

【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27年5月21日(2015.5.21)

【公表番号】特表2014-517842(P2014-517842A)

【公表日】平成26年7月24日(2014.7.24)

【年通号数】公開・登録公報2014-039

【出願番号】特願2014-512101(P2014-512101)

【国際特許分類】

A 6 1 K 39/395 (2006.01)

C 0 7 K 5/09 (2006.01)

C 0 7 K 19/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 39/395 L

C 0 7 K 5/09 Z N A

C 0 7 K 19/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 37/02

【手続補正書】

【提出日】平成27年3月31日(2015.3.31)

【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

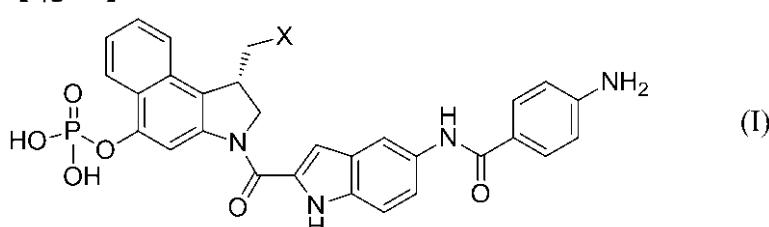
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



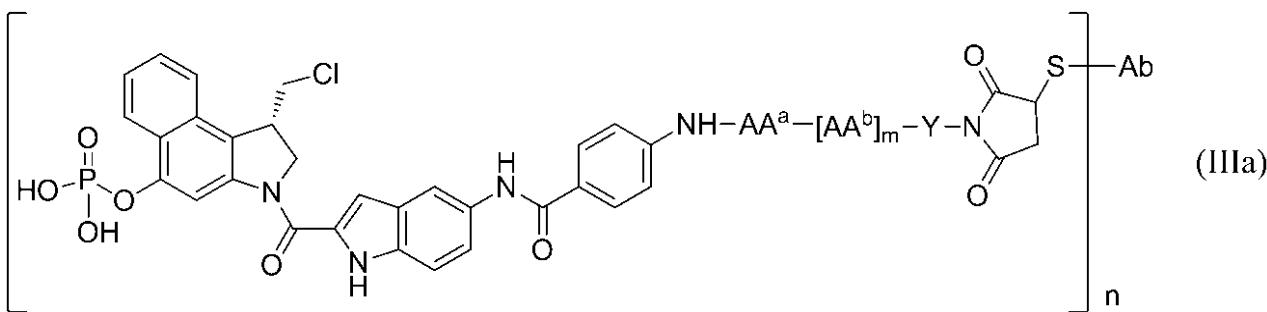
[式中：Xは、求核置換可能な脱離基である]

で示される化合物またはその医薬的に許容される塩が、ペプチジルリンカーを介してその-NH₂基で抗体または該抗体の抗原結合フラグメントと結合している、免疫コンジュゲート。

【請求項2】

式(I I I a)：

【化2】



[式中：

AA^a および各 AA^b は、独立して、アラニン、D-アラニン、D-アミノ酪酸、アルギニン、アスパラギン、アスパラギン酸、D-カルボキシグルタミン酸、シトルリン、システイン、グルタミン酸、グルタミン、グリシン、ヒスチジン、イソロイシン、ロイシン、リジン、メチオニン、ノルロイシン、ノルバリン、オルニチン、フェニルアラニン、プロリン、セリン、スレオニン、トリプトファン、チロシンおよびバリンからなる群より選択され；

m は、0、1、2、3、4 または 5 であり；

Y は、スペーサー部分であり；

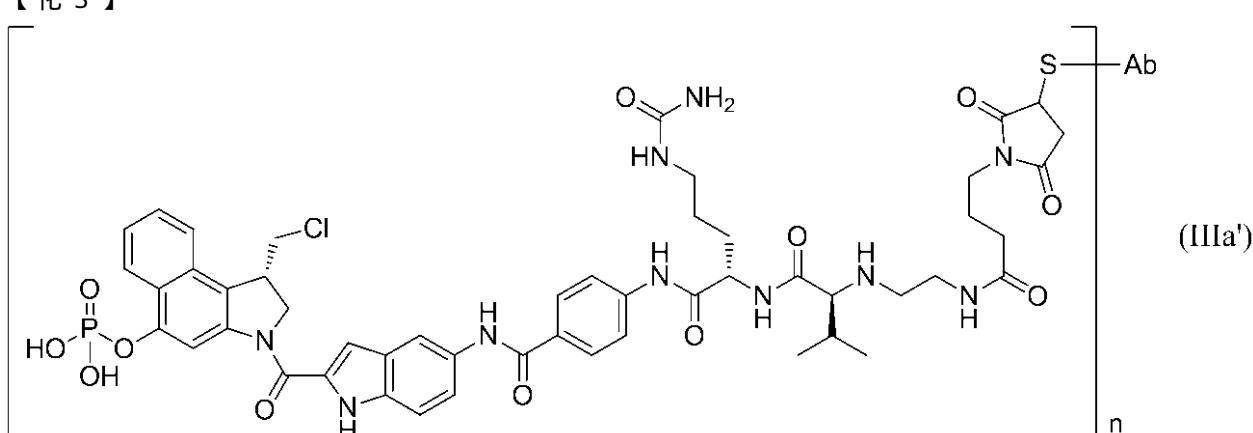
n は、1、2、3、4 または 5 であり；および

Ab は、抗体またはその抗原結合フラグメントを示す]
で示される構造またはその医薬的に許容される塩を有する、請求項1記載の免疫コンジュゲート。

【請求項3】

式(IIIa')：

【化3】



[式中：

n は、1、2、3、4 または 5 であり；および

Ab は、抗体またはその抗原結合フラグメントを示す]
で示される構造またはその医薬的に許容される塩を有する、請求項1記載の免疫コンジュゲート。

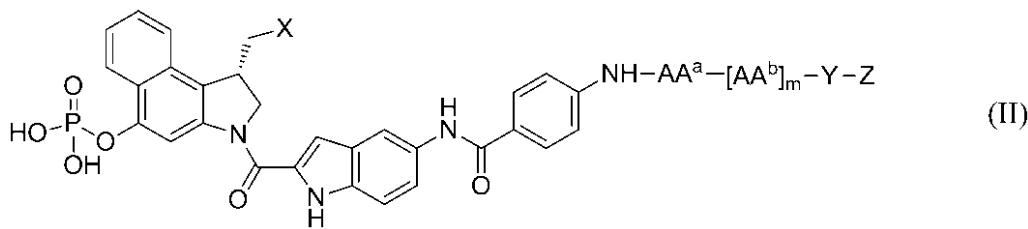
【請求項4】

該抗体が、CD70、メソテリン、PSMA、CD19、グリピカン-3、B7H4、RG-1、CD22 および PTK7 からなる群より選択されるヒト抗原を認識する、ヒトモノクローナル抗体である、請求項3記載の免疫コンジュゲート。

【請求項5】

式(II)：

【化4】



[式中：

Xは、求核置換可能な脱離基であり；

AA^aおよび各AA^bは、独立して、アラニン、-アラニン、-アミノ酪酸、アルギニン、アスパラギン、アスパラギン酸、-カルボキシグルタミン酸、シトルリン、システイン、グルタミン酸、グルタミン、グリシン、ヒスチジン、イソロイシン、ロイシン、リジン、メチオニン、ノルロイシン、ノルバリン、オルニチン、フェニルアラニン、プロリン、セリン、スレオニン、トリプトファン、チロシンおよびバリンからなる群より選択され；

mは、0、1、2、3、4または5であり；

Yは、スペーサー部分であり；および

Zは、抗体と結合しうる反応性官能基である】

で示される構造を有する化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項6】

AA^aが、シトルリン、リジン、アスパラギン酸、グルタミン酸、セリン、イソロイシン、ロイシンおよびスレオニンからなる群より選択され、mが、0、1または2である、請求項5記載の化合物。

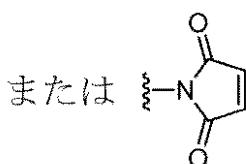
【請求項7】

-AA^a-[AA^b]_m-が、Val-Cit、Phe-Cit、Phe-Lys、Val-Lys、Val-Glu、Val-Asp、Val-SerおよびVal-Glyからなる群より選択されるジペプチドであり、各ジペプチドがN-から-C方向に示されている、請求項5記載の化合物。

【請求項8】

-Zが、-ONH₂、-SH、-N₃、

【化5】

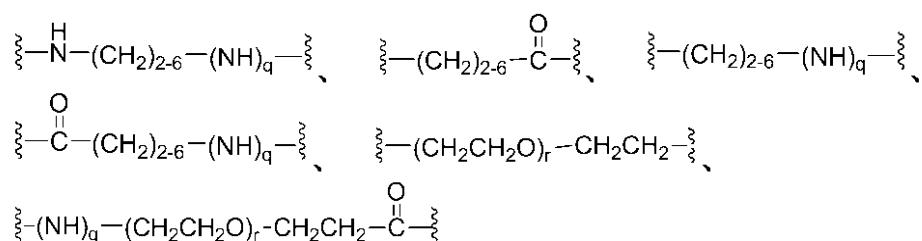


である、請求項5記載の化合物。

【請求項9】

Yが、

【化6】



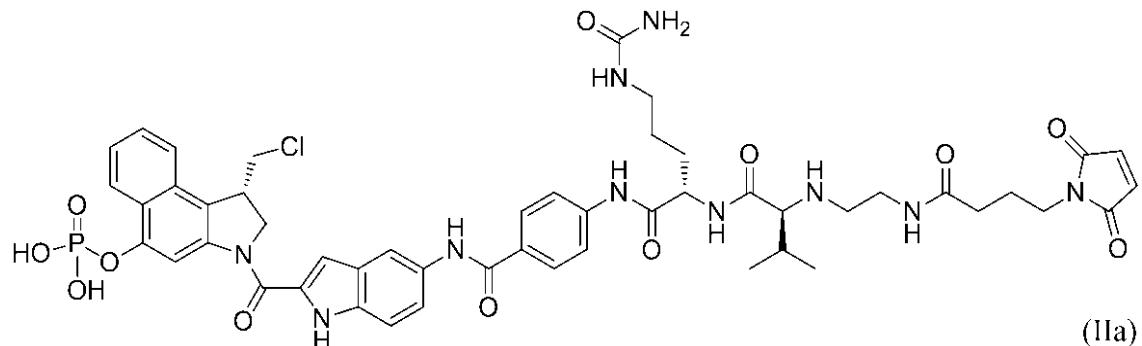
[式中：下付文字qは、それらの各場合について独立して、0または1であり、下付文字rは、それらの各場合について独立して、1～24である]

およびそれらの組合せからなる群より選択される、請求項 5 記載の化合物。

【請求項 10】

式 (II a) :

【化 7】

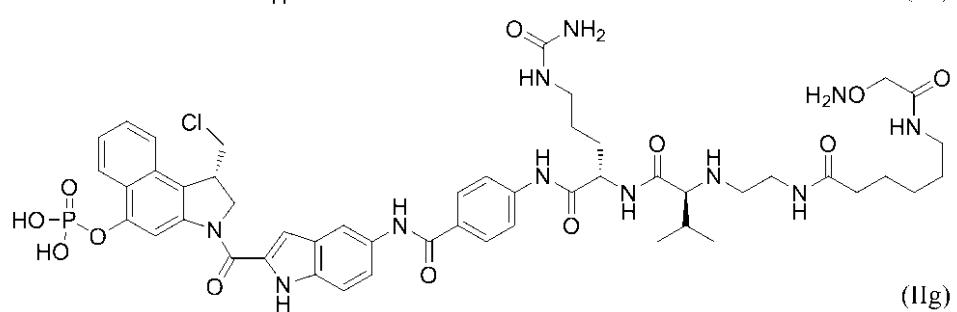
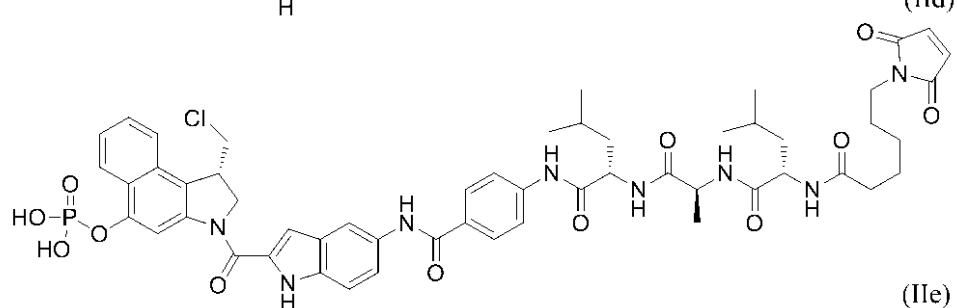
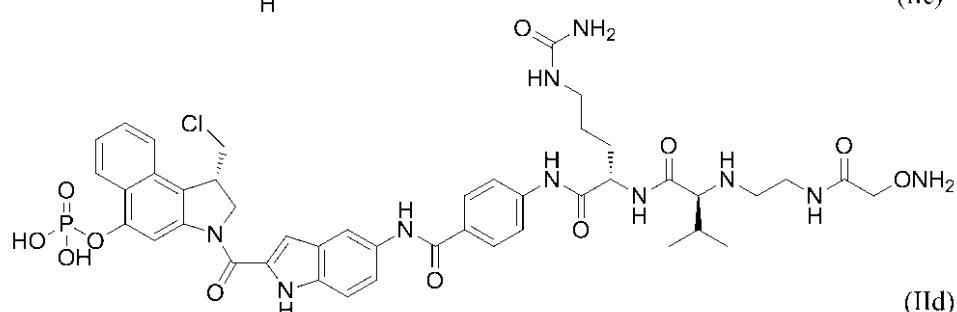
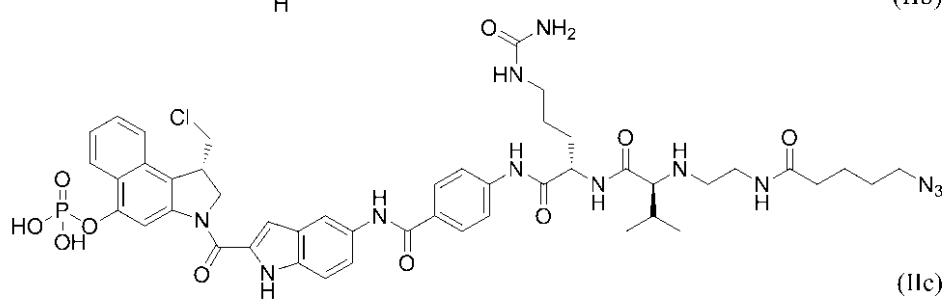
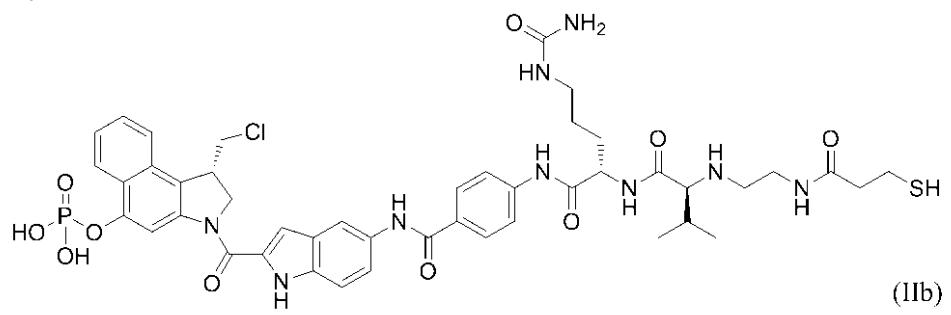


で示される構造を有する、請求項 5 記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 11】

式 (II b) - (II g) :

【化 8】

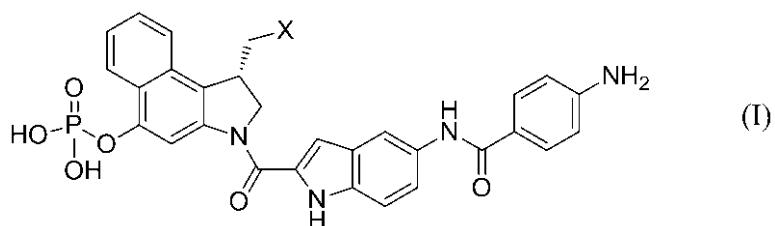


からなる群より選択される構造を有する、請求項 5 記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 1 2】

式 (I) :

【化9】



[式中：Xは、求核置換可能な脱離基である]

で示される化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項13】

癌を治療するための、請求項3記載の構造を有する免疫コンジュゲートを含む医薬組成物。

【請求項14】

癌が、腎臓癌、膵臓癌、卵巣癌、リンパ腫、大腸癌、中皮腫、胃癌、肺癌、前立腺癌、腺癌、肝臓癌、または乳癌である、請求項13記載の医薬組成物。

【請求項15】

癌が、ヒトCD70、メソテリン、PSMA、CD19、グリピカン-3、B7H4、RG-1、CD22、またはPTK7を発現する癌細胞によって特徴付けられる、請求項13記載の医薬組成物。