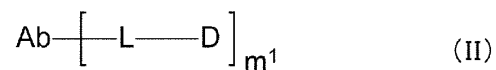


請求の範囲

[請求項1] 次式 (I) :

[化1]



(式中、 m^1 は1から10の範囲であり、

A bは、抗体又は該抗体の機能性断片を示し、該抗体の糖鎖はリモデリングされていてもよく、

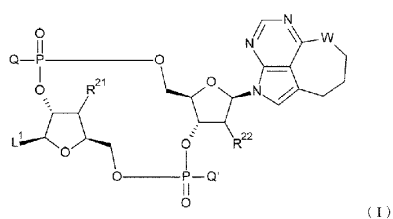
(ここで、抗体は、抗CD70抗体、抗TROP2抗体、及び抗EGFR抗体からなる群から選択されるいずれかの抗体を示す)

Lは、A bとDを連結するリンカーを示し、

A bはそのアミノ酸残基から直接Lに結合するか、A bの糖鎖又はリモデリングされた糖鎖からLに結合していてもよく、

Dは、次式 (I) :

[化2]

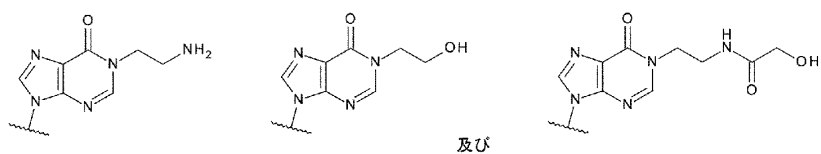


(ここで、

Lは、L¹に含まれる任意の-NH₂又はヒドロキシ基と結合し、

L¹は、以下の3式 :

[化3]



(ここで、波線は置換位置を示す)

のいずれかの基を示し、

Q及びQ'は、それぞれ独立して、ヒドロキシ基又はチオール基を示し、

R²¹及びR²²は、それぞれ独立して、ヒドロキシ基又はフッ素原子を示し、

Wは、-NH-又は硫黄原子を示す)

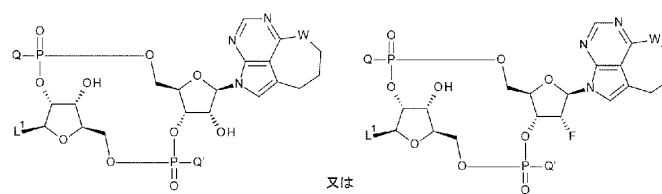
で表される化合物を示す)

で表される抗体薬物コンジュゲート。

[請求項2]

Dが、以下の2式：

[化4]



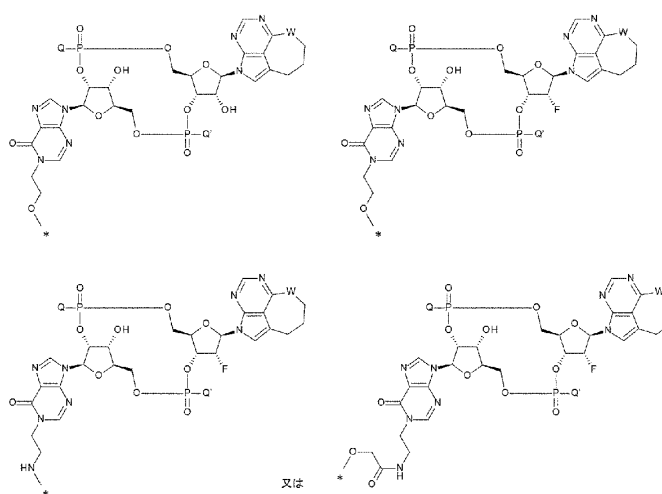
(ここで、L¹、Q、Q'及びWは、前に定義したとおりである)

のいずれかで示される、請求項1に記載の抗体薬物コンジュゲート。

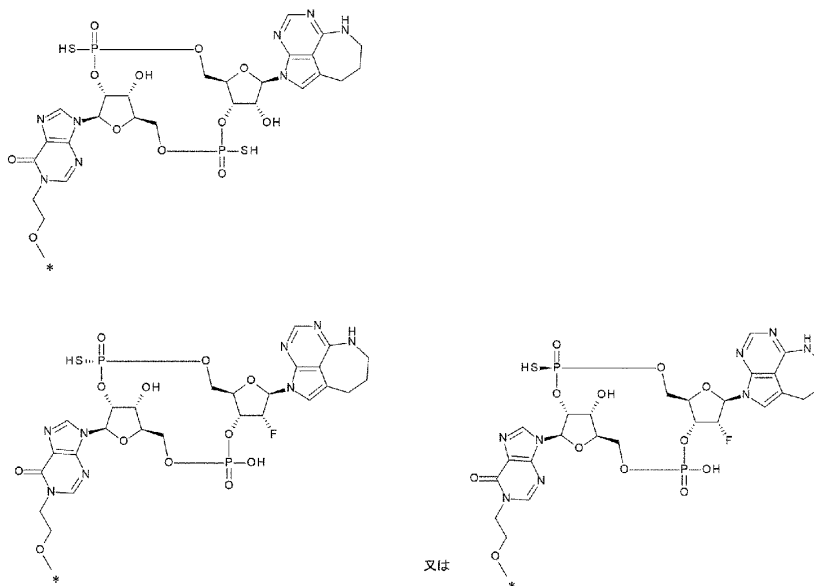
[請求項3]

Dが、以下の4式：

[化5]



[化7]



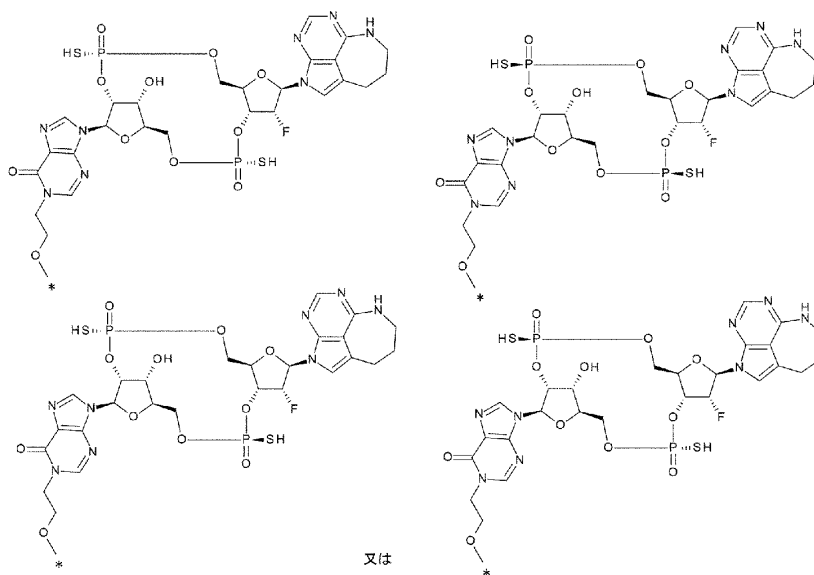
(ここで、アスタリスクはLと結合していることを示す)

のいずれかで示される、請求項 1 ～ 4 のいずれか 1 項に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項6]

Dが、以下の4式：

[化8]

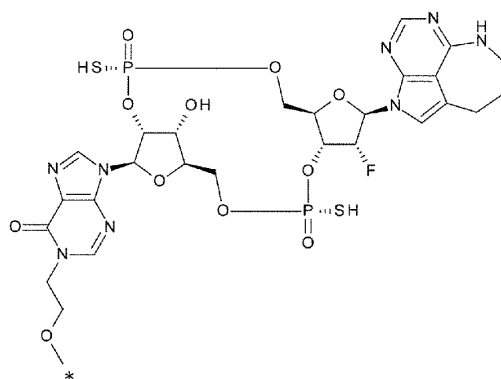


(ここで、アステリスクはLと結合していることを示す)

のいずれかで示される、請求項1～4のいずれか1項に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項7] Dが、次式：

[化9]

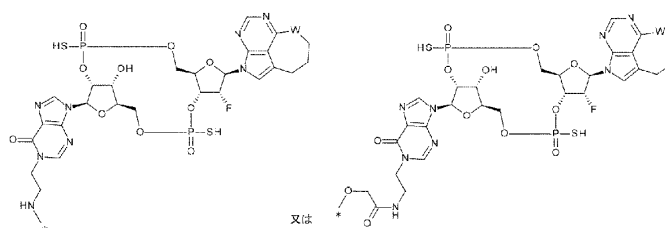


(ここで、アステリスクはLと結合していることを示す)

で示される、請求項1～4又は請求項6のいずれか1項に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項8] Dが、以下の2式：

[化10]

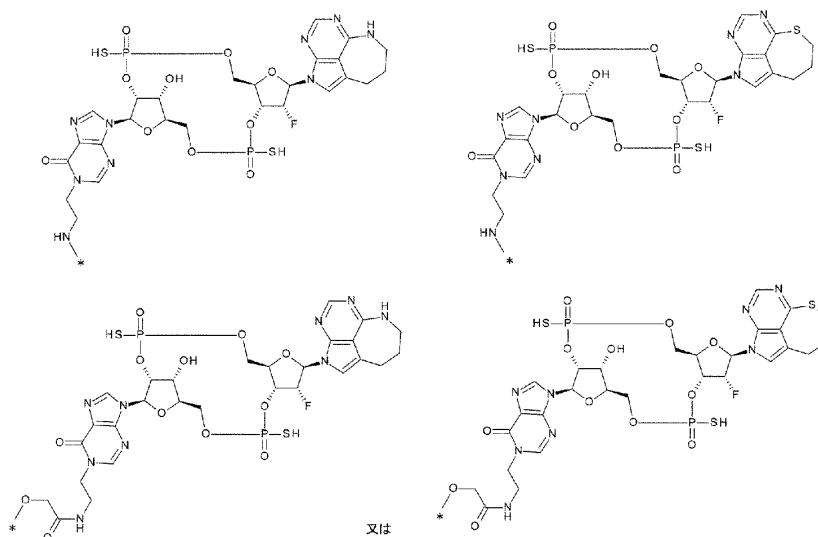


(ここで、アステリスクはLと結合していることを示し、Wは、前に定義したとおりである)

のいずれかで示される、請求項1～3のいずれか1項に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項9] Dが、次の4式：

[化11]



(ここで、アスタリスクはLと結合していることを示す)

のいずれかで示される、請求項 1 ～ 3 又は請求項 8 のいずれか 1 項に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項10]

リンカーLが、 $-L\ b-L\ a-L\ p-L\ c-*$ で示され、

式中、アスタリスクは、薬物Dと結合していることを示し、

L pは、標的細胞において切断可能なアミノ酸配列からなるリンカーを示すか又は存在せず、

L a は、以下の群から選択されるいずれか一つを示し、

$$-\text{C}(=\text{O})-(\text{CH}_2\text{CH}_2)_n-\text{C}(=\text{O})-$$
$$-C(=O) - (CH_2CH_2)_{n^2} - CH_2 - C(=O) -$$
$$-C(=O)-(CH_2CH_2)_n-C(=O)-NH-(CH_2CH_2)_n-C(=O)-$$
$$-C(=O)-(CH_2CH_2)_n-C(=O)-NH-(CH_2CH_2)_n-CH_2-C(=O)-$$
$$-C(=O)-(CH_2CH_2)_n-C(=O)-NH-(CH_2CH_2)_n-C(=O)-CH_2-C(=O)-$$
$$-(CH_2)_n-O-C(=O)-$$
、及び、

— (CH₂)^{n⁹}—C(=O)—

(ここで、n²は1～3の整数を示し、n³は1～5の整数を示し、n⁴は0～2の整数を示し、n⁹は2～7の整数を示す)、

L^bは、L^aとA^bの糖鎖又はリモデリングされた糖鎖を結合するスペーサー又はL^aとA^bのシステイン残基を結合するスペーサーを示し、並びに、

L^cは、—NH—CH₂—、—NH—フェニル基—CH₂—O(C=O)—又は—NH—ヘテロアリール基—CH₂—O(C=O)—を示すか又は存在しない、

請求項1～9のいずれか1項に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項11] L^cが—NH—CH₂—である、請求項10に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項12] L^pが、—GGFG—、—GGPI—、—GGVA—、—GGFM—、—GGVCit—、—GGFCit—、—GGICit—、—GGPL—、—GGAQ—又は—GGPP—のいずれか一つである、請求項10又は11に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項13] L^pが、—GGFG—又は—GGPI—である、請求項12に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項14] L^aが、以下：

—C(=O)—CH₂CH₂—C(=O)—、

—C(=O)—CH₂CH₂—C(=O)—NH—(CH₂CH₂O)₃

—CH₂—C(=O)—、

—C(=O)—CH₂CH₂—C(=O)—NH—(CH₂CH₂O)₄

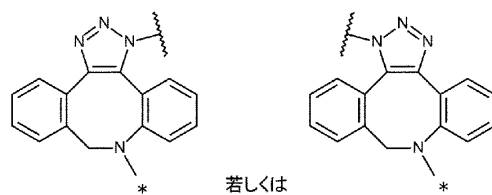
—CH₂—C(=O)—、及び

—(CH₂)₅—C(=O)—

からなる群から選択されるいずれか一つを示す、請求項10～13のいずれか1項に記載の抗体薬物コンジュゲート。

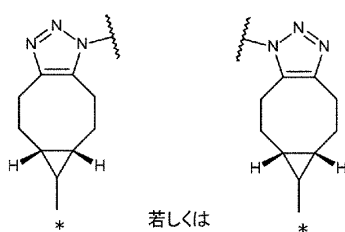
[請求項15] L^bが、次式：

[化12]



又は

[化13]

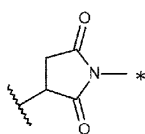


(上記で示されるL bの構造式において、アスタリスクはL aと結合していることを示し、波線はA bの糖鎖又はリモデリングされた糖鎖と結合していることを示す) のいずれかで示される、請求項10～14のいずれか1項に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項16]

L bが、－(スクシンイミド－3－イル－N)－であり、
ここで、－(スクシンイミド－3－イル－N)－は、以下の構造式：

[化14]



を示し、

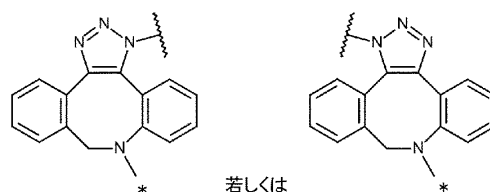
ここで、アスタリスクはL aと結合していることを示し、波線は抗体のシステイン残基の側鎖とチオエーテルを形成して結合していることを示す、請求項10～14のいずれか1項に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項17]

リンカーLが、－L b－L a－L p－L c－*で示され、

式中、アスタリスクは、薬物Dと結合していることを示し、
 L pが、 $-GGFG-$ 、又は $-GGPI-$ であり、
 L aが、 $-C(=O)-CH_2CH_2-C(=O)-$ を示し、
 L bが、次式：

[化15]



(上記で示されるL bの構造式において、アスタリスクはL aと結合していることを示し、波線はA bの糖鎖又はリモデリングされた糖鎖と結合していることを示す)を示し、

L cが、 $-NH-CH_2-$ を示す、請求項10～15のいずれか1項に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項18] 抗体薬物コンジュゲートにおける抗体1分子あたりの平均薬物結合数が、1から10の範囲である、請求項1～17のいずれか1項に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項19] 抗体薬物コンジュゲートにおける抗体1分子あたりの平均薬物結合数が、1から5の範囲である、請求項18に記載の抗体薬物コンジュゲート。

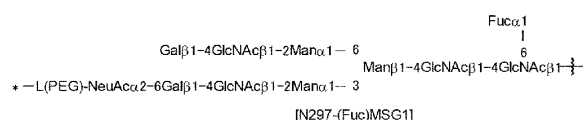
[請求項20] 抗体薬物コンジュゲートにおける抗体1分子あたりの平均薬物結合数が、3から5の範囲である、請求項19に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項21] 抗体が、抗体のAsn297に結合する糖鎖(N297糖鎖)からLに結合している、請求項1～20のいずれか1項に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項22] N297糖鎖が、リモデリングされた糖鎖である、請求項21に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項23] N297糖鎖が、次式で示される構造を有するN297-(Fuc)MSG1又はN297-(Fuc)SGである、請求項21又は22に記載の抗体薬物コンジュゲート：

[化16]



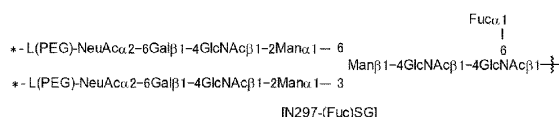
式中、波線は抗体のAsn297に結合していることを示し、

L(PEG)は、 $-(\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O})_n-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-$ を示し、該L(PEG)の右端のアミノ基がN297糖鎖の β -Manの分岐鎖の1-3鎖側の非還元末端のシアル酸の2位のカルボキシル基とアミド結合していることを示し、

アスタリスクは、前記リンカーLにおけるLbの1, 2, 3-トリアゾール環上の1位又は3位の窒素原子と結合していることを示し、及び

n は2～5の整数である；

[化17]



式中、波線は抗体のAsn297に結合していることを示し、

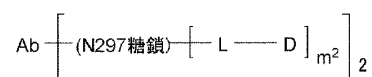
L(PEG)は、 $-(\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O})_n-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-$ を示し、該L(PEG)の右端のアミノ基がN297糖鎖の β -Manの分岐鎖の1-3鎖側及び1-6鎖側の両方の非還元末端のシアル酸の2位のカルボキシル基とアミド結合していることを示し、

アスタリスクは、前記リンカーLにおけるLbの1, 2, 3-トリアゾール環上の1位又は3位の窒素原子と結合していることを示し、及び

n は2～5の整数である。

[請求項24] 次式：

[化18]



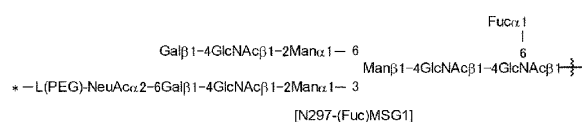
(式中、 m^2 は1又は2の整数を示し、

Lは、AbのN297糖鎖とDを連結するリンカーであって、前に定義したとおりであり、

Abは、抗CD70抗体、抗TROP2抗体、もしくは抗EGFR抗体又はそれらの抗体の機能性断片を示し、

AbのN297糖鎖は、次式で示される構造を有するN297-(Fuc)MSG1又はN297-(Fuc)SGであることを示し、

[化19]



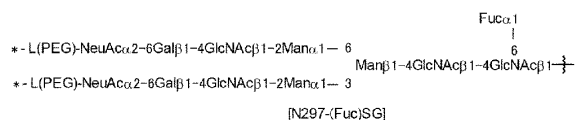
式中、波線は抗体のAsn297に結合していることを示し、

L(PEG)は、 $-(\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O})_n-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-$ を示し、該L(PEG)の右端のアミノ基がN297糖鎖の β -Manの分岐鎖の1-3鎖側の非還元末端のシアル酸の2位のカルボキシル基とアミド結合していることを示し、

アステリスクは、前記リンカーLにおけるLbの1, 2, 3-トリアゾール環上の1位又は3位の窒素原子と結合していることを示し、及び

n は2～5の整数を示し；

[化20]



式中、波線は抗体のAsn297に結合していることを示し、

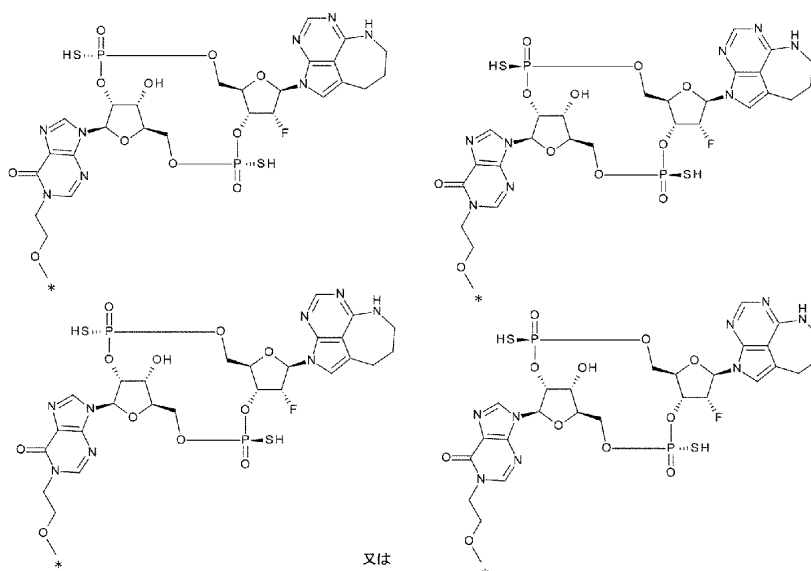
L (PEG) は、 $-(CH_2-CH_2-O)_n-CH_2-CH_2-NH-$ を示し、該L (PEG) の右端のアミノ基がN297糖鎖の β -Manの分岐鎖の1-3鎖側及び1-6鎖側の両方の非還元末端のシアル酸の2位のカルボキシル基とアミド結合していることを示し、

アステリスクは、前記リンカーLにおけるLbの1, 2, 3-トリアゾール環上の1位又は3位の窒素原子と結合していることを示し、及び

n は2～5の整数を示し、

Dは、以下の4式のいずれかで示され、

[化21]

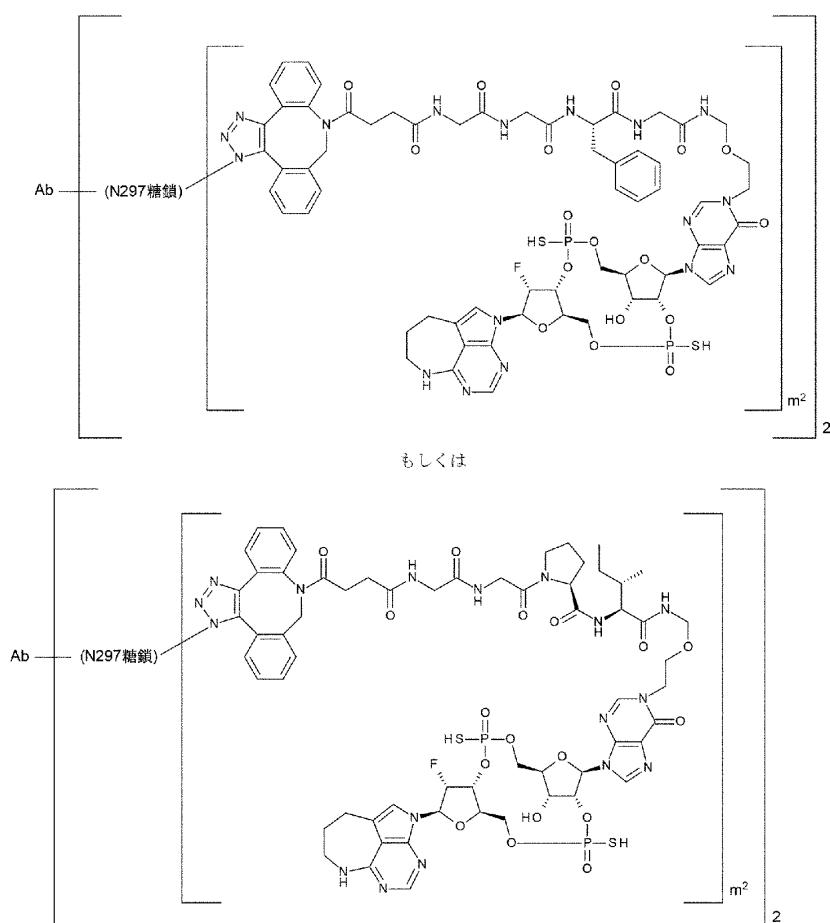


ここで、式中、アステリスクはLと結合していることを示す)で示される、請求項21～23のいずれか1項に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項25]

次式：

[化22]



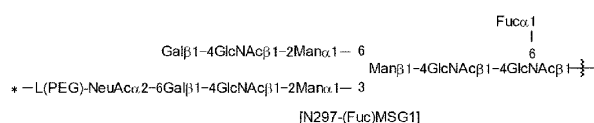
から選ばれ、

上記で示されるそれぞれの構造式において、 m^2 は1又は2の整数であることを示し、

Abは、抗CD70抗体、抗TROP2抗体、もしくは抗EGFR抗体又はそれらの抗体の機能性断片を示し、

AbのN297糖鎖は、次式で示される構造を有するN297-(Fuc)MSG1又はN297-(Fuc)SGのいずれか一つであることを示し、

[化23]



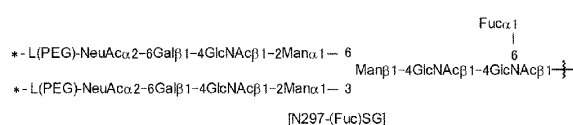
式中、波線は抗体のA s n 2 9 7 に結合していることを示し、

L (P E G) は、 $-(\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O})^n-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-$ を示し、該L (P E G) の右端のアミノ基がN 2 9 7 糖鎖の β -M a n の分岐鎖の1-3鎖側の非還元末端のシアル酸の2位のカルボキシル基とアミド結合していることを示し、

アスタリスクは、前記リンカーLにおけるL b の1, 2, 3-トリアゾール環上の1位又は3位の窒素原子と結合していることを示し、及び

n は2～5の整数を示し；

[化24]



式中、波線は抗体のA s n 2 9 7 に結合していることを示し、

L (P E G) は、 $-(\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O})^n-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-$ を示し、該L (P E G) の右端のアミノ基がN 2 9 7 糖鎖の β -M a n の分岐鎖の1-3鎖側及び1-6鎖側の両方の非還元末端のシアル酸の2位のカルボキシル基とアミド結合していることを示し、

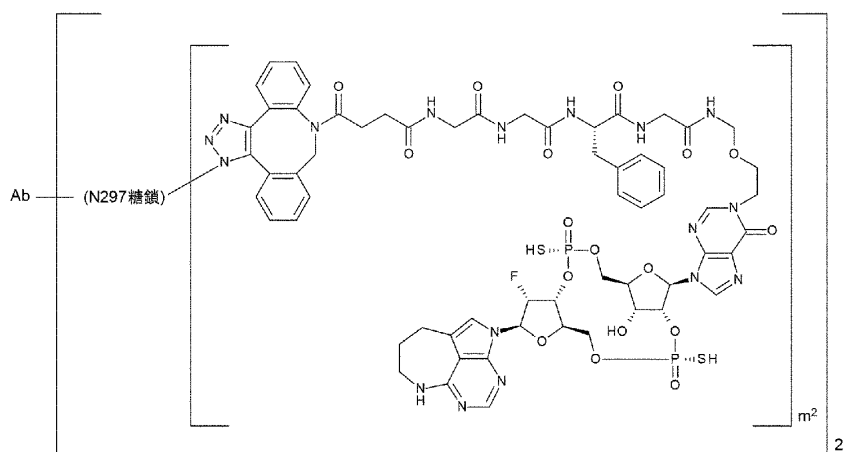
アスタリスクは、前記リンカーLにおけるL b の1, 2, 3-トリアゾール環上の1位又は3位の窒素原子と結合していることを示し、及び

n は2～5の整数を示す、請求項24に記載の抗体薬物コンジュゲート。

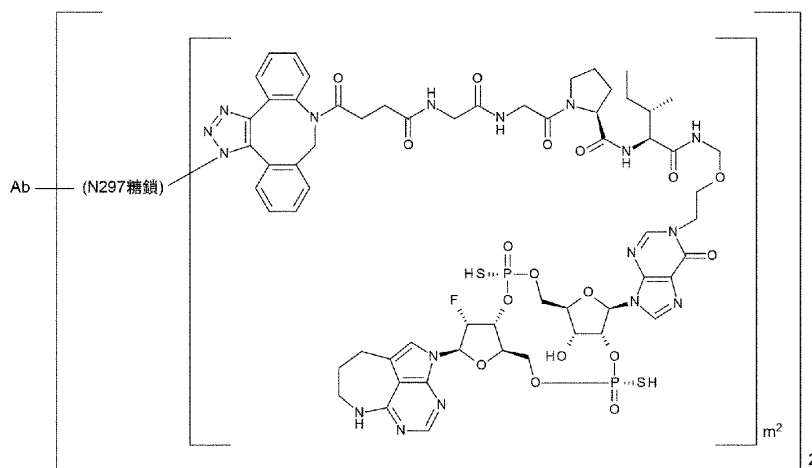
[請求項26]

次式：

[化25]



もしくは



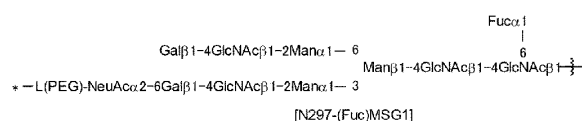
から選ばれ、

上記で示されるそれぞれの構造式において、 m^2 は1又は2の整数であることを示し、

Abは、抗CD70抗体、抗TROP2抗体、もしくは抗EGFR抗体又はそれらの抗体の機能性断片を示し、

AbのN297糖鎖は、次式で示される構造を有するN297-(Fuc)MSG1又はN297-(Fuc)SGのいずれか一つであることを示し、

[化26]



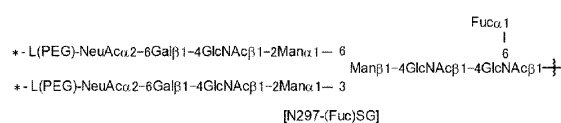
式中、波線は抗体の A s n 2 9 7 に結合していることを示し、

L (P E G) は、 $-(\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O})_n-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-$ を示し、該 L (P E G) の右端のアミノ基が N 2 9 7 糖鎖の β - M a n の分岐鎖の 1 - 3 鎖側の非還元末端のシアル酸の 2 位のカルボキシル基とアミド結合していることを示し、

アスタリスクは、前記リンカー L における L b の 1 , 2 , 3 -トリアゾール環上の 1 位又は 3 位の窒素原子と結合していることを示し、及び

n は 2 ~ 5 の整数を示し；

[化27]



式中、波線は抗体の A s n 2 9 7 に結合していることを示し、

L (P E G) は、 $-(\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O})_n-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-$ を示し、該 L (P E G) の右端のアミノ基が N 2 9 7 糖鎖の β - M a n の分岐鎖の 1 - 3 鎖側及び 1 - 6 鎖側の両方の非還元末端のシアル酸の 2 位のカルボキシル基とアミド結合していることを示し、

アスタリスクは、前記リンカー L における L b の 1 , 2 , 3 -トリアゾール環上の 1 位又は 3 位の窒素原子と結合していることを示し、及び

n は 2 ~ 5 の整数を示す、請求項 2 5 に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項27]

抗体が、抗 C D 7 0 抗体である、請求項 1 ~ 2 6 のいずれか 1 項に記載の抗体薬物コンジュゲート。

- [請求項28] 抗体が、抗TROP2抗体である、請求項1～26のいずれか1項に記載の抗体薬物コンジュゲート。
- [請求項29] 抗体が、抗EGFR抗体である、請求項1～26のいずれか1項に記載の抗体薬物コンジュゲート。
- [請求項30] 抗体が、配列番号1に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖及び配列番号2に記載のアミノ酸配列からなる重鎖を含む抗体、又は、配列番号3に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖及び配列番号4に記載のアミノ酸配列からなる重鎖を含む抗体である、請求項27に記載の抗体薬物コンジュゲート。
- [請求項31] 抗体が、配列番号5に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖及び配列番号6に記載のアミノ酸配列からなる重鎖を含む抗体、又は、配列番号7に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖及び配列番号8に記載のアミノ酸配列からなる重鎖を含む抗体である、請求項28に記載の抗体薬物コンジュゲート。
- [請求項32] 抗体が、配列番号9に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖及び配列番号10に記載のアミノ酸配列からなる重鎖を含む抗体、又は、配列番号11に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖及び配列番号12に記載のアミノ酸配列からなる重鎖を含む抗体である、請求項29に記載の抗体薬物コンジュゲート。
- [請求項33] 抗体が、配列番号1においてアミノ酸番号1乃至112に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、及び配列番号2においてアミノ酸番号1乃至118に記載のアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖を含んでなる抗体、又は、配列番号3においてアミノ酸番号1乃至108に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、及び配列番号4においてアミノ酸番号1乃至118に記載のアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖を含んでなる抗体である、請求項27に記載の抗体薬物コンジュゲート。
- [請求項34] 抗体が、配列番号5においてアミノ酸番号1乃至108に記載のア

ミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、及び配列番号6においてアミノ酸番号1乃至121に記載のアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖を含んでなる抗体、又は、配列番号7においてアミノ酸番号1乃至108に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、及び配列番号8においてアミノ酸番号1乃至121に記載のアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖を含んでなる抗体である、請求項28に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項35] 抗体が、配列番号9においてアミノ酸番号1乃至108に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、及び配列番号10においてアミノ酸番号1乃至119に記載のアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖を含んでなる抗体、又は、配列番号11においてアミノ酸番号1乃至108に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、及び配列番号12においてアミノ酸番号1乃至116に記載のアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖を含んでなる抗体である、請求項29に記載の抗体薬物コンジュゲート。

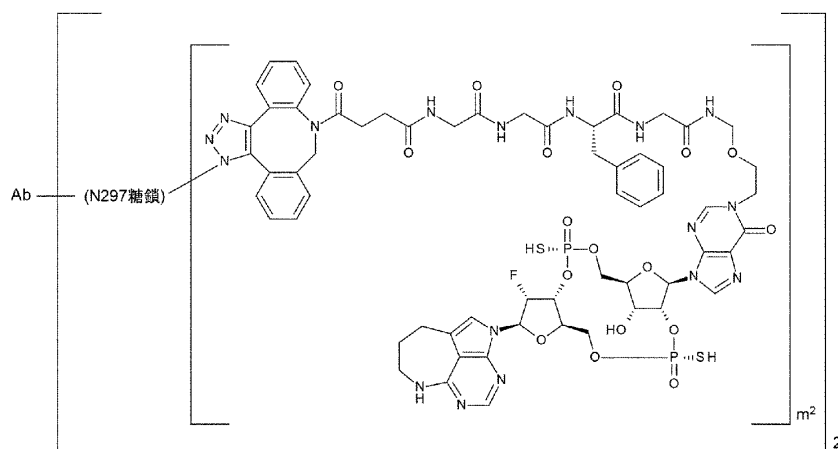
[請求項36] 抗体が、配列番号35に記載のアミノ酸配列からなるCDRL1、配列番号36に記載のアミノ酸配列からなるCDRL2、及び配列番号37に記載のアミノ酸配列からなるCDRL3を含む軽鎖、並びに、配列番号38に記載のアミノ酸配列からなるCDRH1、配列番号39に記載のアミノ酸配列からなるCDRH2、及び配列番号40に記載のアミノ酸配列からなるCDRH3を含む重鎖を含んでなる抗体、又は、配列番号41に記載のアミノ酸配列からなるCDRL1、配列番号42に記載のアミノ酸配列からなるCDRL2、及び配列番号43に記載のアミノ酸配列からなるCDRL3を含む軽鎖、並びに、配列番号44に記載のアミノ酸配列からなるCDRH1、配列番号45に記載のアミノ酸配列からなるCDRH2、及び配列番号46に記載のアミノ酸配列からなるCDRH3を含む重鎖を含んでなる抗体である、請求項27に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項37] 抗体が、配列番号47に記載のアミノ酸配列からなるCDRL1、配列番号48に記載のアミノ酸配列からなるCDRL2、及び配列番号49に記載のアミノ酸配列からなるCDRL3を含む軽鎖、並びに、配列番号50に記載のアミノ酸配列からなるCDRH1、配列番号51に記載のアミノ酸配列からなるCDRH2、及び配列番号52に記載のアミノ酸配列からなるCDRH3を含む重鎖を含んでなる抗体、又は、配列番号53に記載のアミノ酸配列からなるCDRL1、配列番号54に記載のアミノ酸配列からなるCDRL2、及び配列番号55に記載のアミノ酸配列からなるCDRL3を含む軽鎖、並びに、配列番号56に記載のアミノ酸配列からなるCDRH1、配列番号57に記載のアミノ酸配列からなるCDRH2、及び配列番号58に記載のアミノ酸配列からなるCDRH3を含む重鎖を含んでなる抗体である、請求項28に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項38] 抗体が、配列番号59に記載のアミノ酸配列からなるCDRL1、配列番号60に記載のアミノ酸配列からなるCDRL2、及び配列番号61に記載のアミノ酸配列からなるCDRL3を含む軽鎖、並びに、配列番号62に記載のアミノ酸配列からなるCDRH1、配列番号63に記載のアミノ酸配列からなるCDRH2、及び配列番号64に記載のアミノ酸配列からなるCDRH3を含む重鎖を含んでなる抗体、又は、配列番号65に記載のアミノ酸配列からなるCDRL1、配列番号66に記載のアミノ酸配列からなるCDRL2、及び配列番号67に記載のアミノ酸配列からなるCDRL3を含む軽鎖、並びに、配列番号68に記載のアミノ酸配列からなるCDRH1、配列番号69に記載のアミノ酸配列からなるCDRH2、及び配列番号70に記載のアミノ酸配列からなるCDRH3を含む重鎖を含んでなる抗体である、請求項29に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項39] 次式：

[化28]



で表され、式中、A bは以下の群から選択されるいずれか一つを示し

、

配列番号1に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖及び配列番号2に記載のアミノ酸配列からなる重鎖を含む抗体；

配列番号3に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖及び配列番号4に記載のアミノ酸配列からなる重鎖を含む抗体；

配列番号5に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖及び配列番号6に記載のアミノ酸配列からなる重鎖を含む抗体；

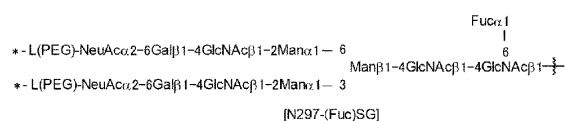
配列番号7に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖及び配列番号8に記載のアミノ酸配列からなる重鎖を含む抗体；

配列番号9に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖及び配列番号10に記載のアミノ酸配列からなる重鎖を含む抗体；

配列番号11に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖及び配列番号12に記載のアミノ酸配列からなる重鎖を含む抗体；

A bのN297糖鎖は、次式：

[化29]

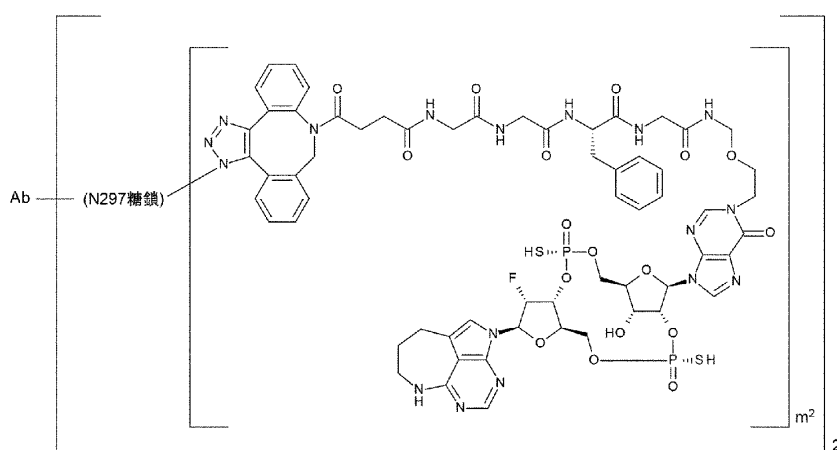


(式中、波線は抗体の A s n 2 9 7 に結合していることを示し、
 L (P E G) は、 $-(CH_2-CH_2-O)_n^5-CH_2-CH_2-NH-$ を示し、該 L (P E G) の右端のアミノ基が N 2 9 7 糖鎖の β -M a n の分岐鎖の 1-3 鎖側及び 1-6 鎖側の両方の非還元末端のシアル酸の 2 位のカルボキシル基とアミド結合していることを示し、
 アステリスクは、前記リンカー L における L b の 1, 2, 3-トリアゾール環上の 1 位又は 3 位の窒素原子と結合していることを示し、
 n^5 は 3 であり、及び
 m^2 が 2 である) で表される、抗体薬物コンジュゲート。

[請求項40]

次式：

[化30]



で表され、式中、A b は以下の群から選択されるいずれか一つを示し

、

配列番号 1 においてアミノ酸番号 1 乃至 1 1 2 に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、及び配列番号 2 においてアミノ酸番号 1 乃至 1 1 8 に記載のアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖を含んでなる抗体；

配列番号 3 においてアミノ酸番号 1 乃至 1 0 8 に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、及び配列番号 4 においてアミノ酸

番号 1 乃至 1 1 8 に記載のアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖を含んでなる抗体；

配列番号 5 においてアミノ酸番号 1 乃至 1 0 8 に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、及び配列番号 6 においてアミノ酸番号 1 乃至 1 2 1 に記載のアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖を含んでなる抗体；

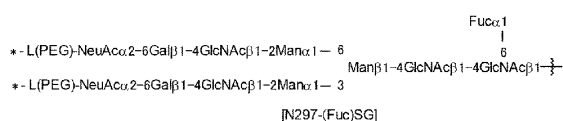
配列番号 7 においてアミノ酸番号 1 乃至 1 0 8 に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、及び配列番号 8 においてアミノ酸番号 1 乃至 1 2 1 に記載のアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖を含んでなる抗体；

配列番号 9 においてアミノ酸番号 1 乃至 1 0 8 に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、及び配列番号 1 0 においてアミノ酸番号 1 乃至 1 1 9 に記載のアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖を含んでなる抗体；

配列番号 1 1 においてアミノ酸番号 1 乃至 1 0 8 に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、及び配列番号 1 2 においてアミノ酸番号 1 乃至 1 1 6 に記載のアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖を含んでなる抗体；

A b の N 2 9 7 糖鎖は、次式：

[化31]



(式中、波線は抗体の A s n 2 9 7 に結合していることを示し、

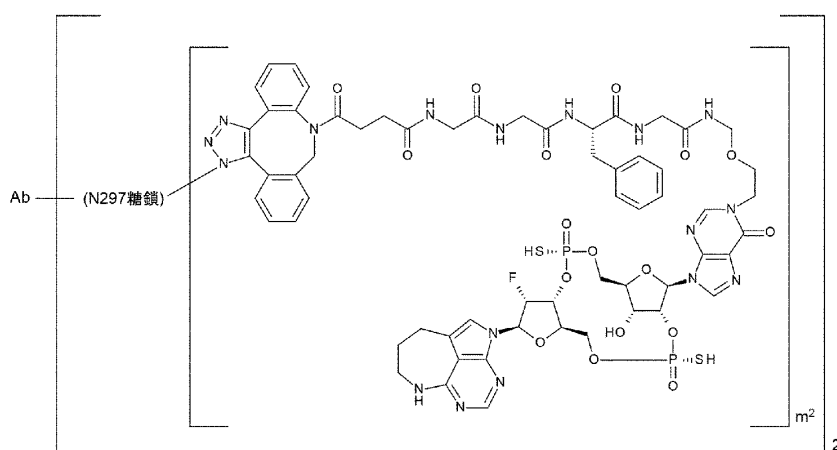
L (P E G) は、 $-(\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O})_n-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}-$ を示し、該 L (P E G) の右端のアミノ基が N 2 9 7 糖鎖の β -M a n の分岐鎖の 1-3 鎖側及び 1-6 鎖側の両方の非還元末端のシアル酸の 2 位のカルボキシル基とアミド結合していることを示し、

アステリスクは、前記リンカーLにおけるL bの1, 2, 3-トリ
アゾール環上の1位又は3位の窒素原子と結合していることを示し、
 n^5 は3であり、及び
 m^2 が2である) で表される、抗体薬物コンジュゲート。

[請求項41]

次式：

[化32]



で表され、式中、A bは以下の群から選択されるいずれか一つを示し、

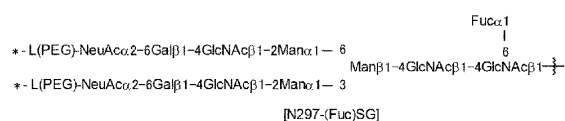
配列番号35に記載のアミノ酸配列からなるCDRL1、配列番号36に記載のアミノ酸配列からなるCDRL2、及び配列番号37に記載のアミノ酸配列からなるCDRL3を含む軽鎖、並びに、配列番号38に記載のアミノ酸配列からなるCDRH1、配列番号39に記載のアミノ酸配列からなるCDRH2、及び配列番号40に記載のアミノ酸配列からなるCDRH3を含む重鎖を含んでなる抗体；

配列番号41に記載のアミノ酸配列からなるCDRL1、配列番号42に記載のアミノ酸配列からなるCDRL2、及び配列番号43に記載のアミノ酸配列からなるCDRL3を含む軽鎖、並びに、配列番号44に記載のアミノ酸配列からなるCDRH1、配列番号45に記載のアミノ酸配列からなるCDRH2、及び配列番号46に記載のアミ

ノ酸配列からなるCDRH3を含む重鎖を含んでなる抗体；
配列番号47に記載のアミノ酸配列からなるCDRL1、配列番号48に記載のアミノ酸配列からなるCDRL2、及び配列番号49に記載のアミノ酸配列からなるCDRL3を含む軽鎖、並びに、配列番号50に記載のアミノ酸配列からなるCDRH1、配列番号51に記載のアミノ酸配列からなるCDRH2、及び配列番号52に記載のアミノ酸配列からなるCDRH3を含む重鎖を含んでなる抗体；
配列番号53に記載のアミノ酸配列からなるCDRL1、配列番号54に記載のアミノ酸配列からなるCDRL2、及び配列番号55に記載のアミノ酸配列からなるCDRL3を含む軽鎖、並びに、配列番号56に記載のアミノ酸配列からなるCDRH1、配列番号57に記載のアミノ酸配列からなるCDRH2、及び配列番号58に記載のアミノ酸配列からなるCDRH3を含む重鎖を含んでなる抗体；
配列番号59に記載のアミノ酸配列からなるCDRL1、配列番号60に記載のアミノ酸配列からなるCDRL2、及び配列番号61に記載のアミノ酸配列からなるCDRL3を含む軽鎖、並びに、配列番号62に記載のアミノ酸配列からなるCDRH1、配列番号63に記載のアミノ酸配列からなるCDRH2、及び配列番号64に記載のアミノ酸配列からなるCDRH3を含む重鎖を含んでなる抗体；
配列番号65に記載のアミノ酸配列からなるCDRL1、配列番号66に記載のアミノ酸配列からなるCDRL2、及び配列番号67に記載のアミノ酸配列からなるCDRL3を含む軽鎖、並びに、配列番号68に記載のアミノ酸配列からなるCDRH1、配列番号69に記載のアミノ酸配列からなるCDRH2、及び配列番号70に記載のアミノ酸配列からなるCDRH3を含む重鎖を含んでなる抗体；

AbのN297糖鎖は、次式：

[化33]

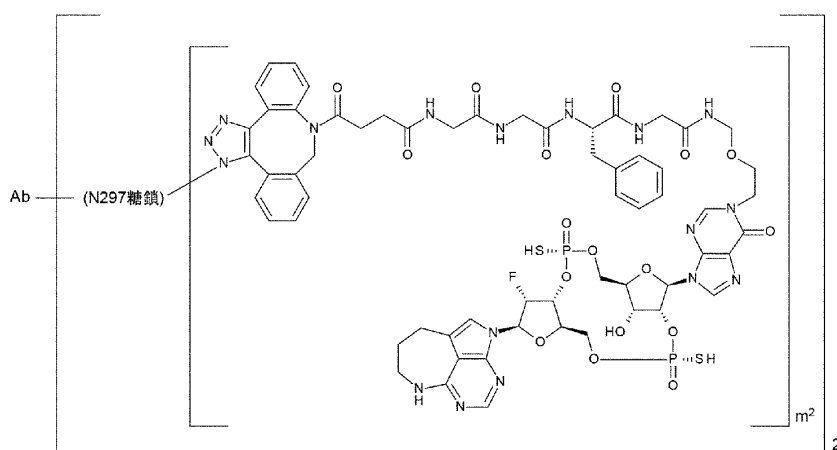


(式中、波線は抗体の A s n 2 9 7 に結合していることを示し、
 L (P E G) は、 $-(\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O})_n-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{NH}_2$ を示し、該 L (P E G) の右端のアミノ基が N 2 9 7 糖鎖の β -
 M a n の分岐鎖の 1 - 3 鎖側及び 1 - 6 鎖側の両方の非還元末端のシ
 アル酸の 2 位のカルボキシル基とアミド結合していることを示し、
 アステリスクは、前記リンカー L における L b の 1 , 2 , 3 -トリ
 アゾール環上の 1 位又は 3 位の窒素原子と結合していることを示し、
 n^5 は 3 であり、及び
 m^2 が 2 である) で表される、抗体薬物コンジュゲート。

[請求項42]

次式：

[化34]



で表され、式中、A b は以下の群から選択されるいずれか一つを示し
 、
 配列番号 1 に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖及び配列番号 2 に記載
 のアミノ酸配列からなる重鎖を含む抗体；
 配列番号 3 に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖及び配列番号 4 に記載

のアミノ酸配列からなる重鎖を含む抗体；

配列番号5に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖及び配列番号6に記載

のアミノ酸配列からなる重鎖を含む抗体；

配列番号 7 に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖及び配列番号 8 に記載

のアミノ酸配列からなる重鎖を含む抗体；

配列番号 9 に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖及び配列番号 10 に記

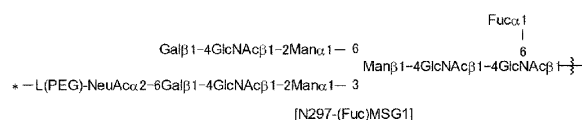
載のアミノ酸配列からなる重鎖を含む抗体；

配列番号 11 に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖及び配列番号 12 に

記載のアミノ酸配列からなる重鎖を含む抗体；

A b の N 2 9 7 糖鎖は、次式：

[化35]



(式中、波線は抗体のA s n 2 9 7に結合していることを示し、

L (PEG) は、 $-(CH_2-CH_2-O)_n-CH_2-CH_2-NH-$ を示し、該L (PEG) の右端のアミノ基がN297糖鎖の β -Manの分岐鎖の1-3鎖側及び1-6鎖側の両方の非還元末端のシアル酸の2位のカルボキシル基とアミド結合していることを示し、

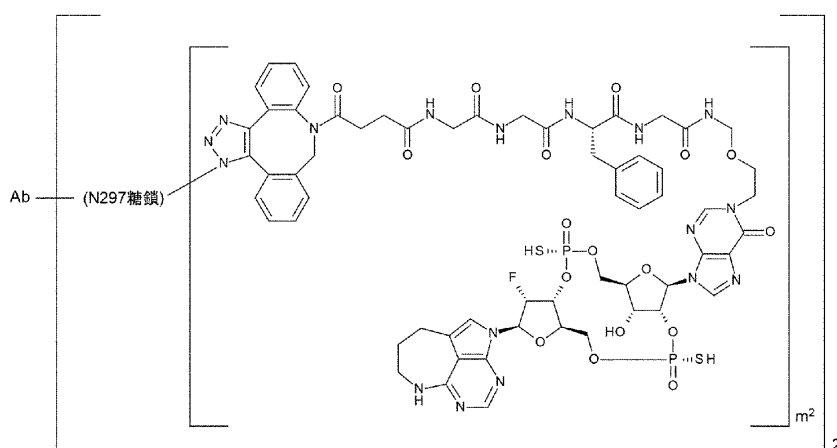
アスタリスクは、前記リンカーLにおけるLbの1, 2, 3-トリ
アゾール環上の1位又は3位の窒素原子と結合していることを示し、
n⁵は3であり、及び

m^2 が1である)で表される、抗体薬物コンジュゲート。

[請求項43]

次式：

[化36]



で表され、式中、A bは以下の群から選択されるいずれか一つを示し

、

配列番号1においてアミノ酸番号1乃至112に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、及び配列番号2においてアミノ酸番号1乃至118に記載のアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖を含んでなる抗体；

配列番号3においてアミノ酸番号1乃至108に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、及び配列番号4においてアミノ酸番号1乃至118に記載のアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖を含んでなる抗体；

配列番号5においてアミノ酸番号1乃至108に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、及び配列番号6においてアミノ酸番号1乃至121に記載のアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖を含んでなる抗体；

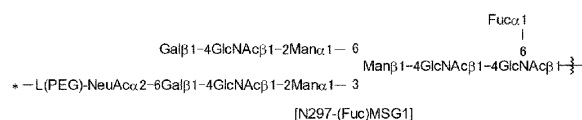
配列番号7においてアミノ酸番号1乃至108に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、及び配列番号8においてアミノ酸番号1乃至121に記載のアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖を含んでなる抗体；

配列番号 9 においてアミノ酸番号 1 乃至 108 に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、及び配列番号 10 においてアミノ酸番号 1 乃至 119 に記載のアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖を含んでなる抗体；

配列番号 11 においてアミノ酸番号 1 乃至 108 に記載のアミノ酸配列からなる軽鎖可変領域を含む軽鎖、及び配列番号 12 においてアミノ酸番号 1 乃至 116 に記載のアミノ酸配列からなる重鎖可変領域を含む重鎖を含んでなる抗体；

A b の N 2 9 7 糖鎖は、次式：

[化37]



(式中、波線は抗体のA s n 2 9 7に結合していることを示し、

L (PEG) は、 $-(CH_2-CH_2-O)_n-CH_2-CH_2-NH-$ を示し、該L (PEG) の右端のアミノ基がN297糖鎖の β -Manの分岐鎖の1-3鎖側及び1-6鎖側の両方の非還元末端のシアル酸の2位のカルボキシル基とアミド結合していることを示し、

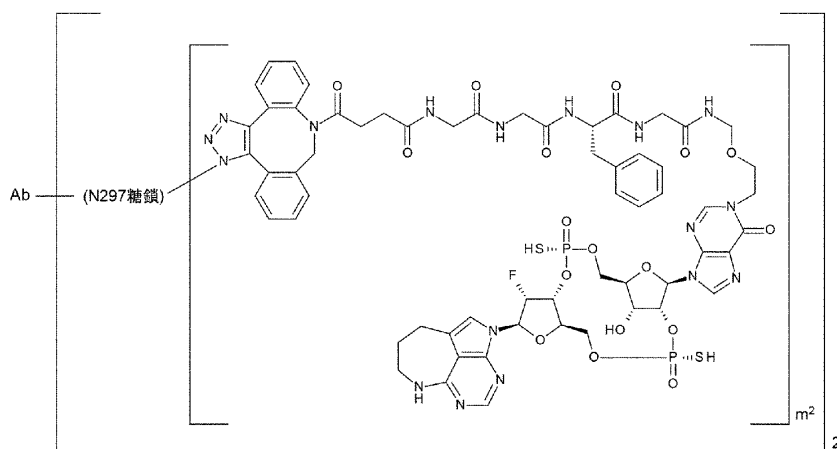
アステリスクは、前記リンカーLにおけるLbの1, 2, 3-トリ
アゾール環上の1位又は3位の窒素原子と結合していることを示し、
n⁵は3であり、及び

m^2 が1である)で表される、抗体薬物コンジュゲート。

[請求項44]

次式：

[化38]



で表され、式中、A bは以下の群から選択されるいずれか一つを示し

、

配列番号35に記載のアミノ酸配列からなるCDRL1、配列番号36に記載のアミノ酸配列からなるCDRL2、及び配列番号37に記載のアミノ酸配列からなるCDRL3を含む軽鎖、並びに、配列番号38に記載のアミノ酸配列からなるCDRH1、配列番号39に記載のアミノ酸配列からなるCDRH2、及び配列番号40に記載のアミノ酸配列からなるCDRH3を含む重鎖を含んでなる抗体；

配列番号41に記載のアミノ酸配列からなるCDRL1、配列番号42に記載のアミノ酸配列からなるCDRL2、及び配列番号43に記載のアミノ酸配列からなるCDRL3を含む軽鎖、並びに、配列番号44に記載のアミノ酸配列からなるCDRH1、配列番号45に記載のアミノ酸配列からなるCDRH2、及び配列番号46に記載のアミノ酸配列からなるCDRH3を含む重鎖を含んでなる抗体；

配列番号47に記載のアミノ酸配列からなるCDRL1、配列番号48に記載のアミノ酸配列からなるCDRL2、及び配列番号49に記載のアミノ酸配列からなるCDRL3を含む軽鎖、並びに、配列番号50に記載のアミノ酸配列からなるCDRH1、配列番号51に記載

のアミノ酸配列からなるCDRH2、及び配列番号52に記載のアミノ酸配列からなるCDRH3を含む重鎖を含んでなる抗体；

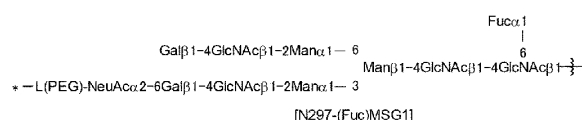
配列番号 53 に記載のアミノ酸配列からなる C D R L 1、配列番号 54 に記載のアミノ酸配列からなる C D R L 2、及び配列番号 55 に記載のアミノ酸配列からなる C D R L 3 を含む軽鎖、並びに、配列番号 56 に記載のアミノ酸配列からなる C D R H 1、配列番号 57 に記載のアミノ酸配列からなる C D R H 2、及び配列番号 58 に記載のアミノ酸配列からなる C D R H 3 を含む重鎖を含んでなる抗体；

配列番号 59 に記載のアミノ酸配列からなる C D R L 1、配列番号 60 に記載のアミノ酸配列からなる C D R L 2、及び配列番号 61 に記載のアミノ酸配列からなる C D R L 3 を含む軽鎖、並びに、配列番号 62 に記載のアミノ酸配列からなる C D R H 1、配列番号 63 に記載のアミノ酸配列からなる C D R H 2、及び配列番号 64 に記載のアミノ酸配列からなる C D R H 3 を含む重鎖を含んでなる抗体；

配列番号 65 に記載のアミノ酸配列からなる CDR L1、配列番号 66 に記載のアミノ酸配列からなる CDR L2、及び配列番号 67 に記載のアミノ酸配列からなる CDR L3 を含む軽鎖、並びに、配列番号 68 に記載のアミノ酸配列からなる CDR H1、配列番号 69 に記載のアミノ酸配列からなる CDR H2、及び配列番号 70 に記載のアミノ酸配列からなる CDR H3 を含む重鎖を含んでなる抗体；

A b の N 2 9 7 糖鎖は、次式：

[化39]



(式中、波線は抗体のA s n 2 9 7に結合していることを示し、

L (PEG) は、 $-(CH_2-CH_2-O)_n-CH_2-CH_2-NH-$ を示し、該L (PEG) の右端のアミノ基がN297糖鎖の β -

Man の分岐鎖の 1 - 3 鎖側及び 1 - 6 鎖側の両方の非還元末端のシアル酸の 2 位のカルボキシル基とアミド結合していることを示し、

アステリスクは、前記リンカー L における L b の 1, 2, 3 - トリアゾール環上の 1 位又は 3 位の窒素原子と結合していることを示し、 n^5 は 3 であり、及び m^2 が 1 である) で表される、抗体薬物コンジュゲート。

[請求項45] 請求項 1 ～ 44 のいずれか 1 項に記載の抗体薬物コンジュゲートを含有する、STING アゴニスト。

[請求項46] 請求項 1 ～ 44 のいずれか 1 項に記載の抗体薬物コンジュゲートを含有する、医薬組成物。

[請求項47] 請求項 1 ～ 44 のいずれか 1 項に記載の抗体薬物コンジュゲートを含有する、抗腫瘍剤。

[請求項48] 腫瘍が、肺がん、腎がん、尿路上皮がん、大腸がん、前立腺がん、多形神経膠芽腫、卵巣がん、膵がん、乳がん、メラノーマ、肝がん、膀胱がん、胃がん、食道がん、子宮体がん、精巣がん、子宮頸がん、胎盤絨毛がん、脳腫瘍、頭頸部がん、甲状腺がん、中皮腫、消化管間質腫瘍 (GIST)、胆のうがん、胆管がん、副腎がん、有棘細胞がん、咽頭がん、舌がん、聴器がん、胸腺がん、小腸がん、白血病、悪性リンパ腫、形質細胞腫、骨髄腫又は肉腫である、請求項 47 に記載の抗腫瘍剤。

[請求項49] 請求項 1 ～ 44 のいずれか 1 項に記載の抗体薬物コンジュゲート、請求項 45 に記載の STING アゴニスト、請求項 46 に記載の医薬組成物及び請求項 47 又は 48 に記載の抗腫瘍剤からなる群から選択されるいずれかを投与することを含む、がんの治療方法。

[請求項50] がんが、肺がん、腎がん、尿路上皮がん、大腸がん、前立腺がん、多形神経膠芽腫、卵巣がん、膵がん、乳がん、メラノーマ、肝がん、膀胱がん、胃がん、食道がん、子宮体がん、精巣がん、子宮頸がん、胎盤絨毛がん、脳腫瘍、頭頸部がん、甲状腺がん、中皮腫、消化管間

質腫瘍（GIST）、胆のうがん、胆管がん、副腎がん、有棘細胞がん、咽頭がん、舌がん、聴器がん、胸腺がん、小腸がん、白血病、悪性リンパ腫、形質細胞腫、骨髓腫又は肉腫である、請求項49に記載の方法。

[請求項51] ヒト腎がん細胞株Caki-1細胞を皮下移植したBALB/c-mouseにおいて抗体標的依存的な抗腫瘍効果を奏する、請求項27、30、33又は36のいずれか1項に記載の抗体薬物コンジュゲート。

[請求項52] 請求項42乃至44のいずれか1項に記載の抗体薬物コンジュゲートであって、下記(i)又は(ii)記載の動物において、抗体薬物コンジュゲートに含まれる抗体より強い抗腫瘍効果を奏する、抗体薬物コンジュゲート：

(i) 該抗体薬物コンジュゲートに含まれる抗体が結合する抗原上のエピトープ部位がヒト型に置換されたヒトマウスキメラ抗原の遺伝子を導入したマウス大腸がん細胞株CT26.WT(CRL2638)が皮下移植されたBALB/cマウス；

(ii) ヒト腎がん細胞株A-498(HTB-44)細胞が皮下移植されたBALB/c-mouse。