

【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6月24日(2024.6.24)

【公開番号】特開2024-45327(P2024-45327A)

【公開日】令和6年4月2日(2024.4.2)

【年通号数】公開公報(特許)2024-060

【出願番号】特願2024-9895(P2024-9895)

【国際特許分類】

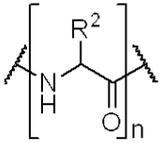
- C 0 7 K 5/06(2006.01) 10
- A 6 1 P 43/00(2006.01)
- A 6 1 K 38/05(2006.01)
- A 6 1 K 38/06(2006.01)
- A 6 1 K 38/07(2006.01)
- A 6 1 K 38/08(2019.01)
- A 6 1 K 39/395(2006.01)
- A 6 1 K 47/68(2017.01)
- A 6 1 K 47/64(2017.01)
- A 6 1 K 31/4748(2006.01)
- A 6 1 P 35/00(2006.01) 20
- A 6 1 K 31/52(2006.01)
- A 6 1 K 39/39(2006.01)
- C 0 7 K 5/065(2006.01)
- C 0 7 K 5/062(2006.01)
- C 0 7 K 5/093(2006.01)
- C 0 7 K 5/087(2006.01)
- C 0 7 K 5/083(2006.01)
- C 1 2 N 15/11(2006.01)
- C 0 7 D 491/08(2006.01)
- C 0 7 D 473/34(2006.01) 30

【F I】

- C 0 7 K 5/06
- A 6 1 P 43/00 1 1 1
- A 6 1 K 38/05 Z N A
- A 6 1 K 38/06
- A 6 1 K 38/07
- A 6 1 K 38/08
- A 6 1 K 39/395 N
- A 6 1 K 47/68
- A 6 1 K 47/64 40
- A 6 1 K 31/4748
- A 6 1 P 35/00
- A 6 1 K 31/52
- A 6 1 K 39/39
- C 0 7 K 5/065
- C 0 7 K 5/062
- C 0 7 K 5/093
- C 0 7 K 5/087
- C 0 7 K 5/083
- C 1 2 N 15/11 Z 50



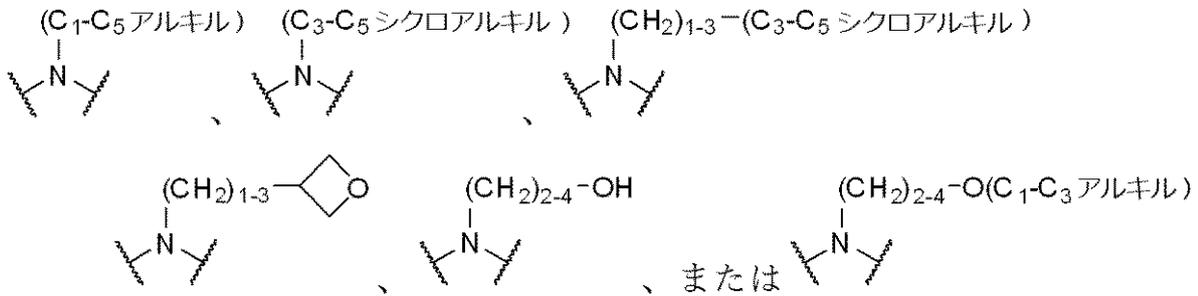
## 【化4】



は、カテプシンBで切断可能であり；

$\text{R}^3$  は、O、NH、

## 【化5】

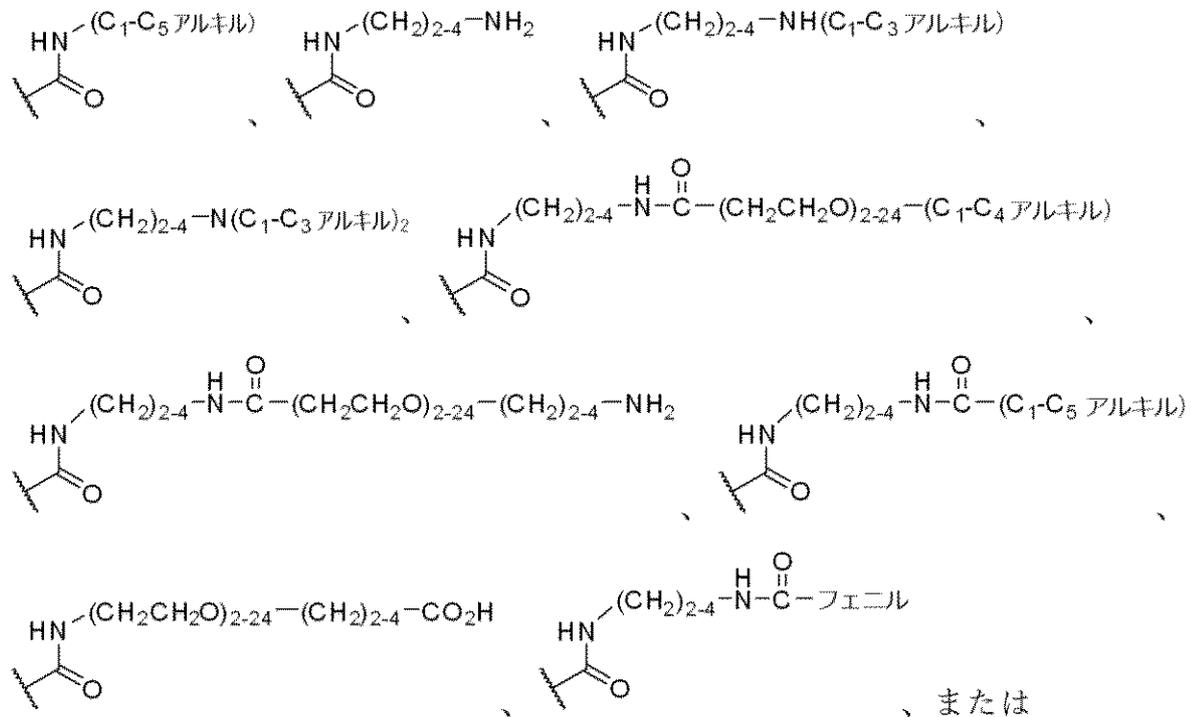


10

であり；

$\text{R}^4$  は、

## 【化6】

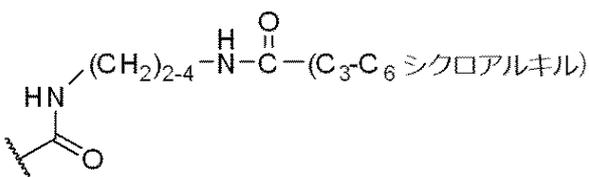


20

30

40

## 【化7】



であり；

50

フェニルまたはC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル基は、F、Cl、CN、NO<sub>2</sub>、またはC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルで適宜置換され；

Lは、式L-R<sup>3</sup>Hの生物活性分子の残渣であり；および

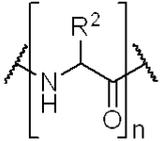
Xは、スペーサー基である]

で示される化合物を含む、医薬組成物。

【請求項2】

式

【化8】



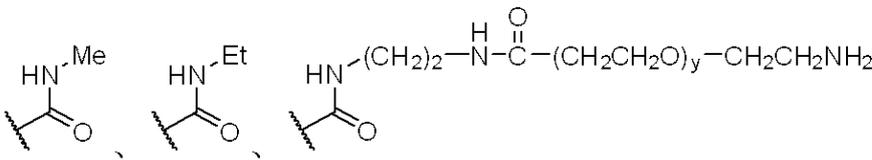
10

が、Val-Cit、Glu-Val-Cit、Phe-Lys、Phe-Arg、Val-Lys、Ala-Lys、Phe-Phe-Lys、Gly-Phe-Lys、Val-Ala、Ala-Val-Cit、またはVal-Glyである、請求項1に記載の医薬組成物。

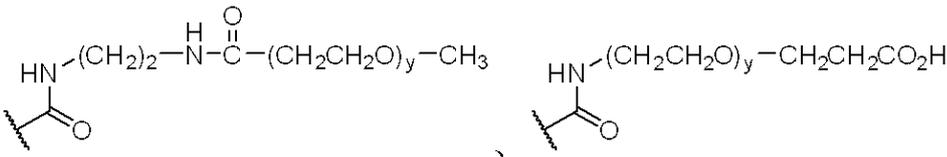
【請求項3】

R<sup>4</sup>が、

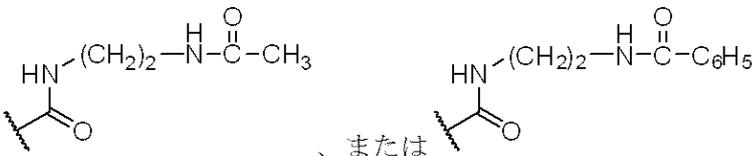
【化9】



20



30



であり；

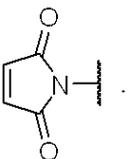
yが、4、8、12、または24である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項4】

40

R<sup>1</sup>が、NH<sub>2</sub>または

【化10】



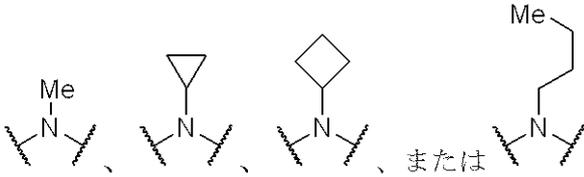
である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項5】

R<sup>3</sup>が、NH、

50

## 【化 1 1】



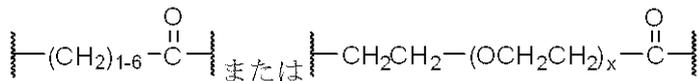
である、請求項 1 に記載の 医薬組成物。

## 【請求項 6】

10

X が、

## 【化 1 2】



であり；

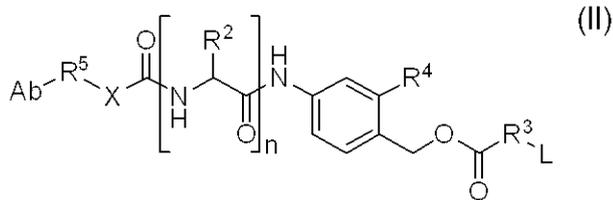
x が、2 ~ 24 の整数である、請求項 1 に記載の 医薬組成物。

## 【請求項 7】

抗がん治療に用いるための、式 (II)

20

## 【化 1 3】



[ 式中、

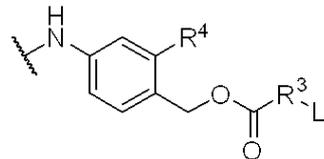
Ab は、抗体であり；

30

各 R<sup>2</sup> は、アラニン、アルギニン、アスパラギン、アスパラギン酸、 $\alpha$ -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、リシン、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、セリン、トレオニン、トリプトファン、チロシン、およびバリンからなる群からそれぞれ独立して選択されるアミノ酸残基の側鎖であり；

n は、2、3、4、または 5 であり；

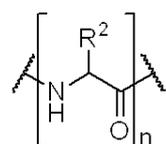
## 【化 1 4】



40

に結合するポリペプチドを有する

## 【化 1 5】

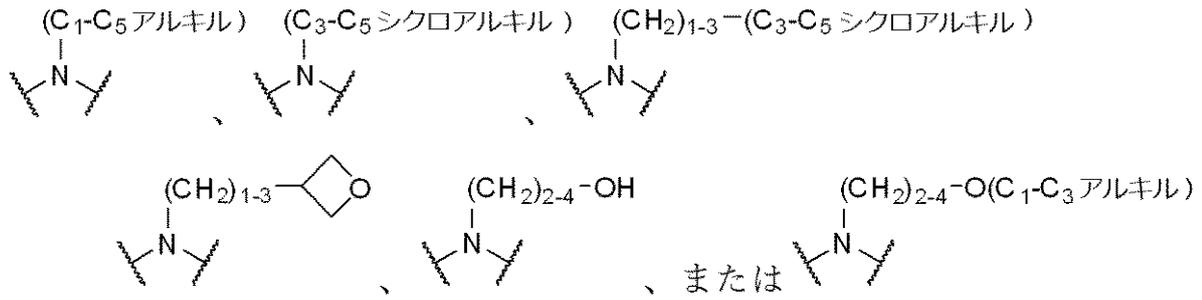


は、カテプシン B で切断可能であり；

50

R<sup>3</sup>は、O、NH、

【化16】

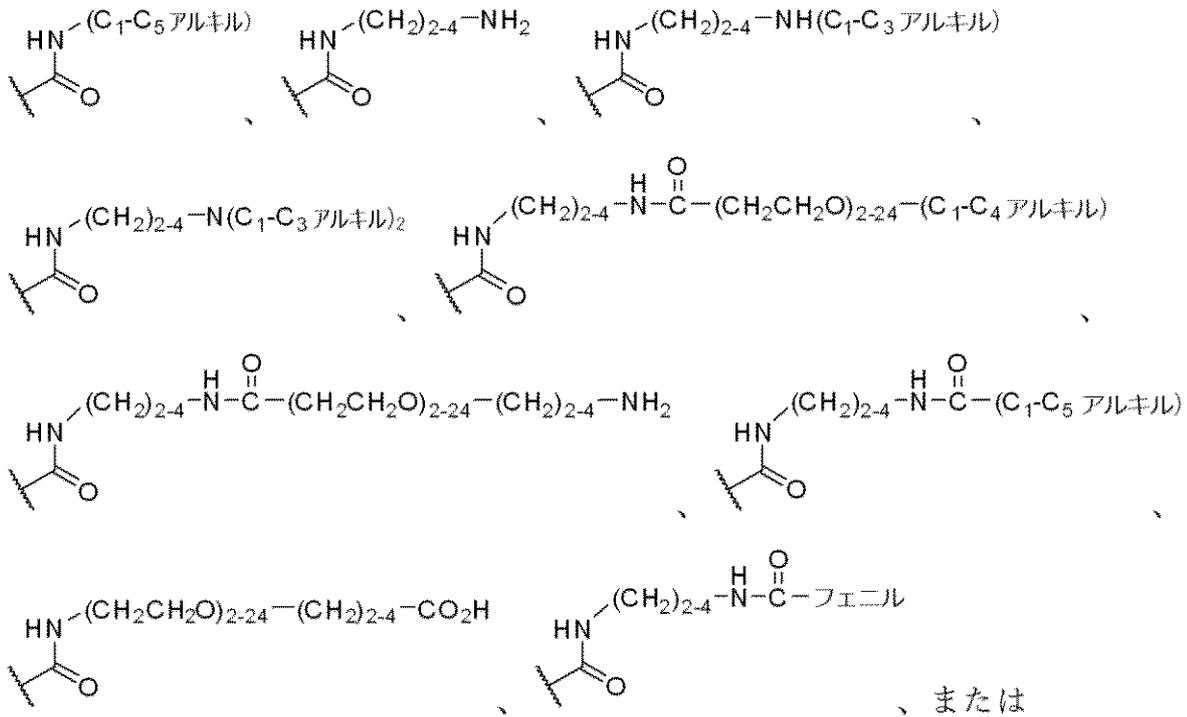


10

であり；

R<sup>4</sup>は、

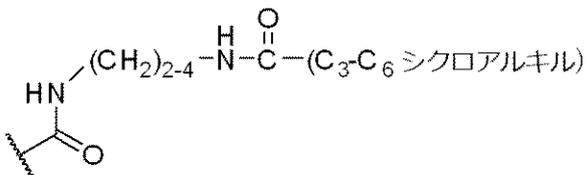
【化17】



20

30

【化18】



40

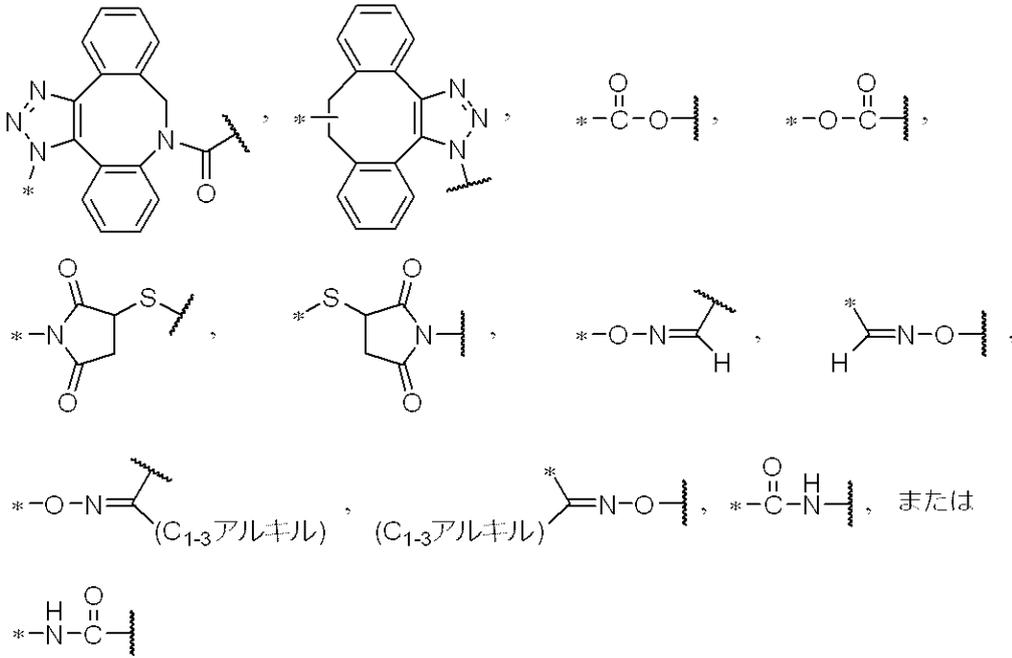
であり；

フェニルまたはC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル基が、F、Cl、CN、NO<sub>2</sub>、またはC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルで適宜置換され；

R<sup>5</sup>は、

50

## 【化19】



10

20

であり、式中、Abに結合する価電子の位置はアスタリスクで表され、Xに結合する価電子の位置は波線で表され；

Lは、式L-R<sup>3</sup>Hの生物活性分子の残渣であり；および

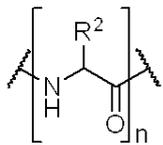
Xは、スペーサー基である]

で示される複合体を含む、医薬組成物。

## 【請求項8】

式

## 【化20】



30

が、Val-Cit、Glu-Val-Cit、Phe-Lys、Phe-Arg、Val-Lys、Ala-Lys、Phe-Phe-Lys、Gly-Phe-Lys、Val-Ala、Ala-Val-Cit、またはVal-Glyである、請求項7に記載の医薬組成物。

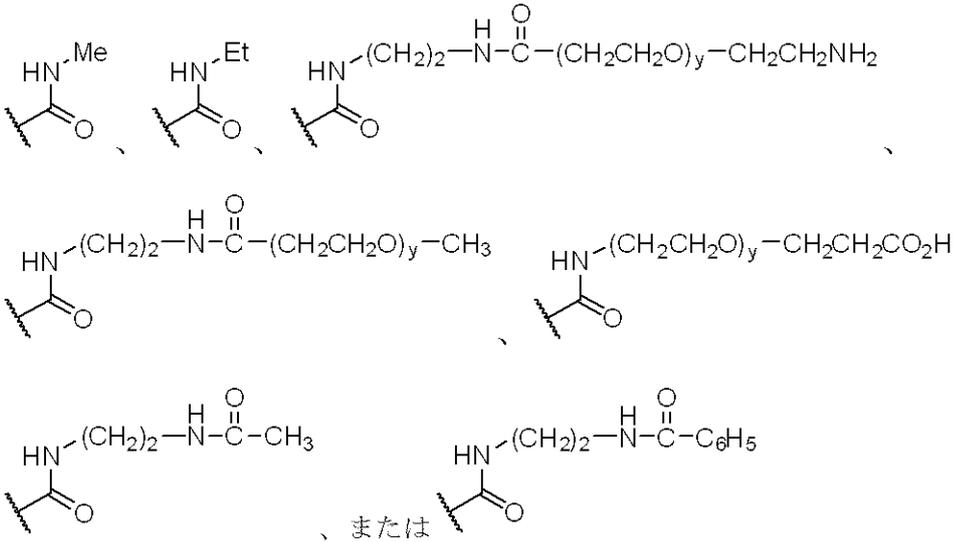
## 【請求項9】

R<sup>4</sup>が、

40

50

【化 2 1】



10

であり；

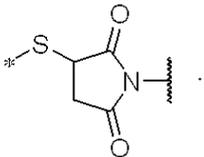
y が、4、8、12、または24である、請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

20

R<sup>5</sup> が、

【化 2 2】



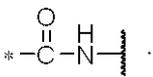
である、請求項7に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

30

R<sup>5</sup> が、

【化 2 3】

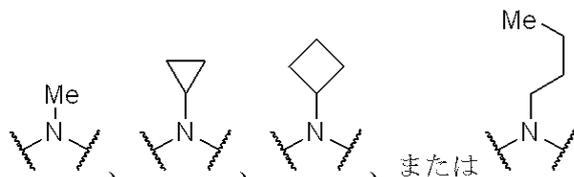


である、請求項9に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

R<sup>3</sup> が、NH、

【化 2 4】



40

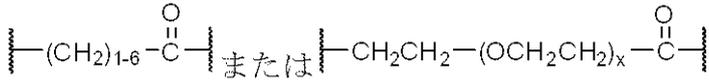
である、請求項7に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

X が、

50

【化 2 5】



であり；

x が、2 ~ 24 の整数である、請求項 7 に記載の 医薬組成物。

【請求項 1 4】

R<sup>3</sup> が、NH、

【化 2 6】

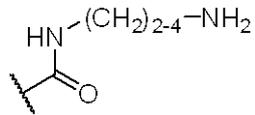


10

であり；

R<sup>4</sup> が、

【化 2 7】



20

である、請求項 4 に記載の 医薬組成物。

【請求項 1 5】

R<sup>3</sup> が、NH、

【化 2 8】

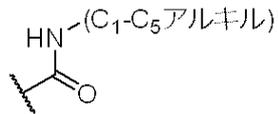


30

であり；

R<sup>4</sup> が、

【化 2 9】

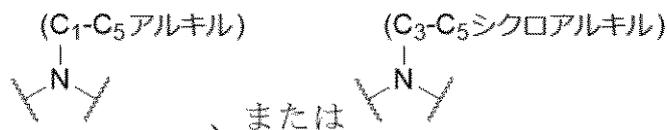


である、請求項 4 に記載の 医薬組成物。

【請求項 1 6】

R<sup>3</sup> が、NH、

【化 3 0】



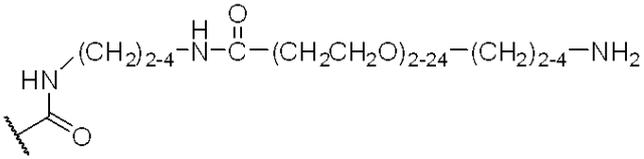
40

であり；

R<sup>4</sup> が、

50

【化 3 1】



である、請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

R<sup>3</sup> が、NH、

【化 3 2】

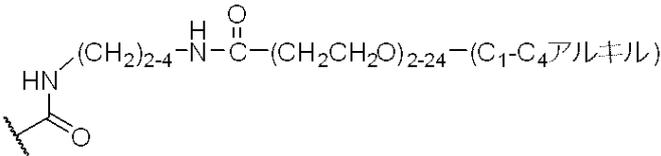


10

であり ;

R<sup>4</sup> が、

【化 3 3】



20

である、請求項 4 に記載の医薬組成物。

30

40

50