

【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 3 年 3 月 25 日 (2021.3.25)

【公表番号】特表 2020-507584 (P2020-507584A)

【公表日】令和 2 年 3 月 12 日 (2020.3.12)

【年通号数】公開・登録公報 2020-010

【出願番号】特願 2019-543387 (P2019-543387)

【国際特許分類】

C 07H 15/12 (2006.01)

A 61P 35/00 (2006.01)

A 61P 43/00 (2006.01)

C 07H 15/18 (2006.01)

A 61K 47/56 (2017.01)

A 61K 47/60 (2017.01)

A 61K 45/00 (2006.01)

A 61K 31/704 (2006.01)

A 61K 31/537 (2006.01)

A 61K 33/24 (2019.01)

A 61K 31/7008 (2006.01)

A 61K 31/337 (2006.01)

C 07H 15/252 (2006.01)

C 07D 498/18 (2006.01)

A 61K 31/55 (2006.01)

【F I】

C 07H 15/12 C S P

A 61P 35/00

A 61P 43/00 1 2 1

C 07H 15/18

A 61K 47/56

A 61K 47/60

A 61K 45/00

A 61K 31/704

A 61K 31/537

A 61K 33/24

A 61K 31/7008

A 61K 31/337

C 07H 15/252

C 07D 498/18 3 1 1

A 61K 31/55

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 2 月 12 日 (2021.2.12)

【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】

任意に置換された N - ( (アジド) アシル ) 5 - アミノ - 3 , 5 - ジデオキシ - D - グリセロ - D - ガラクト - 2 - ノヌロピラノソン酸部分または任意に置換された N - ( (アジド) アシル ) 2 - アミノ - 2 - デオキシ - D - ガラクトピラノシル部分と、

トリガーによって開裂されるトリガー応答性部分と、

自壊性リンカーと、

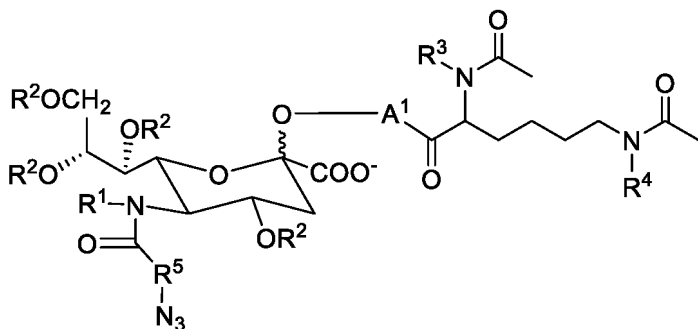
を含む、化合物またはその薬学的に許容される塩であって、

前記自壊性リンカーが、前記ノヌロピラノソン酸部分または前記ガラクトピラノシル部分、および前記トリガー応答性部分に共有結合している、化合物またはその薬学的に許容される塩。

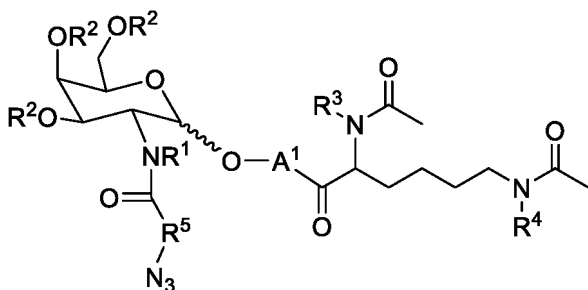
【請求項 2】

式 ( I )、式 ( I I )、または式 ( I I a ) で表される、あるいはそれらの薬学的に許容される塩である、請求項 1 に記載の化合物：

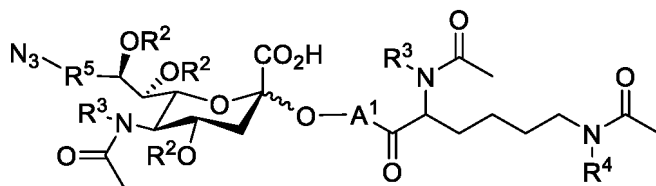
【化 1】



( I )、



( I I )、または



( I I a )

式中、

$R^1$  は、H またはトリ ( (  $C_1 \sim C_6$  ) アルキル ) シリルを表し、

$R^2$  は、各出現について独立して、H、 $-C(O)( (C_1 \sim C_6) \text{ アルキル } )$ 、ガラクトシル、N - アセチルガラクトサミノ、マンノシル、N - アセチルマンノサミノ、グルコシル、N - アセチルグルコサミノ、マルトシル、またはフルクトシルを表し、

$R^3$  および  $R^4$  は、各出現について独立して、H、トリ ( (  $C_1 \sim C_6$  ) アルキル ) シリル、または  $-C(O)( (C_1 \sim C_6) \text{ アルキル } )$  を表し、

$R^5$  は、(  $C_1 \sim C_6$  ) アルキレンを表し、

$A^1$  は、前記自壊性リンカーを表す。

【請求項 3】

$R^1$  が H を表す、および / または

$R^2$  が、各出現について独立して、H または  $-C(O)CH_3$  を表す、および / または

$R^2$  の全ての出現が同一である、および / または  
 $R^3$  および  $R^4$  が H である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

$A^1$  が、 $-X^1-Y^1-$  基を表し、

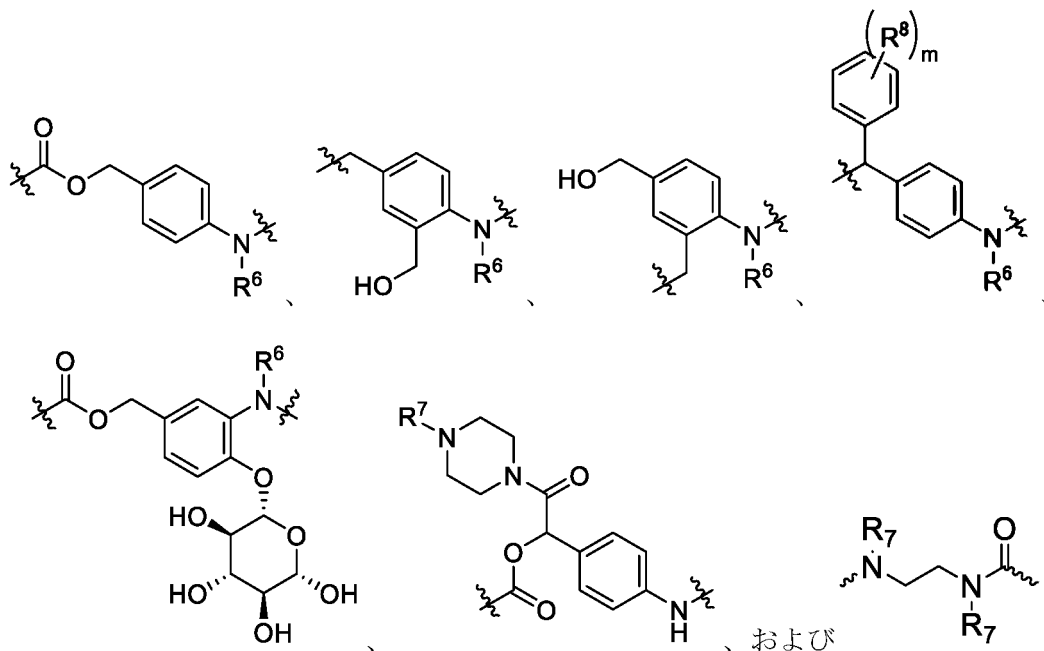
$X^1$  が、結合または  $-C(O)-$  を表し、

$Y^1$  が、結合または任意に置換された  $-(C_1)$  アルキレン - アリーレン - もしくは  $-(C_1)$  アルキレン - ヘテロアリーレン - を表す、請求項 2 または 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

前記自壊性リンカーが、

【化 2】



からなる群から選択され、

式中、

$R^6$  は、H、トリ  $-(C_1 \sim C_6)$  アルキル シリル、または  $-C(O)-(C_1 \sim C_6)$  アルキル) を表し、

$R^7$  は、H、 $(C_1 \sim C_6)$  アルキル、またはヘテロシクロアルキルを表し、

$R^8$  は、H、ハロ、 $-C(O)_2H$ 、 $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシ、ジ  $-(C_1 \sim C_6)$  アルキル) アミノ、 $-NO_2$ 、 $-O(CH_2CH_2O)_qCH_3$  を表し、

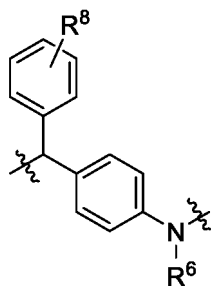
$m$  は、1、2、3、4、または 5 であり、

$q$  は、1 または 2 である、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

前記自壊性リンカーが、

【化 3】

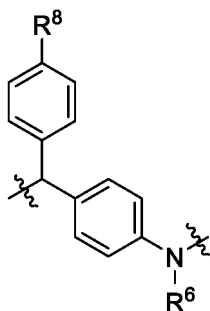


である、請求項 5 に記載の化合物。

## 【請求項 7】

前記自壊性リンカーが、

## 【化 4】

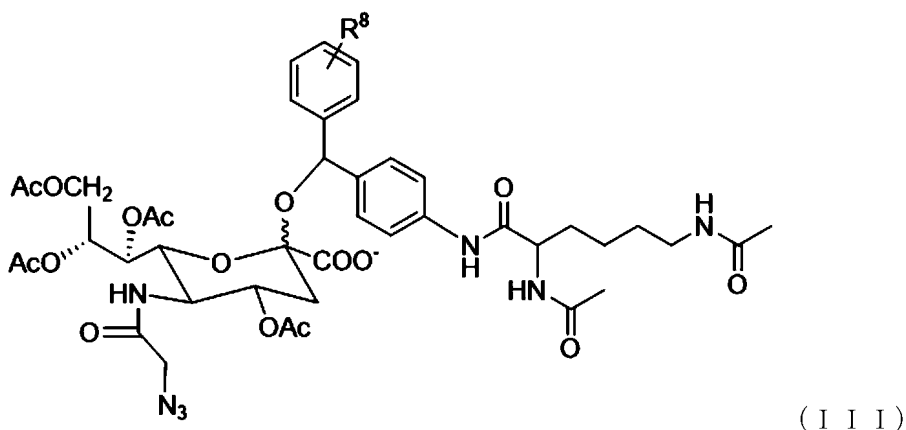


である、請求項 6 に記載の化合物。

## 【請求項 8】

式 ( I I I ) で表される、またはその薬学的に許容される塩である：

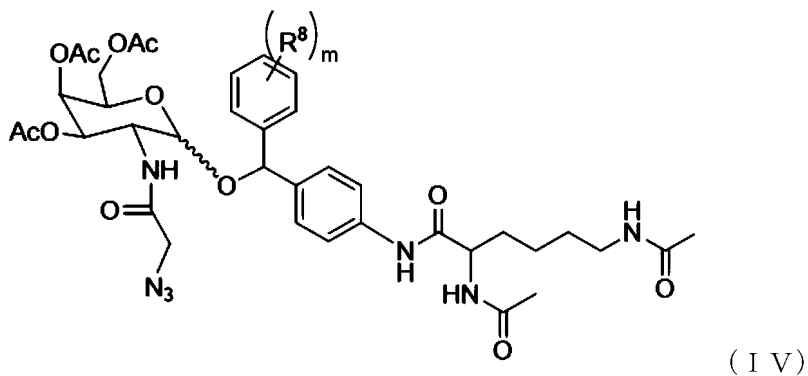
## 【化 5】



[ 式中、 $R^8$  は、H、ハロ、 $-C(O)_2H$ 、 $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシ、ジ $(C_1 \sim C_6)$  アルキル) アミノ、 $-NO_2$ 、 $-O(CH_2CH_2O)_qCH_3$  を表し； $q$  は、1 ~ 5000 である ]、あるいは

式 ( I V ) で表される、またはその薬学的に許容される塩である：

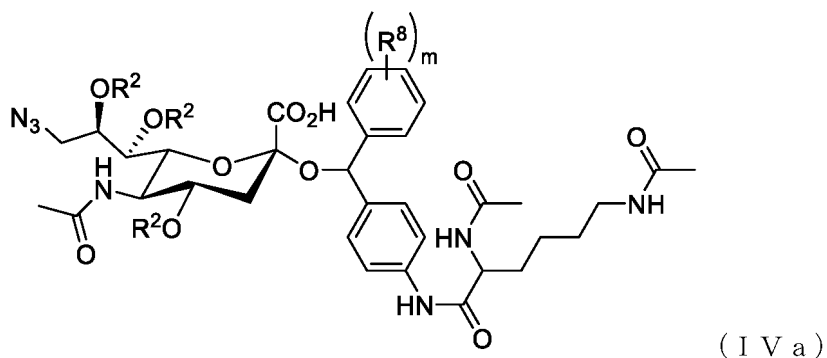
## 【化 6】



[ 式中、 $R^8$  は、H、ハロ、 $-C(O)_2H$ 、 $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシ、ジ $(C_1 \sim C_6)$  アルキル) アミノ、 $-NO_2$ 、 $-O(CH_2CH_2O)_qCH_3$  を表し； $m$  は、1、2、3、4、または 5 であり； $q$  は、1 または 2 である ]、あるいは

式 ( I V a ) で表さる、またはその薬学的に許容される塩である：

## 【化 7】



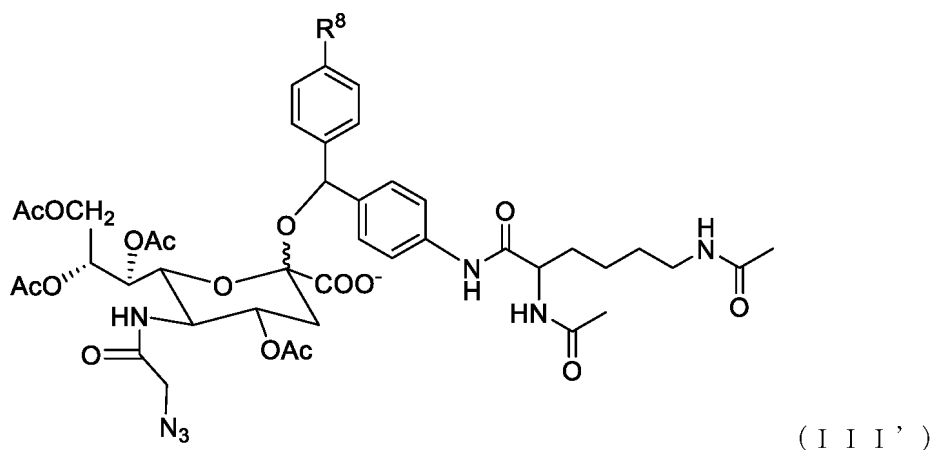
[ 式中、 $R^8$  は、H、ハロ、 $-C(O)_2H$ 、 $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシ、ジ $(C_1 \sim C_6)$  アルキル) アミノ、 $-NO_2$ 、 $-O(CH_2CH_2O)_qCH_3$  を表し； $m$  は、1、2、3、4、または5であり； $q$  は、1または2である ]

請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 9】

式 (III') で表される、またはその薬学的に許容される塩である：

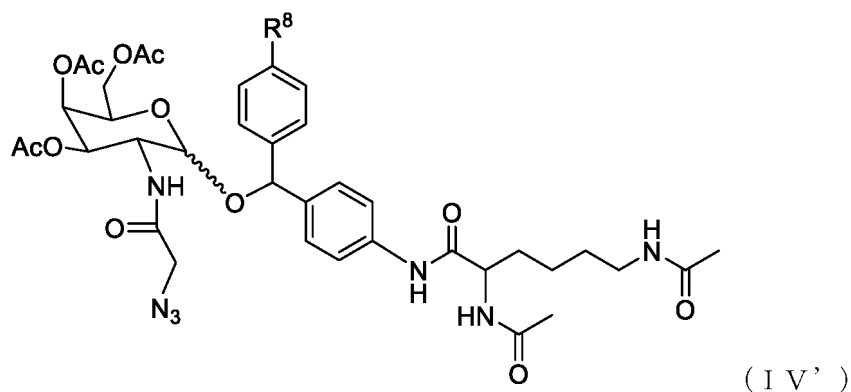
## 【化 8】



[ 式中、 $R^8$  は、H、ハロ、 $-C(O)_2H$ 、 $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシ、ジ $(C_1 \sim C_6)$  アルキル) アミノ、 $-NO_2$ 、 $-O(CH_2CH_2O)_qCH_3$  を表し； $q$  は、1～5000である ]、あるいは

式 (IV') で表される、またはその薬学的に許容される塩である：

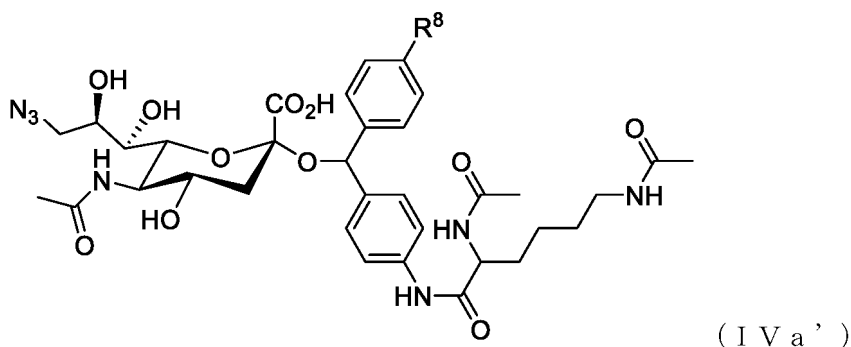
## 【化 9】



[ 式中、 $R^8$  は、H、ハロ、 $-C(O)_2H$ 、 $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシ、ジ $(C_1 \sim C_6)$  アルキル) アミノ、 $-NO_2$ 、 $-O(CH_2CH_2O)_qCH_3$  を表し； $q$  は、1または2である ]、あるいは

式 ( I V a ' ) で表される、またはその薬学的に許容される塩である：

【化 1 0】



( I V a ' )

[ 式中、R<sup>8</sup> は、H、ハロ、-C(O)<sub>2</sub>H、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルコキシ、ジ((C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル)アミノ、-NO<sub>2</sub>、-O(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O)<sub>q</sub>CH<sub>3</sub>を表し；qは、1または2である]

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 0】

R<sup>8</sup> が H である、請求項 4 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 1 1】

1 つ以上の糖部分を含む糖リンカーをさらに含み、前記糖リンカーが、前記自壊性リンカーを前記 N - ((アジド)アシル) 5 - アミノ - 3 , 5 - ジデオキシ - D - グリセロ - D - ガラクト - 2 - ノヌロピラノソン酸部分のアノマー炭素もしくは前記 N - ((アジド)アシル) 2 - アミノ - 2 - デオキシ - D - ガラクトピラノシル部分のアノマー炭素に共有結合する、請求項 1、および 5 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

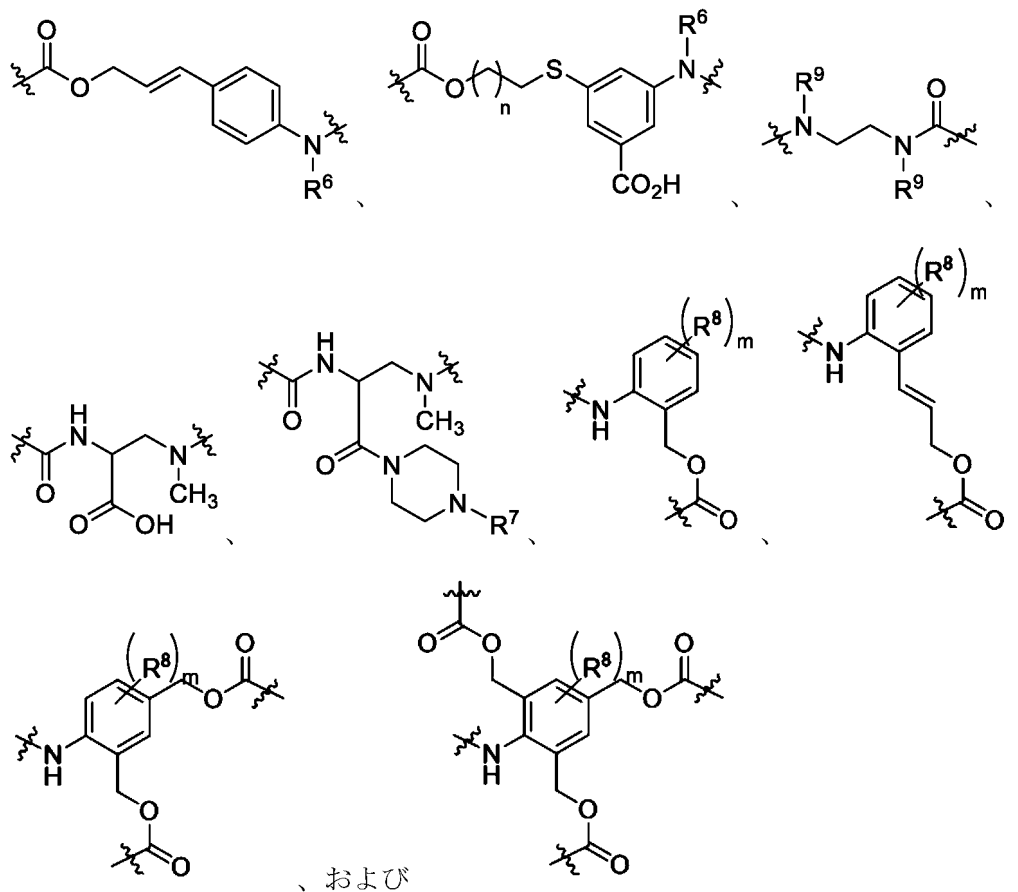
【請求項 1 2】

前記 1 つ以上の糖部分が、ガラクトシル、N - アセチルガラクトサミノ、マンノシル、N - アセチルマンノサミノ、ノイラミン酸、グルコシル、N - アセチルグルコサミノ、マルチル、およびフルクトシルからなる群から選択される、請求項 1 1 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

前記自壊性リンカーが、

## 【化 1 1】



からなる群から選択され、

式中、

$R^6$  は、H、トリ(( $C_1 \sim C_6$ )アルキル)シリル、または $-C(O)((C_1 \sim C_6)$ アルキル)を表し、

$R^7$  は、H、( $C_1 \sim C_6$ )アルキル、またはヘテロシクロアルキルを表し、

$R^8$  は、H、ハロ、 $-C(O)_2H$ 、( $C_1 \sim C_6$ )アルコキシ、ジ(( $C_1 \sim C_6$ )アルキル)アミノ、 $-NO_2$ 、 $-O(CH_2CH_2O)_qCH_3$ を表し、

$R^9$  は、Hまたは( $C_1 \sim C_6$ )アルキルを表し、

$m$  は、1、2、3、4、または5であり、

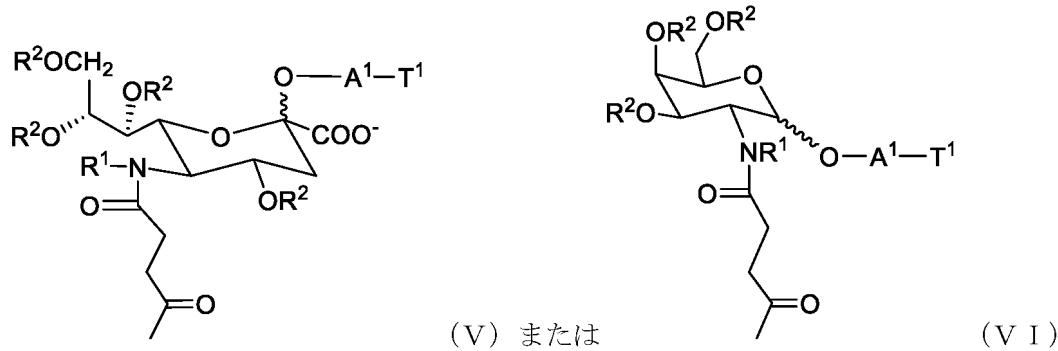
$n$  は、1または2であり、

$q$  は、1または2である、請求項1～3、11および12のいずれか一項に記載の化合物。

## 【請求項14】

式(V)または式(VI)で表される化合物、あるいはそれらの薬学的に許容される塩

## 【化 1 2】



式中、

$R^1$  は、H またはトリ（ $(C_1 \sim C_6)$  アルキル）シリルを表し、

$R^2$  は、各出現について独立して、H、 $-C(O)(C_1 \sim C_6)$  アルキル）、ガラクトシル、N - アセチルガラクトサミノ、マンノシル、N - アセチルマンノサミノ、グルコシル、N - アセチルグルコサミノ、マルトシル、またはフルクトシルを表し、

$A^1$  は、前記自壊性リンカーを表し、

$T^1$  は、前記トリガー応答性部分を表す。

## 【請求項 1 5】

$R^1$  が H を表す、および / または

$R^2$  が、各出現について独立して、H または  $-C(O)CH_3$  を表す、および / または  
 $R^2$  の全ての出現が同一である、請求項 1 4 に記載の化合物。

## 【請求項 1 6】

$A^1$  が、 $-X^1-Y^1-$  基を表し、

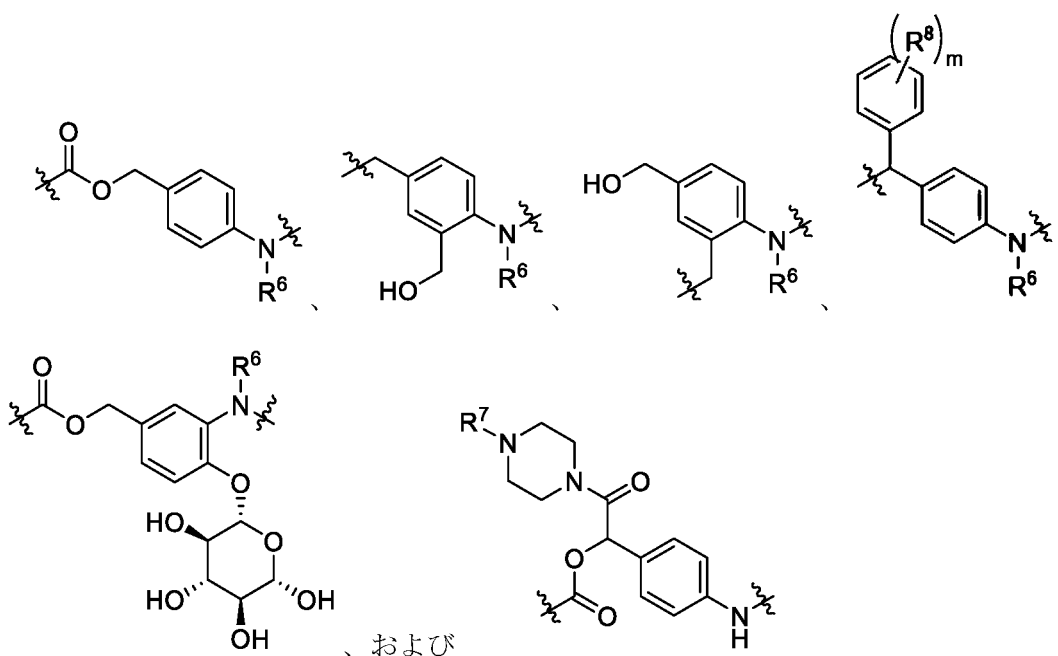
$X^1$  が、結合または  $-C(O)-$  を表し、

$Y^1$  が、結合または任意に置換された  $-(C_1)$  アルキレン）- アリーレン - もしくは  $-(C_1)$  アルキレン）- ヘテロアリーレンを表す、請求項 1 4 または 1 5 に記載の化合物。

## 【請求項 1 7】

前記自壊性リンカーが、

## 【化 1 3】



からなる群から選択され、



式中、

$R^6$  は、H、トリ(( $C_1 \sim C_6$ )アルキル)シリル、または $-C(O)((C_1 \sim C_6)$ アルキル)を表し、

$R^7$  は、H、( $C_1 \sim C_6$ )アルキル、またはヘテロシクロアルキルを表し、

$R^8$  は、H、ハロ、 $-C(O)_2H$ 、( $C_1 \sim C_6$ )アルコキシ、ジ(( $C_1 \sim C_6$ )アルキル)アミノ、 $-NO_2$ 、 $-O(CH_2CH_2O)_qCH_3$ を表し、

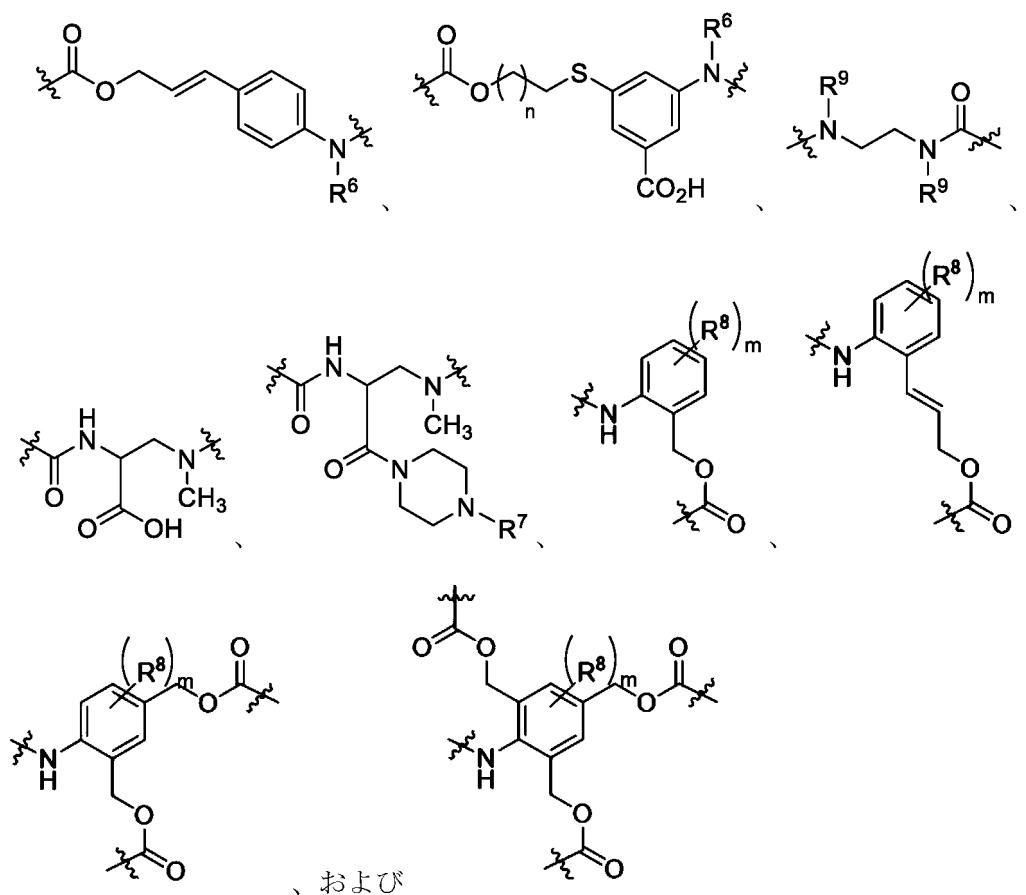
$m$  は、1、2、3、4、または5であり、

$q$  は、1または2である、請求項16に記載の化合物。

【請求項18】

前記自壊性リンカーが、

【化14】



、および

からなる群から選択され、

式中、

$R^6$  は、H、トリ(( $C_1 \sim C_6$ )アルキル)シリル、または $-C(O)((C_1 \sim C_6)$ アルキル)を表し、

$R^7$  は、H、( $C_1 \sim C_6$ )アルキル、またはヘテロシクロアルキルを表し、

$R^8$  は、H、ハロ、 $-C(O)_2H$ 、( $C_1 \sim C_6$ )アルコキシ、ジ(( $C_1 \sim C_6$ )アルキル)アミノ、 $-NO_2$ 、 $-O(CH_2CH_2O)_qCH_3$ を表し、

$R^9$  は、Hまたは( $C_1 \sim C_6$ )アルキルを表し、

$m$  は、1、2、3、4、または5であり、

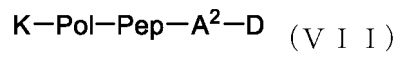
$n$  は、1または2であり、

$q$  は、1または2である、請求項16に記載の化合物。

【請求項19】

式(VII)で表される化合物またはその薬学的に許容される塩であって、

【化 1 5】



式中、

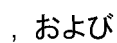
K は、任意に置換されたシクロアルキニル、ヘテロシクロアルキニル、またはアルキニル部分を表し、

P o l は、不在であるか、またはポリマー部分を表し、

P e p は、アミノ酸またはオリゴペプチド配列を表し、

A<sup>2</sup> は、結合であるか、または

【化 1 6】



からなる群から選択される自壊性リンカーを表し、  
式中、

R<sup>6</sup> は、H、トリ（（C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>）アルキル）シリル、または -C（O）（（C<sub>1</sub>～

$C_6$ ) アルキル) を表し、

$R^7$  は、H、( $C_1 \sim C_6$ ) アルキル、またはヘテロシクロアルキルを表し、

$R^8$  は、H、ハロ、 $-C(O)_2H$ 、( $C_1 \sim C_6$ ) アルコキシ、ジ( $(C_1 \sim C_6)$  アルキル) アミノ、 $-NO_2$ 、 $-O(CH_2CH_2O)_qCH_3$  を表し、

$R^9$  は、H または ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルを表し、

m は、1、2、3、4、または5であり、q が、1 または 2 であり、

D は、ファーマコフォアを表し、

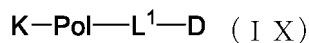
前記ポリマー部分は、存在する場合、ポリアルキレングリコールまたはポリアルキレンイミドであり、

前記アミノ酸またはオリゴペプチド配列は、(i) 対応する健常細胞に対して悪性細胞において過剰発現するか、または(ii) 対応する健常細胞において発現しない悪性細胞において発現する酵素によって開裂されるアミド結合を含む、化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 20】

式 (IX) で表される化合物またはその薬学的に許容される塩であって、

【化 17】



式中、

K は、任意に置換されたシクロアルキニル、ヘテロシクロアルキニル、またはアルキニル部分を表し、

Pol は、不在であるか、またはポリマー部分を表し、

$L^1$  は、アミド、エステル、マレイミド、イミノ、スルフィド、ジスルフィド、ヒドロゾノ、およびオキシモからなる群から選択される部分を含むリンカーを表し、

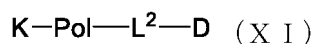
D は、ファーマコフォアを表し、

前記ポリマー部分が、存在する場合、ポリアルキレングリコールまたはポリアルキレンイミドである、化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 21】

式 (XI) で表される化合物またはその薬学的に許容される塩であって、

【化 18】



式中、

K は、任意に置換されたシクロアルキニル、ヘテロシクロアルキニル、またはアルキニル部分を表し、

Pol は、不在であるか、またはポリマー部分を表し、

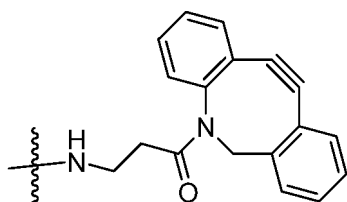
$L^2$  は、不在であるか、またはトリガー応答性部分を表し、

D は、ファーマコフォアを表し、

前記ポリマー部分は、存在する場合、ポリアルキレングリコールまたはポリアルキレンイミドであり、

任意選択で、K は

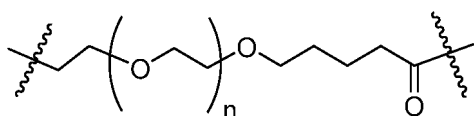
## 【化 19】



であり、

任意選択で、P o l は

## 【化 20】

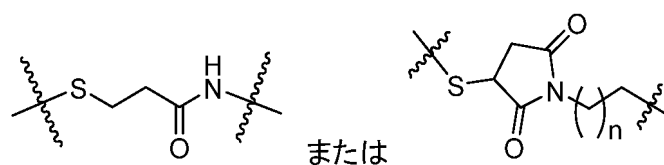


であり、

(式中 n は 0 ~ 5000 である)

任意選択で、L<sup>2</sup> は

## 【化 21】

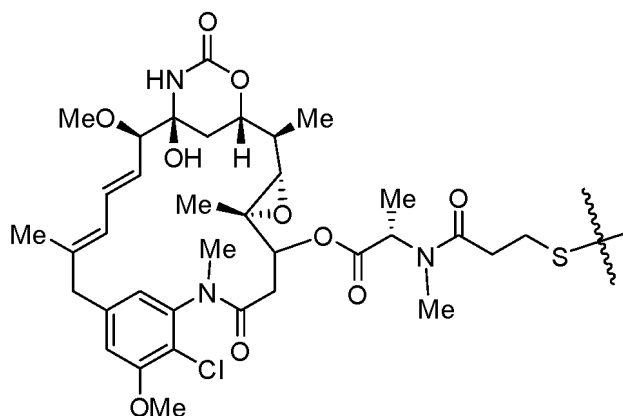


であり、

[ 式中、R<sup>6</sup> は、H、トリ ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルキル ) シリル、または - C ( O ) ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルキル ) であり ; n は 1 または 2 である ]

任意選択で、D は

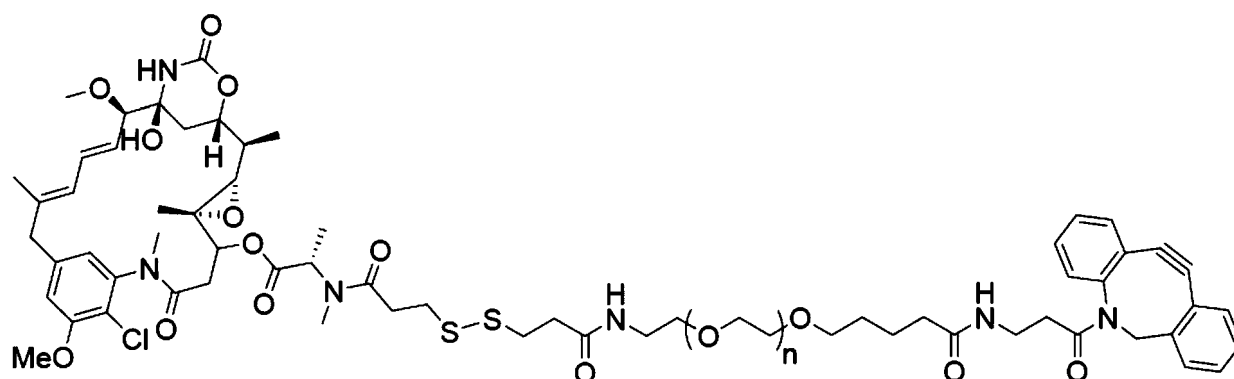
## 【化 22】



であり、

さらに任意選択で、前記化合物は DM 1 - S S - P E G - D B C O :

## 【化 2 3】

**DM1-SS-PEG-DBCO**

(式中、 $n$  は 1 ~ 5000 の整数である)

である、化合物またはその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 2 2】

治療有効量の請求項 1 ~ 2 1 のいずれか一項に記載の化合物を含む、がんを治療するための組成物。

## 【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0280

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0280】

モデル DBCO - パクリタキセルコンジュゲート、PTX - TEG - DBCO を、十分に確立された反応を通して調製した。(図 19)。コンジュゲートの純度および同一性を、RP - HPLC および ESI - MS によって確認した(図 19)。PTX - TEG - DBCO は、静脈内注射用の DMSO - tween 80 - PBS (5 - 10 - 85) 製剤に溶解することができる。予備的 MTD 試験(図 19)は、PTX - TEG - DBCO の MTD が 200 mg / kg (124 mg / kg 当量 PTX) より高いことを示した。全体として、薬物コンジュゲートの高い MTD (製剤中の最大可能用量より高い)は、プロドラッグの良好な生体適合性を示した。

最後に、本発明の好ましい実施態様を項分け記載する。

## [実施態様 1]

任意に置換された N - ((アジド)アシル)5 - アミノ - 3, 5 - ジデオキシ - D - グリセロ - D - ガラクト - 2 - ノヌロピラノソン酸部分または任意に置換された N - ((アジド)アシル)2 - アミノ - 2 - デオキシ - D - ガラクトピラノシル部分と、

トリガーによって開裂されるトリガー応答性部分と、

自壊性リンカーと、

を含む、化合物またはその薬学的に許容される塩であって、

前記自壊性リンカーが、前記ノヌロピラノソン酸部分または前記ガラクトピラノシル部分、および前記トリガー応答性部分に共有結合している、化合物またはその薬学的に許容される塩。

## [実施態様 2]

前記トリガーが、細胞過酸化物である、実施態様 1 に記載の化合物。

## [実施態様 3]

前記トリガー応答性部分が、ボロン酸基、ジアルキルボロネート基、ジアリールボロネート基、ジ（アラルキル）ボロネート基、ボロラン基、またはジオキサボロラン基を含む、実施態様 1 または 2 に記載の化合物。

[ 実施態様 4 ]

細胞過酸化物による前記トリガー応答性部分の開裂時に、前記自壊性リンカーが分解し、それによって任意に置換された N - （（アジド）アシル）5 - アミノ - 3 , 5 - ジデオキシ - D - グリセロ - D - ガラクト - 2 - ノヌロピラノソン酸または任意に置換された N - （（アジド）アシル）2 - アミノ - 2 - デオキシ - D - ガラクトピラノシドを放出する、実施態様 3 に記載の化合物。

[ 実施態様 5 ]

前記トリガーが、低酸素である、実施態様 1 に記載の化合物。

[ 実施態様 6 ]

前記トリガー応答性部分が、2 - ニトロイミダゾール部分またはアゾベンゼンなどのアゾ基を含む、実施態様 1 または 5 に記載の化合物。

[ 実施態様 7 ]

低酸素条件下での前記トリガー応答性部分の開裂時に、前記自壊性リンカーが分解し、それによって任意に置換された N - （（アジド）アシル）5 - アミノ - 3 , 5 - ジデオキシ - D - グリセロ - D - ガラクト - 2 - ノヌロピラノソン酸または任意に置換された N - （（アジド）アシル）2 - アミノ - 2 - デオキシ - D - ガラクトピラノシドを放出する、実施態様 6 に記載の化合物。

[ 実施態様 8 ]

前記トリガーが、スルフヒドリル含有またはグルタチオンなどのチオレート含有化合物である、実施態様 1 に記載の化合物。

[ 実施態様 9 ]

前記トリガー応答性部分が、ジスルフィド結合を含む、実施態様 1 または 8 に記載の化合物。

[ 実施態様 10 ]

スルフヒドリル含有またはチオレート含有化合物による前記ジスルフィド結合の開裂時に、前記自壊性リンカーが分解し、それによって任意に置換された N - （（アジド）アシル）5 - アミノ - 3 , 5 - ジデオキシ - D - グリセロ - D - ガラクト - 2 - ノヌロピラノソン酸または任意に置換された N - （（アジド）アシル）2 - アミノ - 2 - デオキシ - D - ガラクトピラノシドを放出する、実施態様 9 に記載の化合物。

[ 実施態様 11 ]

前記トリガーが、NAD(P)Hデヒドロゲナーゼ（キノン 1）（NQO1）である、実施態様 1 に記載の化合物。

[ 実施態様 12 ]

前記トリガー応答性部分が、任意に置換されたプロピオン酸またはプロピオン酸アミド部分に共有結合した、任意に置換されたキノンを含む、実施態様 1 または 11 に記載の化合物。

[ 実施態様 13 ]

NAD(P)Hデヒドロゲナーゼ（キノン 1）（NQO1）による、任意に置換されたプロピオン酸またはプロピオン酸アミド部分に共有結合した、前記任意に置換されたキノンの開裂時に、前記自壊性リンカーが分解し、それによって任意に置換された N - （（アジド）アシル）5 - アミノ - 3 , 5 - ジデオキシ - D - グリセロ - D - ガラクト - 2 - ノヌロピラノソン酸または任意に置換された N - （（アジド）アシル）2 - アミノ - 2 - デオキシ - D - ガラクトピラノシドを放出する、実施態様 12 に記載の化合物。

[ 実施態様 14 ]

前記トリガーが、カテプシン酵素である、実施態様 1 に記載の化合物。

[ 実施態様 15 ]

前記トリガー応答性部分が、カテプシン酵素によって開裂されるアミド結合を含むアミ

ノ酸またはオリゴペプチド配列である、実施態様 14 に記載の化合物。

[ 実施態様 16 ]

前記アミド結合を含むアミノ酸またはオリゴペプチド配列が、Phe - Lys、Val - Lys、Ala - Lys、Val - Cit、Phe - Cit、Leu - Cit、Ile - Cit、Trp - Cit、Phe - Arg (NO<sub>2</sub>)、Phe - Arg (Ts)、または Lys - Gly - Arg - Arg を含む、実施態様 15 に記載の化合物。

[ 実施態様 17 ]

前記アミノ酸またはオリゴペプチド配列が、置換リジンアミドである、実施態様 15 に記載の化合物。

[ 実施態様 18 ]

前記カテプシン酵素による前記アミド結合の開裂時に、前記自壊性リンカーが分解し、それによって任意に置換された N - ( (アジド) アシル ) 5 - アミノ - 3 , 5 - ジデオキシ - D - グリセロ - D - ガラクト - 2 - ノヌロピラノソン酸または任意に置換された N - ( (アジド) アシル ) 2 - アミノ - 2 - デオキシ - D - ガラクトピラノシドを放出する、実施態様 15 ~ 17 のいずれかに記載の化合物。

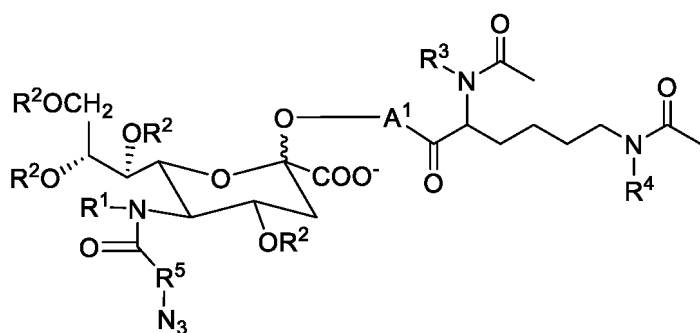
[ 実施態様 19 ]

前記カテプシン酵素が、カテプシン L である、実施態様 14 ~ 18 のいずれかに記載の化合物。

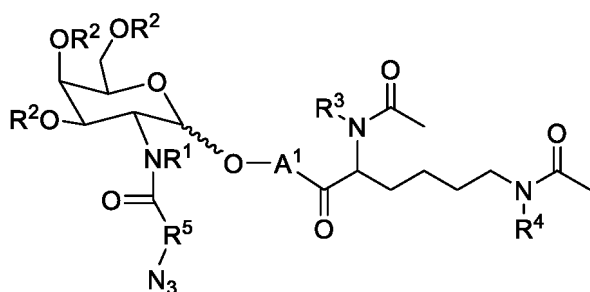
[ 実施態様 20 ]

式 ( I )、式 ( II )、または式 ( II a ) で表され、

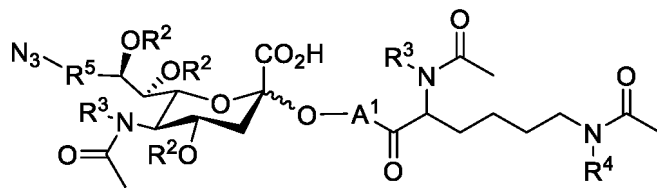
【化 6 2】



( I )、



( II )、または



( II a )

式中、

R<sup>1</sup> が、H またはトリ ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルキル ) シリルを表し、

R<sup>2</sup> が、各出現について独立して、H、- C ( O ) ( ( C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ) アルキル )、ガラクトシル、N - アセチルガラクトサミノ、マンノシル、N - アセチルマンノサミノ、グル



コシル、N - アセチルグルコサミノ、マルトシル、またはフルクトシルを表し、

$R^3$  および  $R^4$  が、各出現について独立して、H、トリ（ $(C_1 \sim C_6)$  アルキル）シリル、または  $-C(O)(C_1 \sim C_6)$  アルキルを表し、

$R^5$  が、 $(C_1 \sim C_6)$  アルキレンを表し、

$A^1$  が、前記自壊性リンカーを表す、実施態様 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

[ 実施態様 2 1 ]

$R^1$  が、Hを表す、実施態様 2 0 に記載の化合物。

[ 実施態様 2 2 ]

$R^2$  が、各出現について独立して、Hまたは  $-C(O)CH_3$  を表す、実施態様 2 0 または 2 1 に記載の化合物。

[ 実施態様 2 3 ]

$R^2$  の全ての出現が、同一である、実施態様 2 2 に記載の化合物。

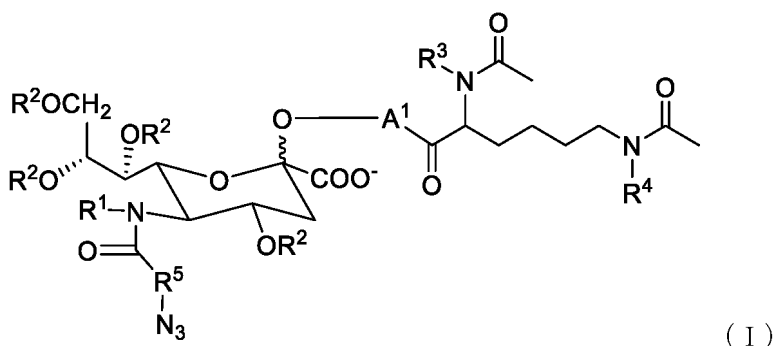
[ 実施態様 2 4 ]

$R^3$  および  $R^4$  が、Hである、実施態様 2 0 ~ 2 3 のいずれかに記載の化合物。

[ 実施態様 2 5 ]

式 ( I ) で表される、実施態様 2 0 ~ 2 4 のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

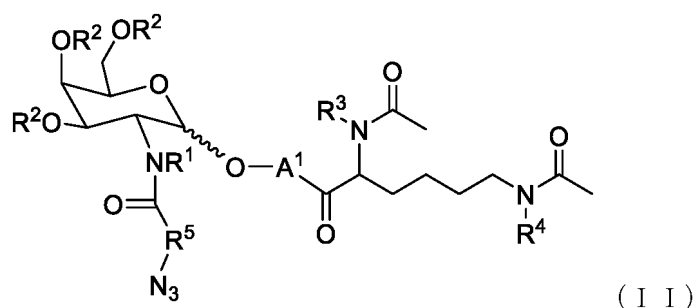
【化 6 3】



[ 実施態様 2 6 ]

式 ( I I ) で表される、実施態様 2 0 ~ 2 4 のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

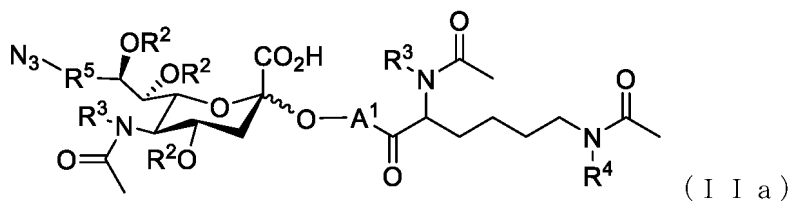
【化 6 4】



[ 実施態様 2 7 ]

式 ( I I a ) で表される、実施態様 2 0 ~ 2 4 のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

## 【化 6 5】



## [ 実施態様 2 8 ]

$A^1$  が、 $-X^1-Y^1-$  基を表し、

$X^1$  が、結合または  $-C(O)-$  を表し、

$Y^1$  が、結合または任意に置換された  $-(C_1)$  アルキレン - アリーレン - もしくは  $-(C_1)$  アルキレン - ヘテロアリーレン - を表す、実施態様 2 0 ~ 2 7 のいずれかに記載の化合物。

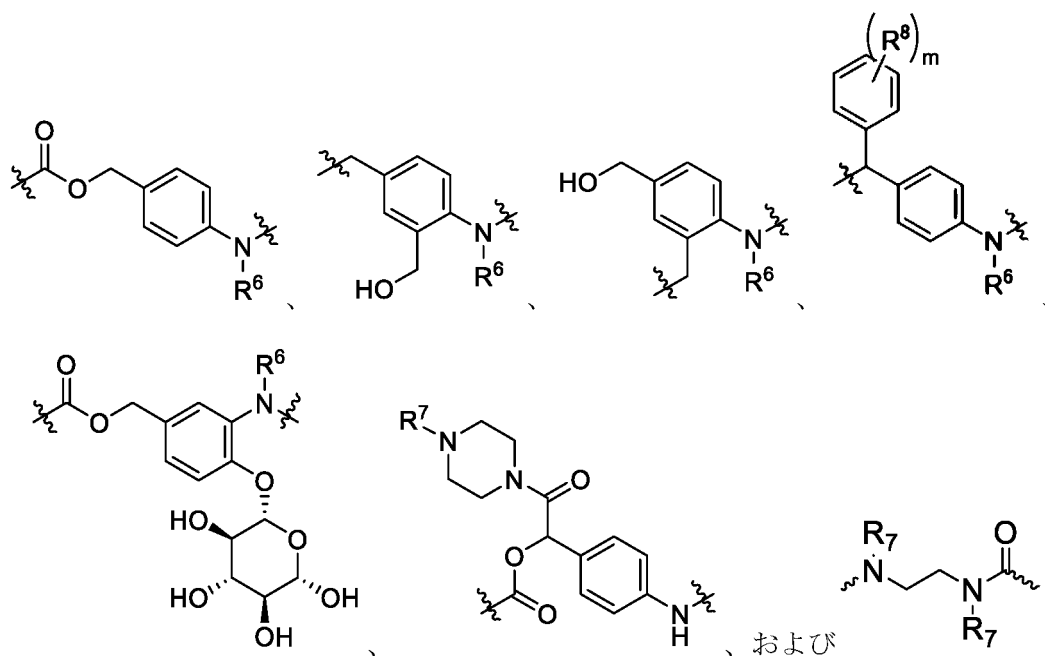
## [ 実施態様 2 9 ]

$Y^1$  が、任意に置換された  $-(C_1)$  アルキレン - アリーレン - を表す、実施態様 2 8 に記載の化合物。

## [ 実施態様 3 0 ]

前記自壊性リンカーが、

## 【化 6 6】



からなる群から選択され、

式中、

$R^6$  が、H、トリ  $-(C_1 \sim C_6)$  アルキルシリル、または  $-C(O)-(C_1 \sim C_6)$  アルキル)を表し、

$R^7$  が、H、 $(C_1 \sim C_6)$  アルキル、またはヘテロシクロアルキルを表し、

$R^8$  が、H、ハロ、 $-C(O)_2H$ 、 $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシ、ジ  $-(C_1 \sim C_6)$  アルキル)アミノ、 $-NO_2$ 、 $-O(CH_2CH_2O)_qCH_3$  を表し、

$m$  が、1、2、3、4、または5であり、

$q$  が、1または2である、実施態様 2 9 に記載の化合物。

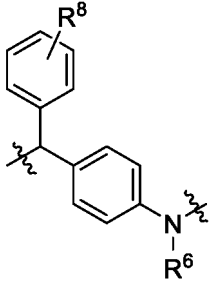
## [ 実施態様 3 1 ]

$R^8$  が、Hである、実施態様 3 0 に記載の化合物。

## [ 実施態様 3 2 ]

前記自壊性リンカーが、

【化 6 7】

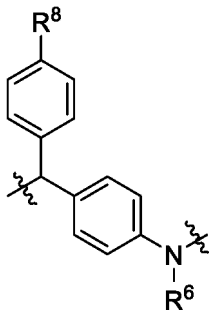


である、実施態様 30 に記載の化合物。

[ 実施態様 33 ]

前記自壊性リンカーが、

【化 6 8】



である、実施態様 32 に記載の化合物。

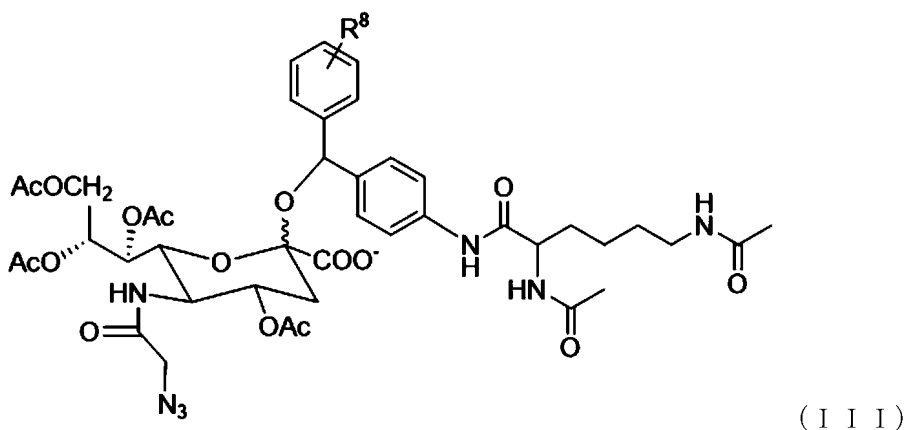
[ 実施態様 34 ]

$R^8$  が、H である、実施態様 32 に記載の化合物。

[ 実施態様 35 ]

式 ( I I I ) で表され、

【化 6 9】



式中、 $R^8$  が、H、ハロ、 $-C(O)_2H$ 、 $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシ、ジ $(C_1 \sim C_6)$  アルキル) アミノ、 $-NO_2$ 、 $-O(CH_2CH_2O)_qCH_3$  を表し、

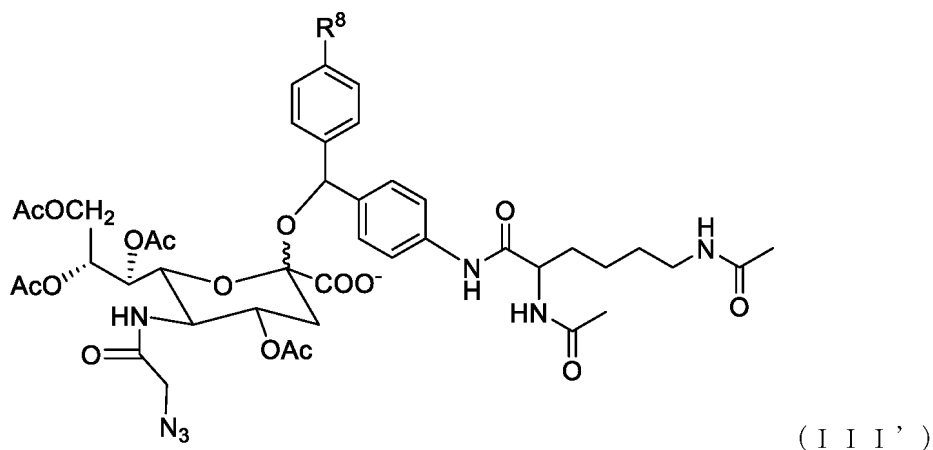
$m$  が、1、2、3、4、または 5 であり、

$q$  が、1 ~ 5000 である、実施態様 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

[ 実施態様 36 ]

式 ( I I I ' ) で表される、実施態様 35 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

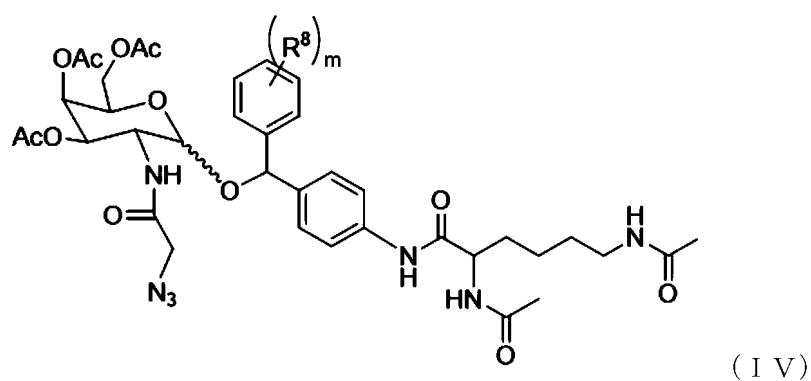
【化 7 0】



[ 実施態様 3 7 ]

式 ( I V ) で表され、

【化 7 1】



式中、 $R^8$  が、H、ハロ、 $-C(O)_2H$ 、 $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシ、ジ $(C_1 \sim C_6)$  アルキル) アミノ、 $-NO_2$ 、 $-O(CH_2CH_2O)_qCH_3$  を表し、

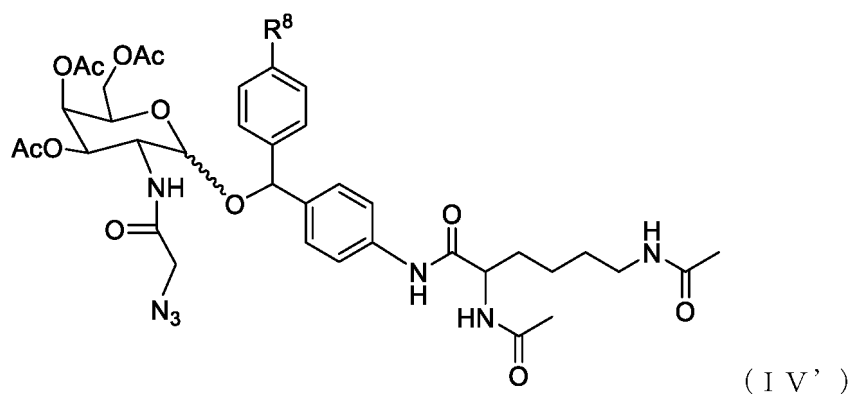
$m$  が、1、2、3、4、または5であり、

$q$  が、1または2である、実施態様 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩

°  
[ 実施態様 3 8 ]

式 ( I V ' ) で表される、実施態様 3 7 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

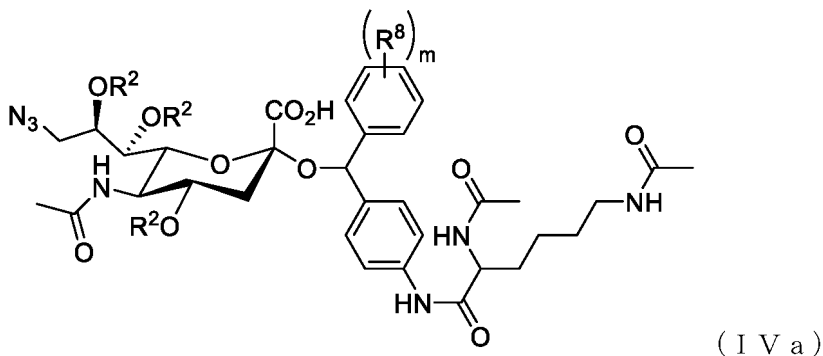
【化 7 2】



[ 実施態様 3 9 ]

式 ( I V a ) で表され、

## 【化 7 3】

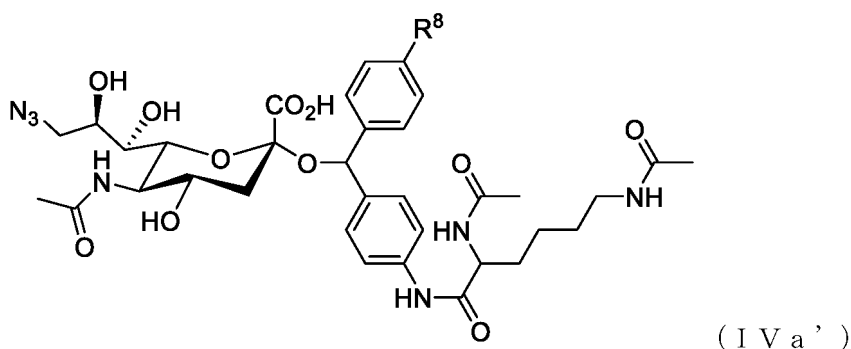


式中、 $R^8$  が、H、ハロ、 $-C(O)_2H$ 、 $(C_1 \sim C_6)$  アルコキシ、ジ $(C_1 \sim C_6)$  アルキル) アミノ、 $-NO_2$ 、 $-O(CH_2CH_2O)_qCH_3$  を表し、  
 $m$  が、1、2、3、4、または5であり、  
 $q$  が、1または2である、実施態様 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩

°  
 [ 実施態様 4 0 ]

式 ( I V a ' ) で表される、実施態様 3 9 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

## 【化 7 4】



## [ 実施態様 4 1 ]

$R^8$  が、Hである、実施態様 3 5 ~ 4 0 のいずれかに記載の化合物。

## [ 実施態様 4 2 ]

1 つ以上の糖部分を含む糖リンカーをさらに含み、( i ) 前記糖リンカーが、前記自壊性リンカーを前記 N - ( ( アジド ) アシル ) 5 - アミノ - 3 , 5 - ジデオキシ - D - グリセロ - D - ガラクト - 2 - ノヌロピラノソン酸部分のアノマー炭素もしくは前記 N - ( ( アジド ) アシル ) 2 - アミノ - 2 - デオキシ - D - ガラクトピラノシル部分のアノマー炭素に共有結合するか、または ( i i )  $A^1$  が、前記糖リンカーをさらに含み、実施態様 1 ~ 2 9 のいずれかに記載の化合物。

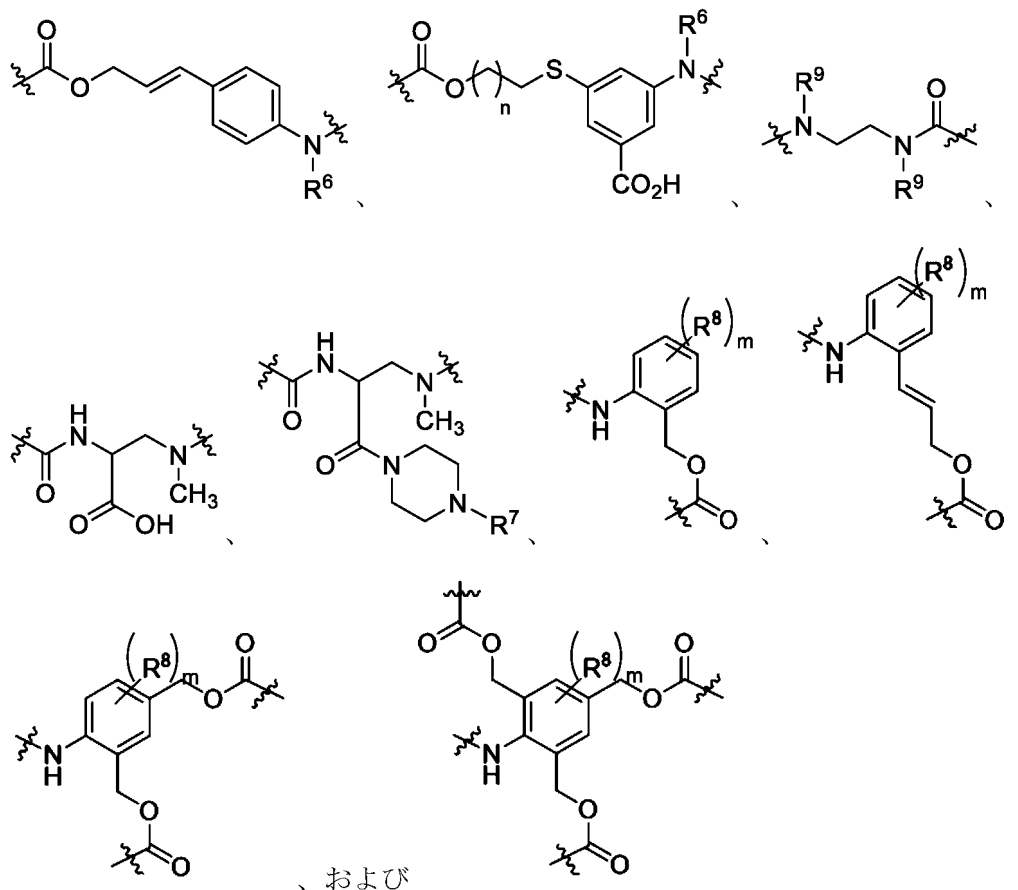
## [ 実施態様 4 3 ]

前記 1 つ以上の糖部分が、ガラクトシル、N - アセチルガラクトサミノ、マンノシル、N - アセチルマンノサミノ、ノイラミン酸、グルコシル、N - アセチルグルコサミノ、マルトシル、およびフルクトシルからなる群から選択される、実施態様 4 2 に記載の化合物

°  
 [ 実施態様 4 4 ]

前記自壊性リンカーが、

## 【化 7 5】



からなる群から選択され、

式中、

$R^6$  が、H、トリ(( $C_1 \sim C_6$ )アルキル)シリル、または  $-C(O)((C_1 \sim C_6)$ アルキル)を表し、

$R^7$  が、H、( $C_1 \sim C_6$ )アルキル、またはヘテロシクロアルキルを表し、

$R^8$  が、H、ハロ、 $-C(O)_2H$ 、( $C_1 \sim C_6$ )アルコキシ、ジ(( $C_1 \sim C_6$ )アルキル)アミノ、 $-NO_2$ 、 $-O(CH_2CH_2O)_qCH_3$ を表し、

$R^9$  が、Hまたは( $C_1 \sim C_6$ )アルキルを表し、

$m$  が、1、2、3、4、または5であり、

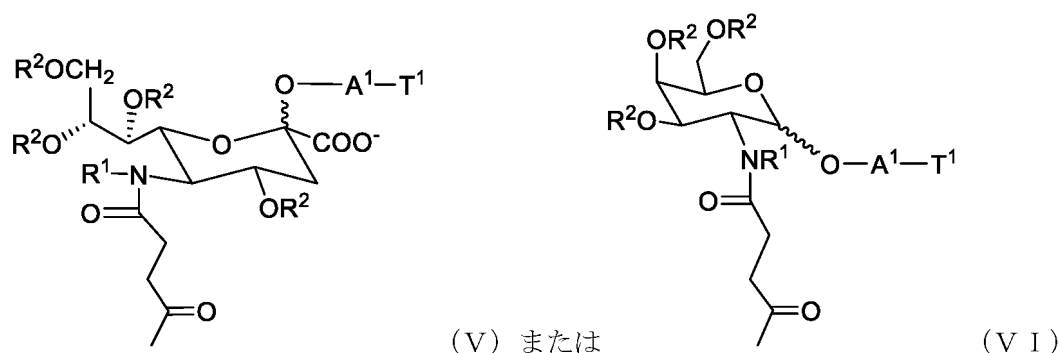
$n$  が、1または2であり、

$q$  が、1または2である、実施態様 20 ~ 27、41、および 42 のいずれかに記載の化合物。

## [ 実施態様 4 5 ]

式 (V) または式 (VI) で表され、

## 【化 7 6】



式中、

$R^1$  が、H またはトリ（ $(C_1 \sim C_6)$  アルキル）シリルを表し、

$R^2$  が、各出現について独立して、H、 $-C(O)(C_1 \sim C_6)$  アルキル）、ガラクトシル、N - アセチルガラクトサミノ、マンノシル、N - アセチルマンノサミノ、グルコシル、N - アセチルグルコサミノ、マルトシル、またはフルクトシルを表し、

$A^1$  が、前記自壊性リンカーを表し、

$T^1$  が、前記トリガー応答性部分を表す、実施態様 1 ~ 19 のいずれかに記載の化合物またはそれらのいずれかの薬学的に許容される塩。

[ 実施態様 46 ]

$R^1$  が、H を表す、実施態様 45 に記載の化合物。

[ 実施態様 47 ]

$R^2$  が、各出現について独立して、H または  $-C(O)CH_3$  を表す、実施態様 45 または 46 に記載の化合物。

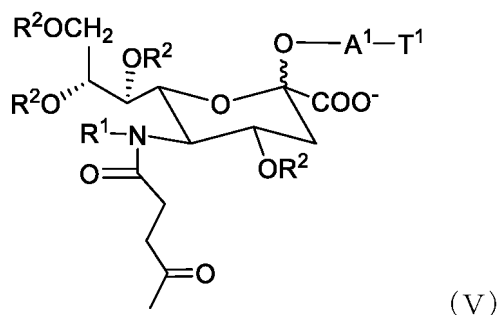
[ 実施態様 48 ]

$R^2$  の全ての出現が、同一である、実施態様 47 に記載の化合物。

[ 実施態様 49 ]

式 (V) で表される、実施態様 45 ~ 48 のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

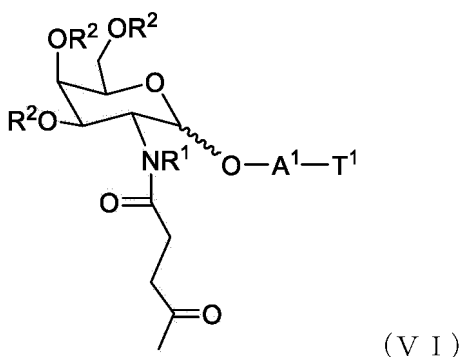
【化 77】



[ 実施態様 50 ]

式 (VI) で表される、実施態様 45 ~ 48 のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【化 78】



[ 実施態様 51 ]

$A^1$  が、 $-X^1-Y^1$  - 基を表し、

$X^1$  が、結合または  $-C(O)-$  を表し、

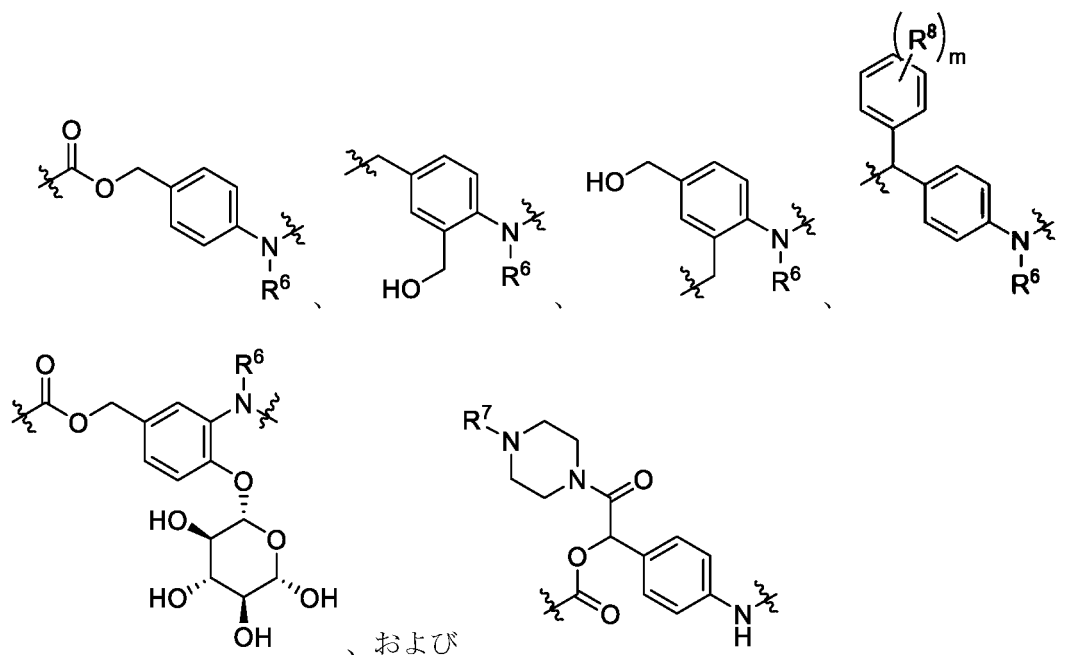
$Y^1$  が、結合または任意に置換された  $-(C_1)$  アルキレン) - アリーレン - もしくは  $-(C_1)$  アルキレン) - ヘテロアリーレンを表す、実施態様 45 ~ 50 のいずれかに記載の化合物。

[ 実施態様 52 ]

$Y^1$  が、任意に置換された - ( (  $C_1$  ) アルキレン ) - アリーレン - を表す、実施態様 5 1 に記載の化合物。

[ 実施態様 5 3 ]

前記自壊性リンカーが、  
【化 7 9】



からなる群から選択され、  
式中、

$R^6$  が、H、トリ ( (  $C_1 \sim C_6$  ) アルキル ) シリル、または - C ( O ) ( (  $C_1 \sim C_6$  ) アルキル ) を表し、

$R^7$  が、H、(  $C_1 \sim C_6$  ) アルキル、またはヘテロシクロアルキルを表し、

$R^8$  が、H、ハロ、- C ( O )  $_2$  H、(  $C_1 \sim C_6$  ) アルコキシ、ジ ( (  $C_1 \sim C_6$  ) アルキル ) アミノ、- NO  $_2$ 、- O ( CH  $_2$  CH  $_2$  O )  $_q$  CH  $_3$  を表し、

$m$  が、1、2、3、4、または 5 であり、

$q$  が、1 または 2 である、実施態様 5 2 に記載の化合物。

[ 実施態様 5 4 ]

$A^1$  が、糖リンカーをさらに含み、前記糖リンカーが、1 つ以上の糖部分を含む、実施態様 4 5 ~ 5 0 のいずれかに記載の化合物。

[ 実施態様 5 5 ]

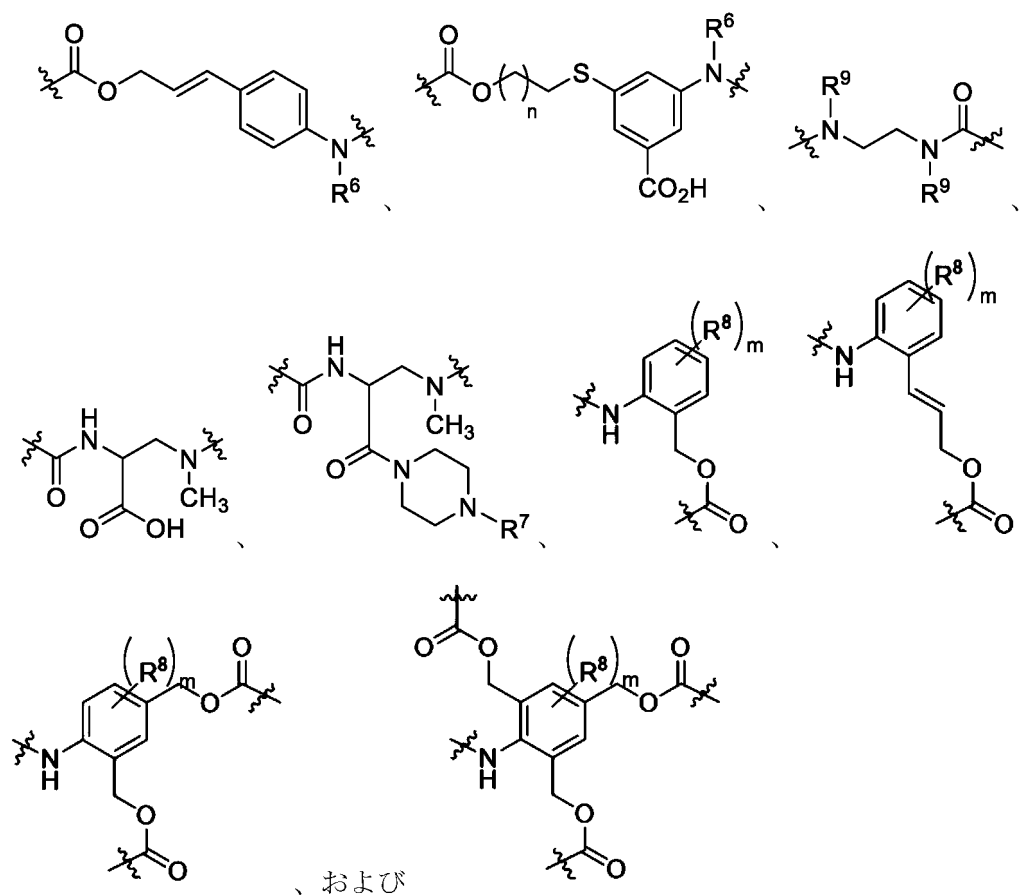
前記 1 つ以上の糖部分が、ガラクトシル、N - アセチルガラクトサミノ、マンノシル、N - アセチルマンノサミノ、ノイラミン酸、グルコシル、N - アセチルグルコサミノ、マルトシル、およびフルクトシルからなる群から選択される、実施態様 5 4 に記載の化合物。

[ 実施態様 5 6 ]

前記自壊性リンカーが、



## 【化 8 0】



からなる群から選択され、

式中、

$R^6$  が、H、トリ(( $C_1 \sim C_6$ )アルキル)シリル、または  $-C(O)((C_1 \sim C_6)$ アルキル)を表し、

$R^7$  が、H、( $C_1 \sim C_6$ )アルキル、またはヘテロシクロアルキルを表し、

$R^8$  が、H、ハロ、 $-C(O)_2H$ 、( $C_1 \sim C_6$ )アルコキシ、ジ(( $C_1 \sim C_6$ )アルキル)アミノ、 $-NO_2$ 、 $-O(CH_2CH_2O)_qCH_3$ を表し、

$R^9$  が、Hまたは( $C_1 \sim C_6$ )アルキルを表し、

$m$  が、1、2、3、4、または5であり、

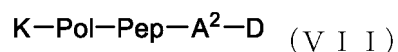
$n$  が、1または2であり、

$q$  が、1または2である、実施態様 45 ~ 50、54、および 55 のいずれかに記載の化合物。

## [ 実施態様 57 ]

式(VII)で表される化合物またはその薬学的に許容される塩であって、

## 【化 8 1】



式中、

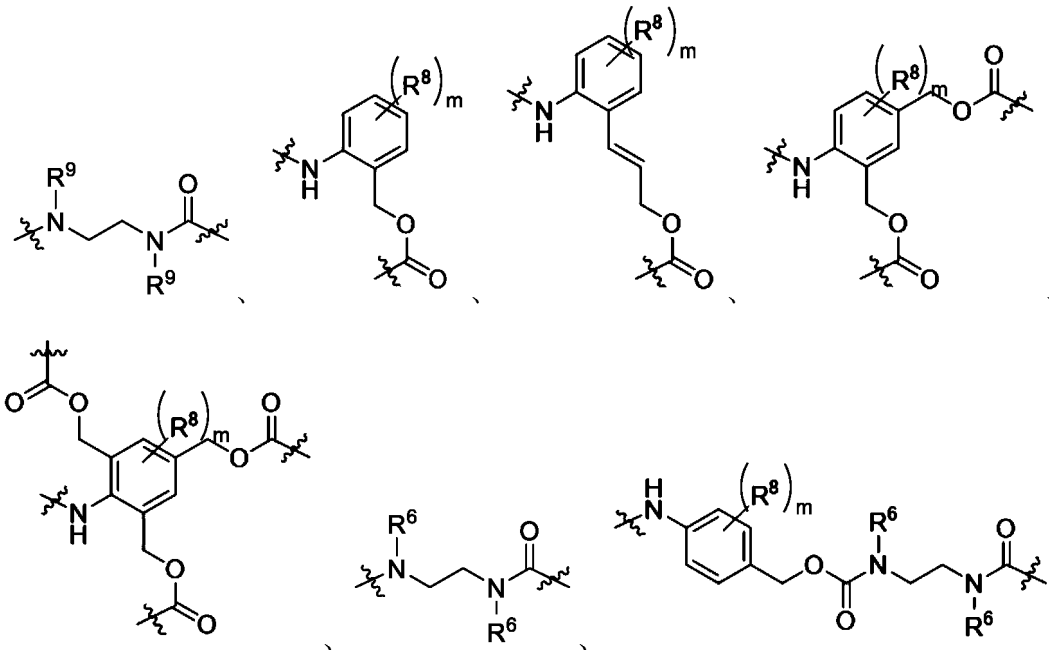
$K$  が、任意に置換されたシクロアルキニル、ヘテロシクロアルキニル、またはアルキニル部分を表し、

$Pol$  が、不在であるか、またはポリマー部分を表し、

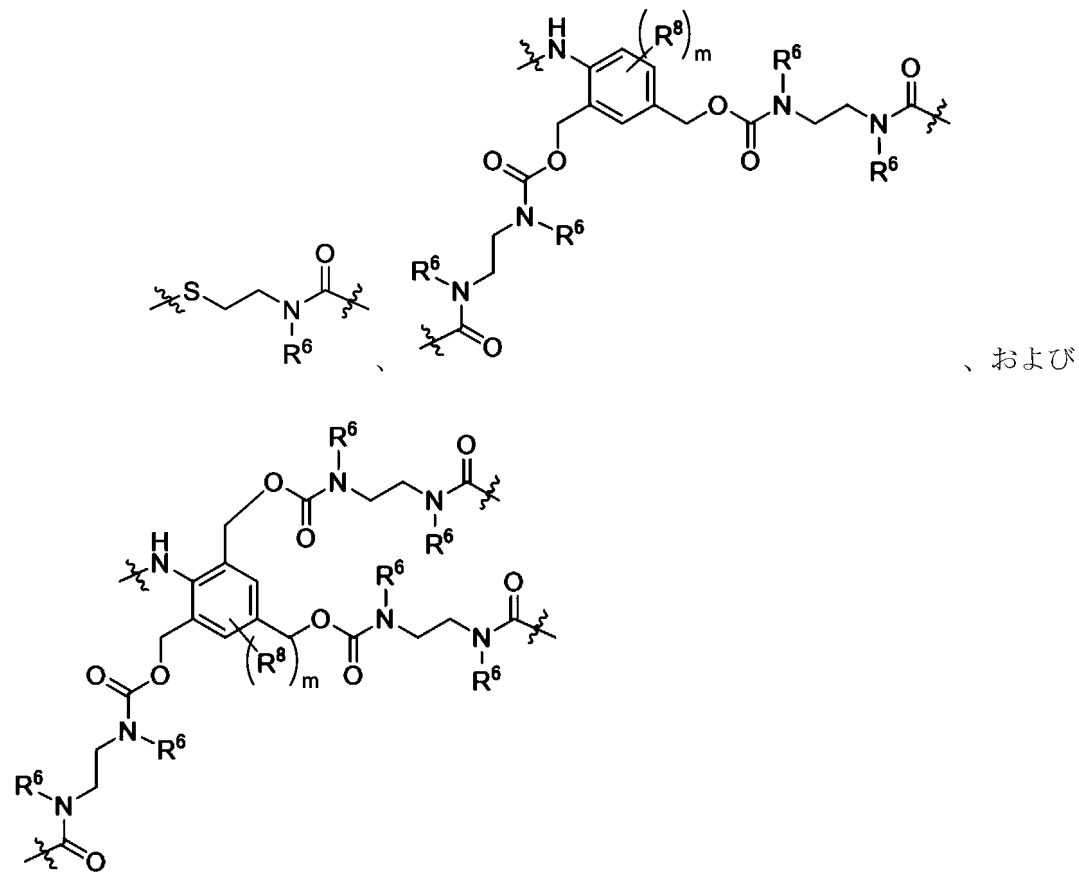
$Pep$  が、アミノ酸またはオリゴペプチド配列を表し、

$A^2$  が、結合であるか、または

## 【化 8 2 - 1】



## 【化 8 2 - 2】



からなる群から選択される自壊性リンカーを表し、

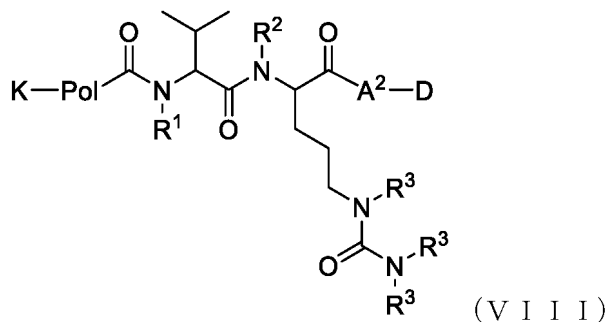
式中、

$R^6$  が、H、トリ(( $C_1 \sim C_6$ )アルキル)シリル、または $-C(O)(C_1 \sim C_6)$ アルキル)を表し、

$R^7$  が、H、( $C_1 \sim C_6$ )アルキル、またはヘテロシクロアルキルを表し、

$R^8$  が、H、ハロ、 $-C(O)_2H$ 、( $C_1 \sim C_6$ )アルコキシ、ジ(( $C_1 \sim C_6$ )

【化 8 3】



P o l が、 1 0 ~ 3 0 個のポリエチレングリコールまたはポリプロピレングリコールの

繰り返し単位を表す、実施態様 65 に記載の化合物。

[ 実施態様 68 ]

Pol が、10～30 個のポリエチレングリコールの繰り返し単位を表す、実施態様 67 に記載の化合物。

[ 実施態様 69 ]

Pol が、15～25 個のポリエチレングリコールの繰り返し単位を表す、実施態様 68 に記載の化合物。

[ 実施態様 70 ]

A<sup>2</sup> が、糖リンカーをさらに含み、前記糖リンカーが、1 つ以上の糖部分を含む、実施態様 57～69 のいずれかに記載の化合物。

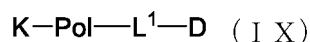
[ 実施態様 71 ]

前記 1 つ以上の糖部分が、ガラクトシル、N - アセチルガラクトサミノ、マンノシル、N - アセチルマンノサミノ、ノイラミン酸、グルコシル、N - アセチルグルコサミノ、マルトシル、およびフルクトシルからなる群から選択される、実施態様 70 に記載の化合物。

[ 実施態様 72 ]

式 (IX) で表される化合物またはその薬学的に許容される塩であって、

【化 84】



式中、

K が、任意に置換されたシクロアルキニル、ヘテロシクロアルキニル、またはアルキニル部分を表し、

Pol が、不在であるか、またはポリマー部分を表し、

L<sup>1</sup> が、アミド、エステル、マレイミド、イミノ、スルフィド、ジスルフィド、ヒドロゾノ、およびオキシモからなる群から選択される部分を含むリンカーを表し、

D が、ファーマコフォアを表し、

前記ポリマー部分が、存在する場合、ポリアルキレングリコールまたはポリアルキレンイミドである、化合物またはその薬学的に許容される塩。

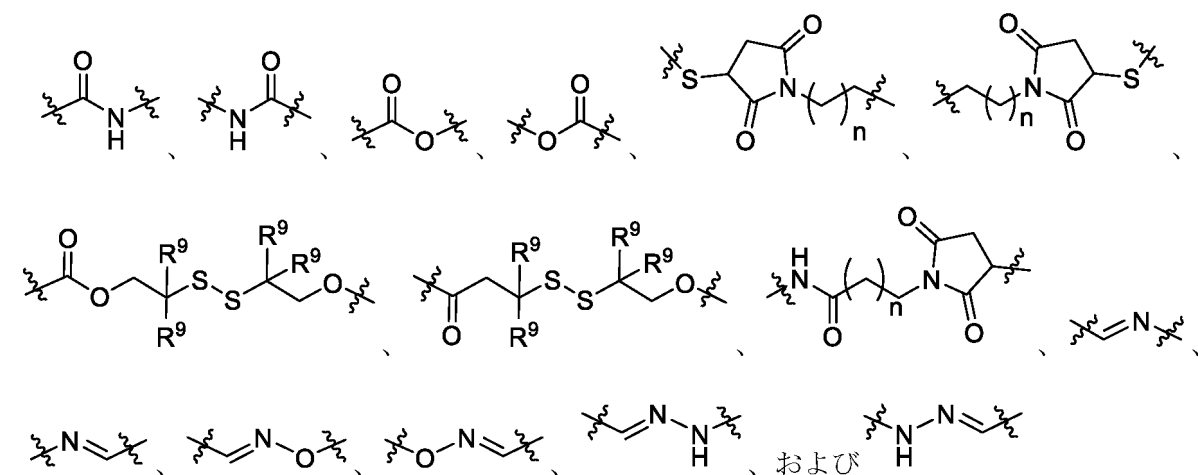
[ 実施態様 73 ]

L<sup>1</sup> が、アミド、カーボネート、またはカルバメート部分を含むリンカーを表す、実施態様 72 に記載の化合物。

[ 実施態様 74 ]

L<sup>1</sup> が、

【化 85】



からなる群から選択される部分を含むリンカーを表し、

式中、

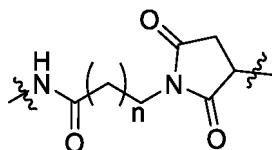
$R^9$  が、H または ( $C_1 \sim C_6$ ) アルキルを表し、

$n$  が、1 または 2 である、実施態様 72 に記載の化合物。

[ 実施態様 75 ]

前記リンカーが、

【化 86】



である、実施態様 72 ~ 74 のいずれかに記載の化合物。

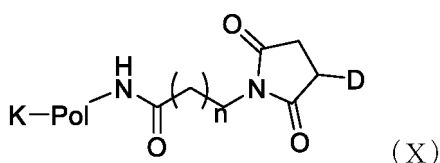
[ 実施態様 76 ]

$n$  が、1 である、実施態様 75 に記載の化合物。

[ 実施態様 77 ]

式 (X) で表され、

【化 87】



(X)

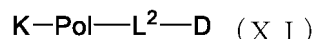
式中、

$n$  が、1 または 2 である、実施態様 72 ~ 75 のいずれかに記載の化合物。

[ 実施態様 78 ]

式 (XI) で表される化合物またはその薬学的に許容される塩であって、

【化 88】



式中、

$K$  が、任意に置換されたシクロアルキニル、ヘテロシクロアルキニル、またはアルキニル部分を表し、

$Pol$  が、不在であるか、またはポリマー部分を表し、

$L^2$  が、不在であるか、またはトリガー応答性部分を表し、

$D$  が、ファーマコフォアを表し、

前記ポリマー部分が、存在する場合、ポリアルキレングリコールまたはポリアルキレンイミドである、化合物またはその薬学的に許容される塩。

[ 実施態様 79 ]

前記トリガーが、細胞過酸化物である、実施態様 78 に記載の化合物。

[ 実施態様 80 ]

前記トリガー応答性部分が、ボロン酸基、ジアルキルボロネート基、ジアリールボロネート基、ジ(アラルキル)ボロネート基、ボロラン基、またはジオキサボロラン基を含む、実施態様 78 または 79 に記載の化合物。

[ 実施態様 81 ]

細胞過酸化物による前記トリガー応答性部分の開裂時に、前記化合物が分解し、それによって前記ファーマコフォアを放出する、実施態様 80 に記載の化合物。

[ 実施態様 82 ]

前記トリガーが、低酸素である、実施態様 78 に記載の化合物。

[ 実施態様 83 ]

前記トリガー応答性部分が、2 - ニトロイミダゾール部分またはアゾベンゼンなどのアゾ基を含む、実施態様 7 8 または 8 2 に記載の化合物。

[ 実施態様 8 4 ]

低酸素条件下での前記トリガー応答性部分の開裂時に、前記化合物が分解し、それによって前記ファーマコフォアを放出する、実施態様 8 3 に記載の化合物。

[ 実施態様 8 5 ]

前記トリガーが、スルフヒドリル含有またはグルタチオンなどのチオレート含有化合物である、実施態様 7 8 に記載の化合物。

[ 実施態様 8 6 ]

前記トリガー応答性部分が、ジスルフィド結合を含む、実施態様 7 8 または 8 5 に記載の化合物。

[ 実施態様 8 7 ]

スルフヒドリル含有またはチオレート含有化合物による前記ジスルフィド結合の開裂時に、前記化合物が分解し、それによって前記ファーマコフォアを放出する、実施態様 8 6 に記載の化合物。

[ 実施態様 8 8 ]

前記トリガーが、N A D ( P ) H デヒドロゲナーゼ ( キノン 1 ) ( N Q O 1 ) である、実施態様 7 8 に記載の化合物。

[ 実施態様 8 9 ]

前記トリガー応答性部分が、任意に置換されたプロピオン酸またはプロピオン酸アミド部分に共有結合した、任意に置換されたキノンを含む、実施態様 7 8 または 8 8 に記載の化合物。

[ 実施態様 9 0 ]

N A D ( P ) H デヒドロゲナーゼ ( キノン 1 ) ( N Q O 1 ) による、任意に置換されたプロピオン酸またはプロピオン酸アミド部分に共有結合した、前記任意に置換されたキノンの開裂時に、前記化合物が分解し、それによって前記ファーマコフォアを放出する、実施態様 8 9 に記載の化合物。

[ 実施態様 9 1 ]

前記トリガーが、カテプシン酵素である、実施態様 7 8 に記載の化合物。

[ 実施態様 9 2 ]

前記トリガー応答性部分が、カテプシン酵素によって開裂されるアミド結合を含むアミノ酸またはオリゴペプチド配列である、実施態様 9 1 に記載の化合物。

[ 実施態様 9 3 ]

前記アミド結合を含むアミノ酸またはオリゴペプチド配列が、P h e - L y s、V a l - L y s、A l a - L y s、V a l - C i t、P h e - C i t、L e u - C i t、I l e - C i t、T r p - C i t、P h e - A r g ( N O <sub>2</sub> )、P h e - A r g ( T s )、または L y s - G l y - A r g - A r g を含む、実施態様 9 2 に記載の化合物。

[ 実施態様 9 4 ]

前記アミノ酸またはオリゴペプチド配列が、置換リジンアミドである、実施態様 9 2 に記載の化合物。

[ 実施態様 9 5 ]

前記カテプシン酵素による前記アミド結合の開裂時に、前記化合物が分解し、それによって前記ファーマコフォアを放出する、実施態様 9 2 ~ 9 4 のいずれかに記載の化合物。

[ 実施態様 9 6 ]

前記カテプシン酵素が、カテプシン L である、実施態様 9 1 ~ 9 5 のいずれかに記載の化合物。

[ 実施態様 9 7 ]

K が、任意に置換されたヘテロシクロアルキニルまたはシクロアルキニルを含む、実施態様 7 2 ~ 9 6 のいずれかに記載の化合物。

[ 実施態様 9 8 ]

K が、任意に置換されたジベンゾシクロオクチン部分を含む、実施態様 97 に記載の化合物。

[ 実施態様 99 ]

P o l が、ポリエチレングリコールまたはポリプロピレングリコール部分を表す、実施態様 72 ~ 98 のいずれかに記載の化合物。

[ 実施態様 100 ]

P o l が、0 ~ 5000 個のポリエチレングリコールまたはポリプロピレングリコールの繰り返し単位を表す、実施態様 99 に記載の化合物。

[ 実施態様 101 ]

P o l が、0 ~ 5000 個のポリエチレングリコールの繰り返し単位を表す、実施態様 99 に記載の化合物。

[ 実施態様 102 ]

P o l が、4 ~ 30 個のポリエチレングリコールの繰り返し単位を表す、実施態様 101 に記載の化合物。

[ 実施態様 103 ]

前記ファーマコフォアが、鎮痙剤、麻酔剤、非ステロイド性抗炎症 ( N S A I D ) 剤などの抗炎症剤、抗癌治療剤、カルシウムチャネル遮断剤、抗生物質剤、免疫抑制剤、抗ウイルス剤、抗増殖剤、抗微生物剤、神経成長誘導剤、または平滑筋弛緩剤である、実施態様 57 ~ 102 のいずれかに記載の化合物。

[ 実施態様 104 ]

前記ファーマコフォアが、抗癌治療剤または細胞毒性剤である、実施態様 103 に記載の化合物。

[ 実施態様 105 ]

前記抗癌治療剤が、アクチノマイシン - D、アルトレタミン、アミノグルテチミド、アムサクリン、アナストロゾール、アスパラギナーゼ、ベラクトシン A、ピカルタミド、ブレオマイシン、ボルテゾミブ、ブセレリン、ブスルファン、カンボテシン、カンプトテシン、カペシタビン、カルボプラチン、カルフィルゾミブ、カルムスチン、クロラムブシル、クロロキン、シスプラチン、クラドリビン、クロドロネート、コルヒチン、シクロホスファミド、シプロテロン、シタラビン、ダカルバジン、ダクチノマイシン、ダウノルビシン、デメトキシビリジン、デキサメタゾン、ジクロロアセテート、ジエネストロール、ジエチルスチルベストロール、ドセタキセル、ドキソルビシン、エビルビシン、エボキシオミシン、エストラジオール、エストラムスチン、エトボシド、エベロリムス、エキセメスタン、フェルタミド B、フィルグラスチム、フルダラビン、フルドロコルチゾン、5 - フルオロウラシル、フロクスウリジン、フルオキシメステロン、フルタミド、ゲムシタビン、ゲニステイン、ゴセレリン、ヒドロキシウレア、イダルビシン、イホスファミド、イマチニブ、インターフェロン、イリノテカン、イクサベピロン、レナリドマイド、レトロゾール、ロイコボリン、ロイプロリド、レバミゾール、ロムスチン、ロニダミン、マリゾミブ、メイタンシン、メクロレタミン、メドロキシプロゲステロン、メゲストロール、メルファラン、メルカプトプリン、メルタンシン、メスナ、メトホルミン、メトトレキサート、メチルプレドニゾロン、マイトマイシン、ミトタン、ミトキサントロン、モノメチルアウリスタチン、ニルタミド、ノコダゾール、オクトレオチド、オムラリド、オキサリプラチン、パクリタキセル、パミドロネート、ペメトレキセド、ペントスタチン、ペリホシン、プリカマイシン、ボマリドミド、ボルフィマー、ブレドニゾン、プロカルバジン、ラルチトレキセド、リツキシマブ、ソラフェニブ、ストレプトゾシン、スニチニブ、スラミン、タモキシフェン、テモゾロミド、テムシロリムス、テニボシド、テストステロン、サリドマイド、チオグアニン、チオテパ、二塩化チタノセン、トボテカン、トラスツズマブ、トレチノイン、ピンブラスチン、ピンクリスチン、ピンデシン、ピノレルビン、S N - 38、M G - 132、P S I、C E P - 18770、M L N - 2238、M L N - 9708、N C - 005、Y U - 101、L U - 005、Y U - 102、N C - 001、L U - 001、N C - 022、P R - 957 ( L M P 7 )、C P S I ( 5 )、10 L M P 2 - s

p - e k、BODIPY - NC - 001、アジド - NC - 002、ONX - 0912、P  
S - 519、125I - NIP - L3VS、NC - 005 - VS、MV151、またはそ  
れらの誘導体である、実施態様104に記載の化合物。

[ 実施態様106 ]

前記抗癌治療剤が、ドキソルピシンである、実施態様105に記載の化合物。

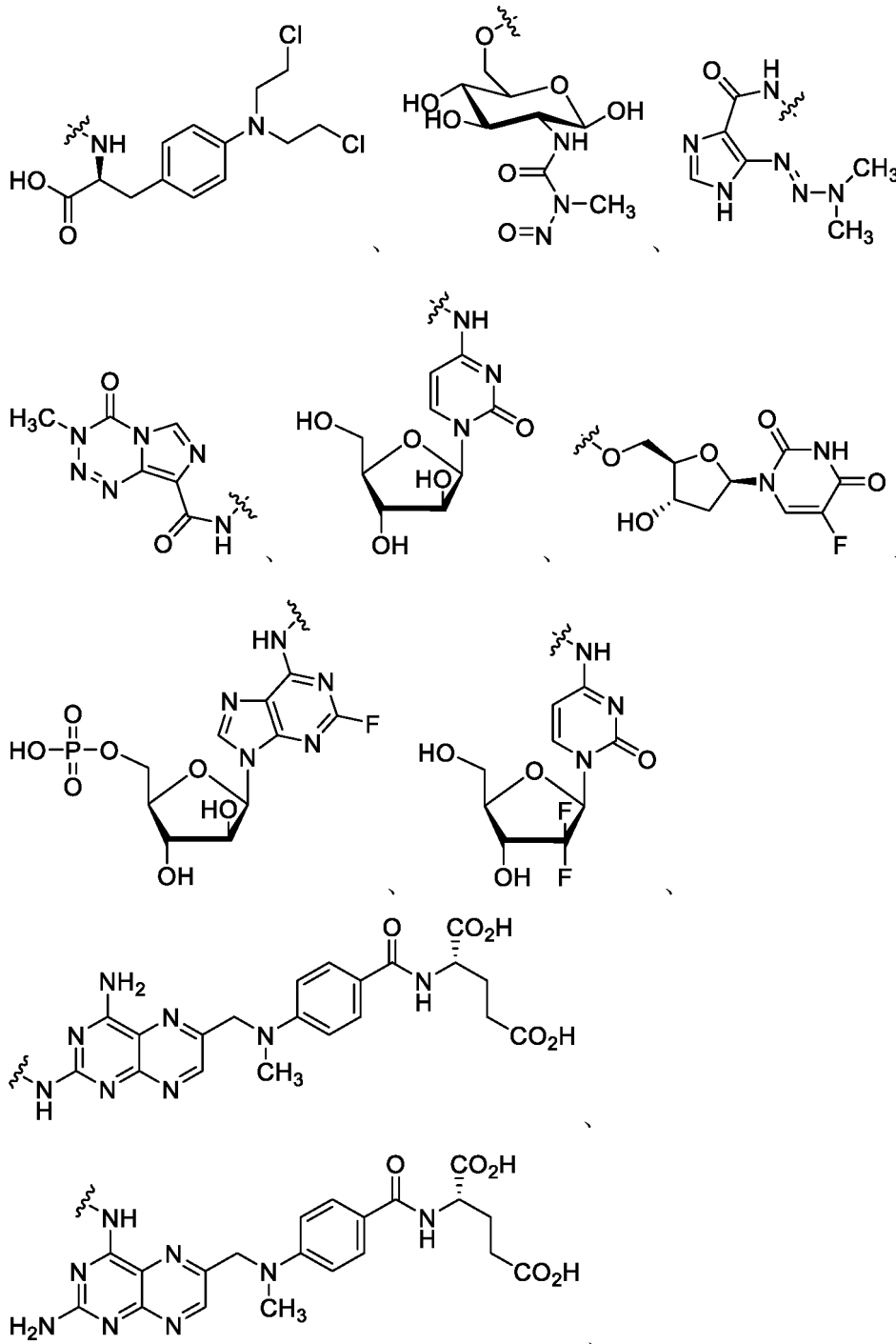
[ 実施態様107 ]

前記抗癌治療剤が、メルタンシンである、実施態様105に記載の化合物。

[ 実施態様108 ]

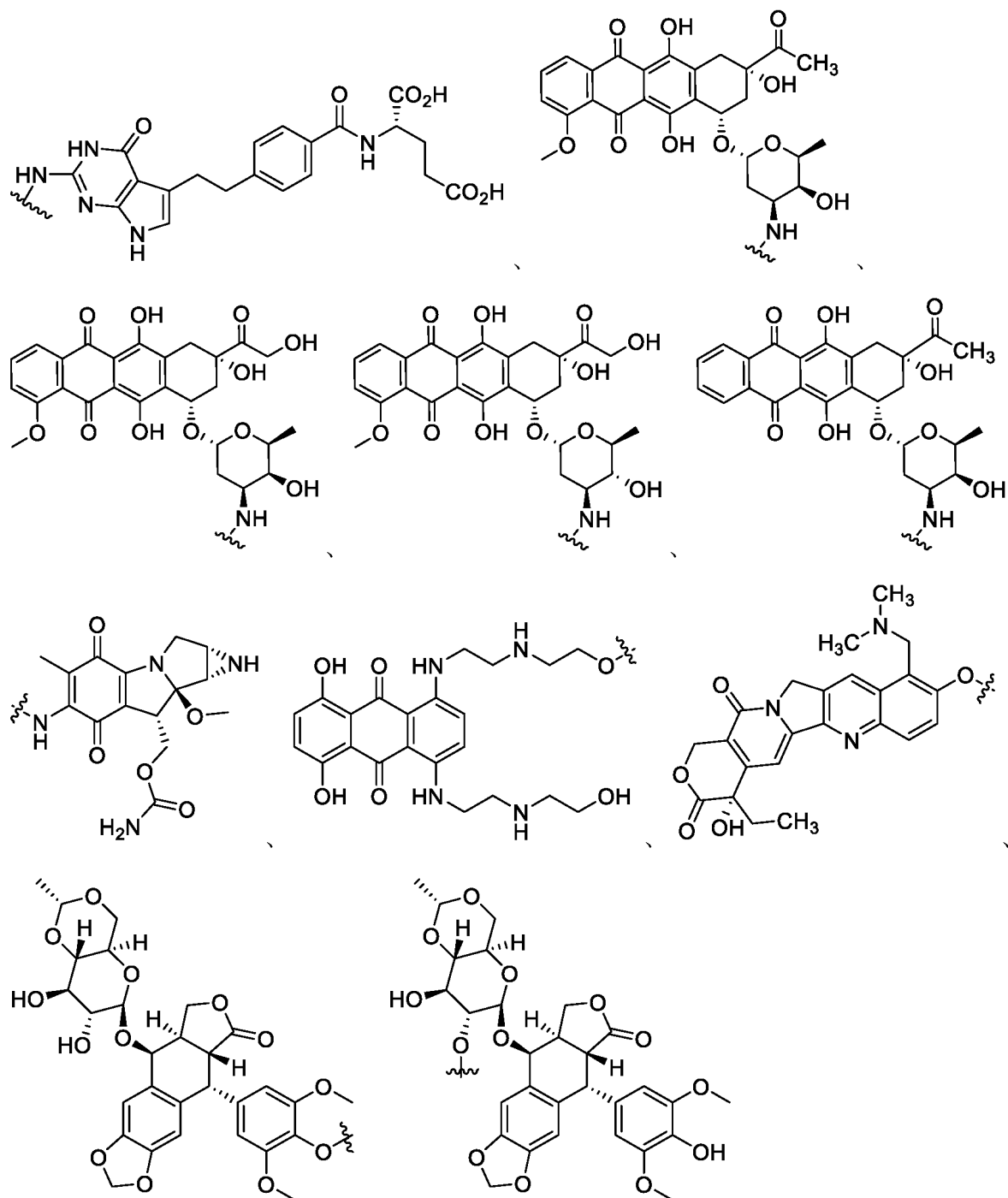
実施態様57～105のいずれかに記載の化合物であって、Dが、

【化89-1】

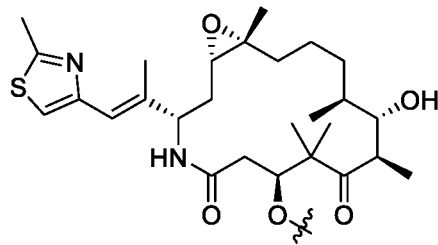
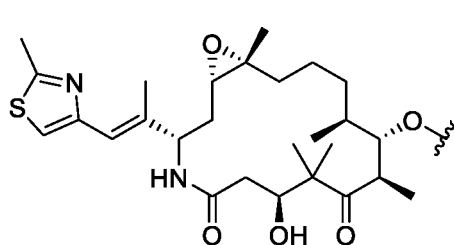
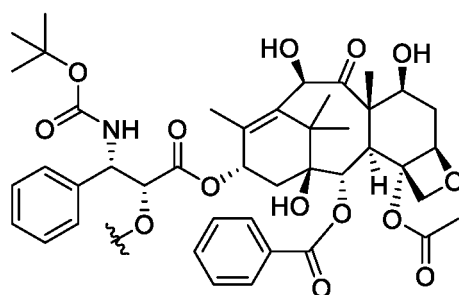
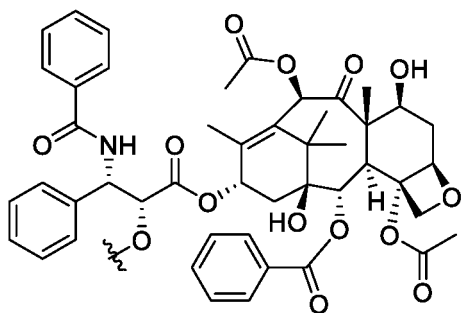
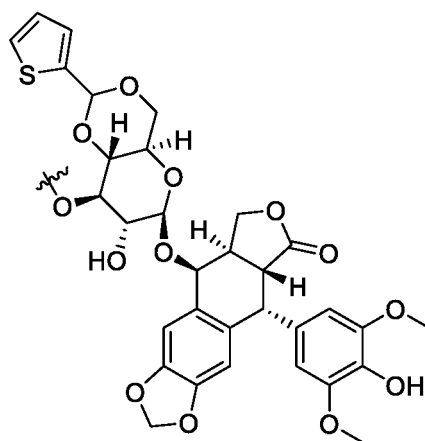
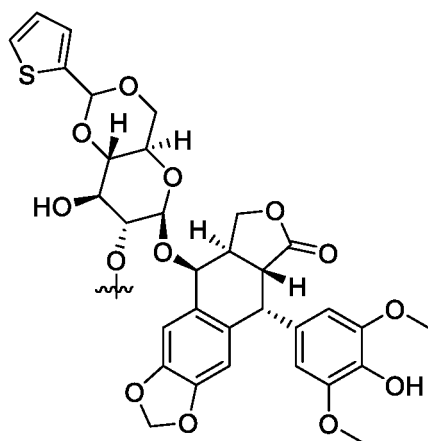
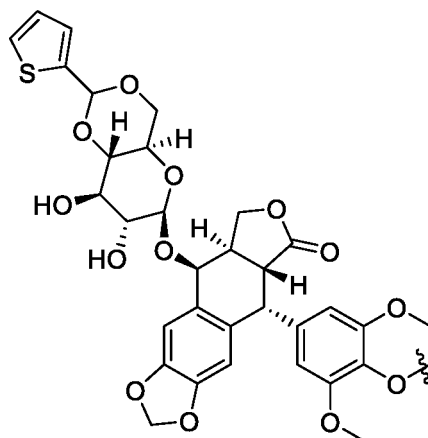
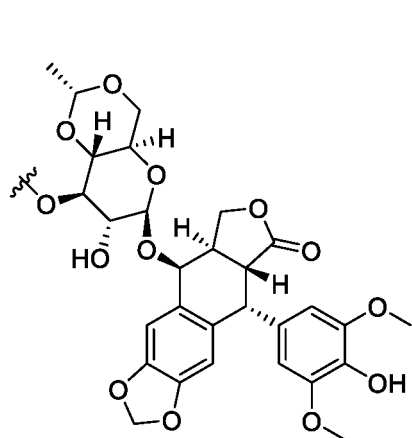




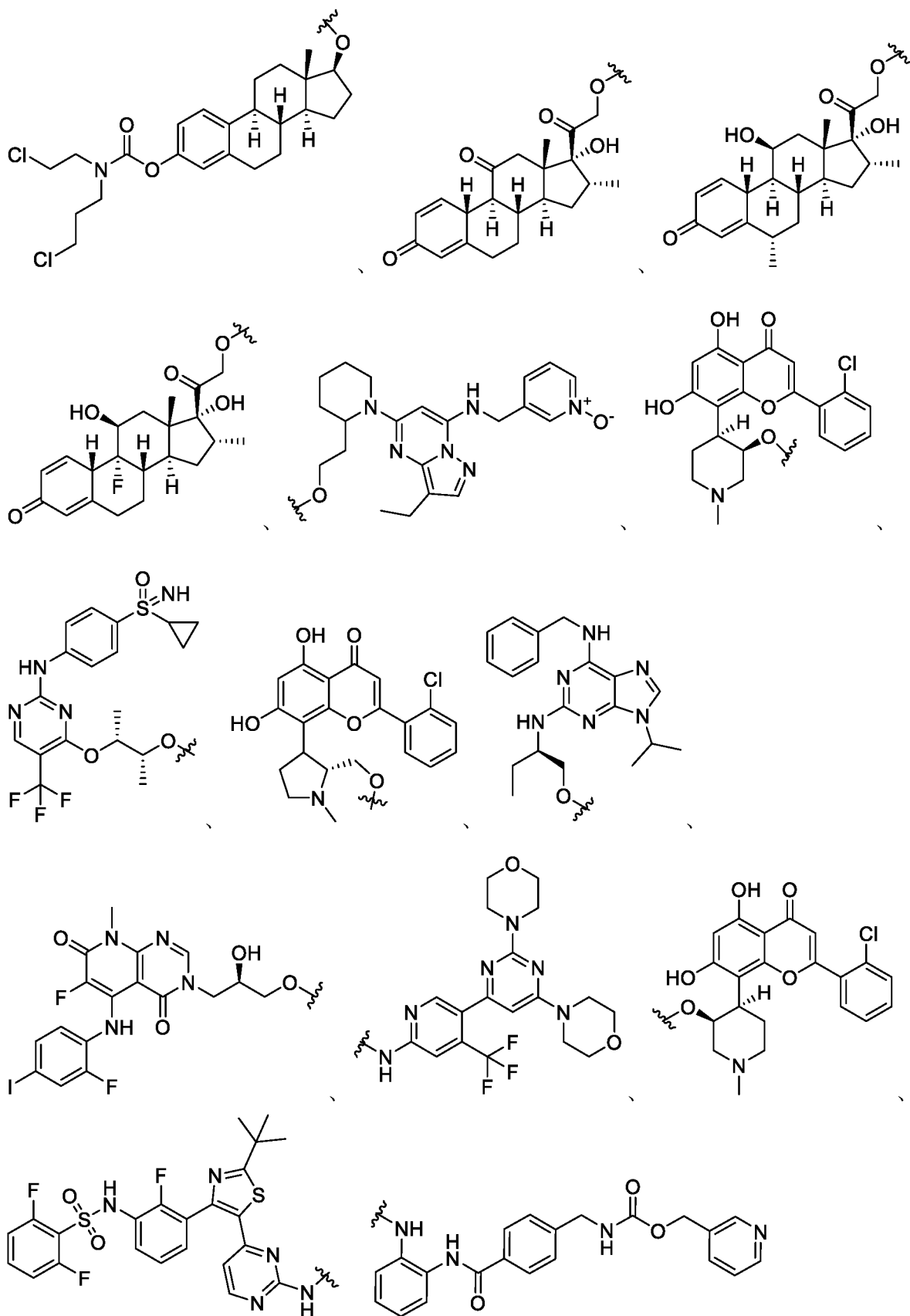
【化 8 9 - 2】



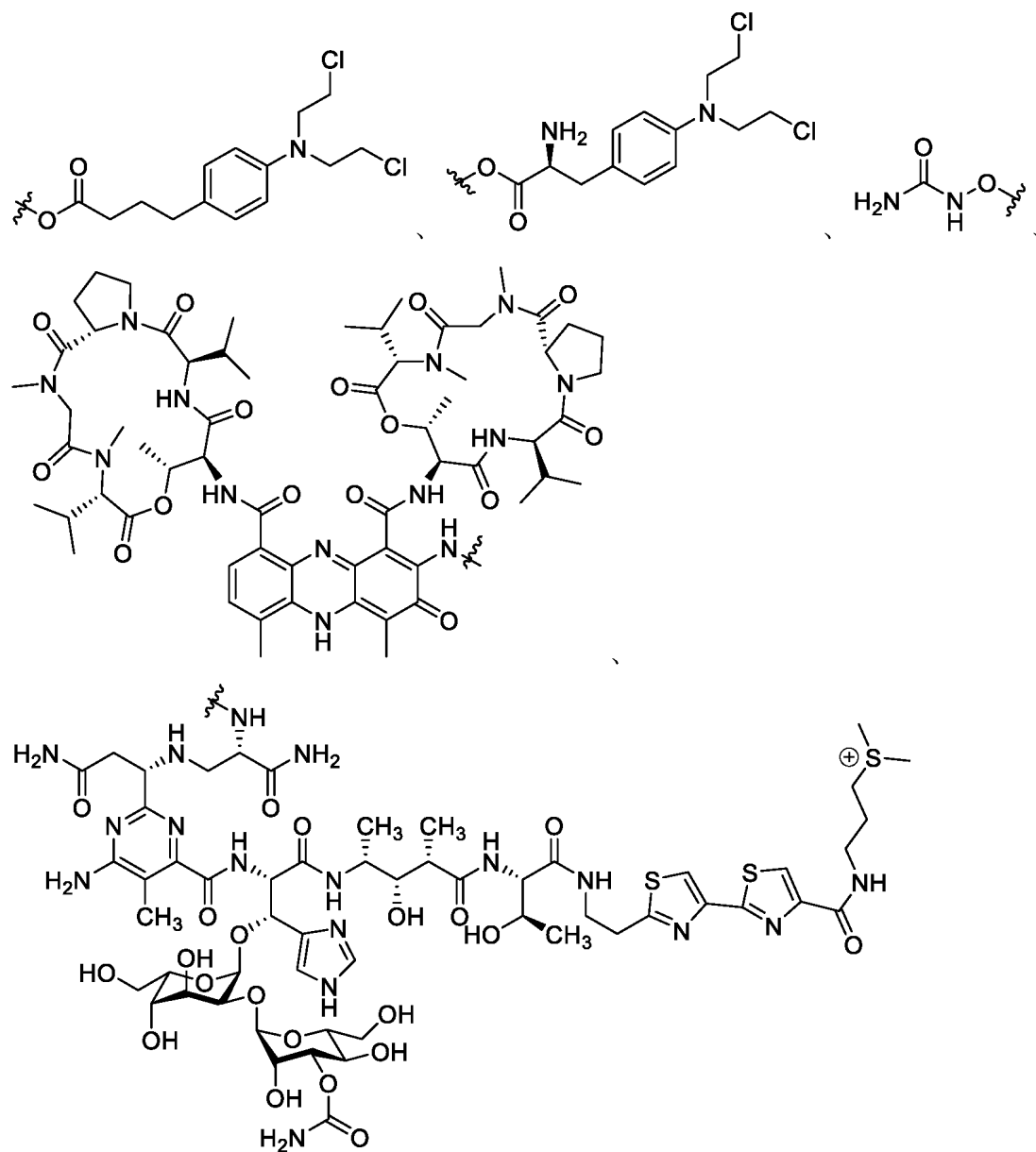
【化 8 9 - 3】



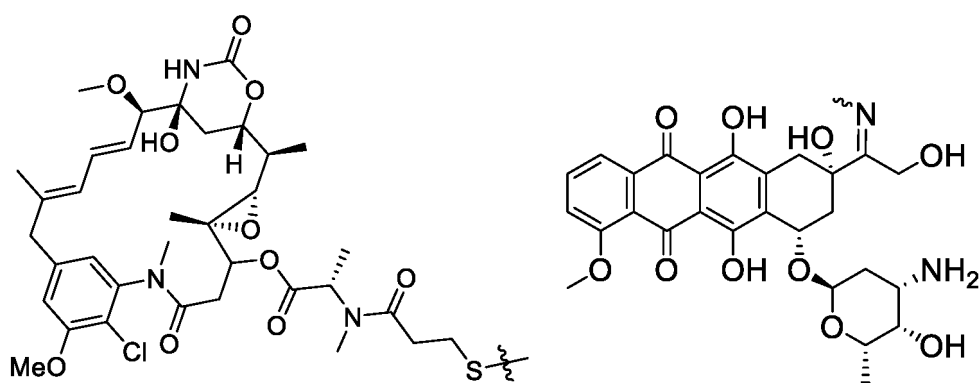
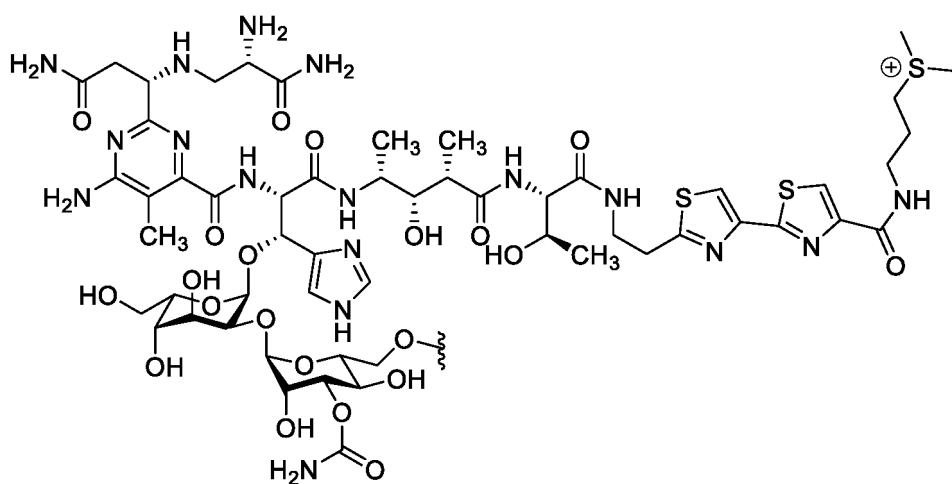
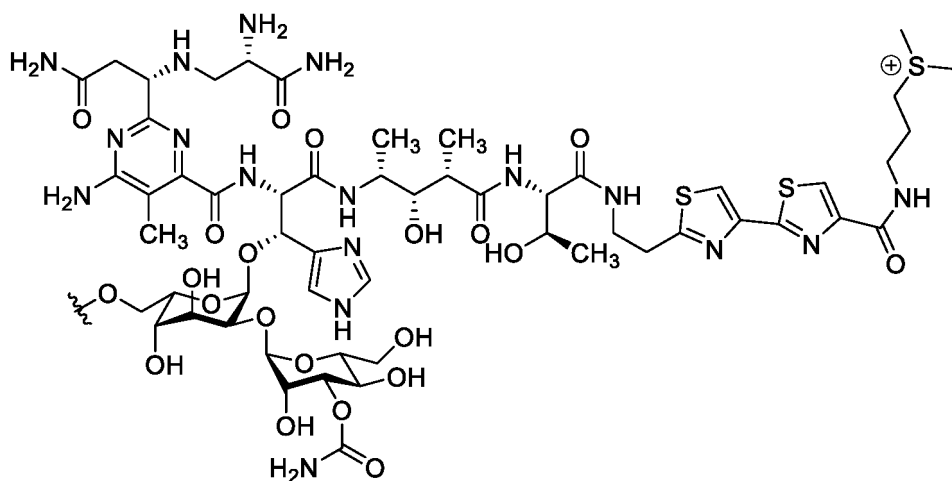
【化 8 9 - 4】



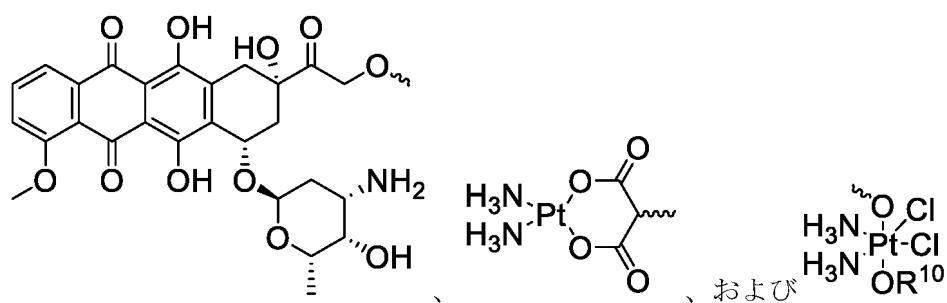
【化 8 9 - 5】



## 【化 8 9 - 6】



## 【化 8 9 - 7】



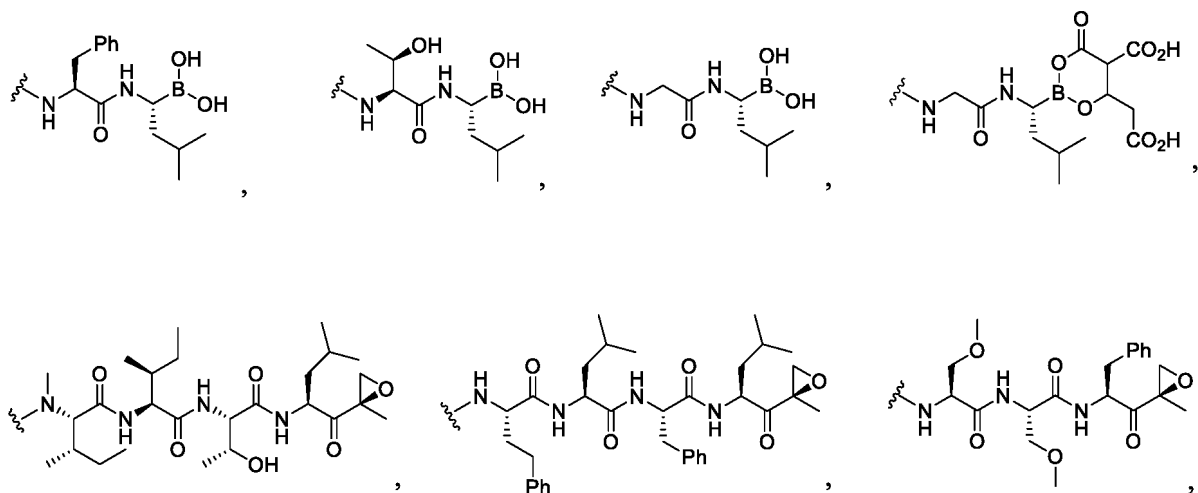
からなる群から選択されるファーマコフォアを表し、式中、

$R^{10}$  が、H、C(O)((C<sub>1</sub> ~ C<sub>18</sub>)アルキル)、C(O)-NH-((C<sub>1</sub> ~ C<sub>18</sub>)アルキル)、または(C<sub>1</sub> ~ C<sub>18</sub>)アルキルである、化合物。

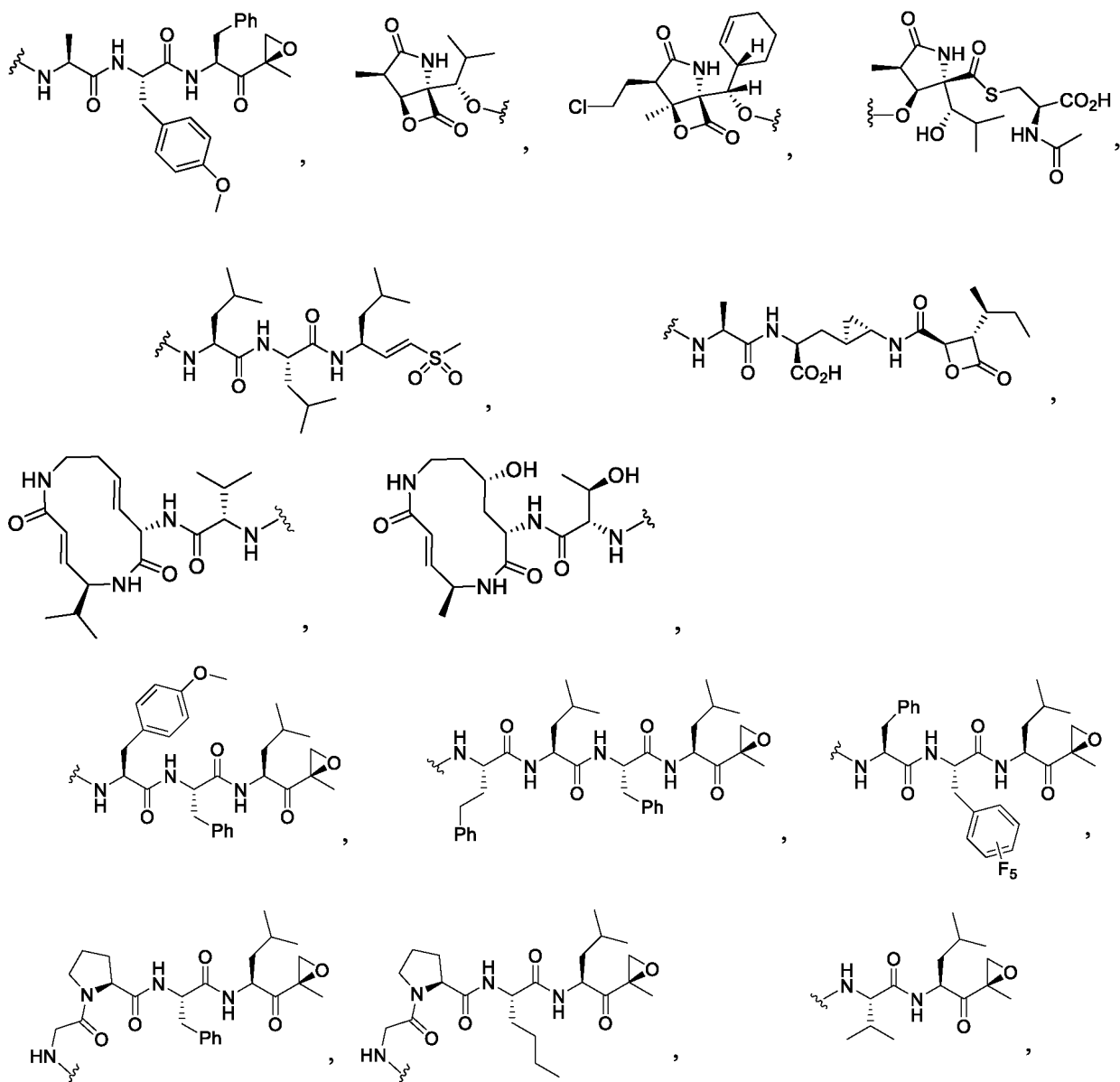
[実施態様109]

実施態様57 ~ 105のいずれかに記載の化合物であって、Dが、

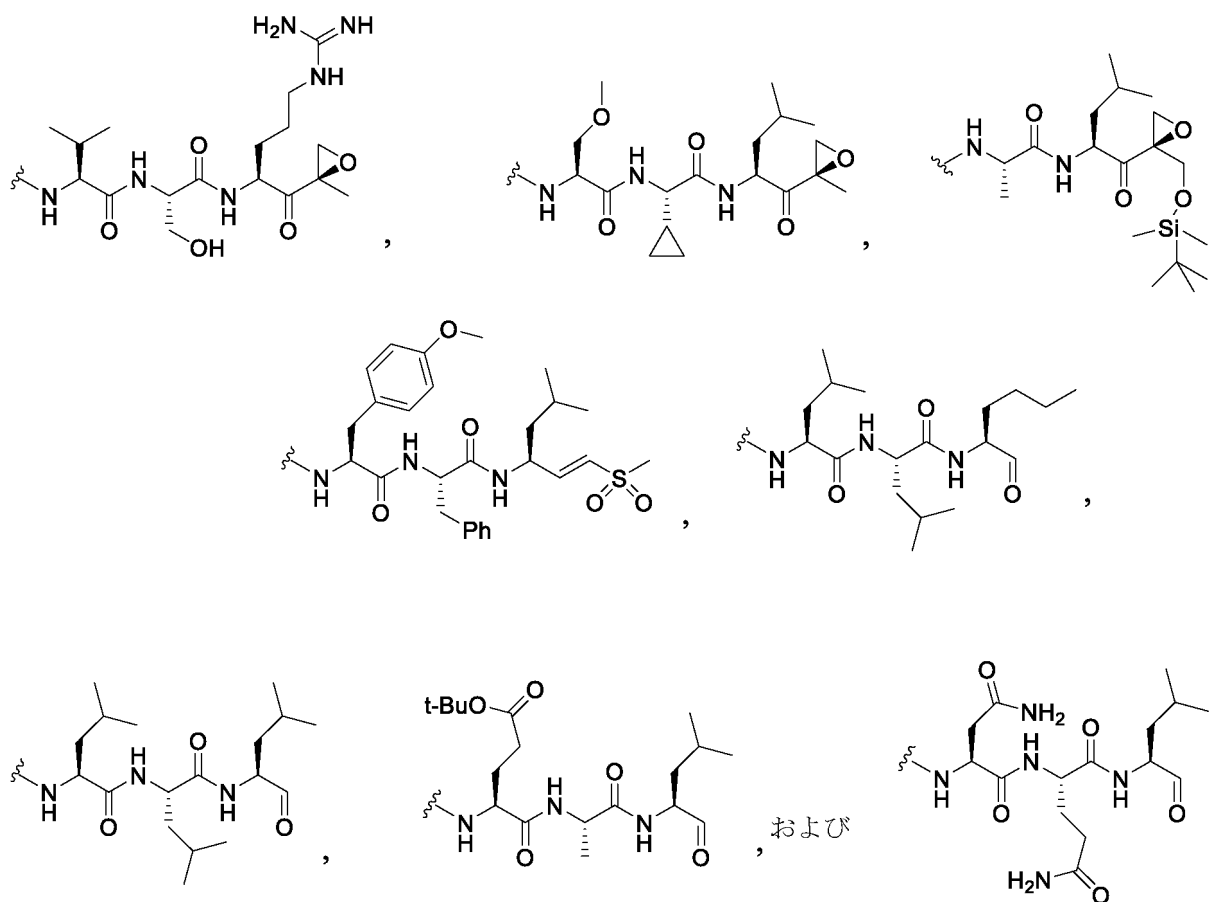
【化90-1】



【化 90 - 2】



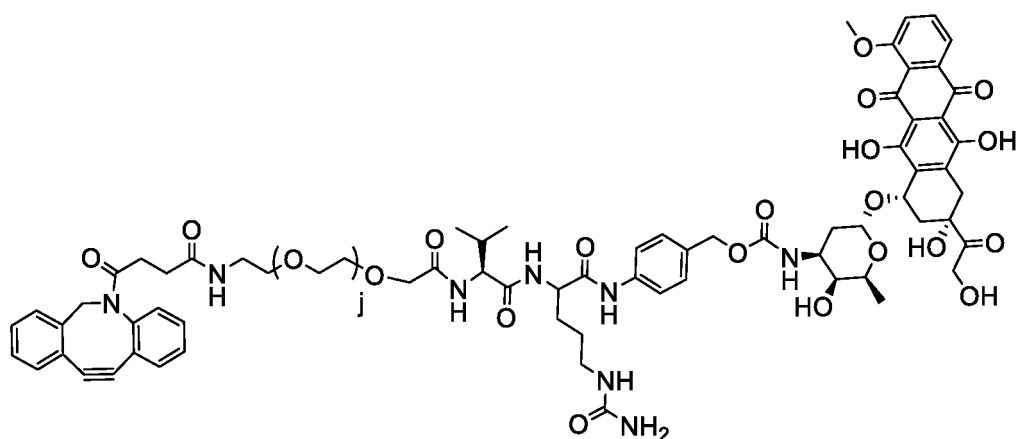
## 【化 9 0 - 3】



からなる群から選択されるファーマコフォアを表す、化合物。

[ 実施態様 1 1 0 ]

## 【化 9 1】



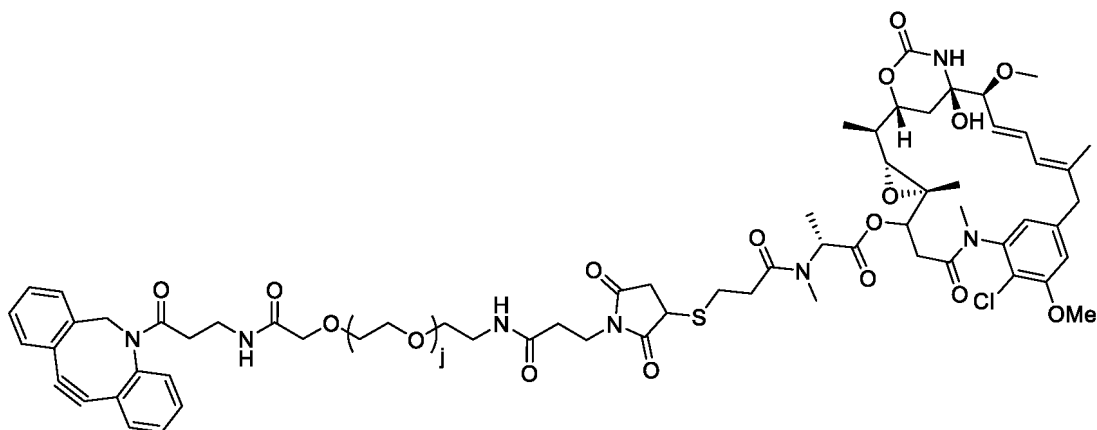
で表される化合物であって、

式中、j が、0 ~ 5 0 0 0 の整数である、化合物。

[ 実施態様 1 1 1 ]



## 【化 9 2】

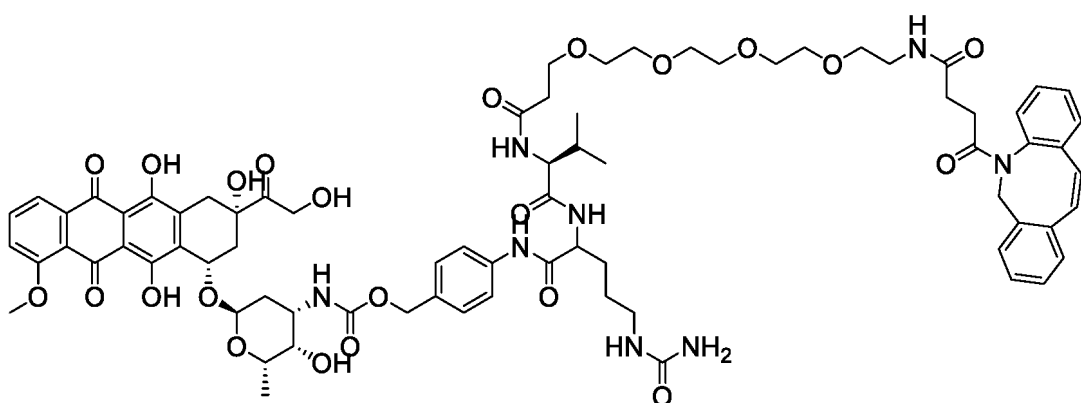


で表される化合物であって、

式中、j が、0 ~ 5 0 0 0 の整数である、化合物。

[ 実施態様 1 1 2 ]

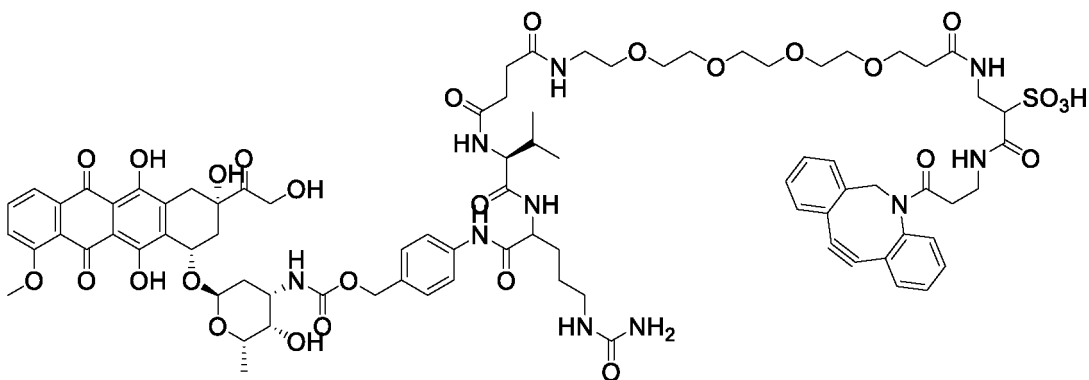
## 【化 9 3】



で表される化合物。

[ 実施態様 1 1 3 ]

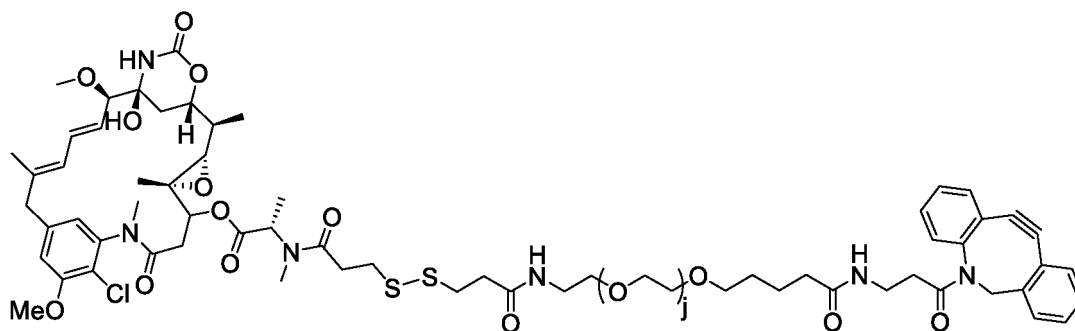
## 【化 9 4】



で表される化合物。

[ 実施態様 1 1 4 ]

## 【化 9 5】

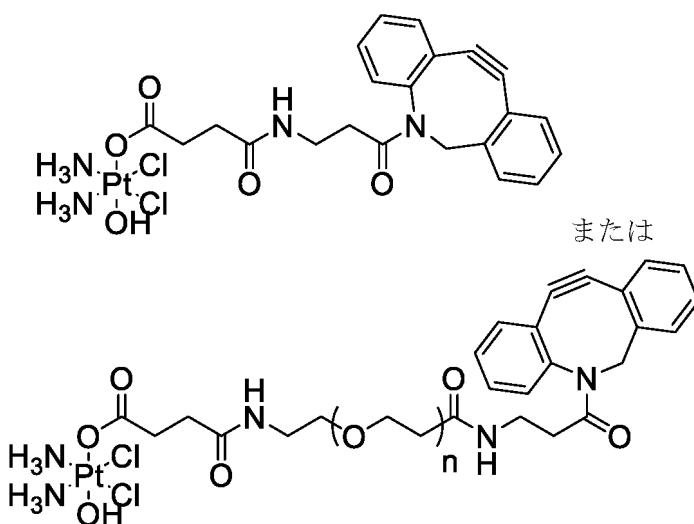


で表される化合物であって、

式中、 $j$  が、 $0 \sim 5000$  の整数である、化合物。

[ 実施態様 115 ]

## 【化 9 6】

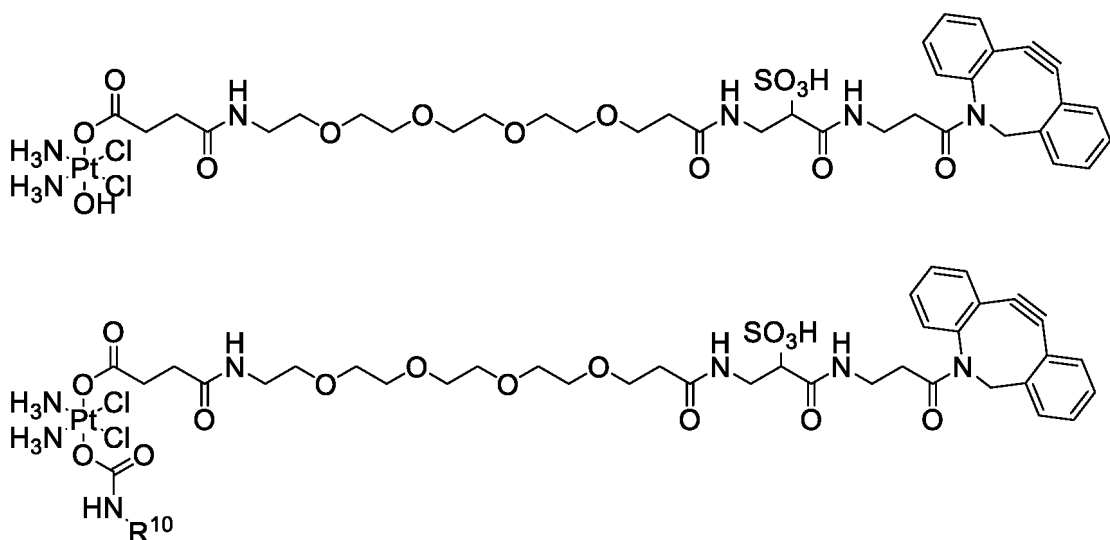
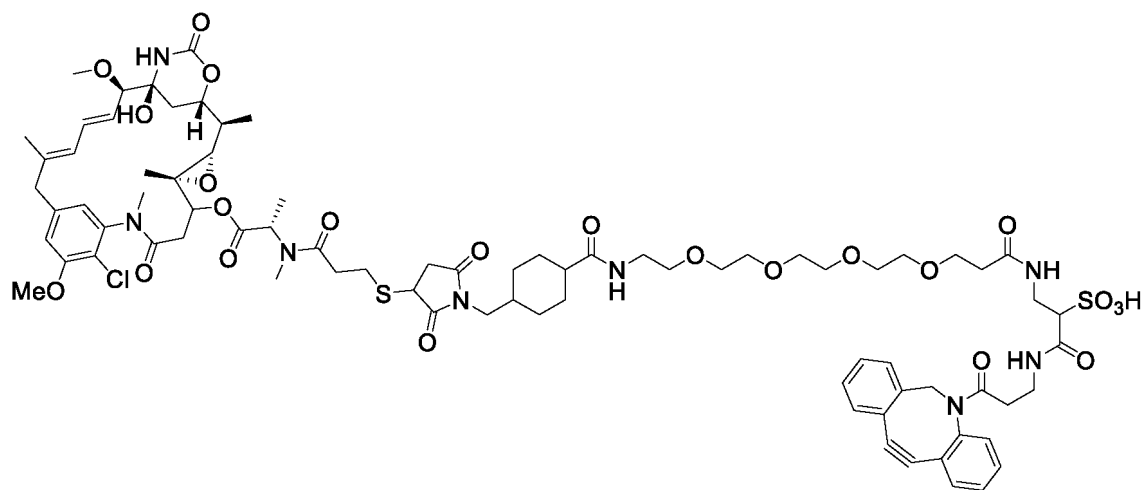


で表される化合物であって、

式中、 $n$  が、 $1 \sim 5000$  の整数である、化合物。

[ 実施態様 116 ]

【化 9 7】



、および

から選択される化合物であって、  
式中、

$R^{10}$  が、Hもしくは $(C_1 \sim C_{18})$ アルキルである、化合物、  
またはその薬学的に許容される塩。

【実施態様 117】

実施態様 1 ~ 116 のいずれかに記載の化合物と、薬学的に許容される賦形剤または担体と、を含む、薬学的組成物。

【実施態様 118】

癌細胞の表面上にアジド糖を発現させる方法であって、

癌細胞を実施態様 1 ~ 56 のいずれかに記載の化合物と接触させ、それによって前記癌細胞の前記表面上に前記アジド糖を発現させることを含む、方法。

【実施態様 119】

哺乳動物における悪性組織においてアジド糖を発現させる方法であって、

悪性組織を有する哺乳動物に有効量の実施態様 1 ~ 56 のいずれかに記載の化合物を投与することを含む、方法。

【実施態様 120】

それを必要とする対象に治療有効量の実施態様 1 ~ 56 のいずれかに記載の化合物を投与することを含む、癌を治療する方法。

【実施態様 121】

前記対象に治療有効量の実施態様 57 ~ 116 のいずれかに記載の化合物を投与するこ

とをさらに含む、実施態様 1 1 7 に記載の方法。

[ 実施態様 1 2 2 ]

それを必要とする対象に治療有効量の実施態様 5 7 ~ 1 1 6 のいずれかに記載の化合物を投与することを含む、癌を治療する方法。