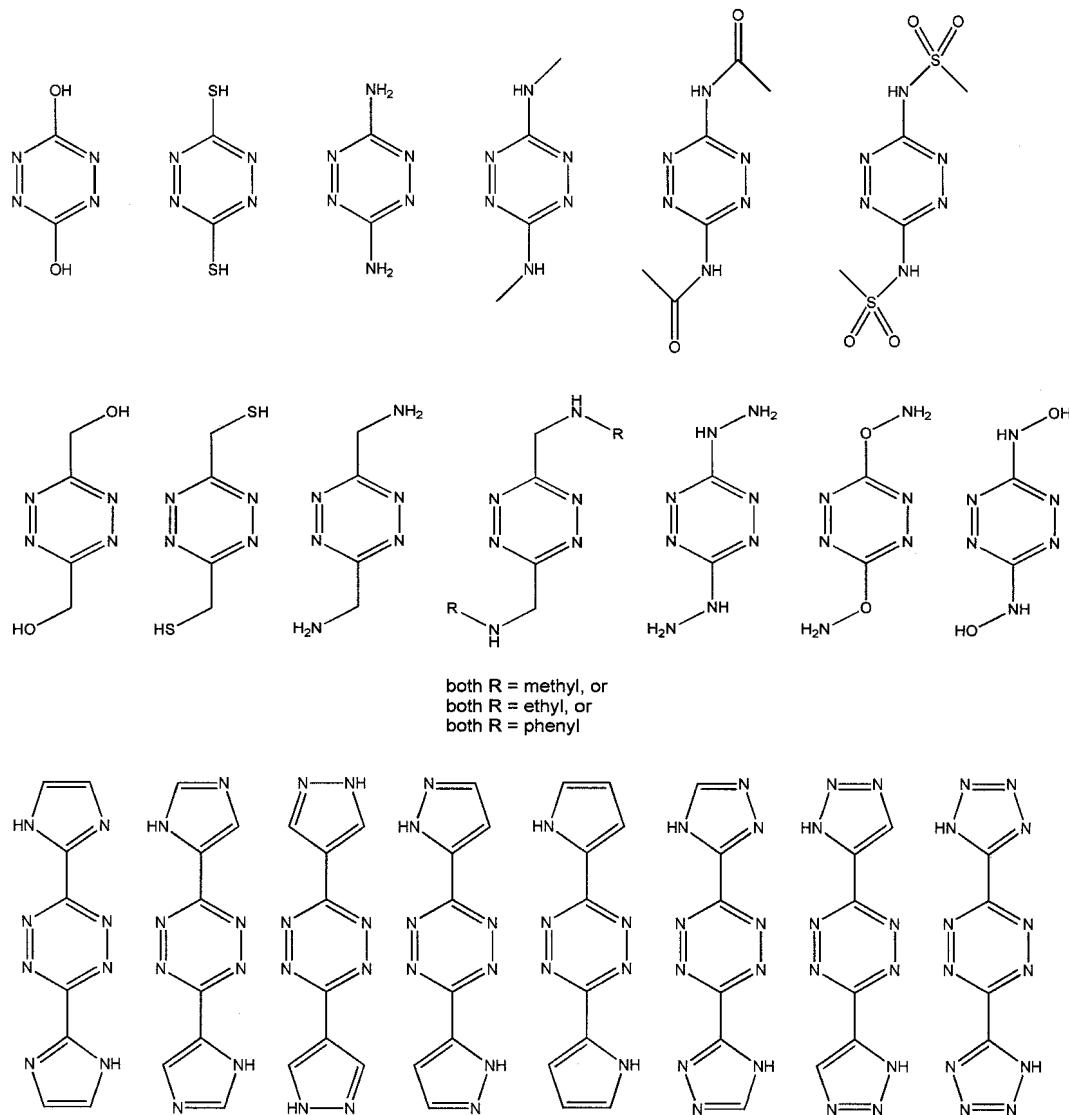
(7)

(ただし式中、 R_1 及び R_2 は、各々独立して、H、アルキル、 NO_2 、 CF_3 、 CN 、 $COOR$ 、 $CONHR$ 、 $CONR_2$ 、 COR 、 SO_2R 、 SO_2OR 、 SO_2NR_2 、 PO_3R_2 、 NO 、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、2,6-ピリミジル、3,5-ピリミジル、2,4-ピリミジル、2,4-イミダジル、2,5-イミダジル及びフェニルから構成される群から選択される置換基であり、前記置換基は、 NO_2 、F、Cl、 CF_3 、 CN 、 $COOR$ 、 $CONHR$ 、 $CONR$ 、 COR 、 SO_2R 、 SO_2OR 、 SO_2NR_2 、 PO_3R_2 、 NO 及びArから構成される群から選択される1つ以上の電子求引性基で置換されてもよく、ここで、RはH又は $C_1 - C_6$ アルキルであり、Arはフェニル、ピリジル又はナフチルである)。

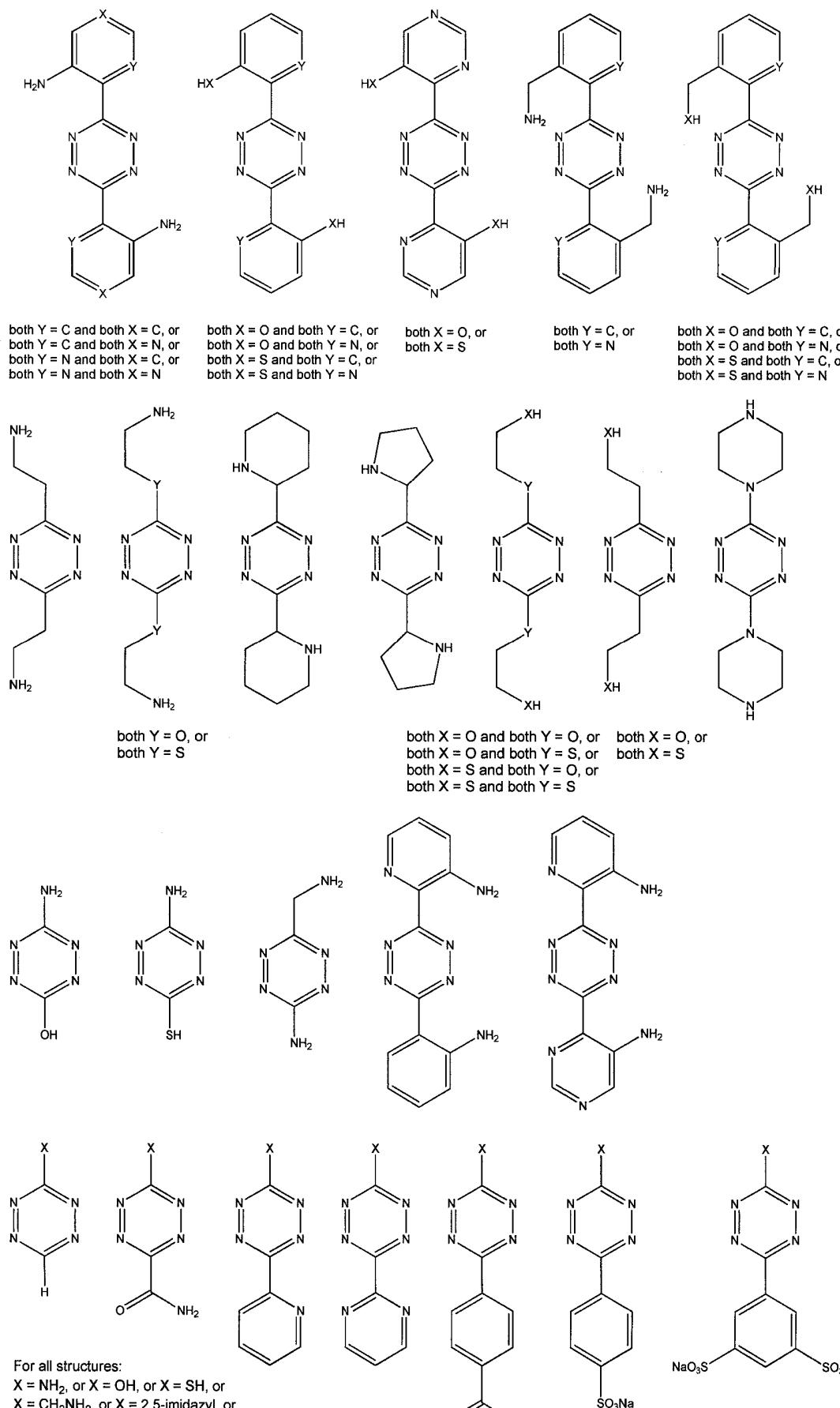
【請求項 8】

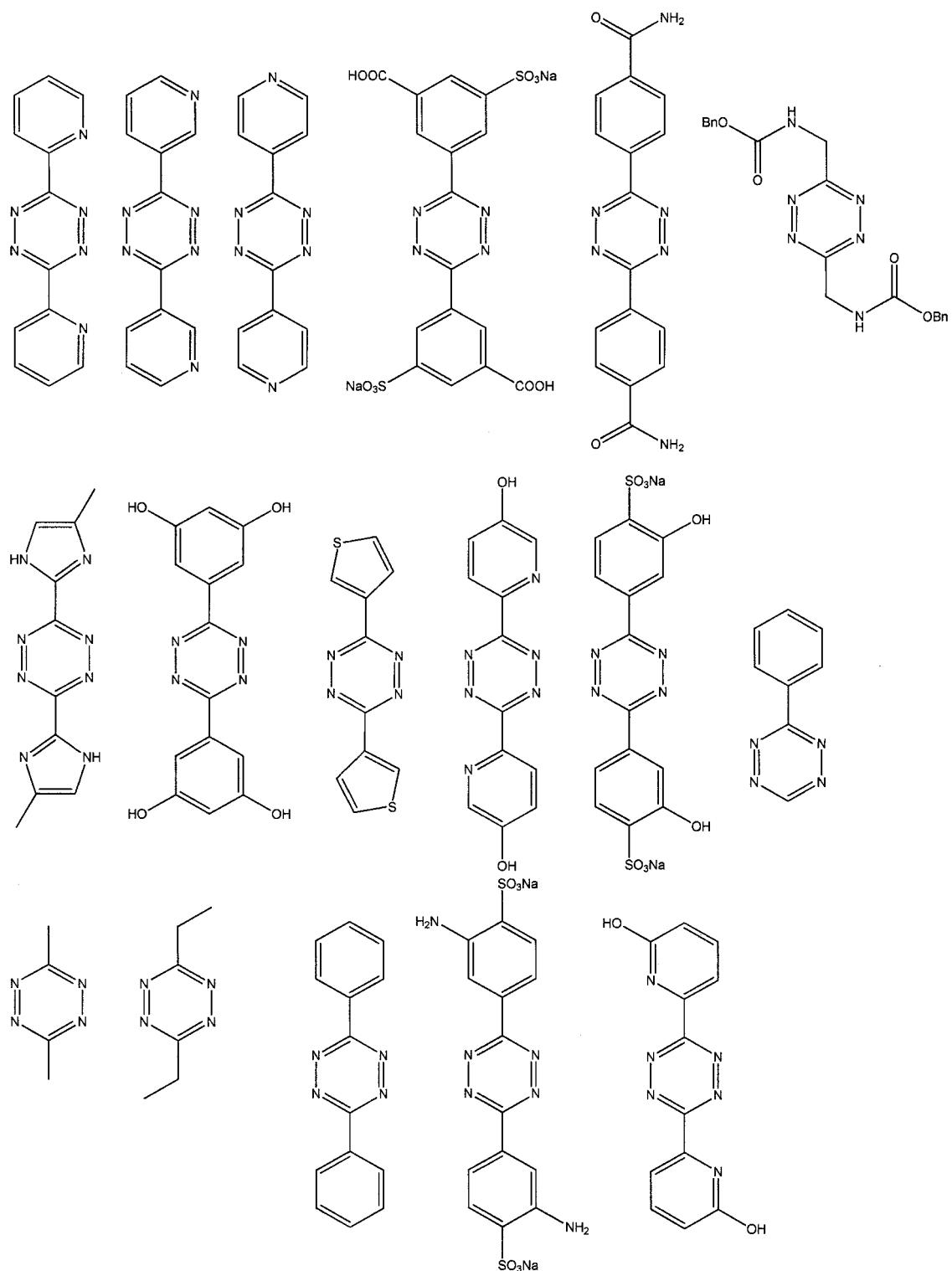
前記ジエンは、

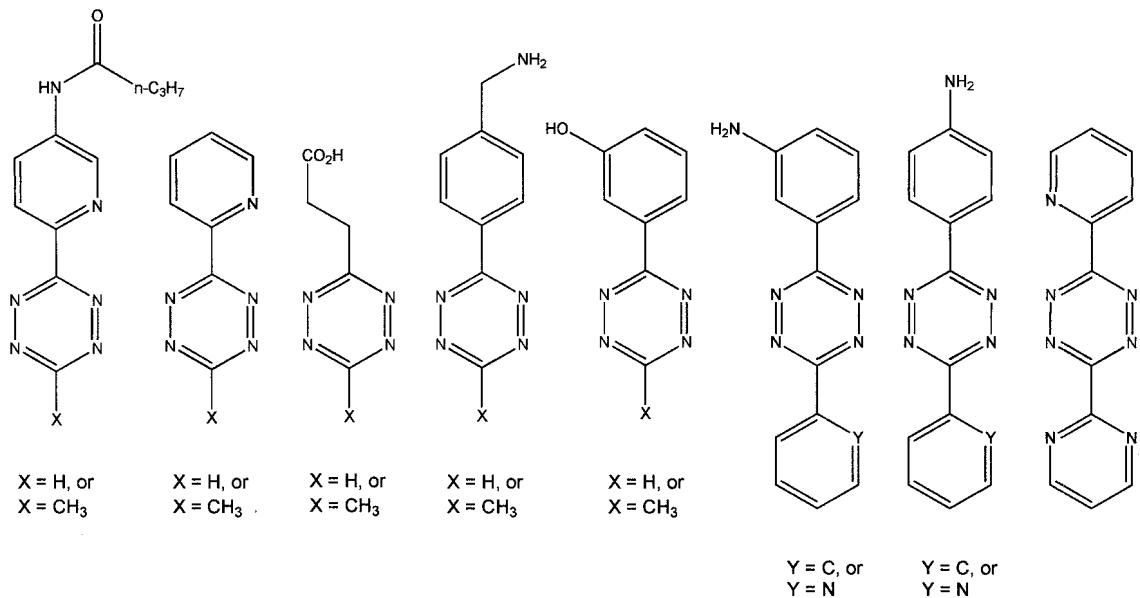
【化 7 6】



【化77】





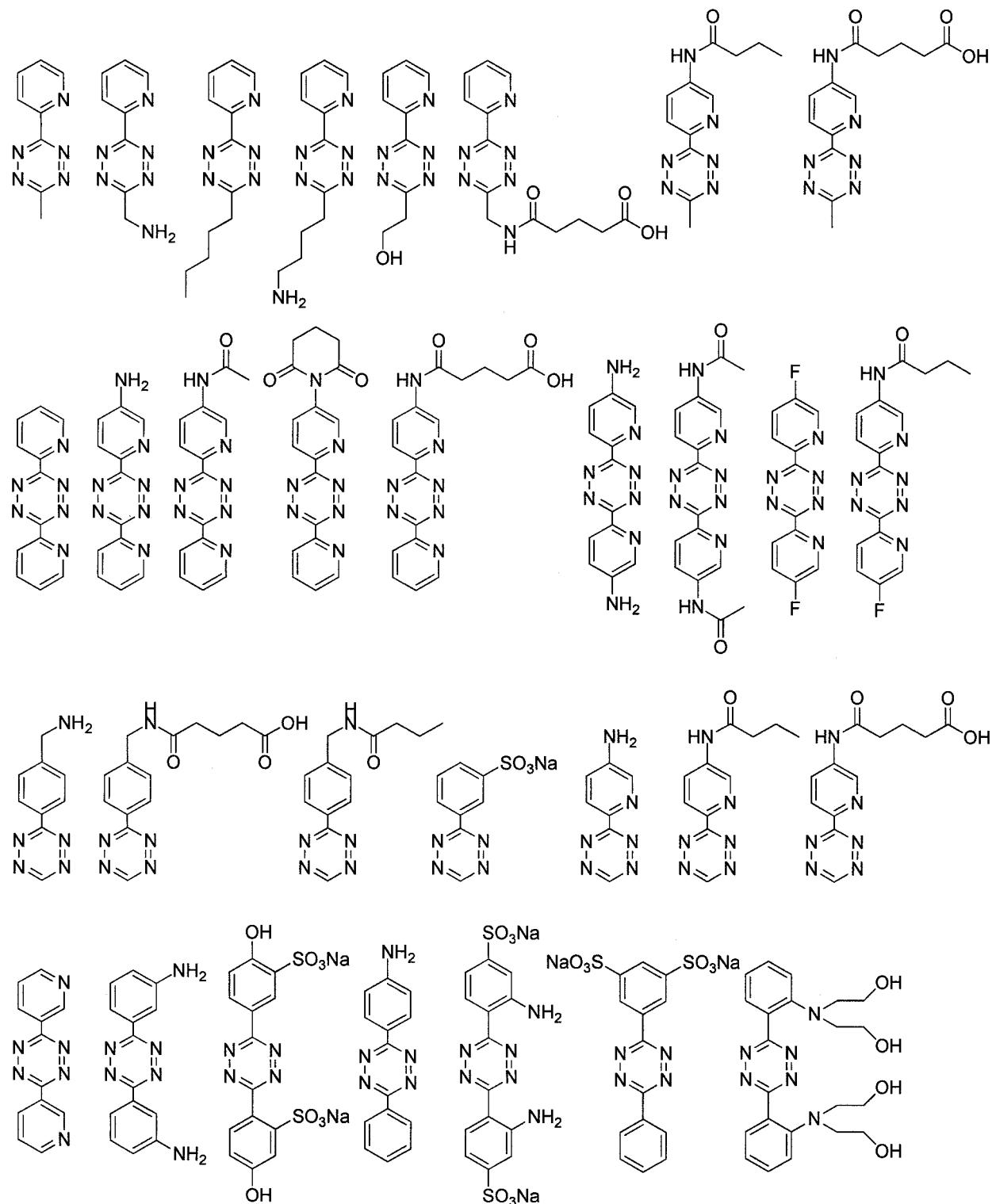


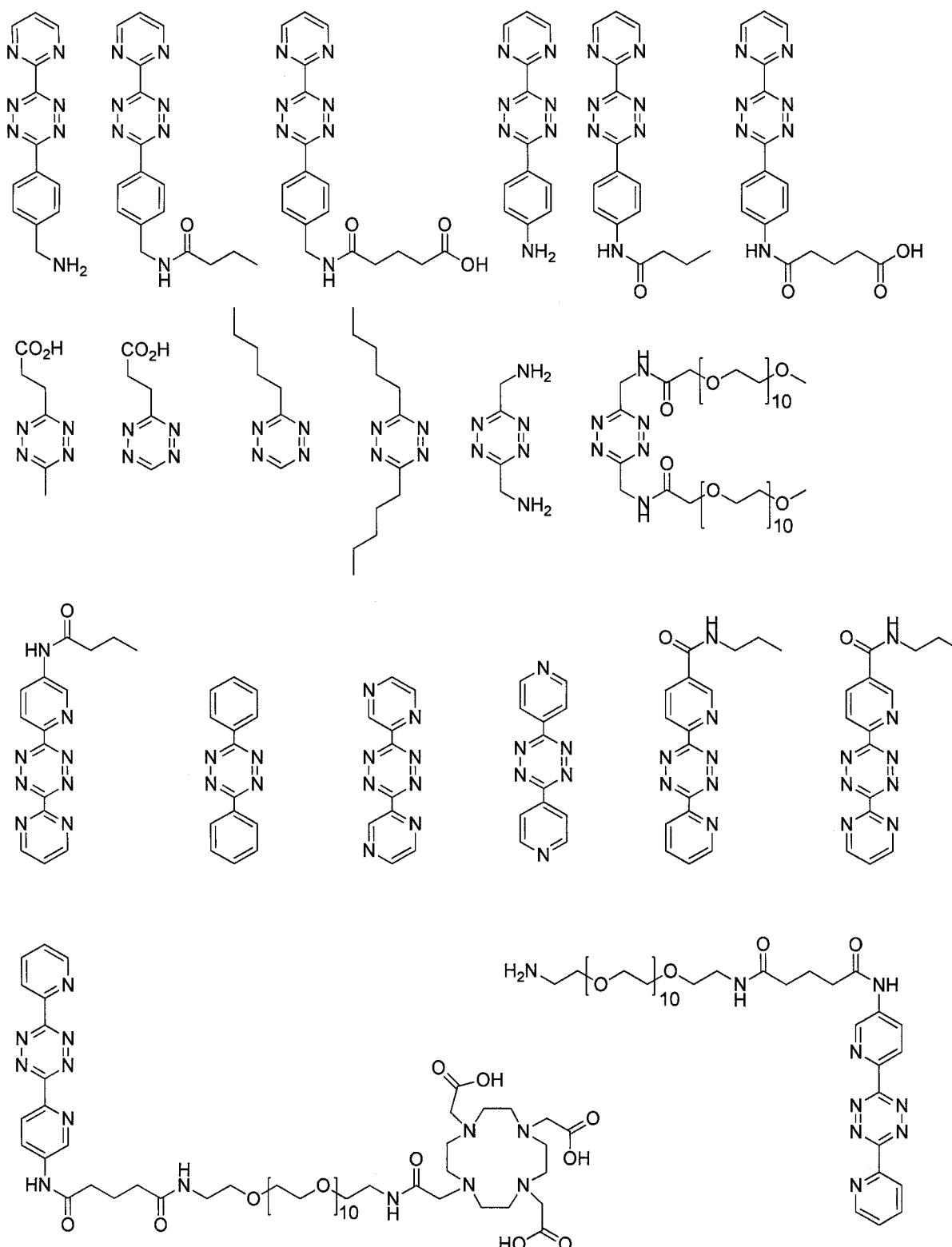
から構成される群から選択される、
請求項 1 に記載のプロドラッグキット。

【請求項 9】

前記ジエンは、

【化 7 8】





から構成される群から選択される、
請求項 1 に記載のプロドラッグキット。

【請求項 10】

前記薬物 D^D 又は前記リンカー L^D の少なくとも 1 つは、抗体である標的化試薬 T^T を含む、

請求項 1 乃至 9 のいずれか一項に記載のプロドラッグキット。

【請求項 11】

前記薬物 D^D 又は前記リンカー L^D の少なくとも 1 つは、ペプチドであるマスキング部分 M^M を含む、

請求項 1 乃至 9 のいずれか一項に記載のプロドラッグキット。

【請求項 1 2】

前記薬物は、T - 細胞係合抗体構成物である、

請求項 1 乃至 11 のいずれか一項に記載のプロドラッグキット。

【請求項 1 3】

前記プロドラッグ化合物は、抗体 - トキシン又は抗体 - 薬物共役物を含む、

請求項 1 乃至 10 のいずれか一項に記載のプロドラッグキット。

【請求項 1 4】

薬物を提供するステップと、

体外でジエノフィル部分に前記薬物を化学的に結合させるステップと、

を含む、請求項 1 乃至 6 のいずれか一項に記載の式 (1a) のプロドラッグ化合物を形成する方法。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

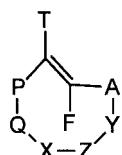
【訂正対象項目名】0013

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0013】

【化 1】



(1a)

(ただし、T、Fは、各々独立して、H又はアルキル、F、Cl、Br又はIから構成される群から選択される置換基を意味し；記号A、P、Q、X、Y及びZの意味は、下記実施形態(1)～(6)から構成される群から選択され、

(1) 結合PQ、QP、QX、XQ、XZ、ZX、ZY、YZ、YA、AYの1つは、-CR^aX^D-CR^aY^D-から構成され、それ以外のA、Y、Z、X、Q、Pによって構成される基は、各々独立して、CR^a₂、S、O、SiR^b₂であり、P及びAはCR^a₂であり、O-O、O-S及びS-Sから構成される群から選択された隣接原子ペアは存在せず、Siがもし存在する場合には、SiはCR^a₂又はOに隣接し；X^DはO-C(O)- (L^D)_n- (D^D)、S-C(O)- (L^D)_n- (D^D)、O-C(S)- (L^D)_n- (D^D)、S-C(S)- (L^D)_n- (D^D)、NR^c-C(O)- (L^D)_n- (D^D)、NR^c-C(S)- (L^D)_n- (D^D)であり；かつY^DはNHR^c、OH、SHであり；又はX^DはC(O)- (L^D)_n- (D^D)、C(S)- (L^D)_n- (D^D)であり；かつY^DはCR^c₂NHR^c、CR^c₂OH、CR^c₂SH、NH-NH₂、O-NH₂又はNH-OHである；

(2) AはCR^aX^DでありかつZはCR^aY^Dである、又はZはCR^aX^DでありかつAはCR^aY^Dである、又はPはCR^aX^DでありかつXはCR^aY^Dである、又はXはCR^aX^DでありかつPはCR^aY^Dであり、X^D及びY^Dは互いに関連してトランス型に配置され；それ以外のA、Y、Z、X、Q、及びPによって構成される基は、互いに独立して、CR^a₂、S、O、SiR^b₂であり、P及びAはCR^a₂であり、O-O、O-S及びS-Sから構成される群から選択された隣接原子ペアは存在せず、Siがもし存在する場合には、SiはCR^a₂又はOに隣接し；X^Dは、O-C(O)- (L^D)_n- (D^D)、S-C(O)- (L^D)_n- (D^D)、O-C(S)- (L^D)_n- (D^D)、NR^c-C(O)- (L^D)_n- (D^D)、S-C(S)- (L^D)_n- (D^D)、NR^c-C(S)- (L^D)_n- (D^D)

、 $NR^c - C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ であり、かつ Y^D は NHR^c 、 OH 、 SH 、 $CR^c_2NHR^c$ 、 CR^c_2OH 、 CR^c_2SH 、 $NH - NH_2$ 、 $O - NH_2$ 又は $NH - OH$ である；又は X^D は $CR^c_2 - O - C(O) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $CR^c_2 - S - C(O) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $CR^c_2 - O - C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $CR^c_2 - S - C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $CR^c_2 - NR^c - C(O) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $CR^c_2 - NR^c - C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ であり、かつ Y^D は NHR^c 、 OH 、 SH である；又は X^D は $C(O) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ であり；かつ Y^D は $CR^c_2NHR^c$ 、 CR^c_2OH 、 CR^c_2SH 、 $NH - NH_2$ 、 $O - NH_2$ 、 $NH - OH$ である；

(3) A は CR^aY^D であり、かつ、P、Q、X、Z の 1 つは CR^aX^D であり、又は、P は CR^aY^D であり、かつ、A、Y、Z、X の 1 つは CR^aX^D である、又は Y は CR^aY^D であり、かつ X 又は P は CR^aX^D である、又は、Q は CR^aY^D であり、かつ、Z 又は A は CR^aX^D である、又は、Z 又は X のいずれかは CR^aY^D であり、かつ、A 又は P は CR^aX^D であり、 X^D 及び Y^D は互いに関連してトランス型に配置され；それ以外の A、Y、Z、X、Q 及び P によって構成される基は、各々独立して、 CR^a_2 、 S 、 O 、 SiR^b_2 であり、P 及び A は CR^a_2 であり、 $O - O$ 、 $O - S$ 及び $S - S$ を構成する群から選択された隣接原子ペアは存在せず、Si がもし存在する場合には、Si は CR^a_2 又は O に隣接し； X^D は $(O - C(O))_p - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $S - C(O) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $O - C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $S - C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ であり、 Y^D は $CR^c_2NHR^c$ 、 CR^c_2OH 、 CR^c_2SH 、 $NH - NH_2$ 、 $O - NH_2$ 、 $NH - OH$ であり；p は 0 又は 1 である；

(4) P は CR^aY^D であり、かつ、Y は CR^aX^D である、又は A は CR^aY^D であり、かつ、Q は CR^aX^D である、又は Q は CR^aY^D であり、かつ、A は CR^aX^D である、又は Y は CR^aY^D であり、かつ P は CR^aX^D であり、 X^D 及び Y^D は、互いに関連してトランス型に配置され；それ以外の A、Y、Z、X、Q 及び P から構成される基は、互いに独立して、 CR^a_2 、 S 、 O 、 SiR^b_2 であり、P 及び A は CR^a_2 であり、 $O - O$ 、 $O - S$ 及び $S - S$ から構成される群から選択された隣接原子ペアは存在せず、Si がもし存在する場合には、Si は CR^a_2 又は O に隣接し； X^D は $(O - C(O))_p - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $S - C(O) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $O - C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $S - C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ であり； Y^D は NHR^c 、 OH 、 SH であり；p は 0 又は 1 である；

(5) Y は Y^D であり、かつ、P は CR^aX^D である、又は Q は Y^D であり、かつ、A は CR^aX^D であり；それ以外の A、Y、Z、X、Q 及び P によって構成される基は、各々独立して、 CR^a_2 、 S 、 O 、 SiR^b_2 であり、P 及び A は CR^a_2 であり、 $O - O$ 、 $O - S$ 及び $S - S$ から構成される群から選択された隣接原子ペアは存在せず、Si がもし存在する場合には、Si は CR^a_2 又は O に隣接し； X^D は $(O - C(O))_p - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $S - C(O) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $O - C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $S - C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $NR^c - C(O) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $NR^c - C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $C(O) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ であり； Y^D は NH であり；p は 0 又は 1 である；

(6) Y は Y^D であり、かつ、P 又は Q は X^D である、又は、Q は Y^D であり、かつ、A 又は Y は X^D であり；それ以外の A、Y、Z、X、Q 及び P によって構成される基は、各々独立して、 CR^a_2 、 S 、 O 、 SiR^b_2 であり、P 及び A は CR^a_2 であり、 $O - O$ 、 $O - S$ 、及び $S - S$ から構成される群から選択された隣接原子ペアは存在せず、Si がもし存在する場合には、Si は CR^a_2 又は O に隣接し； X^D は $N - C(O) - (L^D)_n - (D^D)$ 、 $N - C(S) - (L^D)_n - (D^D)$ であり； Y^D は NH であり；

ここで、各々の R^a は、独立して、H、アルキル、アリール、 OR' 、 SR' 、 $S(=O)R''$ 、 $S(=O)_2R'''$ 、 $S(=O)_2NR'R''$ 、 $Si - R''$ 、 $Si - O - R''$ 、 $OC(=O)R''$ 、 $SC(=O)R''$ 、 $OC(=S)R''$ 、 $SC(=S)R''$ 、F、Cl、Br、I、 N_3 、 SO_2H 、 SO_3H 、 SO_4H

、 PO_3H 、 PO_4H 、 NO 、 NO_2 、 CN 、 OCN 、 SCN 、 NCO 、 NCS 、 CF_3 、 $\text{CF}_2\text{-R}'$ 、 $\text{NR}'\text{R}''$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{R}'$ 、 $\text{C}(=\text{S})\text{R}'$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{O-R}'$ 、 $\text{C}(=\text{S})\text{O-R}'$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{S-R}'$ 、 $\text{C}(=\text{S})\text{S-R}'$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{NR}'\text{R}''$ 、 $\text{C}(=\text{S})\text{NR}'\text{R}''$ 、 $\text{NR}'\text{C}(=\text{O})\text{-R}'''$ 、 $\text{NR}'\text{C}(=\text{S})\text{-R}'''$ 、 $\text{NR}'\text{C}(=\text{O})\text{O-R}'''$ 、 $\text{NR}'\text{C}(=\text{S})\text{O-R}'''$ 、 $\text{NR}'\text{C}(=\text{O})\text{S-R}'''$ 、 $\text{NR}'\text{C}(=\text{S})\text{S-R}'''$ 、 $\text{OC}(=\text{O})\text{NR}'\text{-R}'''$ 、 $\text{SC}(=\text{O})\text{NR}'\text{-R}'''$ 、 $\text{OC}(=\text{S})\text{NR}'\text{-R}'''$ 、 $\text{SC}(=\text{S})\text{NR}'\text{-R}'''$ 、 $\text{NR}'\text{C}(=\text{O})\text{NR}'\text{-R}'''$ 、 $\text{NR}'\text{C}(=\text{S})\text{NR}'\text{-R}'''$ 、 $\text{CR}'\text{NR}'$ から構成される群から選択され、各々の R' 及び各々の R'' は、独立して、 H 、アリール又はアルキルであり、 R''' は、独立して、アリール又はアルキルであり；各々の R^b は、独立して、 H 、アルキル、アリール、 O - アルキル、 O - アリール、 OH から構成される群から選択され；各々の R^c は、独立して、 H 、 C_{1-6} アルキル及び C_{1-6} アリールから選択され；

2つ以上の R^a 、 b 、 c 部分は、結合して環を形成しても良く；

及び $(\text{L}^D)_n$ は、好ましくは S 、 N 、 NH 又は O を介して T^R に結合された、 $n = 0$ 又は 1 を有する任意のリンカーであり、ここで、これら S 、 N 、 NH 又は O 原子はリンカーの一部であり、直鎖状に及び / 又は分枝状に配置された複数のユニットを構成しても良く； D^D は、好ましくは S 、 N 、 NH 又は O を介して結合された 1 つ以上の治療的部又は薬物であり、ここでこれら S 、 N 、 NH 又は O 原子は、前記治療的部の一部である）、を供する。

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0056

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0056】

実施形態 1 において、結合 PQ 、 QP 、 QX 、 XQ 、 XZ 、 ZX 、 ZY 、 YZ 、 YA 、 AY の 1 つは、 $-\text{CR}^a\text{X}^D-\text{CR}^a\text{Y}^D$ - から構成され、それ以外の基 (A 、 Y 、 Z 、 X 、 Q 、 P からの) は、各々独立して、 $\text{CR}^a{}_2$ 、 S 、 O 、 $\text{SiR}^b{}_2$ であり、 P 及び A は、 $\text{CR}^a{}_2$ であり、 O-O 、 O-S からなる群から選択された隣接原子ペアは存在せず、 Si がもし存在する場合には、 Si は、 $\text{CR}^a{}_2$ 又は O に隣接する。

【誤訳訂正4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0060

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0060】

実施形態 2 において、 A は CR^aX^D であり、 Z は CR^aY^D である、又は、 Z は CR^aX^D であり、 A は CR^aY^D である、又は、 P は CR^aX^D であり、 X は CR^aY^D である、又は X は CR^aX^D であり、 P は CR^aY^D である、そして、 X^D 及び Y^D は、互いに関連してトランス型 (*trans conformation*) に配置され、それ以外の基 (A 、 Y 、 Z 、 X 、 Q 、 P からの) は、互いに独立して、 $\text{CR}^a{}_2$ 、 S 、 O 、 $\text{SiR}^b{}_2$ であり、 P 及び A は、 $\text{CR}^a{}_2$ であり、 O-O 、 O-S 及び S-S からなる群から選択された隣接原子ペアは存在せず、 Si がもし存在する場合には、 Si は、 $\text{CR}^a{}_2$ 又は O に隣接し； X^D は $\text{O-C(O)-}(\text{L}^D)_n-(\text{D}^D)$ 、 $\text{S-C(O)-}(\text{L}^D)_n-(\text{D}^D)$ 、 $\text{O-C(S)-}(\text{L}^D)_n-(\text{D}^D)$ 、 $\text{S-C(S)-}(\text{L}^D)_n-(\text{D}^D)$ 、 $\text{NR}^c\text{-C(O)-}(\text{L}^D)_n-(\text{D}^D)$ 、 $\text{NR}^c\text{-C(S)-}(\text{L}^D)_n-(\text{D}^D)$ であり、その場合、 Y^D は NHR^c 、 OH 、 SH 、 $\text{CR}^c{}_2\text{NHR}^c$ 、 $\text{CR}^c{}_2\text{OH}$ 、 $\text{CR}^c{}_2\text{SH}$ 、 NH-NH_2 、 O-NH_2 、 NH-OH であり、又は、 X^D は $\text{CR}^c{}_2\text{-O-C(O)-}(\text{L}^D)_n-(\text{D}^D)$ 、 $\text{CR}^c{}_2\text{-S-C(O)-}(\text{L}^D)_n-(\text{D}^D)$

, C R ^c ₂ - O - C (S) - (L ^D) _n - (D ^D) , C R ^c ₂ - S - C (S) - (L ^D)
_n - (D ^D) , C R ^c ₂ - N R ^c - C (O) - (L ^D) _n - (D ^D) , C R ^c ₂ - N R ^c
- C (S) - (L ^D) _n - (D ^D) であり、その場合、 Y ^D は N H R ^c , O H , S H であ
り、又は、 X ^D は C (O) - (L ^D) _n - (D ^D) , C (S) - (L ^D) _n - (D ^D) であ
り、その場合、 Y ^D は C R ^c ₂ N H R ^c , C R ^c ₂ O H , C R ^c ₂ S H , N H - N H ₂
, O - N H ₂ , N H - O H である。

【誤訳訂正 5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0062

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0062】

実施形態 3 において、 A は C R ^a Y ^D であり、 P , Q , X , Z の 1 つは C R ^a X ^D であ
る、又は、 P は C R ^a Y ^D であり、 A , Y , Z , X の 1 つは C R ^a X ^D である、又は、 Y
は C R ^a Y ^D であり、 X 又は P は C R ^a X ^D である、又は、 Q は C R ^a Y ^D であり、 Z
又は A は C R ^a X ^D である、又は、 Z 又は X のいずれか一方が C R ^a Y ^D であり、 A 又は P
が C R ^a X ^D であり、 X ^D 及び Y ^D は、互いに関連してトランス型で配置され、 それ以外
の基 (A , Y , Z , X , Q , P からの) は、各々独立して、 C R ^a ₂ , S , O , S i R ^b
₂ であり、 P 及び A は、 C R ^a ₂ であり、 O - O , O - S 及び S - S からなる群から選択
された隣接原子ペアは存在せず、 S i がもし存在する場合には、 S i は、 C R ^a ₂ 又は O
に隣接する。

【誤訳訂正 6】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0065

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0065】

実施形態 4 において、 P は C R ^a Y ^D であり、 Y は C R ^a X ^D である又は A は C R ^a Y
^D であり、 Q は C R ^a X ^D である、又は、 Q は C R ^a Y ^D であり、 A は C R ^a X ^D である
、又は、 Y は C R ^a Y ^D であり、 P は C R ^a X ^D である、そして、 X ^D 及び Y ^D は、互い
に関連して、トランス型で配置され； それ以外の基 (A , Y , Z , X , Q , P からの) は、
各々独立して、 C R ^a ₂ , S , O , S i R ^b ₂ であり、 P 及び A は C R ^a ₂ であり、 O
- O , O - S 及び S - S からなる群から選択された隣接原子ペアは存在せず、もし存在す
るなら S i は、 C R ^a ₂ 又は O に隣接する。

【誤訳訂正 7】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0068

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0068】

実施形態 5 において、 Y は Y ^D であり、 P は C R ^a X ^D である、又は、 Q は Y ^D であり
、 A は C R ^a X ^D である； それ以外の基 (A , Y , Z , X , Q , P からの) は、各々独立
して、 C R ^a ₂ , S , O , S i R ^b ₂ であり、 P 及び A は C R ^a ₂ であり、 O - O , O -
S 及び S - S からなる群から選択された隣接原子ペアは存在せず、 S i がもし存在する場
合には、 S i は、 C R ^a ₂ 又は O に隣接する。

【誤訳訂正 8】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0071

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 7 1 】

実施形態 6 において、Y は Y^D であり、P 又は Q は X^D である、又は、Q は Y^D であり、A 又は Y は X^D である；それ以外の基 (A, Y, Z, X, Q, P からの) は、各々独立して、 CR^a_2 , S, O, SiR^b_2 であり、P 及び A は CR^a_2 であり、O - O, O - S 及び S - S からなる群から選択された隣接原子ペアは存在せず、Si がもし存在する場合には、Si は、 CR^a_2 又は O に隣接する。