

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成19年7月5日(2007.7.5)

【公表番号】特表2007-500743(P2007-500743A)

【公表日】平成19年1月18日(2007.1.18)

【年通号数】公開・登録公報2007-002

【出願番号】特願2006-532499(P2006-532499)

【国際特許分類】

C 0 7 F 9/6561 (2006.01)

A 6 1 K 31/662 (2006.01)

A 6 1 K 31/664 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

C 0 7 F 9/6503 (2006.01)

C 0 7 F 9/655 (2006.01)

C 0 7 F 9/653 (2006.01)

C 0 7 F 9/40 (2006.01)

C 0 7 F 9/6512 (2006.01)

C 0 7 F 9/58 (2006.01)

【F I】

C 0 7 F 9/6561 C S P Z

A 6 1 K 31/662

A 6 1 K 31/664

A 6 1 P 29/00

C 0 7 F 9/6503

C 0 7 F 9/655

C 0 7 F 9/653

C 0 7 F 9/40 C

C 0 7 F 9/6512

C 0 7 F 9/40 A

C 0 7 F 9/58 Z

C 0 7 F 9/40 Z

【手続補正書】

【提出日】平成19年4月25日(2007.4.25)

【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】

1個またはそれ以上のホスホネート基に連結された抗炎症性化合物を含有する抱合体、またはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物。

【請求項2】

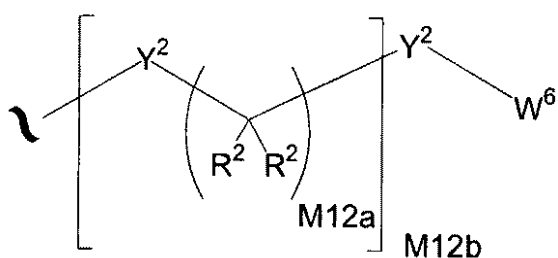
1個またはそれ以上のA⁰基で置換された式500~611のいずれか1つの化合物である、請求項1に記載の抱合体、またはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物：

ここで：

A⁰は、A¹、A²またはW³であるが、但し、該抱合体は、少なくとも1個のA¹を含む；

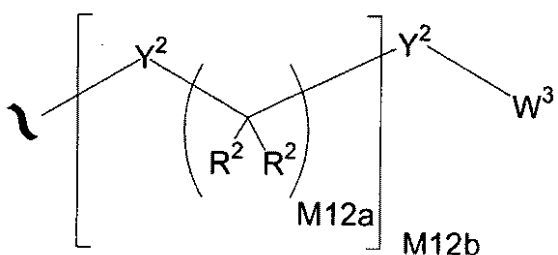
A¹ は、以下である：

【化 1】



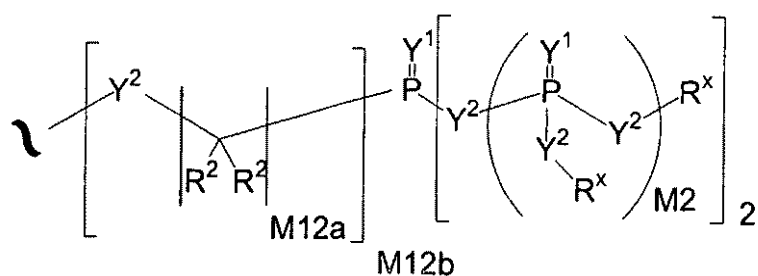
A² は、以下である：

【化 2】



A³ は、以下である：

【化 3】

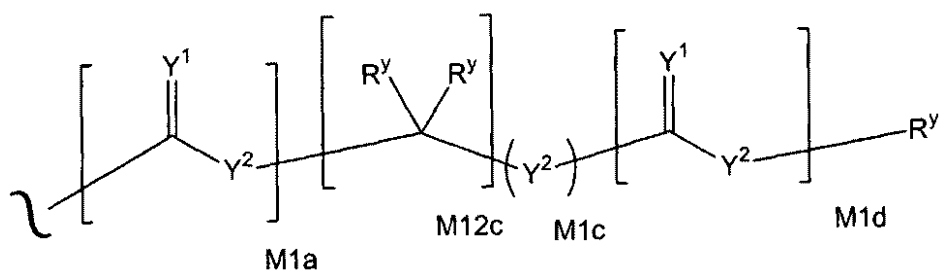


Y¹ は、別個に、O、S、N(R^x)、N(O)(R^x)、N(OR^x)、N(O)(OR^x)またはN(N(R^x)(R^x))である；

Y² は、別個に、結合、O、N(R^x)、N(O)(R^x)、N(OR^x)、N(O)(OR^x)、N(N(R^x)(R^x))、-S(O)_{M2}-または-S(O)_{M2}-S(O)_{M2}-である；そしてY²が2個のリン原子と結合するとき、Y²はまた、C(R²)(R²)であり得る；

R^x は、別個に、H、R¹、R²、W³、保護基または次式である：

【化 4】



ここで：

R^y は、別個に、 H 、 W^3 、 R^2 または保護基である；

R^1 は、別個に、 H または1個～18個の炭素原子を有するアルキルである；

R^2 は、別個に、 H 、 R^1 、 R^3 または R^4 であり、ここで、各 R^4 は、別個に、0個～3個の R^3 基で置換されているか、または炭素原子で一緒になって、2個の R^2 基は、3個～8個の炭素を有する環を形成し、そして該環は、0個～3個の R^3 基で置換され得る；

R^3 は、 R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} または R^{3d} であるが、但し、 R^3 がヘテロ原子に結合されるとき、 R^3 は、 R^{3c} または R^{3d} である；

R^{3a} は、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-CN$ 、 N_3 または $-NO_2$ である；

R^{3b} は、 Y^1 である；

R^{3c} は、 $-R^x$ 、 $-N(R^x)(R^x)$ 、 $-SR^x$ 、 $-S(O)R^x$ 、 $-S(O)_2R^x$ 、 $-S(O)(OR^x)$ 、 $-S(O)_2(OR^x)$ 、 $-OC(Y^1)R^x$ 、 $-OC(Y^1)OR^x$ 、 $-OC(Y^1)(N(R^x)(R^x))$ 、 $-SC(Y^1)R^x$ 、 $-SC(Y^1)OR^x$ 、 $-SC(Y^1)(N(R^x)(R^x))$ 、 $-N(R^x)C(Y^1)R^x$ 、 $-N(R^x)C(Y^1)OR^x$ または $-N(R^x)C(Y^1)(N(R^x)(R^x))$ である；

R^{3d} は、 $-C(Y^1)R^x$ 、 $-C(Y^1)OR^x$ または $-C(Y^1)(N(R^x)(R^x))$ である；

R^4 は、1個～18個の炭素原子を有するアルキル、2個～18個の炭素原子を有するアルケニル、または2個～18個の炭素原子を有するアルキニルである；

R^5 は、 R^4 であり、ここで、各 R^4 は、0個～3個の R^3 基で置換されている；

W^3 は、 W^4 または W^5 である；

W^4 は、 R^5 、 $-C(Y^1)R^5$ 、 $-C(Y^1)W^5$ 、 $-SO_{M2}R^5$ または $-SO_{M2}W^5$ である；

W^5 は、炭素環または複素環であり、ここで、 W^5 は、別個に、0個～3個の R_2 基で置換されている；

W^6 は、 W^3 であり、 W^3 は、別個に、1個、2個または3個の A^3 基で置換されている；

M_2 は、0、1または2である；

M_{12a} は、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11または12である；

M_{12b} は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11または12である；

M_{1a} 、 M_{1c} および M_{1d} は、別個に、0または1である；

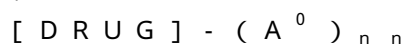
M_{12c} は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11または12である；

X^{66} は、水素またはフッ素である；そして

X^{67} は、水素、ヒドロキシまたはアシルオキシである、
抱合体。

【請求項3】

次式を有する請求項2に記載の抱合体、またはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物：



ここで：

$DRUG$ は、式500～611のいずれか1つの化合物である；そして

nn は、1、2または3である、
抱合体。

【請求項4】

式1～296のいずれか1つを有する請求項2に記載の抱合体であって、ここで：

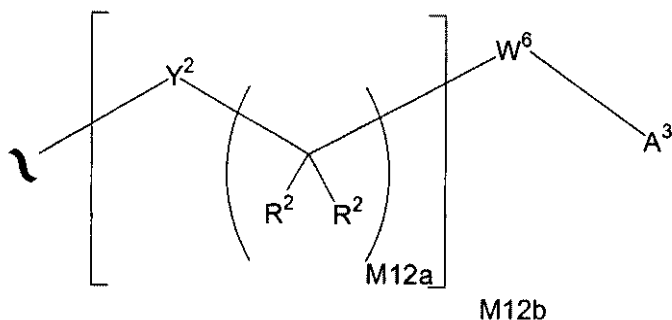
1個の A^0 は、 A^1 である；

X^{50} は、H または F である；
 X^{51} は、H、ヒドロキシまたはアシルオキシである；
 X^{52} は、 NH_2 または $EtC(O)N-Na^+$ である；
 X^{53} は、H、メチル、 CF_3 またはハロである；
 X^{54} は、H、ハロ、トリフルオロメチル、($C1 \sim C3$) アルキル、シアノまたは ($C1 \sim C3$) アルコキシである；
 X^{55} は、H、F、 Cl 、 Br 、メチル、またはトリフルオロメチルである；
 X^{56} は、H、ハロ、トリフルオロメチル、シアノ、メチルである；
 X^{57} は、H、F、 Cl 、 CF_3 、シアノ、メチルまたは t -ブチルである；
 X^{58} は、H または CH_2OH である；
 X^{59} は、H または F である；
 X^{60} は、H、トリフルオロメチルまたはシアノである；
 X^{61} は、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ビニル、エチル、メチル、プロピル、ブチル、シクロプロピル、 N -メチルアミノまたは N -ホルミルアミノである；
 X^{62} は、メチル、クロロまたはトリフルオロメチルである；
 X^{63} は、H、メチル、エチル、シクロプロピル、ビニルまたはトリフルオロメチルである；
 X^{64} は、H、メチル、エチル、シクロプロピル、クロロ、ビニル、アリル、3-メチル-1-ブテン-1-イルである；
 X^{65} は、H または F である；そして
 Ar は、アリールまたはヘテロアリールである、
 抱合体。

【請求項 5】

各 A^1 が、次式である、請求項 2 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の抱合体：

【化 7】

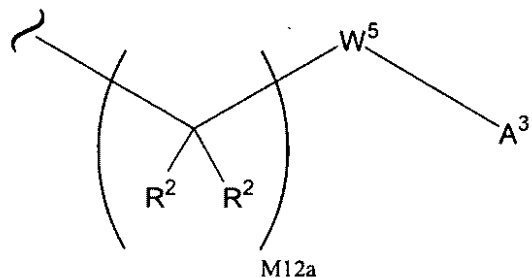


。

【請求項 6】

各 A^1 が、次式である、請求項 2 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の抱合体：

【化 11】

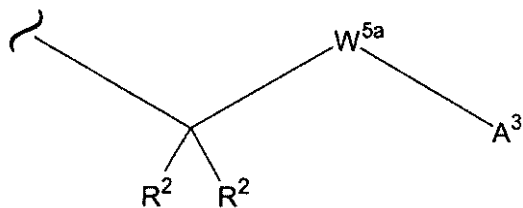


。

【請求項 7】

各 A^1 が、次式である、請求項 2 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の抱合体：

【化 1 2】



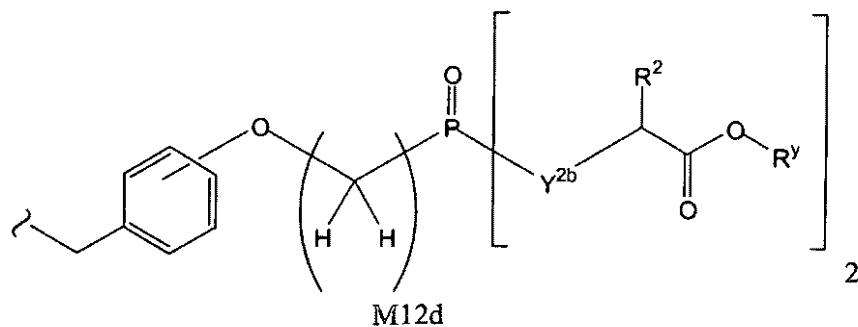
ここで： W^{5a} は、炭素環であり、該炭素環は、別個に、0 個または 1 個の R^2 基で置換されている、

抱合体。

【請求項 8】

各 A^1 が、次式である、請求項 2 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の抱合体：

【化 1 3】



ここで：

Y^{2b} は、O または $N(R^2)$ である；そして

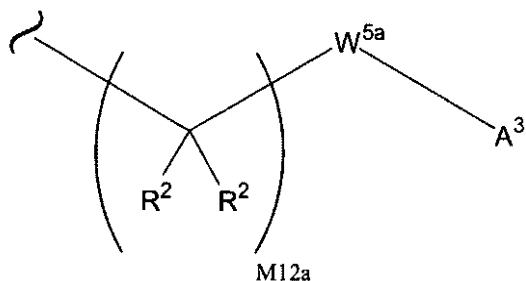
M12d は、1、2、3、4、5、6、7 または 8 である、

抱合体。

【請求項 9】

各 A^1 が、次式である、請求項 2 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の抱合体：

【化 1 4】



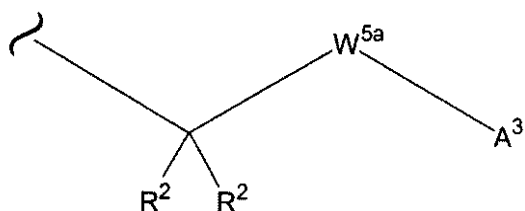
ここで： W^{5a} は、炭素環であり、該炭素環は、別個に、0 個または 1 個の R^2 基で置換されている、

抱合体。

【請求項 10】

各 A^1 が、次式である、請求項 2 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の抱合体：

【化 1 5】

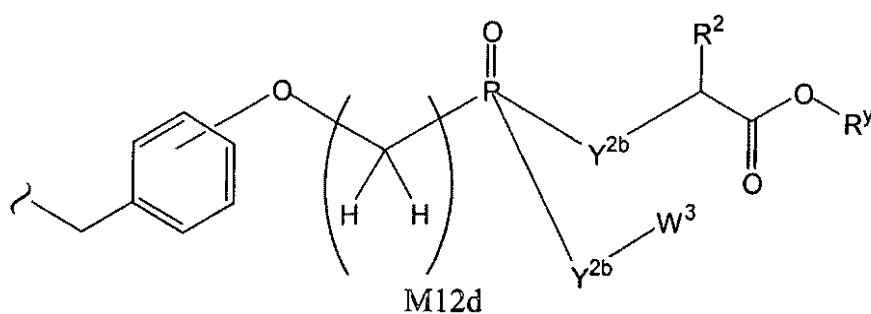


ここで：W^{5 a} は、炭素環または複素環であり、ここで、W^{5 a} は、別個に、0 個または 1 個の R² 基で置換されている、
抱合体。

【請求項 1 1】

各 A¹ が、次式である、請求項 2 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の抱合体：

【化 1 6】



ここで：

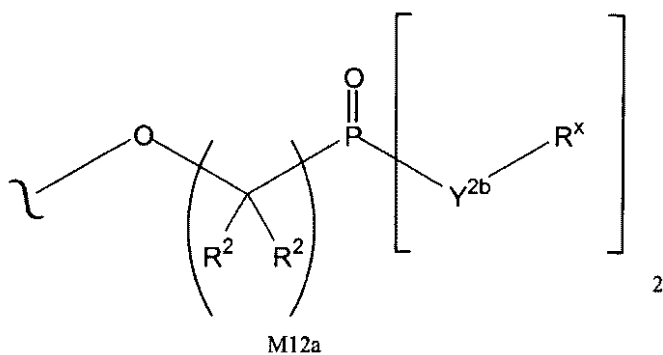
Y^{2 b} は、O または N (R²) である；そして

M 1 2 d は、1、2、3、4、5、6、7 または 8 である、
抱合体。

【請求項 1 2】

各 A³ が、次式である、請求項 2 ~ 1 1 のいずれか 1 項に記載の抱合体：

【化 2 5】

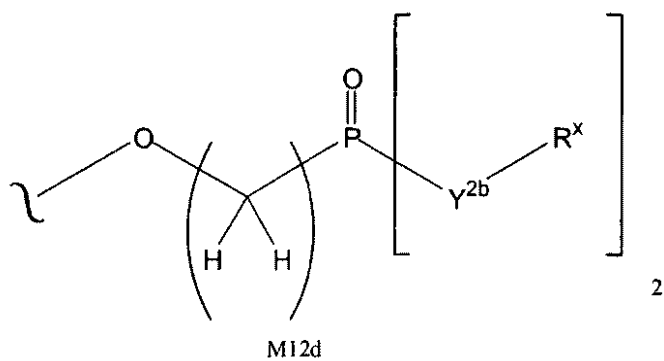


ここで、Y^{2 b} は、O または N (R^x) である、
抱合体。

【請求項 1 3】

各 A³ が、次式である、請求項 2 ~ 1 1 のいずれか 1 項に記載の抱合体：

【化 2 7】



ここで：

 Y^{2b} は、OまたはN(R^x)である；そしてM 1 2 d は、1、2、3、4、5、6、7または8である、
抱合体。

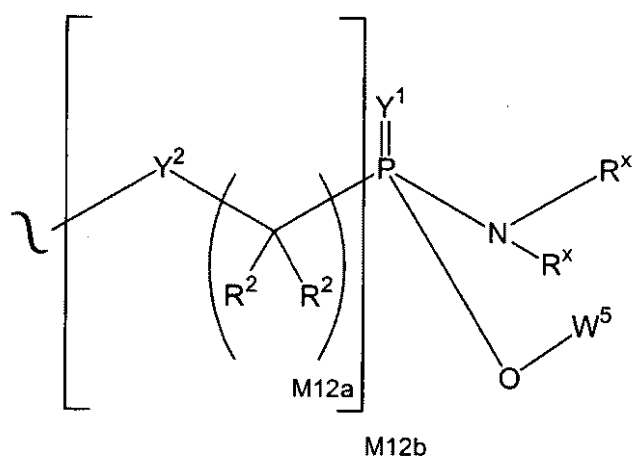
【請求項 1 4】

M 1 2 d が、1である、請求項 1 3 に記載の抱合体。

【請求項 1 5】

各 A^3 が、次式である、請求項 2 ~ 1 1 のいずれか 1 項に記載の抱合体：

【化 3 0】

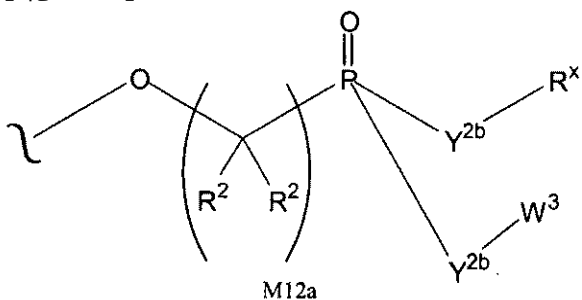


。

【請求項 1 6】

各 A^3 が、次式である、請求項 2 ~ 1 1 のいずれか 1 項に記載の抱合体：

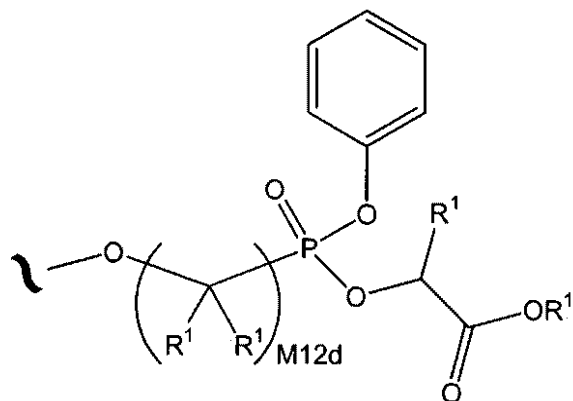
【化 3 2】

ここで、 Y^{2b} は、OまたはN(R^x)である、
抱合体。

【請求項 17】

各 A^3 が、次式である、請求項 2 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の抱合体：

【化 35】

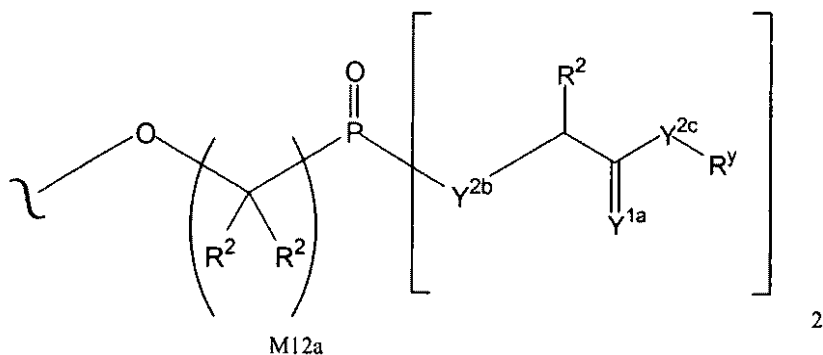


ここで、該フェニル炭素環は、0 個、1 個、2 個または 3 個の R^2 基で置換されている、抱合体。

【請求項 18】

各 A^3 が、次式である、請求項 2 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の抱合体：

【化 40】



ここで：

Y^{1a} は、O または S である；

Y^{2b} は、O または N (R^2) である；そして

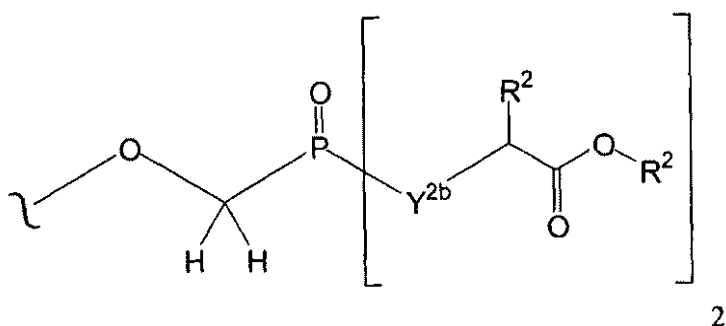
Y^{2c} は、O、N (R^Y) または S である、

抱合体。

【請求項 19】

各 A^3 が、次式である、請求項 2 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の抱合体：

【化 43】



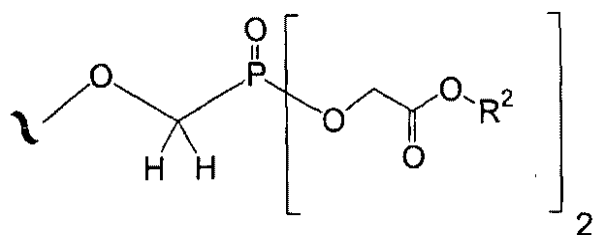
ここで、 Y^{2b} は、O または N (R^2) である、

抱合体。

【請求項 20】

各 A^3 が、次式である、請求項 2 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の抱合体：

【化 44】

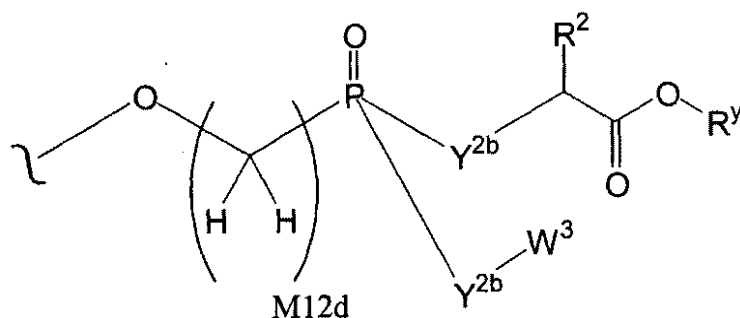


。

【請求項 21】

各 A^3 が、次式である、請求項 2 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の抱合体：

【化 49】



ここで：

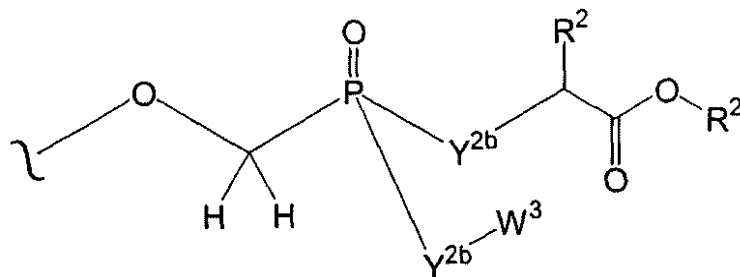
Y^{2b} は、O または $N(R^2)$ である；そして

M12d は、1、2、3、4、5、6、7 または 8 である、
抱合体。

【請求項 22】

各 A^3 が、次式である、請求項 2 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の抱合体：

【化 50】

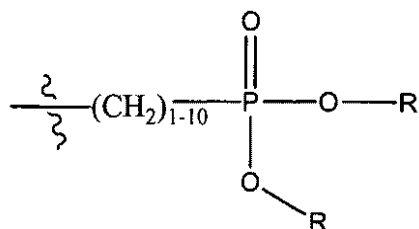


ここで、 Y^{2b} は、O または $N(R^2)$ である、
抱合体。

【請求項 23】

A^0 が、次式である、請求項 3 に記載の抱合体：

【化 5 1】

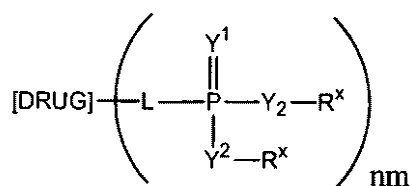


ここで、各 R は、別個に、アルキルである、
抱合体。

【請求項 2 4】

次式を有する、請求項 1、2、3 または 4 に記載の抱合体、またはそれらの薬学的に受容可能な塩または溶媒和物：

【化 5 2】



ここで：

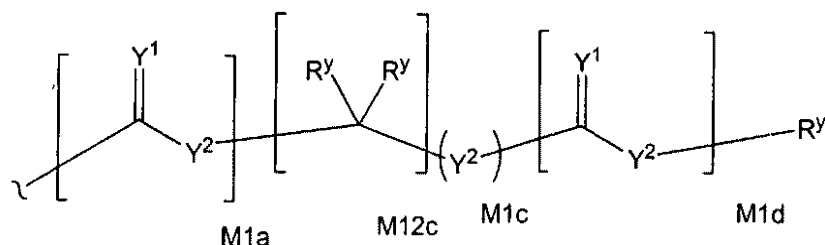
DRUG は、抗炎症性化合物である；

Y^1 は、別個に、O、S、N(R^x)、N(O)(R^x)、N(OR x)、N(O)(OR x) または N(N(R^x)(R^x)) である；

Y^2 は、別個に、結合、O、N(R^x)、N(O)(R^x)、N(OR x)、N(O)(OR x)、N(N(R^x)(R^x))、 $-\text{S}(\text{O})_{m2}-$ または $-\text{S}(\text{O})_{m2}-\text{S}(\text{O})_{m2}-$ である；

R^x は、別個に、H、 R^2 、 W^3 、保護基または次式である：

【化 5 3】



R^y は、別個に、H、 W^3 、 R^2 または保護基である；

R^2 は、別個に、H、 R^3 または R^4 であり、ここで、各 R^4 は、別個に、0 個～3 個の R^3 基で置換されている；

R^3 は、 R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} または R^{3d} であるが、但し、 R^3 がヘテロ原子に結合されるとき、 R^3 は、 R^{3c} または R^{3d} である；

R^{3a} は、F、Cl、Br、I、 $-\text{CN}$ 、 N_3 または $-\text{NO}_2$ である；

R^{3b} は、 Y^1 である；

R^{3c} は、 $-\text{R}^x$ 、 $-\text{N}(\text{R}^x)(\text{R}^x)$ 、 $-\text{SR}^x$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^x$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^x$ 、 $-\text{S}(\text{O})(\text{OR}^x)$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2(\text{OR}^x)$ 、 $-\text{OC}(\text{Y}^1)\text{R}^x$ 、 $-\text{OC}(\text{Y}^1)\text{OR}^x$ 、 $-\text{OC}(\text{Y}^1)(\text{N}(\text{R}^x)(\text{R}^x))$ 、 $-\text{SC}(\text{Y}^1)\text{R}^x$ 、 $-\text{SC}(\text{Y}^1)\text{OR}^x$ 、 $-\text{SC}(\text{Y}^1)(\text{N}(\text{R}^x)(\text{R}^x))$ 、 $-\text{N}(\text{R}^x)\text{C}(\text{Y}^1)\text{R}^x$ 、

- N (R ^x) C (Y ¹) O R ^x または - N (R ^x) C (Y ¹) (N (R ^x) (R ^x)) である ;

R ^{3 d} は、- C (Y ¹) R ^x、- C (Y ¹) O R ^x または - C (Y ¹) (N (R ^x) (R ^x)) である ;

R ⁴ は、1 個 ~ 1 8 個の炭素原子を有するアルキル、2 個 ~ 1 8 個の炭素原子を有するアルケニル、または 2 個 ~ 1 8 個の炭素原子を有するアルキニルである ;

R ⁵ は、R ⁴ であり、ここで、各 R ⁴ は、0 個 ~ 3 個の R ³ 基で置換されている ;

W ³ は、W ⁴ または W ⁵ である ;

W ⁴ は、R ⁵、- C (Y ¹) R ⁵、- C (Y ¹) W ⁵、- S O ₂ R ⁵ または - S O ₂ W ⁵ である ;

W ⁵ は、炭素環または複素環であり、ここで、W ⁵ は、別個に、0 個 ~ 3 個の R ² 基で置換されている ;

M 2 は、1、2 または 3 である ;

M 1 a、M 1 c および M 1 d は、別個に、0 または 1 である ;

M 1 2 c は、0、1、2、3、4、5、6、7、8、9、1 0、1 1 または 1 2 である ;

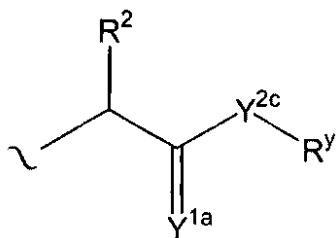
n n は、1、2 または 3 である ; そして

L は、直接結合または連結基である、
抱合体。

【請求項 2 5】

各 R ^x が、次式である、請求項 2 4 に記載の抱合体 :

【化 5 4】



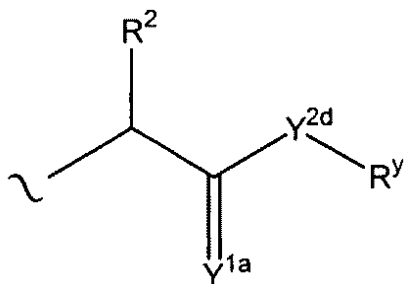
Y ^{1 a} は、O または S である ; そして

Y ^{2 c} は、O、N (R ^y) または S である、
抱合体。

【請求項 2 6】

各 R ^x が、次式である、請求項 2 4 に記載の抱合体 :

【化 5 5】



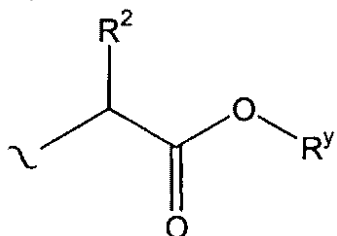
Y ^{1 a} は、O または S である ; そして

Y ^{2 d} は、O または N (R ^y) である、
抱合体。

【請求項 2 7】

各 R ^x が、次式である、請求項 2 4 に記載の抱合体 :

【化 5 6】



。

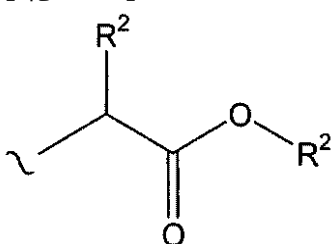
【請求項 2 8】

各 R^y が、別個に、Hまたは1個～10個の炭素を有するアルキルである、請求項 2 5 ～ 2 7 のいずれか1項に記載の抱合体。

【請求項 2 9】

各 R^x が、次式である、請求項 2 4 に記載の抱合体：

【化 5 7】

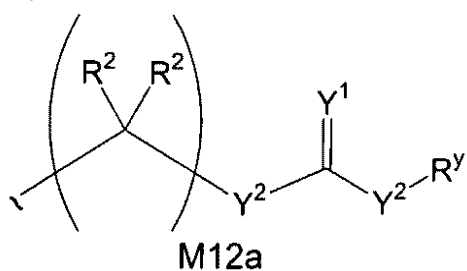


。

【請求項 3 0】

各 R^x が、次式である、請求項 2 4 に記載の抱合体：

【化 5 8】

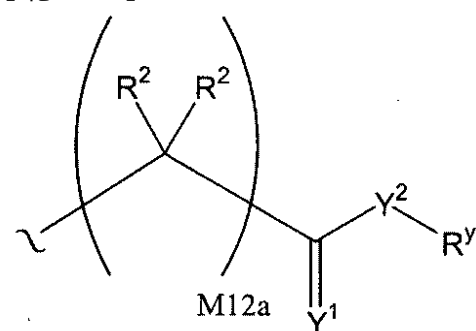


。

【請求項 3 1】

各 R^x が、次式である、請求項 2 4 に記載の抱合体：

【化 5 9】



。

【請求項 3 2】

各 Y^1 が、O または S である、請求項 2 4 に記載の抱合体。

【請求項 3 3】

各 Y^2 が、O、N (R^y) または S である、請求項 2 4 に記載の抱合体。

【請求項 3 4】

n n が、1 である、請求項 2 4 ~ 3 3 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 3 5】

n n が、2 である、請求項 2 4 ~ 3 3 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 3 6】

n n が、3 である、請求項 2 4 ~ 3 3 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 3 7】

前記抗炎症性化合物が、式 5 0 0 ~ 6 1 1 のいずれか 1 つの化合物である；ここで、 X^6 が、H または フッ素 である；そして $X^{6\ 7}$ が、H、ヒドロキシまたはアシルオキシである、請求項 2 4 に記載の抱合体。

【請求項 3 8】

各 L が、二価の分枝または非分枝の飽和または不飽和炭化水素鎖であり、該炭化水素鎖が、2 個 ~ 2 5 個の炭素原子を有し、ここで、該炭素原子の 1 個またはそれ以上が、必要に応じて、(-O-) で置き換えられ、ここで、該鎖が、必要に応じて、炭素上にて、1 個またはそれ以上の置換基で置換されており、該置換基が、($C_1 \sim C_6$) アルコキシ、($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル、($C_1 \sim C_6$) アルカノイル、($C_1 \sim C_6$) アルカノイルオキシ、($C_1 \sim C_6$) アルコキシカルボニル、($C_1 \sim C_6$) アルキルチオ、アジド、シアノ、ニトロ、ハロ、ヒドロキシ、オキソ (=O)、カルボキシ、アリール、アリールオキシ、ヘテロアリールおよびヘテロアリールオキシから選択される、請求項 3 7 に記載の抱合体。

【請求項 3 9】

各 L が、式 W - A であり、ここで、A が、($C_1 \sim C_{2\ 4}$) アルキレン、($C_2 \sim C_{2\ 4}$) アルケニレン、($C_2 \sim C_{2\ 4}$) アルキニレン、($C_3 \sim C_8$) シクロアルキレン、($C_6 \sim C_{1\ 0}$) アリールまたはそれらの組合せであり、ここで、各 W が、-N(R)C(=O)-、-C(=O)N(R)-、-OC(=O)-、-C(=O)O-、-O-、-S-、-S(O)-、-S(O)₂-、-N(R)-、-C(=O)-、-N(R)C=N(R)-N(R)-、-C(R)=N(R)-、-S(O)_{M 2}-N(R)-、-N(R)-S(O)_{M 2}- または 直接結合 である；ここで、各 R が、別個に、H または 1 個 ~ 1 0 個の炭素を有するアルキルである、請求項 3 7 に記載の抱合体。

【請求項 4 0】

各 A が、1 個 ~ 1 0 個の炭素を有するアルキレンである、請求項 3 9 に記載の抱合体。

【請求項 4 1】

各 L が、ペプチドから形成された二価ラジカルである、請求項 3 7 に記載の抱合体。

【請求項 4 2】

各 L が、アミノ酸から形成された二価ラジカルである、請求項 3 7 に記載の抱合体。

【請求項 4 3】

各 L が、ポリ-L-グルタミン酸、ポリ-L-アスパラギン酸、ポリ-L-ヒスチジン、ポリ-L-オルニチン、ポリ-L-セリン、ポリ-L-スレオニン、ポリ-L-チロシン、ポリ-L-ロイシン、ポリ-L-リジン-L-フェニルアラニン、ポリ-L-リジンまたはポリ-L-リジン-L-チロシンから形成された二価ラジカルである、請求項 3 7 に記載の抱合体。

【請求項 4 4】

各 L が、式 W - (CH_2)_n であり、ここで、n が、約 1 と 約 1 0 の間である；そして W が、-N(R)C(=O)-、-C(=O)N(R)-、-OC(=O)-、-C(=O)

) O -、 - O -、 - S -、 - S (O) -、 - S (O)₂ -、 - C (= O) -、 - N (R)
 -、 - N (R) C = N (R) - N (R) -、 - C (R) = N (R) -、 - S (O)_{M 2} -
 N (R) -、 - N (R) - S (O)_{M 2} - または直接結合である；ここで、各 R が、別個に、H または (C₁ ~ C₆) アルキルである、請求項 3 7 に記載の抱合体。

【請求項 4 5】

各 L が、メチレン、エチレンまたはプロピレンである、請求項 3 7 に記載の抱合体。

【請求項 4 6】

各 L が、L の炭素原子で、P に連結されている、請求項 3 7 に記載の抱合体。

【請求項 4 7】

単離され精製された、請求項 1 ~ 4 6 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 4 8】

前記化合物が、プリンヌクレオシドホスホリラーゼ阻害剤ではない、請求項 1 ~ 4 7 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 4 9】

前記化合物が、抗癌剤ではない、請求項 1 ~ 4 8 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 5 0】

前記化合物が、免疫媒介性の状態に対して活性である化合物ではない、請求項 1 ~ 4 9 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 5 1】

前記化合物が、代謝疾患に対して活性である化合物ではない、請求項 1 ~ 5 0 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 5 2】

前記化合物が、抗ウイルス薬ではない、請求項 1 ~ 5 1 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 5 3】

前記化合物が、ヌクレオシドではない、請求項 1 ~ 5 2 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 5 4】

前記化合物が、キナーゼ阻害剤ではない、請求項 1 ~ 5 3 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 5 5】

前記化合物が、代謝拮抗剤ではない、請求項 1 ~ 5 4 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 5 6】

前記化合物が、I M P D H 阻害剤ではない、請求項 1 ~ 5 5 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 5 7】

前記化合物が、抗感染薬ではない、請求項 1 ~ 5 6 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 5 8】

前記化合物が、式 2 4 2 または 2 4 3 の化合物ではない、請求項 4 ~ 5 7 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 5 9】

前記化合物が、式 7 4 ~ 7 6、1 9 9 ~ 2 0 3、2 7 9 ~ 2 8 0、2 0 4 ~ 2 1 0、および 2 8 6 ~ 2 9 2 のいずれか 1 つの化合物ではない、請求項 4 ~ 5 8 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 6 0】

前記化合物が、式 4 5 ~ 4 7、5 6 ~ 5 8、2 2 9、9 5 ~ 9 7、および 2 2 6 ~ 2 3 3 のいずれか 1 つの化合物ではない、請求項 4 ~ 5 9 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 6 1】

前記化合物が、式 8 2 ~ 8 5 のいずれか 1 つの化合物ではない、請求項 4 ~ 6 0 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 6 2】

前記化合物が、式 1 0 6 ~ 1 0 7、2 3 5 ~ 2 4 3、および 2 8 1 ~ 2 8 5 のいずれか 1

つの化合物ではない、請求項 4 ~ 6 1 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 6 3】

前記化合物が、式 1 0 6 ~ 1 0 7 および 2 4 2 ~ 2 4 3 のいずれか 1 つの化合物ではない、請求項 4 ~ 6 2 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 6 4】

前記化合物が、式 7 4 ~ 7 6、1 9 9 ~ 2 0 3、2 0 4 ~ 2 1 0、2 8 1 ~ 2 8 5、および 2 8 6 ~ 2 9 2 のいずれか 1 つの化合物ではない、請求項 4 ~ 6 3 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 6 5】

前記化合物が、式 1 4、4 1 ~ 4 4、6 3 ~ 6 5、7 4 ~ 7 6、7 9 ~ 8 0、9 9 ~ 1 0 0、1 0 6 ~ 1 0 7、1 1 3 ~ 1 2 6、2 0 4 ~ 2 1 0、1 3 3 ~ 1 5 5、1 6 5 ~ 1 7 3、1 7 7 ~ 1 9 2、1 9 6 ~ 2 1 0、2 1 4 ~ 2 4 3、2 4 9 ~ 2 5 0、2 7 2 ~ 2 7 4、2 6 9 ~ 2 7 1、2 7 5 ~ 2 8 0、2 8 6 ~ 2 9 2、および 2 9 3 ~ 2 9 6 のいずれか 1 つの化合物ではない、請求項 4 ~ 6 4 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 6 6】

前記化合物が、式 4 3 ~ 4 7、5 6 ~ 5 8、2 2 9、7 4 ~ 7 9、9 5 ~ 9 7、9 9 ~ 1 0 0、1 0 6 ~ 1 0 7、1 1 3 ~ 1 1 4、1 2 4 ~ 1 2 6、1 3 3 ~ 1 3 8、1 5 4 ~ 1 5 5、1 5 8 ~ 1 5 9、1 6 5 ~ 1 6 7、1 9 9 ~ 2 1 0、2 1 4 ~ 2 2 4、2 2 6 ~ 2 3 3、2 3 5 ~ 2 4 3、2 4 9 ~ 2 5 0、および 2 7 9 ~ 2 9 2 のいずれか 1 つの化合物ではない、請求項 4 ~ 6 5 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 6 7】

前記化合物が、式 5 0 3、5 2 6 ~ 5 2 8、5 3 1、5 4 2、5 5 1、5 5 4、5 5 7、5 5 9、5 6 5、5 6 9、5 7 2 ~ 5 7 4、5 7 7、5 8 5、5 8 7、5 9 8 ~ 6 0 0、6 0 2、6 0 3、6 0 5、6 0 7、6 0 8、および 6 0 9 のいずれか 1 つの化合物ではない、請求項 1 ~ 6 6 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 6 8】

前記化合物が、式 5 2 5 ~ 5 2 7、5 3 3、5 3 4、5 4 2、5 5 4、5 5 7、5 5 9、5 6 3、5 6 5 ~ 5 6 7、5 6 9、5 7 2 ~ 5 7 9、5 8 5、5 8 7 ~ 5 8 9、5 9 1 ~ 5 9 5、5 9 7 ~ 6 0 0、6 0 2、6 0 4 ~ 6 0 5、および 6 0 7 ~ 6 1 1 のいずれか 1 つの化合物ではない、請求項 1 ~ 6 7 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 6 9】

前記化合物が、式 5 9 8 ~ 6 0 0、5 7 7、および 6 0 8 のいずれか 1 つの化合物ではない、請求項 1 ~ 6 8 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 7 0】

前記化合物が、式 5 5 7 または 5 8 5 の化合物ではない、請求項 1 ~ 6 9 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 7 1】

前記化合物が、式 5 5 7、5 7 7、5 8 5、6 0 2、6 0 7、および 6 0 9 のいずれか 1 つの化合物ではない、請求項 1 ~ 7 0 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 7 2】

前記化合物が、式 5 4 4 の化合物ではない、請求項 1 ~ 7 1 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 7 3】

前記化合物が、式 5 2 8、5 3 1、5 5 1、および 6 0 5 のいずれか 1 つの化合物ではない、請求項 1 ~ 7 2 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 7 4】

前記化合物が、式 5 5 9、5 9 8 ~ 6 0 0 および 6 0 8 のいずれか 1 つの化合物ではない、請求項 1 ~ 7 3 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

【請求項 7 5】

前記化合物が、式 5 8 5 の化合物ではない、請求項 1 ~ 7 4 のいずれか 1 項に記載の抱合体。

体。

【請求項 7 6】

式 M B F の化合物。

【請求項 7 7】

表 1 0 0 から選択される、請求項 7 6 に記載の化合物。

【請求項 7 8】

薬学的に受容可能な賦形剤と請求項 1 ~ 7 5 のいずれか 1 項に記載の抱合体または請求項 7 6 ~ 7 7 に記載の化合物とを含有する、医薬組成物。

【請求項 7 9】

請求項 1 ~ 7 5 のいずれか 1 項に記載の抱合体または請求項 7 6 ~ 7 7 に記載の化合物と、薬学的に受容可能な賦形剤とを含有する、単位剤形。

【請求項 8 0】

インビトロまたはインビボで炎症活性を阻害するための組成物であって、請求項 1 ~ 7 5 のいずれか 1 項に記載の抱合体または請求項 7 6 ~ 7 7 に記載の化合物を含有し、該組成物は、このような治療を必要とする検体と接触させるのに適している、組成物。

【請求項 8 1】

前記接触が、インビボでなされる、請求項 8 0 に記載の組成物。

【請求項 8 2】

哺乳動物において炎症を治療するための組成物であって、請求項 1 ~ 7 5 のいずれか 1 項に記載の抱合体または請求項 7 6 ~ 7 7 に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項 8 3】

前記抱合体または化合物が、薬学的に受容可能な賦形剤と共に処方される、請求項 8 2 に記載の組成物。

【請求項 8 4】

前記抱合体または化合物が、また、第二活性成分と共に処方される、請求項 8 3 に記載の組成物。

【請求項 8 5】

医学療法で使用するための、請求項 1 ~ 7 5 のいずれか 1 項に記載の抱合体または請求項 7 6 ~ 7 7 に記載の化合物を含有する、組成物。

【請求項 8 6】

動物における炎症を治療する医薬を調製するための、請求項 1 ~ 7 5 のいずれか 1 項に記載の抱合体または請求項 7 6 ~ 7 7 に記載の化合物の使用。

【請求項 8 7】

本明細書中で記述されたホスホネート置換抗炎症性化合物。

【請求項 8 8】

実施例またはスキームに従って本明細書中で記述された化合物または抱合体を調製する方法。