

【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 07 H	15/12	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
C 07 H	15/18	(2006.01)
A 61 K	47/56	(2017.01)
A 61 K	47/60	(2017.01)
A 61 K	45/00	(2006.01)
A 61 K	31/704	(2006.01)
A 61 K	31/537	(2006.01)
A 61 K	33/24	(2019.01)
A 61 K	31/7008	(2006.01)
A 61 K	31/337	(2006.01)
C 07 H	15/252	(2006.01)
C 07 D	498/18	(2006.01)
A 61 K	31/55	(2006.01)

【F I】

C 07 H	15/12	C S P
A 61 P	35/00	
A 61 P	43/00	1 2 1
C 07 H	15/18	
A 61 K	47/56	
A 61 K	47/60	
A 61 K	45/00	
A 61 K	31/704	
A 61 K	31/537	
A 61 K	33/24	
A 61 K	31/7008	
A 61 K	31/337	
C 07 H	15/252	
C 07 D	498/18	3 1 1
A 61 K	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-ガラクトピラノシリル部分と、

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、

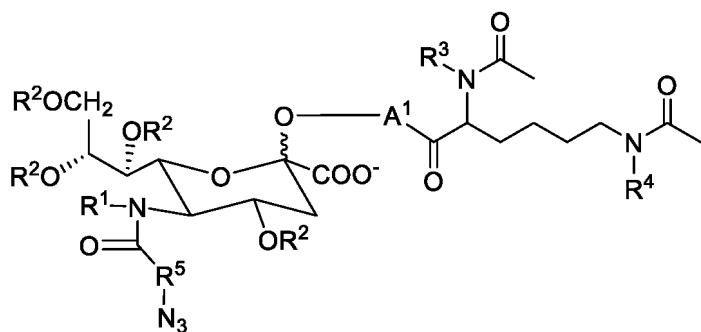
を含む、化合物またはその薬学的に許容される塩であって、

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リル部分、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。

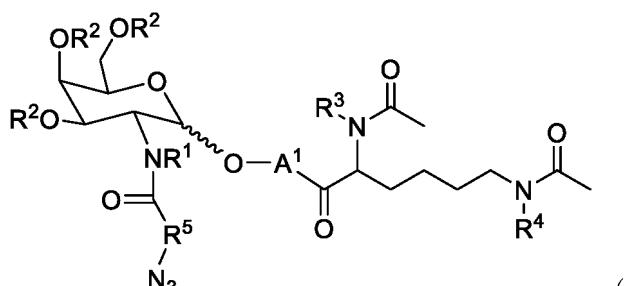
【請求項2】

式(I)、式(II)、または式(IIa)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：

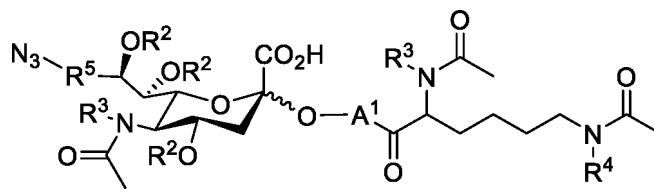
【化1】



(I)、



(II)、または



(IIa)

式中、

R¹は、Hまたはトリ((C₁~C₆)アルキル)シリルを表し、

R²は、各出現について独立して、H、-C(O)((C₁~C₆)アルキル)、ガラクトシリル、N-アセチルガラクトサミノ、マンノシリル、N-アセチルマンノサミノ、グルコシリル、N-アセチルグルコサミノ、マルトシリル、またはフルクトシリルを表し、

R³およびR⁴は、各出現について独立して、H、トリ((C₁~C₆)アルキル)シリル、または-C(O)((C₁~C₆)アルキル)を表し、

R⁵は、(C₁~C₆)アルキレンを表し、

A¹は、前記自壊性リンカーを表す。

【請求項3】

R¹がHを表す、および/または

R²が、各出現について独立して、Hまたは-C(O)CH₃を表す、および/または

R² の全ての出現が同一である、および / または
R³ および R⁴ が H である、請求項 2 に記載の化合物。

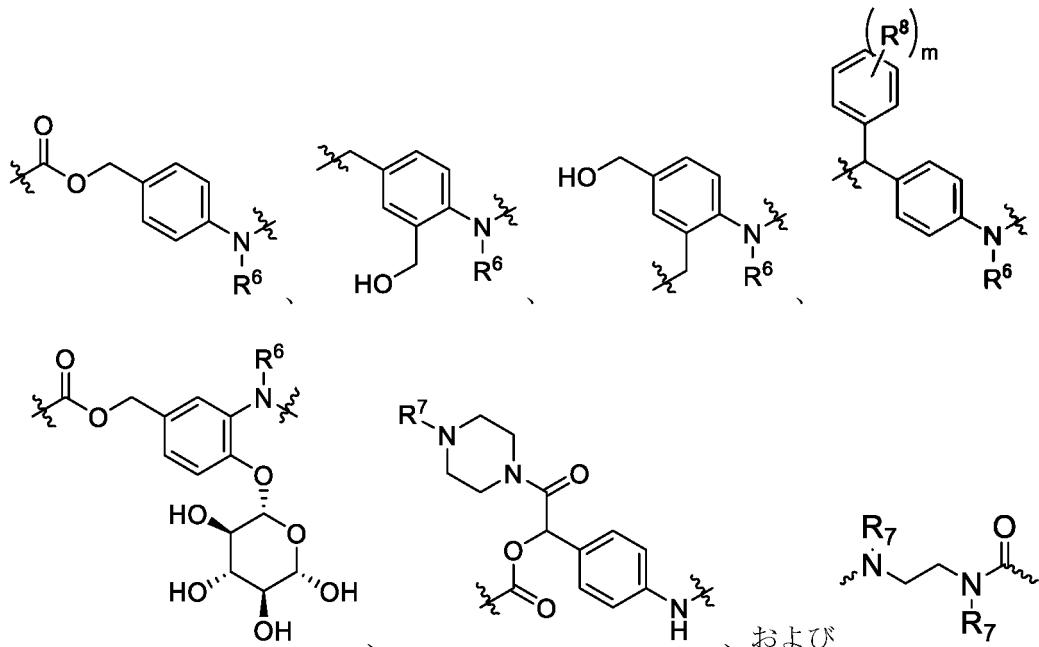
【請求項 4】

A¹ が、 - X¹ - Y¹ - 基を表し、
 X¹ が、結合または - C (O) - を表し、
 Y¹ が、結合または任意に置換された - ((C₁) アルキレン) - アリーレン - もしくは - ((C₁) 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、

R⁶ は、H、トリ((C₁ ~ C₆) アルキル)シリル、または - C (O) ((C₁ ~ C₆) アルキル) を表し、

R⁷ は、H、(C₁ ~ C₆) アルキル、またはヘテロシクロアルキルを表し、

R⁸ は、H、ハロ、- C (O)₂ H、(C₁ ~ C₆) アルコキシ、ジ((C₁ ~ C₆) アルキル)アミノ、- NO₂、- O (C H₂ C H₂ O)_q C H₃ を表し、

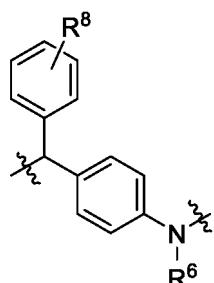
m は、1、2、3、4、または5 であり、

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】

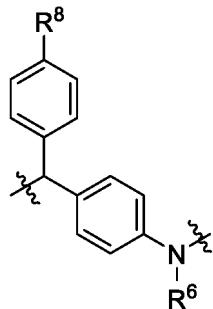


である、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

前記自壊性リンカーが、

【化 4】

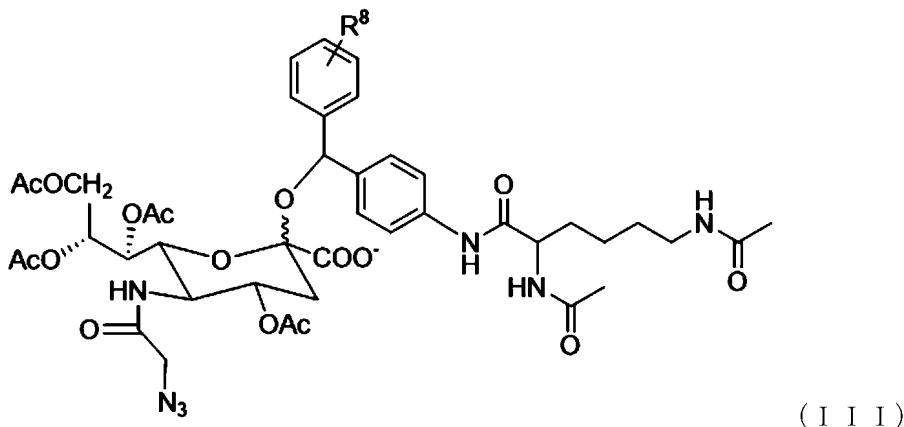


である、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

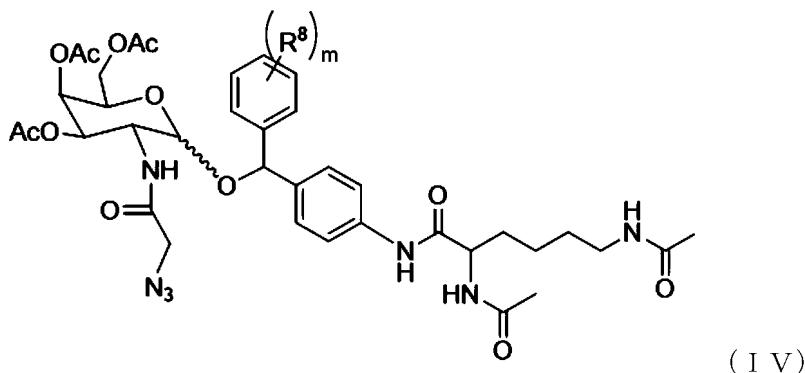
式 (I I I) で表される、またはその薬学的に許容される塩である：

【化 5】

[式中、R⁸ は、H、ハロ、-C(O)₂H、(C₁~C₆)アルコキシ、ジ((C₁~C₆)アルキル)アミノ、-NO₂、-O(CH₂CH₂O)_qCH₃を表し；q は、1~5000である]、あるいは

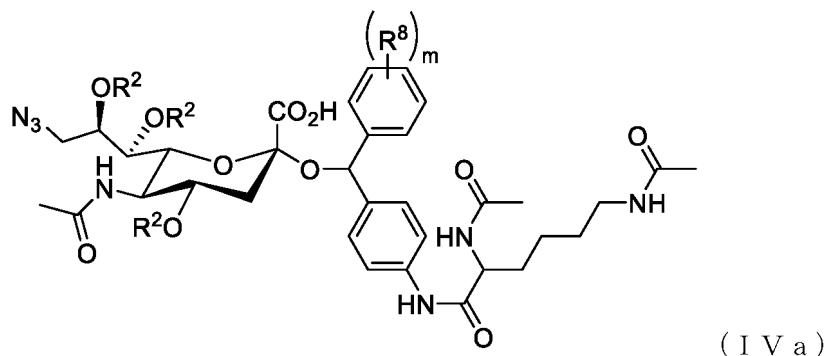
式 (I V) で表される、またはその薬学的に許容される塩である：

【化 6】

[式中、R⁸ は、H、ハロ、-C(O)₂H、(C₁~C₆)アルコキシ、ジ((C₁~C₆)アルキル)アミノ、-NO₂、-O(CH₂CH₂O)_qCH₃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) で表される、またはその薬学的に許容される塩である：

【化7】



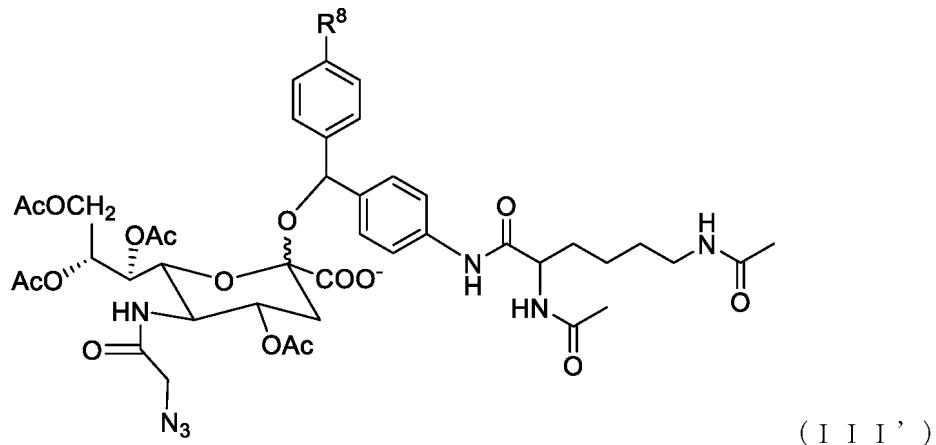
[式中、R⁸は、H、ハロ、-C(O)₂H、(C₁~C₆)アルコキシ、ジ((C₁~C₆)アルキル)アミノ、-NO₂、-O(CH₂CH₂O)_qCH₃を表し；mは、1~2、3、4、または5であり；qは、1または2である]

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：

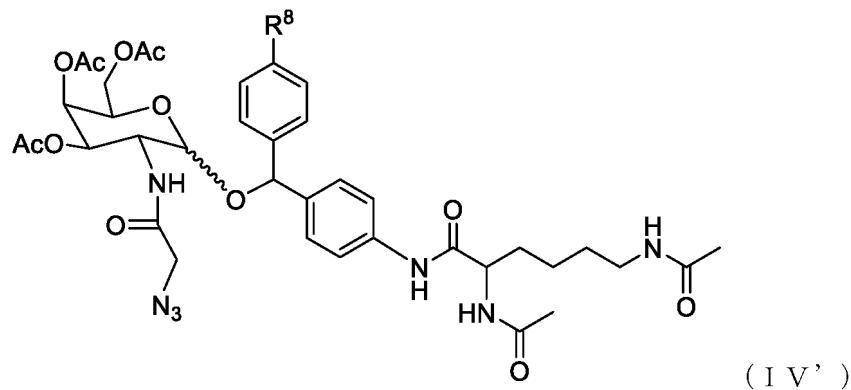
【化8】



[式中、R⁸は、H、ハロ、-C(O)₂H、(C₁~C₆)アルコキシ、ジ((C₁~C₆)アルキル)アミノ、-NO₂、-O(CH₂CH₂O)_qCH₃を表し；qは、1~5000である]、あるいは

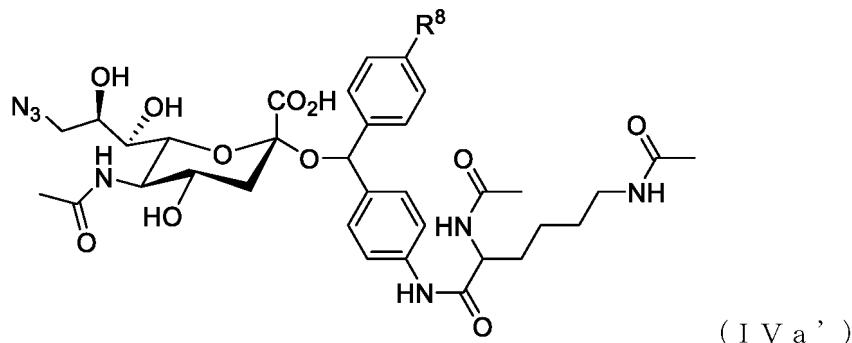
式(IV')で表される、またはその薬学的に許容される塩である：

【化9】



[式中、R⁸は、H、ハロ、-C(O)₂H、(C₁~C₆)アルコキシ、ジ((C₁~C₆)アルキル)アミノ、-NO₂、-O(CH₂CH₂O)_qCH₃を表し；qは、1または2である]、あるいは

式(IVa')で表される、またはその薬学的に許容される塩である：
【化10】



[式中、R⁸は、H、ハロ、-C(O)₂H、(C₁~C₆)アルコキシ、ジ((C₁~C₆)アルキル)アミノ、-NO₂、-O(CH₂CH₂O)_qCH₃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10】

R⁸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11】

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-ガラクトピラノシリ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。

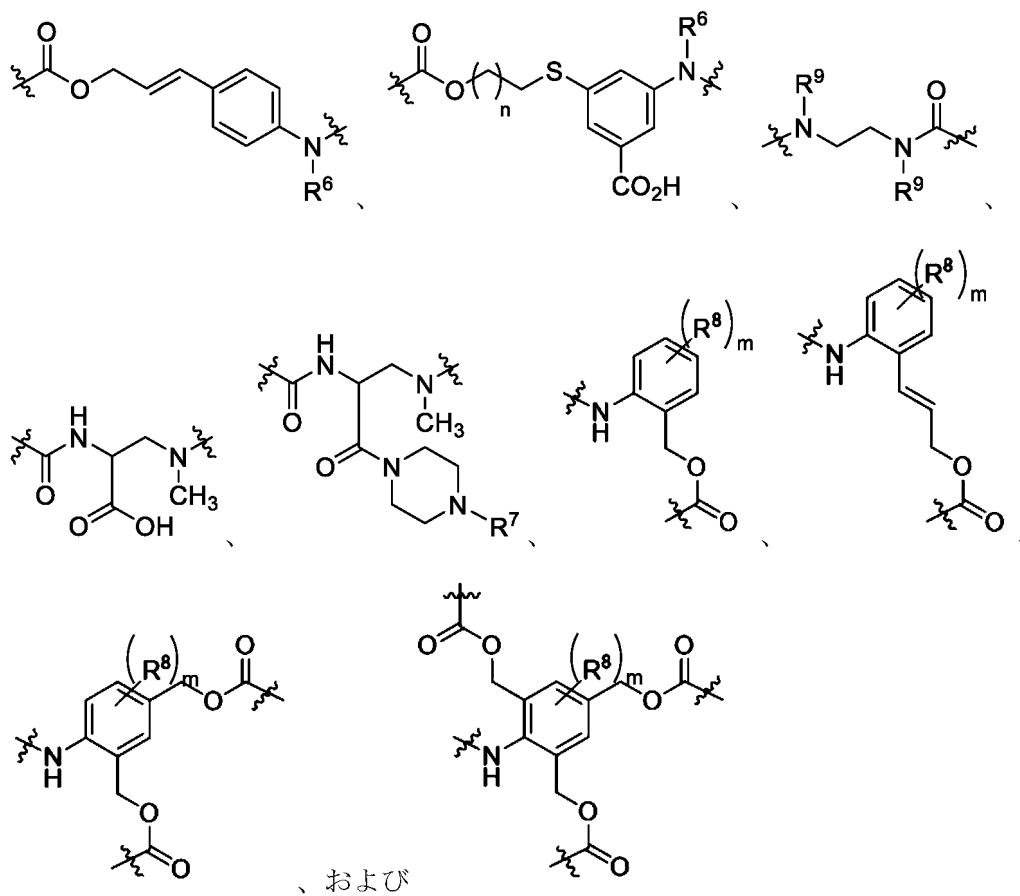
【請求項12】

前記1つ以上の糖部分が、ガラクトシリル、N-アセチルガラクトサミノ、マンノシリル、N-アセチルマンノサミノ、ノイラミン酸、グルコシリル、N-アセチルグルコサミノ、マルトシリル、およびフルクトシリル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】

前記自壊性リンカーが、

【化11】



からなる群から選択され、

式中、

R⁶ は、H、トリ((C₁ ~ C₆)アルキル)シリル、または-C(O)(C₁ ~ C₆)アルキルを表し、

R⁷ は、H、(C₁ ~ C₆)アルキル、またはヘテロシクロアルキルを表し、

R⁸ は、H、ハロ、-C(O)₂H、(C₁ ~ C₆)アルコキシ、ジ((C₁ ~ C₆)アルキル)アミノ、-NO₂、-O(CH₂CH₂O)_qCH₃を表し、

R⁹ は、Hまたは(C₁ ~ C₆)アルキルを表し、

m は、1、2、3、4、または5であり、

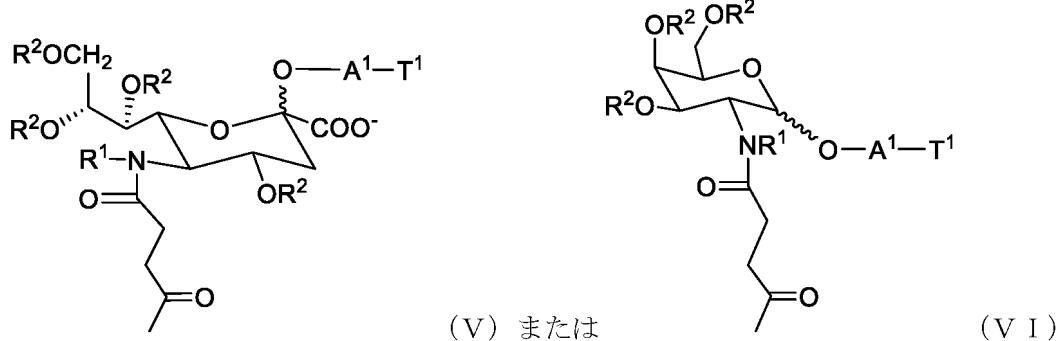
n は、1または2であり、

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12】



式中、

R¹ は、H またはトリ((C₁ ~ C₆)アルキル)シリルを表し、R² は、各出現について独立して、H、-C(O)((C₁ ~ C₆)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、A¹ は、前記自壊性リンカーを表し、T¹ は、前記トリガー応答性部分を表す。

【請求項15】

R¹ がHを表す、および/またはR² が、各出現について独立して、Hまたは-C(O)CH₃を表す、および/またはR² の全ての出現が同一である、請求項14に記載の化合物。

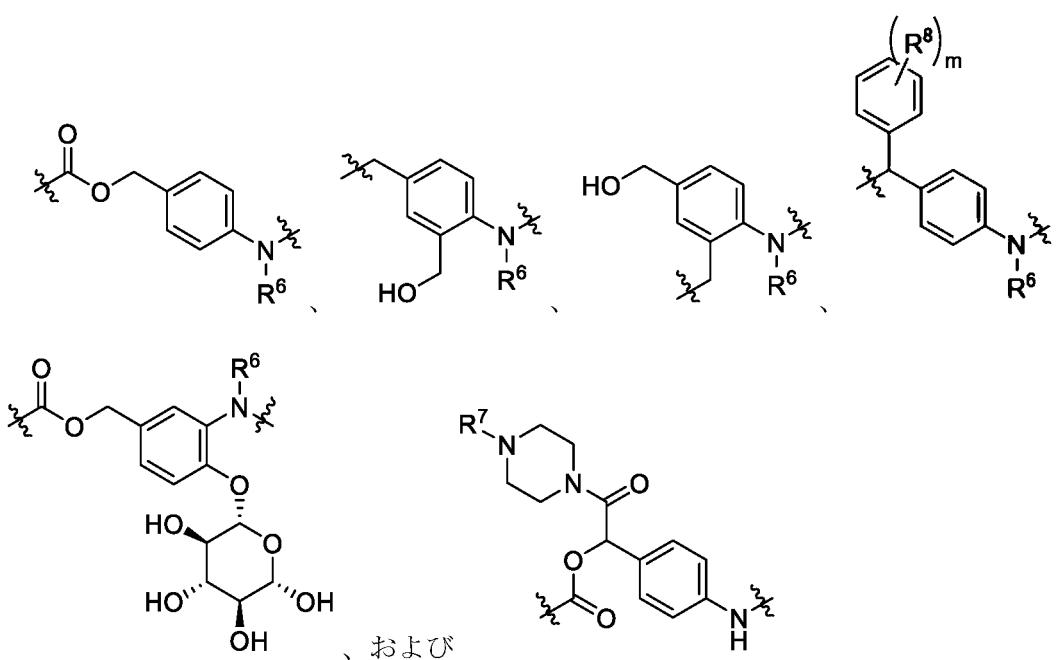
【請求項16】

A¹ が、-X¹-Y¹-基を表し、X¹ が、結合または-C(O)-を表し、Y¹ が、結合または任意に置換された-((C₁)アルキレン)-アリーレン-もしくは-((C₁)アルキレン)-ヘテロアリーレンを表す、請求項14または15に記載の化合物。

【請求項17】

前記自壊性リンカーが、

【化13】



からなる群から選択され、

式中、

R^6 は、H、トリ((C₁ ~ C₆)アルキル)シリル、または-C(=O)((C₁ ~ C₆)アルキル)を表し、

R⁷ は、H、(C₁~C₆)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、(C₁~C₆)アルコキシ、ジ((C₁~C₆)アルキル)アミノ、-NO₂、-O(CH₂CH₂O)_qCH₃を表し、

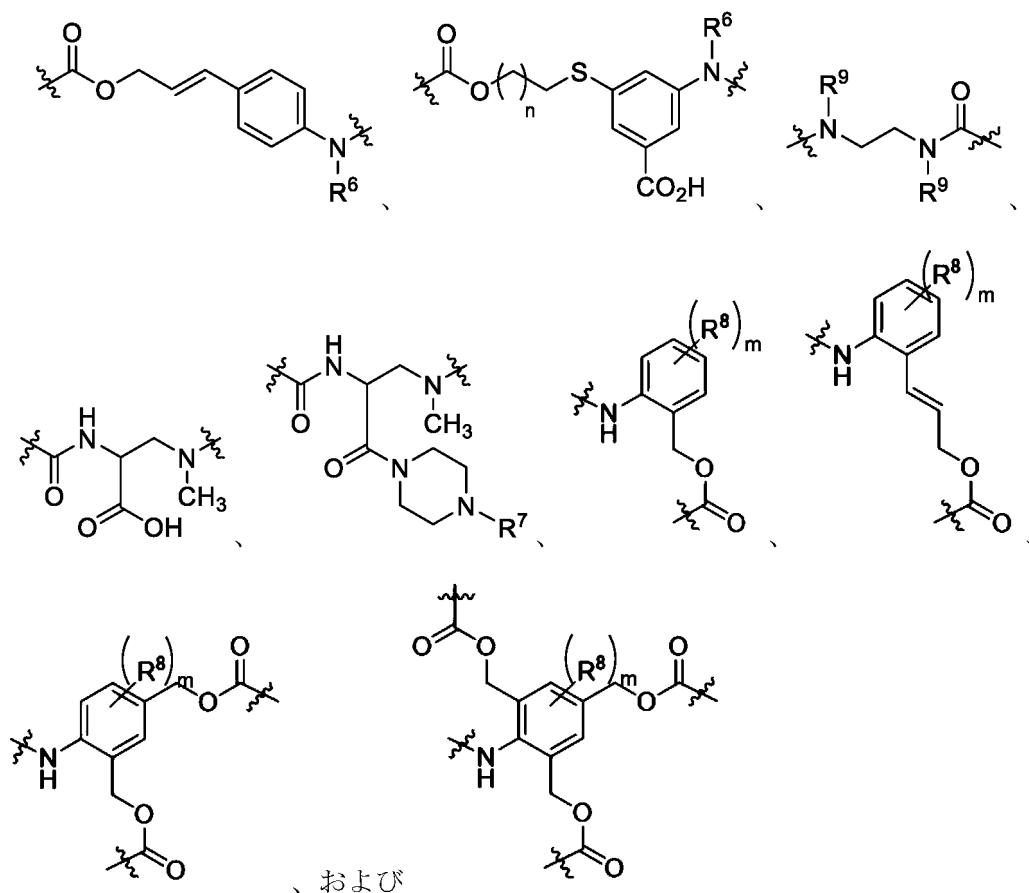
m は、1、2、3、4、または5であり、

q は、1 または 2 である、請求項 1 6 に記載の化合物。

【請求項 18】

前記自壊性リンカーが、

【化 1 4】



からなる群から選択され、

式中、

R^6 は、H、トリ((C₁ ~ C₆)アルキル)シリル、または-C(=O)((C₁ ~ C₆)アルキル)を表し、

R⁷ は、H、(C₁~C₆)アルキル、またはヘテロシクロアルキルを表し、

R^8 は、H、八口、-C(O)₂H、(C₁~C₆)アルコキシ、ジ((C₁~C₆)アルキル)アミノ、-NO₂、-O(CH₂CH₂O)_qCH₃を表し、

R⁹ は、H または (C₁ ~ C₆) アルキルを表し、

m は、1、2、3、4、または5であり、

りは、1または2であり、

q は、1 または 2 である、請求項 1-6 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塗であつて、

【化15】

K-Pol-Pep-A²-D (V I I)

式中、

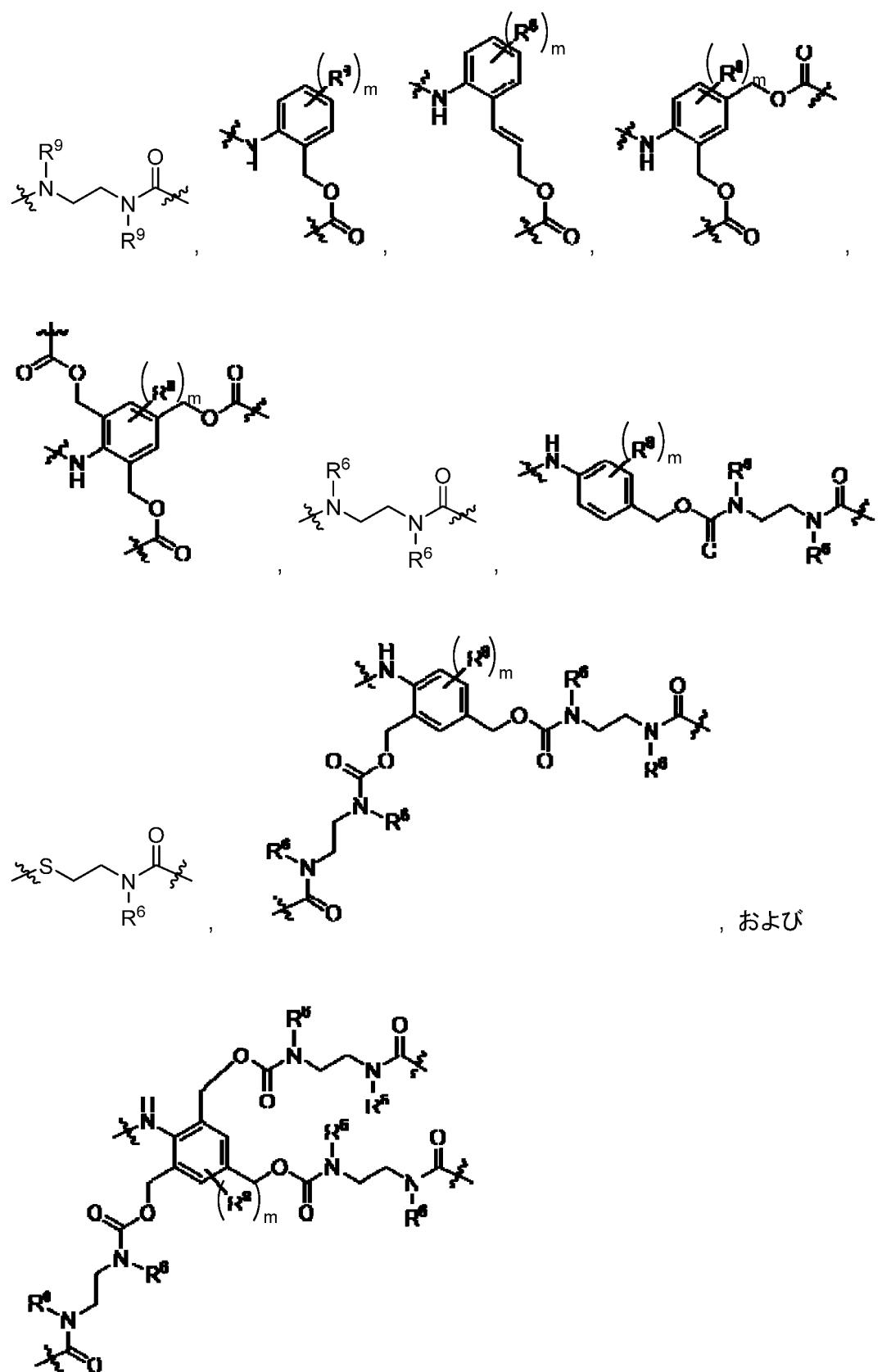
Kは、任意に置換されたシクロアルキニル、ヘテロシクロアルキニル、またはアルキニル部分を表し、

Polは、不在であるか、またはポリマー部分を表し、

Pepは、アミノ酸またはオリゴペプチド配列を表し、

A²は、結合であるか、または

【化16】



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 は、H、トリ((C₁ ~ C₆) アルキル)シリル、または -C(=O)((C₁ ~

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、

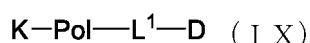
前記ポリマー部分は、 存在する場合、 ポリアルキレングリコールまたはポリアルキレンイミドであり、

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、

P_{ol} 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、

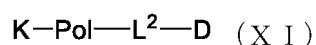
D は、 ファーマコフォアを表し、

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、

P_{ol} は、 不在であるか、 またはポリマー部分を表し、

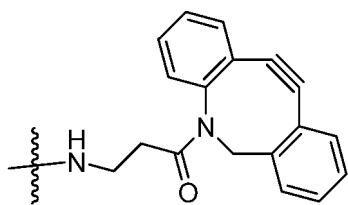
L^2 は、 不在であるか、 またはトリガー応答性部分を表し、

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

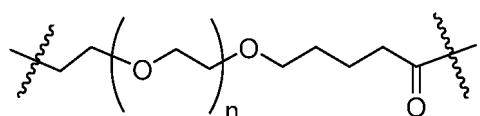
【化19】



であり、

任意選択で、 P_{01} は

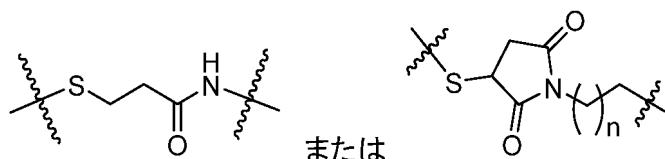
【化20】



であり、

(式中 n は 0 ~ 5000 である)任意選択で、 L^2 は

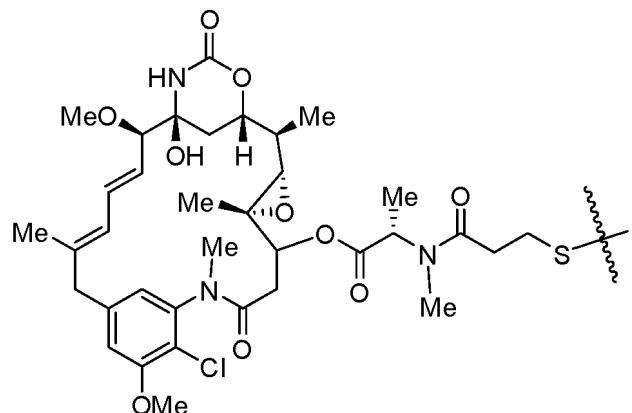
【化21】



であり、

[式中、 R^6 は、H、トリ((C₁ ~ C₆)アルキル)シリル、または -C(O)(C₁ ~ C₆)アルキル)であり； n は 1 または 2 である]任意選択で、 D は

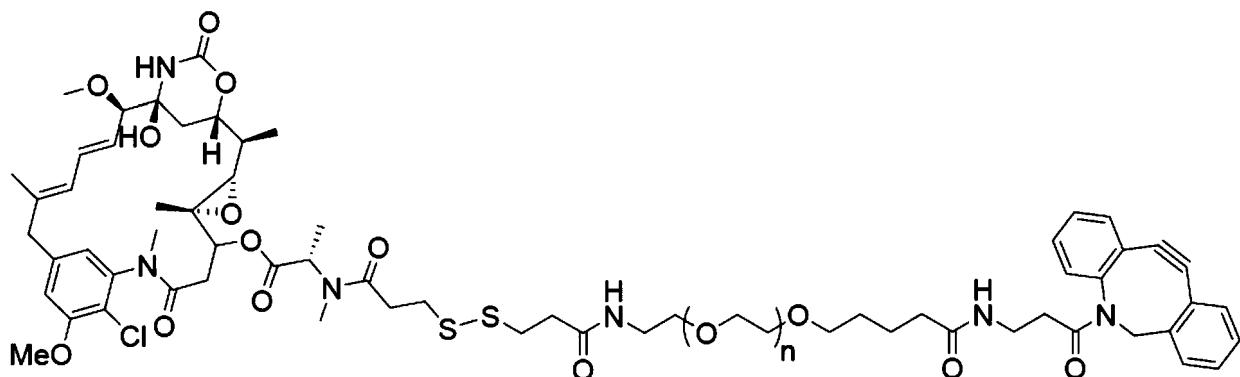
【化22】



であり、

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

【化23】



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22】

治療有効量の請求項1～21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 D B C O - パクリタキセルコンジュゲート、P T X - T E G - D B C O 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、R P - H P L C および E S I - M S によって確認した(図19)。P T X - T E G - D B C O は、静脈内注射用の D M S O - t w e e n 80 - P B S (5 - 10 - 85) 製剤に溶解することができる。予備的 M T D 試験(図19)は、P T X - T E G - D B C O の M T D が 200 m g / k g (124 m g / k g 当量 P T X) 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 M T D (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 1 6]

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(NO₂)、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 1 7]

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 1 8]

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。

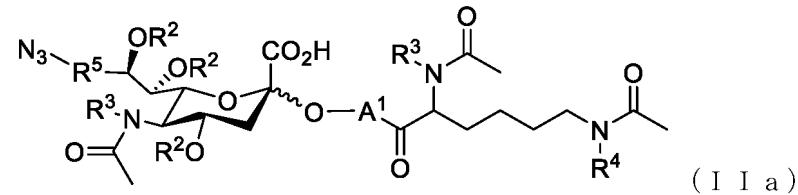
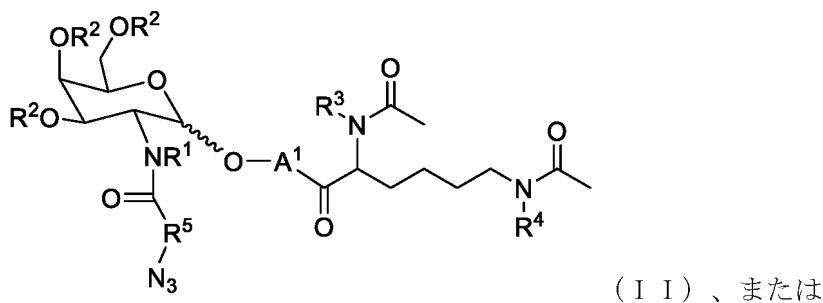
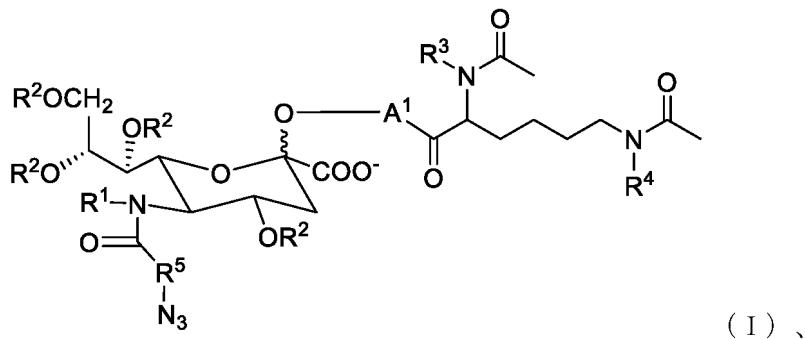
[実施態様 19]

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(ⅠⅠa)で表され、

【化 6 2】



式中、

R^1 が、H またはトリ((C₁ ~ C₆) 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)(C₁~C₆)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、
R³ および R⁴ が、各出現について独立して、H、トリ((C₁~C₆)アルキル)シリル、または-C(O)((C₁~C₆)アルキル)を表し、
R⁵ が、(C₁~C₆)アルキレンを表し、
A¹ 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21】

R¹ が、Hを表す、実施態様20に記載の化合物。

【実施態様22】

R² が、各出現について独立して、Hまたは-C(O)CH₃を表す、実施態様20または21に記載の化合物。

【実施態様23】

R² の全ての出現が、同一である、実施態様22に記載の化合物。

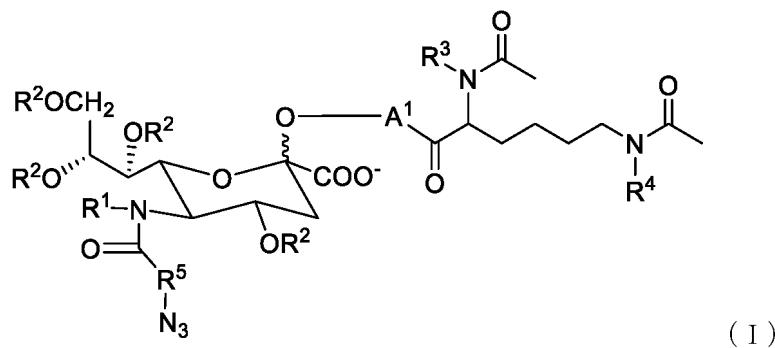
【実施態様24】

R³ および R⁴ が、Hである、実施態様20~23のいずれかに記載の化合物。

【実施態様25】

式(I)で表される、実施態様20~24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。

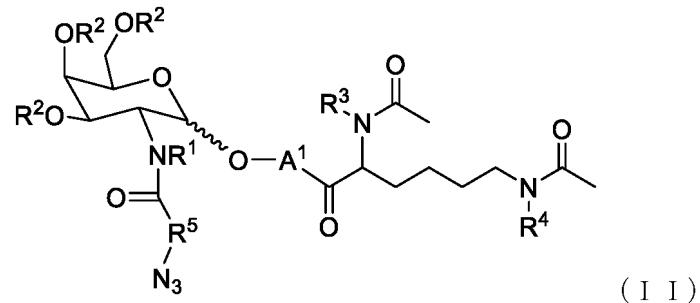
【化63】



【実施態様26】

式(II)で表される、実施態様20~24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。

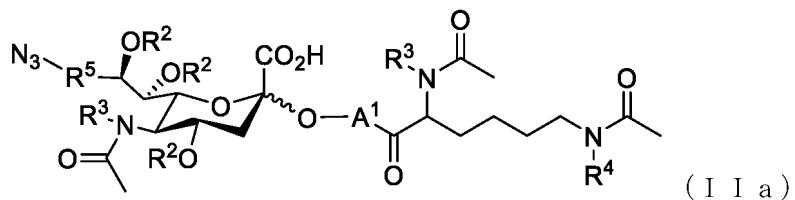
【化64】



【実施態様27】

式(IIa)で表される、実施態様20~24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65】



[実施態様28]

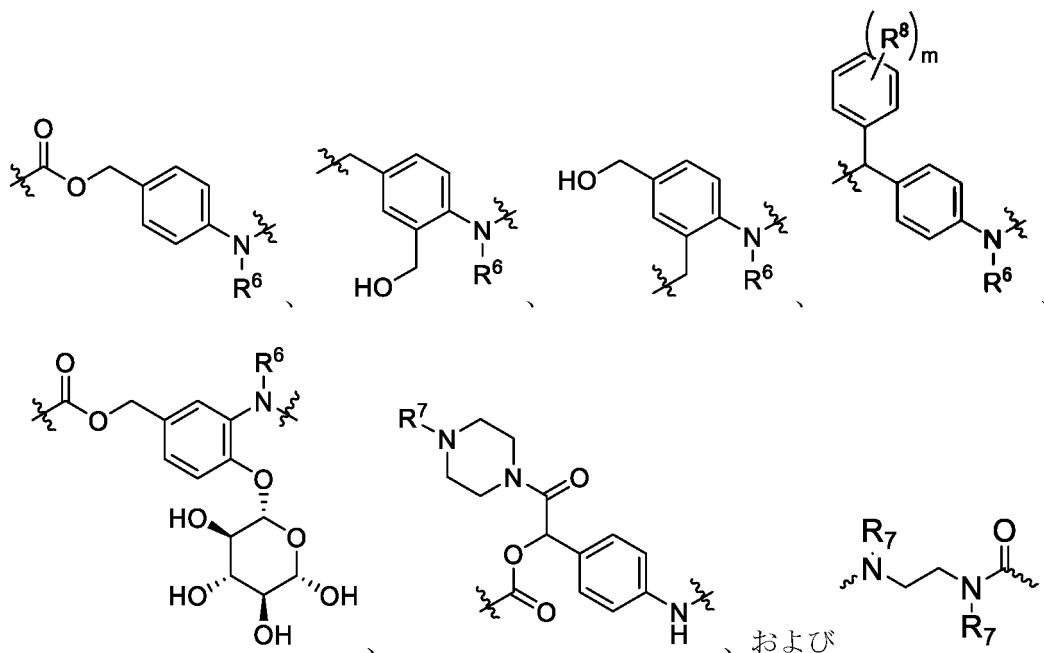
A¹が、-X¹-Y¹-基を表し、
X¹が、結合または-C(=O)-を表し、
Y¹が、結合または任意に置換された-((C₁)アルキレン)-アリーレン-もしくは-((C₁)アルキレン)-ヘテロアリーレン-を表す、実施態様20~27のいずれかに記載の化合物。

[実施態様29]

Y¹が、任意に置換された-((C₁)アルキレン)-アリーレン-を表す、実施態様28に記載の化合物。

[実施態様30]

前記自壊性リンカーが、
【化66】



からなる群から選択され、

式中、

R⁶が、H、トリ((C₁~C₆)アルキル)シリル、または-C(=O)((C₁~C₆)アルキル)を表し、

R⁷が、H、(C₁~C₆)アルキル、またはヘテロシクロアルキルを表し、

R⁸が、H、ハロ、-C(=O)₂H、(C₁~C₆)アルコキシ、ジ((C₁~C₆)アルキル)アミノ、-NO₂、-O(CH₂CH₂O)_qCH₃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29に記載の化合物。

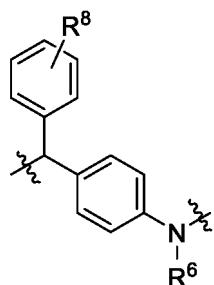
[実施態様31]

R⁸が、Hである、実施態様30に記載の化合物。

[実施態様32]

前記自壊性リンカーが、

【化67】

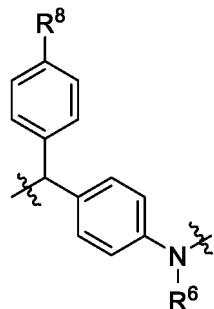


である、実施態様30に記載の化合物。

[実施態様33]

前記自壊性リンカーが、

【化68】



である、実施態様32に記載の化合物。

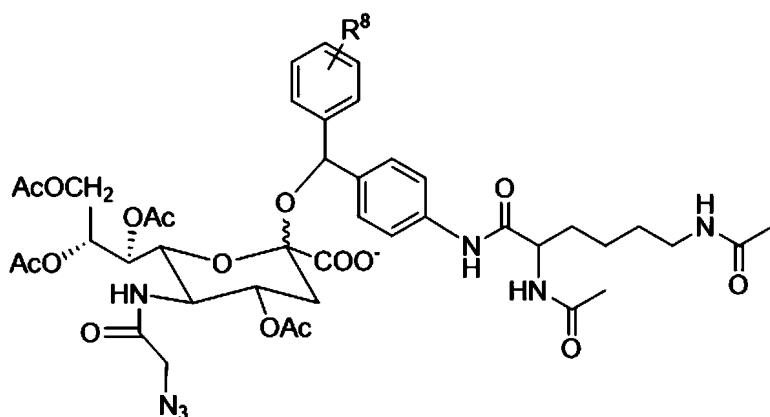
[実施態様34]

R⁸が、Hである、実施態様32に記載の化合物。

[実施態様35]

式(III)で表され、

【化69】



(III)

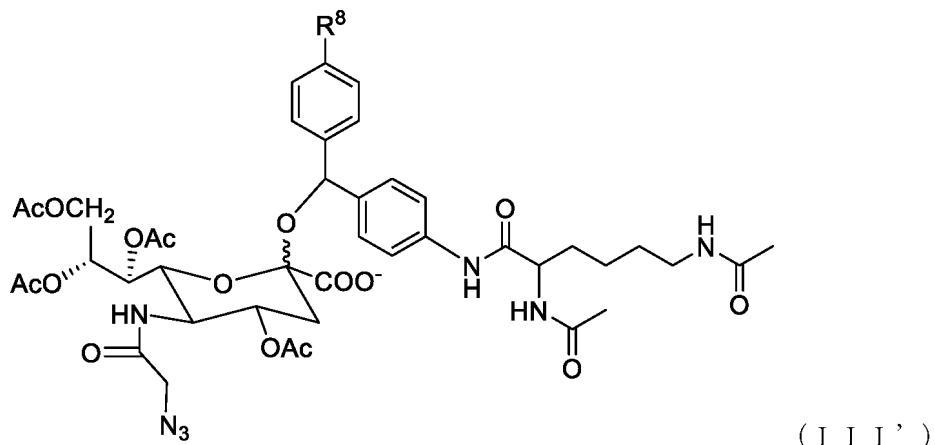
式中、R⁸が、H、ハロ、-C(O)₂H、(C₁~C₆)アルコキシ、ジ((C₁~C₆)アルキル)アミノ、-NO₂、-O(CH₂CH₂O)_qCH₃を表し、mが、1、2、3、4、または5であり、

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(III')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。

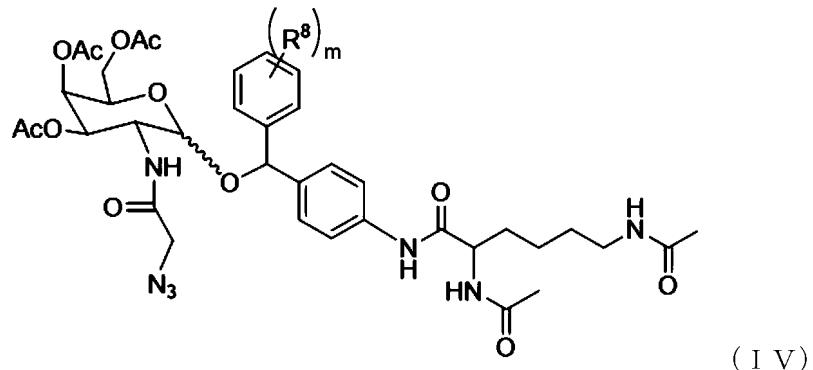
【化70】



[実施態様37]

式(IV)で表され、

【化71】

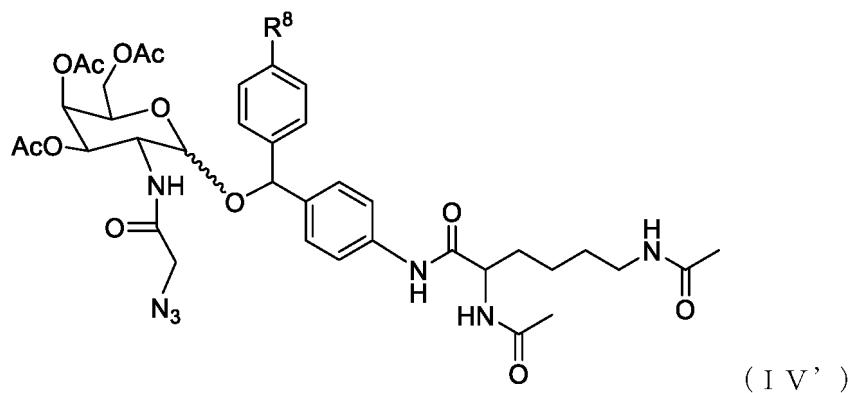


式中、R⁸が、H、ハロ、-C(O)₂H、(C₁~C₆)アルコキシ、ジ((C₁~C₆)アルキル)アミノ、-NO₂、-O(CH₂CH₂O)_qCH₃を表し、
 mが、1、2、3、4、または5であり、
 qが、1または2である、実施態様1に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

[実施態様38]

式(IV')で表される、実施態様37に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

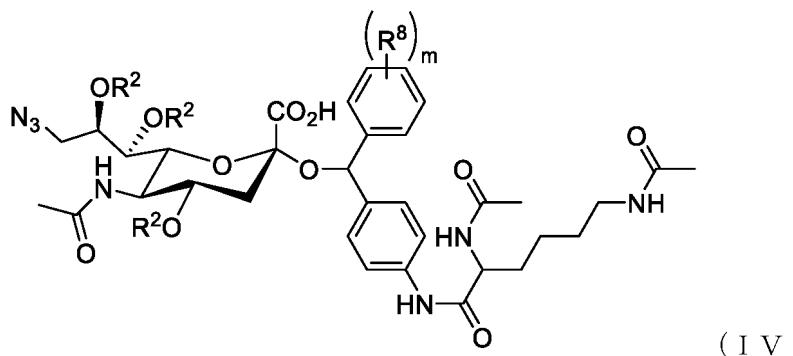
【化72】



[実施態様39]

式(IVa)で表され、

【化73】

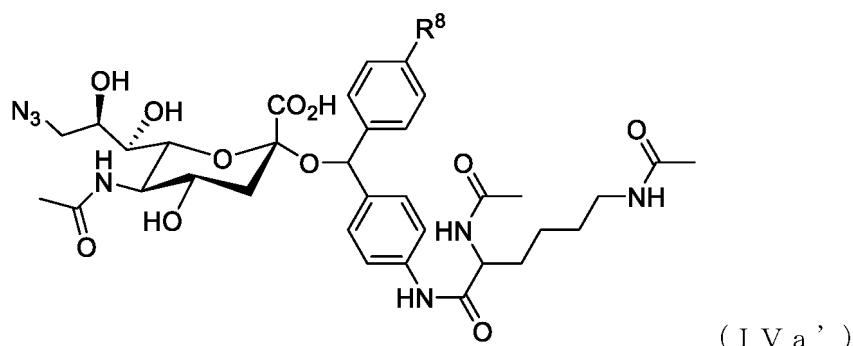


式中、R⁸が、H、ハロ、-C(O)₂H、(C₁~C₆)アルコキシ、ジ((C₁~C₆)アルキル)アミノ、-NO₂、-O(CH₂CH₂O)_qCH₃を表し、mが、1、2、3、4、または5であり、qが、1または2である、実施態様1に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【実施態様40】

式(IV a')で表される、実施態様39に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【化74】



【実施態様41】

R⁸が、Hである、実施態様35~40のいずれかに記載の化合物。

【実施態様42】

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-ガラクトピラノシリル部分のアノマー炭素に共有結合するか、または(ii)A¹が、前記糖リンカーをさらに含む、実施態様1~29のいずれかに記載の化合物。

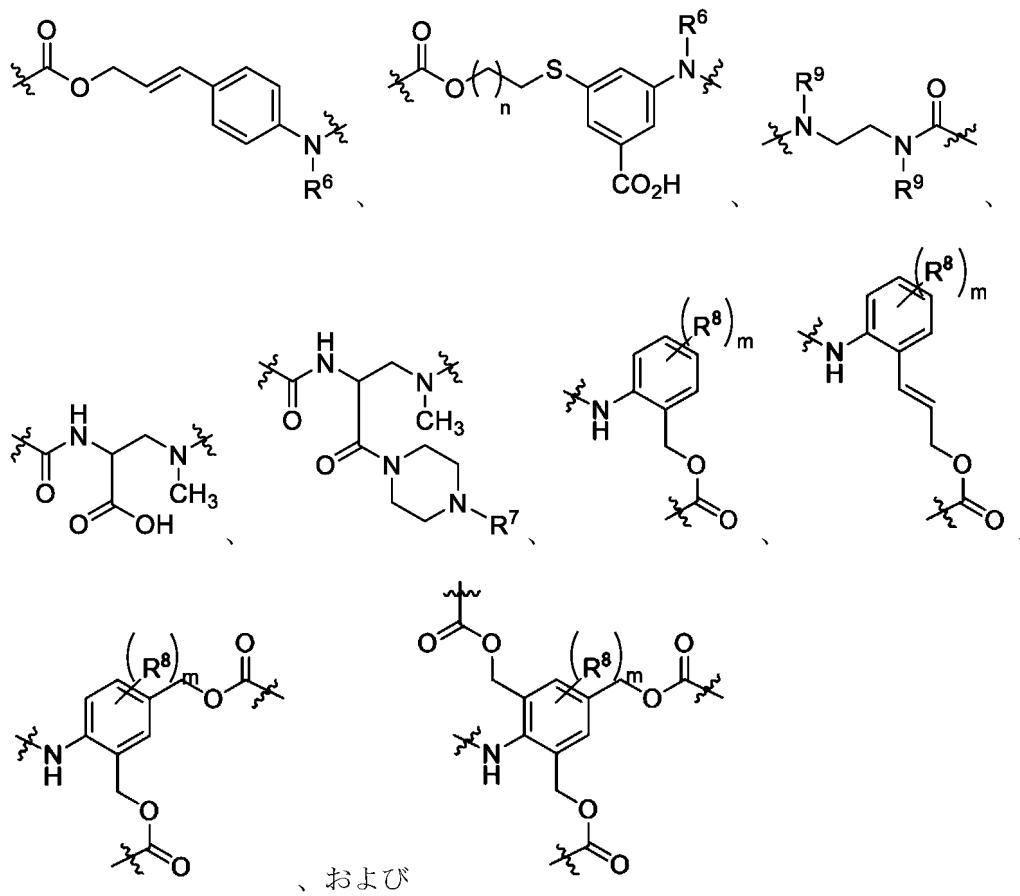
【実施態様43】

前記1つ以上の糖部分が、ガラクトシリル、N-アセチルガラクトサミノ、マンノシリル、N-アセチルマンノサミノ、ノイラミン酸、グルコシリル、N-アセチルグルコサミノ、マルトシリル、およびフルクトシリルからなる群から選択される、実施態様42に記載の化合物。

【実施態様44】

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((C₁ ~ C₆) アルキル)シリル、または -C(0)((C₁ ~ C₆) アルキル)を表し、

R⁷が、H、(C₁~C₆)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、(C₁~C₆)アルコキシ、ジ((C₁~C₆)アルキル)アミノ、-NO₂、-O(CH₂CH₂O)_qCH₃を表し、

R⁹ が、H または (C₁ ~ C₆) アルキルを表し、

m が、 1、 2、 3、 4、 または 5 であり、

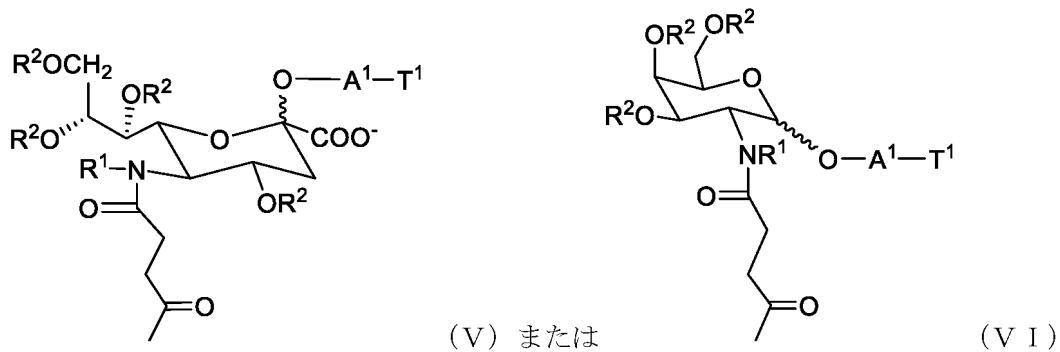
n が、1 または 2 であり、

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、

R¹ が、H またはトリ((C₁ ~ C₆)アルキル)シリルを表し、

R² が、各出現について独立して、H、-C(O)((C₁ ~ C₆)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、

A¹ が、前記自壊性リンカーを表し、

T¹ 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]

R¹ が、H を表す、実施態様 45 に記載の化合物。

[実施態様 47]

R² が、各出現について独立して、H または -C(O)CH₃ を表す、実施態様 45 または 46 に記載の化合物。

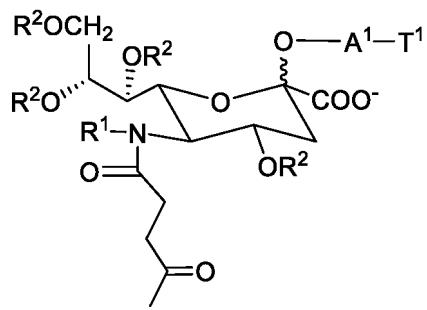
[実施態様 48]

R² 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】

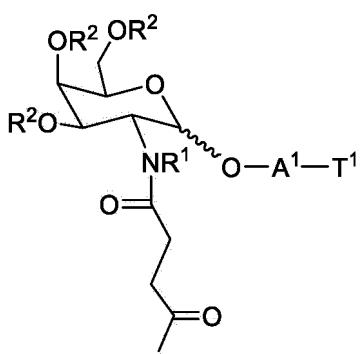


(V)

[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】



(VI)

[実施態様 51]

A¹ が、-X¹-Y¹- 基を表し、

X¹ が、結合または -C(O)- を表し、

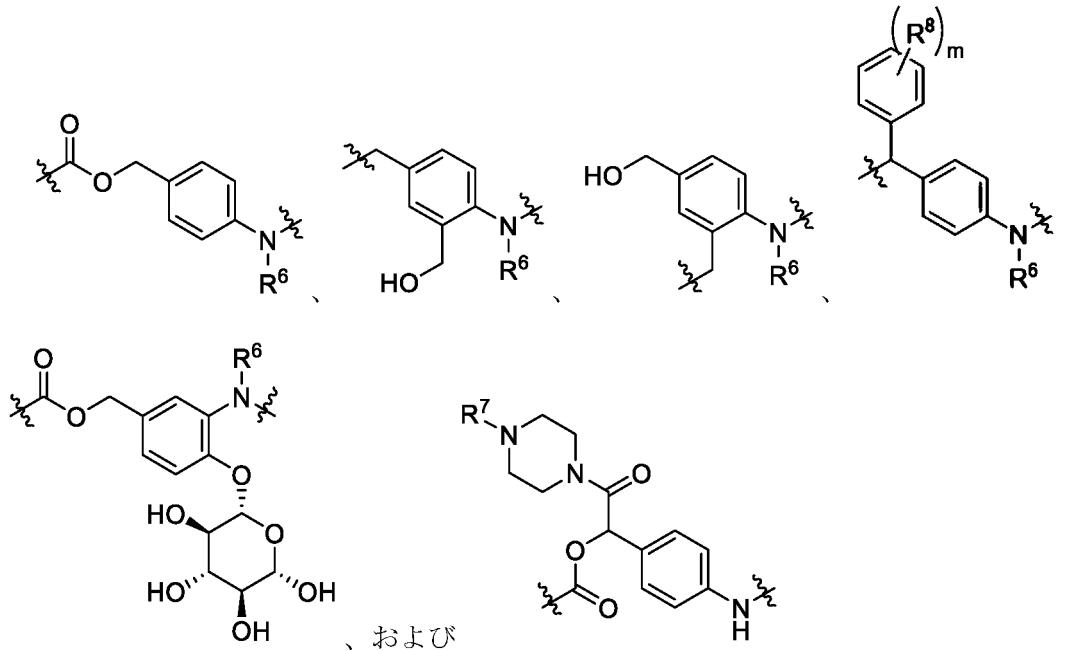
Y¹ が、結合または任意に置換された -((C₁)アルキレン)-アリーレン- もしくは -((C₁)アルキレン)-ヘテロアリーレンを表す、実施態様 45 ~ 50 のいずれかに記載の化合物。

[実施態様 52]

γ^1 が、任意に置換された - ((C₁) 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、

R⁶ が、H、トリ((C₁ ~ C₆) アルキル) シリル、または - C(O) ((C₁ ~ C₆) アルキル) を表し、

R⁷ が、H、(C₁ ~ C₆) アルキル、またはヘテロシクロアルキルを表し、

R⁸ が、H、ハロ、- C(O)₂ H、(C₁ ~ C₆) アルコキシ、ジ((C₁ ~ C₆) アルキル) アミノ、- NO₂、- O(CH₂ CH₂ O)_q CH₃ 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]

A¹ 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。

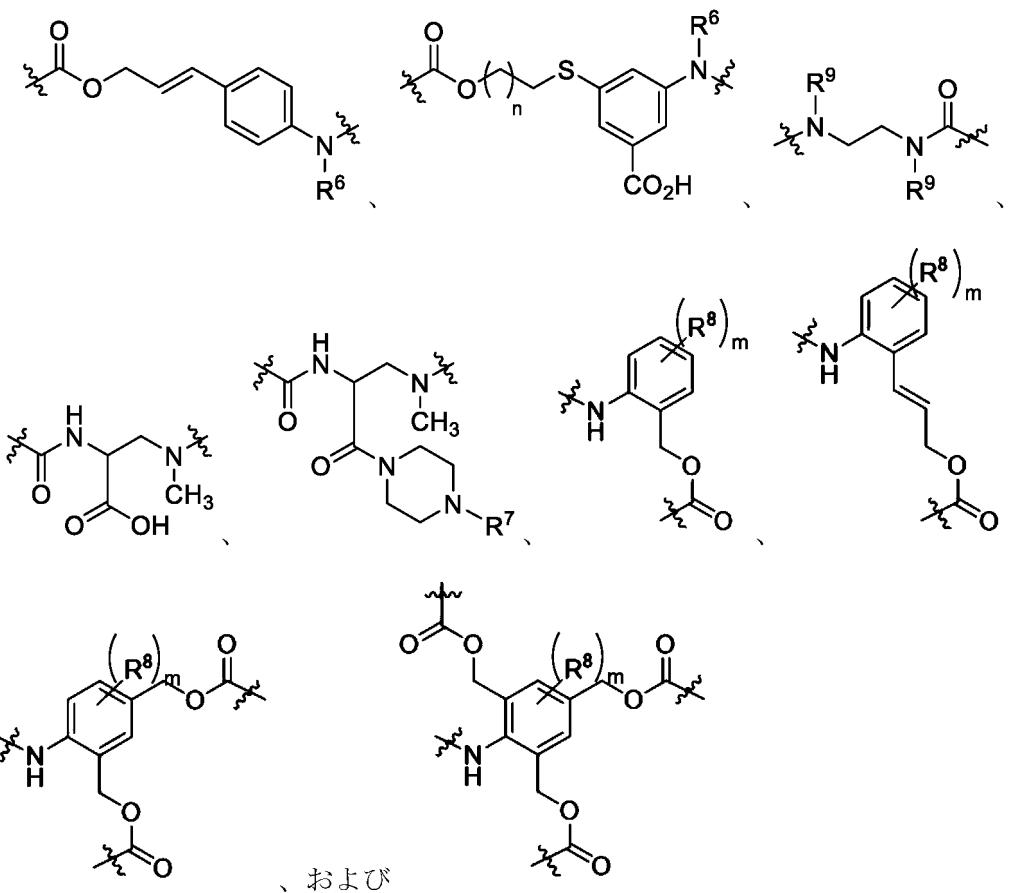
[実施態様 5 5]

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((C₁ ~ C₆) アルキル)シリル、または -C(=O)((C₁ ~ C₆) アルキル)を表し、

R^7 が、H、(C₁~C₆)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、(C₁~C₆)アルコキシ、ジ((C₁~C₆)アルキル)アミノ、-NO₂、-O(CH₂CH₂O)_qCH₃を表し、

R⁹ が、H または (C₁ ~ C₆) 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 5 7]

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つて、

【化 8 1】

K-Pol-Pep-A²-D (V I I)

式中、

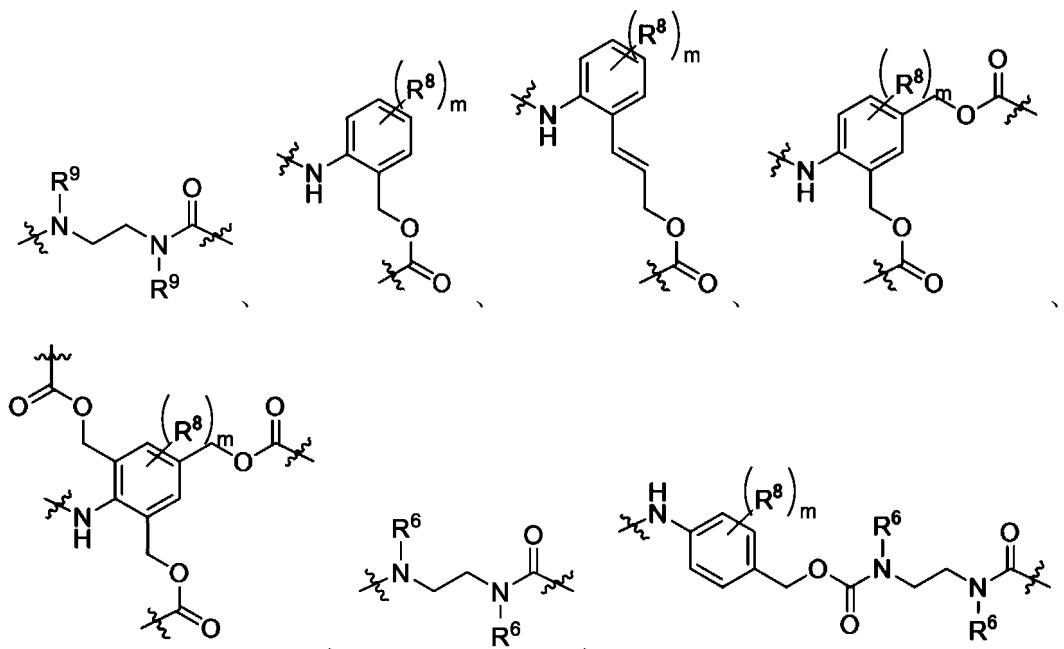
K が、任意に置換されたシクロアルキニル、ヘテロシクロアルキニル、またはアルキニル部分を表し、

P o l が、不在であるか、またはポリマー部分を表し、

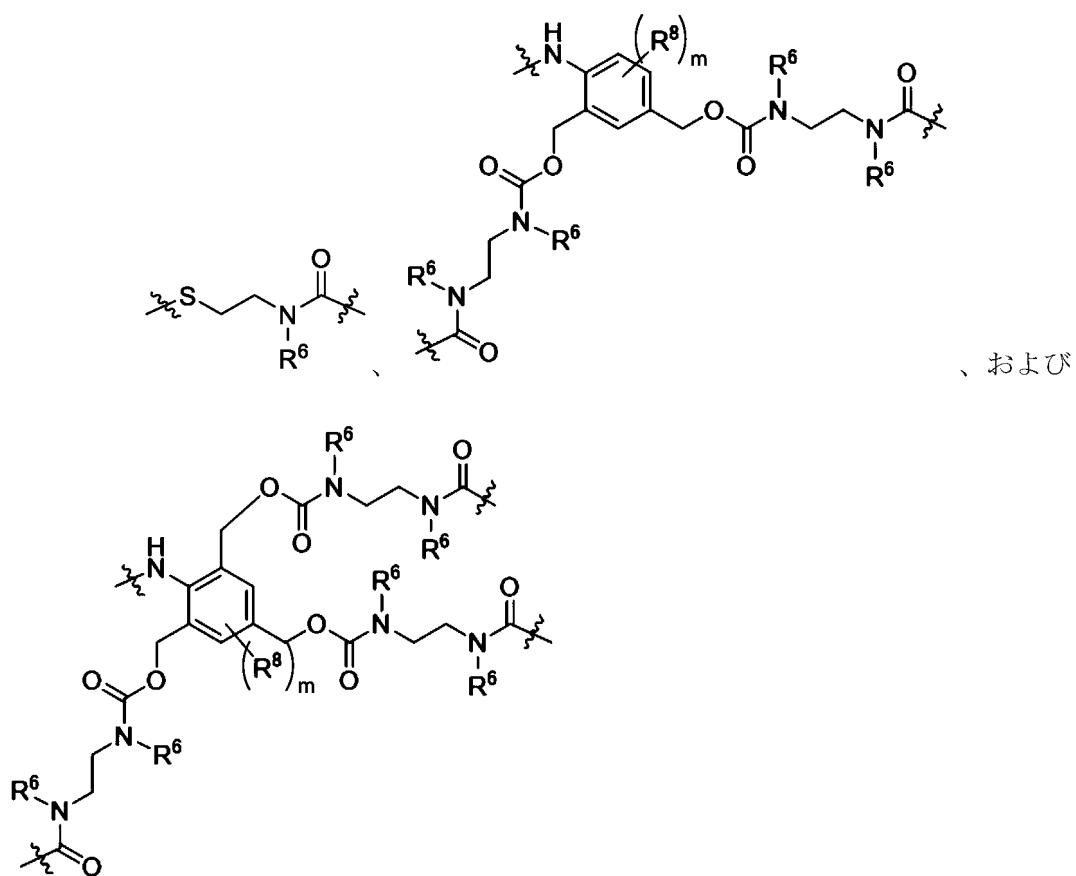
ペプチドが、アミノ酸またはオリゴペプチド配列を表し、

A²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、

R⁶ が、 H、 トリ((C₁ ~ C₆) アルキル)シリル、 または -C(O)((C₁ ~ C₆) アルキル)を表し、

R⁷ が、 H、 (C₁ ~ C₆) アルキル、 またはヘテロシクロアルキルを表し、

R⁸ が、 H、 ハロ、 -C(O)₂H、 (C₁ ~ C₆) アルコキシ、 ジ((C₁ ~ C₆)

）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、 q が、

が、ファーマコフォアを表し、

前記ボリューム部分が 存在する場

前記示すく一部が、存在する場合、示すアルキレンブロールまたは示す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が、(1)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。

[実施態様 5 8]

前記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、それによって前記ファーマコフォアを放送出する、実施態様 57 に記載の化合物。

[実施態様 5 9]

前記酵素が、カテプシン酵素である、実施態様57または58に記載の化合物。

[実施態様 60]

前記カテプシン酵素が、カテプシンBである、実施態様59に記載の化合物。

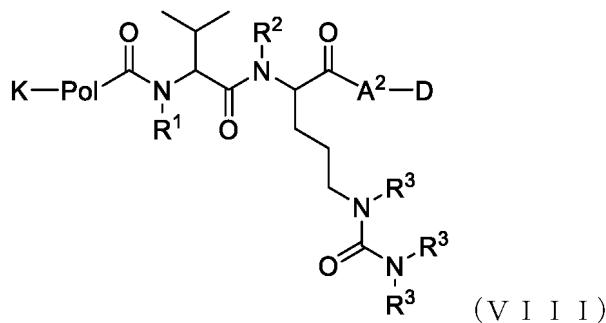
[実施態様 6 1]

P e p が、任意に置換された **V a l - C i t** を表す、実施態様 57~60 のいずれかに記載の化合物。

〔実施様態62〕

式 (VII) で表され、

【化 8 3】



式中、

R¹、R²、およびR³が、各出現について独立して、H、トリ((C₁~C₆)アルキル)シリル、または-C(O)(C₁~C₆)アルキル)を表す、実施態様57に記載の化合物。

[実施態様 6 3]

R¹、R²、およびR³が、Hである、実施態様62に記載の化合物。

[実施態様 6 4]

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 57 ~ 63 のいずれかに記載の化合物。

[実施態様 65]

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 6.4 に記載の化合物。

〔実施様態66〕

【実施例】
P o 1 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
熊様 5 7 ~ 6 5 のいずれかに記載の化合物。

寒施態樣 671

以上が、10~30個のポリエチレングリコニルまたはポリブロピレングリコニルの

繰り返し単位を表す、実施態様 6 5 に記載の化合物。

[実施態様 6 8]

P o 1 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 6 7 に記載の化合物。

[実施態様 6 9]

P o 1 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 6 8 に記載の化合物。

[実施態様 7 0]

A² 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 5 7 ~ 6 9 のいずれかに記載の化合物。

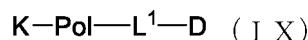
[実施態様 7 1]

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 7 0 に記載の化合物。

[実施態様 7 2]

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 8 4】



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、

P o 1 が、不在であるか、またはポリマー部分を表し、

L¹ 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。

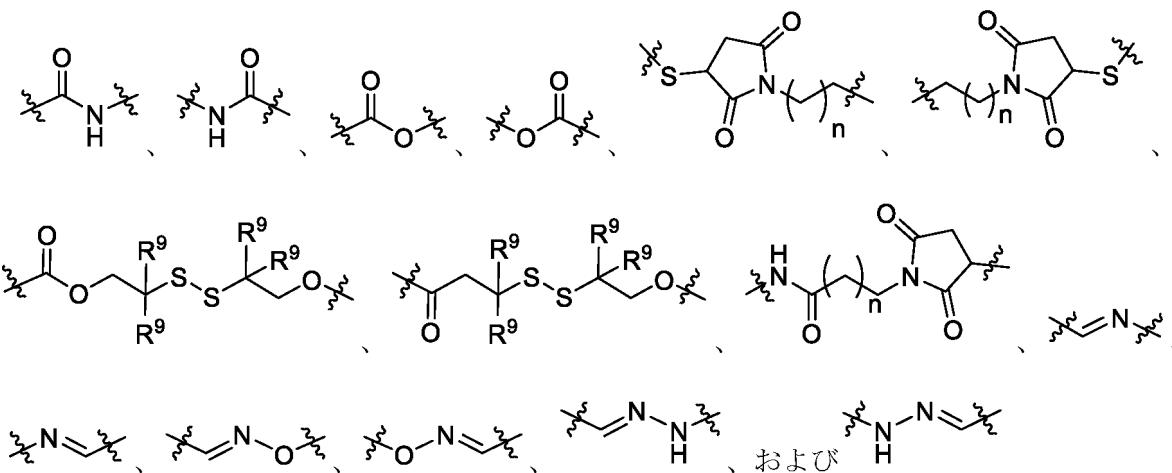
[実施態様 7 3]

L¹ 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 7 2 に記載の化合物。

[実施態様 7 4]

L¹ が、

【化 8 5】



からなる群から選択される部分を含むリンカーを表し、

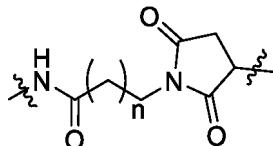
式中、

R^9 が、H または (C₁ ~ C₆) アルキルを表し、
n が、1 または 2 である、実施態様 7 2 に記載の化合物。

[実施態様 7 5]

前記リンカーが、

【化 8 6】



である、実施態様 7 2 ~ 7 4 のいずれかに記載の化合物。

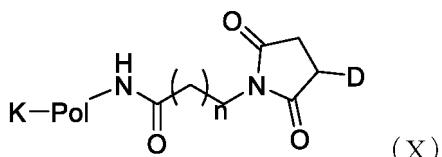
[実施態様 7 6]

n が、1 である、実施態様 7 5 に記載の化合物。

[実施態様 7 7]

式 (X) で表され、

【化 8 7】



式中、

n が、1 または 2 である、実施態様 7 2 ~ 7 5 のいずれかに記載の化合物。

[実施態様 7 8]

式 (X I) 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 8】

K-Pol—L²—D (X I)

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、

P o l が、不在であるか、またはポリマー部分を表し、

L² 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 7 9]

前記トリガーが、細胞過酸化物である、実施態様 7 8 に記載の化合物。

[実施態様 8 0]

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 7 8 または 7 9 に記載の化合物。

[実施態様 8 1]

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 8 0 に記載の化合物。

[実施態様 8 2]

前記トリガーが、低酸素である、実施態様 7 8 に記載の化合物。

[実施態様 8 3]

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78または82に記載の化合物。

[実施態様84]

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83に記載の化合物。

[実施態様85]

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78に記載の化合物。

[実施態様86]

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78または85に記載の化合物。

[実施態様87]

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86に記載の化合物。

[実施態様88]

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78に記載の化合物。

[実施態様89]

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78または88に記載の化合物。

[実施態様90]

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89に記載の化合物。

[実施態様91]

前記トリガーが、カテプシン酵素である、実施態様78に記載の化合物。

[実施態様92]

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91に記載の化合物。

[実施態様93]

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(NO₂)、Phe-Arg(Ts)、またはLys-Gly-Arg-Argを含む、実施態様92に記載の化合物。

[実施態様94]

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92に記載の化合物。

[実施態様95]

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92～94のいずれかに記載の化合物。

[実施態様96]

前記カテプシン酵素が、カテプシンLである、実施態様91～95のいずれかに記載の化合物。

[実施態様97]

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72～96のいずれかに記載の化合物。

[実施態様98]

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]

Po1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]

Po1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]

Po1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]

Po1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（NSAID）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、ビカルタミド、ブレオマイシン、ボルテゾミブ、ブセレリン、ブスルファン、カンポテシン、カンプトシン、カペシタビン、カルボプラチニン、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、シスプラチニン、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、エピルビシン、エポキソミシン、エストラジオール、エストラムスチン、エトポシド、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、メルファン、メルカプトブリン、メルタンシン、メスナ、メトホルミン、メトレキサート、メチルブレドニゾロン、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、オキサリプラチニン、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、ブリカマイシン、ポマリドミド、ポルフィマー、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、テニポシド、テストステロン、サリドマイド、チオグアニン、チオテバ、二塩化チタノセン、トポテカン、トラスツズマブ、トレチノイン、ビンプラスチン、ビンクリスチン、ビンデシン、ビノレルビン、SN-38、MG-132、PSI、CEP-18770、MLN-2238、MLN-9708、NC-005、YU-101、LU-005、YU-102、NC-001、LU-001、NC-022、PR-957(LMP7)、CPSI(5)、10 LMP2-s

p - e k 、 B O D I P Y - N C - 0 0 1 、 アジド - N C - 0 0 2 、 O N X - 0 9 1 2 、 P S - 5 1 9 、 1 2 5 I - N I P - L 3 V S 、 N C - 0 0 5 - V S 、 M V 1 5 1 、 またはそれらの誘導体である、実施態様 1 0 4 に記載の化合物。

[実施態様 106]

前記抗癌治療剤が、ドキソルビシンである、実施態様 105 に記載の化合物。

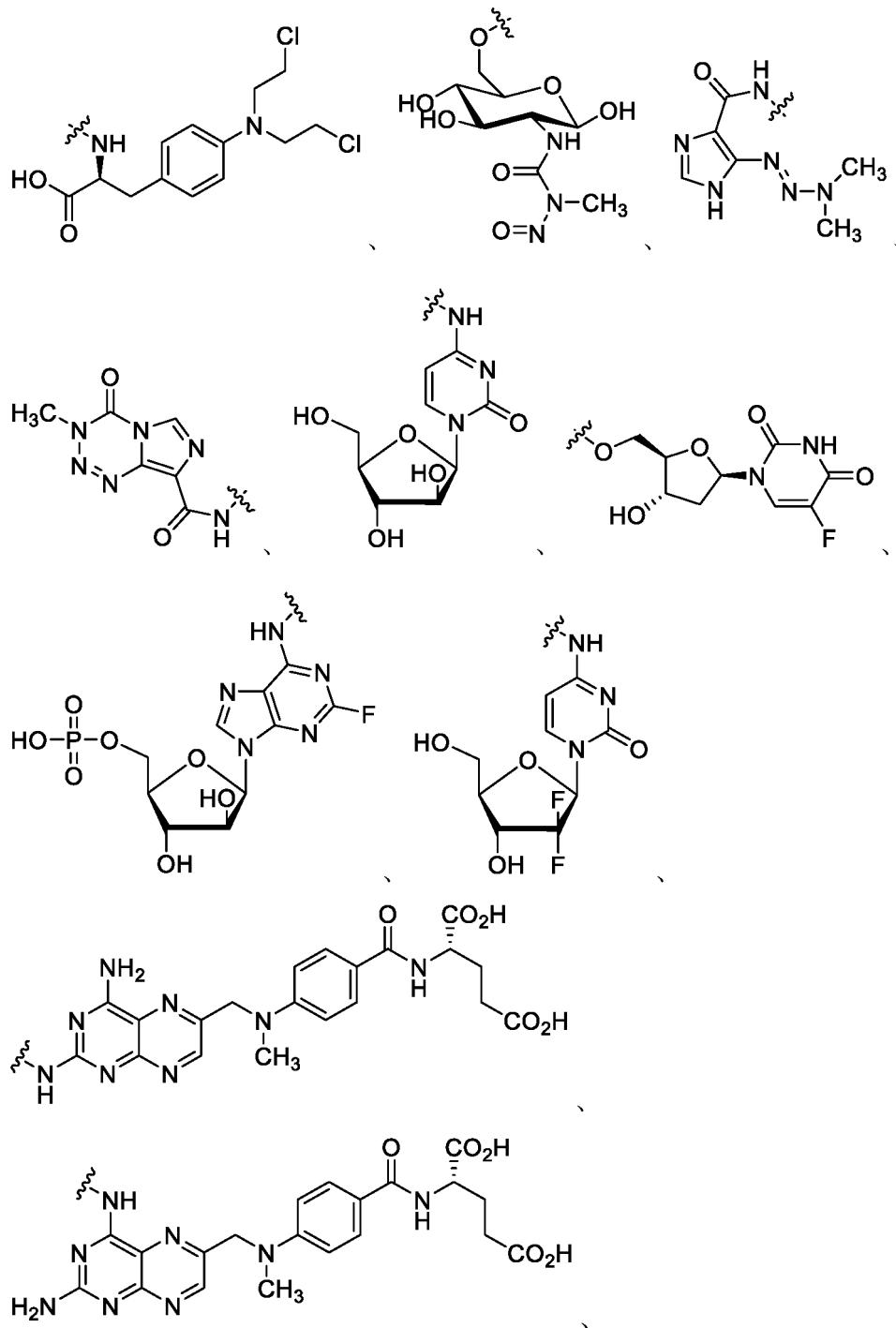
[実施態様 107]

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。

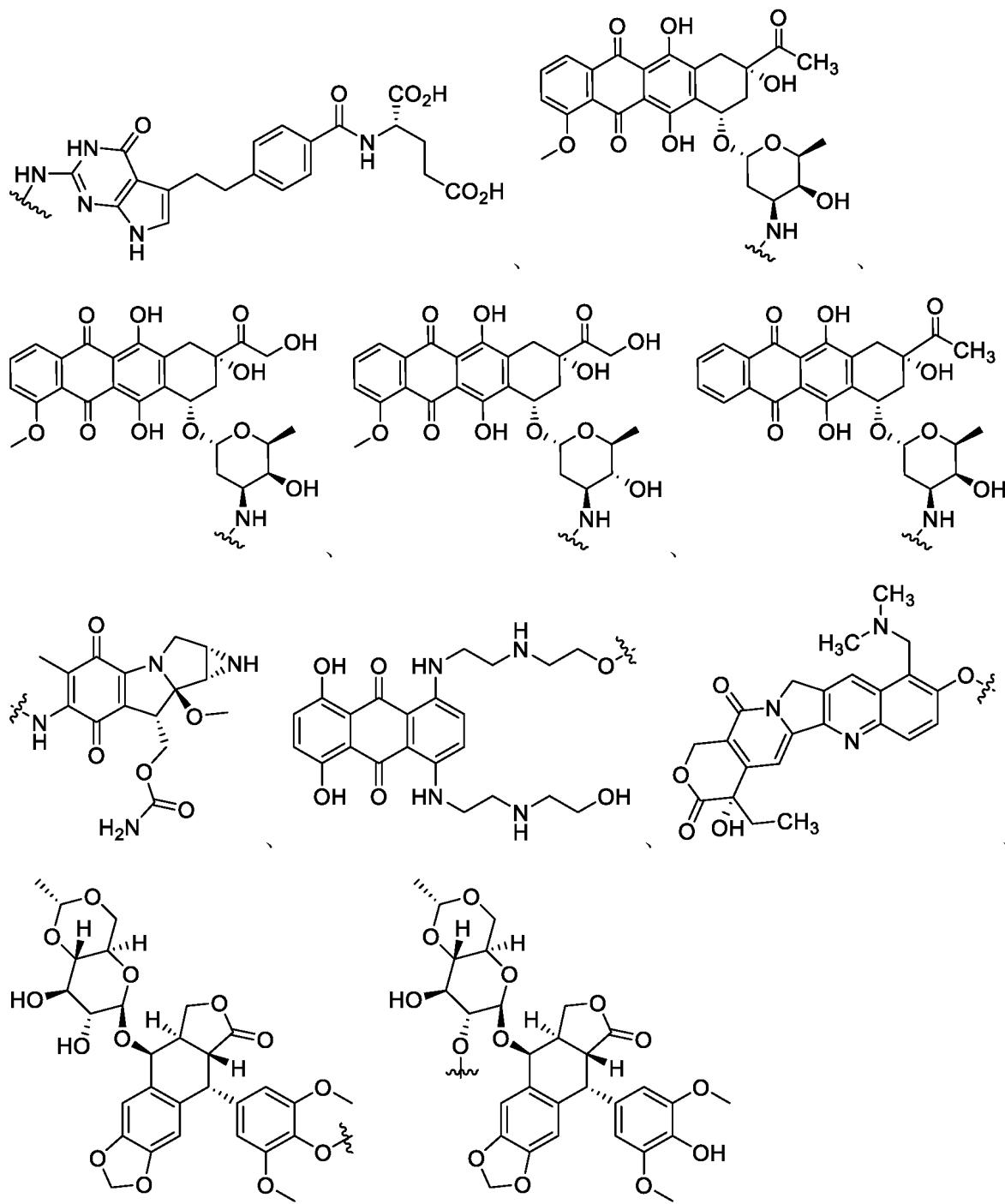
[実施態様 108]

実施態様 5 7 ~ 1 0 5 のいずれかに記載の化合物であって、D が、

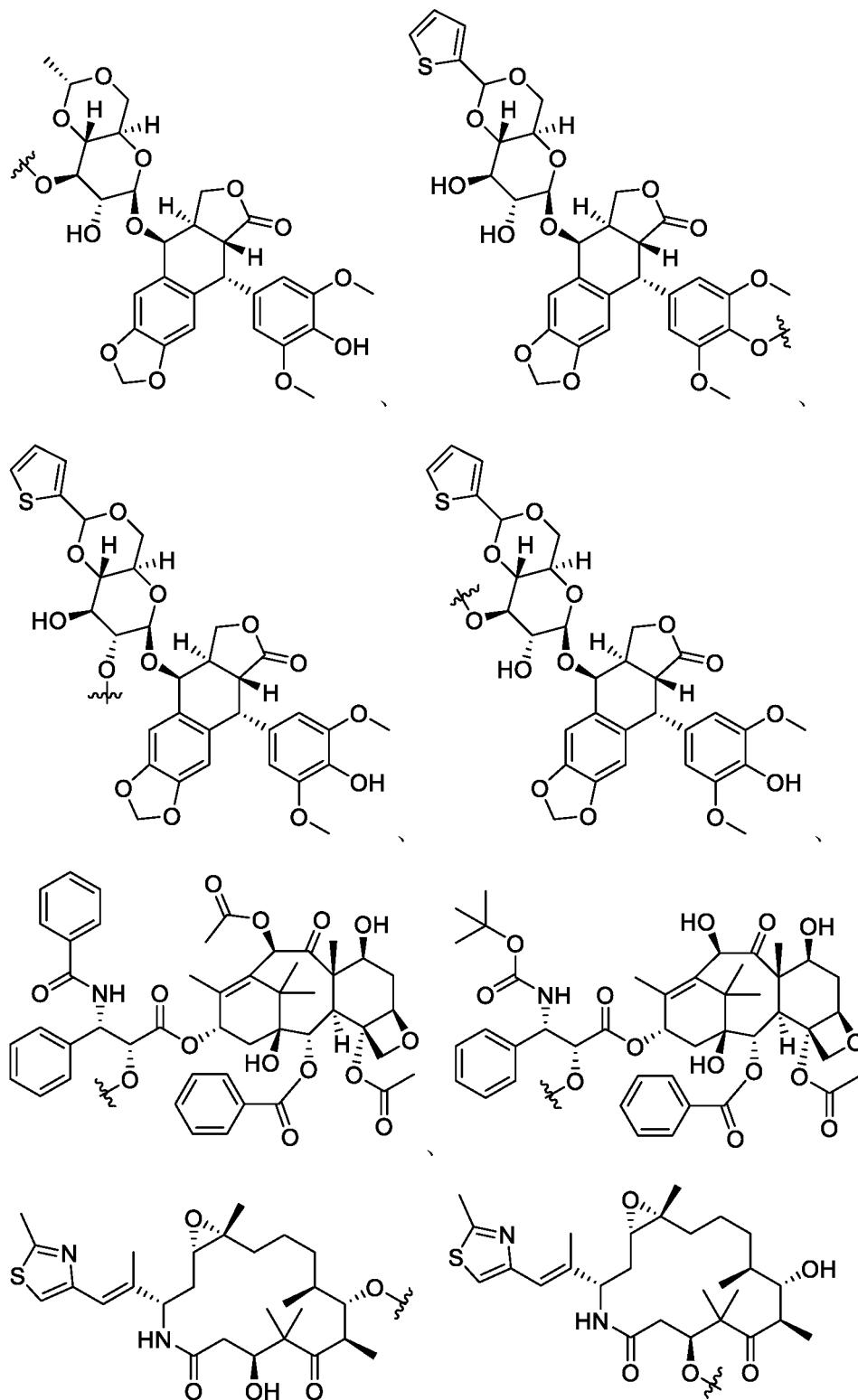
【化 8 9 - 1】



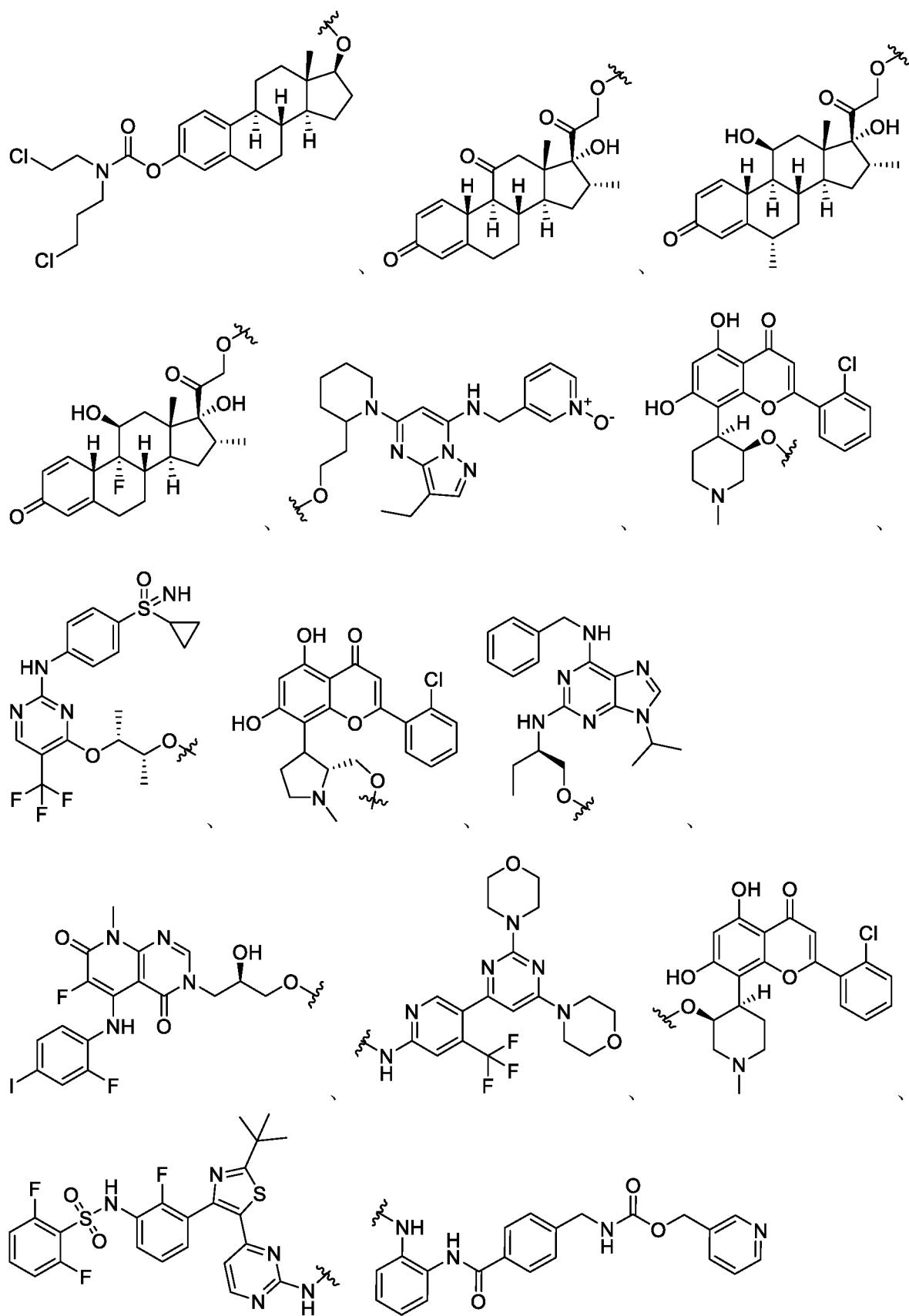
【化 8 9 - 2】



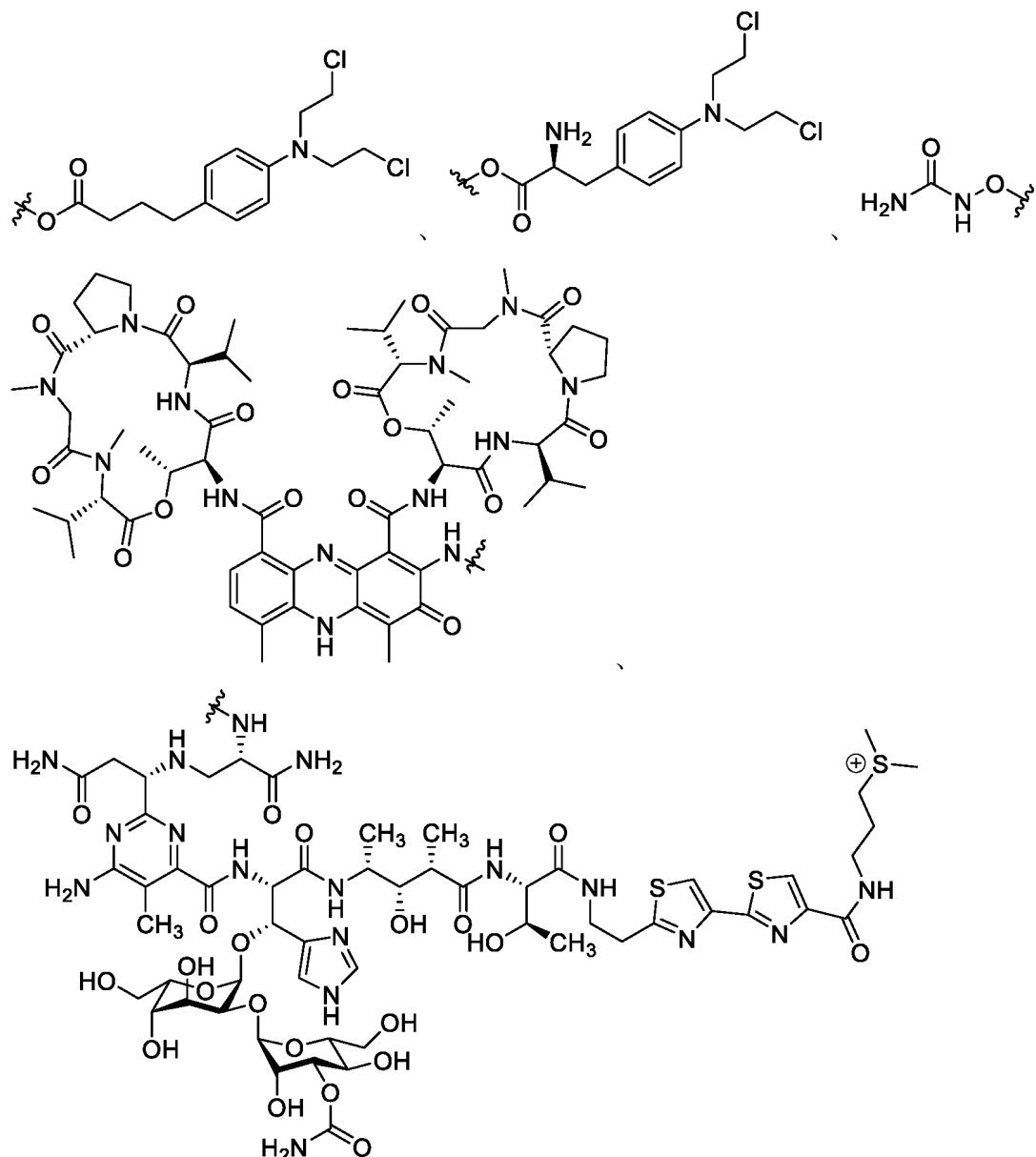
【化 8 9 - 3 】



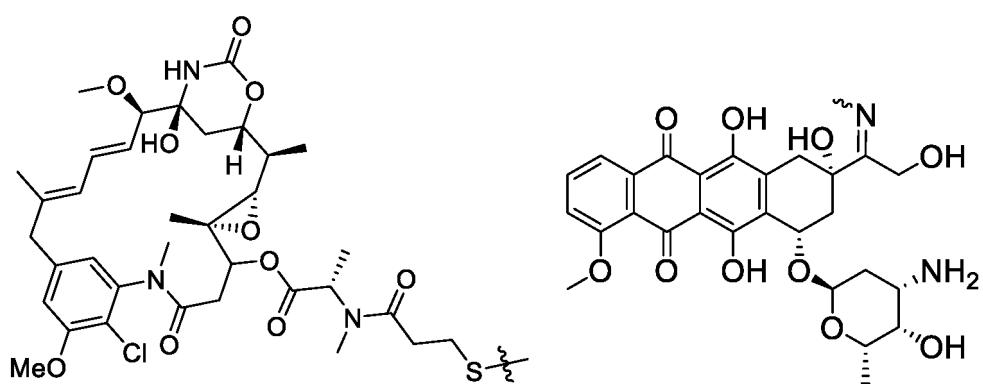
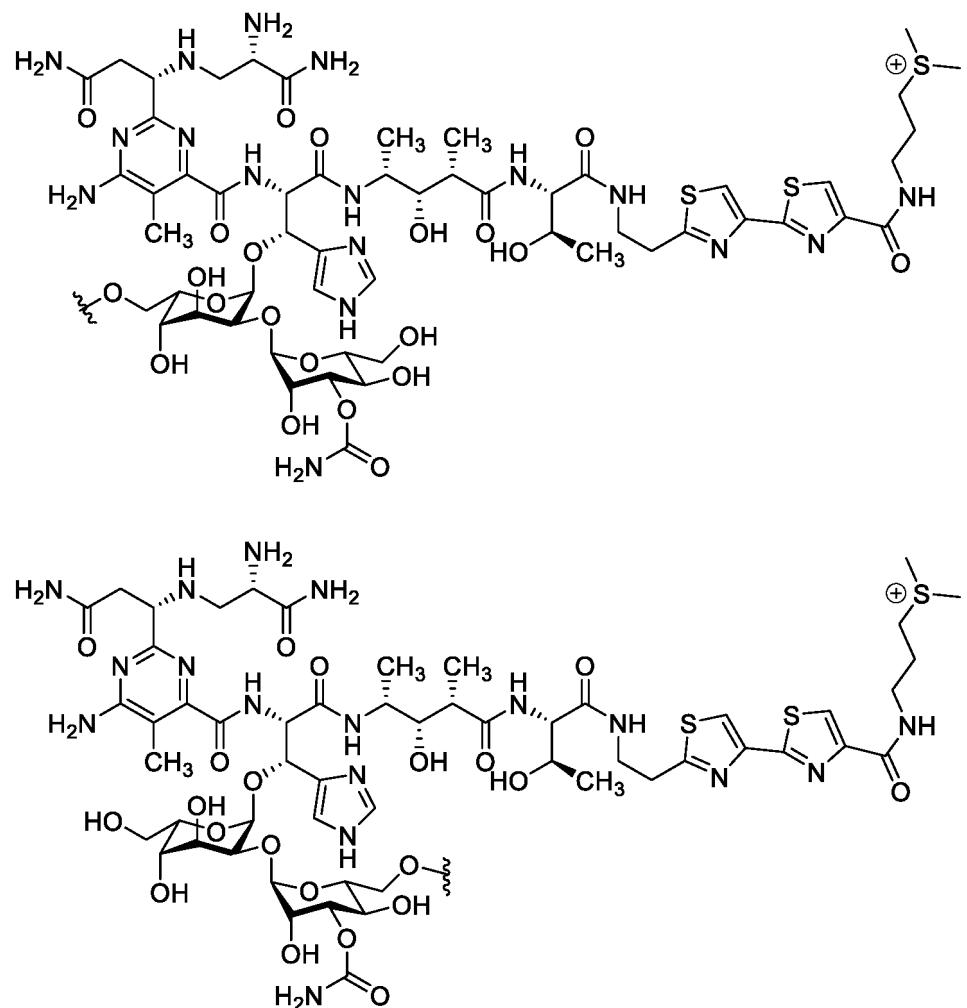
【化 8 9 - 4】



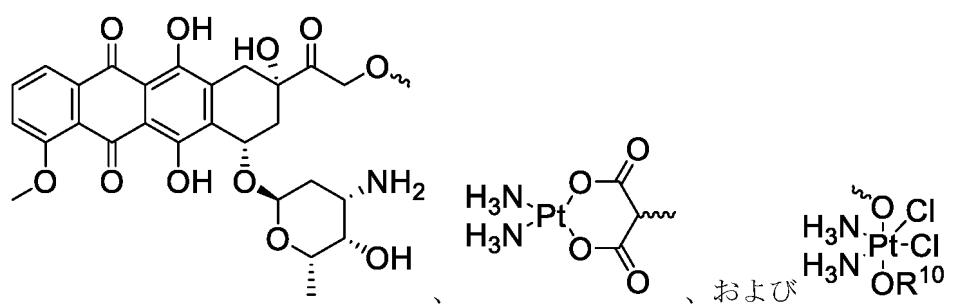
【化 8 9 - 5 】



【化 8 9 - 6】



【化 8 9 - 7】



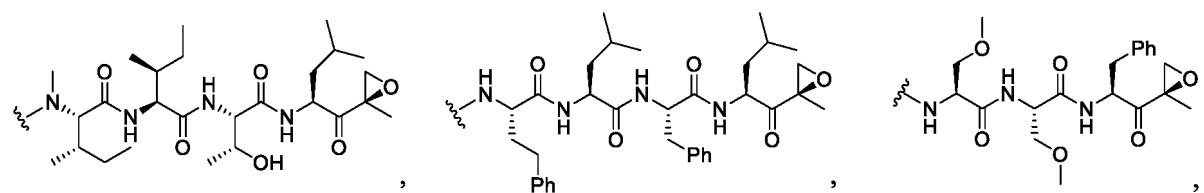
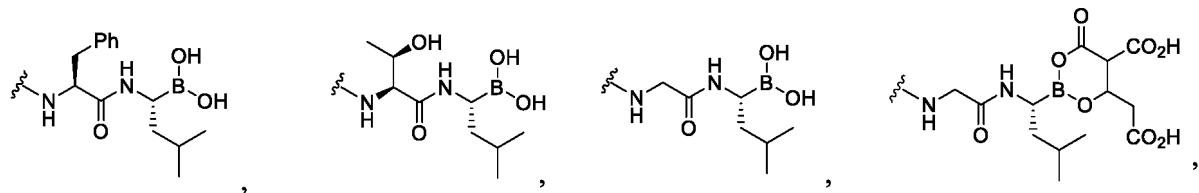
からなる群から選択されるファーマコフォアを表し、式中、

R^{10} が、 H 、 $C(O)(C_1 \sim C_{18})$ アルキル)、 $C(O)-NH-(C_1 \sim C_{18})$ アルキル)、 または $(C_1 \sim C_{18})$ アルキルである、化合物。

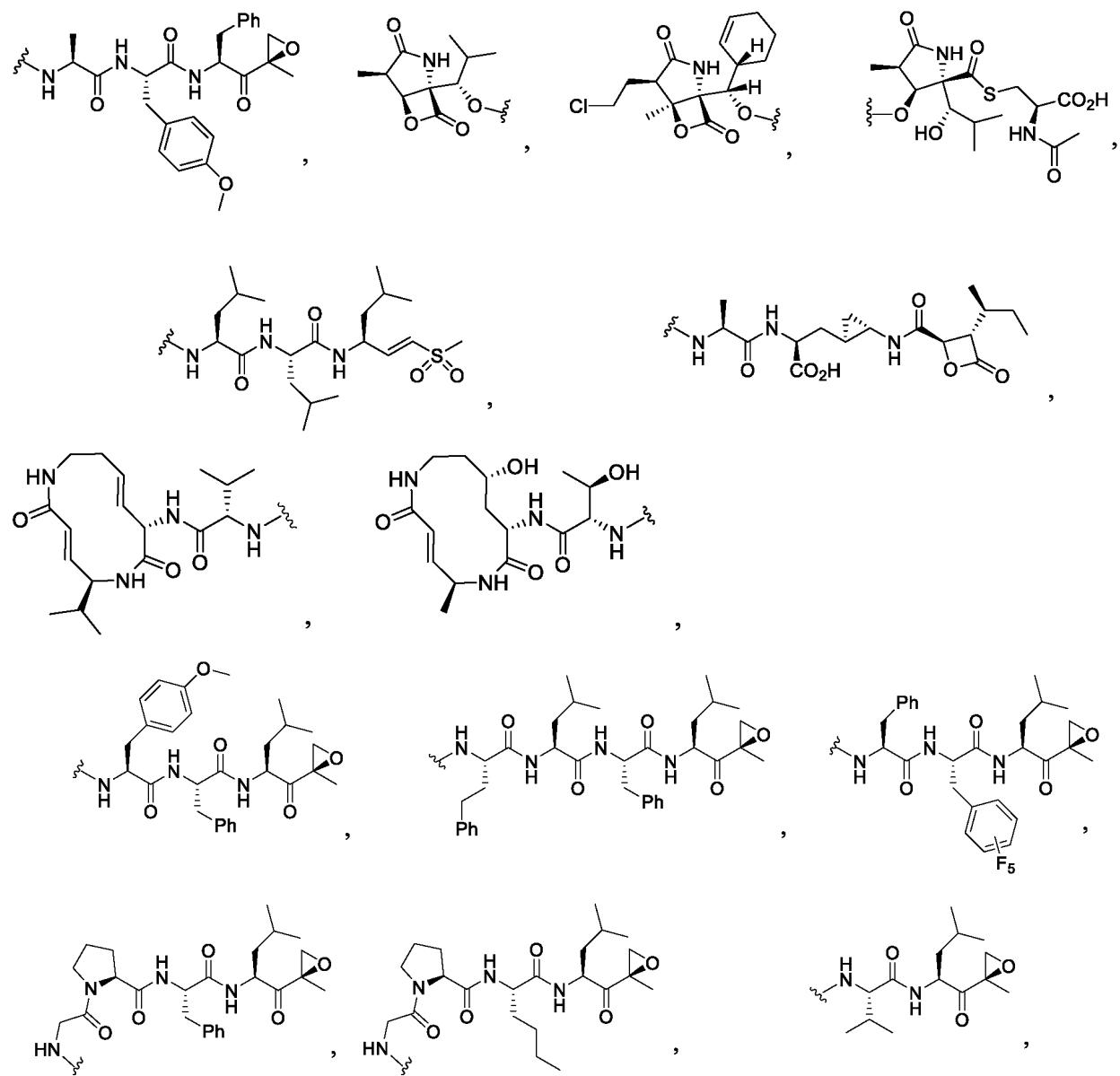
[実施態様 109]

実施態様 57 ~ 105 のいずれかに記載の化合物であって、D が、

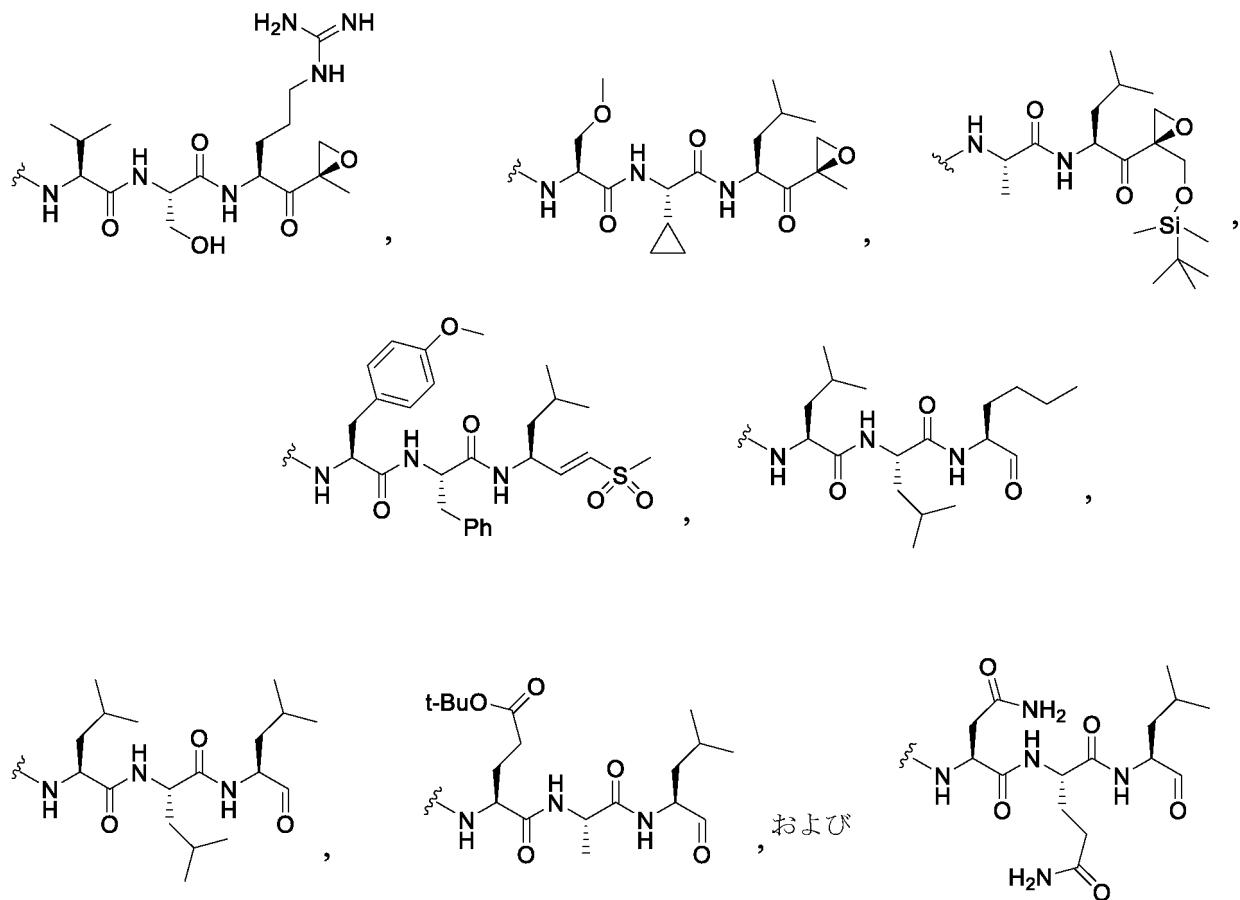
【化 90 - 1】



【化 9 0 - 2】



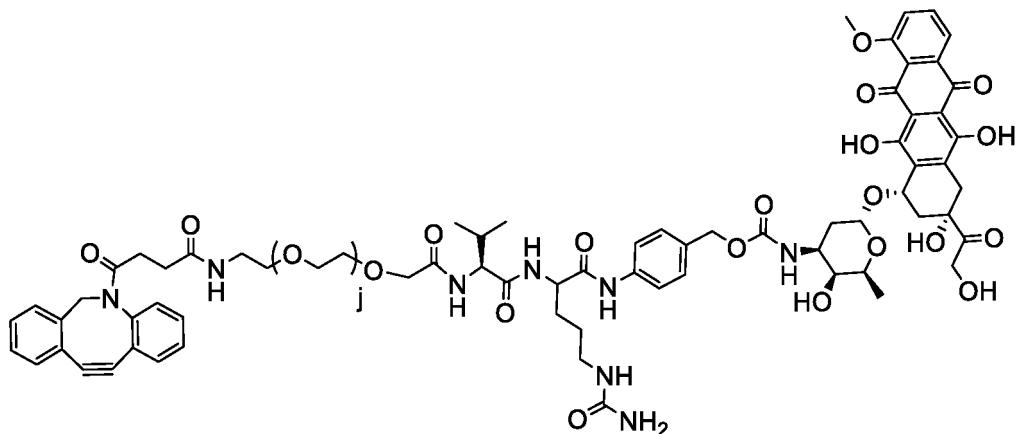
【化90-3】



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110]

【化91】

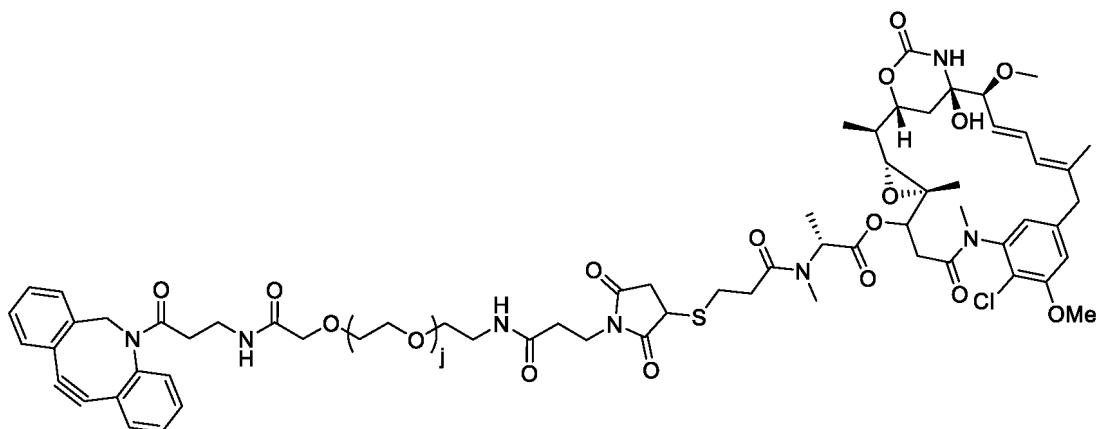


で表される化合物であって、

式中、jが、0～5000の整数である、化合物。

[実施態様111]

【化92】

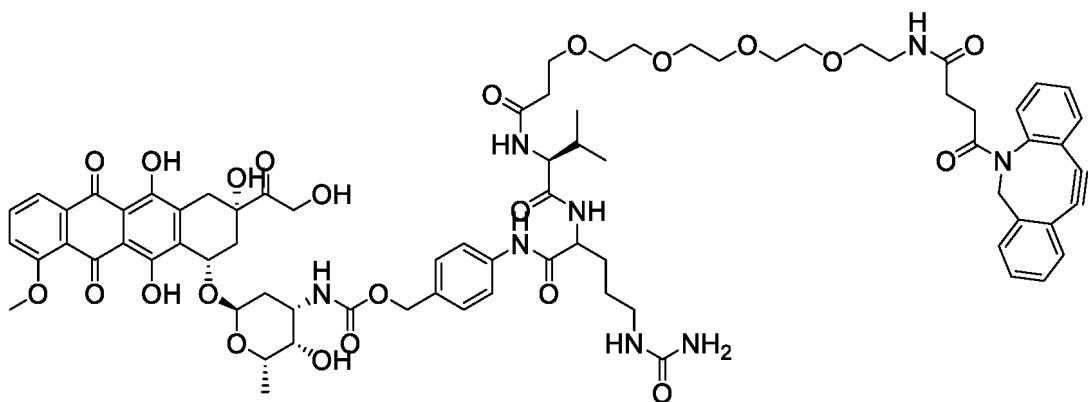


で表される化合物であって、

式中、jが、0～5000の整数である、化合物。

[実施態様112]

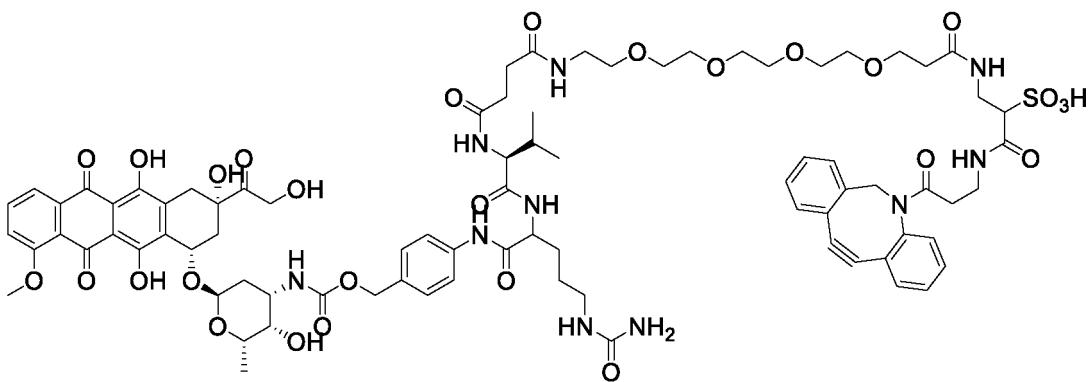
【化93】



で表される化合物。

[実施態様113]

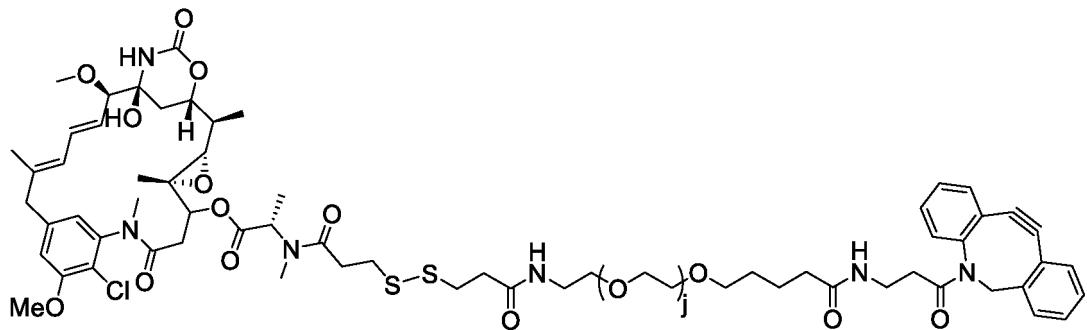
【化94】



で表される化合物。

[実施態様114]

【化 9 5】

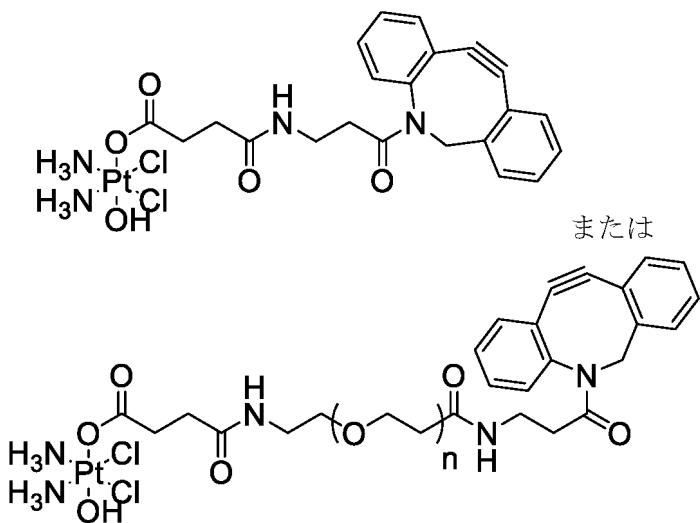


で表される化合物であって、

式中、 j が、0 ~ 5000 の整数である、化合物。

[実施態様 115]

【化 9 6】

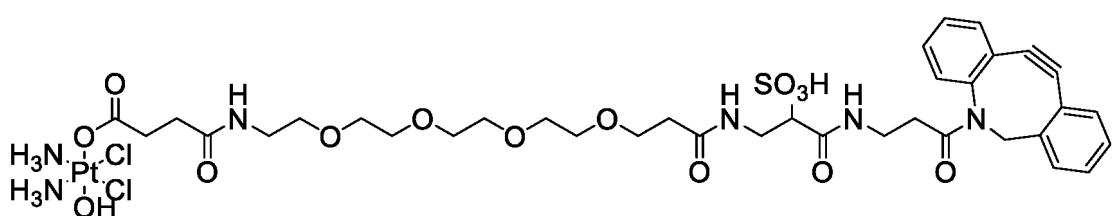
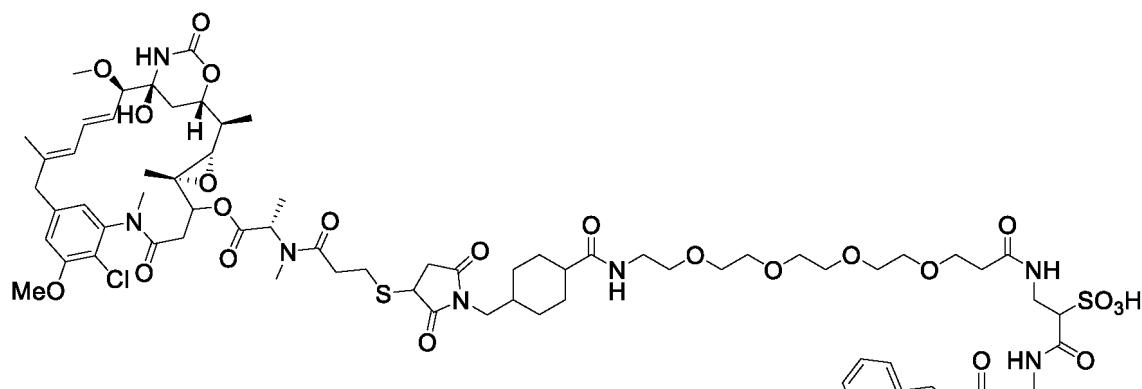


で表される化合物であって、

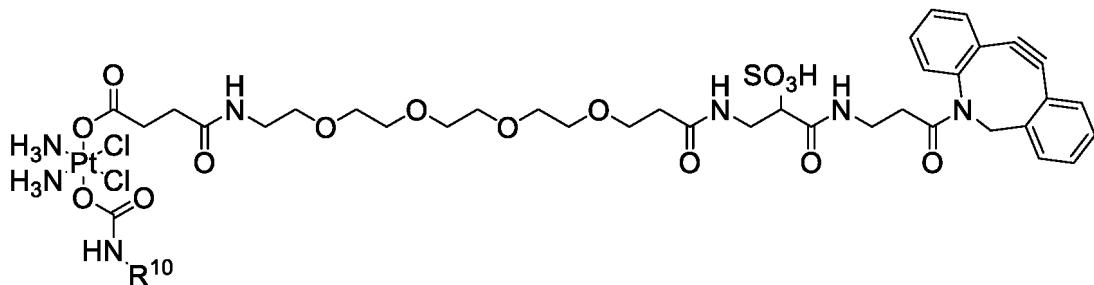
式中、 n が、1 ~ 5 0 0 0 の整数である、化合物。

[実施態様 116]

【化97】



、および



から選択される化合物であって、

式中、

R¹⁰ が、Hもしくは (C₁ ~ C₁₈) 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 117 に記載の方法。

[実施態様 122]

それを必要とする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含む、癌を治療する方法。