

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成30年1月11日 (2018.1.11)

【公表番号】特表2016-538281 (P2016-538281A)

【公表日】平成28年12月8日 (2016.12.8)

【年通号数】公開・登録公報2016-067

【出願番号】特願2016-530111 (P2016-530111)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/34 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4525 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/496 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4178 (2006.01)  
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/665 (2006.01)  
 A 6 1 P 35/02 (2006.01)  
 A 6 1 K 45/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 15/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 1/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 11/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 1/16 (2006.01)  
 A 6 1 P 1/18 (2006.01)  
 A 6 1 P 13/08 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/5377 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/541 (2006.01)  
 C 0 7 D 493/08 (2006.01)  
 A 6 1 K 9/127 (2006.01)  
 A 6 1 K 9/52 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/675 (2006.01)  
 C 0 7 F 9/6561 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/34  
 A 6 1 K 31/4525  
 A 6 1 K 31/496  
 A 6 1 K 31/4178  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 43/00 1 2 3  
 A 6 1 K 31/665  
 A 6 1 P 35/02  
 A 6 1 K 45/00  
 A 6 1 P 43/00 1 2 1  
 A 6 1 P 15/00  
 A 6 1 P 1/00  
 A 6 1 P 11/00  
 A 6 1 P 1/16  
 A 6 1 P 1/18  
 A 6 1 P 13/08  
 A 6 1 P 25/00

A 6 1 K 31/5377  
 A 6 1 K 31/541  
 C 0 7 D 493/08 C S P A  
 A 6 1 K 9/127  
 A 6 1 K 9/52  
 A 6 1 K 31/675  
 C 0 7 F 9/6561 Z

## 【手続補正書】

【提出日】平成29年11月24日(2017.11.24)

## 【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

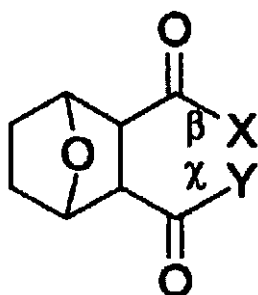
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

構造：

【化 1】



(ここで、

X は、 $OR_3$  または  $NR_4R_5$  であり、ここで、 $R_3$ 、 $R_4$  および  $R_5$  はそれぞれ、H もしくは有機部分であり、または $R_4$  および  $R_5$  は一緒になって有機部分を形成し；Y は、 $OR_6$  または  $NR_7R_8$  であり、ここで、 $R_6$ 、 $R_7$  および  $R_8$  はそれぞれ、H、もしくは有機部分であり、または $R_7$  および  $R_8$  は一緒になって有機部分を形成し；

X または Y の一方が OH である場合、X または Y の他方は OH、 $NR_4R_5$  または  $NR_7R_8$  以外であり、ここで  $R_4$  および  $R_5$  または  $R_7$  および  $R_8$  は一緒になって N - メチルピペラジンを形成する) を有する化合物またはその医薬的に許容される塩もしくはエステルであって、

ここで、結合 および結合 の一方または両方は、対象におけるインビボ加水分解切断を受け、

前記対象の標的細胞にエンドタールをインビボ送達する方法における使用のための化合物。

【請求項 2】

X または Y の一方が OH である場合、X または Y の他方は  $NR_4R_5$  または  $NR_7R_8$  以外であり、ここで  $R_4$  および  $R_5$  または  $R_7$  および  $R_8$  は一緒になって N - tert - ブチルカルボキレートピペラジンを形成する、請求項 1 に記載の使用のための化合物。

【請求項 3】

X または Y の一方が OH である場合、X または Y の他方は  $NR_4R_5$  または  $NR_7R_8$  以外であり、ここで  $R_4$  および  $R_5$  または  $R_7$  および  $R_8$  は一緒になって、無置換のまたは置換されたピペラジン、モルホリンまたはチオモルホリンを形成する、請求項 1 に記載の使用の

ための化合物。

【請求項 4】

X は、 $OR_3$  または  $NR_4R_5$  であり、

ここで、 $R_3$  は、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、アルキルヘテロアリール、アルケニルアリール、アルケニルヘテロアリール、アルキニルアリール、アルキニルヘテロアリール、ヘテロアルキル、ヘテロアルケニル、ヘテロアルキニル、ヒドロキシアルキル、ヒドロキシアルケニル、ヒドロキシアルキニル、アルキル -  $P(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $OP(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $O(CO) - OR_{10}$ 、アルキル -  $P(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ 、またはアルキル -  $OP(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$  であり、

$R_4$  および  $R_5$  は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、アルキルヘテロアリール、アルケニルアリール、アルケニルヘテロアリール、アルキニルアリール、アルキニルヘテロアリール、ヘテロアルキル、ヘテロアルケニル、ヘテロアルキニル、ヒドロキシアルキル、ヒドロキシアルケニル、ヒドロキシアルキニル、アルキル -  $P(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $OP(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $O(CO) - OR_{10}$ 、アルキル -  $P(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ 、またはアルキル -  $OP(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$  であり、

または、 $R_4$  と  $R_5$  は一緒になって、無置換のまたは置換されたシクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニルまたはヘテロシクロアルキルを形成し、

$R_9$  および  $R_{10}$  は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、またはアリールであり、

Y は、 $OR_6$  または  $NR_7R_8$  であり、

ここで、 $R_6$  は、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、アルキルヘテロアリール、アルケニルアリール、アルケニルヘテロアリール、アルキニルアリール、アルキニルヘテロアリール、ヘテロアルキル、ヘテロアルケニル、ヘテロアルキニル、ヒドロキシアルキル、ヒドロキシアルケニル、ヒドロキシアルキニル、アルキル -  $P(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $OP(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $O(CO) - OR_{10}$ 、アルキル -  $P(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ 、またはアルキル -  $OP(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$  であり、

$R_7$  および  $R_8$  は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール、アルキルアリール、アルキルヘテロアリール、アルケニルアリール、アルケニルヘテロアリール、アルキニルアリール、アルキニルヘテロアリール、ヘテロアルキル、ヘテロアルケニル、ヘテロアルキニル、ヒドロキシアルキル、ヒドロキシアルケニル、ヒドロキシアルキニル、アルキル -  $P(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $OP(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $O(CO) - OR_{10}$ 、アルキル -  $P(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ 、またはアルキル -  $OP(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$  であり、

または  $R_7$  と  $R_8$  は一緒になって、無置換のまたは置換されたシクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニルまたはヘテロシクロアルキルを形成し、

$R_9$  および  $R_{10}$  は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、またはアリールである、

または前記化合物の医薬的に許容される塩もしくはエステルである、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の使用のための化合物。

【請求項 5】

X は、 $OR_3$  または  $NR_4R_5$  であり、

ここで、 $R_3$  は、H、アルキル、アルケニル、ヒドロキシアルキル、アルキルアリール、アルキル -  $P(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $OP(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $O(CO) - OR_{10}$ 、アルキル -  $P(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ 、またはアルキル -  $OP(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$  であり、

$R_4$ および $R_5$ は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニル、ヒドロキシアルキル、アルキル -  $P(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $OP(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $O(CO) - OR_{10}$ 、アルキル -  $P(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ 、またはアルキル -  $OP(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ であり、

または $R_4$ と $R_5$ は、一緒になって、無置換のまたは置換されたヘテロシクロアルキルを形成し、

$R_9$ および $R_{10}$ は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、またはアリールであり、

Yは、 $OR_6$ または $NR_7R_8$ であり、

ここで、 $R_6$ は、H、アルキル、アルケニル、ヒドロキシアルキル、アルキルアリール、アルキル -  $P(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $OP(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $O(CO) - OR_{10}$ 、アルキル -  $P(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ 、またはアルキル -  $OP(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ であり、

$R_7$ および $R_8$ は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニル、ヒドロキシアルキル、アルキル -  $P(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $OP(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $O(CO) - OR_{10}$ 、アルキル -  $P(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ 、またはアルキル -  $OP(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ であり、

または $R_7$ と $R_8$ は、一緒になって、無置換のまたは置換されたヘテロシクロアルキルを形成し、

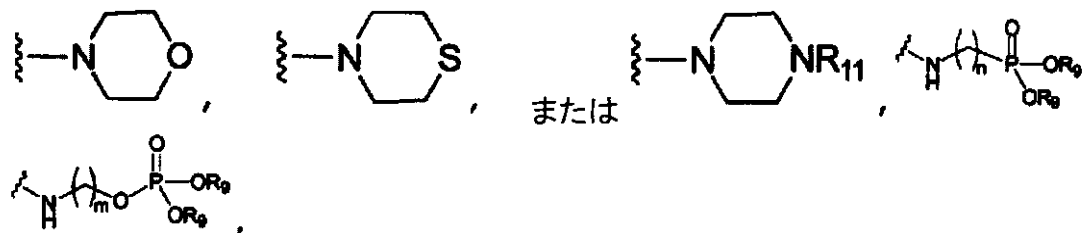
$R_9$ および $R_{10}$ は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、またはアリールである、

または前記化合物の医薬的に許容される塩もしくはエステルである、請求項4に記載の使用のための化合物。

#### 【請求項6】

Xは、 $OR_3$ 、

#### 【化2】



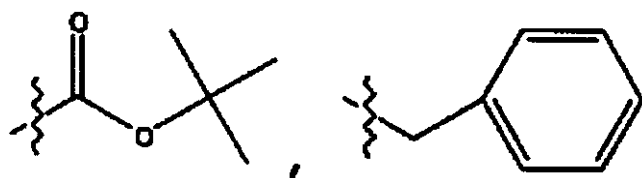
であり、

ここで、 $R_3$ は、H、アルキル、アルケニル、ヒドロキシアルキル、アルキルアリール、アルキル -  $P(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $OP(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $O(CO) - OR_{10}$ 、アルキル -  $P(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ 、またはアルキル -  $OP(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ であり、

$R_9$ および $R_{10}$ は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニル、またはアルキニルであり、

$R_{11}$ は、H、アルキル、ヒドロキシアルキル、アルケニル、アルケニル、アルキニル、アリール、アルキルアリール、ヘテロアリール、アルキルヘテロアリール、

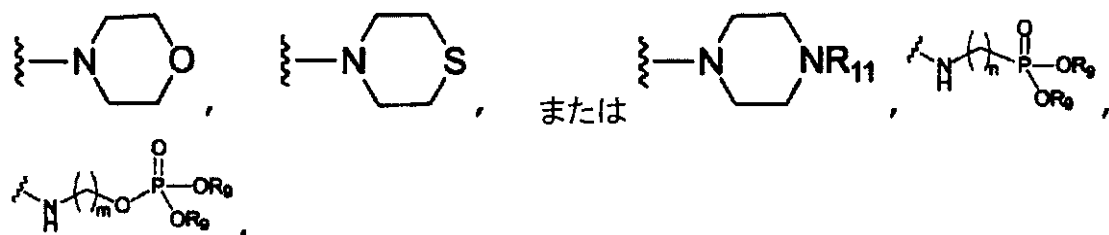
#### 【化3】



、 $-CH_2CN$ 、 $-CH_2CO_2R_{12}$ 、 $-CH_2COR_{12}$ 、 $-NHR_{12}$ 、または $-NH^+(R_1)_2$ であり、

$R_{12}$ は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニルまたはアルキニルであり；  
Yは、 $OR_6$ 、

【化4】



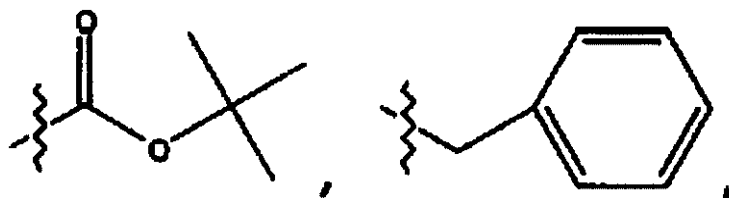
であり、

ここで、 $R_6$ は、H、アルキル、アルケニル、ヒドロキシアルキル、アルキルアリー  
ル、アルキル -  $P(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $OP(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $O(CO) - OR_{10}$ 、アルキル -  $P(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ 、または  
アルキル -  $OP(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ であり、

$R_9$ および $R_{10}$ は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニル、またはアルキ  
ニルであり、

$R_{11}$ は、H、アルキル、ヒドロキシアルキル、アルケニル、アルケニル、アルキニル  
、アリール、アルキルアリール、ヘテロアリール、アルキルヘテロアリール、

【化5】



、 $-CH_2CN$ 、 $-CH_2CO_2R_{12}$ 、 $-CH_2COR_{12}$ 、 $-NHR_{12}$ 、または $-NH^+(R_{12})_2$ であり、

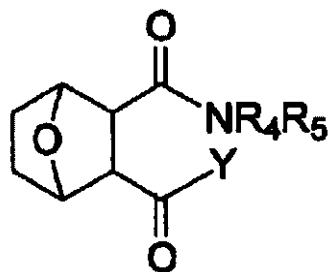
$R_9$ および $R_{10}$ は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニル、またはアルキ  
ニルであり、

$R_{12}$ は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニルまたはアルキニルである  
、請求項5に記載の使用のための化合物。

【請求項7】

前記化合物が、構造：

【化6】



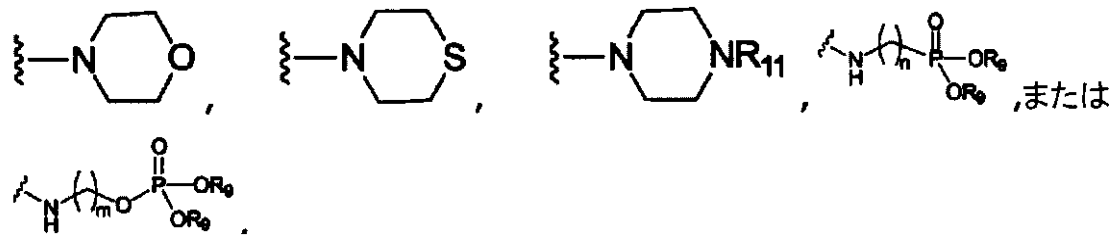
(ここで、

$R_4$ および $R_5$ は、それぞれ、H、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルキル -  $P(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $OP(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $O(CO) - OR_{10}$ 、アル  
キル -  $P(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ 、またはアルキル -  $OP(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ であり、

$R_9$ および $R_{10}$ は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニル、またはアルキ  
ニルであり；

Y は、OR<sub>6</sub>、

【化 7】



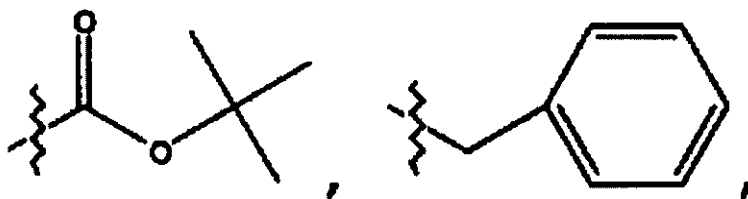
であり、

R<sub>6</sub> は、H、アルキル、アルケニル、ヒドロキシアルキル、アルキルアリール、アルキル - P(O)(OR<sub>9</sub>)<sub>2</sub>、アルキル - OP(O)(OR<sub>9</sub>)<sub>2</sub>、アルキル - O(CO) - OR<sub>10</sub>、アルキル - P(O)(O - アルキル - O(CO) - OR<sub>10</sub>)<sub>2</sub>、またはアルキル - OP(O)(O - アルキル - O(CO) - OR<sub>10</sub>)<sub>2</sub> であり、

R<sub>9</sub> および R<sub>10</sub> は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニル、またはアルキニルであり、

R<sub>11</sub> は、H、アルキル、ヒドロキシアルキル、アルケニル、アルケニル、アルキニル、アリール、アルキルアリール、ヘテロアリール、アルキルヘテロアリール、

【化 8】



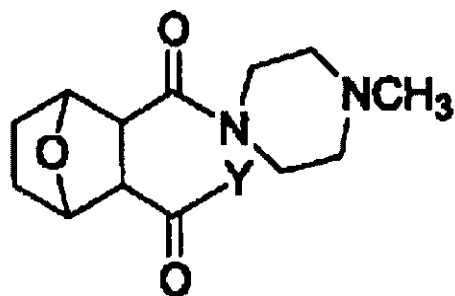
、-CH<sub>2</sub>CN、-CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>R<sub>12</sub>、-CH<sub>2</sub>COR<sub>12</sub>、-NHR<sub>12</sub>、または -NH<sup>+</sup>(R<sub>12</sub>)<sub>2</sub> であり、

R<sub>12</sub> は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニルまたはアルキニルである) を有する、請求項 5 に記載の 使用のための化合物。

【請求項 8】

前記化合物が、構造：

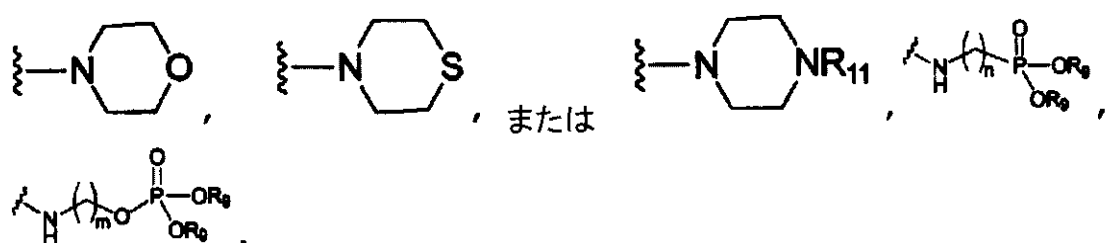
【化 9】



(ここで、

Y は、OR<sub>6</sub>、

【化 10】



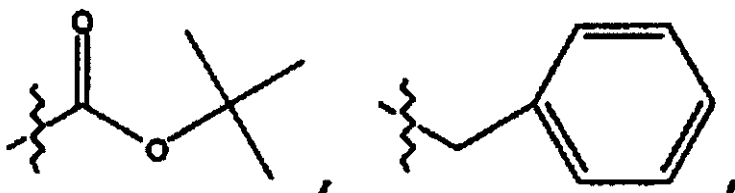
であり、

$R_6$ は、H、アルキル、アルケニル、ヒドロキシアルキル、アルキルアリール、アルキル -  $P(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $OP(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $O(CO) - OR_{10}$ 、アルキル -  $P(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ 、またはアルキル -  $OP(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ であり、

$R_9$ および $R_{10}$ は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニル、またはアルキニルであり、

$R_{11}$ は、H、アルキル、ヒドロキシアルキル、アルケニル、アルケニル、アルキニル、アリール、アルキルアリール、ヘテロアリール、アルキルヘテロアリール、

【化 1 1】



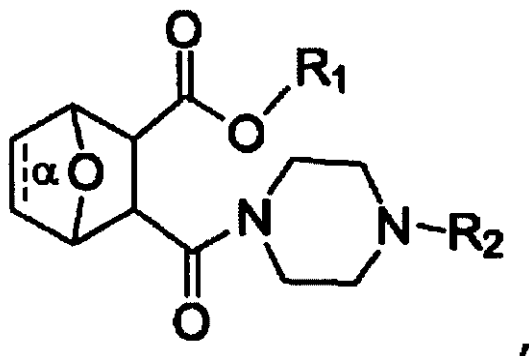
、 $-CH_2CN$ 、 $-CH_2CO_2R_{12}$ 、 $-CH_2COR_{12}$ 、 $-NHR_{12}$ 、または $-NH^+(R_{12})_2$ であり、

$R_{12}$ は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニルまたはアルキニルである)を有する、請求項 4 に記載の使用のための化合物。

【請求項 9】

前記化合物が、構造：

【化 1 2】



(ここで、

結合 は、存在せず、

$R_1$ は、 $C_2 \sim C_{20}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{20}$ アルケニル、または $C_2 \sim C_{20}$ アルキニルであり、

$R_2$ は、H、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル - (フェニル)、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル - (OH)、または $C(O)C(CH_3)_3$ である)を有する化合物またはその医薬的に許容される塩である、請求項 1 に記載の使用のための化合物。

【請求項 10】

前記化合物が、構造：

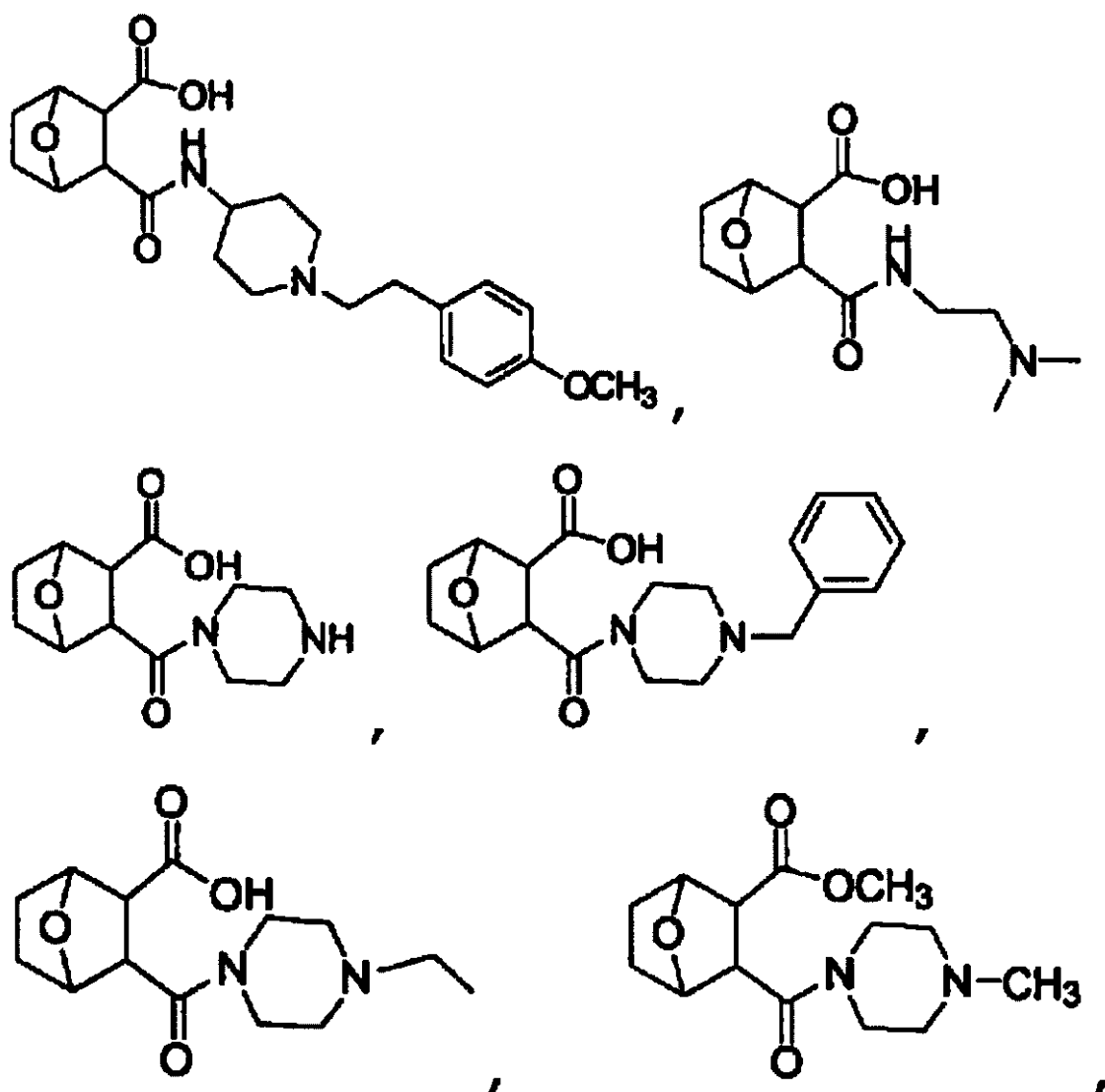
Chemical structures of three compounds are shown, separated by commas. Each structure consists of a bicyclic phthalate derivative (a bicyclo[2.2.2]octane system fused to a phthalate ring) linked via an ester group to a 1-methylpiperazine ring. The first structure has a propyl ester group. The second structure has a hexyl ester group. The third structure has a long unsaturated ester chain.

Chemical structures of the four compounds are shown below:

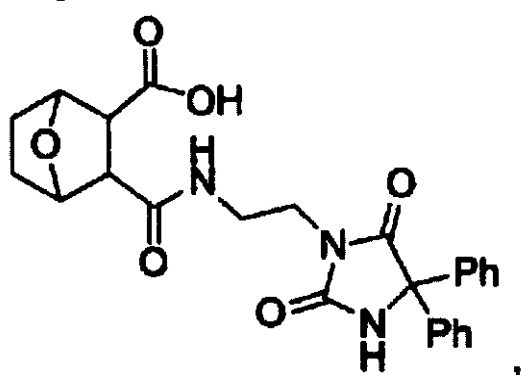
- Structure 1: A bicyclic phthalate derivative with a benzyl ester and a 2-(2-hydroxyethyl)pyrrolidine amide.
- Structure 2: A bicyclic phthalate derivative with a 2-((S)-1-carboxy-2-aminopropyl)benzyl ester and a 1-methylpyrrolidine amide.
- Structure 3: A bicyclic phthalate derivative with a 2-((S)-1-carboxy-2-((tert-butoxycarbonyl)amino)propyl)benzyl ester and a 1-methylpyrrolidine amide.
- Structure 4: A bicyclic phthalate derivative with a (2-chloroethyl) ester and a 1-methylpyrrolidine amide.



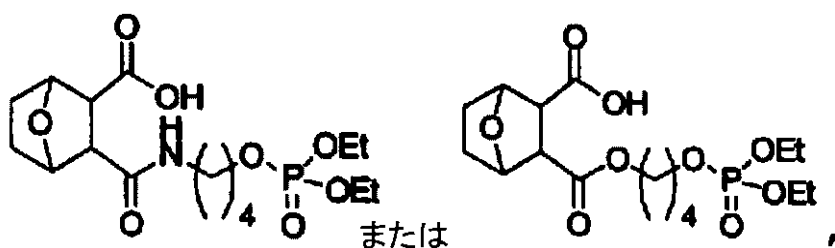
## 【化 1 5】



## 【化 1 6】



## 【化 1 7】



を有する化合物またはその医薬的に許容される塩もしくはエステルである、請求項 1 に記

載の使用のための化合物。

【請求項 1 1】

前記対象の標的細胞へのエンドタールの送達が、前記対象における癌を処置するために有効であり、前記対象が、癌、好ましくは、乳癌、結腸癌、大細胞肺癌、肺腺癌、小細胞肺癌、胃癌、肝臓癌、卵巣腺癌、膵臓癌、前立腺癌、前骨髄球性白血病 (promyelocytic leukemia)、慢性骨髄性白血病、急性リンパ性白血病、結腸直腸癌、卵巣癌、リンパ腫、非ホジキンリンパ腫、ホジキンリンパ腫、脳癌、神経膠腫、毛様細胞性星状細胞腫、低悪性度びまん性星状細胞腫、退形成星状細胞腫、多形膠芽腫、乏突起星状細胞腫、上衣腫、髄膜腫、脳下垂体腫瘍、中枢神経系原発リンパ腫、髄芽細胞腫、頭蓋咽頭腫またはびまん性内在性橋膠腫、を患っている、請求項 1 から 1 0 のいずれか一項に記載の使用のための化合物。

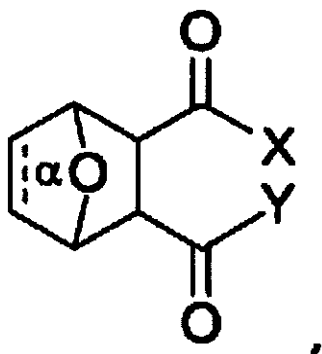
【請求項 1 2】

前記対象に抗癌作用因子を投与することをさらに含み、好ましくは、前記抗癌作用因子が、X線、電離放射線、DNA損傷剤、DNAインターカレート剤、微小管安定化剤、微小管脱安定化剤、紡錘体毒素、アブレリックス、アルデスロイキン、アレムツズマブ、アリトレチノイン (ariteretinoin)、アロプリノール、アルトレタミン、アミホスチン、アナキンラ、アナストロゾール、三酸化ヒ素、アスバラギナーゼ、アザシチジン、ベパシズマブ、ベキサロテン、プレオマイシン、ボルテゾミブ、ブスルファン、カルステロン、カベシタビン、カルボプラチン、カルムスチン、セレコキシブ、セツキシマブ、クロラムブシル、シスプラチン、クラドリビン、クロファラビン、シクロホスファミド、シタラビン、ダカルバジン、ダクチノマイシン、アクチノマイシンD、ダルテパリンナトリウム、ダルベポエチン、ダサチニブ、ダウノルビシン、ダウノマイシン、デシタビン、デニロイキン、デクスラゾキサン、ドセタキセル、ドキシソルビシン、プロピオン酸ドロモスタノロン、エクリズマブ、エビルビシン、エボエチン、エルロチニブ、エストラムスチン、リン酸エトポシド、エトポシド、VP-16、エキセメスタン、クエン酸フェンタニル、フィルグラスチム、フロクスウリジン、フルダラビン、フルオロウラシル、フルベストラント、ゲフィチニブ、ゲムシタビン、酢酸ゴセレリン、酢酸ヒストレリン、ヒドロキシ尿素、イブリットマブチウキセタン、イダルビシン、イホスファミド、メシル酸イマチニブ、インターフェロン 2a、インターフェロン 2b、イリノテカン、ラパチニブジトシレート、レナリドミド、レトロゾール、ロイコボリン (leucovorin)、酢酸ロイプロリド、レバミゾール、ロムスチン、メクロレタミン、酢酸メガストロール、メルファラン、メルカプトプリン、メスナ、メトトレキサート、メトキサレン、マイトマイシンC、ミトタン、ミトキサントロン、フェンプロピオン酸ナンドロロン、ネララビン、ノフェツモマブ、オブレルベキン、オキサリプラチン、パクリタキセル、パリフェルミン、パミドロネート、パニツムマブ、ペガデマーズ、ペガスバルガーゼ、ペグフィルグラスチム、ペグインターフェロン 2b、ペメトレキセドナトリウム、ペントスタチン、ピボプロマン、プリカマイシン、ミトラマイシン、ボルフィマーナトリウム、プロカルバジン、キナクリン、ラスブリカーゼ、リツキシマブ、サルグラモスチム、ソラフェニブ、ストレプトゾシン、スニチニブ、マレイン酸スニチニブ、タルク、タモキシフェン、テモゾロミド、テニポシド、VM-26、テストラクトン、サリドマイド、チオグアニン、G-TG、チオテパ、トポテカン、トレミフェン、トシツモマブ、トラスツズマブ、トレチノインATRA、ウラシルマスタード、バルルビシン (valrunicin)、ビンブラスチン、ピンクリスチン、ビノレルビン、ボリノスタット、ゾレドロネート、ゾレドロン酸、アブラキサンおよびブレンツキシマブベドチンである、請求項 1 1 に記載の使用のための化合物。

【請求項 1 3】

構造：

## 【化 18】



(ここで、

結合 は、存在せず、または存在し、

X は、 $OR_1$ 、 $OR_3$  または  $NR_4R_5$  であり

ここで、 $R_1$  は、 $C_1 \sim C_{20}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{20}$  アルケニル、または  $C_2 \sim C_{20}$  アルキニルであり、

$R_3$  は、H、アルキル、アルキルアリール、アルキル -  $P(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $OP(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $O(CO) - OR_{10}$ 、アルキル -  $P(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ 、またはアルキル -  $OP(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$  であり、

$R_4$  および  $R_5$  は、それぞれ独立して、H、アルキル -  $P(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $OP(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $O(CO) - OR_{10}$ 、アルキル -  $P(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ 、またはアルキル -  $OP(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$  であり、

または、 $R_4$  と  $R_5$  は一緒になって、無置換のまたは置換されたシクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニルまたはヘテロシクロアルキルを形成し、

$R_9$  および  $R_{10}$  は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニル、またはアルキニルであり、

Y は、 $OR_1$ 、 $OR_6$  または  $NR_7R_8$  であり、

ここで、 $R_1$  は、 $C_1 \sim C_{20}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{20}$  アルケニル、または  $C_2 \sim C_{20}$  アルキニルであり、

$R_6$  は、アルキル -  $P(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $OP(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $O(CO) - OR_{10}$ 、アルキル -  $P(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ 、またはアルキル -  $OP(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$  であり、

$R_7$  および  $R_8$  は、それぞれ独立して、H、アルキル -  $P(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $OP(O)(OR_9)_2$ 、アルキル -  $O(CO) - OR_{10}$ 、アルキル -  $P(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$ 、またはアルキル -  $OP(O)(O - \text{アルキル} - O(CO) - OR_{10})_2$  であり、

または、 $R_7$  と  $R_8$  は一緒になって、無置換のまたは置換されたシクロアルキル、シクロアルケニル、シクロアルキニルまたはヘテロシクロアルキルを形成し、

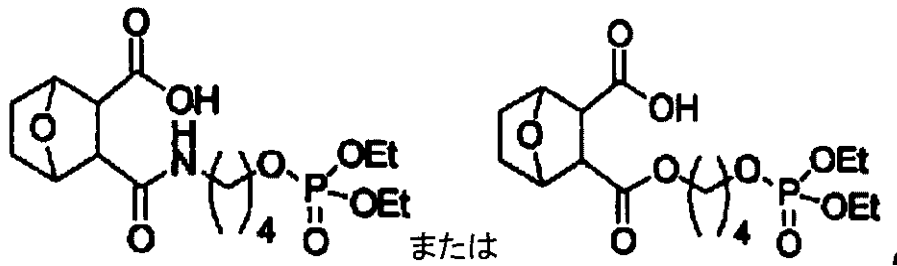
$R_9$  および  $R_{10}$  は、それぞれ独立して、H、アルキル、アルケニル、またはアルキニルであり、

X の 1 つが、OH、 $OCH_3$  または O - アルキルアリールである場合、Y は、 $NR_7R_8$  以外であり、ここで  $R_7$  および  $R_8$  は結合して、無置換のまたは置換されたピペラジン、モルホリンまたはチオモルホリンを形成する) を有する化合物またはその医薬的に許容される塩もしくはエステル。

## 【請求項 14】

構造：

【化 19】

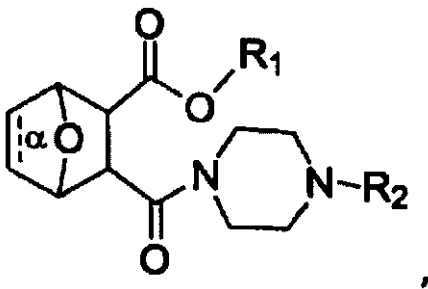


を有する、請求項 13 に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩もしくはエステル。

【請求項 15】

構造：

【化 20】



(ここで、

結合 は、存在せず、または存在し、

$R_1$  は、 $C_2 \sim C_{20}$  アルキル、 $C_2 \sim C_{20}$  アルケニル、または  $C_2 \sim C_{20}$  アルキニルであり

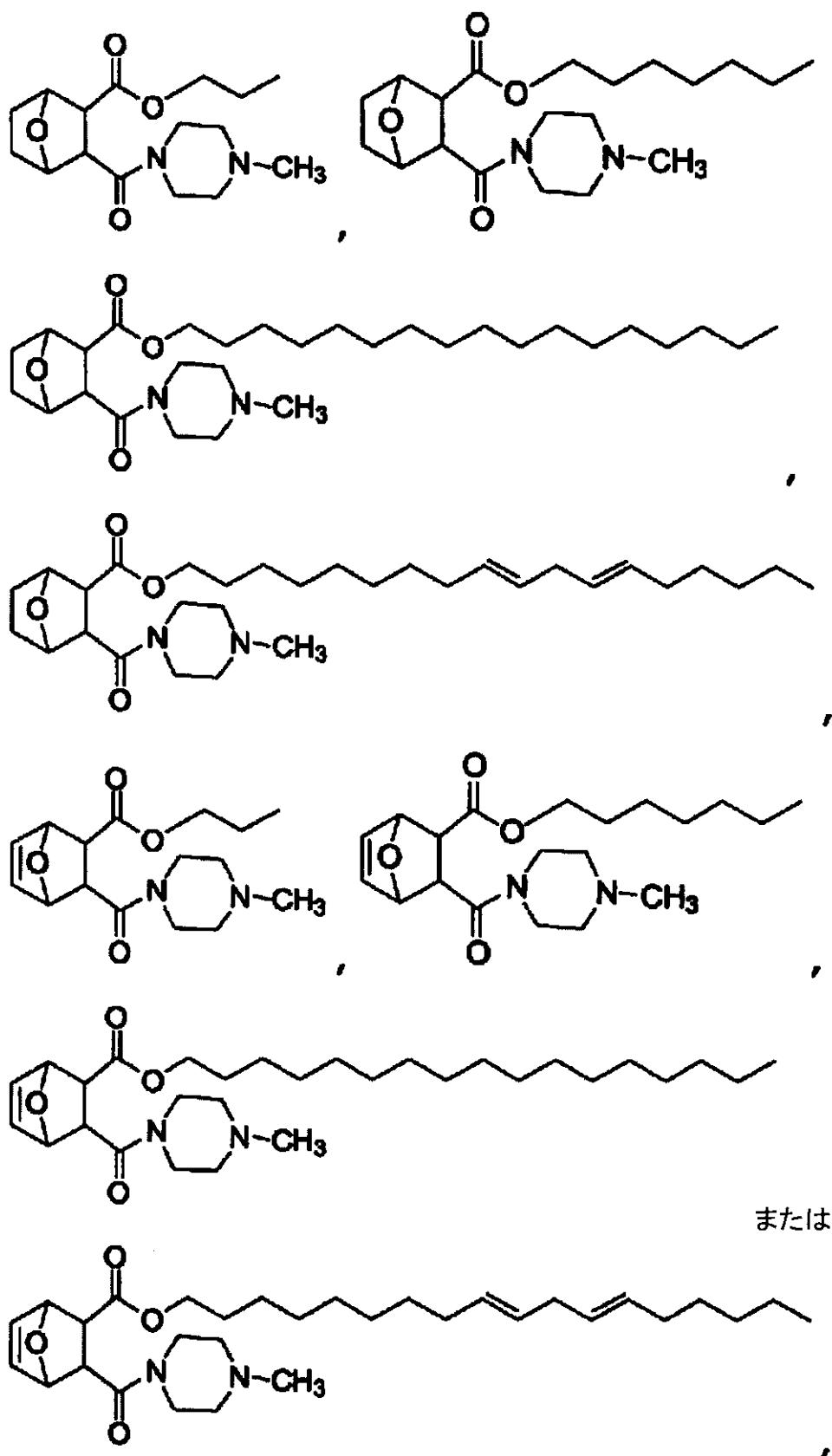
、

$R_2$  は、H、 $C_1 \sim C_{12}$  アルキル、 $C_1 \sim C_{12}$  アルケニル、 $C_1 \sim C_{12}$  アルキニル、 $C_1 \sim C_{12}$  アルキル - (フェニル)、 $C_1 \sim C_{12}$  アルキル - (OH)、または  $C(O)C(CH_3)_3$  である) を有する、請求項 13 に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 16】

構造：

【化 2 1】



を有する、請求項 1 5 に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩。