

【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 1 年 12 月 26 日 (2019.12.26)

【公開番号】特開 2018-108937 (P2018-108937A)

【公開日】平成 30 年 7 月 12 日 (2018.7.12)

【年通号数】公開・登録公報 2018-026

【出願番号】特願 2016-221064 (P2016-221064)

【国際特許分類】

C 0 7 D 493/22 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/357 (2006.01)

A 6 1 K 31/695 (2006.01)

C 0 7 D 317/26 (2006.01)

C 0 7 D 321/00 (2006.01)

C 0 7 D 407/06 (2006.01)

C 0 7 F 7/18 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 493/22 C S P

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/04

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 31/357

A 6 1 K 31/695

C 0 7 D 317/26

C 0 7 D 321/00

C 0 7 D 407/06

C 0 7 F 7/18 S

C 0 7 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】令和 1 年 11 月 11 日 (2019.11.11)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

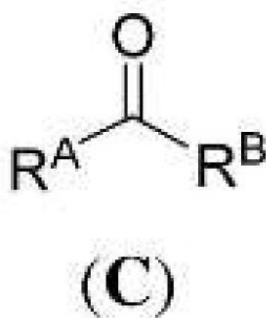
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

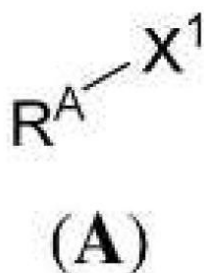
式 (C) :

【化 1】



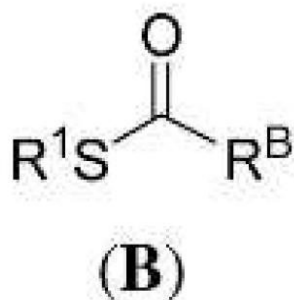
で表される化合物またはその塩を調製するための方法であって、方法が、パラジウム、亜鉛、および電子移動開始剤の存在下、式 (A) :

【化 2】



で表される化合物またはその塩を、式 (B) :

【化 3】



で表される化合物またはその塩と反応させることを含み、式中 :

R^A は、任意置換アルキルである ;

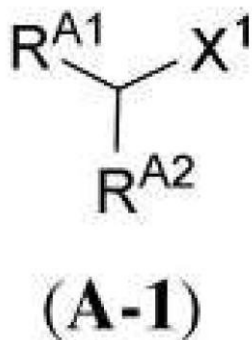
R^B は、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換アリール、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロアリール、または任意置換ヘテロシクリルである ; 任意に、ここで R^A および R^B は、任意置換アルキレン、任意置換ヘテロアルキレン、任意置換アルケニレン、任意置換ヘテロアルケニレン、任意置換アルキニレン、任意置換ヘテロアルキニレン、任意置換アリーレン、任意置換ヘテロアリーレン、任意置換カルボシクリレン、任意置換ヘテロシクリレン、任意置換アシレン、およびそれらの組み合わせからなる群から選択されるリンカーを介して、連結される ;

X¹ は、ハロゲンまたは脱離基である ; および

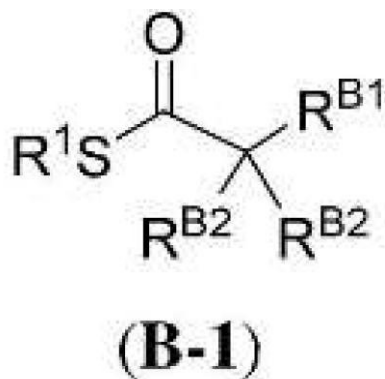
R¹ は、任意置換アルキルである、前記方法。

【請求項 2】

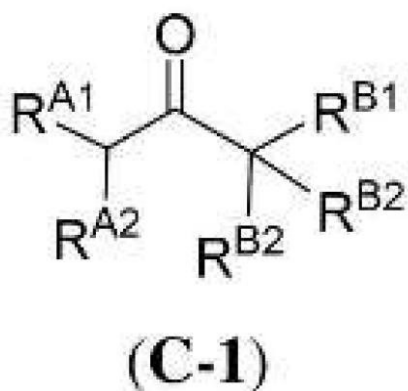
式 (A) で表される化合物が、式 (A - 1) :
【化 4】



で表されるか、またはその塩である；式 (B) で表される化合物が、式 (B - 1) :
【化 5】



で表されるか、またはその塩である；および式 (C) で表される化合物が、式 (C - 1) :
【化 6】



で表されるか、またはその塩であり、式中：

X¹ は、ハロゲンまたは脱離基である；

R¹ は、任意置換アルキルである；および

R^{A1}、R^{A2}、R^{B1}、および R^{B2} は、独立して、水素、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換アリール、任意置換カルボシクリル、任

意置換ヘテロアリール、または任意置換ヘテロシクリルである；

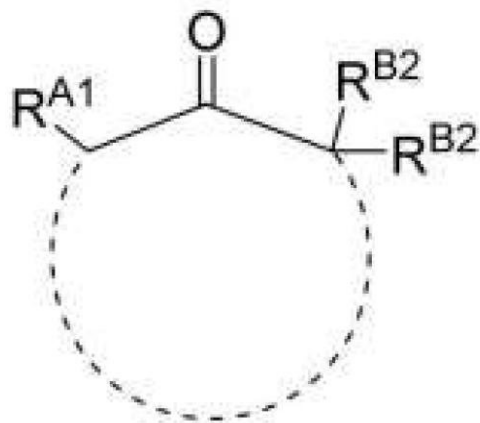
任意に、ここで R^{A1} および R^{B1} は、任意置換アルキレン、任意置換ヘテロアルキレン、任意置換アルケニレン、任意置換ヘテロアルケニレン、任意置換アルキニレン、任意置換ヘテロアルキニレン、任意置換アリーレン、任意置換ヘテロアリーレン、任意置換カルボシクリレン、任意置換ヘテロシクリレン、任意置換アシレン、およびそれらの組み合わせからなる群から選択されるリンカーを介して、連結される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

方法が、

式 (C - 2) :

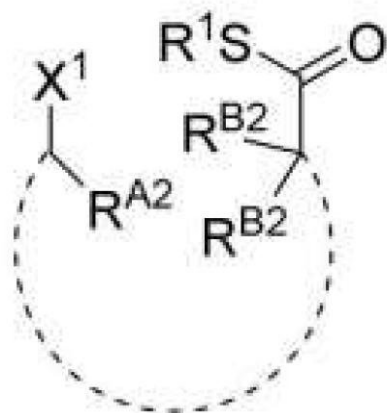
【化 7】



(C-2)

で表される化合物またはその塩の調製用であって、方法が、パラジウム、亜鉛、および電子移動開始剤の存在下、式 (A - B) :

【化 8】



(A-B)

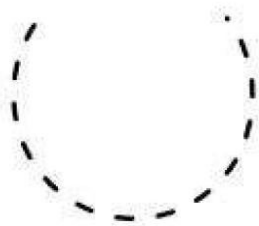
で表される化合物またはその塩を反応させることを含む；式中：

R^{A2} および R^{B2} の各々は、任意置換アルキル、任意置換アルケニル、任意置換アルキニル、任意置換アリール、任意置換カルボシクリル、任意置換ヘテロアリール、または任意置換ヘテロシクリルである；

X^1 は、ハロゲンまたは脱離基である；

R^1 は、任意置換アルキルである；および

【化 9】

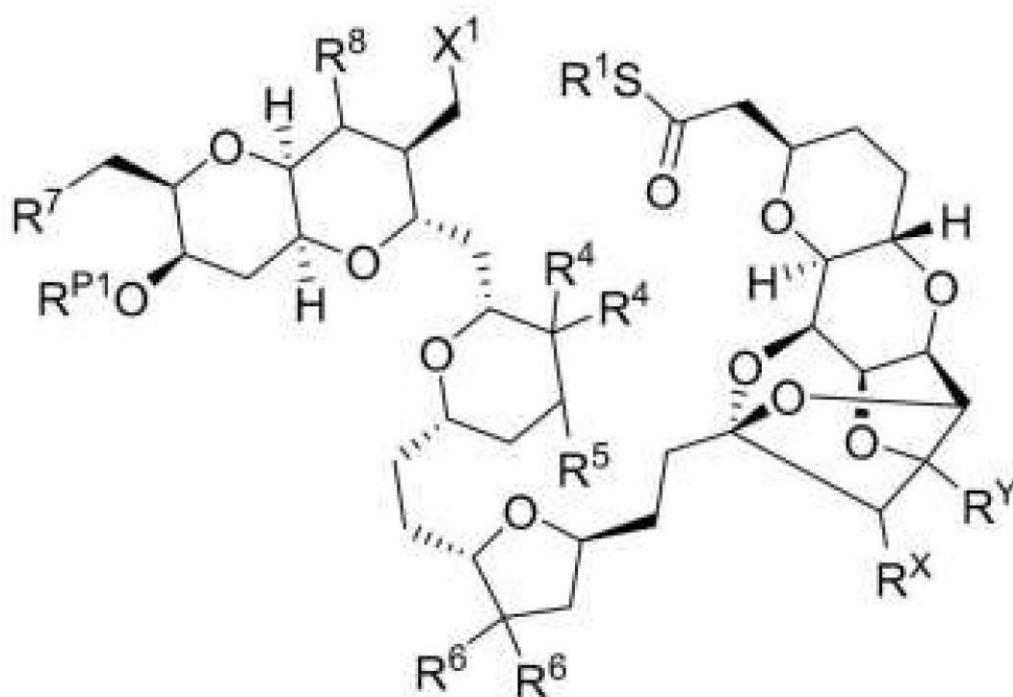


は、任意置換アルキレン、任意置換ヘテロアルキレン、任意置換アルケニレン、任意置換ヘテロアルケニレン、任意置換アルキニレン、任意置換ヘテロアルキニレン、任意置換アリーレン、任意置換ヘテロアリーレン、任意置換カルボシクリレン、任意置換ヘテロシクリレン、任意置換アシレン、およびそれらの組み合わせからなる群から選択されるリンカーを表す、請求項1に記載の方法。

【請求項 4】

式 (H - 3)：

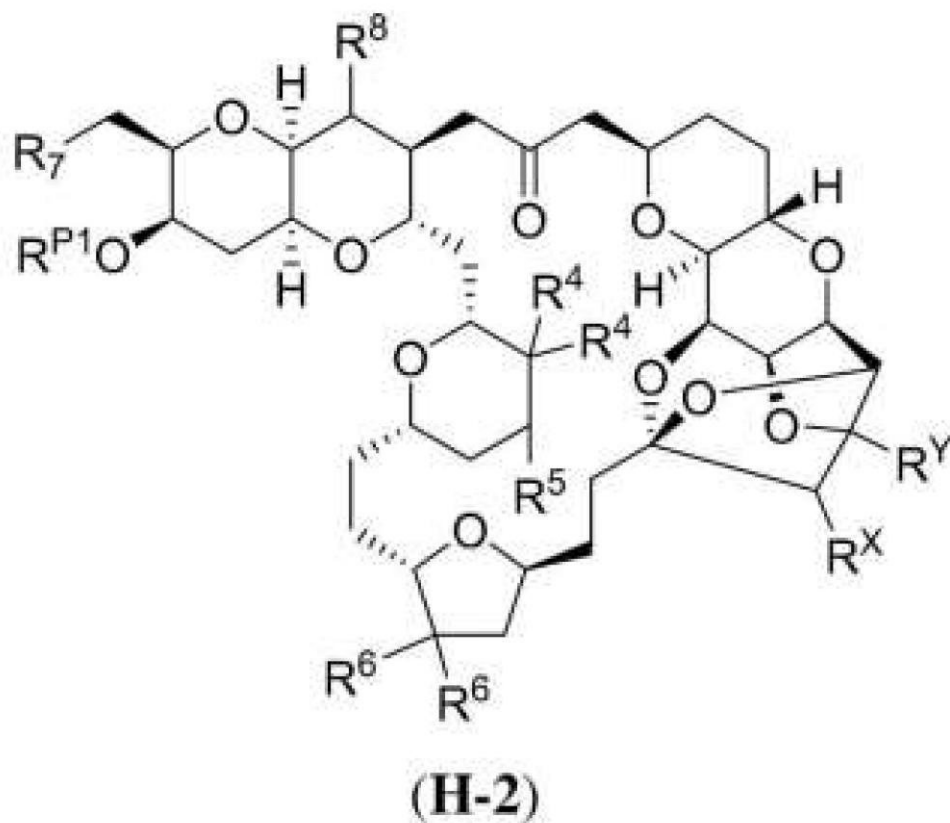
【化 10】



(H-3)

で表される化合物またはその塩を、パラジウム、亜鉛、および一電子移動開始剤の存在下で、反応させて、式 (H - 2)：

【化 1 1】



で表される化合物またはその塩を産出することを含み、式中：

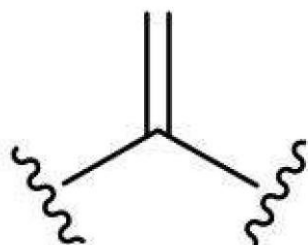
X^1 は、ハロゲンまたは脱離基である；

R^1 は、任意置換アルキルである；

R^{P1} は、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；

R^4 の各々は、独立して、水素、ハロゲン、任意置換アルキルであるか、または 2 個の R^4 基は、一緒になって：

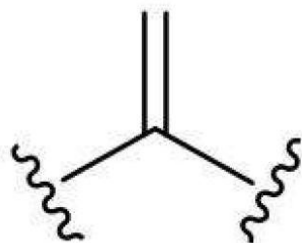
【化 1 2】



形成する；

R^6 の各々は、独立して、水素、ハロゲン、任意置換アルキルであるか、または 2 個の R^6 基は、一緒になって：

【化 1 3】



を形成する；

R^5 は、水素、ハロゲン、または任意置換アルキルである；

R^7 は、 $-CH_2OR^{7a}$ 、 $-CO_2R^{7a}$ 、または $-C(O)H$ である；

R^8 は、水素、ハロゲン、または任意置換アルキルである；

R^X は、水素または $-OR^{Xa}$ であり、ここで R^{Xa} は、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；および

R^Y は、水素または $-OR^{Ya}$ であり、ここで R^{Ya} は、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；

任意に、 R^{Xa} および R^{Ya} は、それらの介在原子とともに連結されて、任意置換ヘテロシクリルを形成する；および

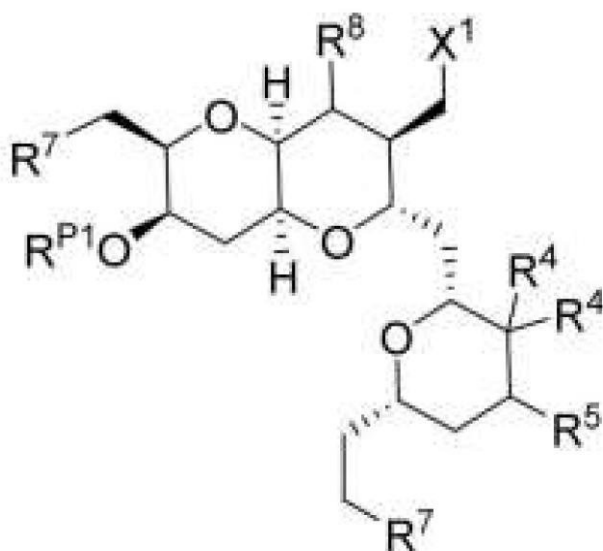
任意に、 R^{P1} および R^{7a} は、介在原子とともに一緒になって、任意置換ヘテロシクリルを形成する、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 5】

以下のステップ：

(a) 式 (H - A - 1)：

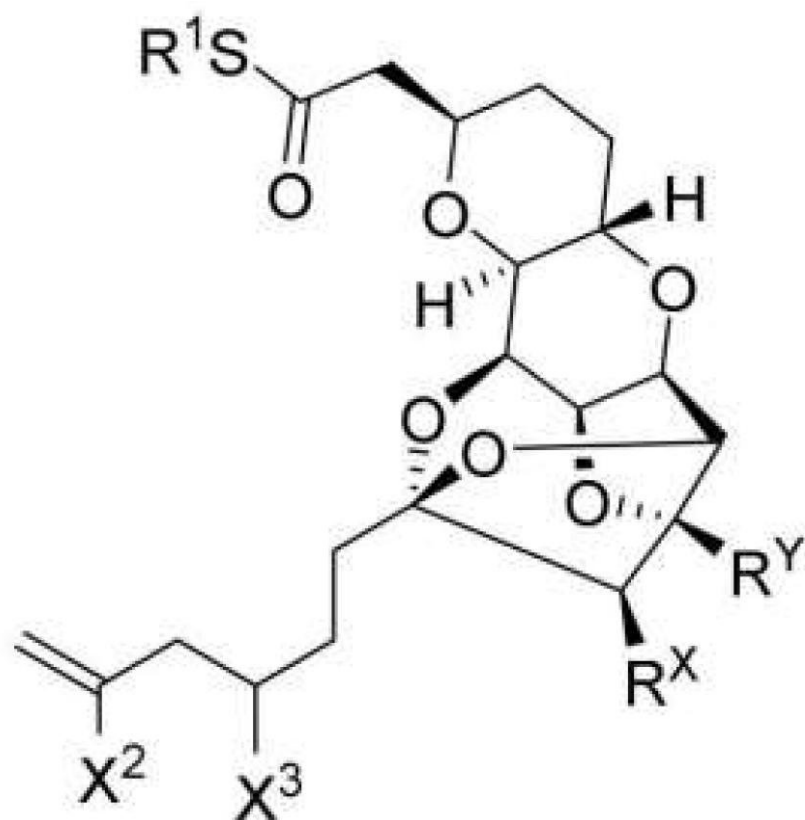
【化 1 4】



(H-A-1)

で表される化合物またはその塩を、ニッケルおよびクロムの存在下で、式 (E - 4)：

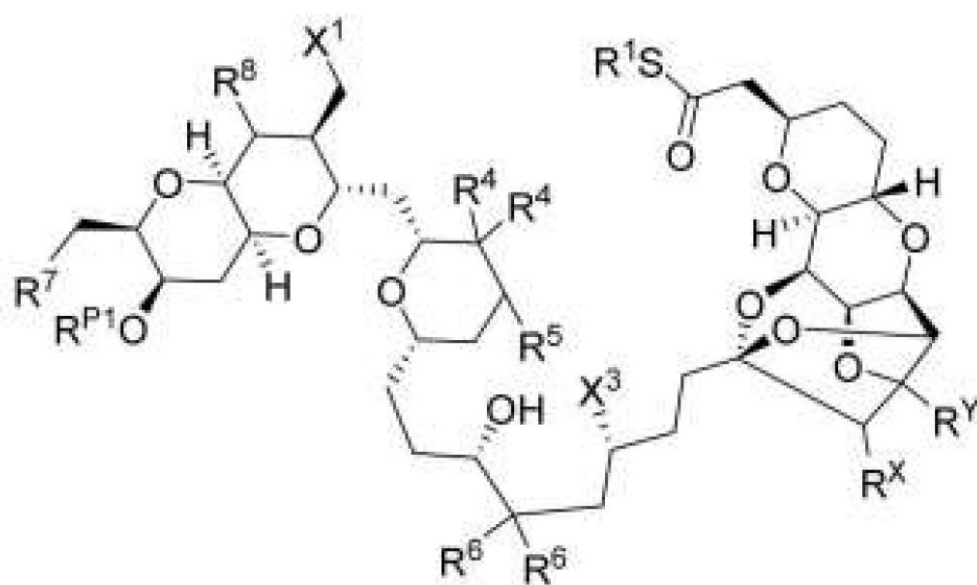
【化 1 5】



(E-4)

で表される化合物またはその塩と反応させて、式 (H - 4) :

【化 1 6】

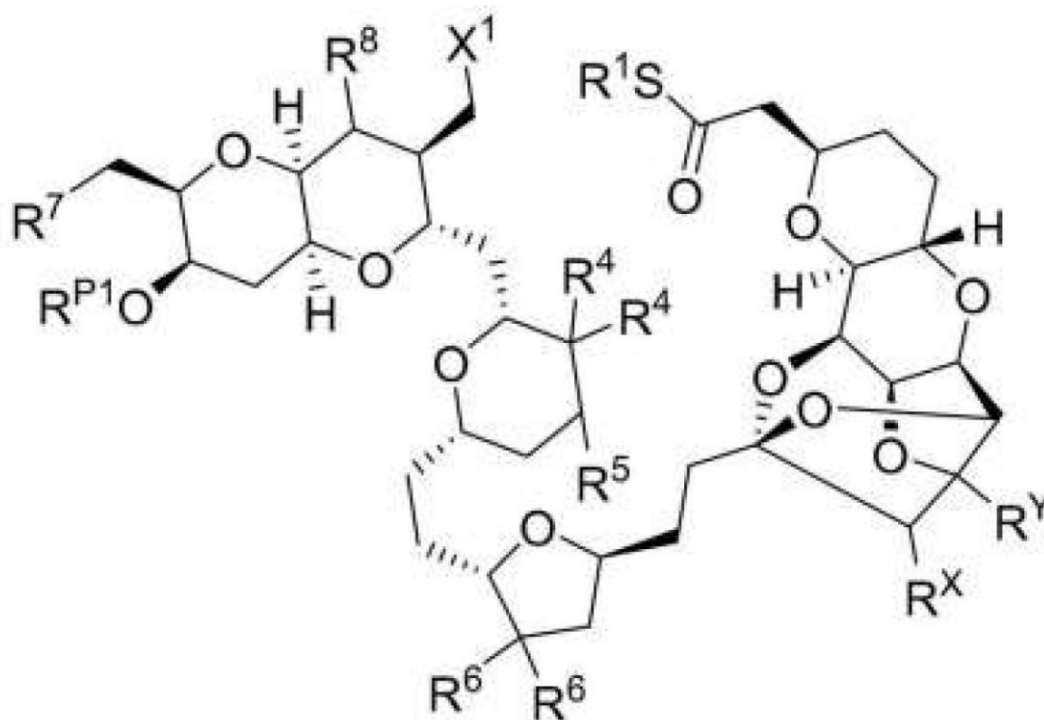


(H-4)

で表される化合物またはその塩を産出すること、および

(b) ステップ (a) で形成された式 (H-4) で表される化合物を、酸の存在下で反応させて、式 (H-3) :

【化 17】



(H-3)

で表される化合物またはその塩を産出すること

をさらに含み、式中 :

X¹、X²、および X³ は、独立して、ハロゲンまたは脱離基である ;

R¹ は、任意置換アルキルである ;

R² は、-OR^{P1} または -N(R^N)₂ である ;

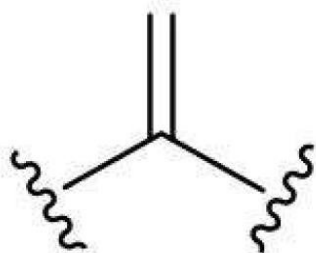
R^N の各々は、水素、任意置換アルキル、または窒素保護基であるか、または任意に 2 個の R^N は、介在原子とともに連結されて、任意置換ヘテロシクリルまたは任意置換ヘテロアールを形成する ;

R^{P1} は、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である ;

R³ は、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である ;

R⁴ の各々は、独立して、水素、ハロゲン、任意置換アルキルであるか、または 2 個の R⁴ 基は、一緒になって :

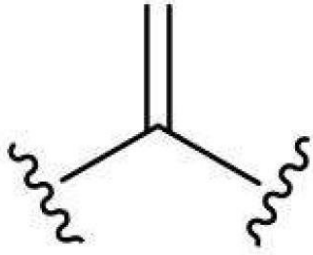
【化 18】



を形成する ;

R^6 の各々は、独立して、水素、ハロゲン、任意置換アルキルであるか、または 2 個の R^6 基は、一緒になって：

【化 19】



を形成する；

R^5 は、水素、ハロゲン、または任意置換アルキルである；

R^7 は、 $-CH_2OR^{7a}$ 、 $-CO_2R^{7a}$ 、または $-C(O)H$ である；

R^X は、水素または $-OR^{Xa}$ であり、ここで R^{Xa} は、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；および

R^Y は、水素または $-OR^{Ya}$ であり、ここで R^{Ya} は、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；

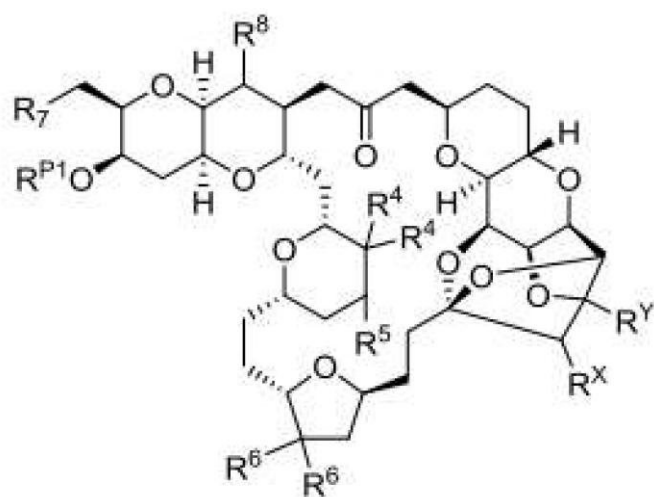
任意に、 R^{Xa} および R^{Ya} は、それらの介在原子とともに連結されて、任意置換ヘテロシクリルを形成する；および

任意に、 R^{P1} および R^{7a} は、介在原子とともに一緒になって、任意置換ヘテロシクリルを形成する、請求項 4 に記載の方法。

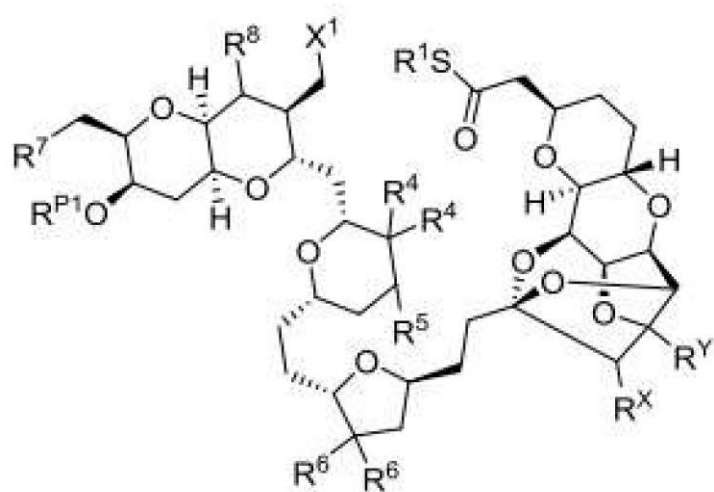
【請求項 6】

式 $(H-2)$ 、 $(H-3)$ 、 $(H-4)$ 、 $(E-4)$ 、 $(H-A-1)$ 、 $(E-B-2)$ 、または $(E-B-1)$ ：

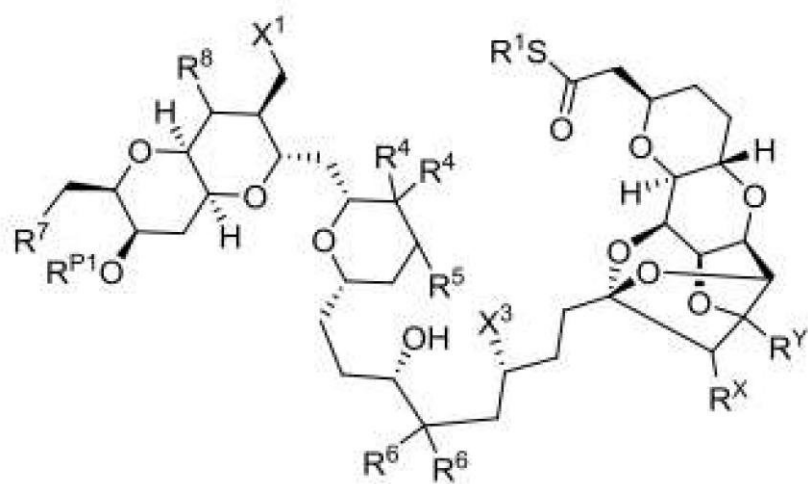
【化 2 0】



(H-2)、

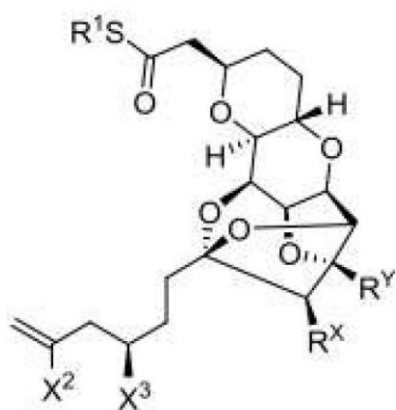


(H-3)、

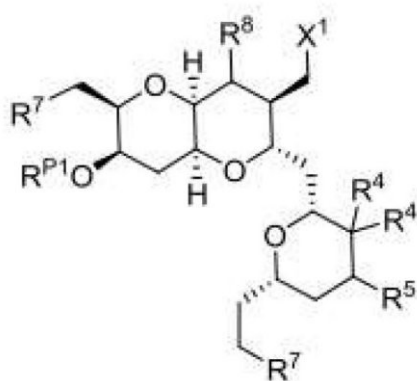


(H-4)、

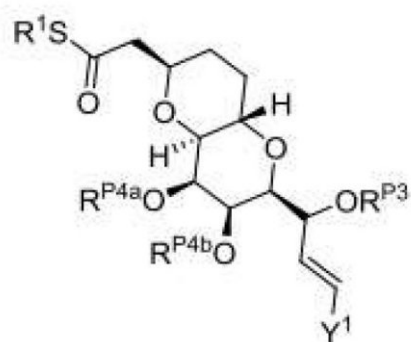
【化 2 1】



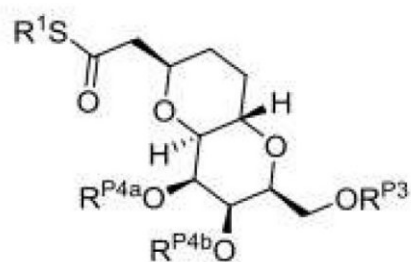
(E-4)、



(H-A-1)、



(E-B-2)、または



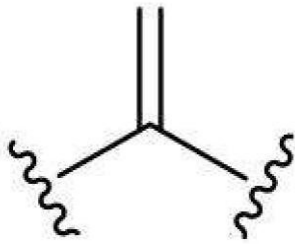
(E-B-1)、

で表される化合物またはその塩であって、式中：

R^{P1} は、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；

R^4 の各々は、独立して、水素、ハロゲン、任意置換アルキルであるか、または 2 個の R^4 基は、一緒になって：

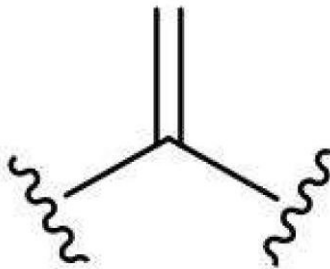
【化 2 2】



を形成する；

R^6 の各々は、独立して、水素、ハロゲン、任意置換アルキルであるか、または 2 個の R^6 基は、一緒になって：

【化 2 3】



を形成する；

R^5 は、水素、ハロゲン、または任意置換アルキルである；

R^7 は、 $-CH_2OR^{7a}$ 、 $-CO_2R^{7a}$ 、または $-C(O)H$ である；

R^8 は、水素、ハロゲン、または任意置換アルキルである；

R^1 は、任意置換アルキルである；および

R^{P3} 、 R^{P4a} 、および R^{P4b} は、独立して、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；

任意に、 R^{P4a} および R^{P4b} は、介在原子とともに連結されて、任意置換ヘテロシクリルを形成する；

Y^1 は、ハロゲン、脱離基、またはシリルである；

X^1 は、ハロゲンまたは脱離基である；

X^2 および X^3 は、独立して、ハロゲンまたは脱離基である；

R^X は、水素または $-OR^{Xa}$ であり、ここで R^{Xa} は、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；および

R^Y は、水素または $-OR^{Ya}$ であり、ここで R^{Ya} は、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；

任意に、 R^{Xa} および R^{Ya} は、それらの介在原子とともに連結されて、任意置換ヘテロシクリルを形成する；および

任意に、 R^{7a} および R^{P1} は、介在原子とともに連結されて、任意置換ヘテロシクリルを形成する、前記化合物 またはその塩。

【請求項 7】

式 (H-1)：

The image shows a complex polycyclic chemical structure, likely a steroid or terpenoid derivative. It features multiple fused rings, including a central six-membered ring with a ketone group. Various substituents are attached to the rings, labeled as R^4 , R^5 , R^6 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^x , and R^y . There are also several hydroxyl groups ($-OH$) and ether linkages ($-O-$) present. The structure is highly branched and contains several stereocenters indicated by wedged and dashed bonds.

(H-1)

R^{P5} 、 R^{P6} 、および R^{P7} は、独立して、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；

R⁴の各々は、独立して、水素、ハロゲン、または任意置換アルキルであるか、または2個のR⁴基は、一緒になって：

A Feynman diagram showing a Z boson (represented by a vertical double line) decaying into a photon (represented by a wavy line) and a gluon (represented by a curly line).

R⁶の各々は、独立して、水素、ハロゲン、または任意置換アルキルであるか、または2個のR⁶基は、一緒になって：

A Feynman diagram showing a Z boson (represented by a vertical double line) decaying into a photon (represented by a wavy line on the left) and a gluon (represented by a wavy line on the right).

R^X は、水素または -OR^{Xa} であり、ここで R^{Xa} は、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；および

R^Y は、水素または -OR^{Y a} であり、ここで R^{Y a} は、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；

任意に、 R^X および R^Y は、介在原子とともに連結されて、任意置換ヘテロシクリ

ルを形成する；

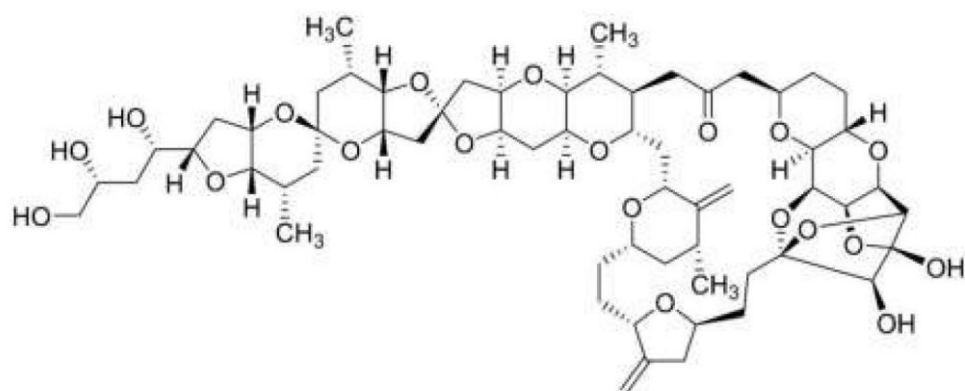
任意に、 R^{P5} および R^{P6} は、介在原子とともに連結されて、任意置換ヘテロシクリルを形成する； or

任意に、 R^{P6} および R^{P7} は、介在原子とともに連結されて、任意置換ヘテロシクリルを形成する、前記化合物。

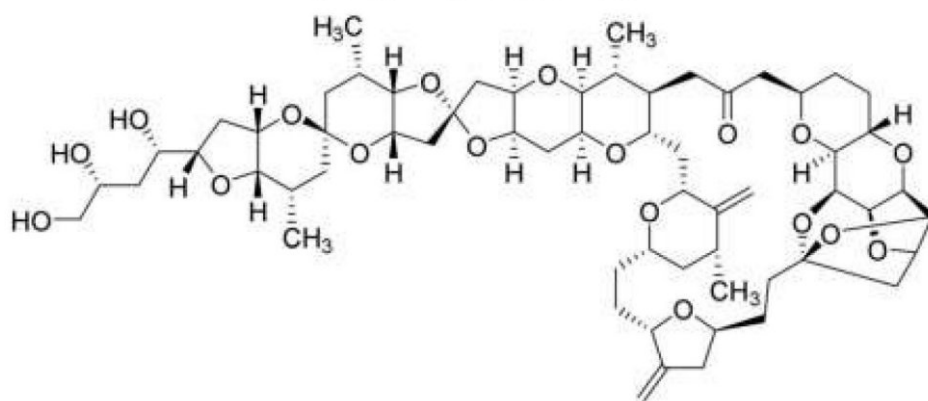
【請求項 8】

化合物が、以下：

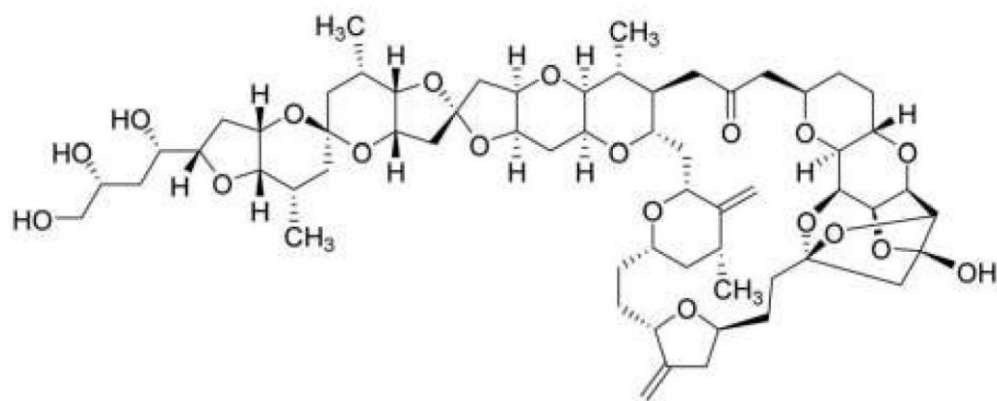
【化 27】



(ケトーハリコンドリン A),



(ケトーハリコンドリン B),



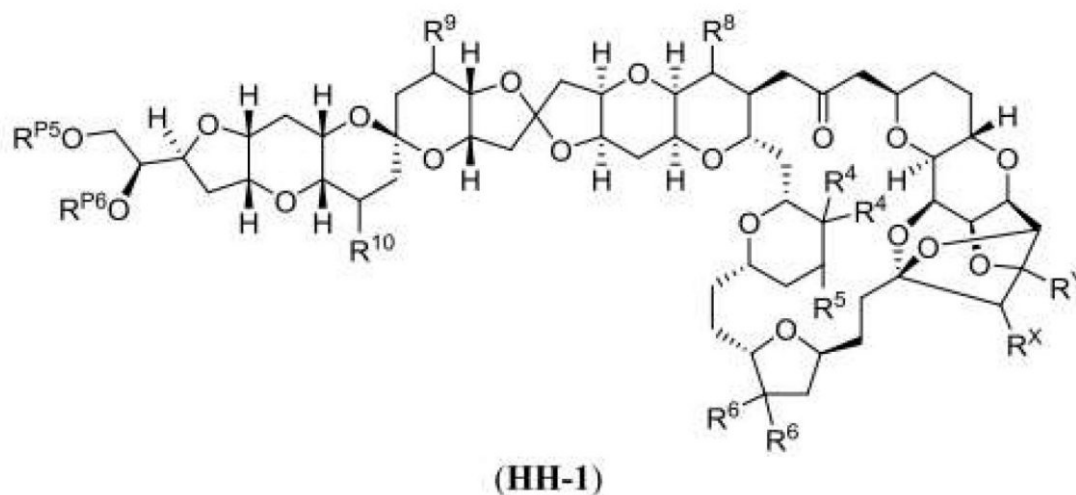
(ケトーハリコンドリン C),

およびそれらの薬学的に許容し得る塩からなる群から選択される、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

式 (HH-1) :

【化 28】

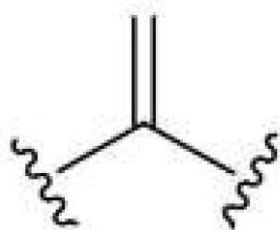


で表される化合物またはその薬学的に許容し得る塩であって、式中：

R^{P5} および R^{P6} は、独立して、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；

R^4 の各々は、独立して、水素、ハロゲン、または任意置換アルキルであるか、または 2 個の R^4 基は、一緒になって：

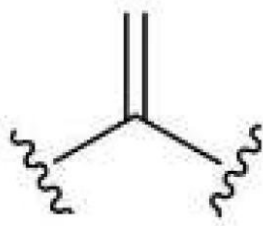
【化 29】



を形成する；

R^6 の各々は、独立して、水素、ハロゲン、または任意置換アルキルであるか、または 2 個の R^6 基は、一緒になって：

【化 30】



を形成する；

R^5 、 R^8 、 R^9 、および R^{10} は、水素、ハロゲン、または任意置換アルキルである；

R^X は、水素または $-OR^{Xa}$ であり、ここで R^{Xa} は、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；および

R^Y は、水素または $-OR^{Ya}$ であり、ここで R^{Ya} は、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；

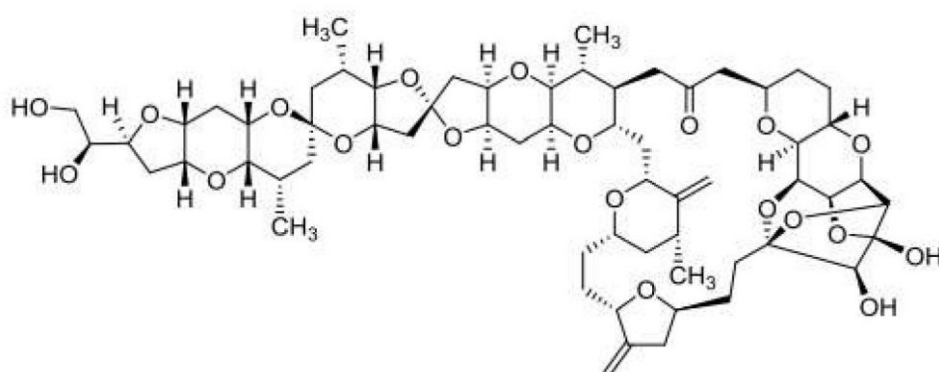
任意に、 R^{Xa} および R^{Ya} は、それらの介在原子とともに連結されて、任意置換ヘテロシクリルを形成する；および

任意に、 R^{P5} および R^{P6} は、介在原子とともに連結されて、任意置換ヘテロシクリルを形成する、前記化合物。

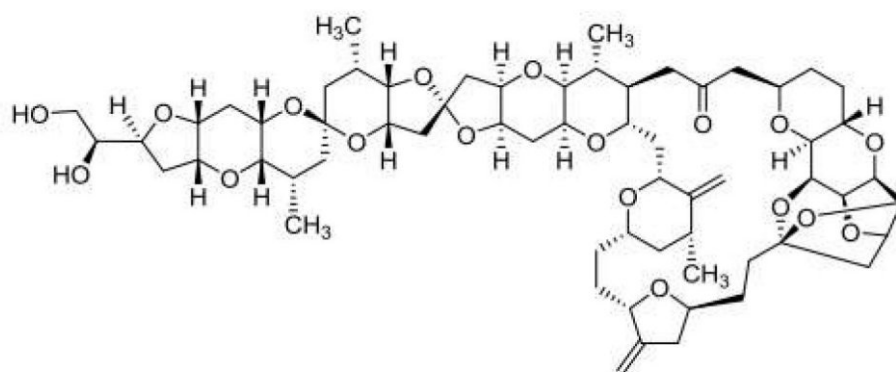
【請求項 10】

化合物が、以下：

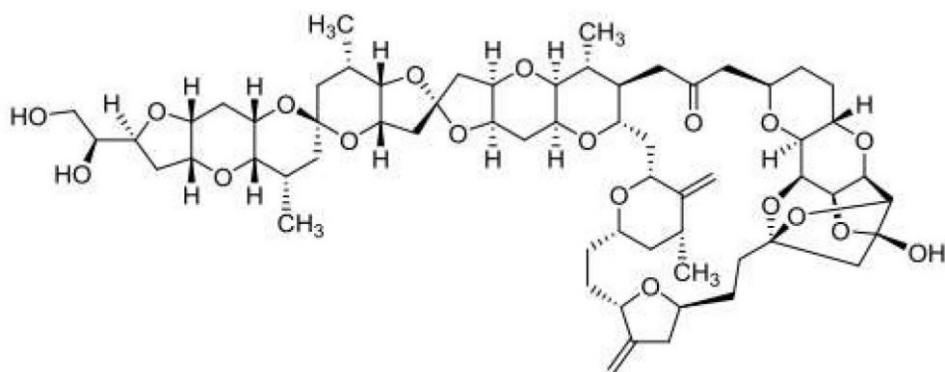
【化 3 1】



(ケト-ホモハリコンドリン A)、



(ケト-ホモハリコンドリン B)、



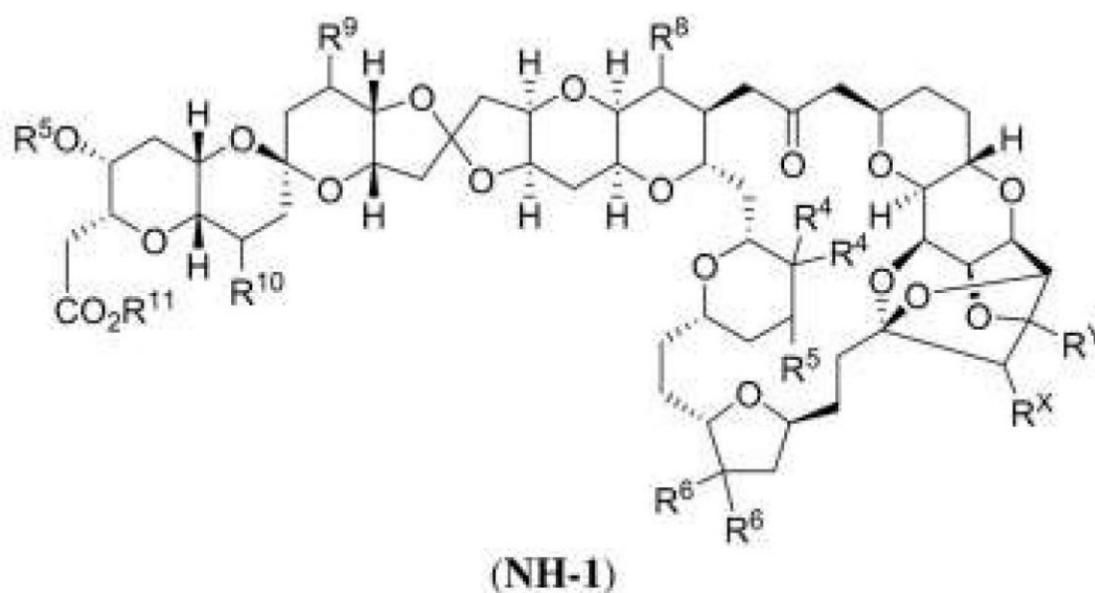
(ケト-ホモハリコンドリン C)、

およびそれらの薬学的に許容し得る塩からなる群から選択される、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

式 (NH - 1) :

【化 3 2】

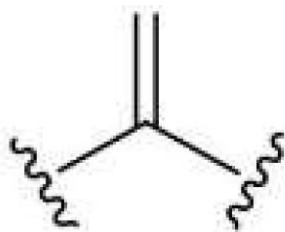


で表される化合物またはその薬学的に許容し得る塩であって、式中：

R^5 および R^{11} は、独立して、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；

R^4 の各々は、独立して、水素、ハロゲン、または任意置換アルキルであるか、または2個の R^4 基は、一緒になって：

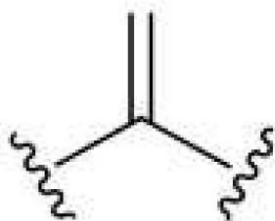
【化 3 3】



を形成する；

R^6 の各々は、独立して、水素、ハロゲン、または任意置換アルキルであるか、または2個の R^6 基は、一緒になって：

【化 3 4】



を形成する；

R^8 および R^9 は、独立して、水素、ハロゲン、または任意置換アルキルである；

R^X は、水素または $-OR^{Xa}$ であり、ここで R^{Xa} は、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；および

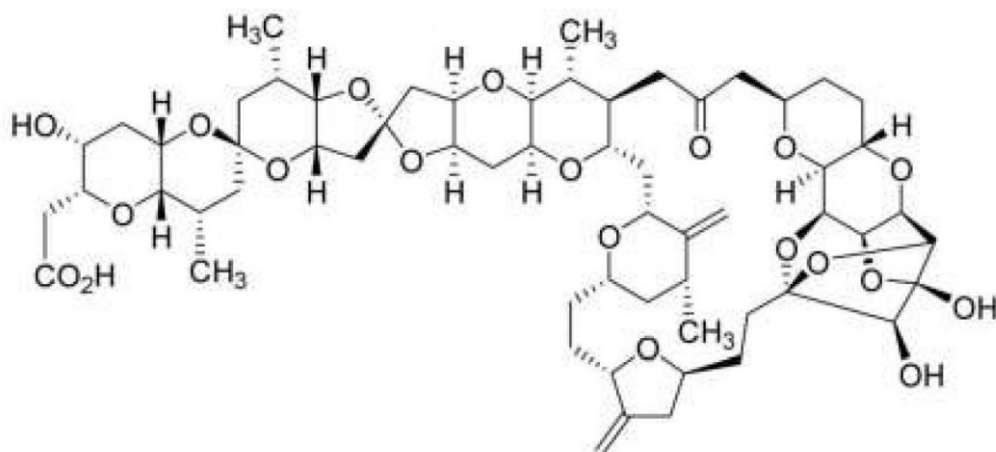
R^Y は、水素または $-OR^{Ya}$ であり、ここで R^{Ya} は、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；

任意に、 R^{Xa} および R^{Ya} は、それらの介在原子とともに連結されて、任意置換ヘテロシクリルを形成する、前記化合物。

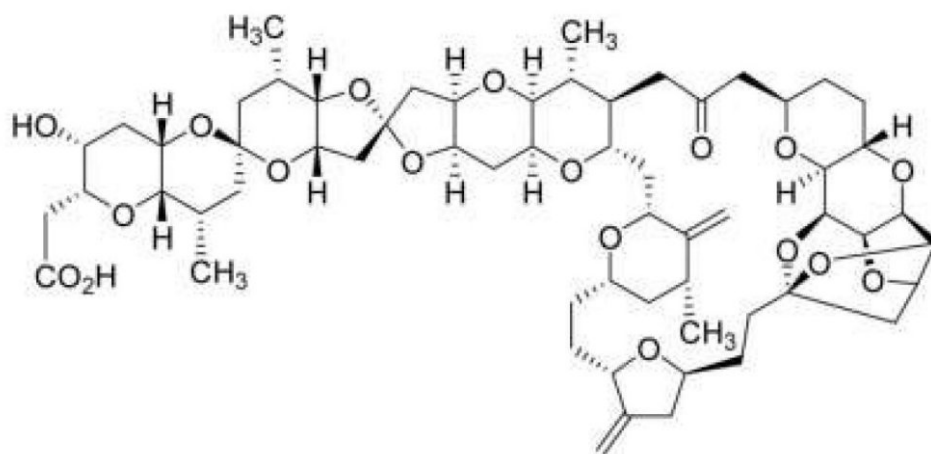
【請求項 12】

化合物が、以下：

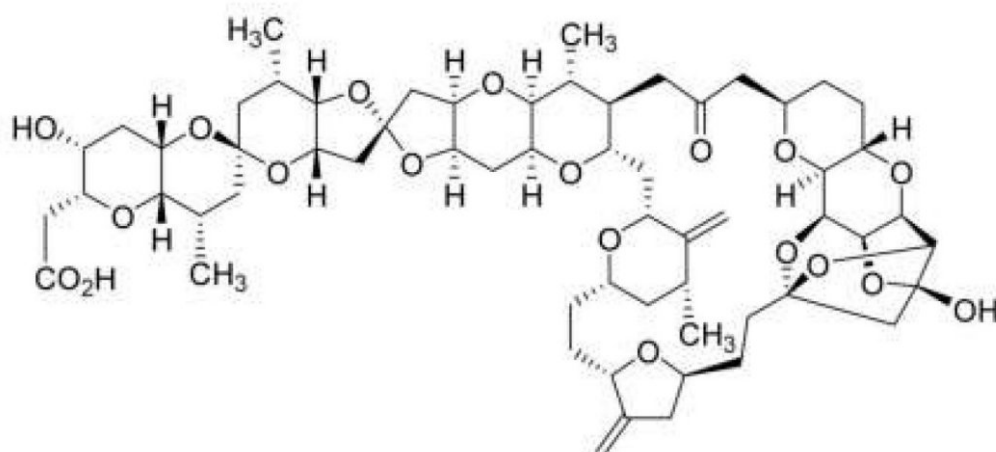
【化 35】



(ケートノルハリコンドリン A),



(ケートノルハリコンドリン B),



(ケートノルハリコンドリン C),

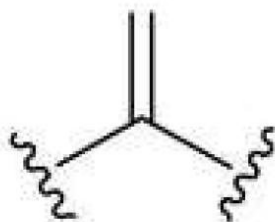
およびそれらの薬学的に許容し得る塩からなる群から選択される、請求項 11 に記載の化

合物。

【請求項 13】

2 個の R^4 が、一緒になって：

【化 36】



を形成する、請求項 7、9、および 11 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 14】

R^5 が、任意置換 $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり；任意に

R^5 が、非置換 $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり；任意に

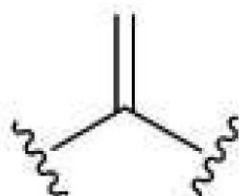
R^5 が、メチルである、請求項 7、9、11 および 13 のいずれか一項に記載の化合物

。

【請求項 15】

2 個の R^6 が、一緒になって：

【化 37】



を形成する、請求項 7、9、11、13 および 14 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 16】

R^X が、水素であり、および R^Y が、水素である、請求項 7、9、11 および 13 ~ 15 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 17】

R^{P5} および R^{P6} が、水素である、請求項 7、9、および 13 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 18】

R^{P7} が、水素である、請求項 7、および 13 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 19】

R^8 、 R^9 、および R^{10} が、任意置換 $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり；任意に

R^8 、 R^9 、および R^{10} が、非置換 $C_{1 \sim 6}$ アルキルであり；任意に

R^8 、 R^9 、および R^{10} が、メチルである、請求項 7、9、11 および 13 ~ 18 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 20】

R^{11} が、水素である、請求項 11 および 13 ~ 19 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 21】

R^X が $-OR^{Xa}$ 、および R^Y が $-OR^{Ya}$ であり；任意に、 R^X および R^Y が $-OH$ である、請求項 7、9、11、13 ~ 15 および 17 ~ 20 のいずれか一項に記載の化合

物。

【請求項 2 2】

R^X が水素、および R^Y が $-OR^Y$ であり；任意に、 R^X が水素および R^Y が $-OH$ である、請求項 7、9、11、13～15 および 17～20 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 3】

請求項 7～22 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩、および任意に薬学的に許容し得る賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項 2 4】

有糸分裂の阻害を、これを必要とする対象において行うことにおける使用のための、請求項 7～22 のいずれか一項に記載の化合物または、その薬学的に許容し得る塩。

【請求項 2 5】

対象の細胞におけるアポトーシスを始動させることにおける使用のための、請求項 7～22 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩。

【請求項 2 6】

異常な細胞増殖に関連する状態の処置を、これを必要とする対象において行うことにおける使用のための、請求項 7～22 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩であって；任意に状態はがんであり；任意にがんは、転移性乳がん、非小細胞肺がん、前立腺がん、または肉腫である、前記化合物、またはその薬学的に許容し得る塩。

【請求項 2 7】

化合物が、微小管に結合し；任意に化合物が、既存の微小管のプラス末端の高親和性部位へ結合し；任意に化合物が、微小管動態の阻害剤である、請求項 7～22 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0007

【補正方法】変更

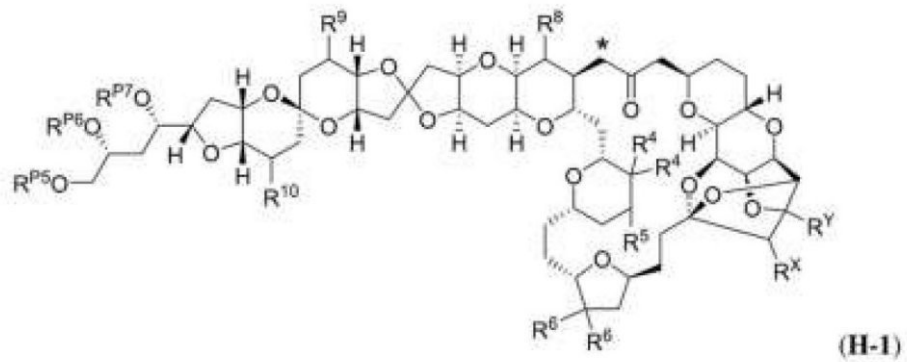
【補正の内容】

【0007】

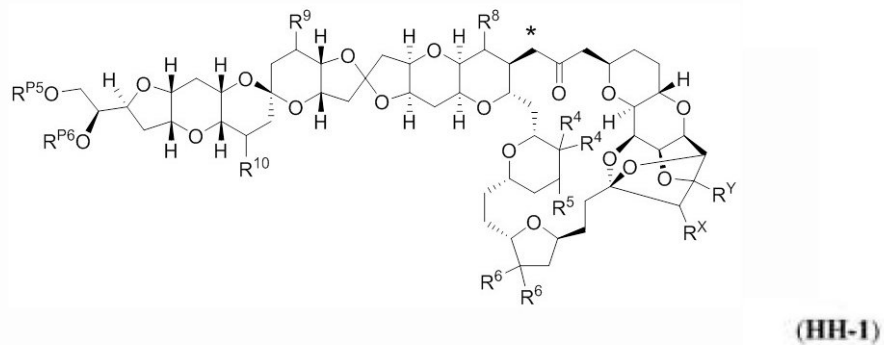
本明細書に提供される方法はまた、式 (H-1)、(HH-1)、および (NH-1) で表される化合物を包含する、ハリコンドリンのケト類似体（例として、ハリコンドリン A、B、C；ホモハリコンドリン A、C、B、ノルハリコンドリン A、B、C）の調製にも有用である。これらのケト類似体は、ハリコンドリンが典型的にはラクトンエステル（下の式において、* によって表示される）を包含するケトンを含む。

【化 6】

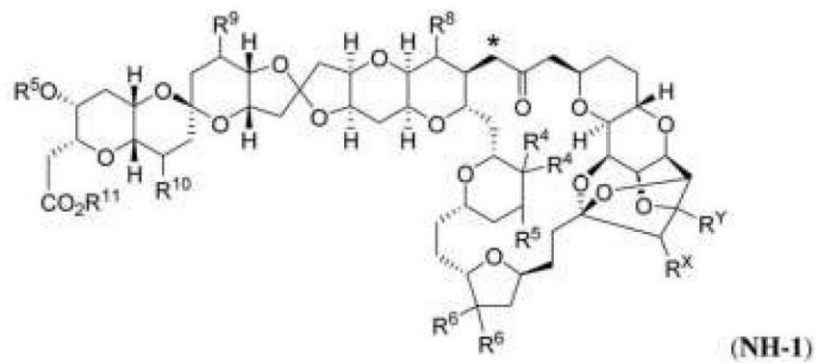
ハリコンドリンA、B、Cのケト類似体



ホモハリコンドリンA、B、Cのケト類似体



ノルハリコンドリンA、B、Cのケト類似体



【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0106

【補正方法】変更

【補正の内容】

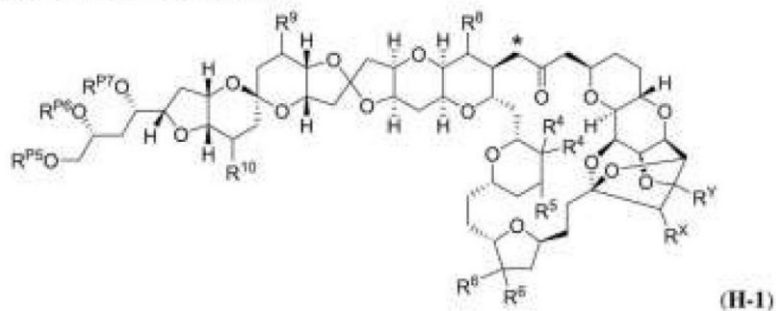
【0106】

エリブリン、およびそれらの類似体の調製に有用な方法に加えて、本発明はまた、ハリコンドリン類似体（例として、ハリコンドリンA、B、Cの類似体；ホモハリコンドリンA、B、Cの類似体；およびノルハリコンドリンA、B、およびCの類似体）の調製に有用な方法も提供する。とりわけ、本明細書に提供されるパラジウム媒介ケトール化反応は

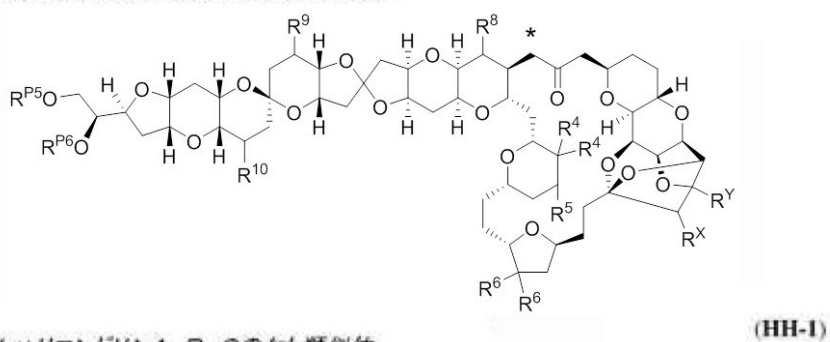
、ハリコンドリンのケト類似体の調製に使用され得る。ハリコンドリンのケト類似体は、天然に存在するハリコンドリンが、ラクトンエステル（式（H - 1）、（HH - 1）、および（NH - 1）で表される化合物上、* によって表示される）を包含するところのケトンを含む。

【化 4 7】

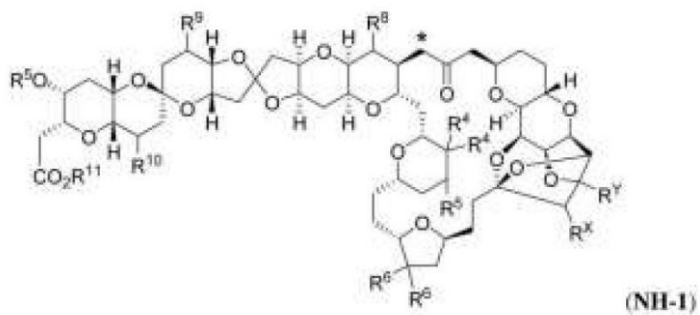
ハリコンドリンA、B、Cのケト類似体



ホモハリコンドリンA、B、Cのケト類似体



ノルハリコンドリンA、B、Cのケト類似体



【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 3 8

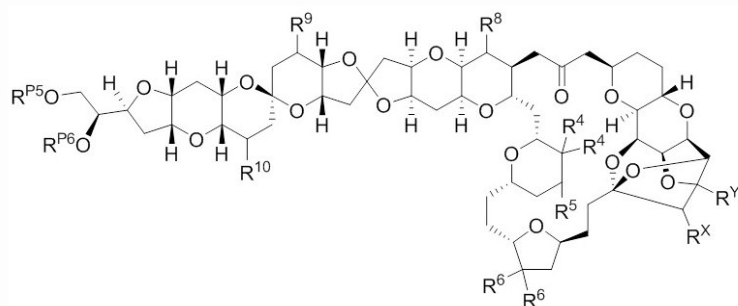
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 3 8】

本明細書に提供されるのは、式（HH - 1）：

【化 8 9】



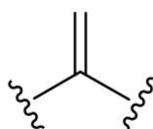
(HH-1)

で表される化合物およびそれらの塩であって、式中：

R^{P5} および R^{P6} は、独立して、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；

R^4 の各々は、独立して、水素、ハロゲン、任意置換アルキルであるか、または 2 個の R^4 基は、一緒になって：

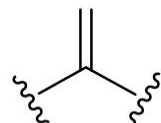
【化 9 0】



を形成する；

R^6 の各々は、独立して、水素、ハロゲン、任意置換アルキルであるか、または 2 個の R^6 基は、一緒になって：

【化 9 1】



を形成する；

R^5 、 R^8 、 R^9 、および R^{10} は、水素、ハロゲン、または任意置換アルキルである；

R^X は、水素または $-OR^{Xa}$ であり、ここで R^{Xa} は、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；および

R^Y は、水素または $-OR^{Ya}$ であり、ここで R^{Ya} は、水素、任意置換アルキル、または酸素保護基である；

任意に、 R^{Xa} および R^{Ya} は、それらの介在原子とともに連結されて、任意置換ヘテロシクリルを形成する；または

任意に、 R^{P5} および R^{P6} は、介在原子とともに連結されて、任意置換ヘテロシクリルを形成する。

【手続補正 5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0139

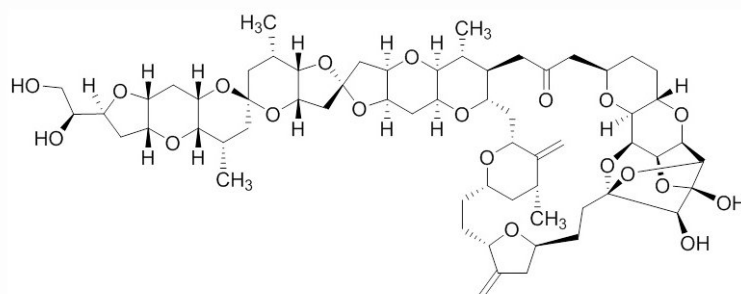
【補正方法】変更

【補正の内容】

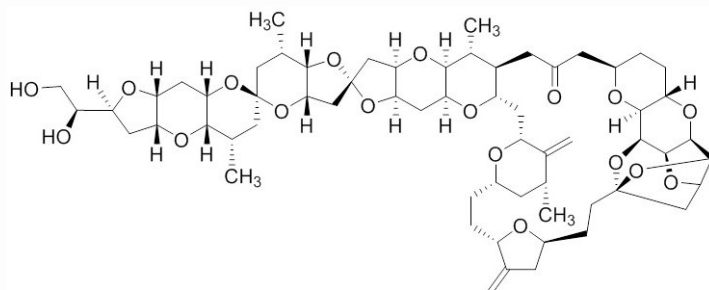
【0139】

ある態様において、式（HH-1）で表される化合物は、以下：

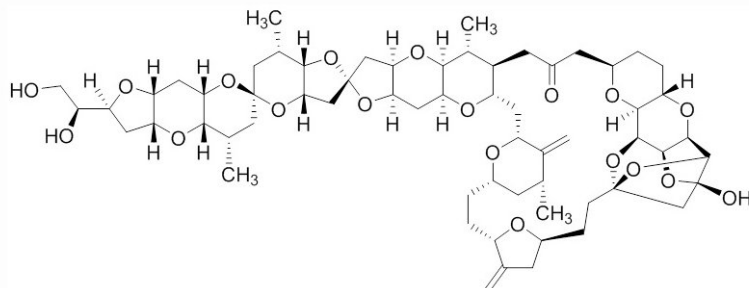
【化92】



(ケトーホモハリコンドリンA),



(ケトーホモハリコンドリンB),



(ケトーホモハリコンドリンC),

およびそれらの薬学的に許容し得る塩からなる群から選択される。