

【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7年3月14日(2025.3.14)

【国際公開番号】WO2022/204528

【公表番号】特表2024-512056(P2024-512056A)

【公表日】令和6年3月18日(2024.3.18)

【年通号数】公開公報(特許)2024-050

【出願番号】特願2023-558656(P2023-558656)

【国際特許分類】

C 0 7 K 1 6 / 3 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 9 / 3 9 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 4 7 / 6 8 ( 2 0 1 7 . 0 1 )

A 6 1 P 3 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 3 5 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 3 7 / 0 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 4 7 / 5 4 ( 2 0 1 7 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

10

20

【 F I 】

C 0 7 K 1 6 / 3 0                    Z N A

A 6 1 K 3 9 / 3 9 5                Y

A 6 1 K 4 7 / 6 8

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 P 3 5 / 0 4

A 6 1 P 1 5 / 0 0

A 6 1 P 1 / 0 0

A 6 1 P 3 7 / 0 2

A 6 1 K 4 7 / 5 4

A 6 1 K 3 1 / 5 5

A 6 1 K 3 9 / 3 9 5                T

30

【手続補正書】

【提出日】令和7年3月6日(2025.3.6)

【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】

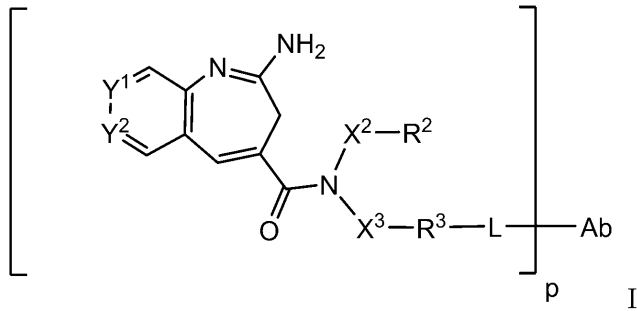
40

【特許請求の範囲】

【請求項1】

1つ以上の2 - アミノ - 4 - カルボキサミド - ベンゾアゼピン部分にリンカーによって共有結合された抗体を含み、式I：

50



10

またはその薬学的に許容される塩を有し、

Abは、抗体であり、

pは、1～8の整数であり、

X<sup>2</sup>及びX<sup>3</sup>は、独立して、結合、C(=O)、C(=O)N(R<sup>5</sup>)、O、N(R<sup>5</sup>)、S、S(O)<sub>2</sub>、及びS(O)<sub>2</sub>N(R<sup>5</sup>)からなる群から選択され、

Y<sup>1</sup>は、CR<sup>1</sup>またはNであり、

Y<sup>2</sup>は、CHまたはNであり、

R<sup>1</sup>は、H、C<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>カルボシクリル、C<sub>6</sub>～C<sub>20</sub>アリール、C<sub>2</sub>～C<sub>9</sub>ヘテロシクリル、及びC<sub>1</sub>～C<sub>20</sub>ヘテロアリールからなる群から選択され、

R<sup>2</sup>は、H、C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>カルボシクリル、C<sub>6</sub>～C<sub>20</sub>アリール、C<sub>2</sub>～C<sub>9</sub>ヘテロシクリル、及びC<sub>1</sub>～C<sub>20</sub>ヘテロアリールからなる群から選択され、

R<sup>3</sup>は、

- (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - N(R<sup>5</sup>) - \* ;

- (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - N(R<sup>5</sup>) - C(=O) \* ;

- (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - N(R<sup>5</sup>) - C(=O)O - (C<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>カルボシクリルジイル) - \* ;

- (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - N(R<sup>5</sup>) - (C<sub>1</sub>～C<sub>20</sub>ヘテロアリールジイル) - \* ;

- (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - N(R<sup>5</sup>) - (C<sub>1</sub>～C<sub>20</sub>ヘテロアリールジイル) - (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - \* ;

- (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - N(R<sup>5</sup>) - S(O)<sub>2</sub> - \* ;

- (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - OC(=O) - (C<sub>2</sub>～C<sub>9</sub>ヘテロシクリルジイル) - \* ;

- (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - O - \* ;

- (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - (C<sub>3</sub>～C<sub>12</sub>カルボシクリルジイル) - \* ;

- (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - (C<sub>6</sub>～C<sub>20</sub>アリールジイル) - \* ;

- (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - (C<sub>6</sub>～C<sub>20</sub>アリール) - (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - N(R<sup>5</sup>) - \* ;

- (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - (C<sub>2</sub>～C<sub>9</sub>ヘテロシクリルジイル) - (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - N(R<sup>5</sup>) - \* ;

- (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - (C<sub>1</sub>～C<sub>20</sub>ヘテロアリールジイル) - N(R<sup>5</sup>) - \* ;

- (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - (C<sub>1</sub>～C<sub>20</sub>ヘテロアリールジイル) - \* ;

- (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - (C<sub>1</sub>～C<sub>20</sub>ヘテロアリールジイル) - (C<sub>1</sub>

～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - \* ;

- (C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルジイル) - (C<sub>1</sub>～C<sub>20</sub>ヘテロアリールジイル) - (C<sub>1</sub>

10

20

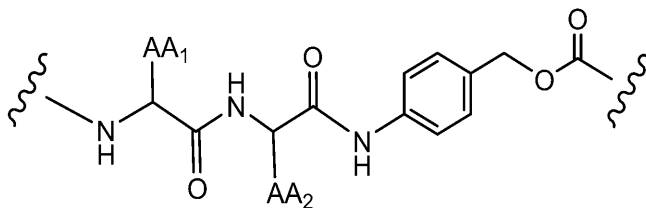
30

40

50

- $\sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $N(R^5)$  - \* ;  
 - ( $C_3 \sim C_{12}$  カルボシクリルジイル) - \* ;  
 - ( $C_3 \sim C_{12}$  カルボシクリルジイル) - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $N(R^5)$  - \* ;  
 - ( $C_3 \sim C_{12}$  カルボシクリルジイル) - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $N(R^5)$  - \* ;  
 - ( $C_3 \sim C_{12}$  カルボシクリルジイル) -  $NR^5$  -  $C(=NR^5a)$  -  $N(R^5)$  - \* ;  
 - ( $C_6 \sim C_{20}$  アリールジイル) - \* ;  
 - ( $C_6 \sim C_{20}$  アリールジイル) -  $N(R^5)$  - \* ; 10  
 - ( $C_6 \sim C_{20}$  アリールジイル) - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $N(R^5)$  - \* ;  
 - ( $C_6 \sim C_{20}$  アリールジイル) -  $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) - ( $C_2 \sim C_{20}$  ヘテロシクリルジイル) - \* ;  
 - ( $C_6 \sim C_{20}$  アリールジイル) - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $N(R^5)$  -  $C(=NR^5a)$  -  $N(R^5)$  - \* ;  
 - ( $C_2 \sim C_{20}$  ヘテロシクリルジイル) - \* ;  
 - ( $C_2 \sim C_9$  ヘテロシクリルジイル) - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $N(R^5)$  - \* ;  
 - ( $C_2 \sim C_9$  ヘテロシクリルジイル) -  $N(R^5)$  -  $C(=NR^5a)$  -  $N(R^5)$  - \* ; 20  
 - ( $C_1 \sim C_{20}$  ヘテロアリールジイル) - \* ;  
 - ( $C_1 \sim C_{20}$  ヘテロアリールジイル) - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $N(R^5)$  - \* ;  
 - ( $C_1 \sim C_{20}$  ヘテロアリールジイル) - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) - O - \* ;  
 ; 及び  
 - ( $C_1 \sim C_{20}$  ヘテロアリールジイル) -  $N(R^5)$  -  $C(=NR^5a)$  -  $N(R^5)$  - \* からなる群から選択され、  
 アスタリスク\*は、リンカーLの結合部位を示し、  
 $R^5$ は、H、 $C_6 \sim C_{20}$  アリール及び $C_1 \sim C_{12}$  アルキルからなる群から選択されるか、または2つの $R^5$ は一緒になって、5員もしくは6員のヘテロシクリル環を形成し、  
 $R^5a$ は、 $C_6 \sim C_{20}$  アリール及び $C_1 \sim C_{20}$  ヘテロアリールからなる群から選択され、  
 Lは、  
 -  $C(=O)$  - PEG -  $C(=O)$  - ;  
 -  $C(=O)$  - PEG -  $C(=O)$  - PEP - ;  
 -  $C(=O)$  - PEG -  $N(R^5)$  - ;  
 -  $C(=O)$  - PEG -  $N(R^5)$  -  $C(=O)$  - ;  
 -  $C(=O)$  - PEG -  $NR^5$  - PEG -  $C(=O)$  - PEP - ; 40  
 -  $C(=O)$  - PEG -  $N^+(R^5)_2$  - PEG -  $C(=O)$  - PEP - ;  
 -  $C(=O)$  - PEG -  $NR^5CH(AA_1)C(=O)$  - PEG -  $C(=O)$  - PEP - ;  
 P - ;  
 -  $C(=O)$  - PEG - O - ;  
 -  $C(=O)$  - PEG - SS - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) - OC(=O) - ;  
 -  $C(=O)$  - PEG - SS - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $C(=O)$  - ;  
 -  $C(=O)$  - PEG - ;  
 -  $C(=O)$  - PEG -  $C(=O)N(R^5)$  - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $N(R^5)C(=O)$  - ( $C_2 \sim C_5$  モノヘテロシクリルジイル) - ;  
 -  $C(=O)$  - PEG -  $C(=O)N(R^5)$  - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) - ; 50

- C ( = O ) - ( C <sub>1</sub> - C <sub>12</sub> アルキルジイル ) - C ( = O ) - P E P - ;
  - C ( = O ) - ( C <sub>1</sub> ~ C <sub>12</sub> アルキルジイル ) - C ( = O ) - P E P - N ( R <sup>5</sup> ) - ( C <sub>1</sub> ~ C <sub>12</sub> アルキルジイル ) - ;
  - C ( = O ) - ( C <sub>1</sub> ~ C <sub>12</sub> アルキルジイル ) - C ( = O ) - P E P - N ( R <sup>5</sup> ) - ( C <sub>1</sub> ~ C <sub>12</sub> アルキルジイル ) - N ( R <sup>5</sup> ) - C ( = O ) ;
  - C ( = O ) - ( C <sub>1</sub> ~ C <sub>12</sub> アルキルジイル ) - C ( = O ) - P E P - N ( R <sup>5</sup> ) - ( C <sub>1</sub> ~ C <sub>12</sub> アルキルジイル ) - N ( R <sup>5</sup> ) C ( = O ) - ( C <sub>2</sub> ~ C <sub>5</sub> モノヘテロシクリルジイル ) - ;
  - C ( = O ) - C H <sub>2</sub> C H <sub>2</sub> O C H <sub>2</sub> C H <sub>2</sub> - ( C <sub>1</sub> ~ C <sub>20</sub> ヘテロアリアルジイル )
  - C H <sub>2</sub> O - P E G - C ( = O ) - ( M C g l u c ) - ;
  - C ( = O ) - C H <sub>2</sub> C H <sub>2</sub> O C H <sub>2</sub> C H <sub>2</sub> - ( C <sub>1</sub> ~ C <sub>20</sub> ヘテロアリアルジイル )
  - C H <sub>2</sub> O - P E G - C ( = O ) - ( M C g l u c ) - N ( R <sup>5</sup> ) - ( C <sub>1</sub> ~ C <sub>12</sub> アルキルジイル ) N ( R <sup>5</sup> ) C ( = O ) - ( C <sub>2</sub> ~ C <sub>5</sub> モノヘテロシクリルジイル ) - ;
  - C ( = O ) - P E G - C ( = O ) N ( R <sup>5</sup> ) - ( C <sub>1</sub> ~ C <sub>12</sub> アルキルジイル ) - ;
  - C ( = O ) - P E G - C ( = O ) N ( R <sup>5</sup> ) - ( C <sub>1</sub> ~ C <sub>12</sub> アルキルジイル ) N ( R <sup>5</sup> ) C ( = O ) - ( C <sub>2</sub> ~ C <sub>5</sub> モノヘテロシクリルジイル ) - ;
  - C ( = O ) - P E G - C ( = O ) - P E P - N ( R <sup>5</sup> ) - ( C <sub>1</sub> ~ C <sub>12</sub> アルキルジイル ) - ;
  - C ( = O ) - P E G - C ( = O ) - P E P - N ( R <sup>5</sup> ) - ( C <sub>1</sub> ~ C <sub>12</sub> アルキルジイル ) N ( R <sup>5</sup> ) C ( = O ) - ( C <sub>2</sub> ~ C <sub>5</sub> モノヘテロシクリルジイル ) - ;
  - スクシンイミジル - ( C H <sub>2</sub> ) <sub>m</sub> - C ( = O ) N ( R <sup>5</sup> ) - P E G - C ( = O ) - ;
  - スクシンイミジル - ( C H <sub>2</sub> ) <sub>m</sub> - C ( = O ) N ( R <sup>5</sup> ) - P E G - N ( R <sup>5</sup> ) - ;
  - スクシンイミジル - ( C H <sub>2</sub> ) <sub>m</sub> - C ( = O ) N ( R <sup>5</sup> ) - P E G - N ( R <sup>5</sup> ) - C ( = O ) - ;
  - スクシンイミジル - ( C H <sub>2</sub> ) <sub>m</sub> - C ( = O ) N ( R <sup>5</sup> ) - P E G - C ( = O ) - P E P - ;
  - スクシンイミジル - ( C H <sub>2</sub> ) <sub>m</sub> - C ( = O ) - P E P - N ( R <sup>5</sup> ) - ( C <sub>1</sub> ~ C <sub>12</sub> アルキルジイル ) - ;
  - スクシンイミジル - ( C H <sub>2</sub> ) <sub>m</sub> - C ( = O ) - P E P - N ( R <sup>5</sup> ) - ( C <sub>1</sub> ~ C <sub>12</sub> アルキルジイル ) N ( R <sup>5</sup> ) C ( = O ) - ; 及び
  - スクシンイミジル - ( C H <sub>2</sub> ) <sub>m</sub> - C ( = O ) - P E P - N ( R <sup>5</sup> ) - ( C <sub>1</sub> ~ C <sub>12</sub> アルキルジイル ) N ( R <sup>5</sup> ) C ( = O ) - ( C <sub>2</sub> ~ C <sub>5</sub> モノヘテロシクリルジイル ) - からなる群から選択され、
- PEGは、式： - ( C H <sub>2</sub> C H <sub>2</sub> O ) <sub>n</sub> - ( C H <sub>2</sub> ) <sub>m</sub> - を有し、 m は 1 ~ 5 の整数であり、 n は 2 ~ 50 の整数であり、
- PEPは、式：



を有し、 A A <sub>1</sub> 及び A A <sub>2</sub> は、アミノ酸側鎖から独立して選択されるか、または A A <sub>1</sub> もしくは A A <sub>2</sub> 及び隣接する窒素原子は 5 員環プロリンアミノ酸を形成し、波線は結合点を示しており、

アルキル、アルキルジイル、アルケニル、アルケニルジイル、アルキニル、アルキニル

10

20

30

40

50

ジイル、アリアル、アリアルジイル、カルボシクリル、カルボシクリルジイル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルジイル、ヘテロアリアル及びヘテロアリアルジイルは、任意選択で、F、Cl、Br、I、-CN、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-CH=CH<sub>2</sub>、-CCH<sub>3</sub>、-C(CCH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>OH、-CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH、-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>OH、-CH(OH)CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>OP(O)(OH)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>F、-CHF<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>、-CH(CH<sub>3</sub>)CN、-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CN、-CH<sub>2</sub>CN、-CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>NHSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>H、-COCH<sub>3</sub>、-CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-CO<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、-COCH(OH)CH<sub>3</sub>、-CONH<sub>2</sub>、-CONHCH<sub>3</sub>、-CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-NHCH<sub>3</sub>、-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-NHCOCH<sub>3</sub>、-N(CH<sub>3</sub>)COCH<sub>3</sub>、-NHS(O)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-N(CH<sub>3</sub>)C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>、-N(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>S(O)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-NO<sub>2</sub>、=O、-OH、-OCH<sub>3</sub>、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-O(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)<sub>n</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>CO<sub>2</sub>H、-O(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)<sub>n</sub>H、-OP(O)(OH)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-SCH<sub>3</sub>、-S(O)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、及び-S(O)<sub>3</sub>Hから独立して選択される1つ以上の基で置換される、免疫複合体。

10

## 【請求項2】

20

前記抗体は、PD-L1、HER2、CEA及びTROP2から選択される標的に結合する抗原結合ドメインを有する、抗体コンストラクトである、請求項1に記載の免疫複合体。

## 【請求項3】

前記抗体は、アテゾリズマブ、デュルバルマブ、アベルマブ、トラスツズマブ、ペルツズマブ、ラベツズマブ、及びサシツズマブからなる群から選択される、請求項2に記載の免疫複合体。

## 【請求項4】

R<sup>1</sup>は、任意選択で置換されたC<sub>1</sub>~C<sub>20</sub>ヘテロアリアルである、請求項1~3のいずれか一項に記載の免疫複合体。

30

## 【請求項5】

R<sup>1</sup>はピリミジニルまたはピリジニルである、請求項1~3のいずれか一項に記載の免疫複合体。

## 【請求項6】

X<sup>2</sup>及びX<sup>3</sup>はそれぞれ結合であり、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>は、C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキル、-O-(C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>アルキル)、-(C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>アルキルジイル)-OR<sup>5</sup>、-(C<sub>1</sub>~C<sub>8</sub>アルキルジイル)-N(R<sup>5</sup>)CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、-(C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>アルキル)-OC(O)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>、-O-(C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>アルキル)-N(R<sup>5</sup>)CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>、及び-O-(C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>アルキル)-OC(O)N(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub>から独立して選択される、請求項1~3のいずれか一項に記載の免疫複合体。

40

## 【請求項7】

X<sup>2</sup>は結合であり、R<sup>2</sup>はC<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>アルキルである、請求項1~3のいずれか一項に記載の免疫複合体。

## 【請求項8】

X<sup>3</sup>はOであり、R<sup>3</sup>は、-(C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>アルキルジイル)-N(R<sup>5</sup>)-\*である、請求項1~3のいずれか一項に記載の免疫複合体。

## 【請求項9】

R<sup>3</sup>は、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH-である、請求項8に記載の免疫複合体。

## 【請求項10】

Lは、-C(=O)-PEG-C(=O)-である、請求項8に記載の免疫複合体。

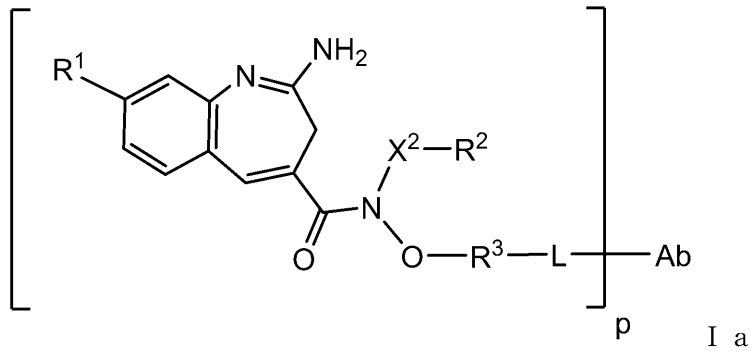
50

## 【請求項 1 1】

n は 10 であり、m は 1 である、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の免疫複合体。

## 【請求項 1 2】

式 I a を有する、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の免疫複合体。



## 【請求項 1 3】

R<sup>1</sup> は、任意選択で置換された C<sub>1</sub> ~ C<sub>20</sub> ヘテロアリールである、請求項 1 2 に記載の免疫複合体。

20

## 【請求項 1 4】

R<sup>1</sup> はピリミジニルまたはピリジルである、請求項 1 3 に記載の免疫複合体。

## 【請求項 1 5】

X<sup>2</sup> は結合であり、R<sup>2</sup> は C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキルである、請求項 1 2 に記載の免疫複合体。

## 【請求項 1 6】

R<sup>3</sup> は、- (C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub> アルキルジイル) - N (R<sup>5</sup>) - \* である、請求項 1 2 に記載の免疫複合体。

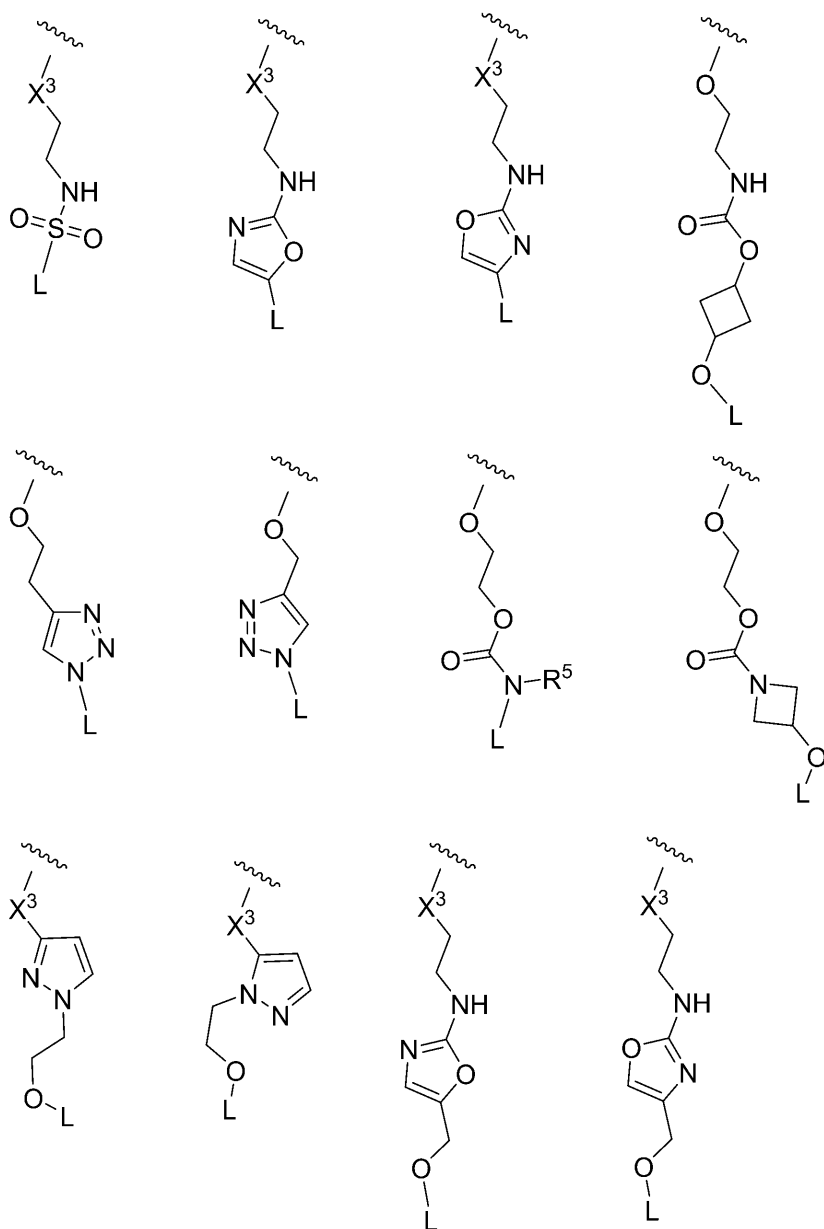
## 【請求項 1 7】

X<sup>3</sup> - R<sup>3</sup> - L は、

30

40

50



10

20

30

からなる群から選択され、波線はNへの結合点を示す、請求項1～3のいずれか一項に記載の免疫複合体。

40

【請求項18】

Y<sup>1</sup>はCR<sup>1</sup>であり、Y<sup>2</sup>はCHである、請求項1～3のいずれか一項に記載の免疫複合体。

【請求項19】

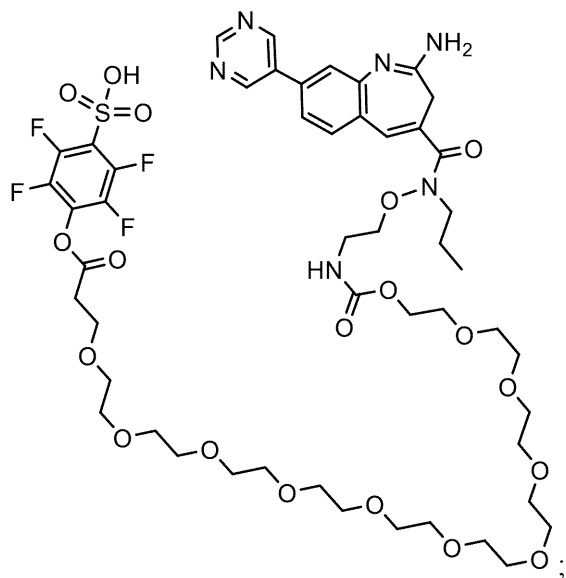
Y<sup>1</sup>はNであり、Y<sup>2</sup>はCHである、請求項1～3のいずれか一項に記載の免疫複合体。

【請求項20】

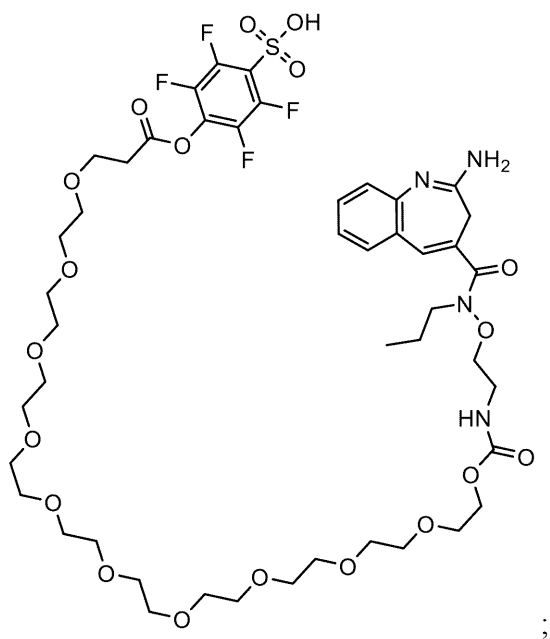
Y<sup>1</sup>はNであり、Y<sup>2</sup>はNである、請求項1～3のいずれか一項に記載の免疫複合体。

【請求項21】

50



10

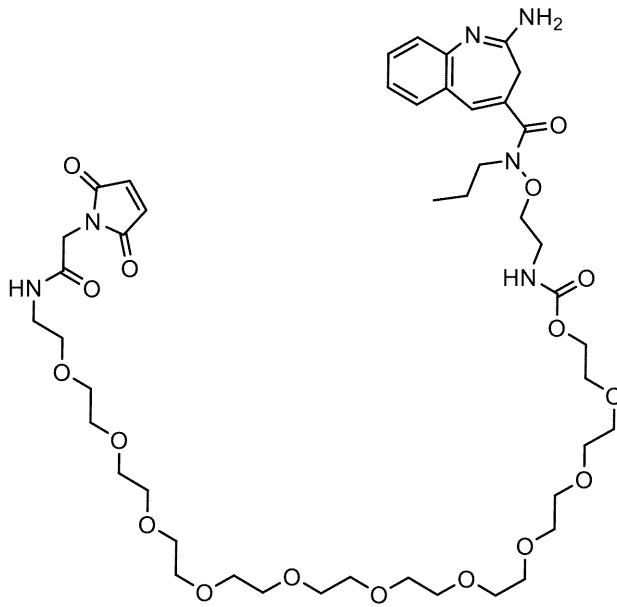


20

30

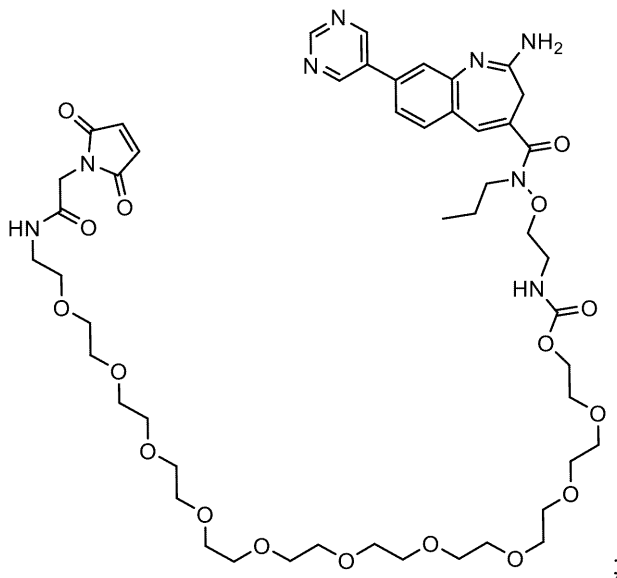
40

50



10

;



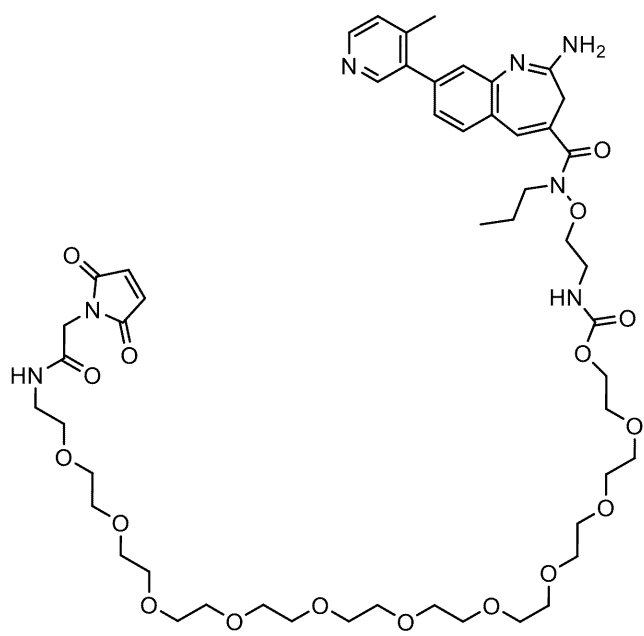
20

30

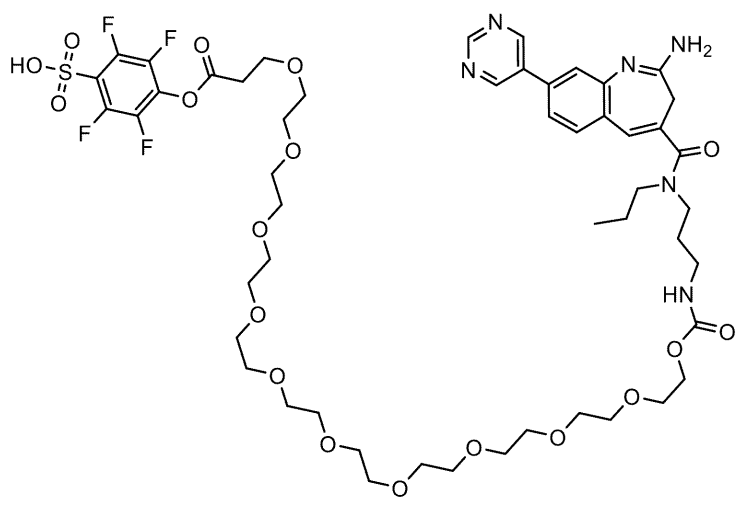
;

40

50



10



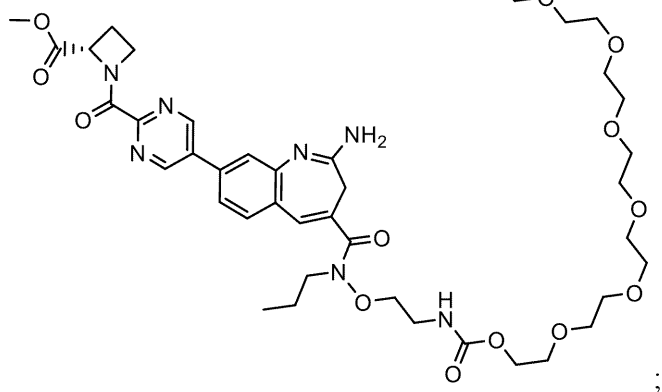
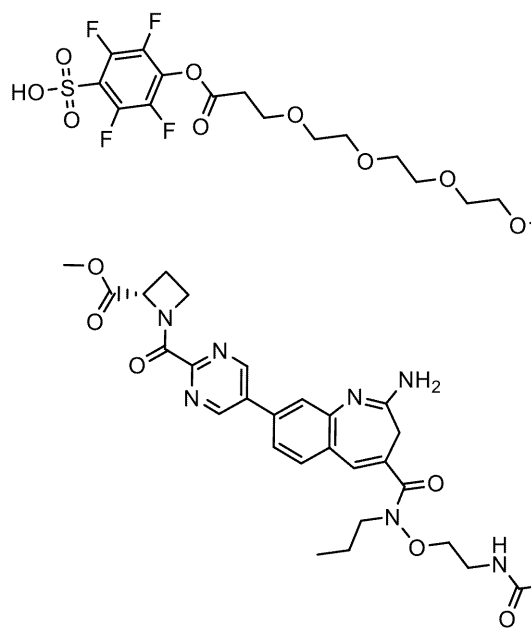
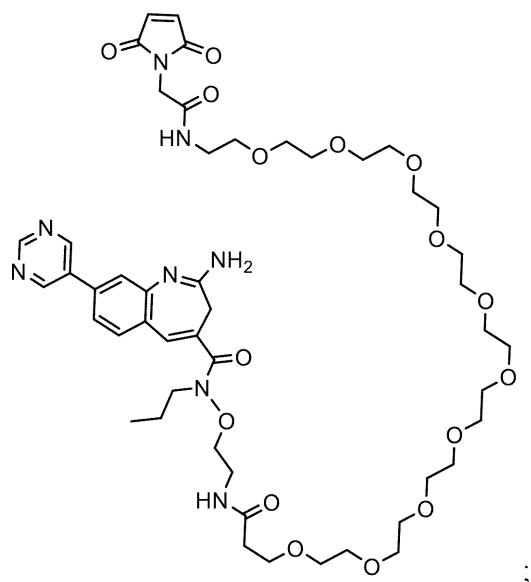
20

30

40

50





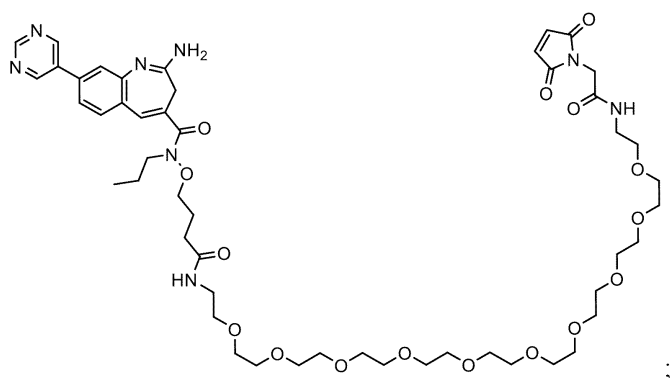
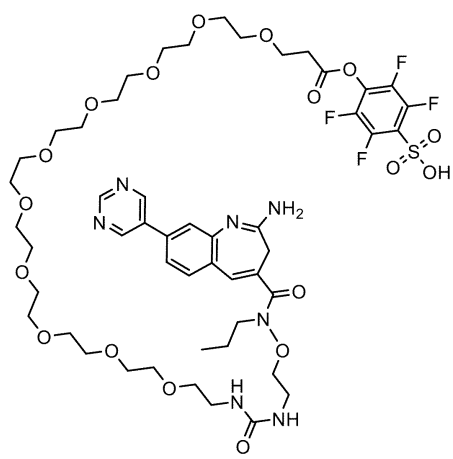
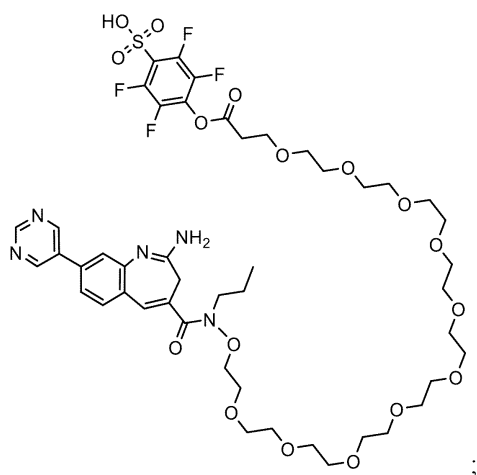
10

20

30

40

50



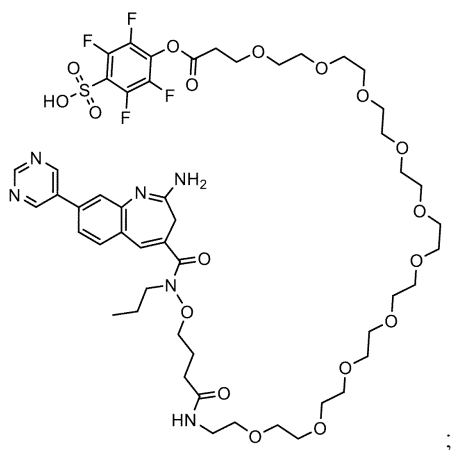
10

20

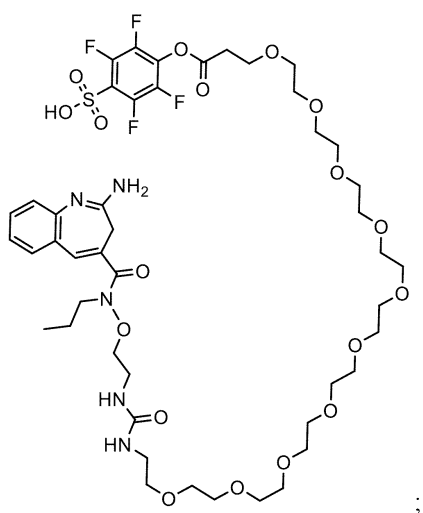
30

40

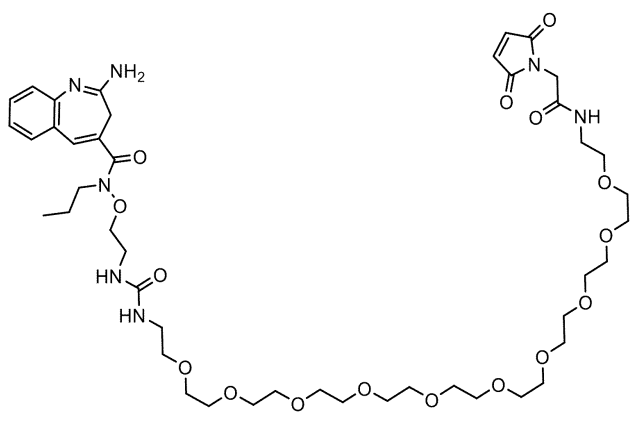
50



10



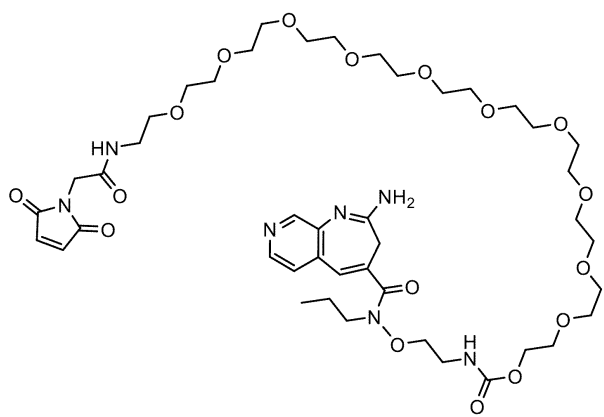
20



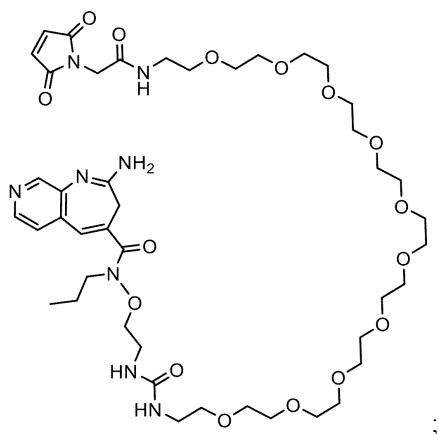
30

40

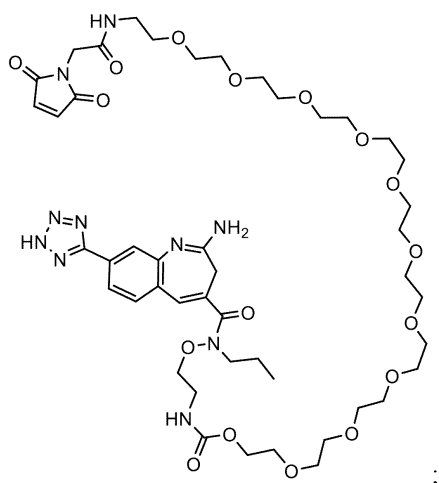
50



10



20

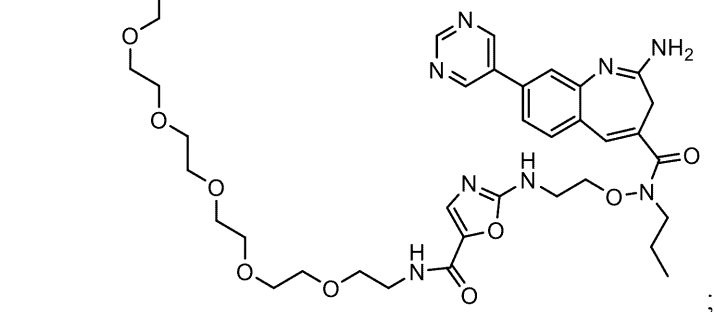
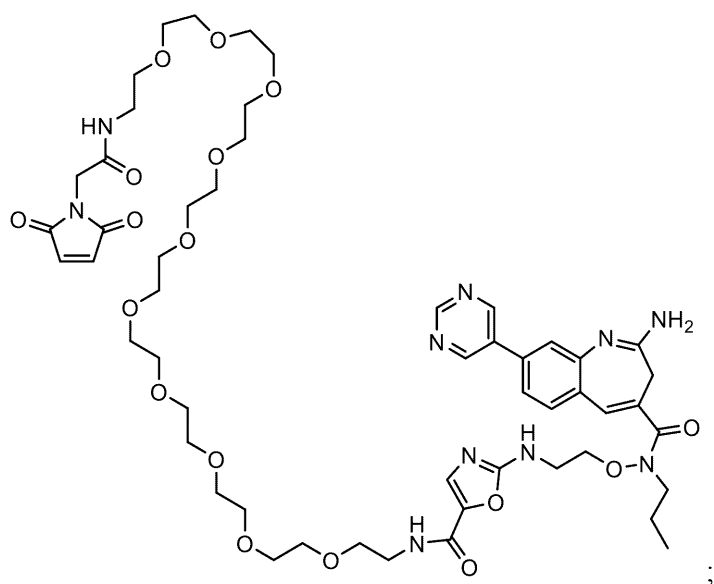
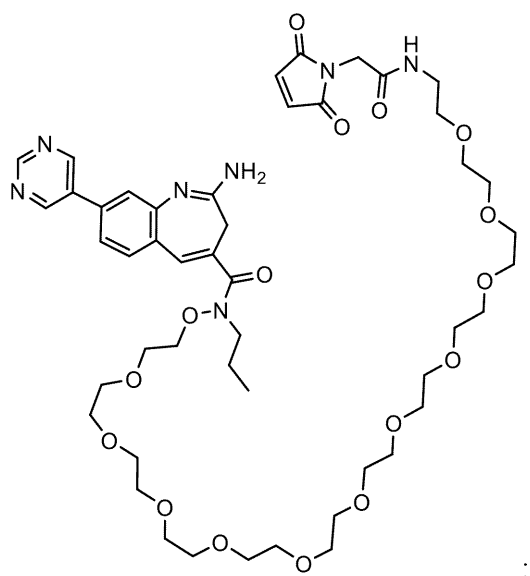


30



40

50



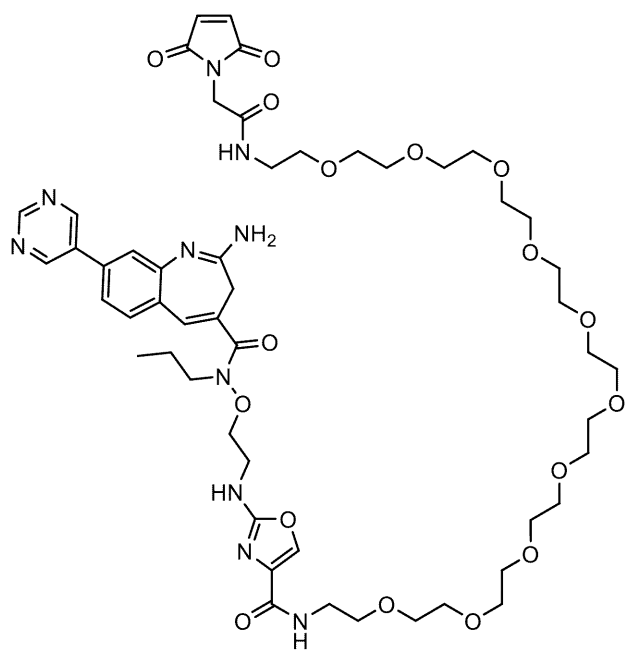
10

20

30

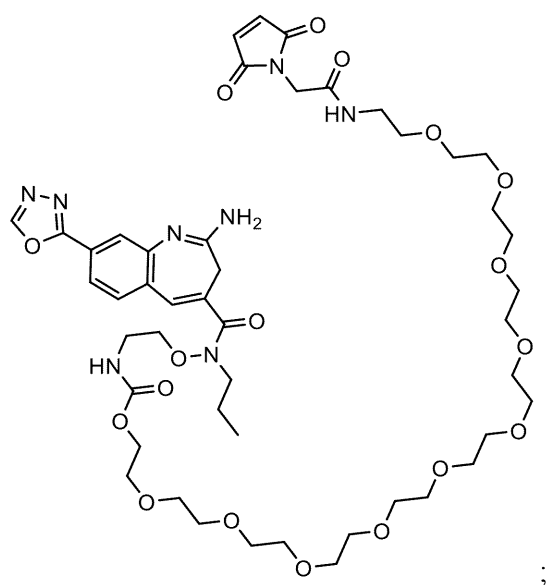
40

50



10

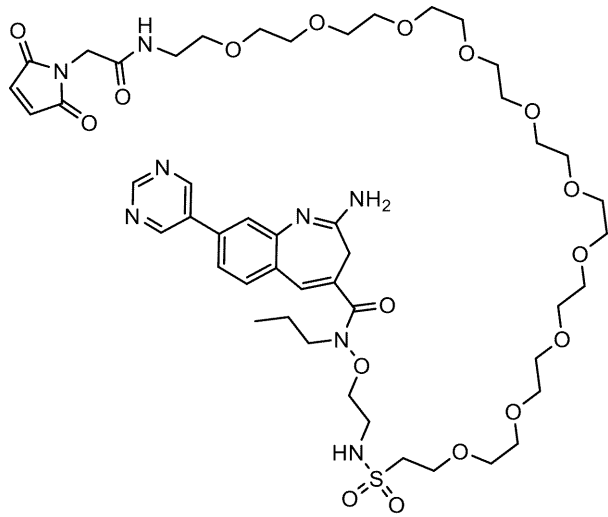
20



30

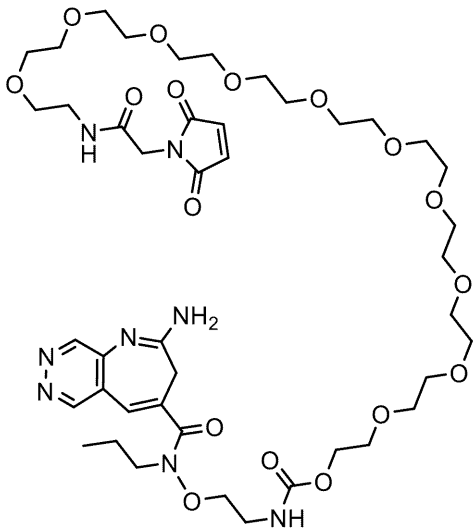
40

50



10

; 及び



20

30

からなる群から選択される 2 - アミノ - 4 - カルボキサミド - ベンゾアゼピンリンカー化合物。

【請求項 2 2】

抗体と、請求項 2 1 に記載の 2 - アミノ - 4 - カルボキサミド - ベンゾアゼピンリンカー化合物とのコンジュゲートによって調製される、免疫複合体。

【請求項 2 3】

治療上有効な量の請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の免疫複合体と、1 つ以上の薬学的に許容される希釈剤、ビヒクル、担体または賦形剤と、を含む、医薬組成物。

40

【請求項 2 4】

治療上有効な量の請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の免疫複合体を含む、がんを治療するための医薬であって、前記がんは、膀胱癌、尿路癌、尿路上皮癌、肺癌、非小細胞肺癌、メルケル細胞癌、結腸癌、結腸直腸癌、胃癌、及び乳癌から選択される、医薬。

【請求項 2 5】

前記がんは、TLR 7 及び / または TLR 8 アゴニズムによって誘発される炎症誘発性応答に感受性である、請求項 2 4 に記載の医薬。

【請求項 2 6】

前記がんは、トリプルネガティブ乳癌、転移性メルケル細胞癌、または胃食道接合部腺

50

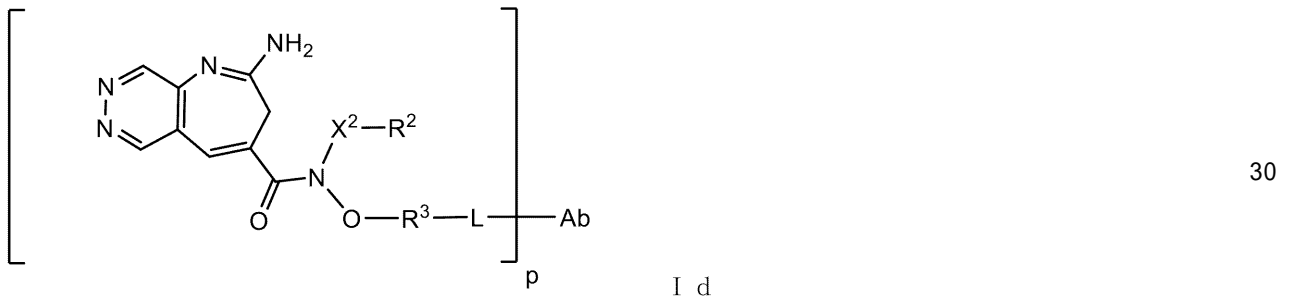
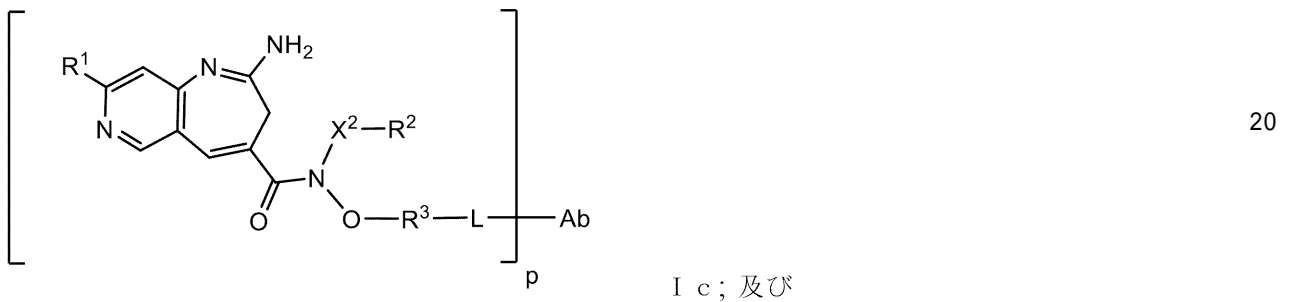
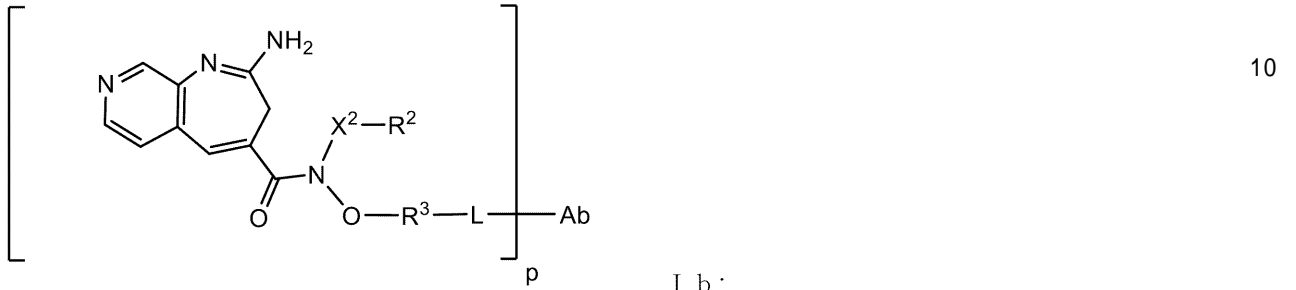
癌である、請求項 2 4 に記載の医薬。

【請求項 2 7】

極性非プロトン性有機溶媒に溶解された請求項 2 1 に記載の 2 - アミノ - 4 - カルボキサミド - ベンゾアゼピンリンカーが、水性緩衝液に溶解された抗体と反応させられる、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の式 I の免疫複合体を調製する方法。

【請求項 2 8】

式 I b ~ d :



から選択される、請求項 1 に記載の免疫複合体。

【請求項 2 9】

L が、

- スクシンイミジル - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - C(=O)N(R<sup>5</sup>) - PEG - C(=O) - ; 40
- スクシンイミジル - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - C(=O)N(R<sup>5</sup>) - PEG - N(R<sup>5</sup>) - ;

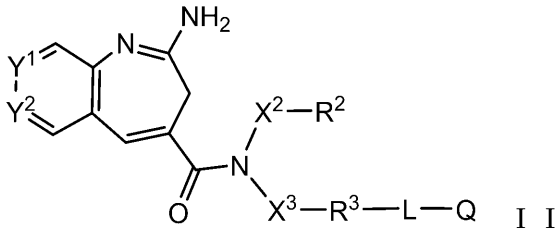
及び

- スクシンイミジル - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - C(=O)N(R<sup>5</sup>) - PEG - N(R<sup>5</sup>) - C(=O) -

から選択される、請求項 1 に記載の免疫複合体。

【請求項 3 0】

式 I I :



10

式中、

$X^2$  及び  $X^3$  は、それぞれ独立して、結合、 $C(=O)$ 、 $C(=O)N(R^5)$ 、 $O$ 、 $N(R^5)$ 、 $S$ 、 $S(O)_2$ 、及び  $S(O)_2N(R^5)$  からなる群から選択され、

$Y^1$  は、 $CR^1$  または  $N$  であり、

$Y^2$  は、 $CH$  または  $N$  であり、

$R^1$  は、 $H$ 、 $C_3 \sim C_{12}$  カルボシクリル、 $C_6 \sim C_{30}$  アリール、 $C_2 \sim C_9$  ヘテロシクリル、及び  $C_1 \sim C_{20}$  ヘテロアリールからなる群から選択され、

$R^2$  は、 $H$ 、 $C_1 \sim C_{12}$  アルキル、 $C_2 \sim C_6$  アルケニル、 $C_2 \sim C_6$  アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$  カルボシクリル、 $C_6 \sim C_{20}$  アリール、 $C_2 \sim C_9$  ヘテロシクリル、及び  $C_1 \sim C_{20}$  ヘテロアリールからなる群から選択され、

20

$R^3$  は、

- ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $N(R^5)$  - \* ;

- ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $N(R^5)$  -  $C(=O)$  \* ;

- ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $O$  - \* ;

- ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) - ( $C_3 \sim C_{12}$  カルボシクリルジイル) - \* ;

- ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) - ( $C_6 \sim C_{20}$  アリールジイル) - \* ;

- ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) - ( $C_6 \sim C_{20}$  アリール) - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $N(R^5)$  - \* ;

- ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) - ( $C_6 \sim C_{20}$  アリール) - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $N(R^5)$  - \* ;

30

- ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) - ( $C_2 \sim C_9$  ヘテロシクリルジイル) - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $N(R^5)$  - \* ;

- ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) - ( $C_1 \sim C_{20}$  ヘテロアリールジイル) ; -

- ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) - ( $C_1 \sim C_{20}$  ヘテロアリールジイル) - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) - \* ;

- ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) - ( $C_1 \sim C_{20}$  ヘテロアリールジイル) - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $N(R^5)$  - \* ;

- ( $C_3 \sim C_{12}$  カルボシクリルジイル) - \* ;

- ( $C_3 \sim C_{12}$  カルボシクリルジイル) - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $N(R^5)$  - \* ;

40

- ( $C_3 \sim C_{12}$  カルボシクリルジイル) - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $N(R^5)$  - \* ;

- ( $C_3 \sim C_{12}$  カルボシクリルジイル) -  $NR^5$  -  $C(=NR^5a)$  -  $N(R^5)$  - \* ;

- ( $C_6 \sim C_{20}$  アリールジイル) - \* ;

- ( $C_6 \sim C_{20}$  アリールジイル) -  $N(R^5)$  - \* ;

- ( $C_6 \sim C_{20}$  アリールジイル) - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) -  $N(R^5)$  - \* ;

- ( $C_6 \sim C_{20}$  アリールジイル) - ( $C_1 \sim C_{12}$  アルキルジイル) - ( $C_2 \sim C_{20}$  ヘ

50

テロシクリルジイル) - \* ;

- ( C<sub>6</sub> ~ C<sub>20</sub>アリアルジイル) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル) - N ( R<sup>5</sup> ) - C ( = N R<sup>5 a</sup> ) - N ( R<sup>5</sup> ) - \* ;

- ( C<sub>2</sub> ~ C<sub>20</sub>ヘテロシクリルジイル) - \* ;

- ( C<sub>2</sub> ~ C<sub>9</sub>ヘテロシクリルジイル) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル) - N ( R<sup>5</sup> ) - \* ;

- ( C<sub>2</sub> ~ C<sub>9</sub>ヘテロシクリルジイル) - N ( R<sup>5</sup> ) - C ( = N R<sup>5 a</sup> ) - N ( R<sup>5</sup> ) - \* ;

- ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>20</sub>ヘテロアリアルジイル) - \* ;

- ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>20</sub>ヘテロアリアルジイル) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル) - N ( R<sup>5</sup> ) - \* ; 及び

- ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>20</sub>ヘテロアリアルジイル) - N ( R<sup>5</sup> ) - C ( = N R<sup>5 a</sup> ) - N ( R<sup>5</sup> ) - \* からなる群から選択され、

アスタリスク\*は、リンカーLの結合部位を示し、

R<sup>5</sup>は、H、C<sub>6</sub> ~ C<sub>20</sub>アリアル及びC<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルからなる群から選択されるか、または2つのR<sup>5</sup>は一緒になって、5員もしくは6員のヘテロシクリル環を形成し

、  
R<sup>5 a</sup>は、C<sub>6</sub> ~ C<sub>20</sub>アリアル及びC<sub>1</sub> ~ C<sub>20</sub>ヘテロアリアルからなる群から選択され、

L - Qは、

Q - C ( = O ) - P E G - C ( = O ) - ;

Q - C ( = O ) - P E G - C ( = O ) - P E P - ;

Q - C ( = O ) - P E G - N ( R<sup>5</sup> ) - ;

Q - C ( = O ) - P E G - N ( R<sup>5</sup> ) - C ( = O ) - ;

Q - C ( = O ) - P E G - N R<sup>5</sup> - P E G - C ( = O ) - P E P - ;

Q - C ( = O ) - P E G - N<sup>+</sup> ( R<sup>5</sup> )<sub>2</sub> - P E G - C ( = O ) - P E P - ;

Q - C ( = O ) - P E G - N R<sup>5</sup> C H ( A A<sub>1</sub> ) C ( = O ) - P E G - C ( = O ) - P E P - ;

Q - C ( = O ) - P E G - O - ;

Q - C ( = O ) - P E G - S S - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル) - O C ( = O ) - ;

Q - C ( = O ) - P E G - S S - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル) - C ( = O ) - ;

Q - C ( = O ) - P E G - ;

Q - C ( = O ) - P E G - C ( = O ) N ( R<sup>5</sup> ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル) - N ( R<sup>5</sup> ) C ( = O ) - ( C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub>モノヘテロシクリルジイル) - ;

Q - C ( = O ) - P E G - C ( = O ) N ( R<sup>5</sup> ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル) - ;

Q - C ( = O ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル) - C ( = O ) - P E P - ;

Q - C ( = O ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル) - C ( = O ) - P E P - N ( R<sup>5</sup> ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル) - ;

Q - C ( = O ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル) - C ( = O ) - P E P - N ( R<sup>5</sup> ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル) - N ( R<sup>5</sup> ) - C ( = O ) ;

Q - C ( = O ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル) - C ( = O ) - P E P - N ( R<sup>5</sup> ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル) - N ( R<sup>5</sup> ) C ( = O ) - ( C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub>モノヘテロシクリルジイル) - ;

Q - C ( = O ) - C H<sub>2</sub> C H<sub>2</sub> O C H<sub>2</sub> C H<sub>2</sub> - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>20</sub>ヘテロアリアルジイル) - C H<sub>2</sub> O - P E G - C ( = O ) - ( M C g l u c ) - ;

Q - C ( = O ) - C H<sub>2</sub> C H<sub>2</sub> O C H<sub>2</sub> C H<sub>2</sub> - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>20</sub>ヘテロアリアルジイル) - C H<sub>2</sub> O - P E G - C ( = O ) - ( M C g l u c ) - N ( R<sup>5</sup> ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル) N ( R<sup>5</sup> ) C ( = O ) - ( C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub>モノヘテロシクリルジイル) - ;

Q - C ( = O ) - P E G - C ( = O ) N ( R<sup>5</sup> ) - ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル) - 50

;

Q - C(=O) - PEG - C(=O)N(R<sup>5</sup>) - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル)N(R<sup>5</sup>)C(=O) - (C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub>モノヘテロシクリルジイル) - ;

Q - C(=O) - PEG - C(=O) - PEP - N(R<sup>5</sup>) - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル) - ;

Q - C(=O) - PEG - C(=O) - PEP - N(R<sup>5</sup>) - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル)N(R<sup>5</sup>)C(=O) - (C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub>モノヘテロシクリルジイル) - ;

Q - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - C(=O) - PEP - N(R<sup>5</sup>) - ;

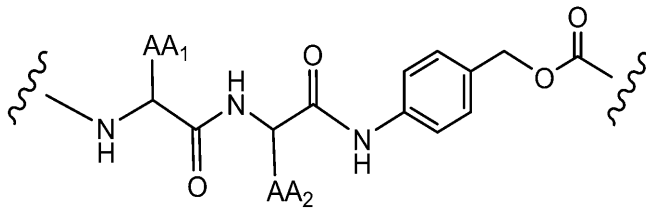
Q - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - C(=O) - PEP - N(R<sup>5</sup>) - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル) - ;

Q - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - C(=O) - PEP - N(R<sup>5</sup>) - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル)N(R<sup>5</sup>)C(=O) - ; 及び

Q - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - C(=O) - PEP - N(R<sup>5</sup>) - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>12</sub>アルキルジイル)N(R<sup>5</sup>)C(=O) - (C<sub>2</sub> ~ C<sub>5</sub>モノヘテロシクリルジイル) - からなる群から選択され、

PEGは、式： - (CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)<sub>n</sub> - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - を有し、mは1 ~ 5の整数であり、nは2 ~ 50の整数であり、

PEPは、式：



を有し、AA<sub>1</sub>及びAA<sub>2</sub>は、アミノ酸側鎖から独立して選択されるか、またはAA<sub>1</sub>もしくはAA<sub>2</sub>及び隣接する窒素原子は5員環プロリンアミノ酸を形成し、波線は結合点を示しており、

Qは、F、Cl、NO<sub>2</sub>及びSO<sub>3</sub><sup>-</sup>から独立して選択される1つ以上の基で置換された、N-ヒドロキシスクシンイミジル、N-ヒドロキシスルホスクシンイミジル、マレイミド、ならびにフェノキシからなる群から選択され、

アルキル、アルキルジイル、アルケニル、アルケニルジイル、アルキニル、アルキニルジイル、アリール、アリールジイル、カルボシクリル、カルボシクリルジイル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルジイル、ヘテロアリール及びヘテロアリールジイルは、任意選択で、F、Cl、Br、I、-CN、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-CH=CH<sub>2</sub>、-CCH<sub>3</sub>、-C(CCH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>OH、-CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH、-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>OH、-CH(OH)CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>OP(O)(OH)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>F、-CHF<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>、-CH(CH<sub>3</sub>)CN、-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CN、-CH<sub>2</sub>CN、-CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>NHSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>NHCH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>H、-COCH<sub>3</sub>、-CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-CO<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、-COCH(OH)CH<sub>3</sub>、-CONH<sub>2</sub>、-CONHCH<sub>3</sub>、-CON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-NHCH<sub>3</sub>、-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-NHCOCH<sub>3</sub>、-N(CH<sub>3</sub>)COCH<sub>3</sub>、-NHS(O)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-N(CH<sub>3</sub>)C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>、-N(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>S(O)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-NO<sub>2</sub>、=O、-OH、-OCH<sub>3</sub>、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>、-OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OH、-OCH<sub>2</sub>CH

10

20

30

40

50

$2\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n-(\text{CH}_2)_m\text{CO}_2\text{H}$ 、 $-\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{H}$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OH})_2$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{SCH}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_3$ 、及び $-\text{S}(\text{O})_3\text{H}$ から独立して選択される1つ以上の基で置換される、

を有する、2-アミノ-4-カルボキサミド-ベンゾアゼピンリンカー化合物。

【請求項31】

$R^1$ が任意選択で置換された $C_1\sim C_{20}$ ヘテロアリアルである、請求項30に記載の2-アミノ-4-カルボキサミド-ベンゾアゼピンリンカー化合物。

【請求項32】

$R^1$ がピリミジニルまたはピリジニルである、請求項31に記載の2-アミノ-4-カルボキサミド-ベンゾアゼピンリンカー化合物。 10

【請求項33】

$X^2$ 及び $X^3$ がそれぞれ結合であり、 $R^2$ 及び $R^3$ が、 $C_1\sim C_8$ アルキル、 $-\text{O}-(C_1\sim C_{12}$ アルキル)、 $-(C_1\sim C_{12}$ アルキルジイル)- $\text{OR}^5$ 、 $-(C_1\sim C_8$ アルキルジイル)- $\text{N}(R^5)\text{CO}_2R^5$ 、 $-(C_1\sim C_{12}$ アルキル)- $\text{OC}(\text{O})\text{N}(R^5)_2$ 、 $-\text{O}-(C_1\sim C_{12}$ アルキル)- $\text{N}(R^5)\text{CO}_2R^5$ 、及び $-\text{O}-(C_1\sim C_{12}$ アルキル)- $\text{OC}(\text{O})\text{N}(R^5)_2$ から独立して選択される、請求項30に記載の2-アミノ-4-カルボキサミド-ベンゾアゼピンリンカー化合物。

【請求項34】

$X^2$ が結合であり、 $R^2$ が $C_1\sim C_{12}$ アルキルである、請求項30に記載の2-アミノ-4-カルボキサミド-ベンゾアゼピンリンカー化合物。 20

【請求項35】

$X^3$ が $\text{O}$ であり、 $R^3$ が、 $-(C_1\sim C_{12}$ アルキルジイル)- $\text{N}(R^5)-*$ である、請求項30に記載の2-アミノ-4-カルボキサミド-ベンゾアゼピンリンカー化合物。

【請求項36】

$R^3$ が、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}-$ である、請求項35に記載の2-アミノ-4-カルボキサミド-ベンゾアゼピンリンカー化合物。

【請求項37】

$L$ が、 $-\text{C}(=\text{O})-\text{PEG}-\text{C}(=\text{O})-$ である、請求項30に記載の2-アミノ-4-カルボキサミド-ベンゾアゼピンリンカー化合物。 30

【請求項38】

$Y^1$ が $\text{CR}^1$ であり、 $Y^2$ が $\text{CH}$ である、請求項30に記載の2-アミノ-4-カルボキサミド-ベンゾアゼピンリンカー化合物。

【請求項39】

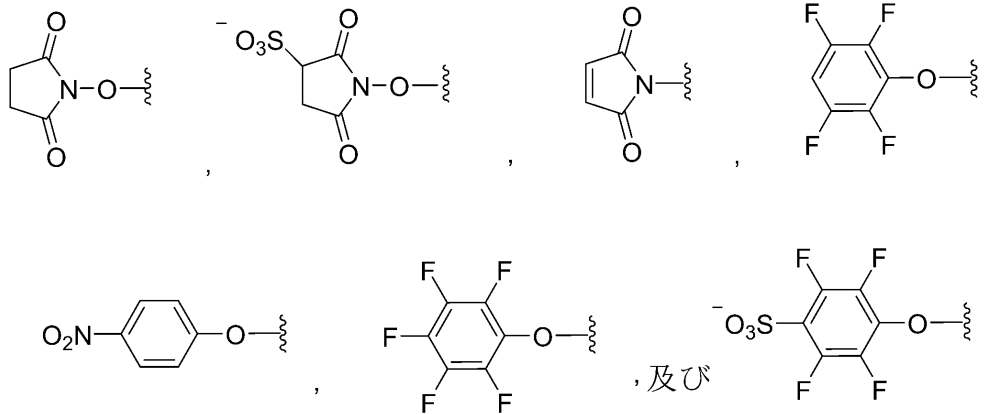
$Y^1$ が $\text{N}$ であり、 $Y^2$ が $\text{CH}$ である、請求項30に記載の2-アミノ-4-カルボキサミド-ベンゾアゼピンリンカー化合物。

【請求項40】

$Y^1$ が $\text{N}$ であり、 $Y^2$ が $\text{N}$ である、請求項30に記載の2-アミノ-4-カルボキサミド-ベンゾアゼピンリンカー化合物。 40

【請求項41】

$Q$ が、



10

から選択される、請求項 30 に記載の 2 - アミノ - 4 - カルボキサミド - ベンゾアゼピンリンカー化合物。

【請求項 4 2】

Q が 2, 3, 5, 6 - テトラフルオロフェノキシまたは 2, 3, 5, 6 - テトラフルオロ, 4 - スルホネート - フェノキシである、請求項 4 1 に記載の 2 - アミノ - 4 - カルボキサミド - ベンゾアゼピンリンカー化合物。

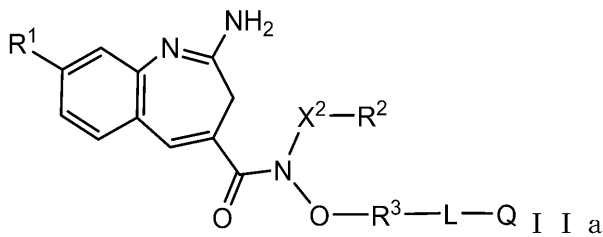
20

【請求項 4 3】

Q がマレイミドである、請求項 4 1 に記載の 2 - アミノ - 4 - カルボキサミド - ベンゾアゼピンリンカー化合物。

【請求項 4 4】

式 I I a :



30

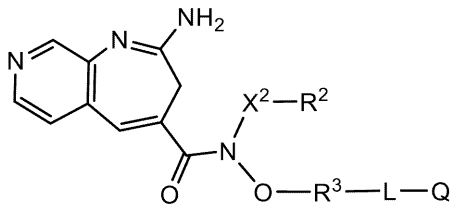
を有する、請求項 30 に記載の 2 - アミノ - 4 - カルボキサミド - ベンゾアゼピンリンカー化合物。

【請求項 4 5】

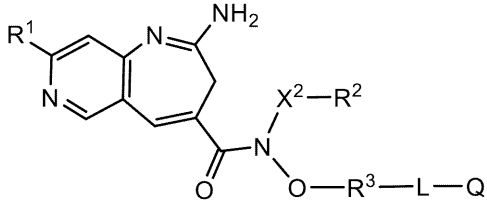
式 I I b ~ d :

40

50

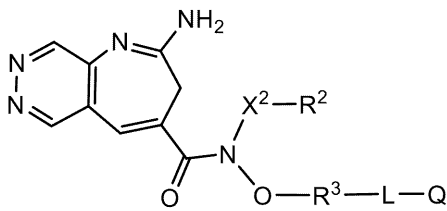


I I b;



10

I I c; 及び

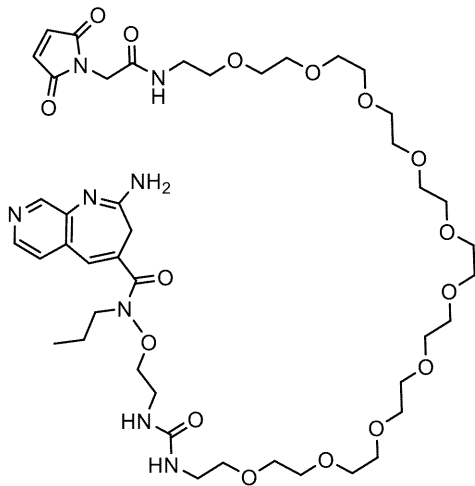


I I d

20

から選択される、請求項 30 に記載の 2 - アミノ - 4 - カルボキサミド - ベンゾアゼピンリンカー化合物。

【請求項 46】



30

40

である、2 - アミノ - 4 - カルボキサミド - ベンゾアゼピンリンカー化合物。

50