

【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20年3月21日(2008.3.21)

【公表番号】特表2007-525494(P2007-525494A)

【公表日】平成19年9月6日(2007.9.6)

【年通号数】公開・登録公報2007-034

【出願番号】特願2006-552017(P2006-552017)

【国際特許分類】

A 61 K 31/136 (2006.01)  
A 61 K 31/415 (2006.01)  
A 61 K 31/196 (2006.01)  
A 61 K 31/4188 (2006.01)  
A 61 K 31/4152 (2006.01)  
A 61 K 31/4155 (2006.01)  
A 61 K 31/166 (2006.01)  
A 61 K 31/18 (2006.01)  
A 61 K 31/428 (2006.01)  
A 61 K 31/4184 (2006.01)  
A 61 K 31/194 (2006.01)  
A 61 K 31/404 (2006.01)  
A 61 K 31/24 (2006.01)  
A 61 K 31/423 (2006.01)  
A 61 K 31/403 (2006.01)  
A 61 K 31/17 (2006.01)  
A 61 K 31/4453 (2006.01)  
A 61 K 31/341 (2006.01)  
A 61 K 31/435 (2006.01)  
A 61 K 31/4425 (2006.01)  
A 61 K 31/426 (2006.01)  
A 61 K 31/427 (2006.01)  
A 61 K 31/336 (2006.01)  
A 61 K 31/192 (2006.01)  
A 61 K 31/343 (2006.01)  
A 61 K 31/201 (2006.01)  
A 61 K 31/53 (2006.01)  
A 61 K 31/4015 (2006.01)  
C 07 D 231/38 (2006.01)  
C 07 D 417/10 (2006.01)  
C 07 D 209/40 (2006.01)  
C 07 D 209/88 (2006.01)  
C 07 D 231/52 (2006.01)  
C 07 D 235/08 (2006.01)  
C 07 D 207/38 (2006.01)  
C 07 D 303/46 (2006.01)  
C 07 D 307/91 (2006.01)  
C 07 D 331/02 (2006.01)  
C 07 D 405/12 (2006.01)  
C 07 D 207/277 (2006.01)  
A 61 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	17/10	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/08	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	15/18	(2006.01)
A 6 1 P	37/04	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	27/16	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	21/04	(2006.01)
A 6 1 P	7/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
C 0 7 C	245/10	(2006.01)
C 0 7 C	233/54	(2006.01)
C 0 7 C	311/21	(2006.01)
C 0 7 C	309/51	(2006.01)
C 0 7 C	233/55	(2006.01)
C 0 7 C	235/16	(2006.01)
C 0 7 C	235/76	(2006.01)
C 0 7 C	65/40	(2006.01)
C 0 7 C	309/46	(2006.01)
C 0 7 D	487/04	(2006.01)
C 0 7 D	231/24	(2006.01)
C 0 7 D	403/04	(2006.01)
C 0 7 D	417/04	(2006.01)
C 0 7 D	235/12	(2006.01)
C 0 7 D	257/04	(2006.01)
C 0 7 D	235/30	(2006.01)
C 0 7 D	263/56	(2006.01)
C 0 7 D	277/64	(2006.01)
C 0 7 D	295/12	(2006.01)
C 0 7 D	307/62	(2006.01)
C 0 7 D	219/08	(2006.01)
C 0 7 D	213/53	(2006.01)
C 0 7 D	277/20	(2006.01)
C 0 7 D	277/36	(2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K	31/136
A 6 1 K	31/415

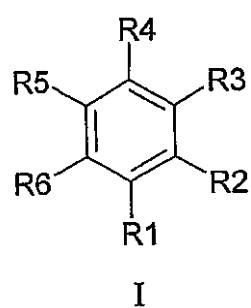
A 6 1 K 31/196  
A 6 1 K 31/4188  
A 6 1 K 31/4152  
A 6 1 K 31/4155  
A 6 1 K 31/166  
A 6 1 K 31/18  
A 6 1 K 31/428  
A 6 1 K 31/4184  
A 6 1 K 31/194  
A 6 1 K 31/404  
A 6 1 K 31/24  
A 6 1 K 31/423  
A 6 1 K 31/403  
A 6 1 K 31/17  
A 6 1 K 31/4453  
A 6 1 K 31/341  
A 6 1 K 31/435  
A 6 1 K 31/4425  
A 6 1 K 31/426  
A 6 1 K 31/427  
A 6 1 K 31/336  
A 6 1 K 31/192  
A 6 1 K 31/343  
A 6 1 K 31/201  
A 6 1 K 31/53  
A 6 1 K 31/4015  
C 0 7 D 231/38 C S P B  
C 0 7 D 417/10  
C 0 7 D 209/40  
C 0 7 D 209/88  
C 0 7 D 231/52  
C 0 7 D 235/08  
C 0 7 D 207/38  
C 0 7 D 303/46  
C 0 7 D 307/91  
C 0 7 D 331/02  
C 0 7 D 405/12  
C 0 7 D 207/277  
A 6 1 P 9/00  
A 6 1 P 35/00  
A 6 1 P 35/02  
A 6 1 P 27/02  
A 6 1 P 17/06  
A 6 1 P 17/10  
A 6 1 P 17/00  
A 6 1 P 19/08  
A 6 1 P 1/04  
A 6 1 P 15/18  
A 6 1 P 37/04  
A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/08  
A 6 1 P 11/06  
A 6 1 P 9/10 1 0 1  
A 6 1 P 27/16  
A 6 1 P 37/06  
A 6 1 P 1/16  
A 6 1 P 3/10  
A 6 1 P 11/00  
A 6 1 P 25/00  
A 6 1 P 21/04  
A 6 1 P 29/00 1 0 1  
A 6 1 P 7/00  
A 6 1 P 43/00 1 1 1  
C 0 7 C 245/10  
C 0 7 C 233/54  
C 0 7 C 311/21  
C 0 7 C 309/51  
C 0 7 C 233/55  
C 0 7 C 235/16 C  
C 0 7 C 235/76  
C 0 7 C 65/40  
C 0 7 C 309/46  
C 0 7 D 487/04 1 3 6  
C 0 7 D 231/24  
C 0 7 D 403/04  
C 0 7 D 417/04  
C 0 7 D 235/12  
C 0 7 D 257/04 N  
C 0 7 D 235/30 B  
C 0 7 D 263/56  
C 0 7 D 277/64  
C 0 7 D 295/12 Z  
C 0 7 D 307/62  
C 0 7 D 219/08  
C 0 7 D 213/53  
C 0 7 D 277/36

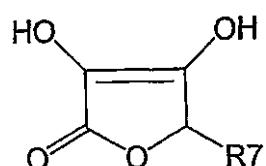
**【手続補正書】****【提出日】**平成20年2月1日(2008.2.1)**【手続補正1】****【補正対象書類名】**特許請求の範囲**【補正対象項目名】**全文**【補正方法】**変更**【補正の内容】****【特許請求の範囲】****【請求項1】**

ヘパラナーゼの触媒活性に起因する又は関連する疾患及び障害を治療するための医薬組成物であって、薬学上許容される担体と、下記一般式I、II、III又はIV及び薬学上許容されるそれらの塩の少なくとも1種のヘパラナーゼ阻害剤とを含有する医薬組成物：

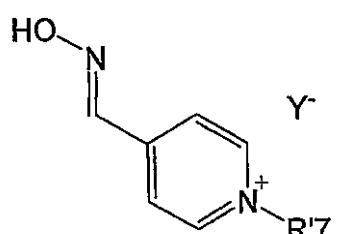
【化1】



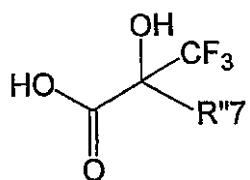
I



II



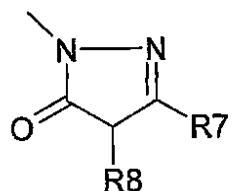
III



IV

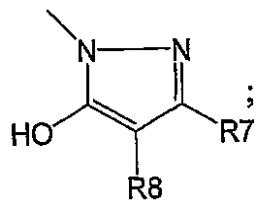
[式中、  
R1は、  
(i)]

【化2】



又はその互変異性体

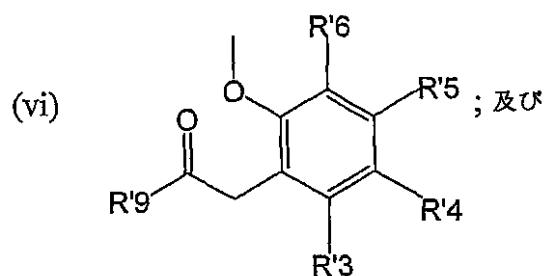
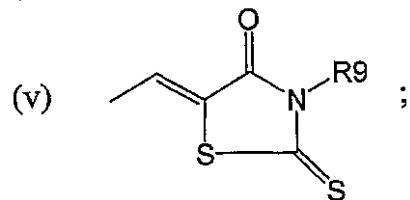
【化3】



## 【化4】

(ii) -N(R9)-CO(R10);

(iii) -CO- N(R9)(R10);

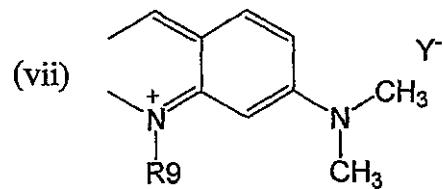
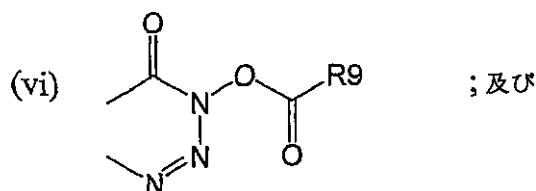
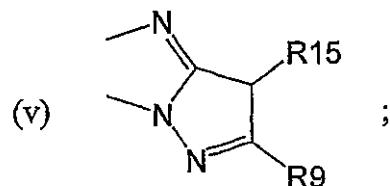
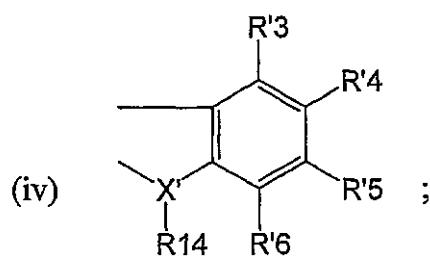
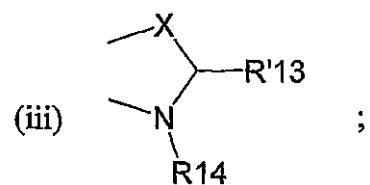
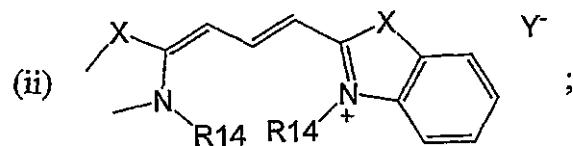
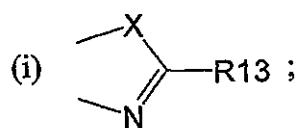
(iv) -SO<sub>2</sub>R11;(vii) -CH(OH)-CH(NH-CO-R'7)-CH<sub>2</sub>NR9R'9

からなる群から選択され；

R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R'3、R'4、R'5及びR'6は、それぞれ独立に、水素、ハロゲン、ニトロ、(C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>2)アルキル、(C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>2)アルケニル、(C<sub>6</sub>～C<sub>1</sub>4)アリール、ヘテロアリール、-OR<sub>9'</sub>、-SR<sub>9'</sub>、-NR<sub>9</sub>R'<sub>9</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR<sub>9</sub>-COR'<sub>9</sub>、-COR'<sub>9</sub>、-COOR'<sub>9</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-N(R9)(R'9)、-SO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>2</sub>R'9、又は-NHSO<sub>2</sub>R'9であるか；

R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>は一緒になって、

【化5】



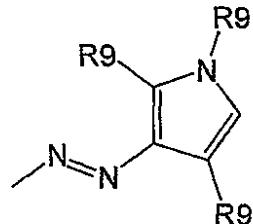
[式中、Xは、O、S、N(R12)又はC(R'12、R"12)であり、X'は、O又はNである]からなる群から選択される部分であるか；

R2+R3、R3+R4、R4+R5又はR5+R6のそれぞれの対は、それらが結合している炭素原子と一緒にになって、5又は6員の芳香族環を形成し；

R7は、H、ハロゲン、(C1~C32)アルキル、(C2~C32)アルケニル、(

C<sub>6</sub> ~ C<sub>14</sub>) アリール、ヘテロアリール、-OR'9、-SR'9、-NR<sub>9</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>-COR'9、-COR'9、-COOR'9、-CH(OH)- (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-O-CO-R<sub>9</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR<sub>9</sub>-COR'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CON(R<sub>9</sub>)(R'9)、-SO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>2</sub>R'9、-NHSO<sub>2</sub>R'9、-N=N-(C<sub>6</sub> ~ C<sub>14</sub>) アリール、及び

【化6】



からなる群から選択され；

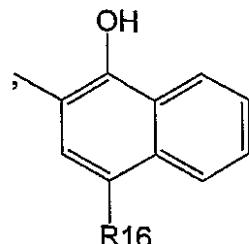
R'7は、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>2)アルキルであり；R"7は、(C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub>2)アルケニルであり；

R8は、R7について定義した通りであり；

R9は、H又は(C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>2)アルキルであり、且つR'9は、H、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>2)アルキル、(C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub>2)アルケニル又は(C<sub>6</sub> ~ C<sub>14</sub>)アリールであるか、R9及びR'9は、基-NR<sub>9</sub>R'9の一部として、それらが結合しているN原子と一緒にになって、1個又は複数のN、S又はO原子をさらに含んでいてもよい3 ~ 7員の飽和環を形成し；

R10は、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>2)アルキル、(C<sub>2</sub> ~ C<sub>3</sub>2)アルケニル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-R17、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NH-CO-R9-O-R'9、及び

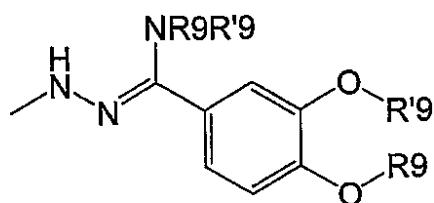
【化7】



からなる群から選択され；

R11は、OH又は

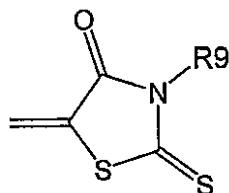
【化8】



であり；

R12、R'12及びR"12は、それぞれ、H又は(C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>2)アルキルであるか、R'12及びR"12は一緒にになって基

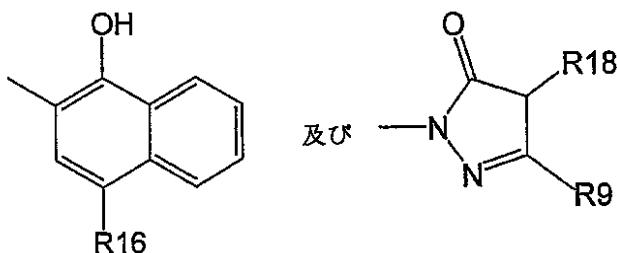
【化9】



であり；

R13は、(C1～C32)アルキル、(C6～C14)アリール、-N=CH-(C6～C14)アリール、

【化10】



からなる群から選択され；

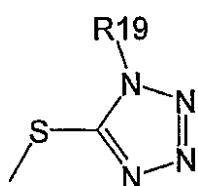
R'13は、=O、=NH又は=N-NH-SO<sub>2</sub>R'9であり；

R14は、H、(C1～C32)アルキル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-CH(OH)-CH<sub>2</sub>-NR9R'9又は-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-CH(OH)-(C6～C14)アリールであり；

R15は、H又は-SO<sub>3</sub>Hであり；

R16は、H、ハロゲン、-COOH、-SO<sub>3</sub>H、-N=N-(C6～C14)アリール及び

【化11】



からなる群から選択され；

R17は、(C1～C32)アルキル、(C6～C14)アリール、-NH-NH-CO-(C1～C32)アルキル、-NH-NH-CO-(C6～C14)アリール、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NH-CO-C(R9)-O(C1～C32)アルキル、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NH-CO-C(R9)-O(C6～C14)アリール、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-(C1～C32)アルキル、及び-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-(C6～C14)アリールからなる群から選択され；

R18は、H又は=N-(C6～C14)アリールであり；

R19は、(C6～C14)アリールであり；

Y<sup>-</sup>は、塩素イオン、臭素イオン、ヨウ素イオン、過塩素酸イオン、p-トルエンスルホン酸イオン、メタンスルホン酸イオン、硫酸イオン、リン酸イオン及び有機アニオンからなる群から選択される対イオンであり；

n は、0 又は 1 ~ 10 の整数であり、m は、1 ~ 10 の整数であり；  
 いずれの「(C 1 ~ C 3 2) アルキル」又は「(C 2 ~ C 3 2) アルケニル」も、直鎖又は分枝鎖でよく、且つ、O、S 及び / 又は N から選択される 1 個又は複数のヘテロ原子で割り込まれていてもよく、且つ / 又は、ハロゲン、(C 3 ~ C 7) シクロアルキル、(C 6 ~ C 14) アリール、ニトロ、OR'9、SR'9、エポキシ、エピチオ、オキソ、-COR'9、-COOR'9、-OSO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>2</sub>R'9、-NHSO<sub>2</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>R'9、アジリジン、=N-OR'9、=N-NR<sub>9</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>-NR<sub>9</sub>R'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR<sub>9</sub>-COR'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-NR<sub>9</sub>R'9、-OPO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9、-PO<sub>2</sub>HR'9 及び -PO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9 からなる群から選択される 1 個又は複数の基で置換されていてもよく；

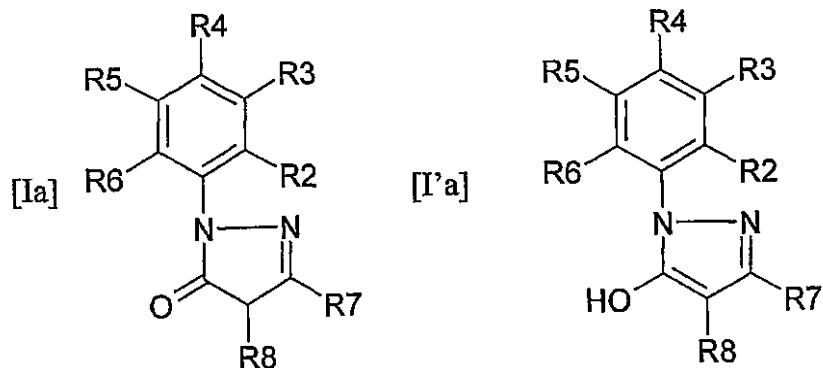
「ヘテロアリール」は、O、S及びNからなる群から選択される1～3個のヘテロ原子を含む単環又は多環ヘテロ芳香族環から誘導される基を意味し：

いずれの「アリール」又は「ヘテロアリール」も、ハロゲン、(C<sub>6</sub>~C<sub>14</sub>)アリール、(C<sub>1</sub>~C<sub>32</sub>)アルキル、ニトロ、-OR'<sub>9</sub>、-SR'<sub>9</sub>、-COR'<sub>9</sub>、COR'<sub>9</sub>、-OSO<sub>3</sub>R'<sub>9</sub>、-SO<sub>3</sub>R'<sub>9</sub>、-SO<sub>2</sub>R'<sub>9</sub>、-NHSO<sub>2</sub>R'<sub>9</sub>、-NR<sub>9</sub>R'<sub>9</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR<sub>9</sub>-COR'<sub>9</sub>及び-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-NR<sub>9</sub>R'<sub>9</sub>からなる群から選択される1個又は複数の基で置換されていてもよい]。

## 【請求項2】

下記式 I a 又は I', a の化合物を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物：

## 【化 1 2】



〔式中、

R<sub>2</sub> は、H、ハロゲン、-NH<sub>2</sub> 又は -SO<sub>3</sub>H であり；

R<sub>3</sub> は、H 又は -SO<sub>3</sub>H であり；

R<sub>4</sub>は、H、ハロゲン、-SO<sub>3</sub>H、-SO<sub>2</sub>-（C<sub>1</sub>0～C<sub>2</sub>2）アルキル又は-O（C<sub>6</sub>～C<sub>1</sub>4）アリール〔式中、アリールは非置換であるか、-O（C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>）アルキルで置換されている〕であり；

R5 は、H であり；

R6 は、H 又はハロゲンであり：

R7 は、

( i ) H

( i i ) ( C 1 0 ~ C 2 2 ) アルキル、

$$(i\ i\ i) - \text{COOH},$$

(i v) - N R 9 - C O R ' 9 [式中、R 9 は H であり、R' 9 は、エポキシで置換されていてもよい (C 10 ~ C 22) アルキル、- C O O H で置換されていてもよい (C 10 ~ C 22) アルケニル、又は - S O<sub>3</sub> H 若しくは - N H - C O (C 10 ~ C 22) アルキルで置換されていてもよい (C 6 ~ C 14) アリールである]、及び

( v ) - SO<sub>3</sub>H で又は - N R 9 - C O R ' 9 で置換されていてもよい ( C 6 ~ C 14 )

) アリール〔式中、R<sub>9</sub>はHであり、R'9は(C<sub>10</sub>～C<sub>22</sub>)アルキルである〕からなる群から選択され；

R<sub>8</sub>は、

(i) H、

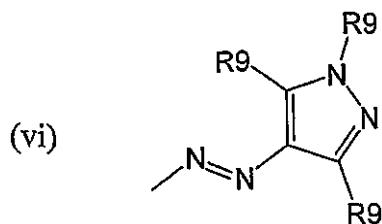
(ii) ハロゲン、

(iii) (C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル、

(iv) -O(C<sub>10</sub>～C<sub>22</sub>)アルキル、

(v) 1個又は複数のハロゲン、-OR'9、-COOR'9、-SO<sub>3</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>R'9又は-NR<sub>9</sub>COOR'9で置換されていてもよい(C<sub>6</sub>～C<sub>14</sub>)アリール〔式中、R<sub>9</sub>及びR'9は、それぞれ独立に、H又は(C<sub>10</sub>～C<sub>22</sub>)アルキルである〕

、  
【化13】



〔式中、R<sub>9</sub>は、それぞれ独立に、H又は(C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>)アルキルである〕、及び  
(vi) 1個又は複数のハロゲン、-OR'9、-COOR'9、-SO<sub>3</sub>R'9、-NH<sub>2</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>R'9又は-NR<sub>9</sub>-CO-R'9で置換されていてもよい-N=N-(C<sub>6</sub>～C<sub>14</sub>)アリール〔式中、R<sub>9</sub>及びR'9は、それぞれ独立に、H又は(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキルであるか、R'9が、メチルで置換された(C<sub>6</sub>～C<sub>14</sub>)アリールである〕

からなる群から選択され；

R<sub>4</sub>、R<sub>7</sub>及びR<sub>8</sub>中で規定したいずれの「(C<sub>10</sub>～C<sub>22</sub>)アルキル」も、直鎖又は分枝鎖でよく、且つ、O、S及びNからなる群から選択される1個又は複数のヘテロ原子で割り込まれていてもよく、且つ又は、ハロゲン、(C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>)シクロアルキル、好ましくはシクロプロピル、(C<sub>6</sub>～C<sub>14</sub>)アリール、ニトロ、-OR'9、-SR'9、エポキシ、エピチオ、オキソ、-COR'9、-COOR'9、-OSO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>2</sub>R'9、-NH<sub>2</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>R'9、アジリジン、=N-OR'9、=N-NR<sub>9</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>-NR<sub>9</sub>R'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR<sub>9</sub>-COR'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-NR<sub>9</sub>R'9、-OPO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9、-PO<sub>2</sub>HR'9及び-PO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9からなる群から選択される1個又は複数の基で置換されていてもよい〔この関係において式中のR<sub>9</sub>は、H又は(C<sub>1</sub>～C<sub>32</sub>)アルキルであり、R'9が、H、(C<sub>1</sub>～C<sub>32</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub>～C<sub>32</sub>)アルケニル又は(C<sub>6</sub>～C<sub>14</sub>)アリールであるか、R<sub>9</sub>及びR'9が、基-NR<sub>9</sub>R'9の一部として、それらが結合しているN原子と一緒にになって、1個又は複数のN、S又はO原子をさらに含んでいてもよい3～7員の飽和環を形成し、nは、0又は1～10の整数である〕。

【請求項3】

R<sub>2</sub>が、H、C<sub>1</sub>、-NH<sub>2</sub>、又は-SO<sub>3</sub>Hであり；

R<sub>3</sub>が、H又は-SO<sub>3</sub>Hであり；

R<sub>4</sub>が、H、C<sub>1</sub>、-SO<sub>3</sub>H、-SO<sub>2</sub>C<sub>16</sub>H<sub>33</sub>、又はエトキシで置換されていてもよいフェノキシであり；

R<sub>5</sub>が、H、-COOH又は-SO<sub>3</sub>Hであり；

R<sub>6</sub>が、H又はC<sub>1</sub>であり；

R<sub>7</sub>が、

( i ) H、

( i i ) ( C 1 7 ~ C 2 0 ) アルキル、

( i i i ) - C O O H、

( i v ) - N R 9 - C O R ' 9 [式中、R 9 は H であり、R ' 9 は、エポキシで置換されていてもよい ( C 1 1 ~ C 2 0 ) アルキル、- C O O H で置換されていてもよい ( C 1 6 ~ C 2 0 ) アルケニル、又は - S O 3 H 若しくは - N H - C O - C 1 7 H 3 5 で置換されていてもよいフェニルである]、及び

( v ) - S O 3 H で又は - N R 9 - C O R ' 9 で置換されていてもよいフェニル [式中、R 9 は H であり、R ' 9 は ( C 1 7 ~ C 2 0 ) アルキルである]

からなる群から選択され；

R 8 が、

( i ) H、

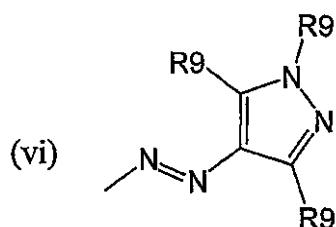
( i i ) B r、

( i i i ) イソプロピル、

( i v ) - O C 1 6 H 3 3、

( v ) 1 個又は複数のハロゲン、- O R ' 9 、- C O O R ' 9 、- S O 3 R ' 9 、- N R 9 R ' 9 又は - N R 9 C O R ' 9 で置換されていてもよいフェニル [式中、R 9 及び R ' 9 は、それぞれ独立に、H 又は - C 1 6 H 3 3 である]、

【化 1 4】



[式中、R 9 は、それぞれ独立に、H、メチル又はデセニルである]、及び

( v i i ) 1 個又は複数の C 1 、- O R ' 9 、- C O O R ' 9 、- S O 3 R ' 9 、- N H S O 2 R ' 9 、- N R 9 R ' 9 又は - N R 9 - C O - R ' 9 で置換されていてもよい - N = N - フェニル [式中、R 9 及び R ' 9 は、それぞれ独立に、H、メチル又はエチルであるか、R ' 9 はメチルで置換されたフェニルである]

からなる群から選択される。

式 I a 又は I ' a の化合物を含有する、請求項 2 に記載の医薬組成物。

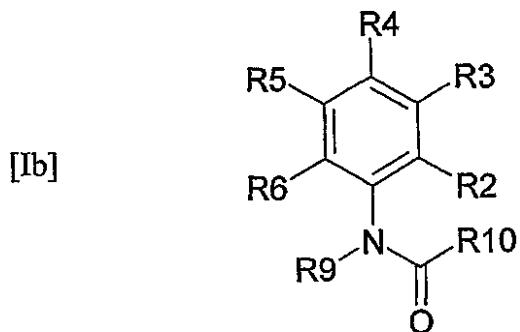
【請求項 4】

化合物 1、5 ~ 2 2 、2 4 ~ 3 0 、5 4 、5 6 、6 9 、7 1 、8 3 、8 4 、8 5 及び 1 0 0 と称される化合物の群から選択される式 I a の化合物、又は化合物 3 2 と称される式 I ' a の化合物を含有する、請求項 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

下記式 I b の化合物を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物：

【化15】



[式中、

 $\text{R}_2$  は、

(i) H、

(ii) ハロゲン

(iii) -OH、

(iv) -O(C<sub>1</sub>0～C<sub>2</sub>2)アルキル、

(v) -COOH、

(vi) -NR<sub>9</sub>R'<sub>9</sub> [式中、 $\text{R}_9$  及び  $\text{R}'_9$  は、それぞれ独立に H であるか、 $\text{R}_9$  が (C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>) アルキルであり、且つ  $\text{R}'_9$  が、H 又は (C<sub>1</sub>0～C<sub>2</sub>2) アルキルである]、及び(vii) 1 個又は複数の -COOH 又は -CO-NH<sub>2</sub> で置換されていてもよい -O(C<sub>6</sub>～C<sub>1</sub>4) アリール

からなる群から選択され；

 $\text{R}_3$  は、H 又は -COOH であり； $\text{R}_4$  は、

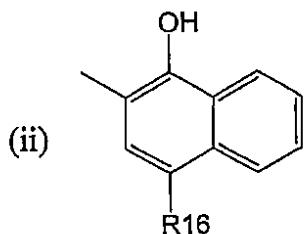
(i) H、

(ii) -SO<sub>3</sub>H、(iii) 1 個又は複数の COOH で置換されていてもよい -O(C<sub>6</sub>～C<sub>1</sub>4) アリール、(iv) 1 個又は複数の COOH で置換されていてもよい -S(C<sub>6</sub>～C<sub>1</sub>4) アリール、及び(v) -NR<sub>9</sub>-CO-R'<sub>9</sub> [式中、 $\text{R}_9$  及び  $\text{R}'_9$  は、それぞれ独立に、H 又は (C<sub>1</sub>0～C<sub>2</sub>2) アルキルである]

からなる群から選択され；

 $\text{R}_5$  は、H、-COOH、-SO<sub>3</sub>H、又は 1 個又は複数の -COOH で置換されていてもよい -NHSO<sub>2</sub>(C<sub>6</sub>～C<sub>1</sub>4) アリールであり； $\text{R}_6$  は H であり； $\text{R}_9$  は、H 又は (C<sub>1</sub>0～C<sub>2</sub>2) アルキルであり； $\text{R}_{10}$  は、(i) ハロゲン、OH、エポキシ及びエピチオからなる群から選択される 1 個又は複数の基で置換されていてもよい (C<sub>1</sub>0～C<sub>2</sub>2) アルキル、

【化 1 6】



[式中、R<sub>16</sub>は、H、ハロゲン、-COOH、-SO<sub>3</sub>H、フェニルで置換されていてもよい-S-テトラゾル-5-イル、又はハロゲン、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>6</sub>~C<sub>14</sub>)アリール、-OH、-COOH、-COOR'、-OR'及び-NHSO<sub>2</sub>R'からなる群から選択される1個又は複数の基で置換されていてもよい-N=N-(C<sub>6</sub>~C<sub>14</sub>)アリールである{式中、R'は、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキルであるか、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキルで置換されていてもよいフェニルである}]}、

( i i i ) - C H<sub>2</sub> - CO - R 17 [式中、R 17は、(C 10 ~ C 22)アルキルであるか、-O-(C 10 ~ C 22)アルキル又は-NH-CO-(C 10 ~ C 22)アルキルで置換されていてもよい(C 6 ~ C 14)アリール、又は-NH-NH-CO-(C 10 ~ C 22)アルキルである]、

( i v ) - NH - ( C 1 0 ~ C 2 2 ) アルキル、及び

( v ) オキソで置換されてもよい ( C 1 0 ~ C 2 2 ) アルケニルからなる群から選択され；

R 2、R 4、R 9 及び R 10 中で規定したいずれの「(C 10 ~ C 22)アルキル」も、直鎖又は分枝鎖でよく、O、S 及び N からなる群から選択される 1 個又は複数のヘテロ原子で割り込まれていてもよく、且つ / 又は、ハロゲン、(C 3 ~ C 7)シクロアルキル、好ましくはシクロプロピル、(C 6 ~ C 14)アリール、ニトロ、-OR'9、-SR'9、エポキシ、エピチオ、オキソ、-COR'9、-COOR'9、-OSO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>2</sub>R'9、-NHSO<sub>2</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>R'9、アジリジン、=N-OR'9、=N-NR<sub>9</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>-NR<sub>9</sub>R'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR<sub>9</sub>-COR'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-NR<sub>9</sub>R'9、-OPO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9、-PO<sub>2</sub>HR'9 及び -PO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9 からなる群から選択される 1 個又は複数の基で置換されていてもよい〔式中、R<sub>9</sub> は、H 又は (C 1 ~ C 32)アルキルであり、且つ、R<sub>9</sub> が、H、(C 1 ~ C 32)アルキル、-(C 2 ~ C 32)アルケニル及び -(C 6 ~ C 14)アリールからなる群から選択されるか、R<sub>9</sub> 及び R'9 が、基 -NR<sub>9</sub>R'9 の一部として、それらが結合している N 原子と一緒にになって、1 個又は複数の N、S 又は O 原子をさらに含んでいてもよい 3 ~ 7 員の飽和環を形成し、n は 0 又は 1 ~ 10 の整数である〕。

## 【請求項 6】

R 2 が、

( i ) H,

( j j ) \subseteq 1.

( i i i ) - O H ,

( i v ) - O C <sub>1</sub> <sub>8</sub> H <sub>3</sub> <sub>7</sub> ,

$$(v) - \text{COOH},$$

(v i) - N R 9 R' 9 [式中、R 9 は H 又はメチルであり、R' 9 は - C<sub>1-8</sub> H<sub>3-7</sub> である]、及び

(viii) 1個又は複数の -COOH 又は -CO-NH<sub>2</sub> で置換されていてもよいフェノキシ

からなる群から選択され；

R<sub>3</sub>が、H又は-COOHであり；

R 4 が、  
 (i) H、  
 (ii) - SO<sub>3</sub>H、  
 (iii) 1個又は複数の - COOH で置換されていてもよいフェノキシ、  
 (iv) 1個又は複数の - COOH で置換されていてもよいフェニルチオ、及び  
 (v) - N R<sub>9</sub> - CO - R'<sub>9</sub>、R<sub>9</sub> 及び R'<sub>9</sub> は、それぞれ独立に、H 又は - C<sub>1-7</sub>H<sub>3-5</sub> である

からなる群から選択され；

R 5 が、H、- COOH、- SO<sub>3</sub>H、1個又は複数の - COOH で置換されていてもよい - NH SO<sub>2</sub> - フェニルであり；

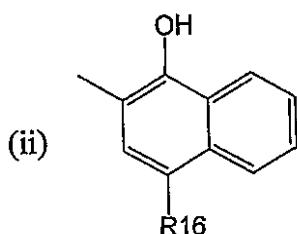
R 6 が H であり；

R 9 が、H 又は - C<sub>1-8</sub>H<sub>3-7</sub> であり；

R 10 が、

(i) Cl、OH、エポキシ及びエピチオからなる群から選択される 1 個又は複数の基で置換されていてもよい - C<sub>1-7</sub>H<sub>3-5</sub>、

【化 17】



[式中、R 16 は、H、Br、- COOH、- SO<sub>3</sub>H、フェニルで置換されてもよい - S - テトラゾル - 5 - イル、又は Cl、メチル、フェニル、- OH、- COOH、- CO OR'<sub>9</sub>、- OR'<sub>9</sub>、及び - NH SO<sub>2</sub>R'<sub>9</sub> からなる群から選択される 1 個又は複数の基で置換されていてもよい - N = N - フェニルである {式中、R'<sub>9</sub> はメチル又はメチルで置換されていてもよいフェニルである} ]、

(i) - CH<sub>2</sub> - CO - R 17 [式中、R 17 は、- C<sub>1-7</sub>H<sub>3-5</sub>、- C<sub>1-8</sub>H<sub>3-5</sub>、- OC<sub>1-8</sub>H<sub>3-7</sub> 又は - NH - CO - (C<sub>1-5</sub> ~ C<sub>2-0</sub>) アルキル、好ましくは - NH - CO - C<sub>1-7</sub>H<sub>3-5</sub> で置換されていてもよいフェニル、及び - NH - NH - CO - (C<sub>1-5</sub> ~ C<sub>2-0</sub>) アルキル、好ましくは - NH - NH - CO - C<sub>1-7</sub>H<sub>3-5</sub> からなる群から選択される、

(iv) - NH - C<sub>1-8</sub>H<sub>3-7</sub>、及び

(v) オキソで置換されていてもよい (C<sub>1-6</sub> ~ C<sub>2-0</sub>) アルケニル、好ましくは - C<sub>1-7</sub>H<sub>3-3</sub> 又は - C<sub>1-6</sub>H<sub>3-1</sub>

からなる群から選択される、式 I b の化合物を含有する、請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

(i) 化合物 61、87、92、93、95 及び 96 と称される化合物から選択される、R 10 が - C<sub>1-7</sub>H<sub>3-5</sub> である化合物、

(ii) 化合物 3、33、34、40、41、43、45、46、47、49、50、52、53、55、62、63 及び 77 と称される化合物の群から選択される、R 10 が 1 - ヒドロキシ - 4 - R 18 - 2 - ナフチルである化合物、

(iii) 化合物 2、23、44、51、60 及び 64 と称される化合物の群から選択される、R 10 が - CH<sub>2</sub> - CO - R 17 である化合物、

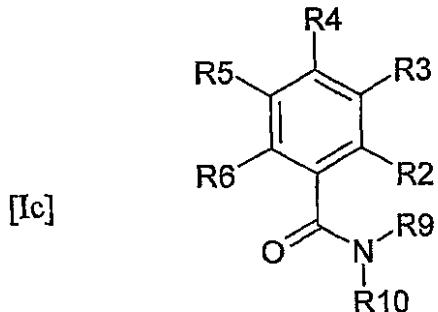
(iv) 化合物 70 と称される、R 10 が - NH - C<sub>1-8</sub>H<sub>3-7</sub> である化合物、又は

(v) 化合物 86 及び 94 と称される化合物の群から選択される、R 10 が (C<sub>1-10</sub> ~

C 22) アルケニルである化合物を含有する、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

式 Ic の化合物を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物：  
【化 18】



[式中、

R2、R3、R4、R5 及び R6 は、それぞれ独立に、水素、ハロゲン、ニトロ、(C1～C32)アルキル、(C2～C32)アルケニル、(C6～C14)アリール、ヘテロアリール、-OR9'、-SR9'、-NR9R'9、-(CH2)n-NR9-CO-R'9、-COR'9、-COOR'9、-(CH2)n-CO-N(R9)(R'9)、-SO3R'9、-SO2R'9、又は-NHSO2R'9を表すか；

R3 及び R4 は、それらが結合している炭素原子と一緒にになって縮合ベンゼン環を形成し；

R9 は、H 又は (C1～C32)アルキルであり、且つ R'9 は、H、(C1～C32)アルキル、(C2～C32)アルケニル又は (C6～C14)アリールであるか、R9 及び R'9 が、基 -NR9R'9 の一部として、それらが結合している N 原子と一緒にになって、1 個又は複数の N、S 又は O 原子をさらに含んでいてもよい 3～7 員の飽和環を形成し；

R10 は、

(i) (C10～C22)アルキル、又は  
(ii) -(CH2)n-NH-CO-R9-O-R'9 [式中、R9 は (C1～C6)アルキルであり、R'9 は、-C15H31 で置換された (C6～C14)アリールであり、n は 1～6 の整数である]

であり；

R2～R6 及び R9 中で規定した「(C1～C32)アルキル」及び「(C2～C32)アルケニル」並びに R10 中で規定した「(C10～C22)アルキル」は、直鎖又は分枝鎖でよく、O、S 及び N からなる群から選択される 1 個又は複数のヘテロ原子で割り込まれていてもよく、且つ / 又は、ハロゲン、(C3～C7)シクロアルキル、好ましくはシクロプロピル、(C6～C14)アリール、ニトロ、-OR'9、-SR'9、エポキシ、エピチオ、オキソ、-COR'9、-COOR'9、-OSO3R'9、-SO3R'9、-SO2R'9、-NHSO2R'9、-NR9R'9、アジリジン、=N-O-R'9、=N-NR9R'9、-NR9-NR9R'9、-(CH2)n-NR9-CO-R'9、-(CH2)n-CO-NR9R'9、-OPO3R9R'9、-PO2HR'9 及び -PO3R9R'9 からなる群から選択される 1 個又は複数の基で置換されていてもよく [式中、R9 は、H 又は (C1～C32)アルキルであり、且つ、R'9 が、H、(C1～C32)アルキル、(C2～C32)アルケニル及び (C6～C14)アリールからなる群から選択されるか、R9 及び R'9 が、基 -NR9R'9 の一部として、それらが結合している N 原子と一緒にになって、1 個又は複数の N、S 又は O 原子をさらに含んでいてもよい 3～7 員の飽和環を形成し、n は 0 又は 1～10 の整数である]、

R2～R6 及び R9 中で規定したいずれの「(C6～C14)アリール」も、ハロゲン

、(C6～C14)アリール、(C1～C32)アルキル、ニトロ、-OR'9、-SR'9、-COR'9、-COOR'9、-SO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>2</sub>R'9、-NH<sub>2</sub>、-NR<sub>9</sub>R'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR<sub>9</sub>-COR'9及び-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-NR<sub>9</sub>R'9からなる群から選択される1個又は複数の基で置換されていてもよい]。

【請求項9】

R<sub>2</sub>が、OHであり；

R<sub>3</sub>及びR<sub>4</sub>が、それらが結合している炭素原子と一緒にになって、縮合ベンゼン環を形成し；

R<sub>5</sub>が、H又は-SO<sub>3</sub>Hであり；

R<sub>6</sub>及びR<sub>9</sub>が、それぞれHであり；

R<sub>10</sub>が、

(i)-C<sub>1-8</sub>H<sub>3-7</sub>、又は、

(ii)-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NH-CO-R<sub>9</sub>-O-R'9〔式中、R<sub>9</sub>は-CH(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)であり、R'9は、-C<sub>1-5</sub>H<sub>3-1</sub>で置換されたフェニルであり、nは3である〕である、式Icの化合物を含有する、請求項8に記載の医薬組成物。

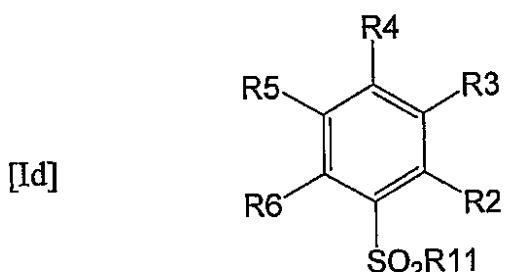
【請求項10】

明細書中で化合物31又は72と称される化合物を含有する、請求項9に記載の医薬組成物。

【請求項11】

下記式Idの化合物を含有する、請求項1に記載の医薬組成物：

【化19】

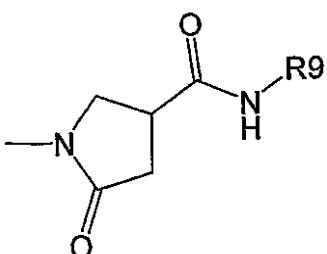


[式中、

R<sub>2</sub>はHであり；

R<sub>3</sub>は、H、-COOH、-NH<sub>2</sub>、又は

【化20】



[式中、R<sub>9</sub>は(C10～C22)アルキルである]であり；

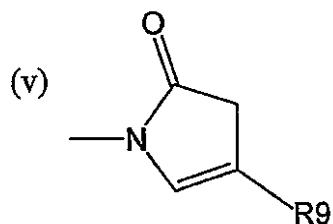
R<sub>4</sub>は、

(i)H、

(ii)-O-(C10～C22)アルキル、

(iii)-NH-(C10～C22)アルキル、

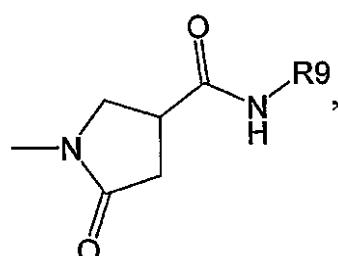
(i v) - S O<sub>2</sub> - (C 1 0 ~ C 2 2) アルキル、  
【化 2 1】



[式中、R 9 は (C 1 0 ~ C 2 2) アルキルである]、及び

(v i) - S O<sub>3</sub> H 又は

【化 2 2】



[式中、R 9 は (C 1 0 ~ C 2 2) アルキルである] で、或いはその双方で置換されてもよいフェノキシ

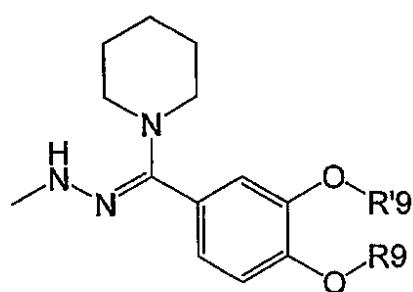
からなる群から選択され；

R 5 は、H、-C O O H、又は-N H<sub>2</sub> であり；

R 6 は、水素であるか、或いはハロゲン、-C O O H 又は-C O N H<sub>2</sub> で置換されてもよいフェノキシであり；

R 1 1 は、O H 又は

【化 2 3】



[式中、R 9 は、(C 1 0 ~ C 2 2) アルキルであり、R' 9 は (C 1 ~ C 6) アルキルである] であり；

ここで、R 4 及び R 9 中で規定したいすれの「(C 1 0 ~ C 2 2) アルキル」も、直鎖又は分枝鎖でよく、O、S 及び N からなる群から選択される 1 個又は複数のヘテロ原子で割り込まれていてもよく、且つ / 又は、ハロゲン、(C 3 ~ C 7) シクロアルキル、好ましくはシクロプロピル、(C 6 ~ C 1 4) アリール、ニトロ、-O R' 9、-S R' 9、エポキシ、エピチオ、オキソ、-C O R' 9、-C O O R' 9、-O S O<sub>3</sub> R' 9、-S O<sub>3</sub> R' 9、-S O<sub>2</sub> R' 9、-N H S O<sub>2</sub> R' 9、-N R 9 R' 9、アジリジン、=N-O R' 9、=N-N R 9 R' 9、-N R 9 -N R 9 R' 9、-(C H<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-N R 9 -

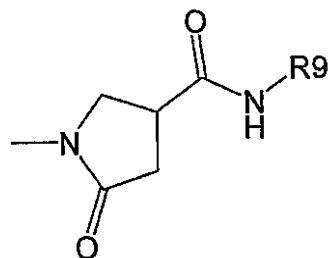
COR'9、- (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - CO - NR<sub>9</sub>R'9、- OPO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9、- PO<sub>2</sub>H<sub>R'9</sub>及び- PO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9からなる群から選択される1個又は複数の基で置換されていてもよい〔式中、R<sub>9</sub>は、H又は(C1~C32)アルキルであり、且つ、R'9が、H、(C1~C32)アルキル、(C2~C32)アルケニル及び(C6~C14)アリールからなる群から選択されるか、R<sub>9</sub>及びR'9が、基-NR<sub>9</sub>R'9の一部として、それらが結合しているN原子と一緒にになって、1個又は複数のN、S又はO原子をさらに含んでいてもよい3~7員の飽和環を形成し、nは0又は1~10の整数である〕〕。

## 【請求項12】

R<sub>2</sub>が、Hであり；

R<sub>3</sub>が、H、-COOH、-NH<sub>2</sub>、又は

## 【化24】

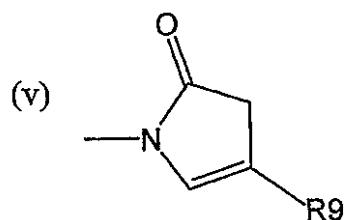


〔式中、R<sub>9</sub>は-C<sub>1~8</sub>H<sub>3~7</sub>である〕であり；

R<sub>4</sub>が、

## 【化25】

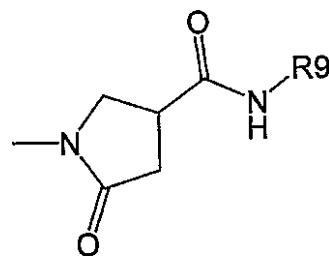
- (i) H;
- (ii) -O-C<sub>16</sub>H<sub>33</sub>;
- (iii) -NH-C<sub>19</sub>H<sub>39</sub>;
- (iv) -SO<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>H<sub>33</sub>;



〔式中、R<sub>9</sub>は-C<sub>1~5</sub>H<sub>3~1</sub>である〕、及び

(v) -SO<sub>3</sub>H又は

## 【化26】



〔式中、R<sub>9</sub>は-C<sub>1~8</sub>H<sub>3~7</sub>である〕で、或いはその双方で置換されていてもよいフェ

## ノキシ

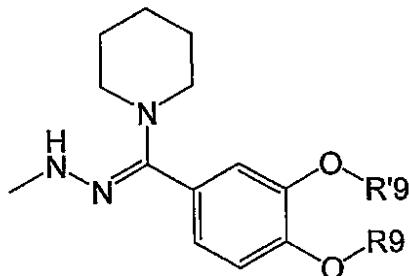
からなる群から選択され；

R 5 が、H、-COOH、又は-NH<sub>2</sub>であり、

R 6 が、Hであるか、或いはハロゲン、-COOH又は-COONH<sub>2</sub>で置換されていてもよいフェノキシであり；

R 11 が、OH又は

【化27】



[式中、R 9 は -C<sub>1~6</sub>H<sub>3~3</sub> であり、R' 9 はメチルである]である、式 I d の化合物を含有する、請求項 11 に記載の医薬組成物。

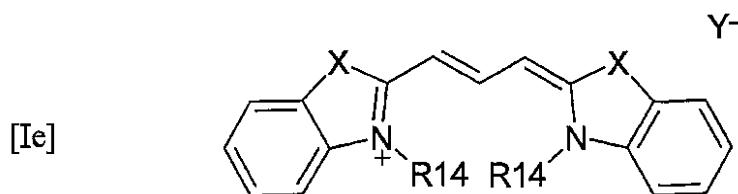
【請求項 13】

化合物 75、76、88、89、101、103、104、105、106 及び 107 と称される化合物から選択される化合物を含有する、請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

下記式 I e の化合物を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物：

【化28】



[式中、

X は、O 又は S であり；

R 14 は、(C 10 ~ C 22) アルキルであり；

Y<sup>-</sup> は、塩素イオン、臭素イオン、ヨウ素イオン、過塩素酸イオン、p-トルエンスルホン酸イオン、メタンスルホン酸イオン、硫酸イオン、リン酸イオン及び有機アニオンからなる群から選択される対イオンであり；

R 14 中で規定した「(C 10 ~ C 22) アルキル」は、直鎖又は分枝鎖でよく、O、S 及び N からなる群から選択される 1 個又は複数のヘテロ原子で割り込まれていてもよく、且つ／又は、ハロゲン、(C 3 ~ C 7) シクロアルキル、好ましくはシクロプロピル、(C 6 ~ C 14) アリール、ニトロ、-OR' 9、-SR' 9、エポキシ、エピチオ、オキソ、-COR' 9、-COOR' 9、-OSO<sub>3</sub>R' 9、-SO<sub>3</sub>R' 9、-SO<sub>2</sub>R' 9、-NHSO<sub>2</sub>R' 9、-NR<sub>9</sub>R' 9、アジリジン、=N-OR' 9、=N-NR<sub>9</sub>R' 9、-NR<sub>9</sub>-NR<sub>9</sub>R' 9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR<sub>9</sub>-COR' 9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-NR<sub>9</sub>R' 9、-OPO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R' 9、-PO<sub>2</sub>HR' 9 及び -PO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R' 9 からなる群から選択される 1 個又は複数の基で置換されていてもよい〔式中、R 9 は、H 又は (C 1 ~ C 3 2) アルキルであり、且つ、R' 9 が、H、(C 1 ~ C 3 2) アルキル、(C 2 ~ C 3 2) アルケニル及び (C 6 ~ C 14) アリールからなる群から選択

されるか、R<sub>9</sub>及びR'<sub>9</sub>が、基-NR<sub>9</sub>R'<sub>9</sub>の一部として、それらが結合しているN原子と一緒にになって、1個又は複数のN、S又はO原子をさらに含んでいてもよい3~7員の飽和環を形成し、nは0又は1~10の整数である]】。

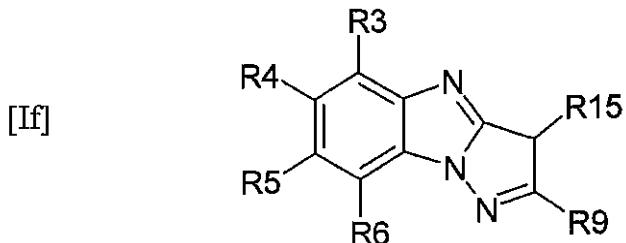
【請求項15】

XがO又はSであり、R<sub>14</sub>が-C<sub>1~8</sub>H<sub>3~7</sub>であり、Y<sup>-</sup>が過塩素酸イオンである、式Ieの化合物であって、化合物66又は67と称される化合物を含有する、請求項14に記載の医薬組成物。

【請求項16】

下記式Ifの化合物を含有する、請求項1に記載の医薬組成物：

【化29】



[式中、

R<sub>3</sub>及びR<sub>5</sub>は、それぞれHであり；

R<sub>4</sub>は、H、-COOH又は-SO<sub>3</sub>Hであり；

R<sub>6</sub>は、H又は-COOHであり；

R<sub>9</sub>は、H又は(C<sub>1~10</sub>~C<sub>2~22</sub>)アルキルであり；

R<sub>15</sub>は、H又は-SO<sub>3</sub>Hであり；

R<sub>9</sub>中で規定した「(C<sub>1~10</sub>~C<sub>2~22</sub>)アルキル」は、直鎖又は分枝鎖でよく、O、S及びNからなる群から選択される1個又は複数のヘテロ原子で割り込まれていてもよく、且つ/又は、ハロゲン、(C<sub>3~C7</sub>)シクロアルキル、好ましくはシクロプロピル、(C<sub>6~C14</sub>)アリール、ニトロ、-OR'<sub>9</sub>、-SR'<sub>9</sub>、エポキシ、エピチオ、オキソ、-COR'<sub>9</sub>、-COOR'<sub>9</sub>、-OSO<sub>3</sub>R'<sub>9</sub>、-SO<sub>3</sub>R'<sub>9</sub>、-SO<sub>2</sub>R'<sub>9</sub>、-NHSO<sub>2</sub>R'<sub>9</sub>、-NR<sub>9</sub>R'<sub>9</sub>、アジリジン、=N-OR'<sub>9</sub>、=N-NR<sub>9</sub>R'<sub>9</sub>、-NR<sub>9</sub>-NR<sub>9</sub>R'<sub>9</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR<sub>9</sub>-COR'<sub>9</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-NR<sub>9</sub>R'<sub>9</sub>、-OPO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'<sub>9</sub>、-PO<sub>2</sub>HR'<sub>9</sub>及び-PO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'<sub>9</sub>からなる群から選択される1個又は複数の基で置換されてもよい〔式中、R<sub>9</sub>は、H又は(C<sub>1~C32</sub>)アルキルであり、且つ、R'<sub>9</sub>が、H、(C<sub>1~C32</sub>)アルキル、(C<sub>2~C32</sub>)アルケニル及び(C<sub>6~C14</sub>)アリールからなる群から選択されるか、R<sub>9</sub>及びR'<sub>9</sub>が、基-NR<sub>9</sub>R'<sub>9</sub>の一部として、それらが結合しているN原子と一緒にになって、1個又は複数のN、S又はO原子をさらに含んでいてもよい3~7員の飽和環を形成し、nは0又は1~10の整数である〕】。

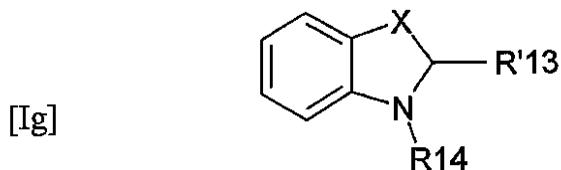
【請求項17】

化合物4、35及び36と称される化合物など、R<sub>3</sub>及びR<sub>5</sub>が、Hであり、R<sub>6</sub>が、H又は-COOHであり、R<sub>4</sub>が、H、COOH又は-SO<sub>3</sub>Hであり、R<sub>9</sub>が、H又は-C<sub>1~7</sub>H<sub>3~5</sub>であり、R<sub>15</sub>が、H又は-SO<sub>3</sub>Hである、式Ifの化合物を含有する、請求項16に記載の医薬組成物。

【請求項18】

下記式Igの化合物を含有する、請求項1に記載の医薬組成物：

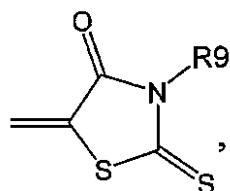
## 【化30】



[式中、

Xは、NR<sub>12</sub>又はCR'12R"12であり；R<sub>12</sub>は(C<sub>10</sub>～C<sub>22</sub>)アルキルであり；R'12及びR"12は、それぞれ、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキルであるか、R'12及びR"12は一緒になって、基

## 【化31】

[式中、R<sub>9</sub>は、Hであるか、-COOHで置換された(C<sub>10</sub>～C<sub>22</sub>)アルキルである]であり；R'13は、=O、=NH及び=N-NH-SO<sub>2</sub>- (C<sub>6</sub>～C<sub>14</sub>)アリール、{式中、アリールは、-COOH及び-O- (C<sub>10</sub>～C<sub>22</sub>)アルキル、又は-NH-SO<sub>2</sub>-フェニル(式中、フェニルは、-COOH及び-O- (C<sub>10</sub>～C<sub>22</sub>)アルキルで置換されている)のいずれかで置換されている}からなる群から選択され；R<sub>14</sub>は、(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>)アルキルであるか、1個若しくは複数の(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルコキシで置換された-CH<sub>2</sub>-CH(OH)- (C<sub>6</sub>～C<sub>14</sub>)アリールであり；

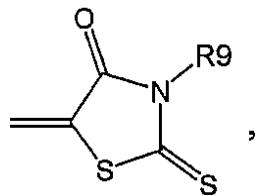
R<sub>12</sub>及びR'13中で規定したいずれの「(C<sub>10</sub>～C<sub>22</sub>)アルキル」も、直鎖又は分枝鎖でよく、O、S及びNからなる群から選択される1個又は複数のヘテロ原子で割り込まれていてもよく、且つ/又は、ハロゲン、(C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>)シクロアルキル、好ましくはシクロプロピル、(C<sub>6</sub>～C<sub>14</sub>)アリール、ニトロ、-OR'9、-SR'9、エポキシ、エピチオ、オキソ、-COR'9、-COOR'9、-OSO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>2</sub>R'9、-NHSO<sub>2</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>R'9、アジリジン、=N-OR'9、=N-NR<sub>9</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>-NR<sub>9</sub>R'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR<sub>9</sub>-COR'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-NR<sub>9</sub>R'9、-OPO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9、-PO<sub>2</sub>HR'9及び-PO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9からなる群から選択される1個又は複数の基で置換されてもよい〔式中、R<sub>9</sub>は、H又は(C<sub>1</sub>～C<sub>32</sub>)アルキルであり、且つ、R'9が、H、(C<sub>1</sub>～C<sub>32</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub>～C<sub>32</sub>)アルケニル及び(C<sub>6</sub>～C<sub>14</sub>)アリールからなる群から選択されるか、R<sub>9</sub>及びR'9が、基-NR<sub>9</sub>R'9の一部として、それらが結合しているN原子と一緒にになって、1個又は複数のN、S又はO原子をさらに含んでいてもよい3～7員の飽和環を形成し、nは0又は1～10の整数である〕]。

## 【請求項19】

Xが、NR<sub>12</sub>又はCR'12R"12であり；R<sub>12</sub>が、-C<sub>16</sub>H<sub>33</sub>であり；

R'12及びR"12が、それぞれメチルであるか、R'12及びR"12が一緒になって基

## 【化32】



[式中、R9は、H又は- $C_{10}H_{20}$ - $COOH$ である]であり；

R'13が、=O、=NH又は=N-NH-SO<sub>2</sub>-フェニル[式中、フェニルは、- $COOH$ 及び- $OC_{18}H_{37}$ 、又は-NH-SO<sub>2</sub>-フェニル{式中、フェニルは、- $COOH$ 及び- $OC_{18}H_{37}$ で置換されている}のいずれかで置換されている]であり；

R14が、メチル又はエチルであるか、1個又は複数のメトキシ基で置換された- $CH_2-CH(OH)-$ フェニルである、式Igの化合物を含有する、請求項18に記載の医薬組成物。

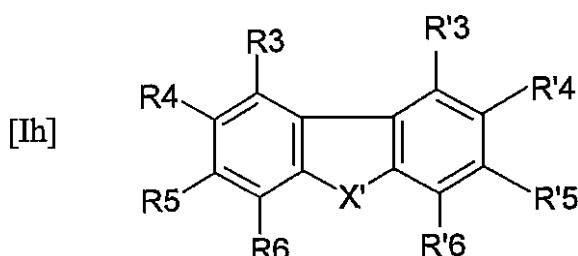
## 【請求項20】

明細書中で化合物48、59、65及び82と称される化合物から選択される化合物を含有する、請求項19に記載の医薬組成物。

## 【請求項21】

下記式Ihの化合物を含有する、請求項1に記載の医薬組成物：

## 【化33】



[式中、

X'は、O又はNR14であり；

R3、R4、R5、R'3及びR'5は、それぞれH又はハロゲンであり；

R'4は、H、ハロゲン又は(C10~C22)アルケニルであり；

R6及びR'6は、それぞれ、H又は-COOHであり；

R14は、1個又は複数のN原子で割り込まれ、且つヒドロキシで置換された(C10~C22)アルキルであり；

R'4中で規定した「(C10~C22)アルケニル」は、直鎖又は分枝鎖でよく、O、S及びNからなる群から選択される1個又は複数のヘテロ原子で割り込まれていてもよく、且つ/又は、ハロゲン、(C3~C7)シクロアルキル、好ましくはシクロプロピル、(C6~C14)アリール、ニトロ、-OR'9、-SR'9、エポキシ、エピチオ、オキソ、-COR'9、-COOR'9、-OSO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>2</sub>R'9、-NH<sub>2</sub>R'9、-NHSO<sub>2</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>R'9、アジリジン、=N-OR'9、=N-NR<sub>9</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>-NR<sub>9</sub>R'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR<sub>9</sub>-COR'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-NR<sub>9</sub>R'9、-OP<sub>2</sub>O<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9、-PO<sub>2</sub>HR'9及び-PO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9からなる群から選択される1個又は複数の基で置換されていてもよい[式中、R9は、H又は(C1~C32)アルキルであり、且つ、R'9が、H、(C1~C32)アルキル、(C2~C32)アルケニル及び(C6~C14)アリールからなる群から選

択されるか、R<sub>9</sub>及びR'<sub>9</sub>が、基-NR<sub>9</sub>R'<sub>9</sub>の一部として、それらが結合しているN原子と一緒にになって、1個又は複数のN、S又はO原子をさらに含んでいてもよい3~7員の飽和環を形成し、nは0又は1~10の整数である]]。

【請求項22】

X'が、O又はNR<sub>1~4</sub>であり；  
 R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R'<sub>3</sub>及びR'<sub>5</sub>が、それぞれH、C<sub>1</sub>又はBrであり；  
 R'<sub>4</sub>が、H、C<sub>1</sub>、Br及び-C<sub>2~0</sub>H<sub>3~9</sub>からなる群から選択され；  
 R<sub>6</sub>及びR'<sub>6</sub>が、それぞれ、-H又は-COOHであり；  
 R<sub>1~4</sub>が、C<sub>1~0</sub>H<sub>2~1</sub>-NH-CH<sub>2</sub>-CH(OH)-CH<sub>2</sub>-又はC<sub>1~8</sub>H<sub>3~7</sub>-NH-CH<sub>2</sub>-CH(OH)-CH<sub>2</sub>-である、式Ihの化合物を含有する、請求項21に記載の医薬組成物。

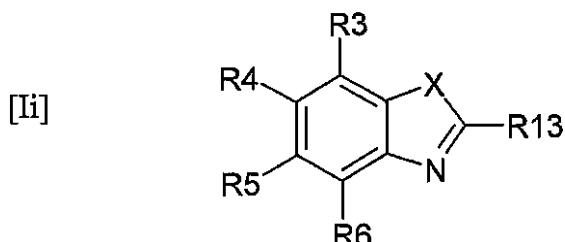
【請求項23】

化合物68、90及び91と称される化合物から選択される化合物を含有する、請求項22に記載の医薬組成物。

【請求項24】

下記式Iiの化合物を含有する、請求項1に記載の医薬組成物：

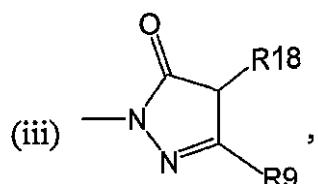
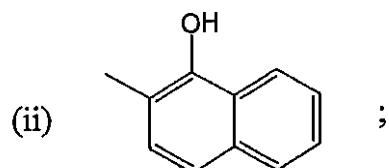
【化34】



[式中、

Xは、O、S又はNR<sub>1~2</sub>であり；  
 R<sub>4</sub>は、H又は-SO<sub>3</sub>Hであり；  
 R<sub>6</sub>は、Hであり；  
 R<sub>3</sub>は、H又は-COOHであり；  
 R<sub>5</sub>は、H、-COOH又は-SO<sub>3</sub>Hであり；  
 R<sub>1~2</sub>は、H又は(C<sub>1~0</sub>~C<sub>2~2</sub>)アルキルであり；  
 R<sub>1~3</sub>は、  
 (i) (C<sub>1~6</sub>)アルキル、

【化35】

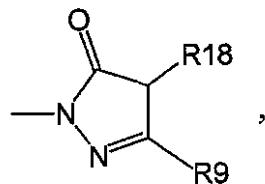


[式中、R<sub>9</sub>は、(C<sub>1~0</sub>~C<sub>2~2</sub>)アルキルであり、R<sub>1~8</sub>は、H又は=N-(C<sub>6~</sub>

C 14) アリール { 式中、アリールは、-NR<sub>9</sub>R' <sub>9</sub>、(式中、R<sub>9</sub>及びR' <sub>9</sub>は、それぞれ(C 1 ~ C 6)アルキルである)で置換されていてもよい}であり；

(i v)

【化36】



で置換されていてもよい(C 6 ~ C 14)アリール [式中、R<sub>9</sub>は、(C 10 ~ C 22)アルキルであり、R<sub>18</sub>は、=N-(C 6 ~ C 14)アリール {式中アリールは-NR<sub>9</sub>R' <sub>9</sub>(式中、R<sub>9</sub>及びR' <sub>9</sub>は、それぞれ(C 1 ~ C 6)アルキルである)で置換されていてもよい}である]、及び；

(v) 1個又は複数のハロゲン及び-OH、又は1個又は複数の-OH及びニトロで置換された-N=CH-(C 6 ~ C 14)アリール

からなる群から選択され、

R 12及びR 13中で規定した「(C 10 ~ C 22)アルキル」は、直鎖又は分枝鎖でよく、O、S及びNからなる群から選択される1個又は複数のヘテロ原子で割り込まれていてもよく、且つ/又は、ハロゲン、(C 3 ~ C 7)シクロアルキル、好ましくはシクロプロピル、(C 6 ~ C 14)アリール、ニトロ、-OR' <sub>9</sub>、-SR' <sub>9</sub>、エポキシ、エピチオ、オキソ、-COR' <sub>9</sub>、-COOR' <sub>9</sub>、-OSO<sub>3</sub>R' <sub>9</sub>、-SO<sub>3</sub>R' <sub>9</sub>、-SO<sub>2</sub>R' <sub>9</sub>、-NH<sub>2</sub>、-NR<sub>9</sub>R' <sub>9</sub>、-NR<sub>9</sub>-NR<sub>9</sub>R' <sub>9</sub>、-NR<sub>9</sub>-COR' <sub>9</sub>、-NR<sub>9</sub>-CO-NR<sub>9</sub>R' <sub>9</sub>、-OPO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R' <sub>9</sub>、-PO<sub>2</sub>HR' <sub>9</sub>及び-PO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R' <sub>9</sub>からなる群から選択される1個又は複数の基で置換されていてもよい[式中、R<sub>9</sub>は、H又は(C 1 ~ C 3 2)アルキルであり、且つ、R' <sub>9</sub>が、H、(C 1 ~ C 3 2)アルキル、(C 2 ~ C 3 2)アルケニル及び(C 6 ~ C 14)アリールからなる群から選択されるか、R<sub>9</sub>及びR' <sub>9</sub>が、基-NR<sub>9</sub>R' <sub>9</sub>の一部として、それらが結合しているN原子と一緒にになって、1個又は複数のN、S又はO原子をさらに含んでいてもよい3 ~ 7員の飽和環を形成し、nは0又は1 ~ 10の整数である]】。

【請求項25】

Xが、O、S又はNR<sub>12</sub>であり；

R<sub>4</sub>が、H又は-SO<sub>3</sub>Hであり；

R<sub>6</sub>が、Hであり；

R<sub>3</sub>が、H又は-COOHであり；

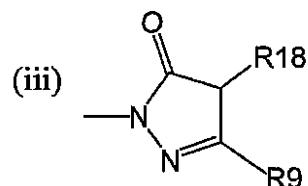
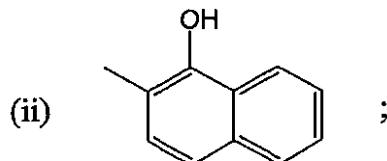
R<sub>5</sub>が、H、-COOH又は-SO<sub>3</sub>Hであり；

R<sub>12</sub>が、H、-C<sub>16</sub>H<sub>33</sub>又は-C<sub>18</sub>H<sub>37</sub>であり；

R<sub>13</sub>が、

(i)メチル、

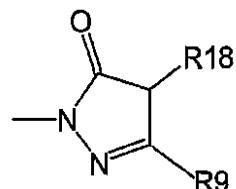
## 【化37】



[式中、R9は、-C<sub>17</sub>H<sub>35</sub>であり、R18は、H又は=N-フェニル{式中、フェニルは-NR<sub>9</sub>R'9(式中、R9及びR'9は、それぞれエチルである)で置換されていてもよい}である]、

(iv)

## 【化38】



で置換されていてもよいフェニル[式中、R9は、-C<sub>17</sub>H<sub>35</sub>であり、R18は、=N-フェニル{式中、フェニルは-NR<sub>9</sub>R'9(式中、R9及びR'9は、それぞれエチルである)で置換されていてもよい}である]、及び

(v) -OH及び1個又は複数のC1又はBrで置換されていてもよい-N=CH-フェニル、或いは-OH若しくはニトロ、又はその双方で置換されていてもよいナフチル

からなる群から選択される、式Iiの化合物を含有する、請求項24に記載の医薬組成物。

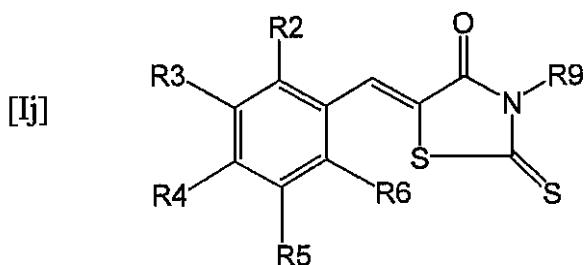
## 【請求項26】

明細書中で化合物37、38、39、42、57、58、73及び102と称される化合物から選択される化合物を含有する、請求項25に記載の医薬組成物。

## 【請求項27】

下記式Ijの化合物を含有する、請求項1に記載の医薬組成物：

## 【化39】



[式中、

R<sub>2</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>及びR<sub>6</sub>は、それぞれHであり；

R<sub>3</sub>は、H又はハロゲンであり；

R<sub>9</sub>は、Hであるか、-COOHで置換された(C<sub>10</sub>~C<sub>22</sub>)アルキルである]。

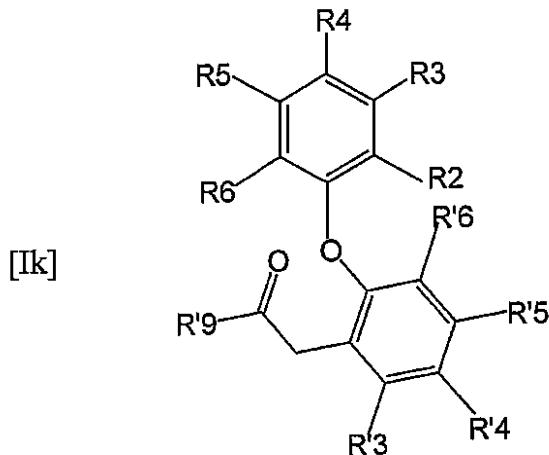
【請求項28】

化合物81と称される化合物などの、R<sub>2</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>及びR<sub>6</sub>が、それぞれHであり、R<sub>3</sub>が、H又はBrであり、R<sub>9</sub>が、H又は-C<sub>10</sub>H<sub>20</sub>-COOHである式Ijの化合物を含有する、請求項27に記載の医薬組成物。

【請求項29】

下記式Ikの化合物を含有する、請求項1に記載の医薬組成物：

【化40】



[式中、

R<sub>2</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>6</sub>、R'3、R'5及びR'6は、それぞれ、Hであり；

R<sub>3</sub>、R<sub>5</sub>及びR'4は、それぞれ、H又は-COOHであり；

R'9は、OH及び-CF<sub>3</sub>で置換されていてもよい(C<sub>10</sub>~C<sub>22</sub>)アルケニルであり；

R'9中で規定した「(C<sub>10</sub>~C<sub>22</sub>)アルケニル」は、直鎖又は分枝鎖でよく、O、S及びNからなる群から選択される1個又は複数のヘテロ原子で割り込まれていてもよく、且つ又は、ハロゲン、(C<sub>3</sub>~C<sub>7</sub>)シクロアルキル、好ましくはシクロプロピル、(C<sub>6</sub>~C<sub>14</sub>)アリール、ニトロ、-OR'9、-SR'9、エポキシ、エピチオ、オキソ、-COR'9、-COOR'9、-OSO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>2</sub>R'9、-NH<sub>2</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>R'9、アジリジン、=N-OR'9、=N-NR<sub>9</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>-NR<sub>9</sub>R'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR<sub>9</sub>-COR'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-NR<sub>9</sub>R'9、-OPO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9、-PO<sub>2</sub>HR'9及び-PO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9からなる群から選択される1個又は複数の基で置換されていてもよい[式中、R<sub>9</sub>は、H又は(C<sub>1</sub>~C<sub>32</sub>)アルキルであり、且つ、R'9が、H、(C<sub>1</sub>~C<sub>32</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub>~C<sub>32</sub>)アルケニル及び(C<sub>6</sub>~C<sub>14</sub>)アリールからなる群から選択されるか、R<sub>9</sub>及びR'9が、基-NR<sub>9</sub>R'9の一部として、それらが結合しているN原子と一緒にになって、1個又は複数のN、S又はO原子をさらに含んでいてもよい3~7員の飽和環を形成し、nは0又は1~10の整数である]。]

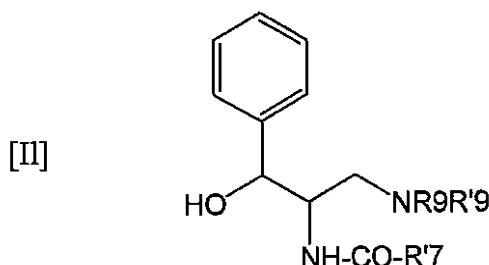
【請求項30】

化合物98と称される化合物など、R<sub>2</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>6</sub>、R'3、R'5及びR'6が、それぞれHであり、R<sub>3</sub>、R<sub>5</sub>及びR'4が、それぞれ-COOHであり、R'9が、OH及び-CF<sub>3</sub>で置換されていてもよいC<sub>17</sub>H<sub>31</sub>である式Ikの化合物を含有する、請求項29に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 1】

下記式 I 1 の化合物を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物：

## 【化 4 1】



[式中、

R'7 は、(C10 ~ C22)アルキルであり；

R9 及び R'9 は、それらが結合している N 原子と一緒にになって、さらなる O、N 又は S 原子を含んでいてもよい 3 ~ 7 員の飽和環を形成し；

R'7 中で規定したいすれの「(C10 ~ C22)アルキル」も、直鎖又は分枝鎖でよく、O、S 及び N からなる群から選択される 1 個又は複数のヘテロ原子で割り込まれてもよく、且つ又は、ハロゲン、(C3 ~ C7)シクロアルキル、好ましくはシクロプロピル、(C6 ~ C14)アリール、ニトロ、-OR'9、-SR'9、エポキシ、エピチオ、オキソ、-COR'9、COOR'9、-OSO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>2</sub>R'9、-NH<sub>2</sub>、-NHSO<sub>2</sub>R'9、-NR9R'9、アジリジン、=N-OR'9、=N-NR9R'9、-NR9-NR9R'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR9-COR'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-NR9R'9、-OPO<sub>3</sub>R9R'9、-PO<sub>2</sub>HR'9 及び -PO<sub>3</sub>R9R'9 からなる群から選択される 1 個又は複数の基で置換されていてもよい〔式中、R9 は、H 又は (C1 ~ C32)アルキルであり、且つ、R'9 が、H、(C1 ~ C32)アルキル、(C2 ~ C32)アルケニル及び (C6 ~ C14)アリールからなる群から選択されるか、R9 及び R'9 が、基-NR9R'9 の一部として、それらが結合している N 原子と一緒にになって、1 個又は複数の N、S 又は O 原子をさらに含んでいてもよい 3 ~ 7 員の飽和環を形成し、n は 0 又は 1 ~ 10 の整数である〕]。

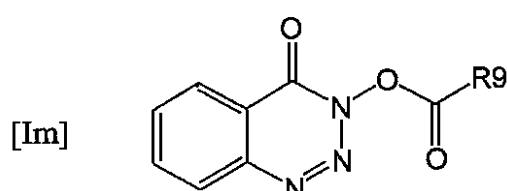
## 【請求項 3 2】

化合物 7 4 と称される化合物など、R'7 が (C10 ~ C22)アルキルであり、R9 及び R'9 が、それらが結合している N 原子と一緒にになってモルホリン環を形成する式 I 1 の化合物を含む、請求項 3 1 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 3】

下記式 I m の化合物を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物：

## 【化 4 2】



[式中、

R9 は、(C10 ~ C22)アルキルであるか、O、S 及び N からなる群から選択される 1 個又は複数のヘテロ原子で割り込まれた (C10 ~ C22)アルキルであるか、ハロゲン、(C3 ~ C7)シクロアルキル、好ましくはシクロプロピル、(C6 ~ C14)ア

リール、ニトロ、-OR'9、-SR'9、エポキシ、エピチオ、オキソ、-COR'9、-COOR'9、-OSO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>2</sub>R'9、-NHSO<sub>2</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>R'9、アジリジン、=N-OR'9、=N-NR<sub>9</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>-NR<sub>9</sub>R'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR<sub>9</sub>-COR'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-NR<sub>9</sub>R'9、-OPO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9、-PO<sub>2</sub>HR'9及び-PO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9からなる群から選択される1個又は複数の基で置換された、又は割り込まれ且つ置換された(C10~C22)アルキルである〔式中、R<sub>9</sub>は、H又は(C1~C32)アルキルであり、且つ、R'9が、H、(C1~C32)アルキル、(C2~C32)アルケニル及び(C6~C14)アリールからなる群から選択されるか、R<sub>9</sub>及びR'9が、基-NR<sub>9</sub>R'9の一部として、それらが結合しているN原子と一緒にになって、1個又は複数のN、S又はO原子をさらに含んでいてもよい3~7員の飽和環を形成し、nは0又は1~10の整数である〕]。

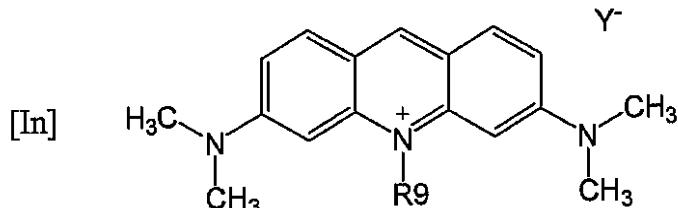
【請求項34】

化合物99と称される化合物など、R<sub>9</sub>がエポキシで置換されていてもよい-C<sub>1~7</sub>H<sub>3~3</sub>である式Imの化合物を含有する、請求項33に記載の医薬組成物。

【請求項35】

下記式Inの化合物を含有する、請求項1に記載の医薬組成物：

【化43】



〔式中、

R<sub>9</sub>は、(C10~C22)アルキルであり；

Y<sup>-</sup>は、塩素イオン、臭素イオン、ヨウ素イオン、過塩素酸イオン、p-トルエンスルホン酸イオン、メタンスルホン酸イオン、硫酸イオン、リン酸イオン及び有機アニオンからなる群から選択される対イオンであり；

R<sub>9</sub>中で規定した「(C10~C22)アルキル」は、直鎖又は分枝鎖でよく、O、S及びNからなる群から選択される1個又は複数のヘテロ原子で割り込まれていてもよく、且つ/又は、ハロゲン、(C3~C7)シクロアルキル、好ましくはシクロプロピル、(C6~C14)アリール、ニトロ、-OR'9、-SR'9、エポキシ、エピチオ、オキソ、-COR'9、-COOR'9、-OSO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>2</sub>R'9、-NHSO<sub>2</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>R'9、アジリジン、=N-OR'9、=N-NR<sub>9</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>-NR<sub>9</sub>R'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR<sub>9</sub>-COR'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-NR<sub>9</sub>R'9、-OPO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9、-PO<sub>2</sub>HR'9及び-PO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9からなる群から選択される1個又は複数の基で置換されていてもよい〔式中、R<sub>9</sub>は、H又は-(C1~C32)アルキルであり、且つ、R'9が、H、(C1~C32)アルキル、(C2~C32)アルケニル及び(C6~C14)アリールからなる群から選択されるか、R<sub>9</sub>及びR'9が、基-NR<sub>9</sub>R'9の一部として、それらが結合しているN原子と一緒にになって、1個又は複数のN、S又はO原子をさらに含んでいてもよい3~7員の飽和環を形成し、nは0又は1~10の整数である〕]。

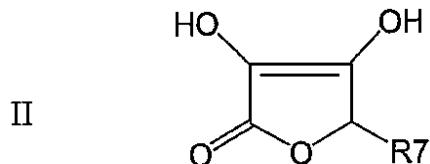
【請求項36】

R<sub>9</sub>が-C<sub>1~8</sub>H<sub>3~7</sub>であり、Y<sup>-</sup>が臭素イオンである、化合物79と称される化合物を含有する、請求項35に記載の医薬組成物。

【請求項37】

下記一般式IIの化合物を含有する、請求項1に記載の医薬組成物：

【化44】



[式中、

R7は、-CH(OH)-CH<sub>2</sub>-O-CO-R9であり、R9は、(C10~C22)アルキルであり；

R9中で規定した「(C10~C22)アルキル」は、直鎖又は分枝鎖でよく、O、S及びNからなる群から選択される1個又は複数のヘテロ原子で割り込まれていてもよく、且つ又は、ハロゲン、(C3~C7)シクロアルキル、好ましくはシクロプロピル、(C6~C14)アリール、ニトロ、-OR'9、-SR'9、エポキシ、エピチオ、オキソ、-COR'9、-COOR'9、-OSO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>2</sub>R'9、-NHSO<sub>2</sub>R'9、-NR9R'9、アジリジン、=N-OR'9、=N-NR9R'9、-NR9-NR9R'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR9-COR'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-NR9R'9、-OPO<sub>3</sub>R9R'9、-PO<sub>2</sub>HR'9及び-PO<sub>3</sub>R9R'9からなる群から選択される1個又は複数の基で置換されてもよい〔式中、R9は、H又は(C1~C32)アルキルであり、且つ、R'9が、H、(C1~C32)アルキル、(C2~C32)アルケニル及び(C6~C14)アリールからなる群から選択されるか、R9及びR'9が、基-NR9R'9の一部として、それらが結合しているN原子と一緒にになって、1個又は複数のN、S又はO原子をさらに含んでいてもよい3~7員の飽和環を形成し、nは0又は1~10の整数である〕]。

【請求項38】

R7が-CH(OH)-CH<sub>2</sub>-O-CO-R9であり、且つR9が-C<sub>1~5</sub>H<sub>3~1</sub>である、明細書中で化合物78と称される化合物を含有する、請求項37に記載の医薬組成物。

【請求項39】

下記一般式IIIの化合物を含有する、請求項1に記載の医薬組成物：

【化45】



[式中、

R'7は、(C10~C22)アルキルであり；

Y-は、塩素イオン、臭素イオン、ヨウ素イオン、過塩素酸イオン、p-トルエンスルホン酸イオン、メタンスルホン酸イオン、硫酸イオン、リン酸イオン及び有機アニオンからなる群から選択される対イオンであり；

R'7中で規定した「(C10~C22)アルキル」は、直鎖又は分枝鎖でよく、O、S及びNからなる群から選択される1個又は複数のヘテロ原子で割り込まれていてもよく、且つ又は、ハロゲン、(C3~C7)シクロアルキル、好ましくはシクロプロピル、(C6~C14)アリール、ニトロ、-OR'9、-SR'9、エポキシ、エピチオ、オ

キソ、-COR'9、-COOR'9、-OSO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>2</sub>R'9、-NHSO<sub>2</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>R'9、アジリジン、=N-OR'9、=N-NR<sub>9</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>-NR<sub>9</sub>R'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR<sub>9</sub>-COR'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-NR<sub>9</sub>R'9、-OPO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9、-PO<sub>2</sub>HR'9及び-PO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9からなる群から選択される1個又は複数の基で置換されていてもよい〔式中、R<sub>9</sub>は、H又は(C1~C32)アルキルであり、且つ、R'9が、H、(C1~C32)アルキル、(C2~C32)アルケニル及び(C6~C14)アリールからなる群から選択されるか、R<sub>9</sub>及びR'9が、基-NR<sub>9</sub>R'9の一部として、それらが結合しているN原子と一緒にになって、1個又は複数のN、S又はO原子をさらに含んでいてもよい3~7員の飽和環を形成し、nは0又は1~10の整数である〕]。

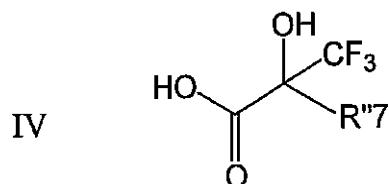
## 【請求項40】

R'7が-C<sub>1~6</sub>H<sub>3~3</sub>であり、Y<sup>-</sup>が臭素イオンである、明細書中で化合物80と称される化合物を含有する、請求項39に記載の医薬組成物。

## 【請求項41】

下記一般式IVの化合物を含有する、請求項1に記載の医薬組成物：

## 【化46】



## 〔式中、

R''7は、直鎖又は分枝鎖でよく、O、S及びNからなる群から選択される1個又は複数のヘテロ原子で割り込まれていてもよく、且つ/又は、ハロゲン、(C3~C7)シクロアルキル、好ましくはシクロプロピル、(C6~C14)アリール、ニトロ、-OR'9、-SR'9、エポキシ、エピチオ、オキソ、-COR'9、-COOR'9、-OSO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>3</sub>R'9、-SO<sub>2</sub>R'9、-NHSO<sub>2</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>R'9、アジリジン、=N-OR'9、=N-NR<sub>9</sub>R'9、-NR<sub>9</sub>-NR<sub>9</sub>R'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NR<sub>9</sub>-COR'9、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-CO-NR<sub>9</sub>R'9、-OPO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9、-PO<sub>2</sub>HR'9及び-PO<sub>3</sub>R<sub>9</sub>R'9からなる群から選択される1個又は複数の基で置換されていてもよい(C2~C32)アルケニルである〔式中、R<sub>9</sub>は、H又は(C1~C32)アルキルであり、且つ、R'9が、H、(C1~C32)アルキル、(C2~C32)アルケニル及び(C6~C14)アリールからなる群から選択されるか、R<sub>9</sub>及びR'9が、基-NR<sub>9</sub>R'9の一部として、それらが結合しているN原子と一緒にになって、1個又は複数のN、S又はO原子をさらに含んでいてもよい3~7員の飽和環を形成し、nは0又は1~10の整数である〕]。

## 【請求項42】

R''7が-C<sub>1~6</sub>H<sub>3~1</sub>である、明細書中で化合物97と称される化合物を含有する、請求項41に記載の医薬組成物。

## 【請求項43】

新脈管形成を抑制するための、請求項1から42のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項44】

あらゆるタイプの白血病(例えば、急性リンパ性白血病(ALL)、急性骨髓性白血病(AML)、慢性リンパ性白血病(CLL)、慢性骨髓性白血病(CML)、骨髓異形成症候群(MDS)、肥満細胞性白血病、毛様細胞性白血病、ホジキン病、非ホジキンリンパ腫、バーキットリンパ腫及び多発性骨髓腫)等の造血系悪性腫瘍などの非固形癌、又は唇及び口腔、咽頭、喉頭、鼻腔洞、大唾液腺、甲状腺、食道、胃、小腸、結腸、結腸直腸

、肛門管、肝臓、胆嚢、肝外胆管、ファーテー膨大部、外分泌腺、肺における腫瘍、胸膜中皮腫、骨、柔組織肉腫、皮膚、胸部、外陰部、膣、子宮頸部、子宮体、卵巣、卵管、妊娠栄養膜腫瘍、陰茎、前立腺、精巣、腎臓、腎孟、尿管、膀胱、尿道の癌腫及び悪性黒色腫、眼瞼の癌腫、結膜の癌腫、結膜の悪性黒色腫、ブドウ膜の悪性黒色腫、網膜芽腫、涙腺の癌腫、眼窩、脳、脊髄、脈管系の肉腫、血管肉腫及びカポジ肉腫などの固形腫瘍などの悪性細胞増殖性疾患又は障害を治療又は抑制するための、或いは腫瘍形成、初期腫瘍、腫瘍進行又は腫瘍転移を治療又は抑制するための、請求項1から42のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項45】

糖尿病性網膜症及び黄斑変性、特に加齢性黄斑変性などの眼障害を治療するための；乾癬、肥厚性瘢痕、挫瘍及び硬化症／硬皮症などの細胞増殖性疾患又は障害を抑制又は治療するための；ポリープ、多発性外骨症、遺伝性外骨症、水晶体後線維増殖症、血管腫、胃潰瘍の再灌流及び動静脈奇形から選択される疾患又は障害を抑制又は治療するための；避妊のための、又は妊娠の初期段階における流産を誘発するための；免疫及び／又は炎症の抑制が有益である任意の疾患、状態又は障害における炎症症状を治療又は改善するための；関節、筋骨格及び結合組織の障害における炎症症状を治療又は改善するための；過敏症、アレルギー反応、喘息、アテローム性動脈硬化症、耳炎及びその他の耳鼻咽喉科疾患、皮膚炎及びその他の皮膚疾患、後部及び前部ブドウ膜炎、結膜炎、視神経炎、強膜炎及びその他の免疫及び／又は炎症性眼疾患に伴う炎症症状を治療又は改善するための；イートン-ランバート症候群、グッドパスチャー症候群、グレーヴズ病、ギラン-バレー症候群、自己免疫性溶血性貧血（AIHA）、肝炎、インスリン依存性糖尿病（IDDM）、全身性紅斑性狼瘡（SLE）、多発性硬化症（MS）、重症筋無力症、神経叢障害、例えば、急性腕神経叢炎、多腺性欠乏症候群、原発性胆汁性肝硬変、慢性関節リウマチ、硬皮症、血小板減少症、甲状腺炎、例えば橋本病、シェーグレン症候群、アレルギー性紫斑病、乾癬、混合性結合組織病、多発性筋炎、皮膚筋炎、脈管炎、結節性動脈周囲炎、リウマチ性多発性筋痛、ベーゲナー肉芽腫症、ライター症候群、ベーチェット症候群、強直性脊椎炎、天疱瘡、水疱性天疱瘡、疱疹上皮膚炎、クローン病又は自閉症などの自己免疫疾患を治療又は改善するための、請求項1から42のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項46】

明細書中で化合物12、18、27、37、48、50、61～63、70、71、75、77、83～87、90～96及び98～107と称される化合物の群から選択される化合物。