

【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

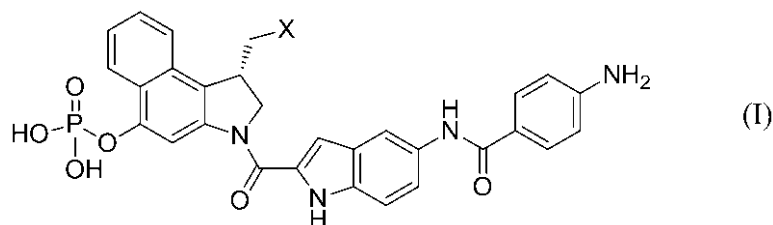
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



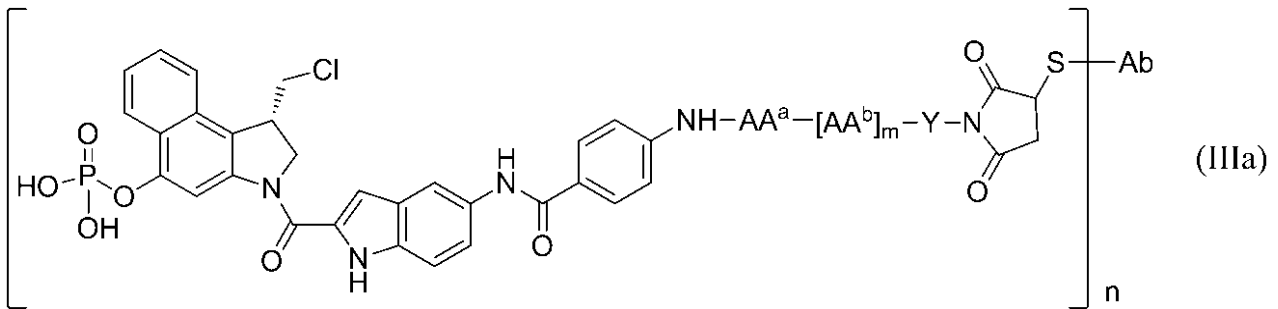
[式中：X は、求核置換可能な脱離基である]

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、 α -アラニン、 α -アミノ酪酸、アルギニン、アスパラギン、アスパラギン酸、 γ -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

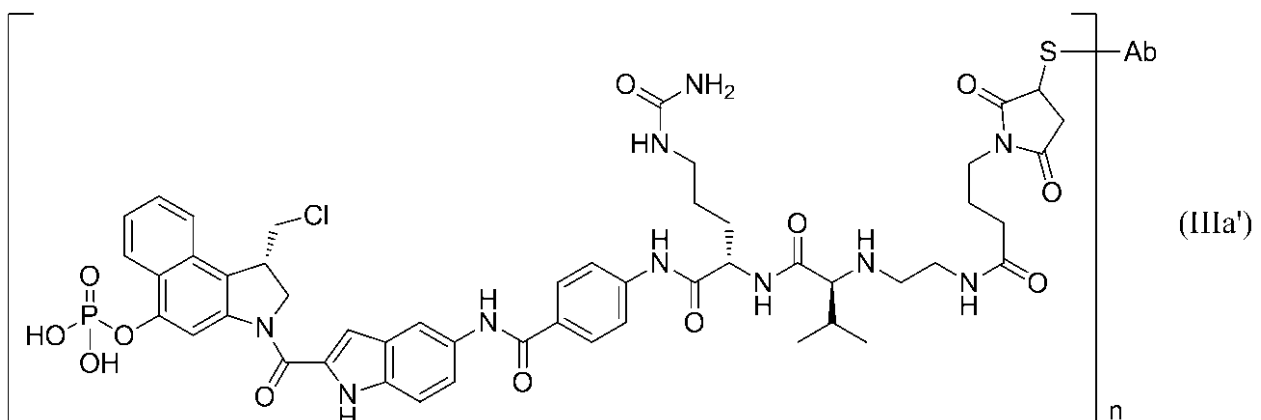
Ab は、抗体またはその抗原結合フラグメントを示す]

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。

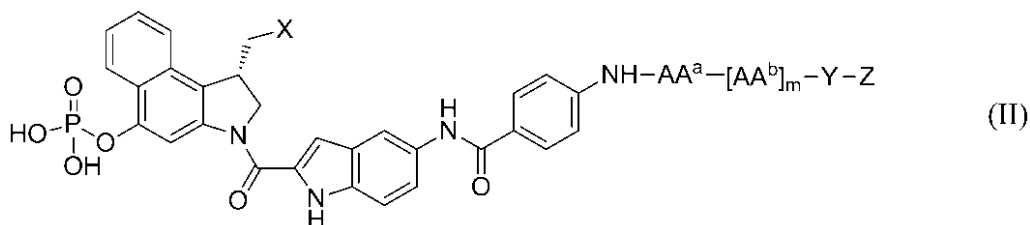
【請求項 4】

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、 α -アラニン、 β -アミノ酪酸、アルギニン、アスパラギン、アスパラギン酸、 γ -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。

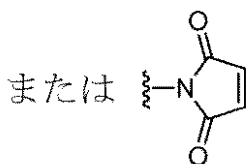
【請求項 7】

- 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】

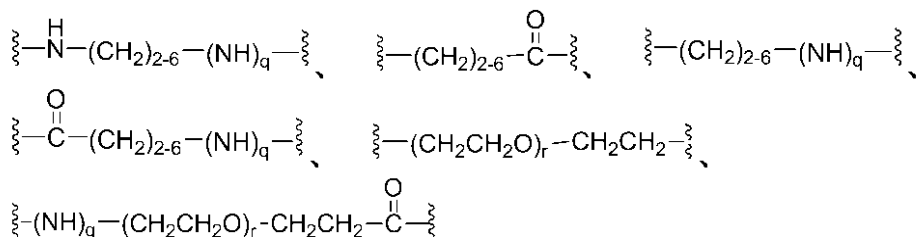


である、請求項 5 記載の化合物。

【請求項 9】

Y が、

【化 6】



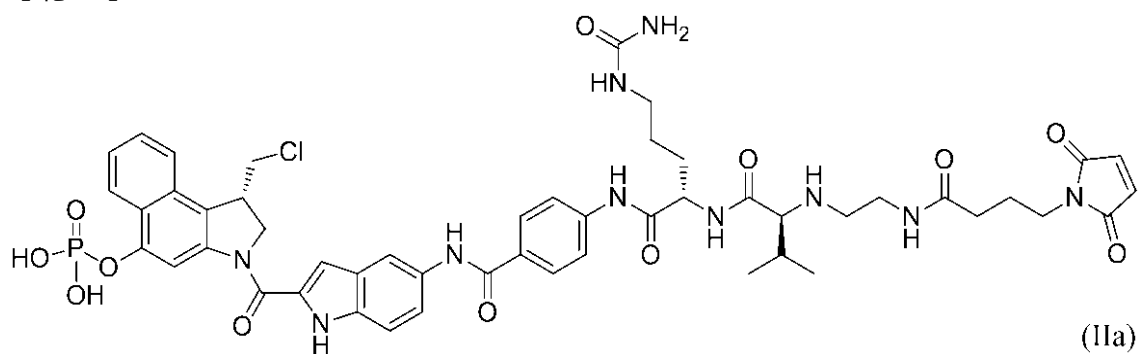
[式中：下付文字 q は、それらの各場合について独立して、0 または 1 であり、下付文字 r は、それらの各場合について独立して、1 ~ 24 である]

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 (IIa) :

【化 7】

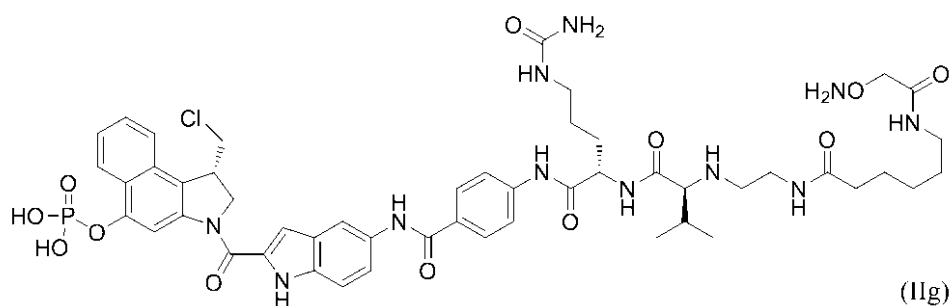
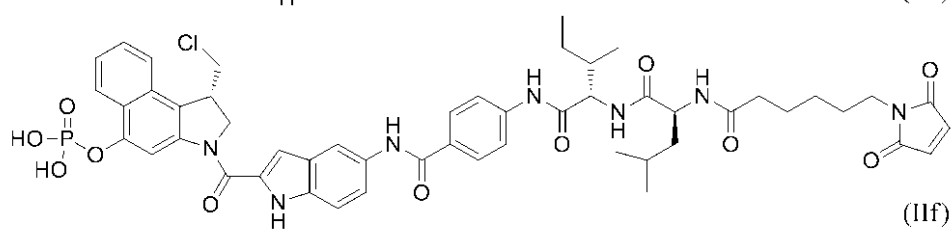
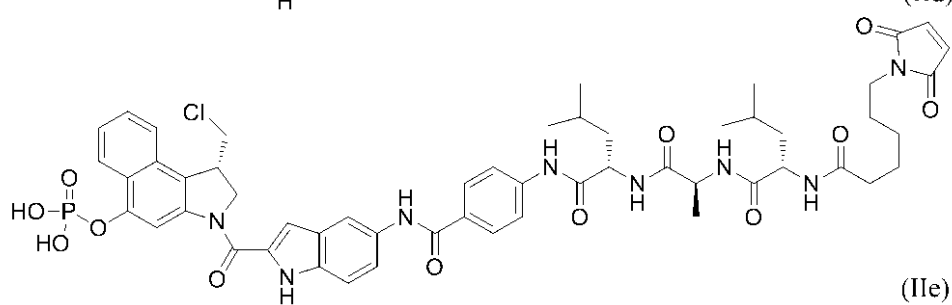
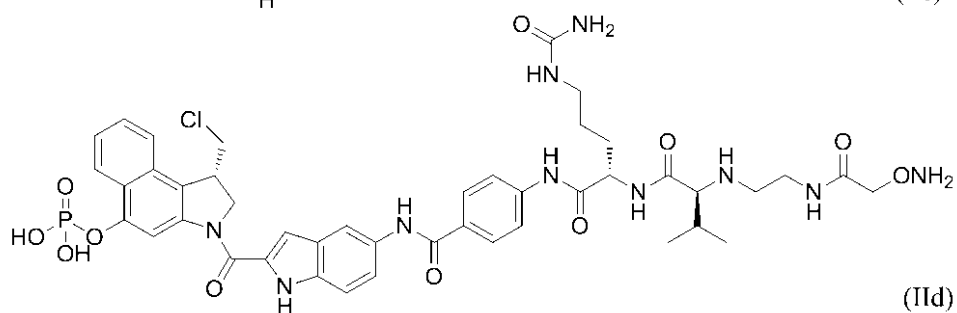
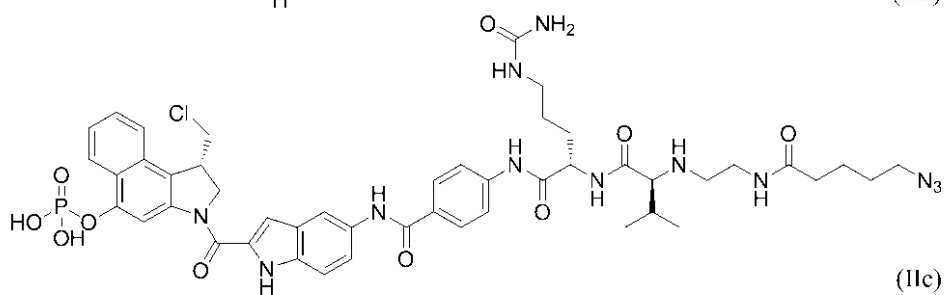
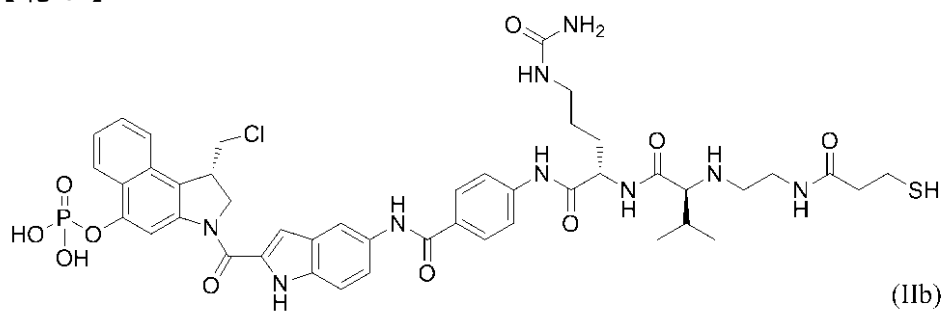


で示される構造を有する、請求項 5 記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 11】

式 (IIb) - (IIg) :

【化 8】



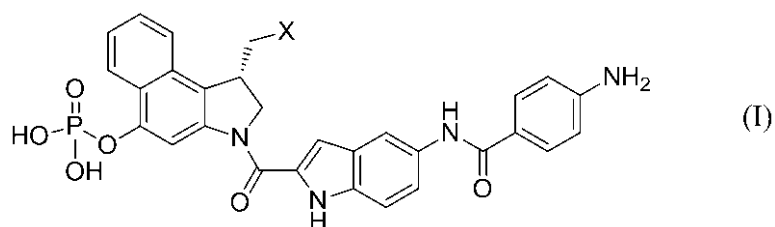
および

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 1 3】

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 1 4】

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 1 3 記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

癌が、ヒト CD 70、メソテリン、PSMA、CD 19、グリピカン - 3、B7H4、RG - 1、CD 22、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 1 3 記載の医薬組成物。