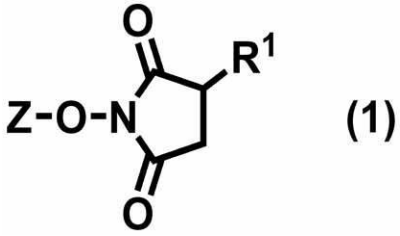
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和4年12月22日(2022.12.22)

【国際公開番号】WO2020/166592
【出願番号】特願2020-572264(P2020-572264)
【国際特許分類】
C07K 5/027(2006.01)
C07K 16/18(2006.01)
A61K 38/06(2006.01)
A61K 45/00(2006.01)
A61K 38/21(2006.01)
A61K 39/395(2006.01)
A61K 47/68(2017.01)
A61P 35/00(2006.01)
A61P 35/02(2006.01)
A61P 43/00(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｋ 5/027
Ｃ０７Ｋ 16/18
Ａ６１Ｋ 38/06
Ａ６１Ｋ 45/00
Ａ６１Ｋ 38/21
Ａ６１Ｋ 39/395 Ｔ
Ａ６１Ｋ 39/395 Ｌ
Ａ６１Ｋ 47/68
Ａ６１Ｐ 35/00
Ａ６１Ｐ 35/02
Ａ６１Ｐ 43/00 １２１

【手続補正書】
【提出日】令和4年12月14日(2022.12.14)
【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（１）：
【化１】

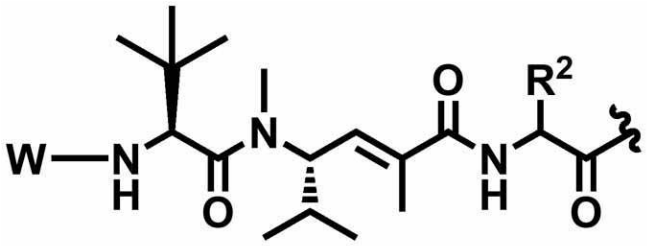


(1)

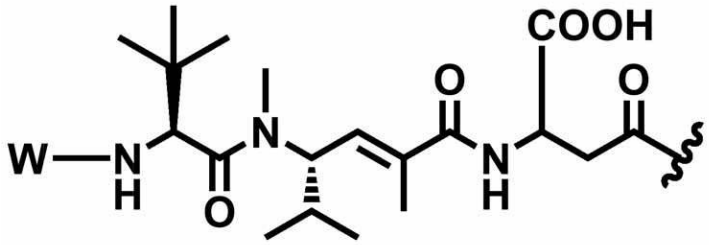
[式中、
Ｒ^{1}は、水素原子又はスルホニル基を表し、

Ｚは、式（Ｚ－１）、式（Ｚ－２）又は式（Ｚ－３）：

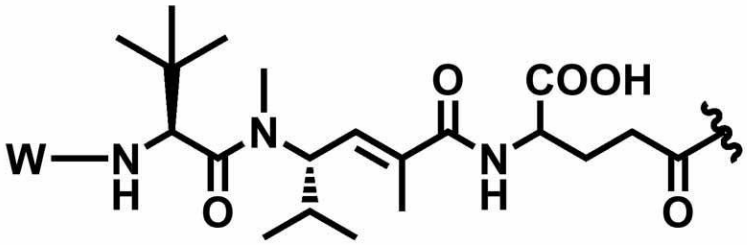
【化２】



(Z-1)



(Z-2)

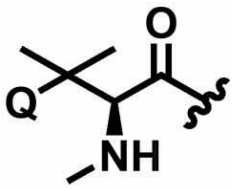


(Z-3)

（式中、

Ｗは、式（Ｗ－１）：

【化３】

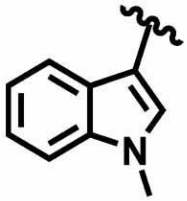


(W-1)

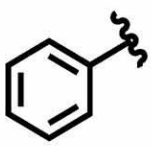
（式中、

Ｑは、式（Ｑ－１）又は式（Ｑ－２）：

【化４】



(Q-1)

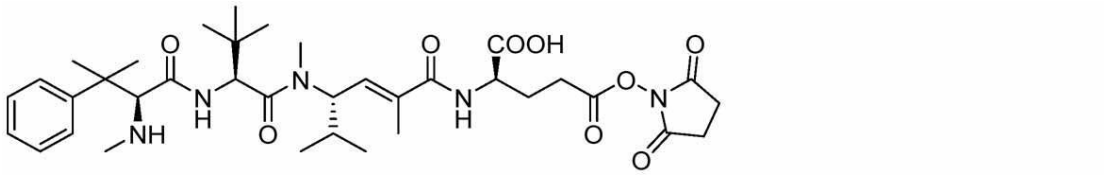


(Q-2)

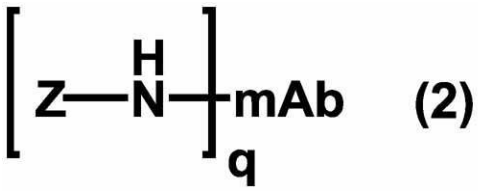
で表される基を表す）

で表される基を表し、

Ｒ^{2}は、－（ＣＨ$_{2}$）$_{u}$－ＣＯＯＨを表し、
ｕは１又は２を表す）
で表される基を表す］
で表される、化合物又はその塩。
【請求項２】
Ｒ^{1}が、水素原子である、請求項１に記載の化合物又はその塩。
【請求項３】
以下の化合物から選択される、請求項１に記載の化合物又はその塩。
【化５】

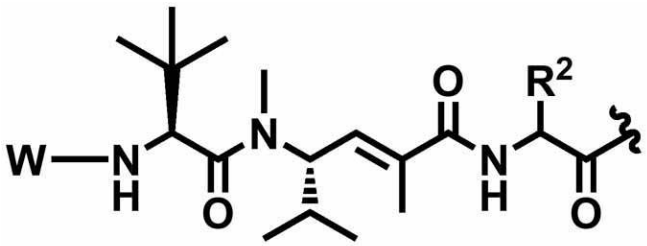


【請求項４】
式（２）：
【化６】

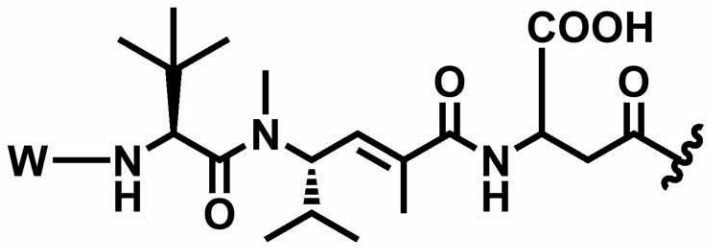


［式中、
ｍＡｂは、抗体を表し、
ｑは、１～３０の整数を表し、
Ｚは、式（Ｚ－１）、式（Ｚ－２）又は式（Ｚ－３）：

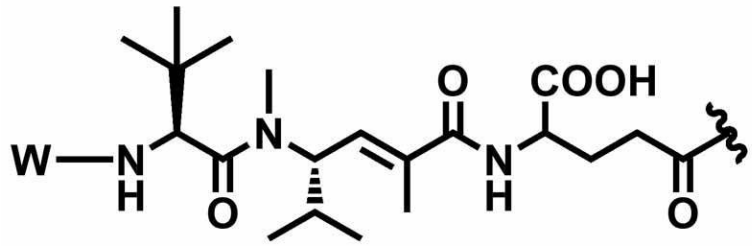
【化７】



(Z-1)

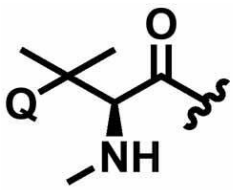


(Z-2)



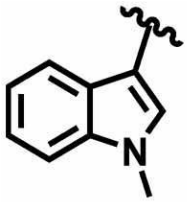
(Z-3)

（式中、
Ｗは、式（Ｗ－１）：
【化８】

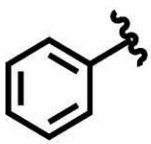


(W-1)

（式中、
Ｑは、式（Ｑ－１）又は式（Ｑ－２）：
【化９】



(Q-1)



(Q-2)

で表される基を表す）
で表される基を表し、
Ｒ^{2}は、－（ＣＨ$_{2}$）$_{u}$－ＣＯＯＨを表し、

ｕは１又は２を表す）
で表される基を表す］
で表される、抗体薬物複合体又はその製薬学的に許容される塩。
【請求項５】
ｍＡｂが、ブレンツキシマブ、トラスツズマブ、イノツズマブ、ゲムツズマブ、グレムバツムマブ、ラベツズマブ、サシツズマブ、リファスツズマブ、インデュサツマブ、ポラツズマブ、ピナツズマブ、コルツキシマブ、インダツキシマブ、ミラツズマブ、ロバルピツズマブ、アネツマブ、チソツマブ、ロルボツズマブ（ｌｏｒｖｏｔｕｚｕｍａｂ）、リツキシマブ、デパツキシズマブ、デニンツズマブ、エンホルツマブ、テルソツズマブ、バンドルツズマブ、ソフィツズマブ、ボルセツズマブ、ミルベツキシマブ（ｍｉｒｖｅｔｕｘｉｍａｂ）、ナラツキシマブ、カンツズマブ、ラプリツキシマブ、ビバツズマブ、バダスツキシマブ、ルパルツマブ、アプルツマブ、アバゴボマブ、アブシキシマブ、アビツズマブ、アブリルマブ、アクトクスマブ、アダリブマブ、アデカツムマブ、アデュカヌマブ、アファセビクマブ、アフェリモマブ、アラシズマブ、アレムツズマブ、アリロクマブ、アルツモマブ、アマツキシマブ、アナツモマブ、アニフロルマブ、アンルキンズマブ、アポリズマブ、アルシツモマブ、アスクリンバクマブ、アセリズマブ、アテゾリズマブ、アチヌマブ、アトロリムマブ、アベルマブ、アジンツキシズマブ、バピネズマブ、バシリキシマブ、バビツキシマブ、ベクツモマブ、ベゲロマブ、ベリムマブ、ベンラリズマブ、ベルチリムマブ、ベシレソマブ、ベバシズマブ、ベズロトクスマブ、ビシロマブ、ビマグルマブ、ビメキズマブ、ブレセルマブ、ブリナツモマブ、ブロンツベトマブ、ブロソズマブ、ボコシズマブ、ブラジクマブ、ブリアキヌマブ、ブロダルマブ、ブロルシズマブ、ブロンチクツズマブ、ブロスマブ、カビラリズマブ、カムレリズマブ、カプラシズマブ、カプロマブ、カルルマブ、カロツキシマブ、カツマクソマブ、セデリズマブ、セルトリズマブ、セツキシマブ、シタツズマブ、シキスツムマブ、クレノリキシマブ、クリバツズマブ、コドリツズマブ、コナツムマブ、コンシズマブ、コスフロビキシマブ、クレネズマブ、クリザンリズマブ、クロテデュマブ、ダセツズマブ、ダクリズマブ、ダロツズマブ、ダピロリズマブ、ダラツムマブ、デクトレクマブ、デムシズマブ、デノスマブ、デツモマブ、デザミズマブ、ジヌツキシマブ、ジリダブマブ、ドマグロズマブ、ドルリモマブ、ドロジツマブ、デュリゴツズマブ、デュピルマブ、デュルバルマブ、デュシギツマブ、デュボルツキシズマブ、エクロメキシマブ、エクリズマブ、エドバコマブ、エドレコロマブ、エファリズマブ、エフングマブ、エルデルマブ、エレザヌマブ、エロツズマブ、エルシリモマブ、エマクツズマブ、エマパルマブ、エミベツズマブ、エミシズマブ、エナバツズマブ、エンリモマブ、エノブリツズマブ、エノキズマブ、エノチクマブ、エンシツキシマブ、エピツモマブ、エプラツズマブ、エプチネズマブ、エレヌマブ、エルリズマブ、エルツマキソマブ、エタラシズマブ、エトロリズマブ、エビナクマブ、エボロクマブ、エクスビビルマブ、ファラリモマブ、ファルレツズマブ、ファシヌマブ、フェルビズマブ、フェザキヌマブ、フィクラツズマブ、フィギツムマブ、フィリブマブ、フランボツマブ、フレチクマブ、フォントリズマブ、フォラルマブ、フォラビルマブ、フレマネズマブ、フレソリムマブ、フルネベトマブ、フルラヌマブ、フツキシマブ、ガルカネズマブ、ガリキシマブ、ガニツマブ、ガンテネルマブ、ガチポツズマブ、ガビリモマブ、ゲディブマブ、ゲボキズマブ、ギルベトマブ、ギレンツキシマブ、ゴリムマブ、グセルクマブ、イバリズマブ、イブリツモマブ、イクルクマブ、イダルシズマブ、イファボツズマブ、イゴボマブ、イマルマブ、イムシロマブ、イムガツズマブ、インクラクマブ、イネビリズマブ、インフリキシマブ、イノリモマブ、インテツムマブ、イピリムマブ、イラツムマブ、イサツキシマブ、イトリズマブ、イキセキズマブ、ケリキシマブ、ラクノツズマブ、ランパリズマブ、ラナデルマブ、ランドグロズマブ、ラルカビキシマブ、レブリキズマブ、レマレソマブ、レンジルマブ、レルデリムマブ、レソファブマブ、レトリズマブ、レキサツムマブ、リビビルマブ、リファツズマブ、リゲリズマブ、リロトマブ、リンツズマブ、リリルマブ、ロデルシズマブ、ロキベトマブ、ルカツムマブ、ルリズマブ、ルムレツズマブ、ルチキズマブ、マパツムマブ、マルゲツキシマブ、マサリモマブ、マツズマブ、マブリリムマブ、メポリズマ

ブ、メテリムマブ、ミンレツモマブ、ミツモマブ、モドツキシマブ、モガムリズマブ、モナリズマブ、モロリムマブ、モタビズマブ、モキセツモマブ、ムロモナブ、ナコロマブ、ナミルマブ、ナプツモマブ、ナルナツマブ、ナタリズマブ、ナビシキシズマブ、ナビブマブ、ネバクマブ、ネシツムマブ、ネモリズマブ、ネレリモマブ、ネスバクマブ、ニモツズマブ、ニボルマブ、オビルトキサキシマブ、オビヌツズマブ、オカラツズマブ、オクレリズマブ、オデュリモマブ、オファツムマブ、オララツマブ、オレクルマブ、オレンダリズマブ、オロキズマブ、オマリズマブ、オナルツズマブ、オンツキシズマブ、オピシヌマブ、オポルツズマブ、オレゴボマブ、オルチクマブ（ｏｒｔｉｃｕｍａｂ）、オテリキシズマブ、オトレルツズマブ、オキセルマブ、オザネズマブ、オゾラリズマブ、パギバキシマブ、パリビズマブ、パムレブルマブ、パニツムマブ、パノバクマブ、パルサツズマブ、パスコリズマブ、パソツキシズマブ、パテクリズマブ、パトリツマブ、ペンブロリズマブ、ペラキズマブ、ペルツズマブ、ペキセリズマブ、ピディリズマブ、プラクルマブ、プロザリズマブ、ポネズマブ、ポルガビキシマブ、プレザルマブ、プリリキシマブ、プリトキサキシマブ、プリツムマブ、クイリズマブ、ラコツモマブ、ラドレツマブ、ラフィビルマブ、ラルパンシズマブ、ラムシルマブ、ラネベトマブ、ラニビズマブ、ラキシバクマブ、レファネズマブ、レガビルマブ、レムトルマブ、レスリズマブ、リロツムマブ、リヌクマブ、リサンキズマブ、リババズマブ、ロバツムマブ、ロレデュマブ、ロモソズマブ、ロンタリズマブ、ロスマンツズマブ、ロベリズマブ、ロザノリキシズマブ、ルプリズマブ、サマリズマブ、サリルマブ、サトラリズマブ、サツモマブ、セクキヌマブ、セリクレルマブ、セリバンツマブ、セトキサキシマブ、セビルマブ、シブロツズマブ、シファリムマブ、シルツキシマブ、シムツズマブ、シプリズマブ、シルクマブ、ソラネズマブ、ソリトマブ、ソンツズマブ、スタムルマブ、スレソマブ、スプタブマブ、スビズマブ、スブラトクスマブ、タバルマブ、タドシズマブ、タリズマブ、タムツベトマブ、タネズマブ、タプリツモマブ、タレクスツマブ、タボリキシズマブ、ファノレソマブ、ノフェツモマブ、ピンツモマブ、テフィバズマブ、テリモマブ、テリソツズマブ、テナツモマブ、テネリキシマブ、テプリズマブ、テプロツムマブ、テシドルマブ、テゼペルマブ、ティガツズマブ、ティルドラキズマブ、チミグツズマブ、チモルマブ、トシリズマブ、トムゾツキシマブ、トラリズマブ、トサトクスマブ、トシツモマブ、トベツマブ、トラロキヌマブ、トレガリズマブ、トレメリムマブ、トレボグルマブ、ツコツズマブ、ツビルマブ、ウブリツキシマブ、ウロクプルマブ、ウレルマブ、ウルトキサズマブ、ウステキヌマブ、ウトミルマブ、バンチクツマブ、バヌシズマブ、バパリキシマブ、バリサクマブ、バルリルマブ、バテリズマブ、ベドリズマブ、ベルツズマブ、ベパリモマブ、ベセンクマブ、ビシリズマブ、ボバリリズマブ、ボロシキシマブ、ボンレロリズマブ、ボツムマブ、ブナキズマブ、タカツズマブ、ザルツムマブ、ザノリムマブ、ジラリムマブ、ゾリモマブ、カミダンルマブ、コフェツズマブ、ラジラツズマブ、ロンカスツキシマブ、テリソツズマブ、エナポタマブ、ＡＭＧ５９５の抗体又は抗エンビジン抗体である、請求項４に記載の抗体薬物複合体又はその製薬学的に許容される塩。

【請求項６】

ｍＡｂが、ブレンツキシマブである、請求項４に記載の抗体薬物複合体又はその製薬学的に許容される塩。

【請求項７】

ｑが１～２０の整数である、請求項４～６のいずれか一項に記載の抗体薬物複合体又はその製薬学的に許容される塩。

【請求項８】

ｑが１～１０の整数である、請求項４～６のいずれか一項に記載の抗体薬物複合体又はその製薬学的に許容される塩。

【請求項９】

請求項４～８のいずれか一項に記載の抗体薬物複合体又はその製薬学的に許容される塩を含有する、医薬組成物。

【請求項１０】

請求項４～８のいずれか一項に記載の抗体薬物複合体又はその製薬学的に許容される塩と、

抗がん性アルキル化剤、抗がん性代謝拮抗剤、抗がん性抗生物質、抗がん性白金配位化合物、抗がん性カンプトテシン誘導体、抗がん性チロシンキナーゼ阻害剤、抗がん性セリンスレオニンキナーゼ阻害剤、抗がん性リン脂質キナーゼ阻害剤、抗がん性モノクローナル抗体、インターフェロン、生物学的応答調節剤、ホルモン剤、免疫チェックポイント阻害剤、エピジェネティクス関連分子阻害剤、及びタンパク質翻訳後修飾阻害剤からなる群より選択される１種以上の抗がん性化合物又はその製薬学的に許容される塩と、を含む医薬組成物。

【請求項１１】

抗がん性アルキル化剤、抗がん性代謝拮抗剤、抗がん性抗生物質、抗がん性白金配位化合物、抗がん性カンプトテシン誘導体、抗がん性チロシンキナーゼ阻害剤、抗がん性セリンスレオニンキナーゼ阻害剤、抗がん性リン脂質キナーゼ阻害剤、抗がん性モノクローナル抗体、インターフェロン、生物学的応答調節剤、ホルモン剤、免疫チェックポイント阻害剤、エピジェネティクス関連分子阻害剤、及びタンパク質翻訳後修飾阻害剤からなる群より選択される１種以上の抗がん性化合物又はその製薬学的に許容される塩と併用してがんを治療するための、請求項９に記載の医薬組成物。

【請求項１２】

乳がん、胃がん、肺がん、肝臓がん、子宮頸がん、大腸がん、直腸がん、結腸がん、神経膠腫、リンパ腫、卵巣がん、膵がん、前立腺がん、腎がん、尿路上皮がん、皮膚がん、甲状腺がん、膀胱がん、頭頸部がん、子宮体がん、中皮腫、黒色腫、多発性骨髄腫及び白血病からなる群より選択されるがんの治療に用いられる、請求項９～１１のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項１３】

請求項４～８のいずれか一項に記載の抗体薬物複合体又はその製薬学的に許容される塩を含有する、抗がん剤。

【請求項１４】

がんが、乳がん、胃がん、肺がん、肝臓がん、子宮頸がん、大腸がん、直腸がん、結腸がん、神経膠腫、リンパ腫、卵巣がん、膵がん、前立腺がん、腎がん、尿路上皮がん、皮膚がん、甲状腺がん、膀胱がん、頭頸部がん、子宮体がん、中皮腫、黒色腫、多発性骨髄腫又は白血病である、請求項１３に記載の抗がん剤。

【手続補正２】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】０１６１

【補正方法】変更

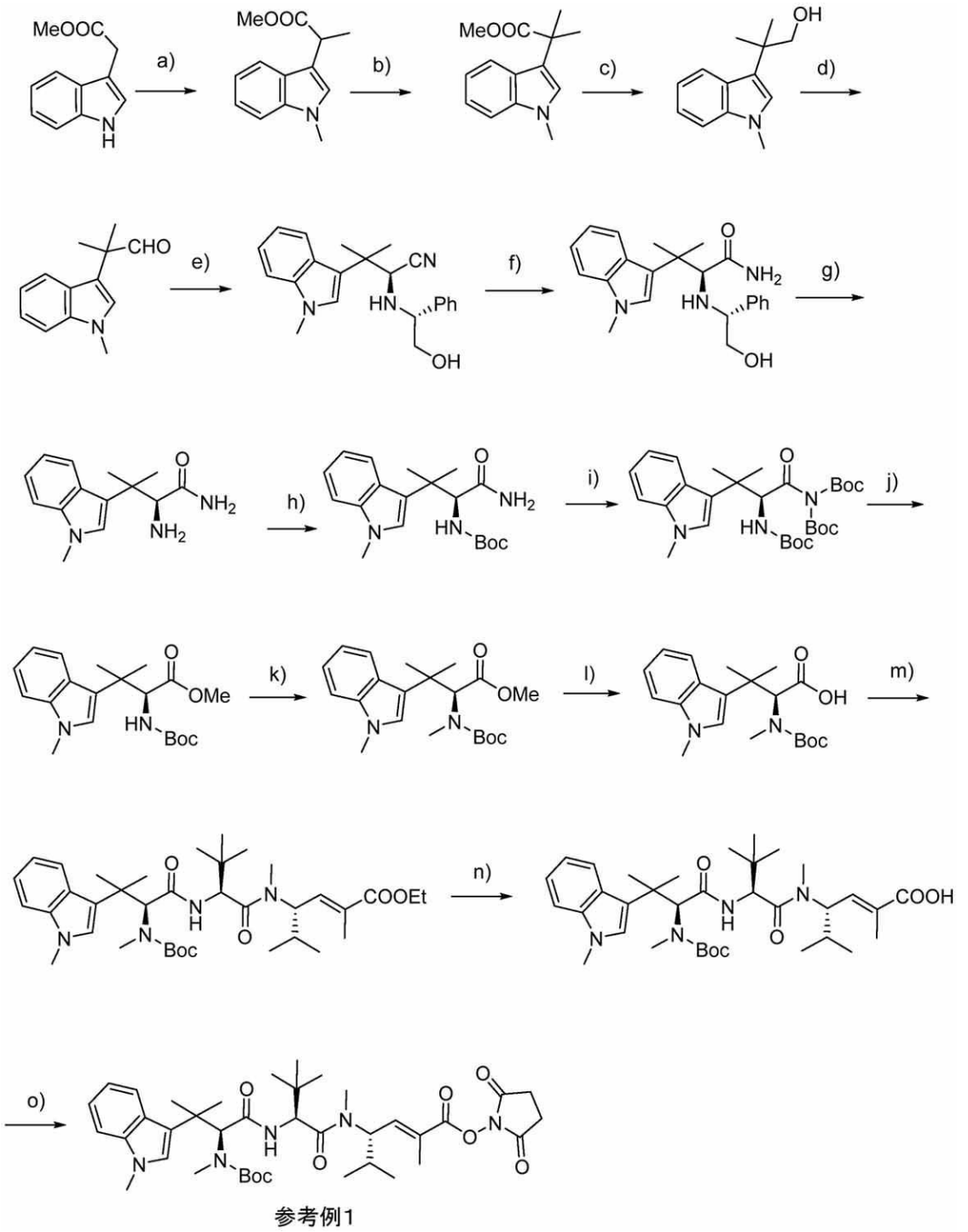
【補正の内容】

【０１６１】

参考例１

Ｎ－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－Ｎ，β，β，１－テトラメチル－Ｌ－トリプトフイル－Ｎ－｛（３Ｓ，４Ｅ）－６－［（２，５－ジオキソピロリジン－１－イル）オキシ］－２、５－ジメチル－６－オキソヘキサ－４－エン－３－イル｝－Ｎ，３－ジメチル－Ｌ－バリンアミド

【化２１】


MeOOC
a)
b)
c)
OH
d)
CHO
e)
CN
HN
Ph
OH
f)
NH2
g)
h)
Boc
i)
j)
OMe
k)
l)
m)
COOEt
n)
COOH
o)

参考例1