

【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6年12月11日(2024.12.11)

【国際公開番号】WO2023/054714
 【出願番号】特願2023-551927(P2023-551927)

【国際特許分類】

C 0 7 K 16/00(2006.01)
 C 0 7 K 5/083(2006.01)
 C 0 7 K 19/00(2006.01)
 A 6 1 K 39/395(2006.01)
 A 6 1 K 49/00(2006.01)
 A 6 1 P 35/00(2006.01)
 A 6 1 K 47/68(2017.01)

10

【F I】

C 0 7 K 16/00
 C 0 7 K 5/083 Z N A
 C 0 7 K 19/00
 A 6 1 K 39/395 L
 A 6 1 K 39/395 T
 A 6 1 K 49/00
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 K 47/68

20

【手続補正書】

【提出日】令和6年12月3日(2024.12.3)

【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

30

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

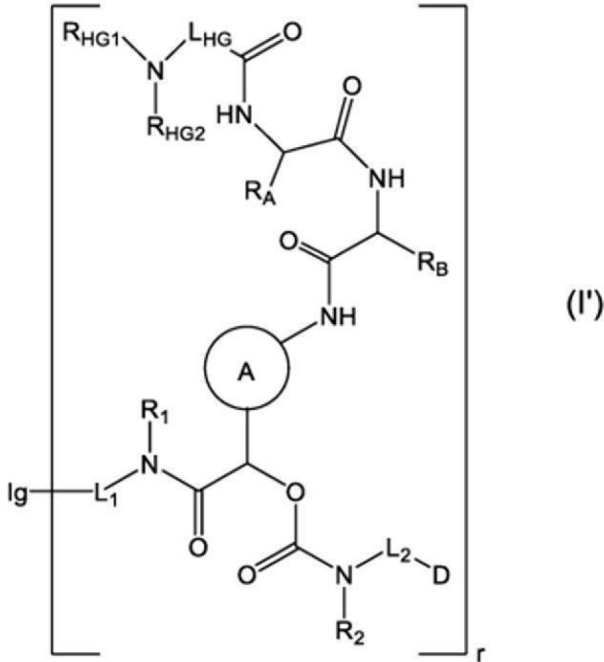
【請求項1】

下記式(I ') :

40

50

【化 1】



10

20

〔式中、

Ig は、2 個の重鎖および 2 個の軽鎖を含むイムノグロブリン単位を示し、かつ、2 個の重鎖中の、Eu numbering に従う 246 / 248 位、288 / 290 位、または 317 位に存在するリジン残基の側鎖中のアミノ基を介して、Ig に隣接する L₁ と位置選択的に結合しており、

R_A は、バリン残基の側鎖を示し、

R_B は、シトルリン残基、またはアラニン残基の側鎖を示し、

環 A は、置換基を有していてもよいフェニレン基を示し、

R₁、および R₂ は、それぞれ独立して、水素原子、またはアルキルを示し、

L₁ がカルボニル基を有し、Ig との位置選択的な結合が、リジン残基の側鎖中のアミノ基、および L₁ 中のカルボニル基の結合によるアミド結合により達成される、2 価の基を示し、

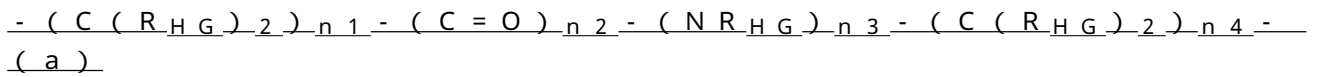
30

L₂ は、2 価の基を示し、

D は、医薬、標識物質、または安定化剤を示し、

2 個の重鎖あたりの前記結合の平均比率 r は、1.5 ~ 2.5 であり、

(-L_{HG}-) が、下記式 (a) :



〔式中、

複数の R_{HG} は、それぞれ独立して、水素原子、親水性基、または親水性基を含んでいてもよい 1 価の基を示し、

40

n₁ は、0 ~ 3 の整数であり、

n₂ は、0 または 1 の整数であり、

n₃ は、0 または 1 の整数であり、

n₄ は、0 ~ 3 の整数である。〕で表される親水性基を含んでいてもよい 2 価の基を示し、

R_{HG1}、および R_{HG2} は、それぞれ独立して、水素原子、親水性基、または親水性基を含んでいてもよい 1 価の基を示し、

少なくとも 1 つの親水性基が、L_{HG}、R_{HG1}、および R_{HG2} からなる群より選ばれる 1 以上の部位において含まれ、

50

親水性基が、カルボン酸基、スルホン酸基、水酸基、ポリエチレングリコール基、ポリサルコシン基、および糖部分からなる群より選ばれる1以上の基である。)で表される構造単位を含む、位置選択的なコンジュゲートまたはその塩。

【請求項2】

式(a)で表される2価の基が、下記式(a1)、(a2)、または(a3)：

(a1) $-(C(R_{HG})_2)-$ ；

(a2) $-(C(R_{HG})_2)-(C=O)-(NR_{HG})-(C(R_{HG})_2)-$ ；または

(a3) $-(C=O)-(C(R_{HG})_2)_2-$ ；

〔式中、

複数の R_{HG} は、それぞれ独立して、水素原子、親水性基、または親水性基を含む炭素原子数1~6のアルキル基を示す。)で表される2価の基である、請求項1記載の位置選択的なコンジュゲートまたはその塩。

【請求項3】

親水性基が、それぞれ独立して、カルボン酸基、スルホン酸基、または水酸基である、請求項1または2のいずれか一項記載の位置選択的なコンジュゲートまたはその塩。

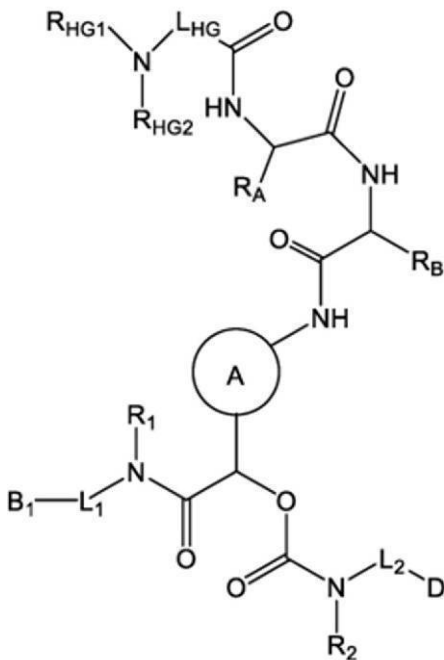
【請求項4】

親水性基が、カルボン酸基である、請求項3記載の位置選択的なコンジュゲートまたはその塩。

【請求項5】

下記式(III')：

【化2】



(III')

〔式中、

R_A は、バリン残基の側鎖を示し、

R_B は、シトルリン残基、またはアラニン残基の側鎖を示し、

環Aは、置換基を有していてもよいフェニレン基を示し、

R_1 、および R_2 は、それぞれ独立して、水素原子、またはアルキルを示し、

L_1 、および L_2 は、それぞれ独立して、2価の基を示し、

B_1 は、生体直交性官能基を示し、

Dは、医薬、標識物質、または安定化剤を示し、

$(-L_{HG}-)$ が、下記式(a)：

$-(C(R_{HG})_2)_{n1}-(C=O)_{n2}-(NR_{HG})_{n3}-(C(R_{HG})_2)_{n4}-$ 50

(a)

〔 式中、

複数の R_{HG} は、それぞれ独立して、水素原子、親水性基、または親水性基を含んでいてもよい 1 価の基を示し、

n_1 は、0 ~ 3 の整数であり、

n_2 は、0 または 1 の整数であり、

n_3 は、0 または 1 の整数であり、

n_4 は、0 ~ 3 の整数である。〕で表される親水性基を含んでいてもよい 2 価の基を示し、

R_{HG1} 、および R_{HG2} は、それぞれ独立して、水素原子、親水性基、または親水性基を含んでいてもよい 1 価の基を示し、

少なくとも 1 つの親水性基が、 L_{HG} 、 R_{HG1} 、および R_{HG2} からなる群より選ばれる 1 以上の部位において含まれ、

親水性基が、カルボン酸基、スルホン酸基、水酸基、ポリエチレングリコール基、ポリサルコシン基、および糖部分からなる群より選ばれる 1 以上の基である。〕で表される、化合物またはその塩。

【請求項 6】

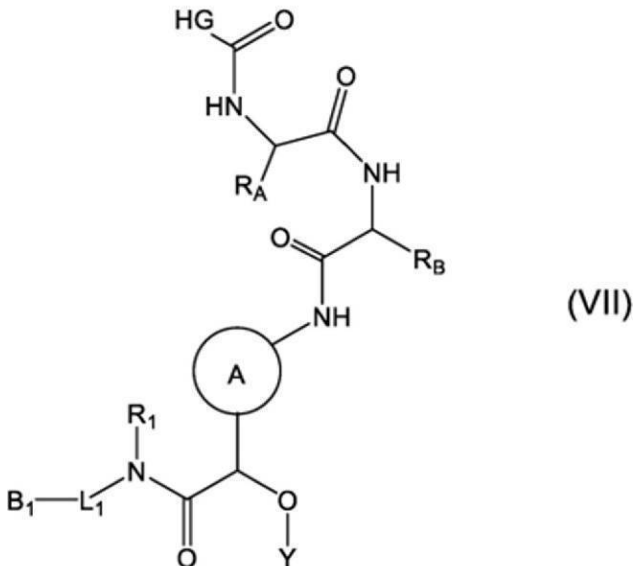
請求項 5 記載の化合物またはその塩を含む、抗体の誘導体化試薬。

【請求項 7】

下記 (3) の化合物またはその塩：

(3) 下記式 (VII) :

【化 3】



〔 式中、

HG は、親水性基、または親水性基を含む 1 価の基を示し、
親水性基が、カルボン酸基、スルホン酸基、水酸基、ポリサルコシン基、および糖部分からなる群より選ばれる 1 以上の基であり、

R_A は、バリン残基の側鎖を示し、

R_B は、シトルリン残基、またはアラニン残基の側鎖を示し、

環 A は、置換基を有していてもよい 2 価の芳香族環基を示し、

Y は、1 価の基を示し、

R_1 は、水素原子、または 1 価の基を示し、

L_1 は、2 価の基を示し、

B_1 は、生体直交性官能基を示す。〕で表される、生体直交性官能基を有する化合物またはその塩。

10

20

30

40

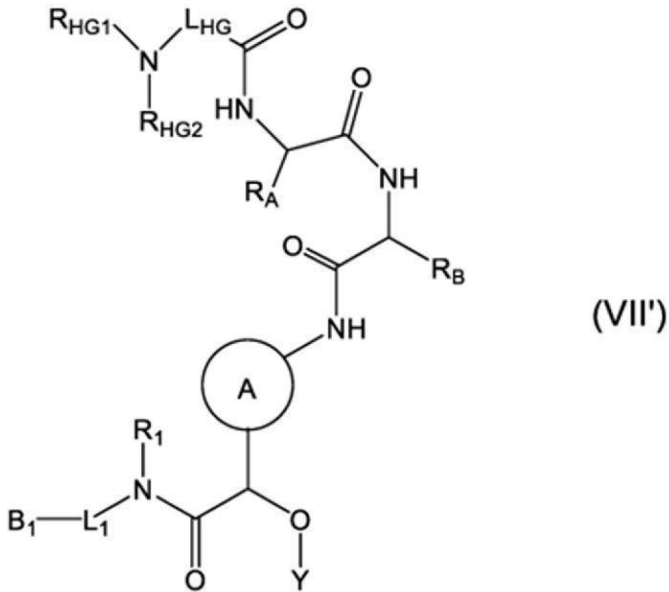
50

【請求項 8】

前記(3)の化合物が、下記(3')の化合物である、請求項記載の化合物またはその塩：

(3') 下記式(VII')：

【化 4】



10

20

〔式中、

R_A 、 R_B 、環A、およびYは、それぞれ、式(VII)で示されるものと同じであり

、

L_{HG} は、結合、または親水性基を含んでもよい2価の基を示し、

R_{HG1} 、および R_{HG2} は、それぞれ独立して、水素原子、親水性基、または親水性基を含んでもよい1価の基を示し、

R_1 、 L_1 、および B_1 は、それぞれ、式(VII)で示されるものと同じである。〕

30

40

50