

【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6月4日(2025.6.4)

【国際公開番号】WO2022/246576
 【公表番号】特表2024-519140(P2024-519140A)
 【公表日】令和6年5月8日(2024.5.8)
 【年通号数】公開公報(特許)2024-083
 【出願番号】特願2023-572596(P2023-572596)
 【国際特許分類】

10

C 0 7 D 4 9 1 / 2 2 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 3 1 / 4 7 4 5 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 3 7 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 3 1 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 4 7 / 6 8 (2 0 1 7 . 0 1)
 A 6 1 K 3 9 / 3 9 5 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 3 1 / 4 9 6 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 3 1 / 5 4 1 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 3 1 / 5 3 8 6 (2 0 0 6 . 0 1)
 C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

20

【 F I 】

C 0 7 D 4 9 1 / 2 2 C S P
 A 6 1 P 3 5 / 0 0
 A 6 1 K 3 1 / 4 7 4 5
 A 6 1 P 3 7 / 0 6
 A 6 1 P 3 1 / 1 2
 A 6 1 K 4 7 / 6 8
 A 6 1 K 3 9 / 3 9 5 C
 A 6 1 K 3 9 / 3 9 5 L
 A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7
 A 6 1 K 3 1 / 4 9 6
 A 6 1 K 3 1 / 5 4 1
 A 6 1 K 3 1 / 5 3 8 6
 C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 3 0 1

30

【手続補正書】

【提出日】令和7年5月27日(2025.5.27)

【手続補正1】

40

【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】

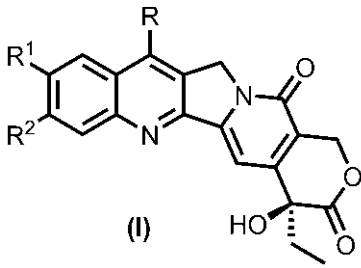
【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

50

【化 1】



10

を有する化合物であって、
式中、

R^1 は、 $-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 及び $-\text{NH}_2$ から選択され、

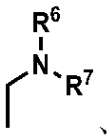
R^2 は、 $-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OCH}_3$ 及び $-\text{OCF}_3$ から選択され、

R^1 が $-\text{NH}_2$ である場合、 R は R^3 または R^4 であり、 R^1 が $-\text{NH}_2$ 以外である場合、 R は R^4 であり、

R^3 は、 $-\text{H}$ 、 $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})-\text{O}-\text{R}^5$ 、

20

【化 2】

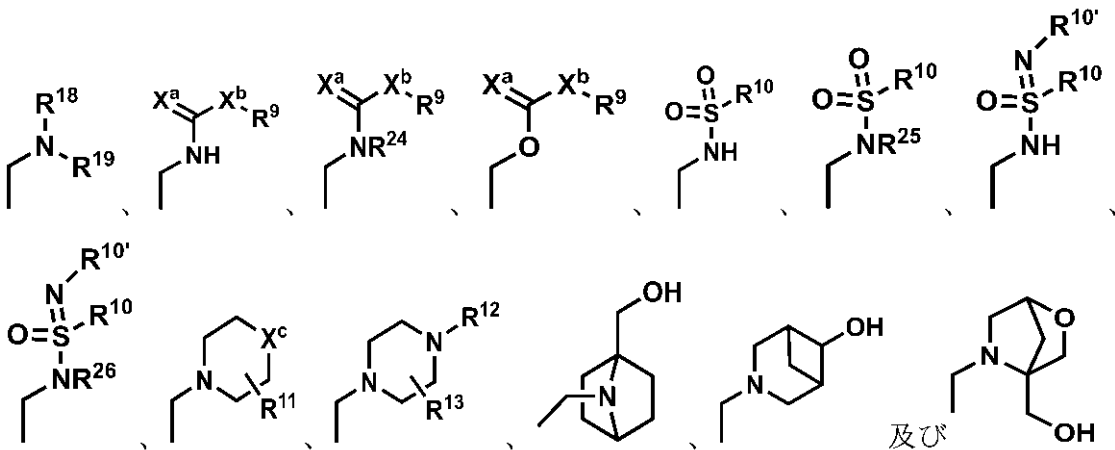


$-\text{CO}_2\text{R}^8$ 、 $-\text{アリール}$ 、 $-\text{ヘテロアリール}$ 及び $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})-\text{アリール}$ から選択され、

R^4 は、

30

【化 3】



40

から選択され、

R^5 は、 $-\text{H}$ 、 $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル、 $-\text{アリール}$ 、 $-\text{ヘテロアリール}$ 及び $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})-\text{アリール}$ から選択され、

R^6 及び R^7 は、それぞれ独立して、 $-\text{H}$ 、 $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル、 $-(\text{C}_1 \sim \text{C}_6 \text{ アルキル})-\text{O}-\text{R}^5$ 、 $-\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ ヘテロシクロアルキル

50

及び - C (O) R¹⁷ から選択され、

R⁸ は、 - H、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 及び - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキルから選択され、

各 R⁹ は、独立して、 - H、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 - アリール、 - ヘテロアリール及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

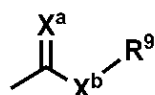
各 R¹⁰ は、独立して、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 - N R¹⁴ R^{14'}、 - アリール、 - ヘテロアリール及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

各 R^{10'} は、独立して、 - H、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 - アリール、 - ヘテロアリール及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

R¹¹ は、 - H 及び - C₁ ~ C₆ アルキルから選択され、

R¹² は、 - H、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C O₂ R⁸、 - アリール、 - ヘテロアリール、 - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリール、 - S (O)₂ R¹⁶ 及び

【化 4】



から選択され、

R¹³ は、 - H 及び - C₁ ~ C₆ アルキルから選択され、

R¹⁴ 及び R^{14'} は、それぞれ独立して、 - H、 C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 及び - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキルから選択され、

R¹⁶ は、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 - アリール、 - ヘテロアリール、 及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

R¹⁷ は、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキル、 - (C₁ ~ C₆ アルキル) - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキル、 - アリール、 - ヘテロアリール及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

R¹⁸ 及び R¹⁹ は、それらが結合する N 原子と一緒に、ハロゲン、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - O - R⁵ から選択される 0 から 3 個の置換基を有する 4、5、6 または 7 員環を形成し、

R²⁴、R²⁵ 及び R²⁶ は、それぞれ - C₁ ~ C₆ アルキルであり、

X^a 及び X^b は、それぞれ独立して、NH、O 及び S から選択され、

X^c は、O、S 及び S (O)₂ から選択され、

アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール基はそれぞれ置換されていてもよい、

化合物またはその医薬的に許容される塩もしくは保護型。

【請求項 2】

R⁴ は、

10

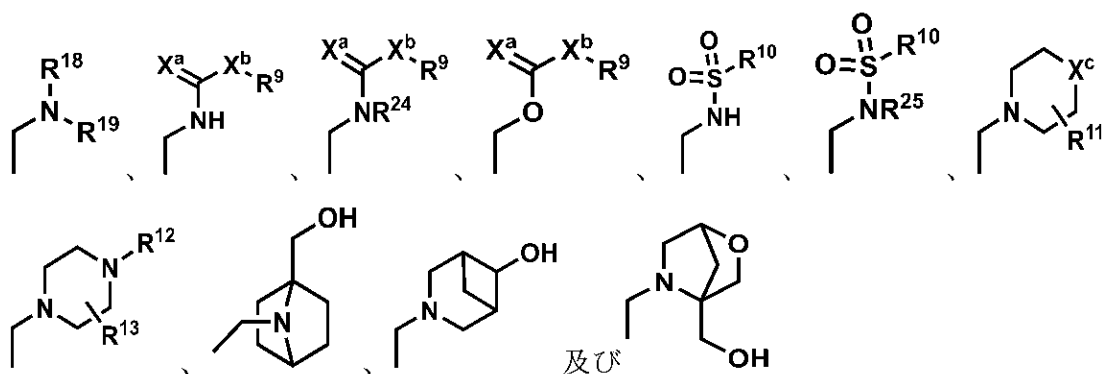
20

30

40

50

【化5】



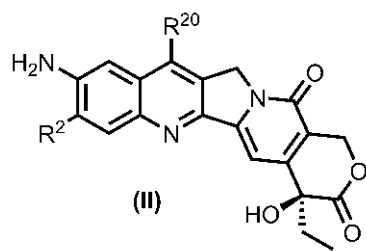
10

から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

式(II)：

【化6】



20

を有する化合物であって、

式中、

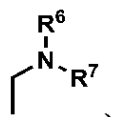
R^2 は、 $-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-F$ 、 $-Br$ 、 $-Cl$ 、 $-OCH_3$ 及び $-OCF_3$ から

選択され、

R^{20} は、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-(C_1 \sim C_6$ アルキル) $-O-R^5$ 、

30

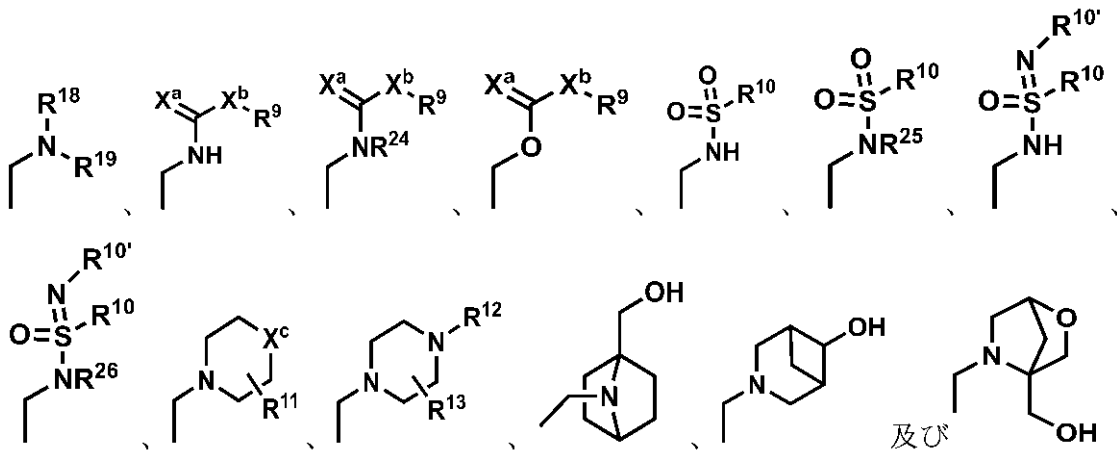
【化7】



$-CO_2R^8$ 、 $-アリール$ 、 $-ヘテロアリール$ 、 $-(C_1 \sim C_6$ アルキル) $-アリール$ 、

40

【化 8】



10

から選択され、

R^5 は、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択され、

R^6 及び R^7 は、それぞれ独立して、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-R^5$ 、 $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル及び $-C(O)R^{17}$ から選択され、

20

R^8 は、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、及び $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキルから選択され、

各 R^9 は、独立して、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択され、

各 R^{10} は、独立して、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-NR^{14}$ 、 R^{14} 、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択され、

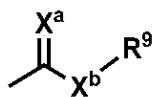
各 $R^{10'}$ は、独立して、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択され、

30

R^{11} は、 $-H$ 及び $-C_1 \sim C_6$ アルキルから選択され、

R^{12} は、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CO_2R^8$ 、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリール、 $-S(O)_2R^{16}$ 及び

【化 9】



から選択され、

40

R^{13} は、 $-H$ 及び $-C_1 \sim C_6$ アルキルから選択され、

R^{14} 及び $R^{14'}$ は、それぞれ独立して、 $-H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、及び $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキルから選択され、

R^{16} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール、及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択され、

R^{17} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択され、

R^{18} 及び R^{19} は、それらが結合する N 原子と一緒に、ハロゲン、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-R^5$ から選択さ

50

れる 0 から 3 個の置換基を有する 4、5、6、または 7 員環を形成し、

R^{24} 、 R^{25} 及び R^{26} は、それぞれ $-C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

X^a 及び X^b は、それぞれ独立して、 NH 、 O 及び S から選択され、

X^c は、 O 、 S 及び $S(O)_2$ から選択される、

請求項 1 に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩もしくは保護型。

【請求項 4】

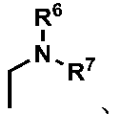
R^2 は、 $-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OCH_3$ 及び $-OCF_3$ から選択される、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

R^{20} は、

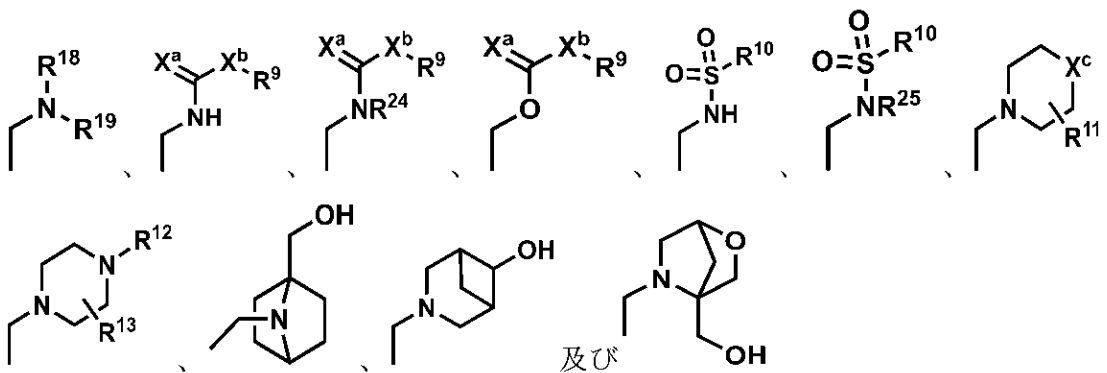
(a) $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-R^5$ 、

【化 10】



$-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ - アリール、

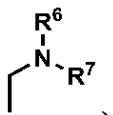
【化 11】



または、

(b) $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-R^5$ 、

【化 12】



$-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ - アリール、

10

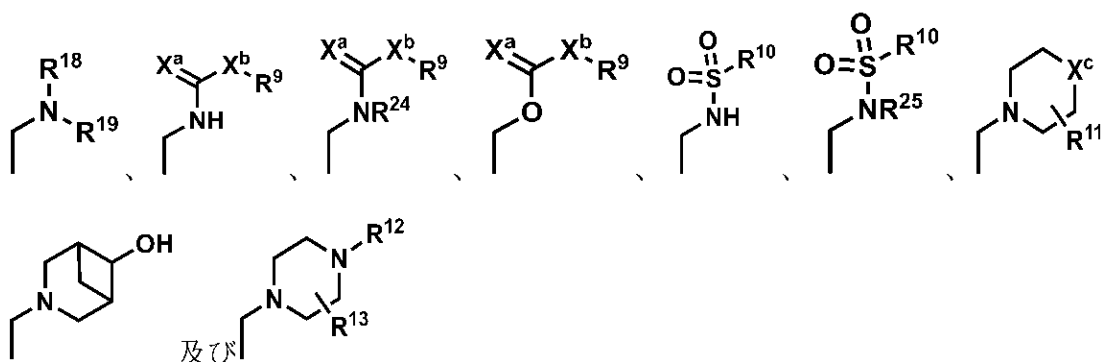
20

30

40

50

【化 1 3】

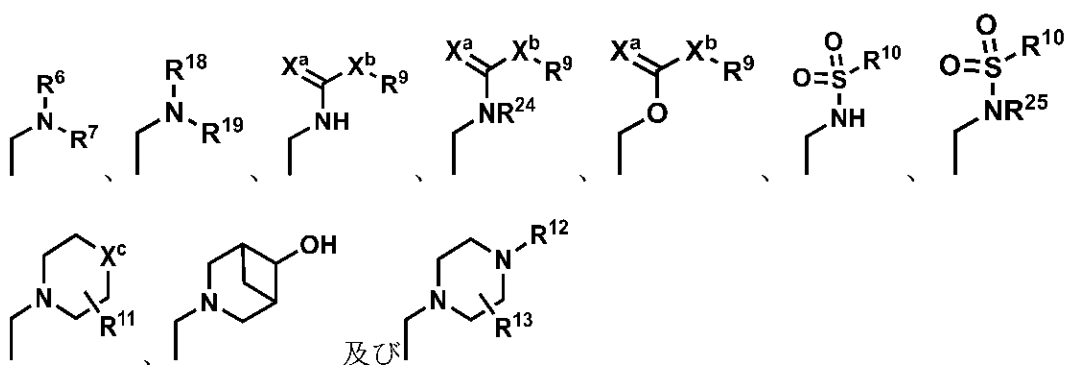


10

または、

(c) - H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- (C₁ ~ C₆ アルキル) - O - R⁵、

【化 1 4】



20

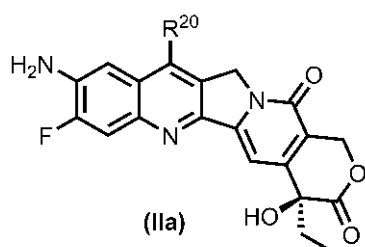
から選択される、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 6】

30

式 (I I a) :

【化 1 5】



(IIa)

40

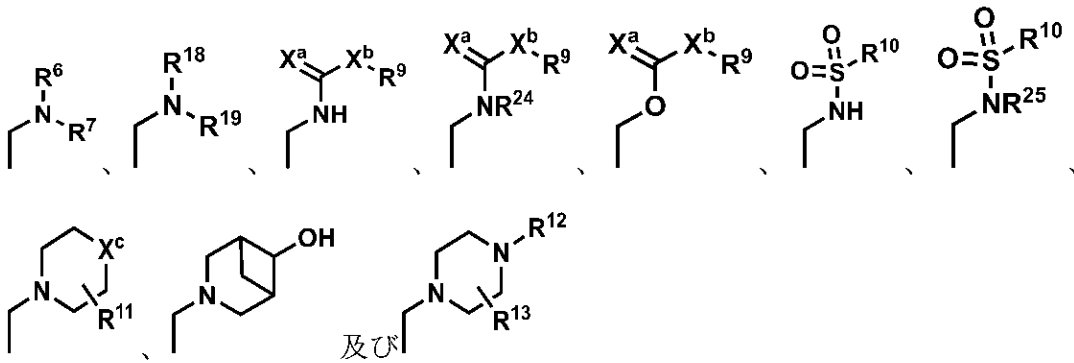
を有し、式中、R²⁰、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R^{10'}、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴、R^{14'}、R¹⁶、R¹⁷、R¹⁸、R¹⁹、R²⁴、R²⁵、R²⁶、X^a、X^b 及び X^c は、請求項 3 で定義されたとおりである、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 7】

R²⁰ は、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- (C₁ ~ C₆ アルキル) - O - R⁵、

50

【化 1 6】



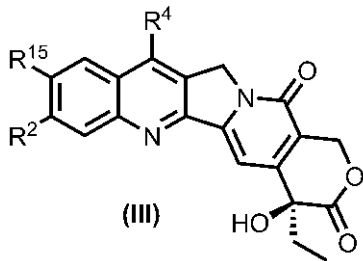
10

から選択される、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

式 (III) :

【化 1 7】



20

を有する化合物であって、

式中、

R² は、 $-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OCH}_3$ 及び $-\text{OCF}_3$ から

30

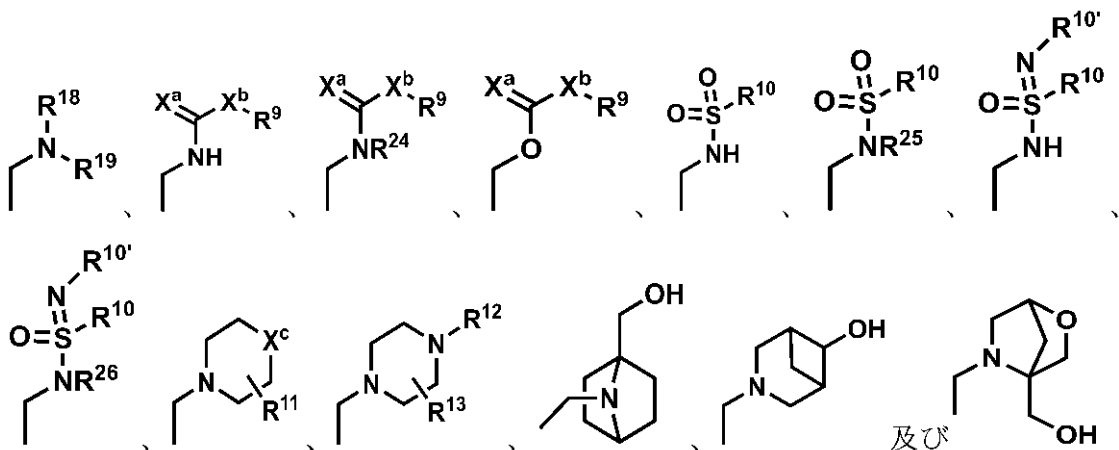
選択され、

R¹⁵ は、 $-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OCH}_3$ 及び $-\text{OCF}_3$ から

選択され、

R⁴ は、

【化 1 8】



40

から選択され、

R⁵ は、 $-\text{H}$ 、 $-\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{C}_3 \sim \text{C}_8$ シクロアルキル、 $-\text{アリール}$ 、 $-\text{$

50

から選択される、
請求項 8 に記載の化合物。

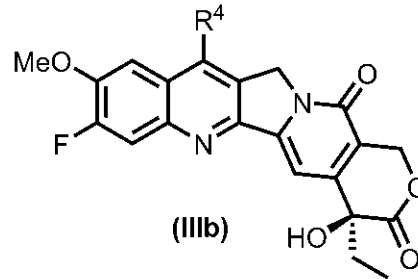
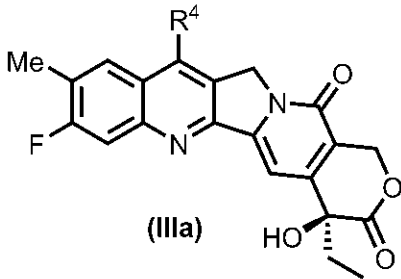
【請求項 10】

R^{15} は、 $-CH_3$ または $-OCH_3$ である、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 11】

式 (IIIa) または (IIIb) :

【化 21】



10

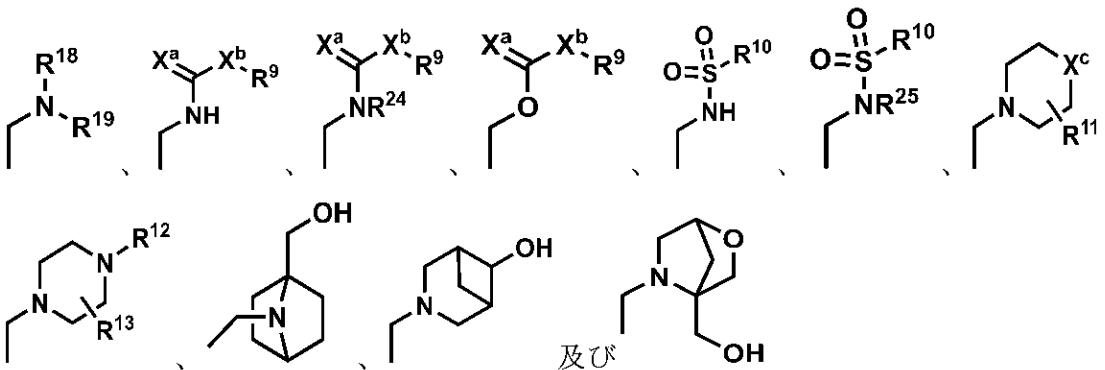
を有し、式中、 R^4 、 R^5 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 $R^{10'}$ 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 $R^{14'}$ 、 R^{16} 、 R^{18} 、 R^{19} 、 R^{24} 、 R^{25} 、 R^{26} 、 X^a 、 X^b 及び X^c は、
請求項 8 で定義されたとおりである、請求項 8 に記載の化合物。

20

【請求項 12】

R^4 は、

【化 22】



30

から選択される、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】

アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール基はそれぞれ、

(a) ハロゲン、アシル、アシルオキシ、アルコキシ、カルボキシ、ヒドロキシ、アミノ、アミド、ニトロ、シアノ、アジド、アルキルチオ、チオ、スルホニル、スルホンアミド、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール、または

40

(b) ハロゲン、アシル、アシルオキシ、アルコキシ、カルボキシ、ヒドロキシ、アミノ、アミド、ニトロ、シアノ、アジド、アルキルチオ、チオ、スルホニル及びスルホンアミド

から選択される 1 つ以上の置換基で置換されていてもよい、請求項 1 から 12 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 14】

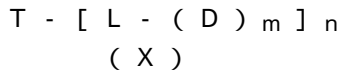
前記化合物は、表 1 に記載の化合物 100 から 168 から選択される、請求項 1 に記載

50

の化合物。

【請求項 15】

式 (X) :



を有する複合体であって、式中、

T は、標的化部分であり、

L は、リンカーであり、

D は、請求項 1 から 14 のいずれか 1 項に記載の化合物であり、

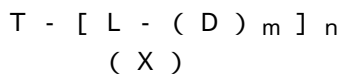
m は、1 から 4 の間の整数であり、

n は、1 から 10 の間の整数である、

複合体。

【請求項 16】

式 (X) :



を有する複合体であって、式中、

T は、標的化部分であり、

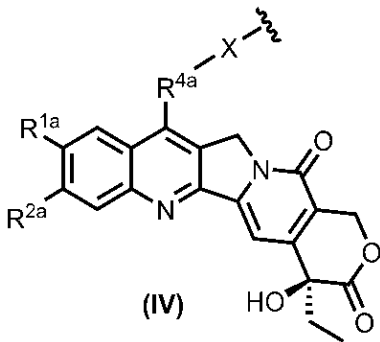
L は、リンカーであり、

m は、1 から 4 の間の整数であり、

n は、1 から 10 の間の整数であり、

D は、式 (IV) :

【化 23】



の化合物であり、式中、

R^{1a} は、 $-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 及び $-\text{NH}_2$ から選択され、

R^{2a} は、 $-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Br}$ 、 $-\text{Cl}$ 、 $-\text{OCH}_3$ 及び $-\text{OCF}_3$ から選択され、

X は、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ または $-\text{NH}-$ であり、R^{4a} は、

10

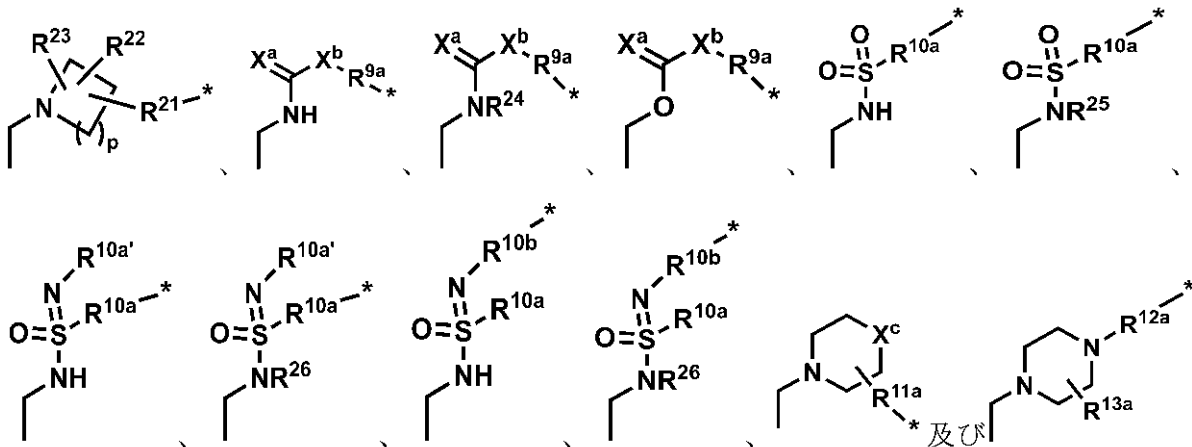
20

30

40

50

【化 2 4】



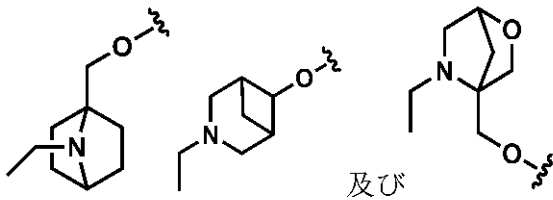
10

から選択され、*は、Xとの結合点であり、pは、1、2、3または4であるか、あるいは

Xは、Oであり、 $R^{4a} - X -$ は、

【化 2 5】

20



から選択され、

R^{5a} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリーール、 $-$ ヘテロアリーール、及び $-(C_1 \sim C_6$ アルキル) $-$ アリーールから選択され、

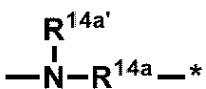
30

R^{8a} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、及び $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキルから選択され、

各 R^{9a} は、独立して、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリーール、 $-$ ヘテロアリーール及び $-(C_1 \sim C_6$ アルキル) $-$ アリーールから選択されるか、あるいは R^{9a} は、存在せず、 $X^b = X$ であり、

各 R^{10a} は、独立して、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリーール、 $-$ ヘテロアリーール、 $-(C_1 \sim C_6$ アルキル) $-$ アリーール及び

【化 2 6】



40

から選択され、

各 $R^{10a'}$ は、独立して、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリーール、 $-$ ヘテロアリーール及び $-(C_1 \sim C_6$ アルキル) $-$ アリーールから選択され、

各 R^{10b} は、独立して、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリーール、 $-$ ヘテロアリーール及び $-(C_1 \sim C_6$ アルキル) $-$ アリーールから選択され、

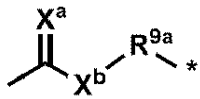
R^{11a} は、存在しないか、または $-C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

R^{12a} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CO_2R^{8a}$ 、 $-$ アリーール、 $-$ ヘテロアリーール、

50

- (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリール、 - S(O)₂R^{16a} 及び

【化 27】



から選択され、

R^{13a} は、 - H 及び - C₁ ~ C₆ アルキルから選択され、

R^{14a} は、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 及び - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキルから選択され、

10

R^{14a'} は、 H、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 及び - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキルから選択され、

R^{16a} は、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 - アリール、 - ヘテロアリール、 及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

R²¹ は、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - O - R^{5a} から選択され、

R²² 及び R²³ は、それぞれ独立して、 - H、 - ハロゲン、 C₁ ~ C₆ アルキル、 及び - C₃ ~ C₈ シクロアルキルから選択され、

R²⁴、 R²⁵ 及び R²⁶ は、それぞれ - C₁ ~ C₆ アルキルであり、

X^a 及び X^b は、それぞれ独立して、 NH、 O 及び S から選択され、

20

X^c は、 O、 S 及び S(O)₂ から選択され、

【化 28】



は、リンカー L との結合点を示し、

アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール基はそれぞれ置換されていてもよい、

複合体。

30

【請求項 17】

R^{1a} は、

(a) - CH₃、 - CF₃、 - OCH₃、 - OCF₃ 及び - NH₂ ; または

(b) - CH₃、 - OCH₃ 及び NH₂

から選択される、請求項 16 に記載の複合体。

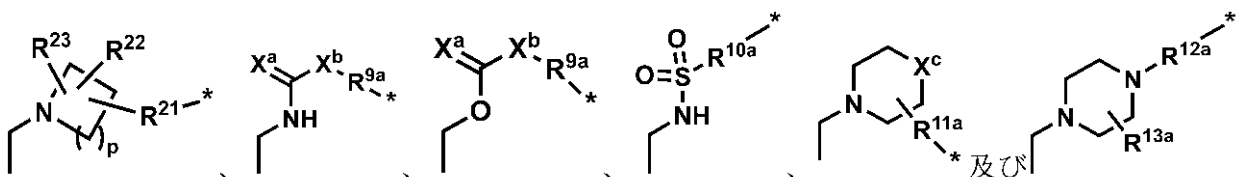
【請求項 18】

(a) R^{2a} は、 - F、 - Br 及び - Cl から選択され、及び / または

(b) X は、 - O -、 - S - または - NH - であり、 R^{4a} は、

【化 29】

40



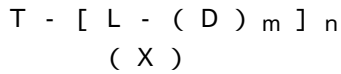
から選択される、

請求項 16 に記載の複合体。

【請求項 19】

式 (X) :

50



を有する複合体であって、式中、

Tは、標的化部分であり、

Lは、リンカーであり、

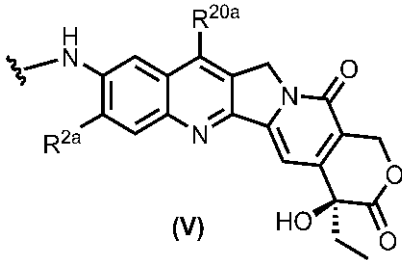
mは、1から4の間の整数であり、

nは、1から10の間の整数であり、

Dは、式(V)：

【化30】

10



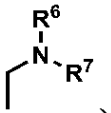
の化合物であり、式中、

R^{2a}は、-CH₃、-CF₃、-F、-Br、-Cl、-OCH₃及び-OCF₃から選択され、

R^{20a}は、-H、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、-(C₁~C₆アルキル)-O-R⁵、

【化31】

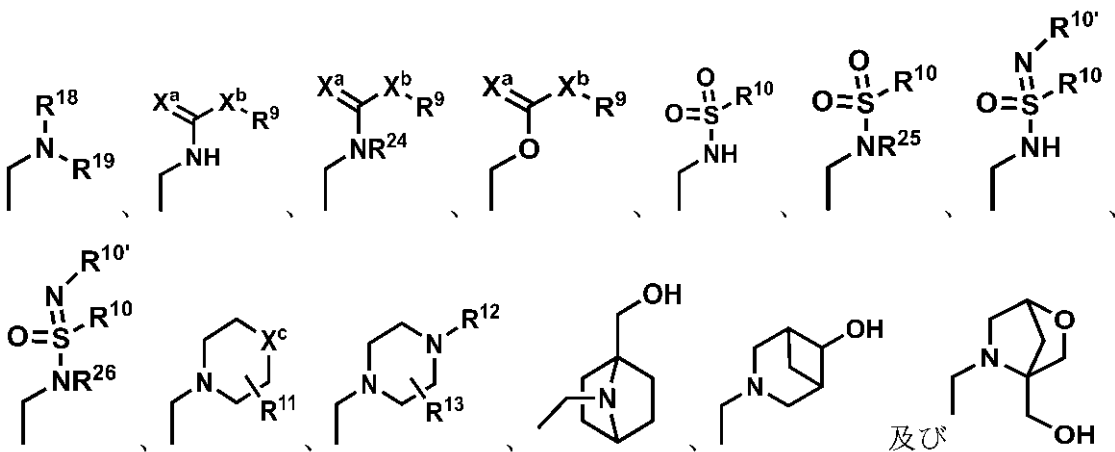
20



-CO₂R⁸、-アリール、-ヘテロアリール、-(C₁~C₆アルキル)-アリール、

【化32】

30



から選択され、

R⁵は、-H、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、-アリール、-ヘテロアリール及び-(C₁~C₆アルキル)-アリールから選択され、

R⁶及びR⁷は、それぞれ独立して、-H、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シク

40

50

ロアルキル、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-R^5$ 、 $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル及び $-C(O)R^{17}$ から選択され、

R^8 は、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、及び $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキルから選択され、

各 R^9 は、独立して、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択され、

各 R^{10} は、独立して、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリール及び

【化33】



10

から選択され、

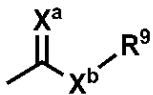
R^{10a} は、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択され、

R^{11} は、 $-H$ 及び $-C_1 \sim C_6$ アルキルから選択され、

R^{12} は、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CO_2R^8$ 、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリール、 $-S(O)_2R^{16}$ 及び

【化34】

20



から選択され、

R^{13} は、 $-H$ 及び $-C_1 \sim C_6$ アルキルから選択され、

R^{14} 及び $R^{14'}$ は、それぞれ独立して、 $-H$ 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、及び $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキルから選択され、

R^{16} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール、及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択され、

30

R^{17} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択され、

R^{18} 及び R^{19} は、それらが結合するN原子と一緒に、ハロゲン、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-R^5$ から選択される0から3個の置換基を有する4、5、6または7員環を形成し、

R^{24} 、 R^{25} 及び R^{26} は、それぞれ $-C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

X^a 及び X^b は、それぞれ独立して、 NH 、 O 及び S から選択され、

X^c は、 O 、 S 及び $S(O)_2$ から選択され、

【化35】

40



は、リンカーLとの結合点を示し、

アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール基はそれぞれ置換されていてもよい、

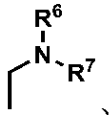
複合体。

【請求項20】

(a) R^{2a} はFであり、及び/または

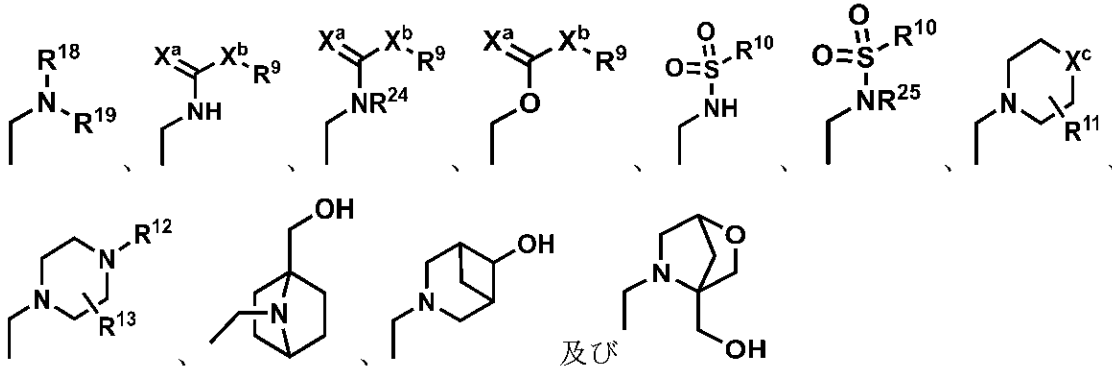
50

(b) R^{20a}は、-H、-C₁~C₆アルキル、-(C₁~C₆アルキル)-O-R⁵、
【化36】



-(C₁~C₆アルキル)-アリール、
【化37】

10

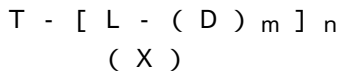


20

から選択される、
請求項19に記載の複合体。

【請求項21】

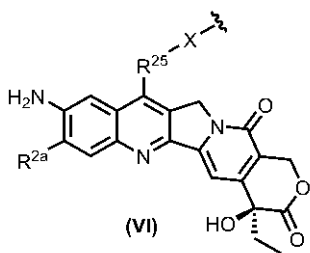
式(X)：



を有する複合体であって、式中、
Tは、標的化部分であり、
Lは、リンカーであり、
mは、1から4の間の整数であり、
nは、1から10の間の整数であり、
Dは、式(VI)：

30

【化38】



40

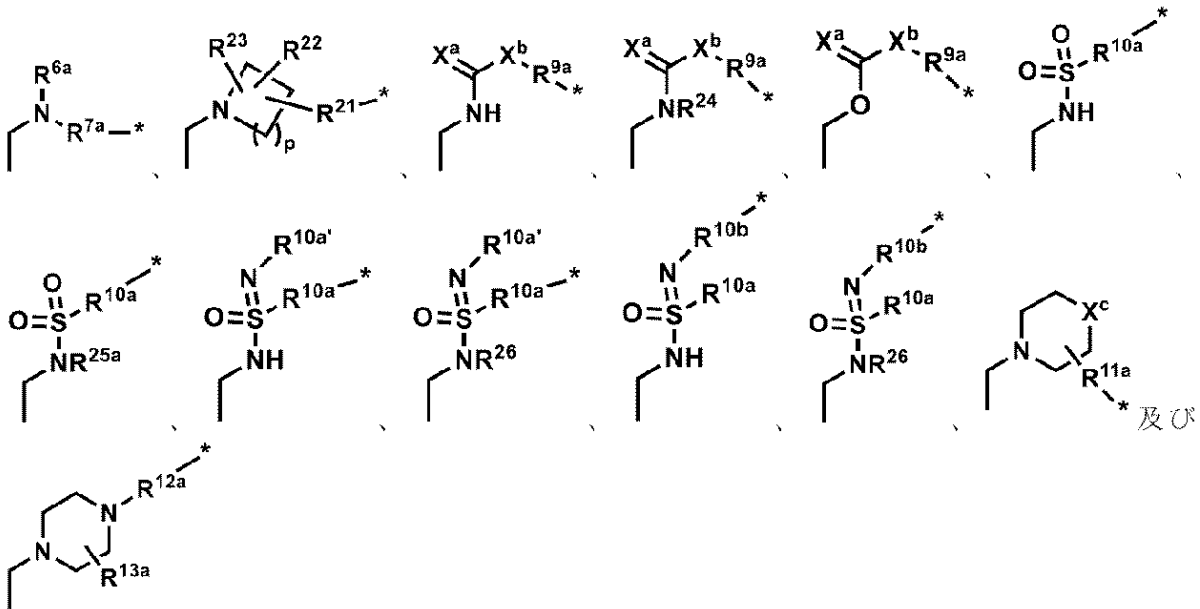
の化合物であり、式中、

R^{2a}は、-CH₃、-CF₃、-F、-Br、-Cl、-OCH₃及び-OCF₃から
選択され、

Xは、-O-、-S-または-NH-であり、R²⁵は、-C₁~C₆アルキル、-(
C₁~C₆アルキル)-O-R^{5a}、-CO₂R^{8a}、-C(O)-、-アリール、-ヘ
テロアリール、-(C₁~C₆アルキル)-アリール、

50

【化 3 9】



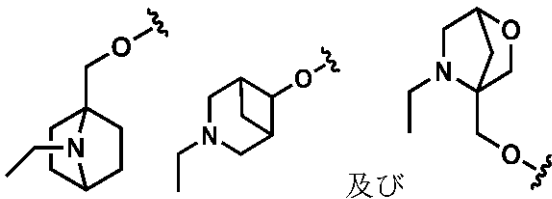
10

から選択され、*は、Xとの結合点であり、pは、1、2、3または4であるか、あるいは

20

Xは、Oであり、R²⁵-X-は、

【化 4 0】



30

から選択され、

R^{5a}は、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、-アリーール、-ヘテロアリーール、及び-(C₁~C₆アルキル)-アリーールから選択され、

R^{6a}は、-H、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、及び-C₃~C₈ヘテロシクロアルキルから選択され、

R^{7a}は、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、-(C₁~C₆アルキル)-O-R^{5a}、-C₃~C₈ヘテロシクロアルキル及び-C(O)R^{17a}から選択され、

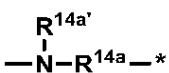
R^{8a}は、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、及び-C₃~C₈ヘテロシクロアルキルから選択され、

40

各R^{9a}は、独立して、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、-アリーール、-ヘテロアリーール及び-(C₁~C₆アルキル)-アリーールから選択されるか、あるいはR^{9a}は、存在せず、X^b=Xであり、

各R^{10a}は、独立して、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、-アリーール、-ヘテロアリーール、-(C₁~C₆アルキル)-アリーール及び

【化 4 1】



50

から選択され、

各 R^{10a} は、独立して、- H、- $C_1 \sim C_6$ アルキル、- $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、- アリール、- ヘテロアリール及び - ($C_1 \sim C_6$ アルキル) - アリールから選択され、

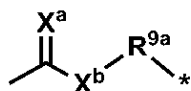
各 R^{10b} は、独立して、- $C_1 \sim C_6$ アルキル、- $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、- アリール、- ヘテロアリール及び - ($C_1 \sim C_6$ アルキル) - アリールから選択され、

R^{11a} は、存在しないか、または - $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

R^{12a} は、- $C_1 \sim C_6$ アルキル、- CO_2R^{8a} 、- アリール、- ヘテロアリール、- ($C_1 \sim C_6$ アルキル) - アリール、- $S(O)_2R^{16a}$ 及び

【化 4 2】

10



から選択され、

R^{13a} は、- H 及び - $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択され、

R^{14a} は、- $C_1 \sim C_6$ アルキル、- $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、及び - $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキルから選択され、

R^{14a} は、H、- $C_1 \sim C_6$ アルキル、- $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、及び - $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキルから選択され、

20

R^{16a} は、- $C_1 \sim C_6$ アルキル、- $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、- アリール、- ヘテロアリール、及び - ($C_1 \sim C_6$ アルキル) - アリールから選択され、

R^{17a} は、- $C_1 \sim C_6$ アルキル、- $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、- $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、- ($C_1 \sim C_6$ アルキル) - $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、- アリール、- ヘテロアリール及び - ($C_1 \sim C_6$ アルキル) - アリールから選択され、

R^{21} は、- $C_1 \sim C_6$ アルキル、- $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル及び - ($C_1 \sim C_6$ アルキル) - $O - R^{5a}$ から選択され、

R^{22} 及び R^{23} は、それぞれ独立して、- H、- ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、及び - $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルから選択され、

30

R^{24} 、 R^{25a} 及び R^{26} は、それぞれ - $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

X^a 及び X^b は、それぞれ独立して、NH、O 及び S から選択され、

X^c は、O、S 及び $S(O)_2$ から選択され、

【化 4 3】



は、リンカー L との結合点を示し、

アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール基はそれぞれ置換されていてもよい、

40

複合体。

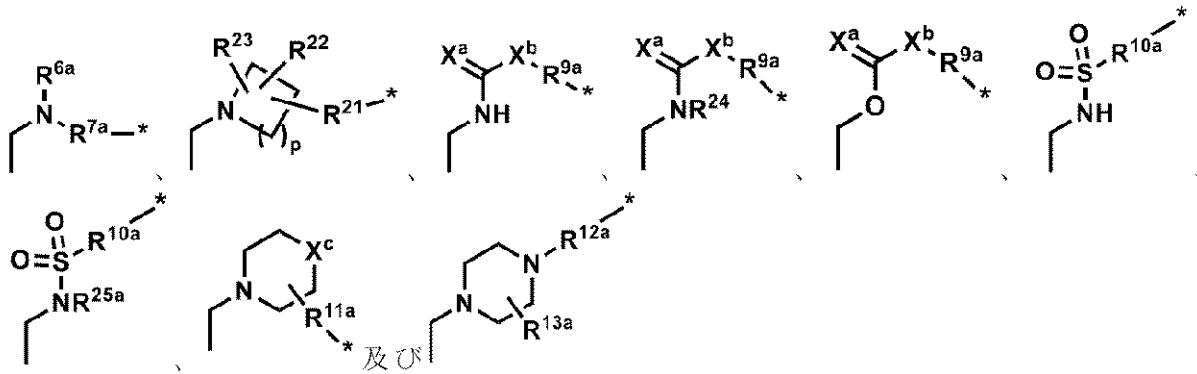
【請求項 2 2】

(a) R^{2a} は F であり、及び / または

(b) X は、- O -、- S - または - NH - であり、 R^{25} は、- $C_1 \sim C_6$ アルキル、- ($C_1 \sim C_6$ アルキル) - $O - R^{5a}$ 、- ($C_1 \sim C_6$ アルキル) - アリール、

50

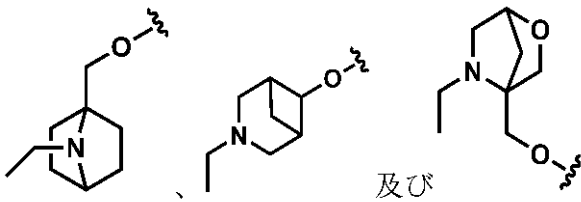
【化 4 4】



10

から選択されるか、あるいは
 (c) XはOであり、R²⁵-X-は、

【化 4 5】



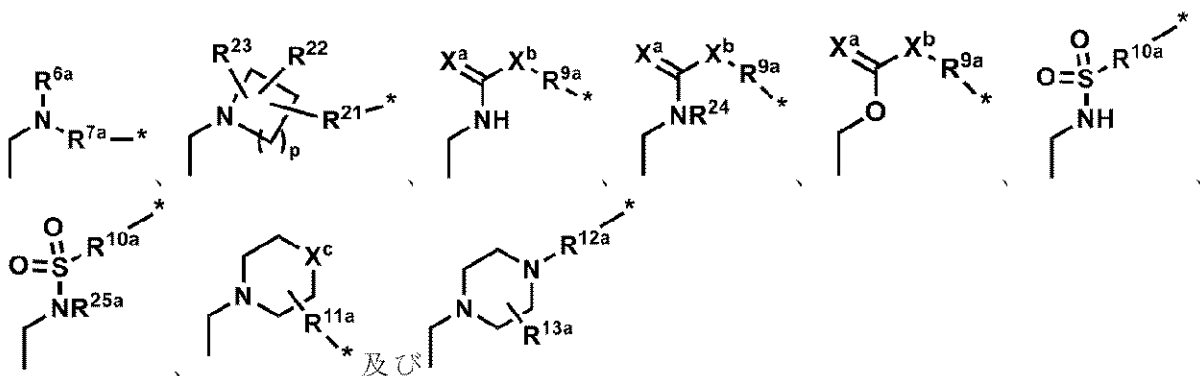
20

から選択される、
 請求項 2 1 に記載の複合体。

【請求項 2 3】

Xは、-O-、-S-または-NH-であり、R²⁵は、-C₁~C₆アルキル、-(C₁~C₆アルキル)-O-R^{5a}、-(C₁~C₆アルキル)-アリール、

【化 4 6】



30

から選択される、請求項 2 1 に記載の複合体。

【請求項 2 4】

アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール基はそれぞれ、

(a) ハロゲン、アシル、アシルオキシ、アルコキシ、カルボキシ、ヒドロキシ、アミノ、アミド、ニトロ、シアノ、アジド、アルキルチオ、チオ、スルホニル、スルホンアミド、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール、または

(b) ハロゲン、アシル、アシルオキシ、アルコキシ、カルボキシ、ヒドロキシ、アミノ、アミド、ニトロ、シアノ、アジド、アルキルチオ、チオ、スルホニル及びスルホンアミ

40

50

ド

から選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよい、請求項1.6から2.3のいずれか1項に記載の複合体。

【請求項2.5】

(a) mは1または2であり、及び/または

(b) nは2から8の間である、

請求項1.5から2.3のいずれか1項に記載の複合体。

【請求項2.6】

Lは、切断可能なリンカーまたはプロテアーゼ切断可能なリンカーである、請求項1.5から2.3のいずれか1項に記載の複合体。

【請求項2.7】

Lは、ジペプチド、トリペプチドまたはテトラペプチドを含む、請求項2.6に記載の複合体。

【請求項2.8】

(a) Tは、腫瘍関連抗原に結合し、及び/または

(b) Tは、抗体または抗原結合抗体フラグメントであり、及び/または

(c) Tは、二重特異性抗体または多重特異性抗体である、

請求項1.5から2.3のいずれか1項に記載の複合体。

【請求項2.9】

請求項1から1.4のいずれか1項に記載の化合物、または請求項1.5から2.8のいずれか1項に記載の複合体、及び医薬的に許容される担体または希釈剤を含む、医薬組成物。

【請求項3.0】

がん、自己免疫疾患またはウイルス感染症の治療用の医薬の製造における請求項1から1.4のいずれか1項に記載の化合物または請求項1.5から2.8のいずれか1項に記載の複合体の使用。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

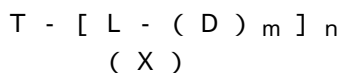
【補正対象項目名】0014

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0014】

本開示の別の態様は、式(X)：



を有する複合体であって、式中、

Tは、標的化部分であり、

Lは、リンカーであり、

mは、1から4の間の整数であり、

nは、1から10の間の整数であり、

Dは、式(IV)：

10

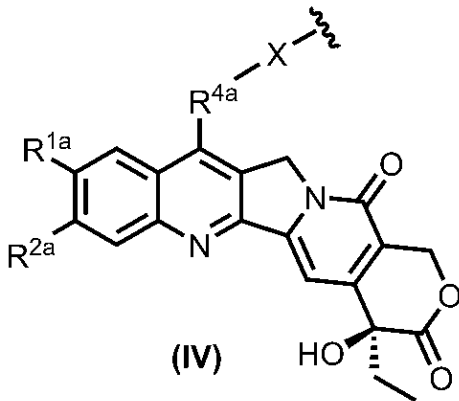
20

30

40

50

【化5】



10

の化合物であり、式中、

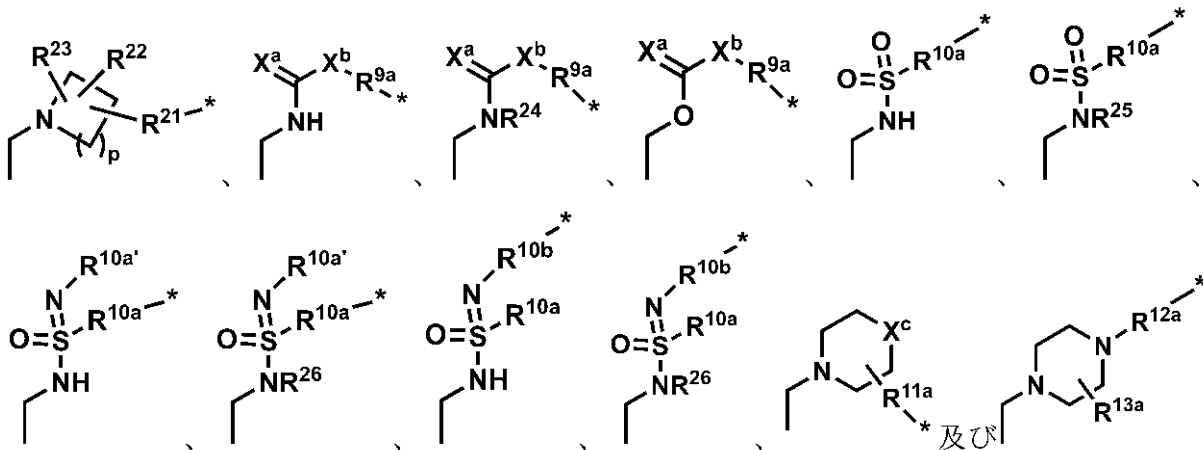
R^{1a} は、 $-H$ 、 $-CH_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-F$ 、 $-Br$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCF_3$ 及び $-NH_2$ から選択され、

R^{2a} は、 $-H$ 、 $-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-F$ 、 $-Br$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 及び $-OCF_3$ から選択され、

20

X は、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NH-$ であり、 R^{4a} は、

【化6】



30

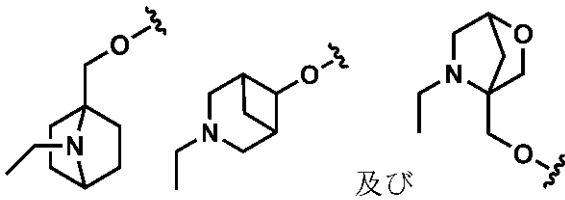
から選択され、 $*$ は、 X との結合点であり、 p は、 1 、 2 、 3 または 4 であるか、あるいは

40

X は、 O であり、 $R^{4a} - X -$ は、

50

【化 7】



10

から選択され、

R^{5a} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール、及び $- (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) -$ アリールから選択され、

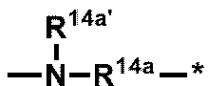
R^{8a} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、及び $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキルから選択され、

各 R^{9a} は、独立して、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $- (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) -$ アリールから選択されるか、あるいは R^{9a} は、存在せず、 $X^b = X$ であり、

各 R^{10a} は、独立して、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール、 $- (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) -$ アリール及び

20

【化 8】



から選択され、

各 R^{10a} は、独立して、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $- (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) -$ アリールから選択され、

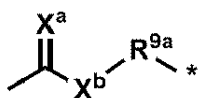
30

各 R^{10b} は、独立して、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $- (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) -$ アリールから選択され、

R^{11a} は、存在しないか、または $-C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

R^{12a} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CO_2R^{8a}$ 、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール、 $- (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) -$ アリール、 $-S(O)_2R^{16a}$ 及び

【化 9】



40

から選択され、

R^{13a} は、 $-H$ 及び $-C_1 \sim C_6$ アルキルから選択され、

R^{14a} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、及び $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキルから選択され、

$R^{14a'}$ は、 H 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、及び $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキルから選択され、

R^{16a} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール、及び $- (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) -$ アリールから選択され、

R^{21} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル及び $- (C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) - O - R^{5a}$ から選択され、

50

R^{22} 及び R^{23} は、それぞれ独立して、-H、-ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、及び $C_3 \sim C_8$ シクロアルキルから選択され、

R^{24} 、 R^{25} 及び R^{26} は、それぞれ $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

X^a 及び X^b は、それぞれ独立して、NH、O 及び S から選択され、

X^c は、O、S 及び $S(O)_2$ から選択され、

【化10】



10

は、リンカー L との結合点を示す、複合体に関する。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

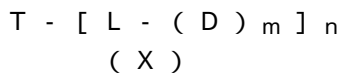
【補正対象項目名】0015

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0015】

本開示の別の態様は、式(X)：



20

を有する複合体であって、式中、

T は、標的化部分であり、

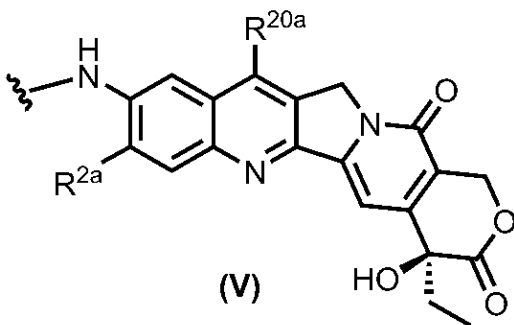
L は、リンカーであり、

m は、1 から 4 の間の整数であり、

n は、1 から 10 の間の整数であり、

D は、式(V)：

【化11】



30

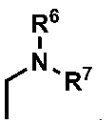
の化合物であり、式中、

R^{2a} は、-CH₃、-CF₃、-F、-Br、-Cl、-OH、-OCH₃ 及び -OCF₃ から選択され、

40

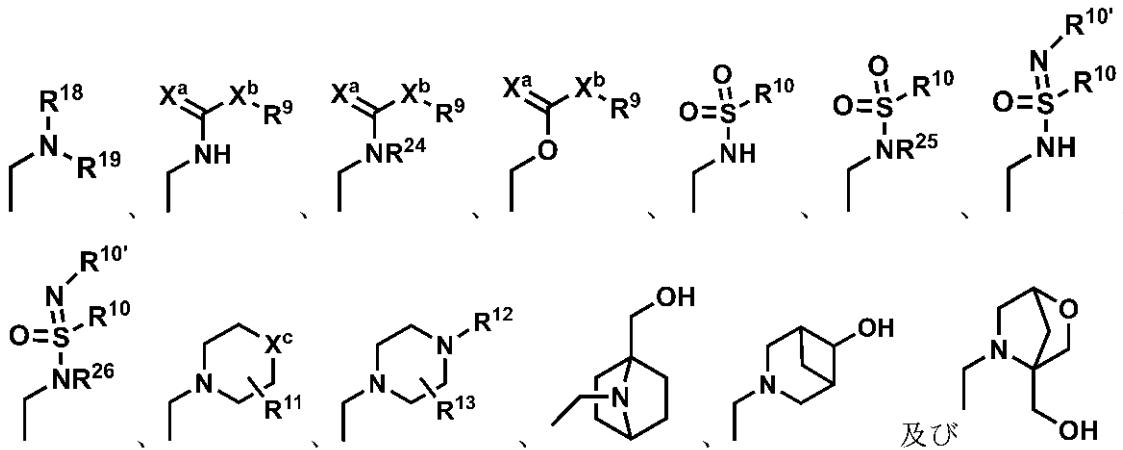
R^{20a} は、-H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $(C_1 \sim C_6$ アルキル)-O-R⁵、

【化12】



50

- CO₂R⁸、- アリール、- ヘテロアリール、- (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリール、
【化 1 3】



10

から選択され、

R⁵ は、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- アリール、-
ヘテロアリール及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

R⁶ 及び R⁷ は、それぞれ独立して、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シク
ロアルキル、- (C₁ ~ C₆ アルキル) - O - R⁵、- C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキル
及び - C(O)R¹⁷ から選択され、

20

R⁸ は、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、及び - C₃ ~ C₈
ヘテロシクロアルキルから選択され、

各 R⁹ は、独立して、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、-
アリール、- ヘテロアリール及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

各 R¹⁰ は、独立して、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- アリ
ール、- ヘテロアリール、- (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリール及び

【化 1 4】



30

から選択され、

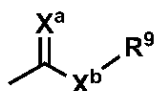
R¹⁰ は、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- アリール、
- ヘテロアリール及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

R¹¹ は、- H 及び - C₁ ~ C₆ アルキルから選択され、

R¹² は、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- CO₂R⁸、- アリール、- ヘテロアリ
ール、- (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリール、- S(O)₂R¹⁶ 及び

【化 1 5】

40



から選択され、

R¹³ は、- H 及び - C₁ ~ C₆ アルキルから選択され、

R¹⁴ 及び R^{14'} は、それぞれ独立して、- H、C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シ
クロアルキル、及び - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキルから選択され、

R¹⁶ は、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- アリール、- ヘテ
ロアリール、及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

50

R^{17} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) - C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) -$ アリールから選択され、

R^{18} 及び R^{19} は、それらが結合する N 原子と一緒に、ハロゲン、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) - O - R^5$ から選択される 0 から 3 個の置換基を有する 4、5、6 または 7 員環を形成し、

R^{24} 、 R^{25} 及び R^{26} は、それぞれ $-C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

X^a 及び X^b は、それぞれ独立して、NH、O 及び S から選択され、

X^c は、O、S 及び $S(O)_2$ から選択され、

【化 16】

10



は、リンカー L との結合点を示す、複合体に関する。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0263

【補正方法】変更

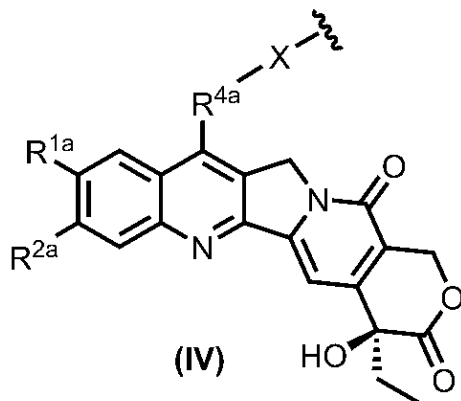
【補正の内容】

20

【0263】

本開示の特定の実施形態は、式 (X) を有する複合体に関し、D は、式 (IV) :

【化 68】



30

の化合物であり、式中、

R^{1a} は、 $-H$ 、 $-CH_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-F$ 、 $-Br$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCF_3$ 及び $-NH_2$ から選択され、

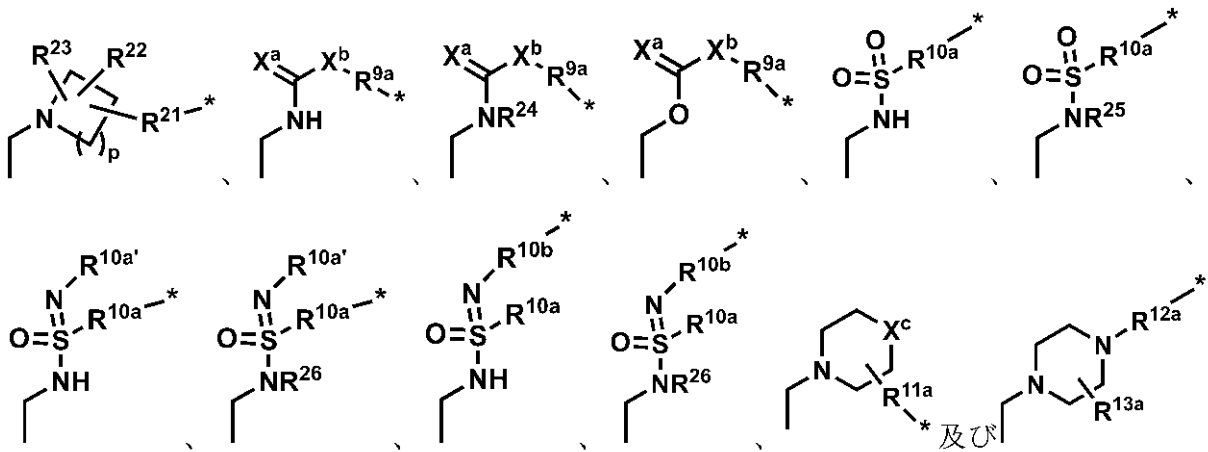
R^{2a} は、 $-H$ 、 $-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-F$ 、 $-Br$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 及び $-OCF_3$ から選択され、

40

X は、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NH-$ であり、 R^{4a} は、

50

【化 6 9】



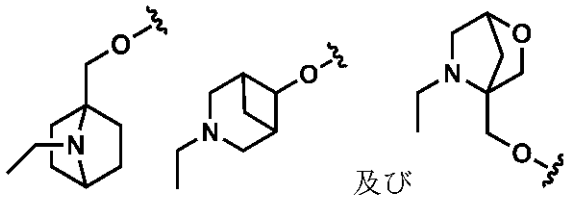
10

から選択され、*は、Xとの結合点であり、pは、1、2、3または4であるか、あるいは

Xは、Oであり、 $R^{4a} - X -$ は、

【化 7 0】

20



から選択され、

R^{5a} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリーール、 $-$ ヘテロアリーール、及び $-(C_1 \sim C_6$ アルキル) $-$ アリーールから選択され、

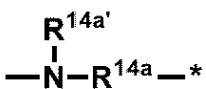
30

R^{8a} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、及び $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキルから選択され、

各 R^{9a} は、独立して、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリーール、 $-$ ヘテロアリーール及び $-(C_1 \sim C_6$ アルキル) $-$ アリーールから選択されるか、あるいは R^{9a} は、存在せず、 $X^b = X$ であり、

各 R^{10a} は、独立して、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリーール、 $-$ ヘテロアリーール、 $-(C_1 \sim C_6$ アルキル) $-$ アリーール及び

【化 7 1】



40

から選択され、

各 $R^{10a'}$ は、独立して、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリーール、 $-$ ヘテロアリーール及び $-(C_1 \sim C_6$ アルキル) $-$ アリーールから選択され、

各 R^{10b} は、独立して、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリーール、 $-$ ヘテロアリーール及び $-(C_1 \sim C_6$ アルキル) $-$ アリーールから選択され、

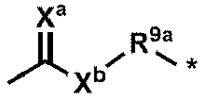
R^{11a} は、存在しないか、または $-C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

R^{12a} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CO_2R^{8a}$ 、 $-$ アリーール、 $-$ ヘテロアリーール、

50

- (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリール、 - S(O)₂R^{16a} 及び

【化72】



から選択され、

R^{13a} は、 - H 及び - C₁ ~ C₆ アルキルから選択され、

R^{14a} は、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 及び - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキルから選択され、

10

R^{14a'} は、 H、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 及び - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキルから選択され、

R^{16a} は、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 - アリール、 - ヘテロアリール、 及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

R²¹ は、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - O - R^{5a} から選択され、

R²² 及び R²³ は、それぞれ独立して、 - H、 - ハロゲン、 C₁ ~ C₆ アルキル、 及び - C₃ ~ C₈ シクロアルキルから選択され、

R²⁴、 R²⁵ 及び R²⁶ は、それぞれ - C₁ ~ C₆ アルキルであり、

X^a 及び X^b は、それぞれ独立して、 NH、 O 及び S から選択され、

20

X^c は、 O、 S 及び S(O)₂ から選択され、

【化73】



は、リンカー L との結合点を示す。

【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0284

30

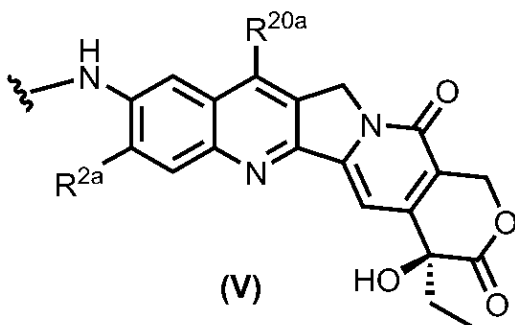
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0284】

本開示の特定の実施形態は、式(X)を有する複合体に関し、Dは、式(V)：

【化77】



40

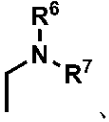
の化合物であり、式中、

R^{2a} は、 - CH₃、 - CF₃、 - F、 - Br、 - Cl、 - OH、 - OCH₃ 及び - OCF₃ から選択され、

R^{20a} は、 - H、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 - (C₁ ~ C

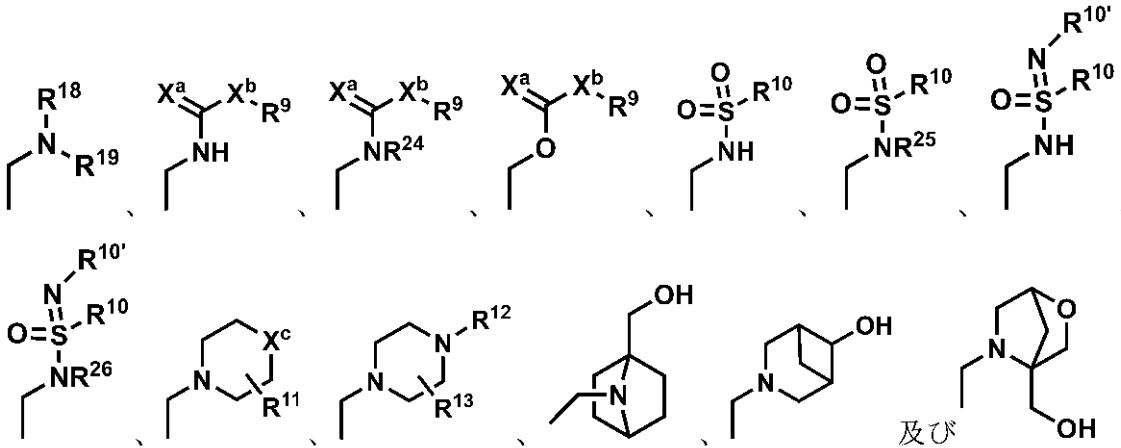
50

6 アルキル) - O - R⁵、
【化 7 8】



- CO₂R⁸、- アリール、- ヘテロアリール、- (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリール、
【化 7 9】

10



20

から選択され、

R⁵ は、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- アリール、- ヘテロアリール及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

R⁶ 及び R⁷ は、それぞれ独立して、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- (C₁ ~ C₆ アルキル) - O - R⁵、- C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキル及び - C(O)R¹⁷ から選択され、

30

R⁸ は、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、及び - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキルから選択され、

各 R⁹ は、独立して、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- アリール、- ヘテロアリール及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

各 R¹⁰ は、独立して、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- アリール、- ヘテロアリール、- (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリール及び

【化 8 0】



40

から選択され、

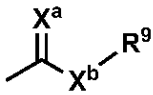
各 R¹⁰ は、独立して、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- アリール、- ヘテロアリール及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

R¹¹ は、- H 及び - C₁ ~ C₆ アルキルから選択され、

R¹² は、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- CO₂R⁸、- アリール、- ヘテロアリール、- (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリール、- S(O)₂R¹⁶ 及び

50

【化 8 1】



から選択され、

R^{13} は、- H 及び - $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択され、

R^{14} 及び $R^{14'}$ は、それぞれ独立して、- H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、- $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、及び - $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキルから選択され、

10

R^{16} は、- $C_1 \sim C_6$ アルキル、- $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、- アリール、- ヘテロアリール、及び - ($C_1 \sim C_6$ アルキル) - アリールから選択され、

R^{17} は、- $C_1 \sim C_6$ アルキル、- $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、- $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、- ($C_1 \sim C_6$ アルキル) - $C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、- アリール、- ヘテロアリール及び - ($C_1 \sim C_6$ アルキル) - アリールから選択され、

R^{18} 及び R^{19} は、それらが結合する N 原子と一緒に、ハロゲン、- $C_1 \sim C_6$ アルキル、- $C_3 \sim C_8$ シクロアルキル及び - ($C_1 \sim C_6$ アルキル) - O - R^5 から選択される 0 から 3 個の置換基を有する 4、5、6、または 7 員環を形成し、

R^{24} 、 R^{25} 及び R^{26} は、それぞれ - $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

X^a 及び X^b は、それぞれ独立して、N、O 及び S から選択され、

20

X^c は、O、S 及び S(O)₂ から選択され、

【化 8 2】



は、リンカー L との結合点を示す。

【手続補正 6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0315

30

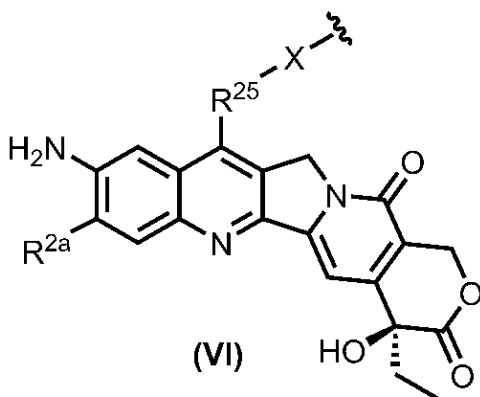
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0315】

本開示の特定の実施形態は、式 (X) を有する複合体に関し、D は、式 (VI) :

【化 9 3】



40

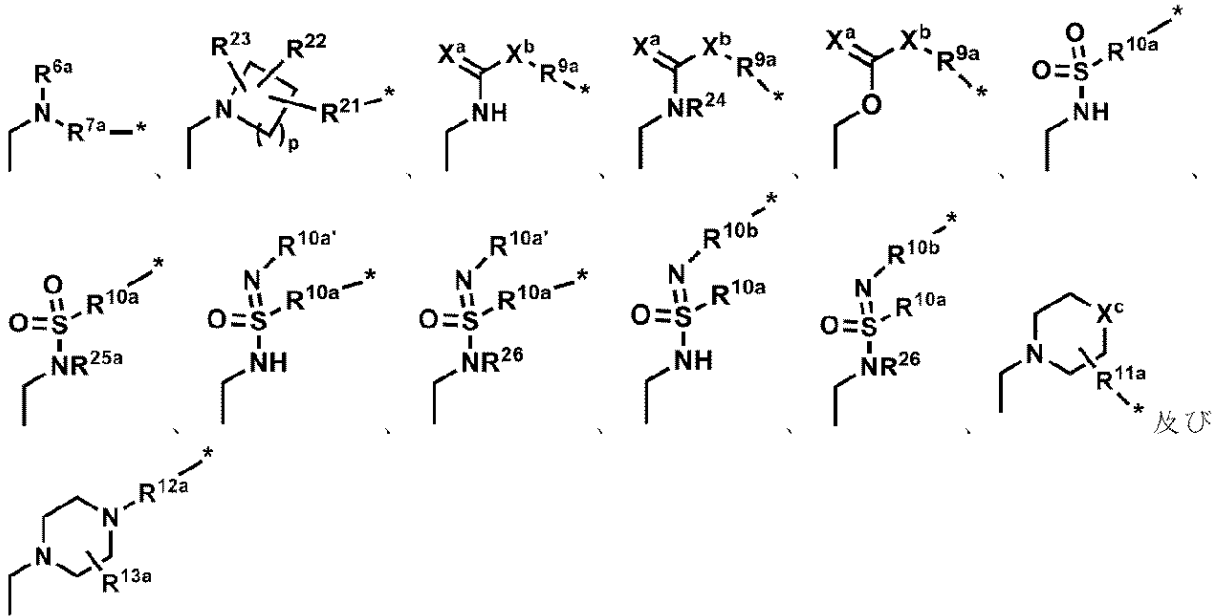
の化合物であり、式中、

R^{2a} は、- H、- CH_3 、- CF_3 、- F、- Br、- Cl、- OH、- OCH_3 及

50

び - OCF₃ から選択され、

X は、 - O - 、 - S - または - NH - であり、 R²⁵ は、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - (C₁ ~ C₆ アルキル) - O - R^{5a}、 - CO₂R^{8a}、 - C(O) - 、 - アリール、 - ヘテロアリール、 - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリール、
【化 9 4】



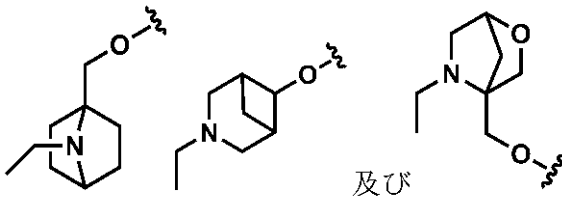
10

20

から選択され、* は、X との結合点であり、p は、1、2、3 または 4 であるか、あるいは

X は、O であり、R²⁵ - X - は、

【化 9 5】



30

から選択され、

R^{5a} は、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 - アリール、 - ヘテロアリール、 及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリール から選択され、

R^{6a} は、 - H、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 及び - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキル から選択され、

R^{7a} は、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 - (C₁ ~ C₆ アルキル) - O - R^{5a}、 - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキル 及び - C(O)R^{17a} から選択され、

40

R^{8a} は、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 及び - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキル から選択され、

各 R^{9a} は、独立して、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 - アリール、 - ヘテロアリール 及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリール から選択されるか、あるいは R^{9a} は、存在せず、X^b = X であり、

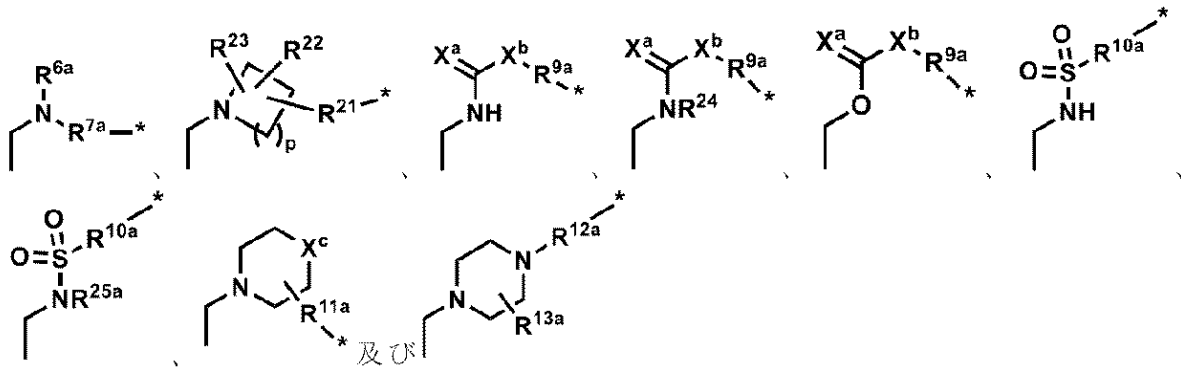
各 R^{10a} は、独立して、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 - アリール、 - ヘテロアリール、 - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリール 及び

50

【0320】

いくつかの実施形態では、式(VI)の化合物において、Xは、-O-、-S-または-NH-であり、R²⁵は、-C₁~C₆アルキル、-(C₁~C₆アルキル)-O-R^{5a}、-(C₁~C₆アルキル)-アリール、

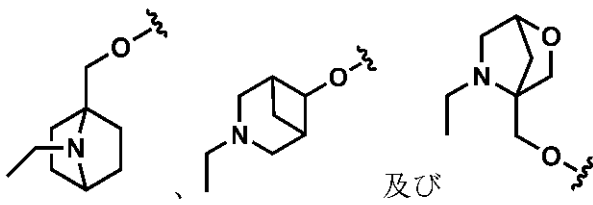
【化99】



10

から選択されるか、あるいはXはOであり、R²⁵-X-は、

【化100】



20

から選択される。

【手続補正8】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0321

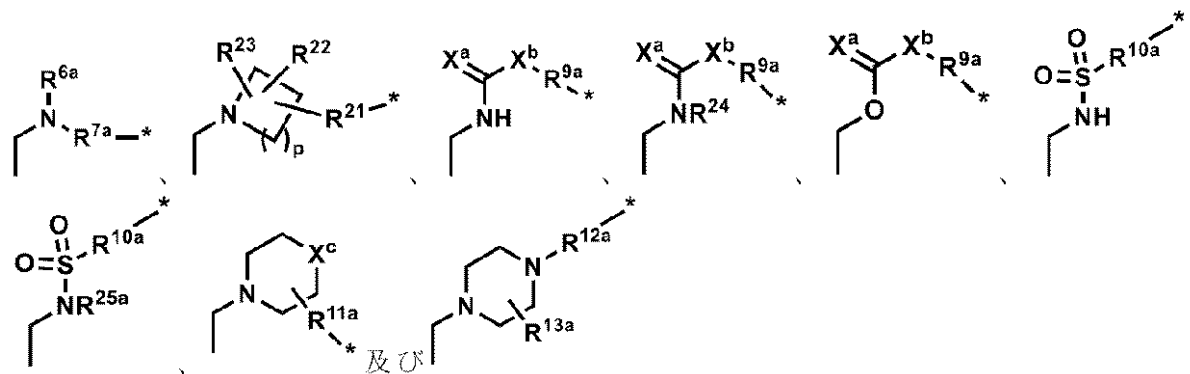
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0321】

いくつかの実施形態では、式(VI)の化合物において、Xは、-O-、-S-または-NH-であり、R²⁵は、-C₁~C₆アルキル、-(C₁~C₆アルキル)-O-R^{5a}、-(C₁~C₆アルキル)-アリール、

【化101】



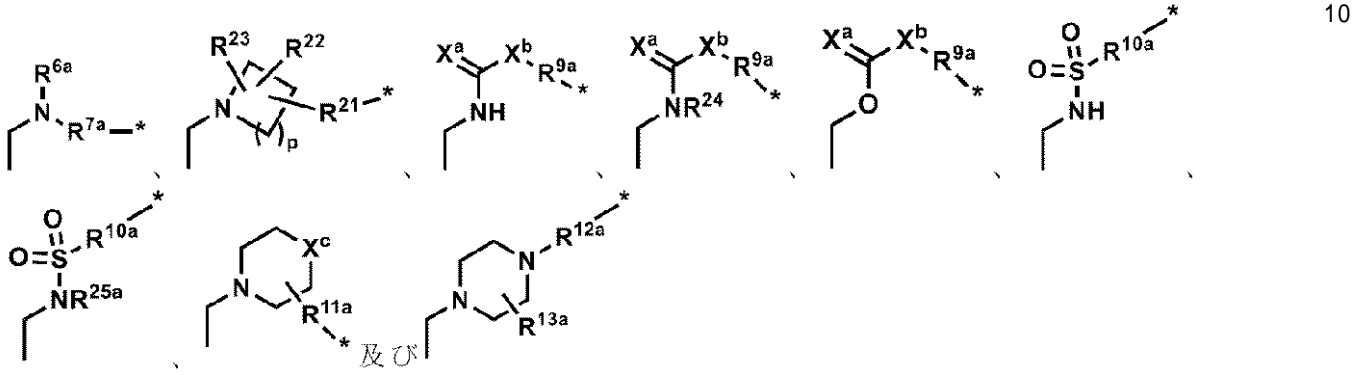
40

から選択される。

【手続補正9】

50

【補正対象書類名】明細書
 【補正対象項目名】0322
 【補正方法】変更
 【補正の内容】
 【0322】
 いくつかの実施形態では、式(VI)の化合物において、Xは、-O-、-S-または
 -NH-であり、R²⁵は、-C₁~C₆アルキル、-(C₁~C₆アルキル)-O-R^{5a}、
 【化102】

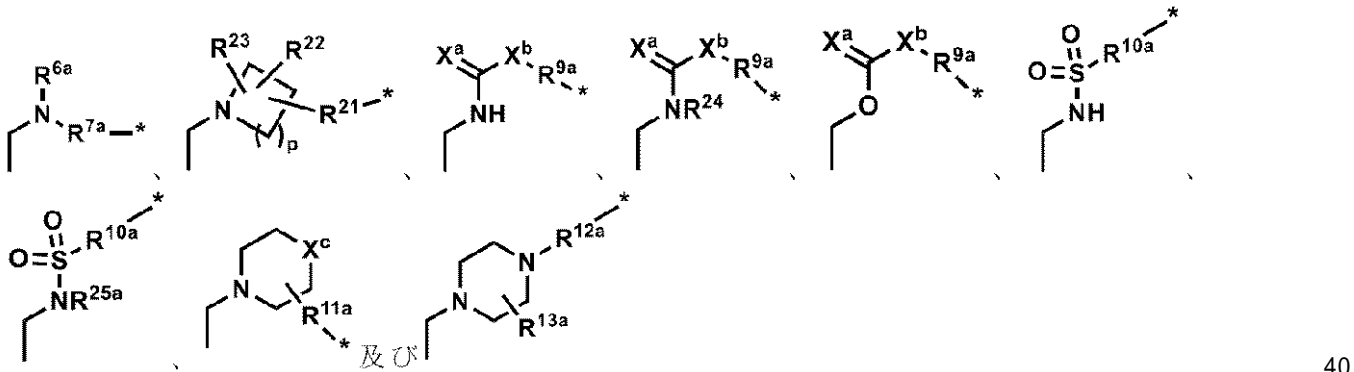


10

20

から選択される。

【手続補正10】
 【補正対象書類名】明細書
 【補正対象項目名】0323
 【補正方法】変更
 【補正の内容】
 【0323】
 いくつかの実施形態では、式(VI)の化合物において、Xは、-O-、-S-または
 -NH-であり、R²⁵は、
 【化103】



30

40

から選択される。

【手続補正11】
 【補正対象書類名】明細書
 【補正対象項目名】0897
 【補正方法】変更
 【補正の内容】
 【0897】

当業者には明らかであろう、本明細書に記載される特定の実施形態の改変は、以下の特許請求の範囲内に含まれることが意図される。

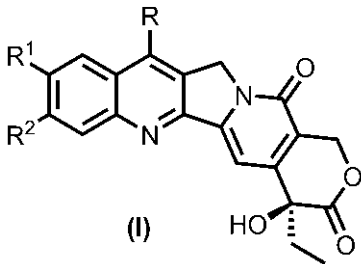
50

本発明は、以下の態様および実施形態を含む。

[項 1]

式 (I) :

【 化 2 7 4 】



10

を有する化合物であって、

式中、

R^1 は、 $-H$ 、 $-CH_3$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-F$ 、 $-Br$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCF_3$ 及び $-NH_2$ から選択され、

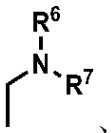
R^2 は、 $-H$ 、 $-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-F$ 、 $-Br$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 及び $-OCF_3$ から選択され、

R^1 が $-NH_2$ である場合、 R は R^3 または R^4 であり、 R^1 が $-NH_2$ 以外である場合、 R は R^4 であり、

R^3 は、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-(C_1 \sim C_6$ アルキル) $-O-R^5$ 、

20

【 化 2 7 5 】

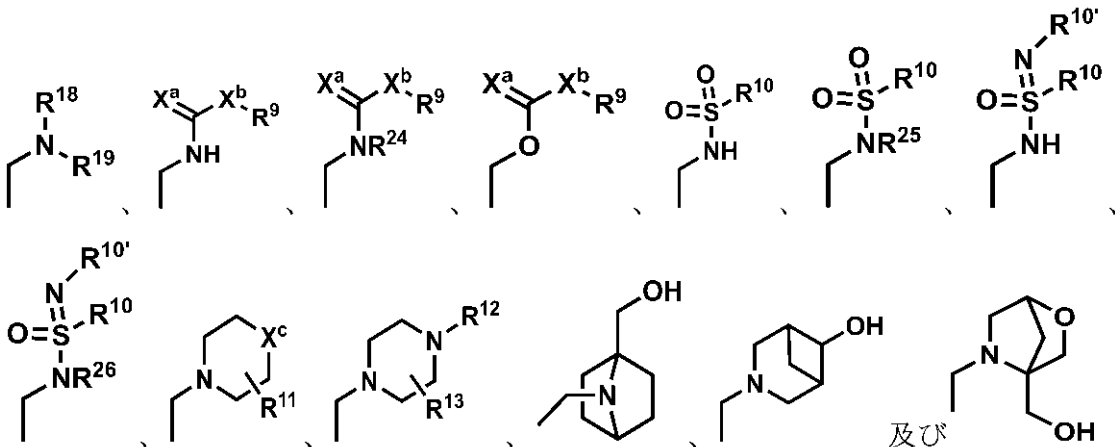


30

$-CO_2R^8$ 、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $-(C_1 \sim C_6$ アルキル) $-$ アリールから選択され、

R^4 は、

【 化 2 7 6 】



40

から選択され、

R^5 は、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$

50

ヘテロアリール、-アリール及び-(C₁~C₆アルキル)-アリールから選択され、

R⁶及びR⁷は、それぞれ独立して、-H、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、-(C₁~C₆アルキル)-O-R⁵、-C₃~C₈ヘテロシクロアルキル及び-C(O)R¹⁷から選択され、

R⁸は、-H、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、及び-C₃~C₈ヘテロシクロアルキルから選択され、

各R⁹は、独立して、-H、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、-アリール、-ヘテロアリール及び-(C₁~C₆アルキル)-アリールから選択され、

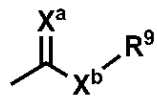
各R¹⁰は、独立して、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、-NR¹⁴R^{14'}、-アリール、-ヘテロアリール及び-(C₁~C₆アルキル)-アリールから選択され、

各R^{10'}は、独立して、-H、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、-アリール、-ヘテロアリール及び-(C₁~C₆アルキル)-アリールから選択され、

R¹¹は、-H及び-C₁~C₆アルキルから選択され、

R¹²は、-H、-C₁~C₆アルキル、-CO₂R⁸、-アリール、-ヘテロアリール、-(C₁~C₆アルキル)-アリール、-S(O)₂R¹⁶及び

【化277】



から選択され、

R¹³は、-H及び-C₁~C₆アルキルから選択され、

R¹⁴及びR^{14'}は、それぞれ独立して、-H、C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、及び-C₃~C₈ヘテロシクロアルキルから選択され、

R¹⁶は、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、-アリール、-ヘテロアリール、及び-(C₁~C₆アルキル)-アリールから選択され、

R¹⁷は、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、-C₃~C₈ヘテロシクロアルキル、-(C₁~C₆アルキル)-C₃~C₈ヘテロシクロアルキル、-アリール、-ヘテロアリール及び-(C₁~C₆アルキル)-アリールから選択され、

R¹⁸及びR¹⁹は、それらが結合するN原子と一緒に、ハロゲン、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル及び-(C₁~C₆アルキル)-O-R⁵から選択される0から3個の置換基を有する4、5、6または7員環を形成し、

R²⁴、R²⁵及びR²⁶は、それぞれ-C₁~C₆アルキルであり、

X^a及びX^bは、それぞれ独立して、NH、O及びSから選択され、

X^cは、O、S及びS(O)₂から選択され、

ただし、前記化合物は、(S)-9-アミノ-11-ブチル-4-エチル-4-ヒドロキシ-1,12-ジヒドロ-14H-ピラノ[3',4':6,7]インドリジノ[1,2-b]キノリン-3,14(4H)-ジオン以外である、前記化合物またはその医薬的に許容される塩もしくは保護型。

[項2]

R¹はNH₂であり、Rは、R³またはR⁴である、項1に記載の化合物。

[項3]

R²は-H以外である、項2に記載の化合物。

[項4]

R¹は、-H、-CH₃、-CHF₂、-CF₃、-F、-Br、-Cl、-OH、-OCH₃及び-OCF₃から選択され、RはR⁴である、項1に記載の化合物。

[項5]

R²は、-H、-CH₃、-CF₃、-F、-Cl、-OCH₃及び-OCF₃から選

10

20

30

40

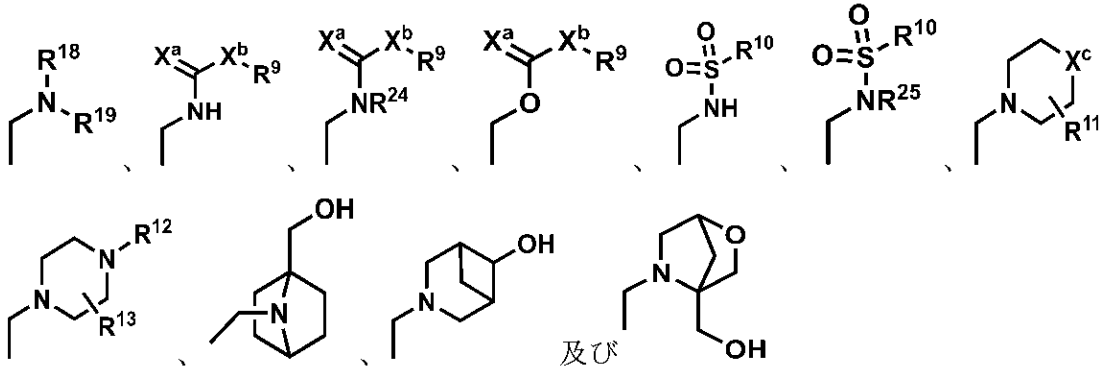
50

択される、項 1 または 4 に記載の化合物。

[項 6]

R⁴ は、

【化 2 7 8】



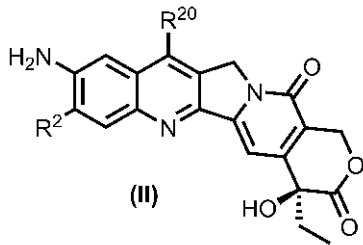
10

から選択される、項 1 から 4 のいずれかに記載の化合物。

[項 7]

式 (I I) :

【化 2 7 9】



20

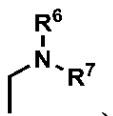
を有する化合物であって、

式中、

R² は、- H、- CH₃、- CF₃、- F、- Br、- Cl、- OH、- OCH₃ 及び - OCF₃ から選択され、

R²⁰ は、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- (C₁ ~ C₆ アルキル) - O - R⁵、

【化 2 8 0】

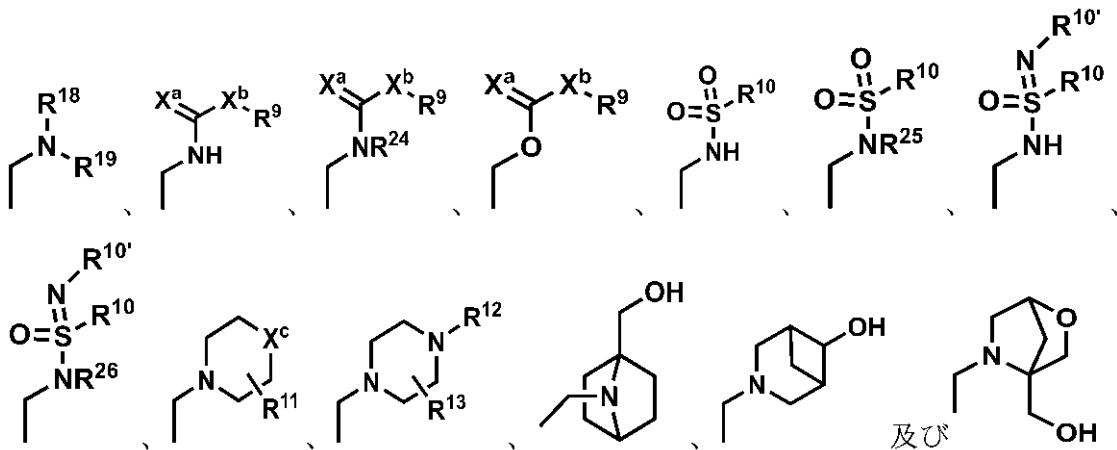


40

- CO₂R⁸、- アリール、- ヘテロアリール、- (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリール、

50

【化 2 8 1】



10

から選択され、

R^5 は、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択され、

R^6 及び R^7 は、それぞれ独立して、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-R^5$ 、 $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル及び $-C(O)R^{17}$ から選択され、

20

R^8 は、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、及び $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキルから選択され、

各 R^9 は、独立して、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択され、

各 R^{10} は、独立して、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-NR^{14}$ 、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択され、

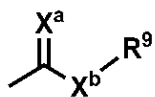
各 $R^{10'}$ は、独立して、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択され、

30

R^{11} は、 $-H$ 及び $-C_1 \sim C_6$ アルキルから選択され、

R^{12} は、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CO_2R^8$ 、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリール、 $-S(O)_2R^{16}$ 及び

【化 2 8 2】



から選択され、

40

R^{13} は、 $-H$ 及び $-C_1 \sim C_6$ アルキルから選択され、

R^{14} 及び $R^{14'}$ は、それぞれ独立して、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、及び $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキルから選択され、

R^{16} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール、及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択され、

R^{17} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択され、

R^{18} 及び R^{19} は、それらが結合する N 原子と一緒に、ハロゲン、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-R^5$ から選択さ

50

れる 0 から 3 個の置換基を有する 4、5、6、または 7 員環を形成し、

R^{24} 、 R^{25} 及び R^{26} は、それぞれ $-C_1 \sim C_6$ アルキルであり、

X^a 及び X^b は、それぞれ独立して、 NH 、 O 及び S から選択され、

X^c は、 O 、 S 及び $S(O)_2$ から選択される、項 1 に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩もしくは保護型。

[項 8]

R^2 は、 $-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-F$ 、 $-Br$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 及び $-OCF_3$ から選択される、項 7 に記載の化合物。

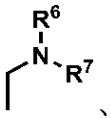
[項 9]

R^2 は、 $-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-F$ 、 $-Cl$ 、 $-OCH_3$ 及び $-OCF_3$ から選択される、項 7 に記載の化合物。

[項 10]

R^{20} は、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-R^5$ 、

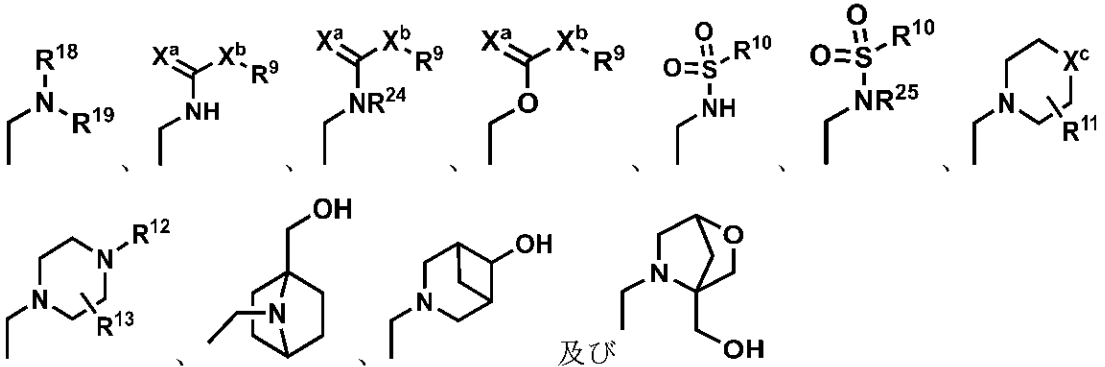
【化 283】



20

$-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ - アリール、

【化 284】



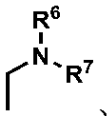
30

から選択される、項 7 から 9 のいずれかに記載の化合物。

[項 11]

R^{20} は、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-O-R^5$ 、

【化 285】

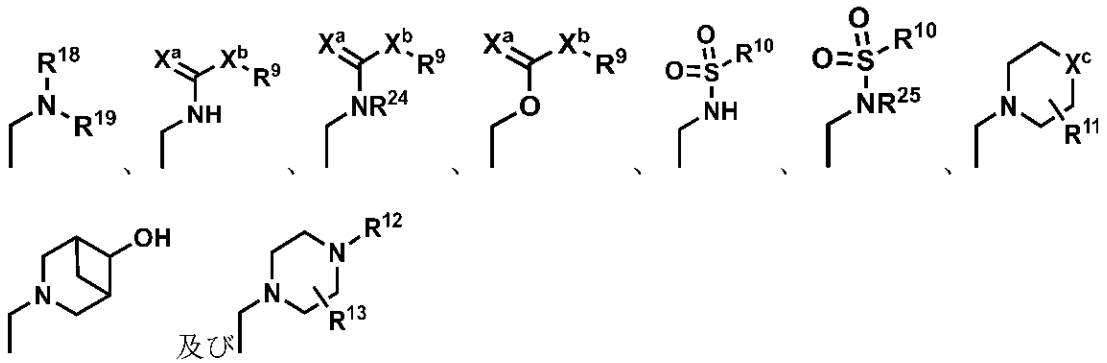


40

$-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})$ - アリール、

50

【化 2 8 6】



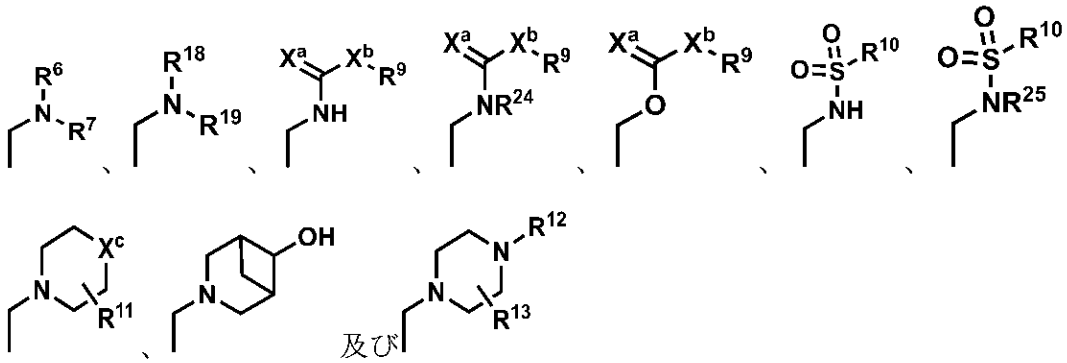
10

から選択される、項 7 から 9 のいずれかに記載の化合物。

[項 1 2]

R^{20} は、- H、- $C_1 \sim C_6$ アルキル、- ($C_1 \sim C_6$ アルキル) - O - R^5 、

【化 2 8 7】



20

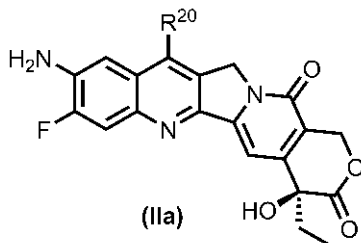
から選択される、項 7 から 9 のいずれかに記載の化合物。

30

[項 1 3]

式 (I I a) :

【化 2 8 8】



40

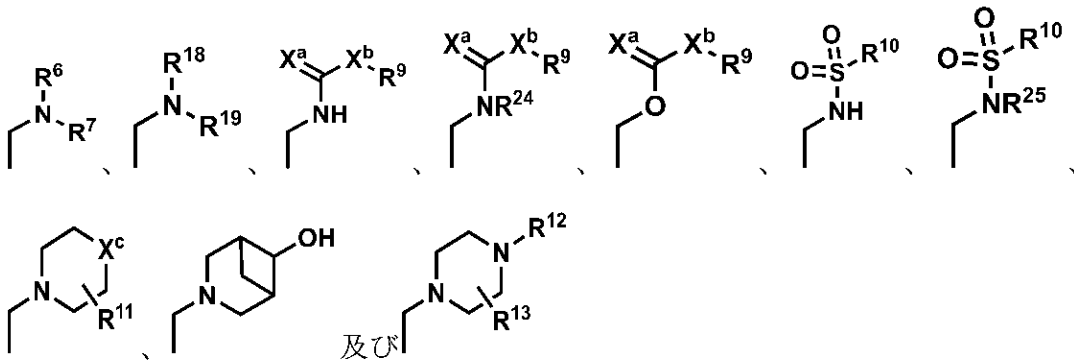
を有し、式中、 R^{20} 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 $R^{10'}$ 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 $R^{14'}$ 、 R^{16} 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} 、 X^a 、 X^b 及び X^c は、項 7 で定義されたとおりである、項 7 に記載の化合物。

[項 1 4]

R^{20} は、- H、- $C_1 \sim C_6$ アルキル、- ($C_1 \sim C_6$ アルキル) - O - R^5 、

50

【化 2 8 9】



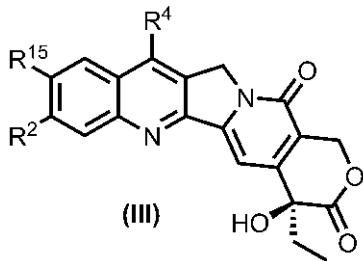
10

から選択される、項 1 3 に記載の化合物。

[項 1 5]

式 (I I I) :

【化 2 9 0】



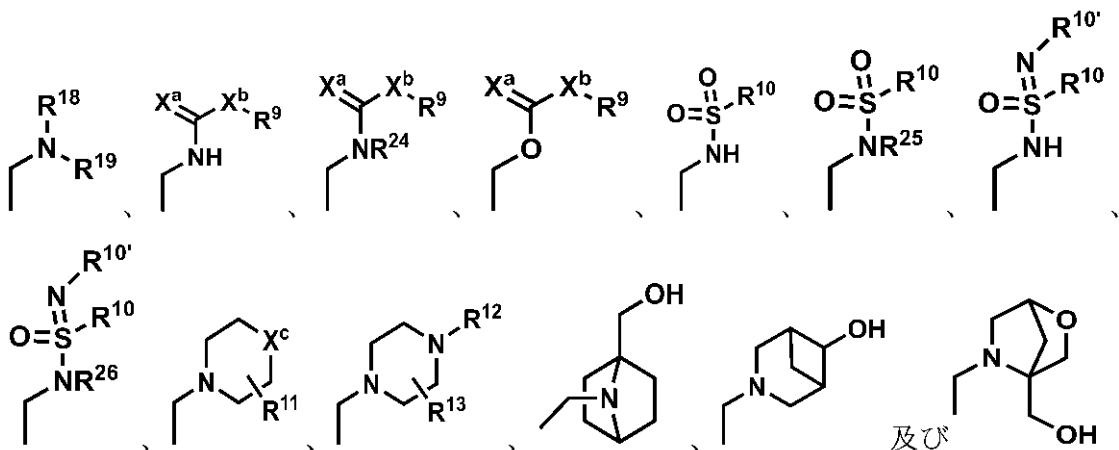
20

を有する化合物であって、
式中、R² は、 - H、 - CH₃、 - CF₃、 - F、 - Br、 - Cl、 - OH、 - OCH₃ 及び
- OCF₃ から選択され、

30

R¹⁵ は、 - H、 - CH₃、 - CHF₂、 - CF₃、 - F、 - Br、 - Cl、 - OH、
- OCH₃ 及び - OCF₃ から選択され、R⁴ は、

【化 2 9 1】



40

から選択され、

R⁵ は、 - H、 - C₁ ~ C₆ アルキル、 - C₃ ~ C₈ シクロアルキル、 - アリール、 -

50

ヘテロアリール及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

R⁸ は、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、及び - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキルから選択され、

各 R⁹ は、独立して、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- アリール、- ヘテロアリール及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

各 R¹⁰ は、独立して、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- NR¹⁴R^{14'}、- アリール、- ヘテロアリール及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

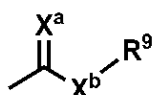
各 R¹⁰ は、独立して、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- アリール、- ヘテロアリール及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

10

R¹¹ は、- H 及び - C₁ ~ C₆ アルキルから選択され、

R¹² は、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- CO₂R⁸、- アリール、- ヘテロアリール、- (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリール、- S(O)₂R¹⁶ 及び

【化 2 9 2】



から選択され、

20

R¹³ は、- H 及び - C₁ ~ C₆ アルキルから選択され、

R¹⁴ 及び R^{14'} は、それぞれ独立して、- H、C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、及び - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキルから選択され、

R¹⁶ は、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- アリール、- ヘテロアリール、及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

R¹⁸ 及び R¹⁹ は、それらが結合する N 原子と一緒に、ハロゲン、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - O - R⁵ から選択される 0 から 3 個の置換基を有する 4、5、6 または 7 員環を形成し、

R²⁴、R²⁵ 及び R²⁶ は、それぞれ - C₁ ~ C₆ アルキルであり、

X^a 及び X^b は、それぞれ独立して、NH、O 及び S から選択され、

30

X^c は、O、S 及び S(O)₂ から選択される、項 1 に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩もしくは保護型。

[項 1 6]

R² は、- H、- F、- Br 及び - Cl から選択される、項 1 5 に記載の化合物。

[項 1 7]

R¹⁵ は、- CH₃、- CF₃、- OCH₃ 及び - OCF₃ から選択される、項 1 5 に記載の化合物。

[項 1 8]

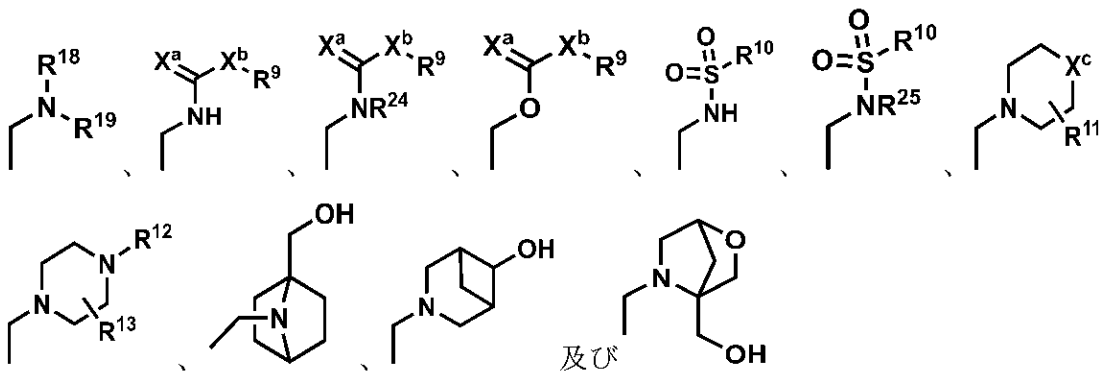
R¹⁵ は、- CH₃ または - OCH₃ である、項 1 5 に記載の化合物。

[項 1 9]

40

R⁴ は、

【化 2 9 3】



10

から選択される、項 1 5 から 1 8 のいずれかに記載の化合物。

[項 2 0]

式 (I I I a) または (I I I b) :

【化 2 9 4】



20

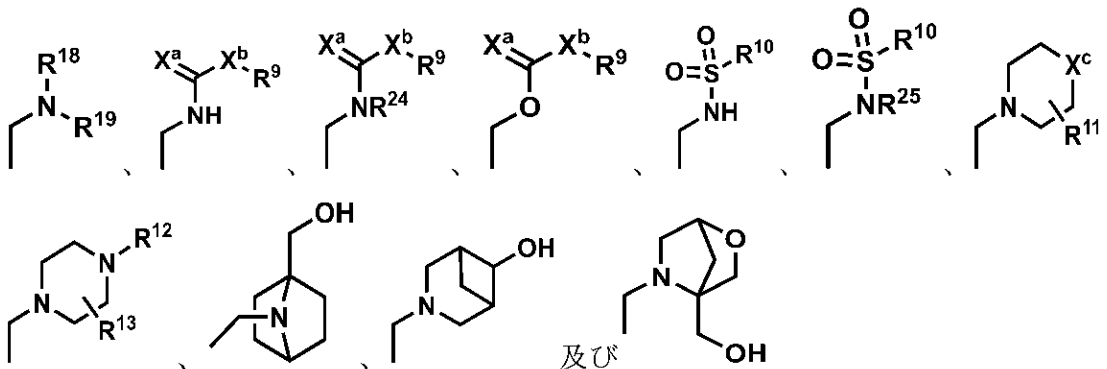
を有し、式中、 R^4 、 R^5 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 $R^{10'}$ 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 $R^{14'}$ 、 R^{16} 、 R^{18} 、 R^{19} 、 X^a 、 X^b 及び X^c は、項 1 5 で定義されたとおりである、項 1 5 に記載の化合物。

30

[項 2 1]

R^4 は、

【化 2 9 5】



40

から選択される、項 2 0 に記載の化合物。

[項 2 2]

アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール基はそれぞれ、任意にハロゲン、アシル、アシルオキシ、アルコキシ、カルボキシ、ヒドロキシ、アミノ、アミド、ニトロ、シアノ、アジド、アルキルチオ、チオ、スルホニル、スル

50

ホンアミド、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で置換される、項1から21のいずれかに記載の化合物。

[項23]

アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール基はそれぞれ、任意にハロゲン、アシル、アシルオキシ、アルコキシ、カルボキシ、ヒドロキシ、アミノ、アミド、ニトロ、シアノ、アジド、アルキルチオ、チオ、スルホニル及びスルホンアミドから選択される1つ以上の置換基で置換される、項1から21のいずれかに記載の化合物。

[項24]

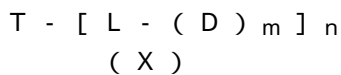
前記化合物は、表1に記載の化合物100から168から選択される、項1に記載の化合物。

[項25]

項1から24のいずれかに記載の化合物、及び医薬的に許容される担体または希釈剤を含む、医薬組成物。

[項26]

式(X)：



を有する複合体であって、式中、

Tは、標的化部分であり、

Lは、リンカーであり、

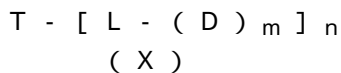
Dは、項1から24のいずれかに記載の化合物であり、

mは、1から4の間の整数であり、

nは、1から10の間の整数である、前記複合体。

[項27]

式(X)：



を有する複合体であって、式中、

Tは、標的化部分であり、

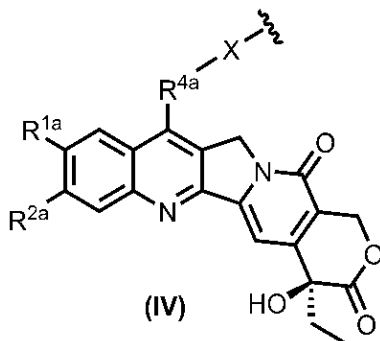
Lは、リンカーであり、

mは、1から4の間の整数であり、

nは、1から10の間の整数であり、

Dは、式(IV)：

【化296】



の化合物であり、式中、

R^{1a}は、-H、-CH₃、-CHF₂、-CF₃、-F、-Br、-Cl、-OH、-OCH₃、-OCF₃及び-NH₂から選択され、

10

20

30

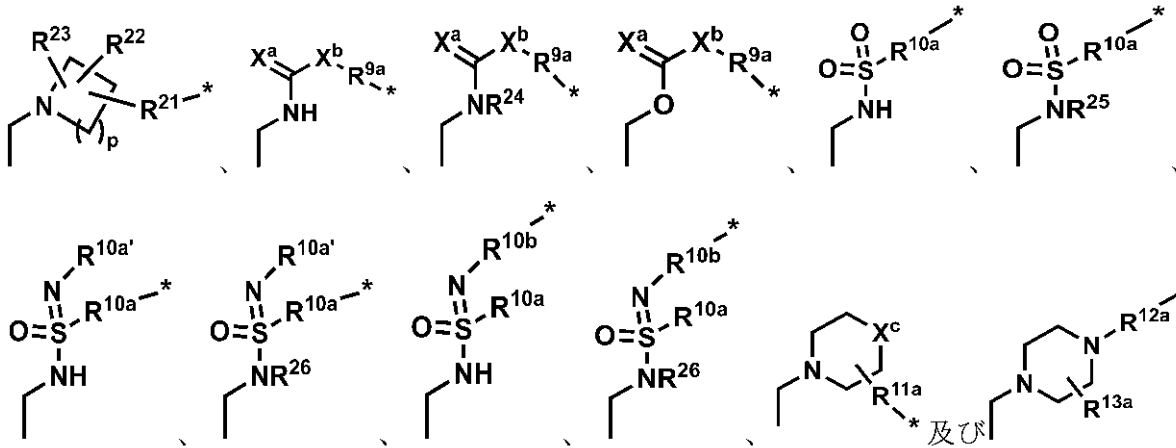
40

50

R^{2a} は、 $-H$ 、 $-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-F$ 、 $-Br$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 及び $-OCF_3$ から選択され、

X は、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NH-$ であり、 R^{4a} は、

【化 297】



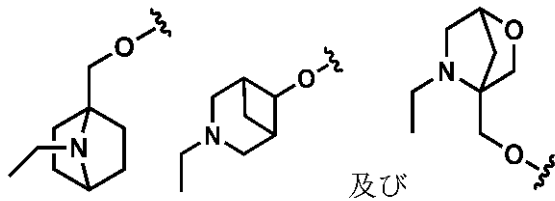
10

から選択され、 $*$ は、 X との結合点であり、 p は、 1 、 2 、 3 または 4 であるか、あるいは

20

X は、 O であり、 $R^{4a}-X-$ は、

【化 298】



及び

30

から選択され、

R^{5a} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール、及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択され、

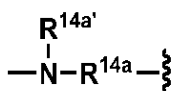
R^{8a} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、及び $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキルから選択され、

各 R^{9a} は、独立して、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択されるか、あるいは R^{9a} は、存在せず、 $X^b = X$ であり、

各 R^{10a} は、独立して、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリール及び

40

【化 299】

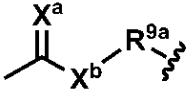


から選択され、

各 $R^{10a'}$ は、独立して、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル})-$ アリールから選択され、

50

各 R^{10b} は、独立して、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) -$ アリールから選択され、
 R^{11a} は、存在しないか、または $-C_1 \sim C_6$ アルキルであり、
 R^{12a} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-CO_2R^{8a}$ 、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール、
 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) -$ アリール、 $-S(O)_2R^{16a}$ 及び
 【化300】



10

から選択され、

R^{13a} は、 $-H$ 及び $-C_1 \sim C_6$ アルキルから選択され、
 R^{14a} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、及び $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキルから選択され、
 $R^{14a'}$ は、 H 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、及び $-C_3 \sim C_8$ ヘテロシクロアルキルから選択され、
 R^{16a} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル、 $-$ アリール、 $-$ ヘテロアリール、及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) -$ アリールから選択され、
 R^{21} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキル及び $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) - O - R^{5a}$ から選択され、
 R^{22} 及び R^{23} は、それぞれ独立して、 $-H$ 、 $-$ ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、及び $-C_3 \sim C_8$ シクロアルキルから選択され、
 R^{24} 、 R^{25} 及び R^{26} は、それぞれ $-C_1 \sim C_6$ アルキルであり、
 X^a 及び X^b は、それぞれ独立して、 NH 、 O 及び S から選択され、
 X^c は、 O 、 S 及び $S(O)_2$ から選択され、
 【化301】

20



30

は、リンカー L との結合点を示す、前記複合体。

[項28]

R^{1a} は、 $-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCH_3$ 、 $-OCF_3$ 及び $-NH_2$ から選択される、項27に記載の複合体。

[項29]

R^{1a} は、 $-CH_3$ 、 $-OCH_3$ 及び NH_2 から選択される、項27に記載の複合体。

[項30]

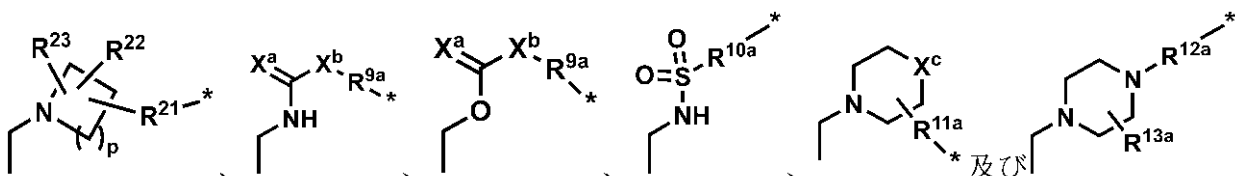
R^{2a} は、 $-H$ 、 $-F$ 、 $-Br$ 及び $-Cl$ から選択される、項27に記載の複合体。

[項31]

X は、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NH-$ であり、 R^{4a} は、

40

【化302】

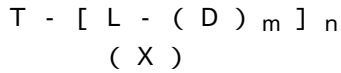


から選択される、項27から30のいずれかに記載の複合体。

50

[項 3 2]

式 (X) :



を有する複合体であって、式中、

T は、標的化部分であり、

L は、リンカーであり、

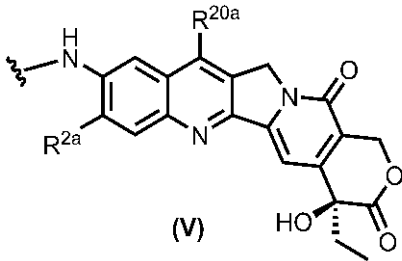
m は、1 から 4 の間の整数であり、

n は、1 から 10 の間の整数であり、

D は、式 (V) :

10

【化 3 0 3】

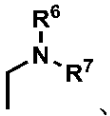


20

の化合物であり、式中、

R^{2a} は、-CH₃、-CF₃、-F、-Br、-Cl、-OH、-OCH₃ 及び -OCF₃ から選択され、R^{20a} は、-H、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、-(C₁~C₆アルキル)-O-R⁵、

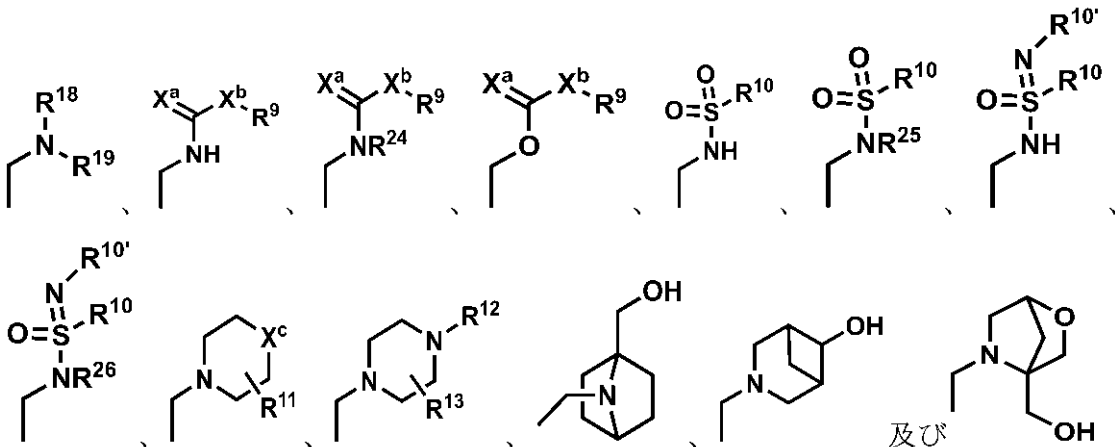
【化 3 0 4】



30

-CO₂R⁸、-アリール、-ヘテロアリール、-(C₁~C₆アルキル)-アリール、

【化 3 0 5】



40

から選択され、

R⁵ は、-H、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、-アリール、-

50

ヘテロアリール及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

R⁶ 及び R⁷ は、それぞれ独立して、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- (C₁ ~ C₆ アルキル) - O - R⁵、- C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキル及び - C(O)R¹⁷ から選択され、

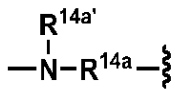
R⁸ は、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、及び - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキルから選択され、

各 R⁹ は、独立して、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- アリール、- ヘテロアリール及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

各 R^{10a} は、独立して、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- アリール、- ヘテロアリール、- (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリール及び

10

【化306】



から選択され、

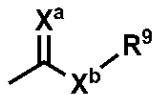
R^{10a'} は、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- アリール、- ヘテロアリール及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

R¹¹ は、- H 及び - C₁ ~ C₆ アルキルから選択され、

20

R¹² は、- H、- C₁ ~ C₆ アルキル、- CO₂R⁸、- アリール、- ヘテロアリール、- (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリール、- S(O)₂R¹⁶ 及び

【化307】



から選択され、

R¹³ は、- H 及び - C₁ ~ C₆ アルキルから選択され、

30

R¹⁴ 及び R^{14'} は、それぞれ独立して、- H、C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、及び - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキルから選択され、

R¹⁶ は、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- アリール、- ヘテロアリール、及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

R¹⁷ は、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル、- C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキル、- (C₁ ~ C₆ アルキル) - C₃ ~ C₈ ヘテロシクロアルキル、- アリール、- ヘテロアリール及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - アリールから選択され、

R¹⁸ 及び R¹⁹ は、それらが結合する N 原子と一緒に、ハロゲン、- C₁ ~ C₆ アルキル、- C₃ ~ C₈ シクロアルキル及び - (C₁ ~ C₆ アルキル) - O - R⁵ から選択される 0 から 3 個の置換基を有する 4、5、6 または 7 員環を形成し、

40

R²⁴、R²⁵ 及び R²⁶ は、それぞれ - C₁ ~ C₆ アルキルであり、

X^a 及び X^b は、それぞれ独立して、NH、O 及び S から選択され、

X^c は、O、S 及び S(O)₂ から選択され、

【化308】



は、リンカー L との結合点を示す、前記複合体。

[項33]

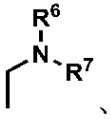
50

R^{2a} は F である、項 3 2 に記載の複合体。

[項 3 4]

R^{20a} は、 $-H$ 、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) - O - R^5$ 、

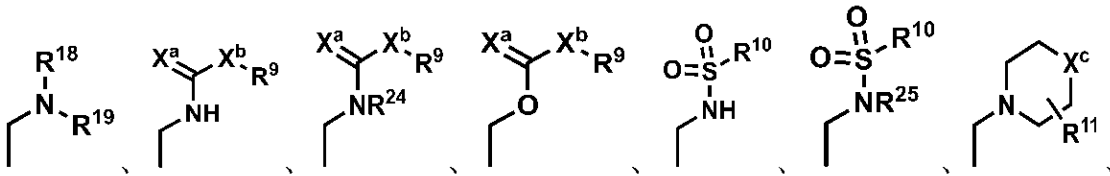
【化 3 0 9】



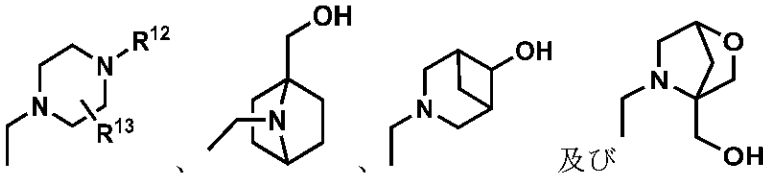
10

$-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) - \text{アリール}$ 、

【化 3 1 0】



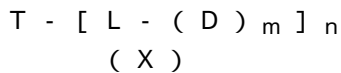
20



から選択される、項 3 2 または 3 3 に記載の複合体。

[項 3 5]

式 (X) :



を有する複合体であって、式中、

T は、標的化部分であり、

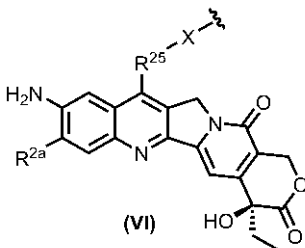
L は、リンカーであり、

m は、1 から 4 の間の整数であり、

n は、1 から 10 の間の整数であり、

D は、式 (V I) :

【化 3 1 1】



40

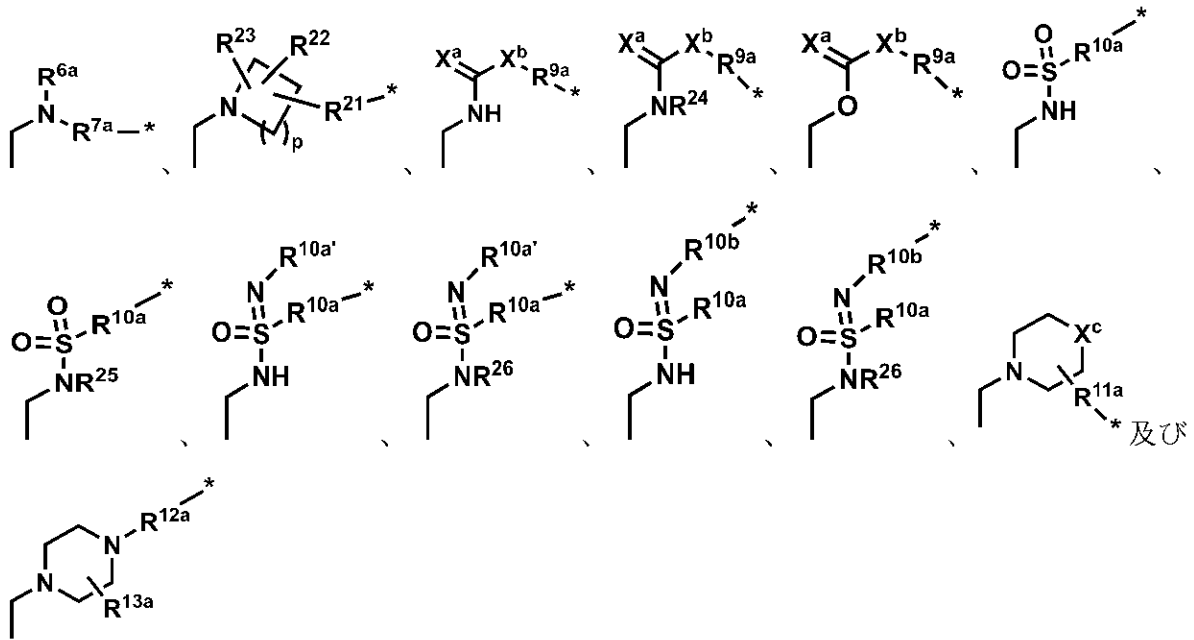
の化合物であり、式中、

R^{2a} は、 $-H$ 、 $-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-F$ 、 $-Br$ 、 $-Cl$ 、 $-OH$ 、 $-OCH_3$ 及び $-OCF_3$ から選択され、

X は、 $-O-$ 、 $-S-$ または $-NH-$ であり、 R^{25} は、 $-C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-(C_1 \sim C_6 \text{ アルキル}) - O - R^{5a}$ 、 $-CO_2R^{8a}$ 、 $-C(O)-$ 、 $-アリール$ 、 $-ヘ$

50

テロアリール、 - (C ₁ ~ C ₆ アルキル) - アリール、
【化 3 1 2】



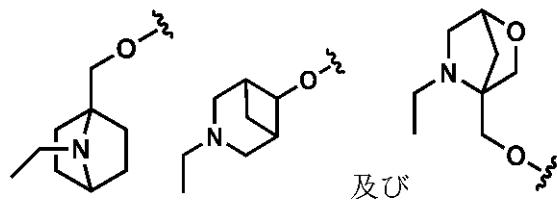
10

20

から選択され、 * は、 X との結合点であり、 p は、 1、 2、 3 または 4 であるか、 あるいは

X は、 O であり、 R ^{2 5} - X - は、

【化 3 1 3】



30

から選択され、

R ^{5 a} は、 - C ₁ ~ C ₆ アルキル、 - C ₃ ~ C ₈ シクロアルキル、 - アリール、 - ヘテロアリール、 及び - (C ₁ ~ C ₆ アルキル) - アリールから選択され、

R ^{6 a} は、 - H、 - C ₁ ~ C ₆ アルキル、 - C ₃ ~ C ₈ シクロアルキル、 及び - C ₃ ~ C ₈ ヘテロシクロアルキルから選択され、

R ^{7 a} は、 - C ₁ ~ C ₆ アルキル、 - C ₃ ~ C ₈ シクロアルキル、 - (C ₁ ~ C ₆ アルキル) - O - R ^{5 a}、 - C ₃ ~ C ₈ ヘテロシクロアルキル及び - C (O) R ^{1 7 a} から選択され、

40

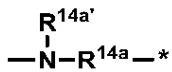
R ^{8 a} は、 - C ₁ ~ C ₆ アルキル、 - C ₃ ~ C ₈ シクロアルキル、 及び - C ₃ ~ C ₈ ヘテロシクロアルキルから選択され、

各 R ^{9 a} は、 独立して、 - C ₁ ~ C ₆ アルキル、 - C ₃ ~ C ₈ シクロアルキル、 - アリール、 - ヘテロアリール及び - (C ₁ ~ C ₆ アルキル) - アリールから選択されるか、 あるいは R ^{9 a} は、 存在せず、 X ^b = X であり、

各 R ^{1 0 a} は、 独立して、 - C ₁ ~ C ₆ アルキル、 - C ₃ ~ C ₈ シクロアルキル、 - アリール、 - ヘテロアリール、 - (C ₁ ~ C ₆ アルキル) - アリール及び

50

【化 3 1 4】



から選択され、

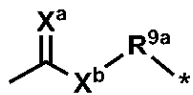
各 R^{10a} は、独立して、-H、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、-アリーール、-ヘテロアリーール及び-(C₁~C₆アルキル)-アリーールから選択され、

各 R^{10b} は、独立して、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、-アリーール、-ヘテロアリーール及び-(C₁~C₆アルキル)-アリーールから選択され、

R^{11a} は、存在しないか、または-C₁~C₆アルキルであり、

R^{12a} は、-C₁~C₆アルキル、-CO₂R^{8a}、-アリーール、-ヘテロアリーール、-(C₁~C₆アルキル)-アリーール、-S(O)₂R^{16a}及び

【化 3 1 5】



から選択され、

R^{13a} は、-H及び-C₁~C₆アルキルから選択され、

R^{14a} は、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、及び-C₃~C₈ヘテロシクロアルキルから選択され、

$R^{14a'}$ は、H、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、及び-C₃~C₈ヘテロシクロアルキルから選択され、

R^{16a} は、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、-アリーール、-ヘテロアリーール、及び-(C₁~C₆アルキル)-アリーールから選択され、

R^{17a} は、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル、-C₃~C₈ヘテロシクロアルキル、-(C₁~C₆アルキル)-C₃~C₈ヘテロシクロアルキル、-アリーール、-ヘテロアリーール及び-(C₁~C₆アルキル)-アリーールから選択され、

R^{21} は、-C₁~C₆アルキル、-C₃~C₈シクロアルキル及び-(C₁~C₆アルキル)-O-R^{5a}から選択され、

R^{22} 及び R^{23} は、それぞれ独立して、-H、-ハロゲン、C₁~C₆アルキル、及び-C₃~C₈シクロアルキルから選択され、

R^{24} 、 R^{25} 及び R^{26} は、それぞれ-C₁~C₆アルキルであり、

X^a 及び X^b は、それぞれ独立して、NH、O及びSから選択され、

X^c は、O、S及びS(O)₂から選択され、

【化 3 1 6】



は、リンカー L との結合点を示す、前記複合体。

[項 3 6]

R^{2a} は、-CH₃、-CF₃、-F、-Br、-Cl、-OH、-OCH₃ 及び -OCF₃ から選択される、項 3 5 に記載の複合体。

[項 3 7]

R^{2a} は F である、項 3 5 に記載の複合体。

[項 3 8]

10

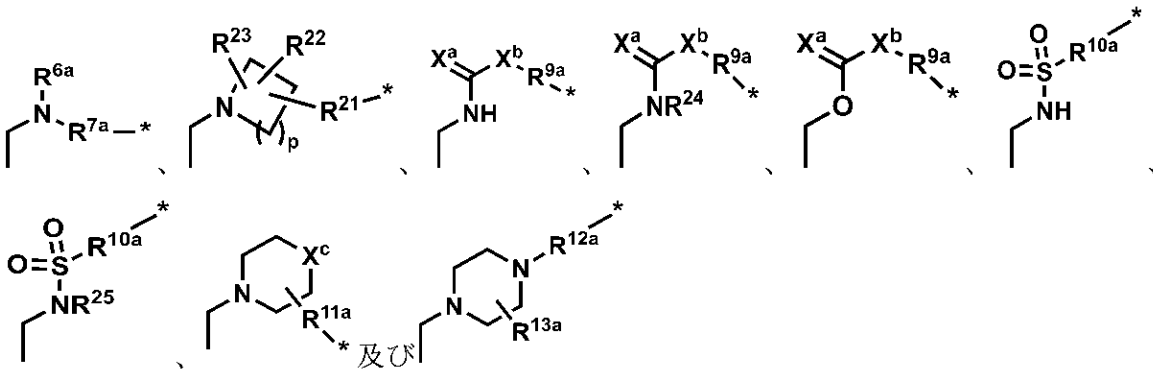
20

30

40

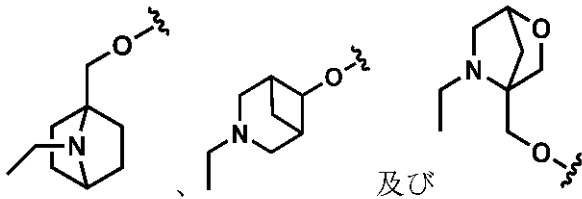
50

Xは、- O -、- S - または - NH - であり、 R^{25} は、- C₁ ~ C₆アルキル、- (C₁ ~ C₆アルキル) - O - R^{5a}、- (C₁ ~ C₆アルキル) - アリール、
 【化317】



10

から選択されるか、あるいはXはOであり、 R^{25} - X - は、
 【化318】

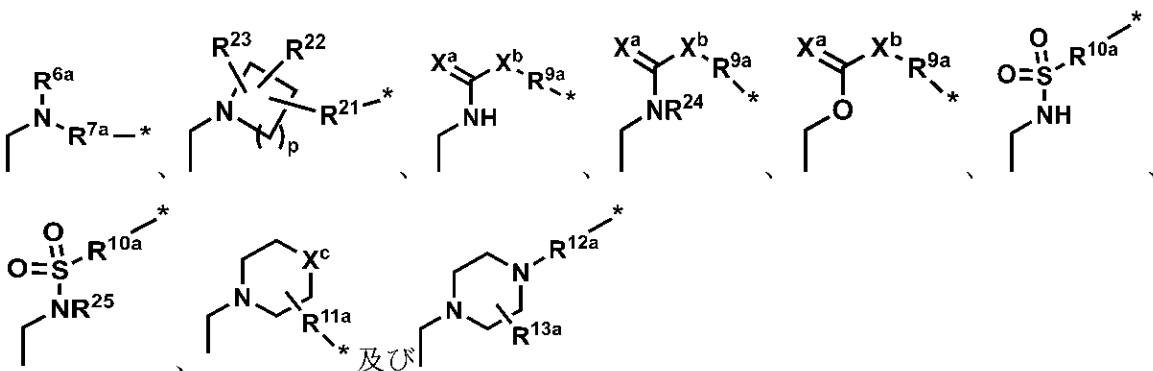


20

から選択される、項35から37のいずれかに記載の複合体。
 [項39]

Xは、- O -、- S - または - NH - であり、 R^{25} は、- C₁ ~ C₆アルキル、- (C₁ ~ C₆アルキル) - O - R^{5a}、- (C₁ ~ C₆アルキル) - アリール、
 【化319】

30



40

から選択される、項35から37のいずれかに記載の複合体。
 [項40]

アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール基はそれぞれ、任意にハロゲン、アシル、アシルオキシ、アルコキシ、カルボキシ、ヒドロキシ、アミノ、アミド、ニトロ、シアノ、アジド、アルキルチオ、チオ、スルホニル、スルホンアミド、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で置換される、項27から39のいずれかに記載の複合体。

50

[項 4 1]

アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール及びヘテロアリール基はそれぞれ、任意にハロゲン、アシル、アシルオキシ、アルコキシ、カルボキシ、ヒドロキシ、アミノ、アミド、ニトロ、シアノ、アジド、アルキルチオ、チオ、スルホニル及びスルホンアミドから選択される1つ以上の置換基で置換される、項27から39のいずれかに記載の複合体。

[項 4 2]

mは1または2である、項26から41のいずれかに記載の複合体。

[項 4 3]

nは2から8の間である、項26から42のいずれかに記載の複合体。

10

[項 4 4]

Lは、切断可能なリンカーである、項26から43のいずれかに記載の複合体。

[項 4 5]

Lは、プロテアーゼ切断可能なリンカーである、項44に記載の複合体。

[項 4 6]

Lは、ジペプチド、トリペプチドまたはテトラペプチドを含む、項44または45に記載の複合体。

[項 4 7]

Tは、腫瘍関連抗原に結合する、項26から46のいずれかに記載の複合体。

[項 4 8]

Tは、抗体または抗原結合抗体フラグメントである、項26から47のいずれかに記載の複合体。

20

[項 4 9]

前記抗体は、二重特異性抗体または多重特異性抗体である、項48に記載の複合体。

[項 5 0]

項26から49のいずれかに記載の複合体、及び医薬的に許容される担体または希釈剤を含む、医薬組成物。

[項 5 1]

がん細胞の増殖を抑制する方法であって、前記細胞を有効量の項1から24のいずれかに記載の化合物、または項26から49のいずれかに記載の複合体と接触させることを含む、前記方法。

30

[項 5 2]

がん細胞を殺傷する方法であって、前記細胞を有効量の項1から24のいずれかに記載の化合物、または項26から49のいずれかに記載の複合体と接触させることを含む、前記方法。

[項 5 3]

がんの治療を必要とする対象においてがんを治療する方法であって、前記対象に有効量の項1から24のいずれかに記載の化合物、または項26から49のいずれかに記載の複合体を投与することを含む、前記方法。

[項 5 4]

自己免疫疾患の治療を必要とする対象において自己免疫疾患を治療する方法であって、前記対象に有効量の項1から24のいずれかに記載の化合物、または項26から49のいずれかに記載の複合体を投与することを含む、前記方法。

40

[項 5 5]

ウイルス感染症の治療を必要とする対象においてウイルス感染症を治療する方法であって、前記対象に有効量の項1から24のいずれかに記載の化合物、または項26から49のいずれかに記載の複合体を投与することを含む、前記方法。

[項 5 6]

治療に使用するための、項1から24のいずれかに記載の化合物または項26から49のいずれかに記載の複合体。

50

[項 5 7]

がん、自己免疫疾患またはウイルス感染症の治療に使用するための、項 1 から 2 4 のいずれかに記載の化合物または項 2 6 から 4 9 のいずれかに記載の複合体。

[項 5 8]

がん、自己免疫疾患またはウイルス感染症の治療用の医薬の製造における項 1 から 2 4 のいずれかに記載の化合物または項 2 6 から 4 9 のいずれかに記載の複合体の使用。

10

20

30

40

50