

【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 6 1 K | 31/136 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/415 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/196 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/4188 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/4152 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/4155 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/166 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/18 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/428 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/4184 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/194 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/404 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/24 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/423 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/403 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/17 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/4453 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/341 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/435 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/4425 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/426 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/427 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/336 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/192 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/343 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/201 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/53 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/4015 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 231/38 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 417/10 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 209/40 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 209/88 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 231/52 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 235/08 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 207/38 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 303/46 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 307/91 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 331/02 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 405/12 | (2006.01) |
| C 0 7 D | 207/277 | (2006.01) |
| A 6 1 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】

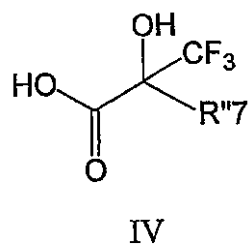
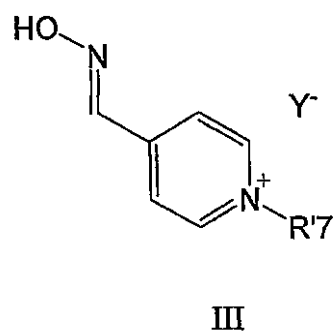
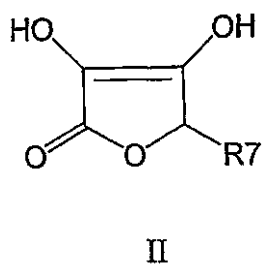
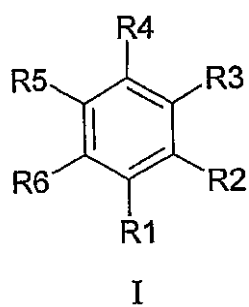
【特許請求の範囲】

【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種のヘパラーゼ阻害剤とを含有する医薬組成物

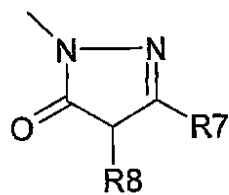
：

【化 1】

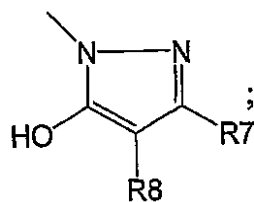


[式中、
R 1 は、
(i)

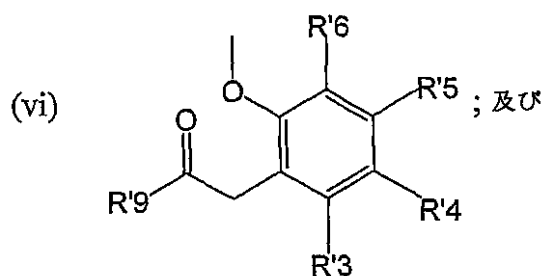
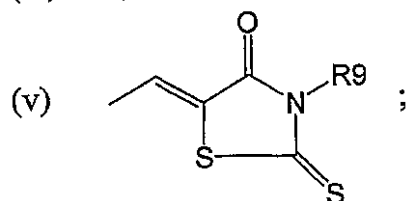
【化 2】



又はその互変異性体
【化 3】



【化 4】

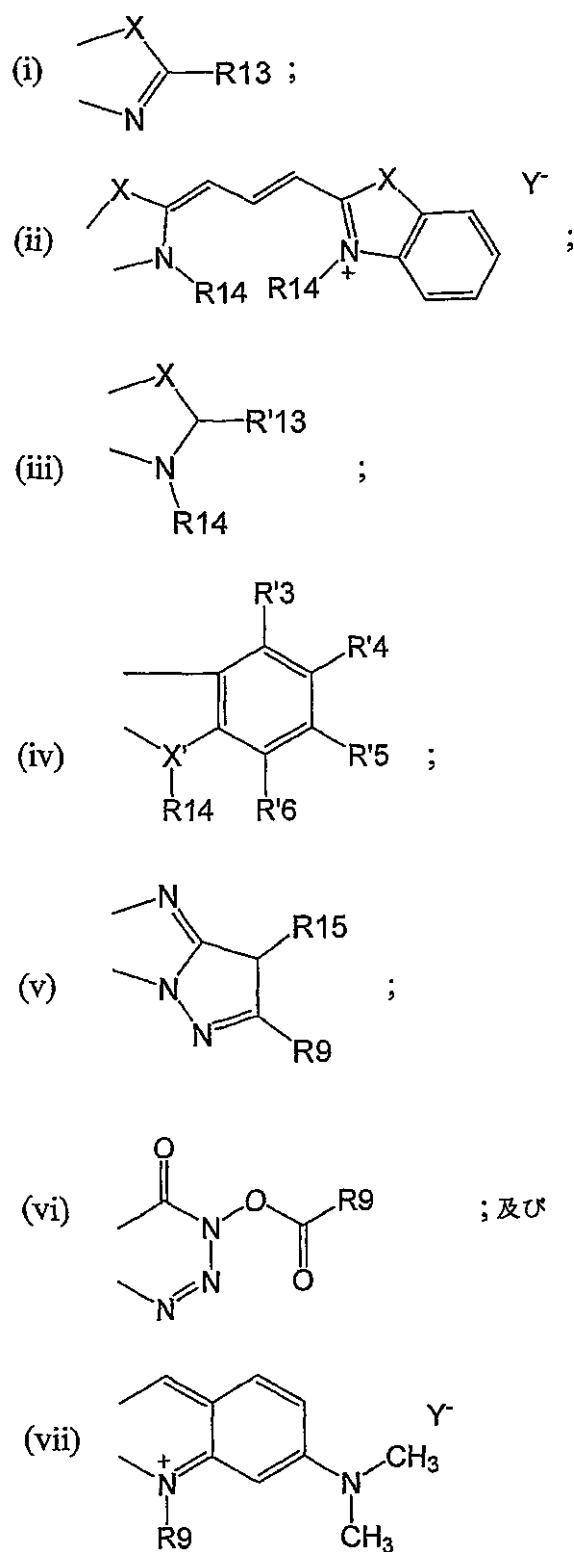
(ii) $-N(R_9)-CO(R_{10})$;(iii) $-CO-N(R_9)(R_{10})$;(iv) $-SO_2R_{11}$;(vii) $-CH(OH)-CH(NH-CO-R'_7)-CH_2NR_9R'_9$

からなる群から選択され；

R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 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、 $(C_1 \sim C_{32})$ アルキル、 $(C_2 \sim C_{32})$ アルケニル、 $(C_6 \sim C_{14})$ アリール、ヘテロアリール、 $-OR'_9$ 、 $-SR'_9$ 、 $-NR_9R'_9$ 、 $-(CH_2)_n-NR_9-COR'_9$ 、 $-COR'_9$ 、 $-COOR'_9$ 、 $-(CH_2)_n-CO-N(R_9)(R'_9)$ 、 $-SO_3R'_9$ 、 $-SO_2R'_9$ 、又は $-NH-SO_2R'_9$ であるか；

R_1 及び R_2 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；

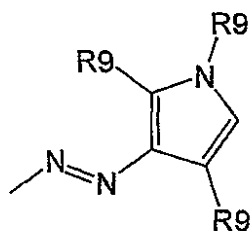
R² + R³、R³ + R⁴、R⁴ + R⁵又はR⁵ + R⁶のそれぞれの対は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、5又は6員の芳香族環を形成し；

R⁷は、H、ハロゲン、(C¹ ~ C³)アルキル、(C² ~ C³)アルケニル、(

C 6 ~ C 1 4) アリール、ヘテロアリール、- O R ' 9、- S R ' 9、- N R 9 R ' 9、
 - N R 9 - C O R ' 9、- C O R ' 9、- C O O R ' 9、- C H (O H) - (C H 2) n
 - O - C O - R 9、- (C H 2) n - N R 9 - C O R ' 9、- (C H 2) n - C O N (R
 9) (R ' 9)、- S O 3 R ' 9、- S O 2 R ' 9、- N H S O 2 R ' 9、- N = N - (

C 6 ~ C 1 4) アリール、及び

【化 6】



からなる群から選択され；

R ' 7 は、(C 1 ~ C 3 2) アルキルであり；

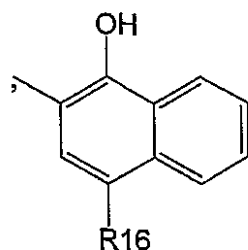
R " 7 は、(C 2 ~ C 3 2) アルケニルであり；

R 8 は、R 7 について定義した通りであり；

R 9 は、H 又は (C 1 ~ C 3 2) アルキルであり、且つ R ' 9 は、H、(C 1 ~ C 3 2)
 アルキル、(C 2 ~ C 3 2) アルケニル又は (C 6 ~ C 1 4) アリールであるか、R 9
 及び R ' 9 は、基 - N R 9 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
 なって、1 個又は複数の N、S 又は O 原子をさらに含んでもよい 3 ~ 7 員の飽和環を形
 成し；

R 1 0 は、(C 1 ~ C 3 2) アルキル、(C 2 ~ C 3 2) アルケニル、- (C H 2) n
 - C O - R 1 7、- (C H 2) n - N H - C O - R 9 - O - R ' 9、及び

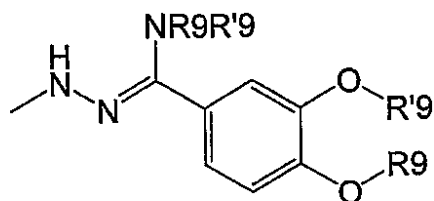
【化 7】



からなる群から選択され；

R 1 1 は、O H 又は

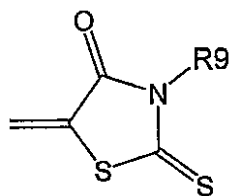
【化 8】



であり；

R 1 2、R ' 1 2 及び R " 1 2 は、それぞれ、H 又は (C 1 ~ C 3 2) アルキルである
 か、R ' 1 2 及び R " 1 2 は一緒になって基

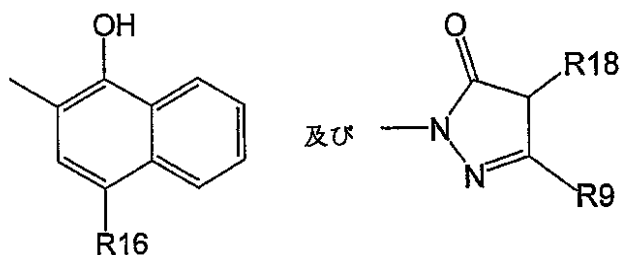
【化 9】



であり；

R 1 3 は、(C 1 ~ C 3 2) アルキル、(C 6 ~ C 1 4) アリール、- N = C H - (C 6 ~ C 1 4) アリール、

【化 1 0】



からなる群から選択され；

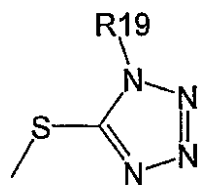
R ' 1 3 は、= O、= N H 又は = N - N H - S O ₂ R ' 9 であり；

R 1 4 は、H、(C 1 ~ C 3 2) アルキル、- (C H ₂) _m - C H (O H) - C H ₂ - N R 9 R ' 9 又は - (C H ₂) _m - C H (O H) - (C 6 ~ C 1 4) アリールであり；

R 1 5 は、H 又は - S O ₃ H であり；

R 1 6 は、H、ハロゲン、- C O O H、- S O ₃ H、- N = N - (C 6 ~ C 1 4) アリール及び

【化 1 1】



からなる群から選択され；

R 1 7 は、(C 1 ~ C 3 2) アルキル、(C 6 ~ C 1 4) アリール、- N H - N H - C O - (C 1 ~ C 3 2) アルキル、- N H - N H - C O - (C 6 ~ C 1 4) アリール、- (C H ₂) _n - N H - C O - C (R 9) - O (C 1 ~ C 3 2) アルキル、- (C H ₂) _n - N H - C O - C (R 9) - O (C 6 ~ C 1 4) アリール、- (C H ₂) _n - C O - (C 1 ~ C 3 2) アルキル、及び - (C H ₂) _n - C O - (C 6 ~ C 1 4) アリールからなる群から選択され；

R 1 8 は、H 又は = N - (C 6 ~ C 1 4) アリールであり；

R 1 9 は、(C 6 ~ C 1 4) アリールであり；

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；

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「(C1 ~ C32) アルキル」又は「(C2 ~ C32) 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、(C3 ~ C7) シクロアルキル、(C6 ~ C14) アリール、ニトロ、OR'9、SR'9、エボキシ、エピチオ、オキシ、-COR'9、-COOR'9、-OSO₃R'9、-SO₃R'9、-SO₂R'9、-NH₂SO₂R'9、-NR₉R'9、アジリジン、=N-OR'9、=N-NR₉R'9、-NR₉-NR₉R'9、-(CH₂)_n-NR₉-COR'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；

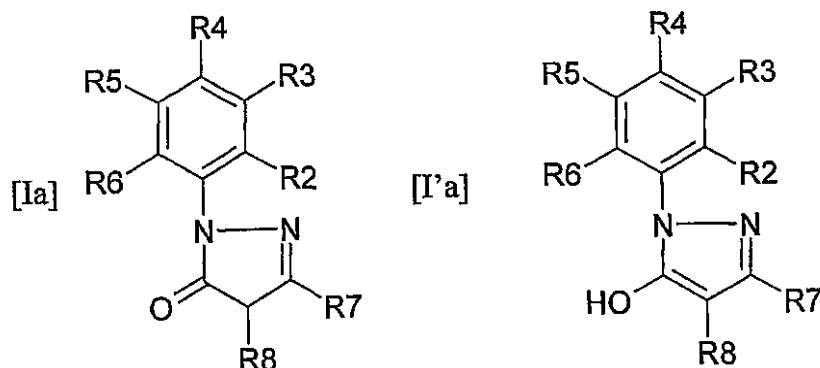
「ヘテロアリール」は、O、S 及び N からなる群から選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含む単環又は多環ヘテロ芳香族環から誘導される基を意味し；

いずれの「アリール」又は「ヘテロアリール」も、ハロゲン、(C6 ~ C14) アリール、(C1 ~ C32) アルキル、ニトロ、-OR'9、-SR'9、-COR'9、-COOR'9、-OSO₃R'9、-SO₃R'9、-SO₂R'9、-NH₂SO₂R'9、-NR₉R'9、-(CH₂)_n-NR₉-COR'9 及び -(CH₂)_n-CO-NR₉R'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 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、

R2 は、H、ハロゲン、-NH₂ 又は -SO₃H であり；

R3 は、H 又は -SO₃H であり；

R4 は、H、ハロゲン、-SO₃H、-SO₂-(C10 ~ C22) アルキル 又は -O(C6 ~ C14) アリール [式中、アリールは非置換であるか、-O(C1 ~ C8) 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、

(ii) (C10 ~ C22) アルキル、

(iii) -COOH、

(iv) -NR₉-COR'9 [式中、R₉ は H であり、R'9 は、エボキシで置換されていてもよい (C10 ~ C22) アルキル、-COOH で置換されていてもよい (C10 ~ C22) アルケニル、又は -SO₃H 若しくは -NH-CO(C10 ~ C22) アルキルで置換されていてもよい (C6 ~ C14) アリールである]、及び

(v) -SO₃H 又は -NR₉-COR'9 で置換されていてもよい (C6 ~ C14

) アリール〔式中、 R_9 はHであり、 R'_9 は(C10～C22)アルキルである〕
 からなる群から選択され；

R_8 は、

(i) H、

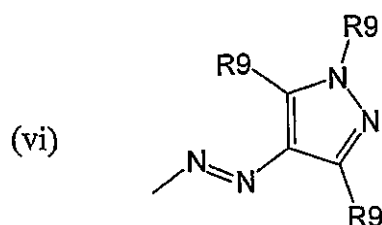
(ii) ハロゲン、

(iii) (C2～C6)アルキル、

(iv) -O(C10～C22)アルキル、

(v) 1個又は複数のハロゲン、-OR'₉、-COOR'₉、-SO₃R'₉、-NR₉R'₉又は-NR₉COR'₉で置換されていてもよい(C6～C14)アリール〔式中、 R_9 及び R'_9 は、それぞれ独立に、H又は(C10～C22)アルキルである〕

【化13】



〔式中、 R_9 は、それぞれ独立に、H又は(C1～C12)アルキルである〕、及び

(vii) 1個又は複数のハロゲン、-OR'₉、-COOR'₉、-SO₃R'₉、-NH₂SO₂R'₉、-NR₉R'₉又は-NR₉-CO-R'₉で置換されていてもよい-N=N-(C6～C14)アリール〔式中、 R_9 及び R'_9 は、それぞれ独立に、H又は(C1～C6)アルキルであるか、 R'_9 が、メチルで置換された(C6～C14)アリールである〕

からなる群から選択され；

R_4 、 R_7 及び R_8 中で規定したいずれの「(C10～C22)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、(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、-NH₂SO₂R'₉、-NR₉R'₉、アジリジン、=N-OR'₉、=N-NR₉R'₉、-NR₉-NR₉R'₉、-(CH₂)_n-NR₉-COR'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い〔この関係において式中の R_9 は、H又は(C1～C32)アルキルであり、 R'_9 が、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、 R_9 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原子と一緒にあって、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_2 が、H、Cl、-NH₂、又は-SO₃Hであり；

R_3 が、H又は-SO₃Hであり；

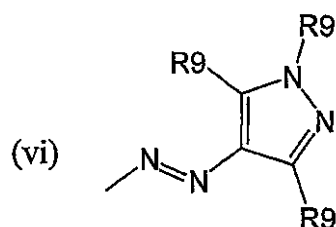
R_4 が、H、Cl、-SO₃H、-SO₂C₁₆H₃₃、又はエトキシで置換されていてもよいフェノキシであり；

R_5 が、H、-COOH又は-SO₃Hであり；

R_6 が、H又はClであり；

R_7 が、

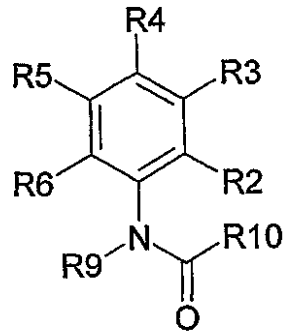
(i) H、
 (i i) (C 1 7 ~ C 2 0) アルキル、
 (i i i) - C O O H、
 (i v) - N R 9 - C O R ' 9 [式中、R 9 は H であり、R ' 9 は、エポキシで置換されていてもよい (C 1 1 ~ C 2 0) アルキル、- C O O H で置換されていてもよい (C 1 6 ~ C 2 0) アルケニル、又は - S O ₃ H 若しくは - N H - C O - C _{1 7} H _{3 5} で置換されていてもよいフェニルである]、及び
 (v) - S O ₃ H 又は - N R 9 - C O R ' 9 で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

[Ib]



[式中、

R 2 は、

(i) H、

(i i) ハロゲン

(i i i) - O H、

(i v) - O (C 1 0 ~ C 2 2) アルキル、

(v) - C O O H、

(v i) - N R 9 R ' 9 [式中、 R 9 及び R ' 9 は、それぞれ独立に H であるか、 R 9 が (C 1 ~ C 6) アルキルであり、且つ R ' が、 H 又は (C 1 0 ~ C 2 2) アルキルである]、及び

(v i i) 1 個又は複数の - C O O H 又は - C O - N H 2 で置換されていてよい - O (C 6 ~ C 1 4) アリール

からなる群から選択され；

R 3 は、 H 又は - C O O H であり；

R 4 は、

(i) H、

(i i) - S O 3 H、

(i i i) 1 個又は複数の C O O H で置換されていてよい - O (C 6 ~ C 1 4) アリール、

(i v) 1 個又は複数の C O O H で置換されていてよい - S (C 6 ~ C 1 4) アリール、及び

(v) - N R 9 - C O - R ' 9 [式中、 R 9 及び R ' 9 は、それぞれ独立に、 H 又は (C 1 0 ~ C 2 2) アルキルである]

からなる群から選択され；

R 5 は、 H、 - C O O H、 - S O 3 H、又は 1 個又は複数の - C O O H で置換されていてよい - N H S O 2 (C 6 ~ C 1 4) アリールであり；

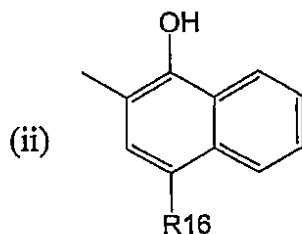
R 6 は H であり；

R 9 は、 H 又は (C 1 0 ~ C 2 2) アルキルであり；

R 1 0 は、

(i) ハロゲン、 O H、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よい (C 1 0 ~ C 2 2) アルキル、

【化 16】



〔式中、R 16 は、H、ハロゲン、-COOH、-SO₃H、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 1 ~ C 6)アルキル、(C 6 ~ C 14)アリール、-OH、-COOH、-COOR' 9、-OR' 9 及び-NHSO₂R' 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-N=N-(C 6 ~ C 14)アリールである〔式中、R' 9 は、(C 1 ~ C 6)アルキルであるか、(C 1 ~ C 6)アルキルで置換されていてもよいフェニルである〕〕、

(iii) -CH₂-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〕、

(iv) -NH-(C 10 ~ C 22)アルキル、及び

(v) オキソで置換されていてもよい(C 10 ~ C 22)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、-OSO₃R' 9、-SO₃R' 9、-SO₂R' 9、-NHSO₂R' 9、-NR₉R' 9、アジリジン、=N-OR' 9、=N-NR₉R' 9、-NR₉-NR₉R' 9、-(CH₂)_n-NR₉-COR' 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い〔式中、R 9 は、H 又は (C 1 ~ C 32)アルキルであり、且つ、R' 9 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 9 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、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、

(ii) Cl、

(iii) -OH、

(iv) -OC₁₈H₃₇、

(v) -COOH、

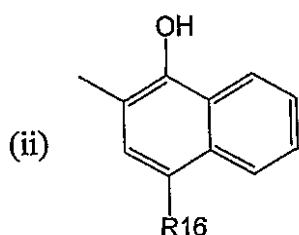
(vi) -NR₉R' 9〔式中、R 9 は H 又はメチルであり、R' 9 は -C₁₈H₃₇ である〕、及び

(vii) 1 個又は複数の -COOH 又は -CO-NH₂ 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 3 が、H 又は -COOH であり；

R 4 が、
 (i) H、
 (i i) - S O ₃ H、
 (i i i) 1 個又は複数の - C O O H で置換されていてもよいフェノキシ、
 (i v) 1 個又は複数の - C O O H で置換されていてもよいフェニルチオ、及び
 (v) - N R ₉ - C O - R ' ₉、R ₉ 及び R ' ₉ は、それぞれ独立に、H 又は - C ₁₋₇ H ₃₋₅ である
 からなる群から選択され；
 R 5 が、H、- C O O H、- S O ₃ H、1 個又は複数の - C O O H で置換されていてもよい - N H S O ₂ - フェニルであり；
 R 6 が H であり；
 R 9 が、H 又は - C ₁₋₈ H ₃₋₇ であり；
 R 10 が、
 (i) C 1、O H、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 ₁₋₇ H ₃₋₅、
 【化 17】



〔式中、R 16 は、H、Br、- C O O H、- S O ₃ 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 C 1、メチル、フェニル、- O H、- C O O H、- C O O R ' ₉、- O R ' ₉、及び - N H S O ₂ 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 - N = N - フェニルである〔式中、R ' ₉ 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 i i) - C H ₂ - C O - R 17〔式中、R 17 は、- C ₁₋₇ H ₃₋₅、- C ₁₋₈ H ₃₋₅、- O C ₁₋₈ H ₃₋₇ 又は - N H - C O - (C 15 ~ C 20) アルキル、好ましくは - 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、及び - N H - N H - C O - (C 15 ~ C 20) アルキル、好ましくは - N H - N H - C O - C ₁₋₇ H ₃₋₅ からなる群から選択される、

(i v) - N H - C ₁₋₈ H ₃₋₇、及び

(v) オキソで置換されていてもよい (C 16 ~ C 20) アルケニル、好ましくは - C ₁₋₇ H ₃₋₃ 又は - C ₁₋₆ H ₃₋₁

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 ₁₋₇ H ₃₋₅ である化合物、

(i i) 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、

(i i i) 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 - C H ₂ - C O - R 17 である化合物、

(i v) 化合物 70 と称される、R 10 が - N H - C ₁₋₈ H ₃₋₇ である化合物、又は

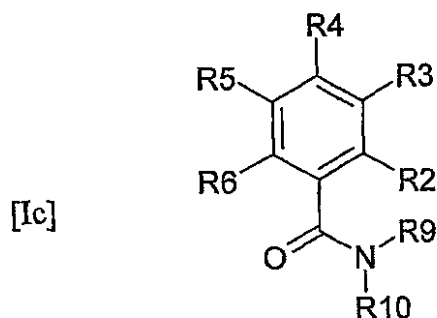
(v) 化合物 86 及び 94 と称される化合物の群から選択される、R 10 が (C 10 ~

C 2 2) 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 I c の化合物を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物：

【化 1 8】



[式中、

R 2、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 1 ~ C 3 2) アルキル、(C 2 ~ C 3 2) アルケニル、(C 6 ~ C 1 4) アリール、ヘテロアリール、- O R ' 9、- S R ' 9、- N R 9 R ' 9、- (C H 2) n - N R 9 - C O R ' 9、- C O R ' 9、- C O O R ' 9、- (C H 2) n - C O - N (R 9) (R ' 9)、- S O 3 R ' 9、- S O 2 R ' 9、又は - N H S O 2 R ' 9 を表すか；

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

R 9 は、H 又は (C 1 ~ C 3 2) アルキルであり、且つ R ' 9 は、H、(C 1 ~ C 3 2) アルキル、(C 2 ~ C 3 2) アルケニル又は (C 6 ~ C 1 4) アリールであるか、R 9 及び R ' 9 が、基 - N R 9 R ' 9 の一部として、それらが結合している N 原子と一緒になって、1 個又は複数の N、S 又は O 原子をさらに含んでもよい 3 ~ 7 員の飽和環を形成し；

R 1 0 は、

(i) (C 1 0 ~ C 2 2) アルキル、又は

(i i) - (C H 2) n - N H - C O - R 9 - O - R ' 9 [式中、R 9 は (C 1 ~ C 6) アルキルであり、R ' 9 は、- C 1 5 H 3 1 で置換された (C 6 ~ C 1 4) アリールであり、n は 1 ~ 6 の整数である]

であり；

R 2 ~ R 6 及び R 9 中で規定した「(C 1 ~ C 3 2) アルキル」及び「(C 2 ~ C 3 2) アルケニル」並びに R 1 0 中で規定した「(C 1 0 ~ C 2 2) 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 1 4) アリール、ニトロ、- O R ' 9、- S R ' 9、エボキシ、エピチオ、オキソ、- C O R ' 9、- C O O R ' 9、- O S O 3 R ' 9、- S O 3 R ' 9、- S O 2 R ' 9、- N H S O 2 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 2) n - N R 9 - C O R ' 9、- (C H 2) n - C O - N R 9 R ' 9、- O P O 3 R 9 R ' 9、- P O 2 H R ' 9 及び - P O 3 R 9 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 [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 1 4) アリールからなる群から選択されるか、R 9 及び R ' 9 が、基 - N R 9 R ' 9 の一部として、それらが結合している N 原子と一緒になって、1 個又は複数の N、S 又は O 原子をさらに含んでもよい 3 ~ 7 員の飽和環を形成し、n は 0 又は 1 ~ 1 0 の整数である]、

R 2 ~ R 6 及び R 9 中で規定したいずれの「(C 6 ~ C 1 4) 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、-SO₃R'₉、-SO₂R'₉、-NH₂SO₂R'₉、-NR₉R'₉、-(CH₂)_n-NR₉-COR'₉及び-(CH₂)_n-CO-NR₉R'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】

R₂が、OHであり；

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

R₅が、H又は-SO₃Hであり；

R₆及びR₉が、それぞれHであり；

R₁₀が、

(i) -C₁₈H₃₇、又は、

(ii) -(CH₂)_n-NH-CO-R₉-O-R'₉〔式中、R₉は-CH(C₂H₅)であり、R'₉は、-C₁₅H₃₁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。

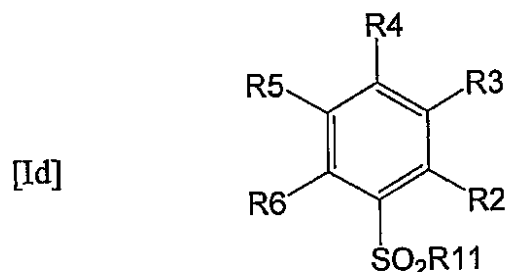
【請求項10】

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】

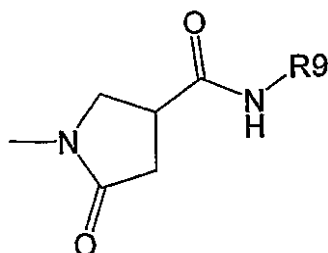


〔式中、

R₂はHであり；

R₃は、H、-COOH、-NH₂、又は

【化20】



〔式中、R₉は(C₁₀～C₂₂)アルキルである〕であり；

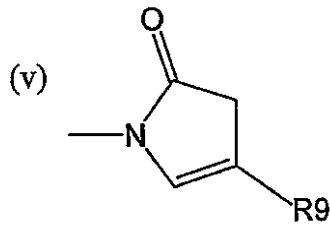
R₄は、

(i) H、

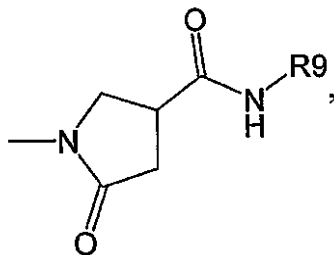
(ii) -O-(C₁₀～C₂₂)アルキル、

(iii) -NH-(C₁₀～C₂₂)アルキル、

(iv) - SO₂ - (C₁₀ ~ C₂₂) アルキル、
【化 2 1】



〔式中、R₉は(C₁₀ ~ C₂₂) アルキルである〕、及び
(vi) - SO₃H又は
【化 2 2】



〔式中、R₉は(C₁₀ ~ C₂₂) アルキルである〕で、或いはその双方で置換されていてもよいフェノキシ

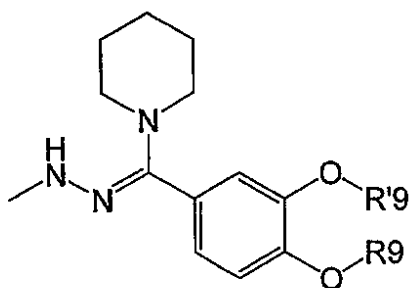
からなる群から選択され；

R₅は、H、-COOH、又は-NH₂であり；

R₆は、水素であるか、或いはハロゲン、-COOH又は-CONH₂で置換されていてもよいフェノキシであり；

R₁₁は、OH又は

【化 2 3】



〔式中、R₉は、(C₁₀ ~ C₂₂) アルキルであり、R'₉は(C₁ ~ C₆) アルキルである〕であり；

ここで、R₄及びR₉中で規定したいずれの「(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、-NH₂SO₂R'₉、-NR₉R'₉、アジリジン、=N-OR'₉、=N-NR₉R'₉、-NR₉-NR₉R'₉、-(CH₂)_n-NR₉-

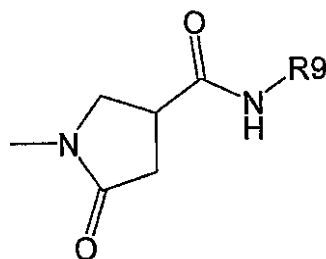
COR'_9 、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{CO}-\text{NR}_9\text{R}'_9$ 、 $-\text{OPO}_3\text{R}_9\text{R}'_9$ 、 $-\text{PO}_2\text{H}$
 R'_9 及び $-\text{PO}_3\text{R}_9\text{R}'_9$ からなる群から選択される 1 個又は複数の基で置換されて
 いてもよい〔式中、 R_9 は、 H 又は $(\text{C}1 \sim \text{C}32)$ アルキルであり、且つ、 R'_9 が、
 H 、 $(\text{C}1 \sim \text{C}32)$ アルキル、 $(\text{C}2 \sim \text{C}32)$ アルケニル及び $(\text{C}6 \sim \text{C}14)$ アリ
 ールからなる群から選択されるか、 R_9 及び R'_9 が、基 $-\text{NR}_9\text{R}'_9$ の一部として、
 それらが結合している N 原子と一緒に、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_2 が、 H であり；

R_3 が、 H 、 $-\text{COOH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、又は

【化 24】



〔式中、 R_9 は $-\text{C}_{18}\text{H}_{37}$ である〕であり；

R_4 が、

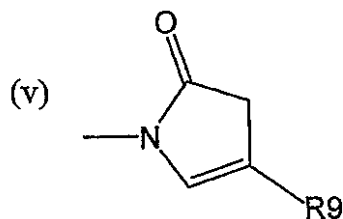
【化 25】

(i) H ；

(ii) $-\text{O}-\text{C}_{16}\text{H}_{33}$ ；

(iii) $-\text{NH}-\text{C}_{19}\text{H}_{39}$ ；

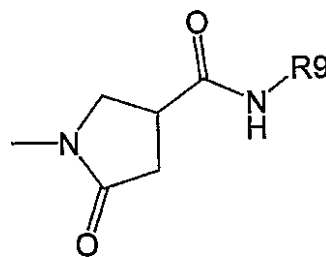
(iv) $-\text{SO}_2-\text{C}_{16}\text{H}_{33}$ ；



〔式中、 R_9 は $-\text{C}_{15}\text{H}_{31}$ である〕、及び

(vi) $-\text{SO}_3\text{H}$ 又は

【化 26】



〔式中、 R_9 は $-\text{C}_{18}\text{H}_{37}$ 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

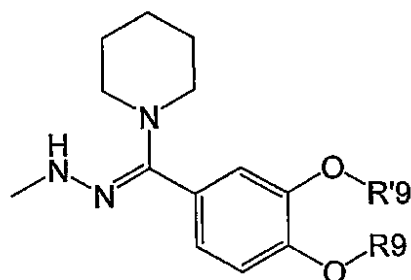
からなる群から選択され；

R 5 が、H、-COOH、又は-NH₂であり、

R 6 が、Hであるか、或いはハロゲン、-COOH又は-CONH₂で置換されていて
もよいフェノキシであり；

R 1 1 が、OH又は

【化 2 7】



〔式中、R 9 は -C₁₆H₃₃ 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 1 1 に記載の医薬組成物。

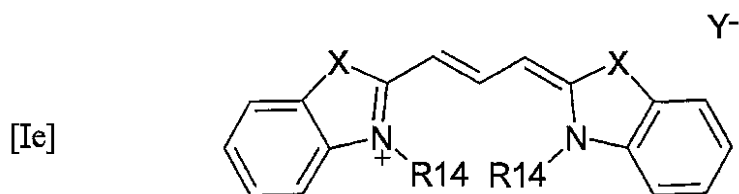
【請求項 1 3】

化合物 7 5、7 6、8 8、8 9、1 0 1、1 0 3、1 0 4、1 0 5、1 0 6 及び 1 0 7
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 1 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

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 2 8】



〔式中、

X は、O 又は S であり；

R 1 4 は、(C 1 0 ~ C 2 2) 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 1 4 中で規定した「(C 1 0 ~ C 2 2) 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 1 4) 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、-NH₂SO₂R' 9、-NR₉R' 9、アジリジン、=N-OR' 9、=N-NR'
9R' 9、-NR₉-NR₉R' 9、-(CH₂)_n-NR₉-COR' 9、-(CH₂)
n-CO-NR₉R' 9、-OPO₃R₉R' 9、-PO₂HR' 9 及び -PO₃R₉
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 1 4) アリールからなる群から選択

されるか、 R_9 及び R'_9 が、基 - $NR_9R'_9$ の一部として、それらが結合している N 原子と一緒にあって、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〕〕。

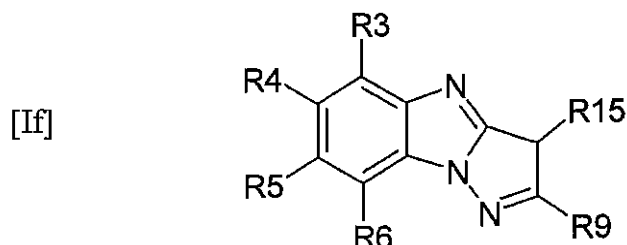
【請求項 15】

X が O 又は S であり、 R_{14} が $-C_{18}H_{37}$ であり、 Y^- が過塩素酸イオンである、式 I e 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 I f 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_3 及び R_5 は、それぞれ H であり；

R_4 は、H、 $-COOH$ 又は $-SO_3H$ であり；

R_6 は、H 又は $-COOH$ であり；

R_9 は、H 又は $(C_{10} \sim C_{22})$ アルキルであり；

R_{15} は、H 又は $-SO_3H$ であり；

R_9 中で規定した「 $(C_{10} \sim C_{22})$ 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、 $(C_3 \sim C_7)$ シクロアルキル、好ましくはシクロプロピル、 $(C_6 \sim C_{14})$ アリール、ニトロ、 $-OR'_9$ 、 $-SR'_9$ 、エボキシ、エピチオ、オキソ、 $-COR'_9$ 、 $-COOR'_9$ 、 $-OSO_3R'_9$ 、 $-SO_3R'_9$ 、 $-SO_2R'_9$ 、 $-NH SO_2R'_9$ 、 $-NR_9R'_9$ 、アジリジン、 $=N-OR'_9$ 、 $=N-NR_9R'_9$ 、 $-NR_9-NR_9R'_9$ 、 $-(CH_2)_n-NR_9-COR'_9$ 、 $-(CH_2)_n-CO-NR_9R'_9$ 、 $-OPO_3R_9R'_9$ 、 $-PO_2HR'_9$ 及び $-PO_3R_9R'_9$ 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_9 は、H 又は $(C_1 \sim C_{32})$ アルキルであり、且つ、 R'_9 が、H、 $(C_1 \sim C_{32})$ アルキル、 $(C_2 \sim C_{32})$ アルケニル及び $(C_6 \sim C_{14})$ アリールからなる群から選択されるか、 R_9 及び R'_9 が、基 - $NR_9R'_9$ の一部として、それらが結合している N 原子と一緒にあって、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】

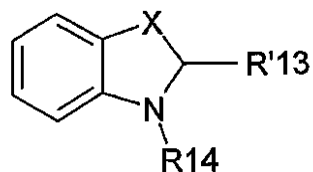
化合物 4、35 及び 36 と称される化合物など、 R_3 及び R_5 が、H であり、 R_6 が、H 又は $-COOH$ であり、 R_4 が、H、 $COOH$ 又は $-SO_3H$ であり、 R_9 が、H 又は $-C_{17}H_{35}$ であり、 R_{15} が、H 又は $-SO_3H$ である、式 I f の化合物を含有する、請求項 16 に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

下記式 I g の化合物を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物：

【化 3 0】

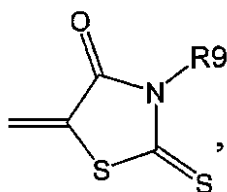
[Ig]



〔式中、

Xは、NR₁₂又はCR'₁₂R''₁₂であり；R₁₂は(C₁₀～C₂₂)アルキルであり；R'₁₂及びR''₁₂は、それぞれ、(C₁～C₆)アルキルであるか、R'₁₂及びR''₁₂は一緒になって、基

【化 3 1】

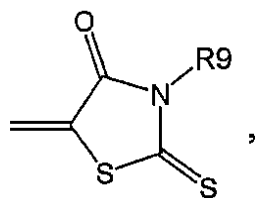
〔式中、R₉は、Hであるか、-COOHで置換された(C₁₀～C₂₂)アルキルである〕であり；R'₁₃は、=O、=NH及び=N-NH-SO₂-(C₆～C₁₄)アリール、{式中、アリールは、-COOH及び-O-(C₁₀～C₂₂)アルキル、又は-NH-SO₂-フェニル(式中、フェニルは、-COOH及び-O-(C₁₀～C₂₂)アルキルで置換されている)のいずれかで置換されている}からなる群から選択され；R₁₄は、(C₁～C₈)アルキルであるか、1個若しくは複数の(C₁～C₆)アルコキシで置換された-CH₂-CH(OH)-(C₆～C₁₄)アリールであり；

R₁₂及びR'₁₃中で規定したいずれの「(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、-NH-SO₂R'₉、-NR₉R'₉、アジリジン、=N-OR'₉、=N-NR₉R'₉、-NR₉-NR₉R'₉、-(CH₂)_n-NR₉-COR'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、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、NR₁₂又はCR'₁₂R''₁₂であり；R₁₂が、-C₁₆H₃₃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 3 2】



〔式中、R₉は、H又は - C₁₀H₂₀ - COOHである〕であり；

R'₁₃が、= O、= NH又は = N - NH - SO₂ - フェニル〔式中、フェニルは、- COOH及び - OC₁₈H₃₇、又は - NH - SO₂ - フェニル〔式中、フェニルは、- COOH及び - OC₁₈H₃₇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 - CH₂ - CH(OH) - フェニルである、式 I g の化合物を含有する、請求項 18 に記載の医薬組成物。

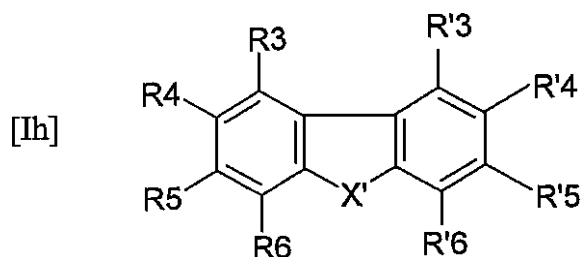
【請求項 20】

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 I h の化合物を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物：

【化 3 3】



〔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、- OSO₃R'₉、- SO₃R'₉、- SO₂R'₉、- NHSO₂R'₉、- NR₉R'₉、アジリジン、= N - OR'₉、= N - NR₉R'₉、- NR₉ - NR₉R'₉、- (CH₂)_n - NR₉ - COR'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

扱われるか、 R_9 及び R'_9 が、基 - $NR_9R'_9$ の一部として、それらが結合している N 原子と一緒にあって、1 個又は複数の N、S 又は O 原子をさらに含んでもよい 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_{14} であり；

R_3 、 R_4 、 R_5 、 R'_3 及び R'_5 が、それぞれ H、Cl 又は Br であり；

R'_4 が、H、Cl、Br 及び $-C_{20}H_{39}$ からなる群から選択され；

R_6 及び R'_6 が、それぞれ、-H 又は $-COOH$ であり；

R_{14} が、 $C_{10}H_{21}-NH-CH_2-CH(OH)-CH_2-$ 又は $C_{18}H_{37}-NH-CH_2-CH(OH)-CH_2-$ である、式 I h の化合物を含有する、請求項 21 に記載の医薬組成物。

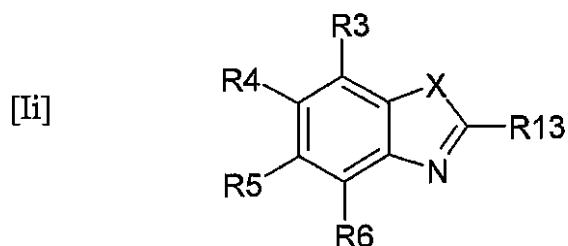
【請求項 23】

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 I i 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_{12} であり；

R_4 は、H 又は $-SO_3H$ であり；

R_6 は、H であり；

R_3 は、H 又は $-COOH$ であり；

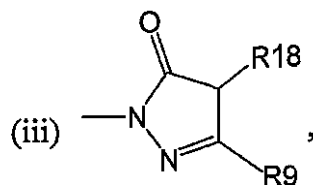
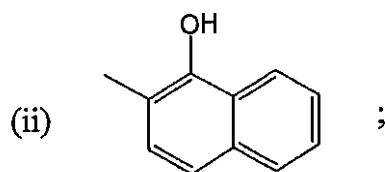
R_5 は、H、 $-COOH$ 又は $-SO_3H$ であり；

R_{12} は、H 又は $(C_{10} \sim C_{22})$ アルキルであり；

R_{13} は、

(i) $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、

【化 35】

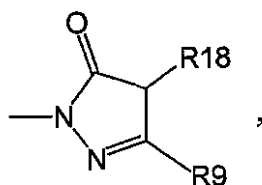


[式中、 R_9 は、 $(C_{10} \sim C_{22})$ アルキルであり、 R_{18} は、H 又は $=N-(C_6 \sim$

C 1 4) アリール { 式中、アリールは、 $-NR^9R'^9$ 、(式中、 R^9 及び R'^9 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 3 6】



で置換されていてもよい (C 6 ~ C 1 4) アリール [式中、 R^9 は、(C 1 0 ~ C 2 2) アルキルであり、 R^{18} は、 $=N-(C 6 ~ C 1 4)$ アリール { 式中アリールは $-NR^9R'^9$ (式中、 R^9 及び R'^9 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 $-N=CH-(C 6 ~ C 1 4)$ 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 1 0 ~ C 2 2) 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 1 4) アリール、ニトロ、 $-OR'^9$ 、 $-SR'^9$ 、エボキシ、エピチオ、オキソ、 $-COR'^9$ 、 $-COOR'^9$ 、 $-OSO_3R'^9$ 、 $-SO_3R'^9$ 、 $-SO_2R'^9$ 、 $-NH SO_2R'^9$ 、 $-NR^9R'^9$ 、アジリジン、 $=N-OR'^9$ 、 $=N-NR^9R'^9$ 、 $-NR^9-NR^9R'^9$ 、 $-(CH_2)_n-NR^9-COR'^9$ 、 $-(CH_2)_n-CO-NR^9R'^9$ 、 $-OPO_3R^9R'^9$ 、 $-PO_2HR'^9$ 及び $-PO_3R^9R'^9$ 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 1 4) アリールからなる群から選択されるか、 R^9 及び R'^9 が、基 $-NR^9R'^9$ の一部として、それらが結合している N 原子と一緒にあって、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 ~ 1 0 の整数である]]。

【請求項 2 5】

X が、O、S 又は NR^{12} であり ;

R^4 が、H 又は $-SO_3H$ であり ;

R^6 が、H であり ;

R^3 が、H 又は $-COOH$ であり ;

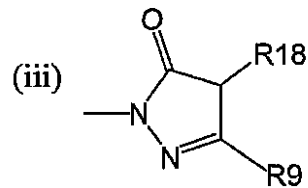
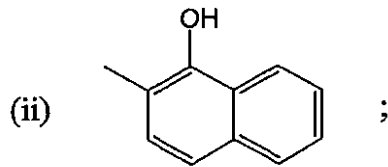
R^5 が、H、 $-COOH$ 又は $-SO_3H$ であり ;

R^{12} が、H、 $-C_{16}H_{33}$ 又は $-C_{18}H_{37}$ であり ;

R^{13} が、

(i) メチル、

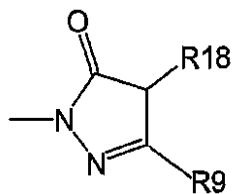
【化 3 7】



〔式中、R 9 は、 $-C_{1-7}H_{3-5}$ であり、R 1 8 は、H 又は $=N$ -フェニル〔式中、フェニルは $-NR_9R'_9$ (式中、R 9 及び R ' 9 は、それぞれエチルである) で置換されている) である〕、

(i v)

【化 3 8】



で置換されている) フェニル〔式中、R 9 は、 $-C_{1-7}H_{3-5}$ であり、R 1 8 は、 $=N$ -フェニル〔式中、フェニルは $-NR_9R'_9$ (式中、R 9 及び R ' 9 は、それぞれエチルである) で置換されている) である〕、及び

(v) $-OH$ 及び 1 個又は複数の Cl 又は Br で置換されている) $-N=CH$ -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る) ナフチルからなる群から選択される、式 I i の化合物を含有する、請求項 2 4 に記載の医薬組成物。

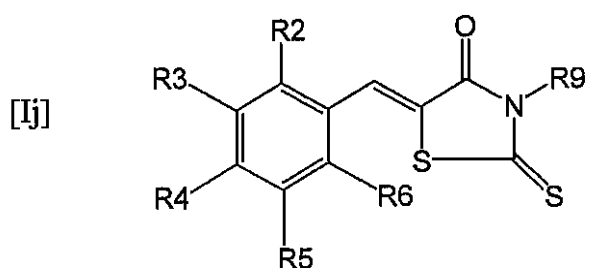
【請求項 2 6】

明細書中で化合物 3 7、3 8、3 9、4 2、5 7、5 8、7 3 及び 1 0 2 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 2 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 7】

下記式 I j の化合物を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物：

【化 3 9】



[式中、

R 2、R 4、R 5 及び R 6 は、それぞれ H であり；

R 3 は、H 又はハロゲンであり；

R 9 は、H であるか、- C O O H で置換された (C 1 0 ~ C 2 2) アルキルである]。

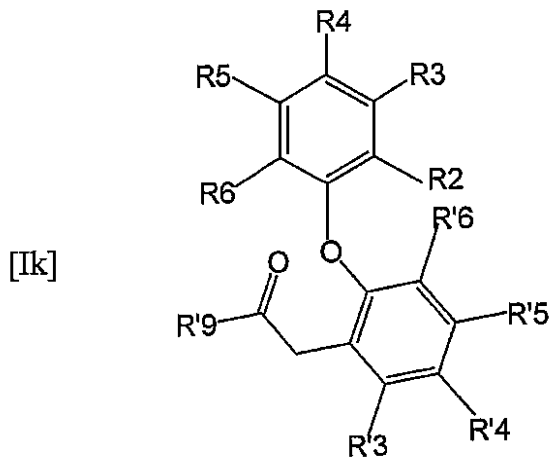
【請求項 2 8】

化合物 8 1 と称される化合物などの、R 2、R 4、R 5 及び R 6 が、それぞれ H であり、R 3 が、H 又は B r であり、R 9 が、H 又は - C ₁₀ H ₂₀ - C O O H である式 I j の化合物を含有する、請求項 2 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 9】

下記式 I k の化合物を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物：

【化 4 0】



[式中、

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

R 3、R 5 及び R ' 4 は、それぞれ、H 又は - C O O H であり；

R ' 9 は、O H 及び - C F ₃ で置換されていてもよい (C 1 0 ~ C 2 2) アルケニルであり；

R ' 9 中で規定した「(C 1 0 ~ C 2 2) 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 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 ₃ R ' 9、- S O ₃ R ' 9、- S O ₂ R ' 9、- N H S O ₂ 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 ₂) _n - N R 9 - C O R ' 9、- (C H ₂) _n - C O - N R 9 R ' 9、- O P O ₃ R 9 R ' 9、- P O ₂ H R ' 9 及び - P O ₃ R 9 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 1 4) アリールからなる群から選択されるか、R 9 及び R ' 9 が、基 - N R 9 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、1 個又は複数の N、S 又は O 原子をさらに含んでもよい 3 ~ 7 員の飽和環を形成し、n は 0 又は 1 ~ 1 0 の整数である]]。

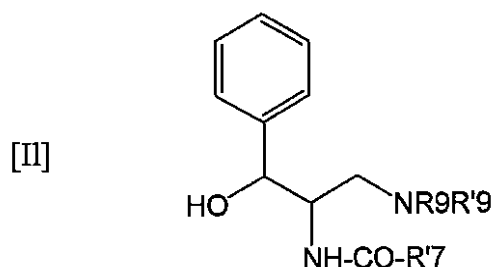
【請求項 3 0】

化合物 9 8 と称される化合物など、R 2、R 4、R 6、R ' 3、R ' 5 及び R ' 6 が、それぞれ H であり、R 3、R 5 及び R ' 4 が、それぞれ - C O O H であり、R ' 9 が、O H 及び - C F ₃ で置換されていてもよい C ₁₇ H ₃₁ である式 I k の化合物を含有する、請求項 2 9 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、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 中で規定したいずれの「(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、エボキシ、エビチオ、オキソ、-COR'9、COOR'9、-OSO₃R'9、-SO₃R'9、-SO₂R'9、-NH₂SO₂R'9、-NR₉R'9、アジリジン、=N-OR'9、=N-NR₉R'9、-NR₉-NR₉R'9、-(CH₂)_n-NR₉-COR'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、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〕〕。

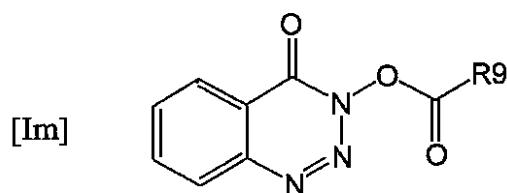
【請求項 3 2】

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 Im 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、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、エポキシ、エピチオ、オキソ、 $-COR'$ 、 $-COOR'$ 、 $-OSO_3R'$ 、 $-SO_3R'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-NH SO_2R'$ 、 $-NR_9R'$ 、アジリジン、 $=N-OR'$ 、 $=N-NR_9R'$ 、 $-NR_9-NR_9R'$ 、 $-(CH_2)_n-NR_9-COR'$ 、 $-(CH_2)_n-CO-NR_9R'$ 、 $-OPO_3R_9R'$ 、 $-PO_2HR'$ 及び $-PO_3R_9R'$ 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_9 は、H又は(C1～C32)アルキルであり、且つ、 R' 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_9 及び R' が、基 $-NR_9R'$ の一部として、それらが結合しているN原子と一緒に、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〕〕。

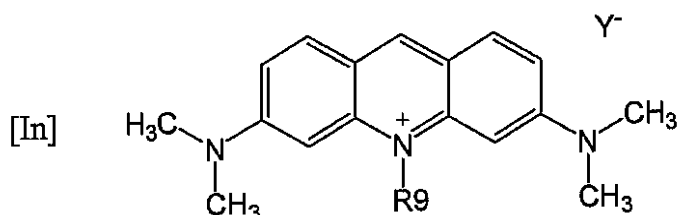
【請求項34】

化合物99と称される化合物など、 R_9 がエポキシで置換されていてもよい $-C_{17}H_{33}$ 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_9 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_9 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、 $-OR'$ 、 $-SR'$ 、エポキシ、エピチオ、オキソ、 $-COR'$ 、 $-COOR'$ 、 $-OSO_3R'$ 、 $-SO_3R'$ 、 $-SO_2R'$ 、 $-NH SO_2R'$ 、 $-NR_9R'$ 、アジリジン、 $=N-OR'$ 、 $=N-NR_9R'$ 、 $-NR_9-NR_9R'$ 、 $-(CH_2)_n-NR_9-COR'$ 、 $-(CH_2)_n-CO-NR_9R'$ 、 $-OPO_3R_9R'$ 、 $-PO_2HR'$ 及び $-PO_3R_9R'$ 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(C1～C32)アルキルであり、且つ、 R' 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_9 及び R' が、基 $-NR_9R'$ の一部として、それらが結合しているN原子と一緒に、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】

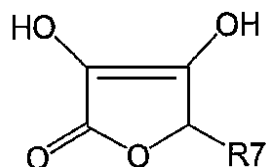
R_9 が $-C_{18}H_{37}$ であり、 Y^- が臭素イオンである、化合物79と称される化合物を含有する、請求項35に記載の医薬組成物。

【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 4 4】

II



〔式中、

R 7 は、 $-\text{CH}(\text{OH})-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CO}-\text{R}9$ であり、R 9 は、(C 1 0 ~ C 2 2) アルキルであり；

R 9 中で規定した「(C 1 0 ~ C 2 2) 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 1 4) アリール、ニトロ、 $-\text{OR}'9$ 、 $-\text{SR}'9$ 、エポキシ、エピチオ、オキソ、 $-\text{COR}'9$ 、 $-\text{COOR}'9$ 、 $-\text{OSO}_3\text{R}'9$ 、 $-\text{SO}_3\text{R}'9$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}'9$ 、 $-\text{NHSO}_2\text{R}'9$ 、 $-\text{NR}9\text{R}'9$ 、アジリジン、 $=\text{N}-\text{OR}'9$ 、 $=\text{N}-\text{NR}9\text{R}'9$ 、 $-\text{NR}9-\text{NR}9\text{R}'9$ 、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{NR}9-\text{COR}'9$ 、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{CO}-\text{NR}9\text{R}'9$ 、 $-\text{OPO}_3\text{R}9\text{R}'9$ 、 $-\text{PO}_2\text{HR}'9$ 及び $-\text{PO}_3\text{R}9\text{R}'9$ 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 1 4) アリールからなる群から選択されるか、R 9 及び R' 9 が、基 $-\text{NR}9\text{R}'9$ の一部として、それらが結合している N 原子と一緒にあって、1 個又は複数の N、S 又は O 原子をさらに含んでもよい 3 ~ 7 員の飽和環を形成し、n は 0 又は 1 ~ 1 0 の整数である〕〕。

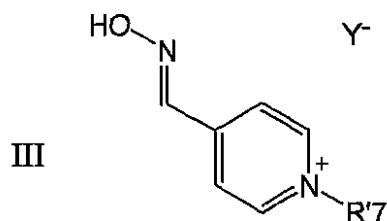
【請求項 3 8】

R 7 が $-\text{CH}(\text{OH})-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CO}-\text{R}9$ であり、且つ R 9 が $-\text{C}_{15}\text{H}_{31}$ である、明細書中で化合物 7 8 と称される化合物を含有する、請求項 3 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 9】

下記一般式 I I I の化合物を含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物：

【化 4 5】



〔式中、

R' 7 は、(C 1 0 ~ C 2 2) 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「(C 1 0 ~ C 2 2) 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 1 4) アリール、ニトロ、 $-\text{OR}'9$ 、 $-\text{SR}'9$ 、エポキシ、エピチオ、オ

キソ、 $-\text{COR}'_9$ 、 $-\text{COOR}'_9$ 、 $-\text{OSO}_3\text{R}'_9$ 、 $-\text{SO}_3\text{R}'_9$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}'_9$ 、 $-\text{NH}\text{SO}_2\text{R}'_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}'_9$ 、アジリジン、 $=\text{N}-\text{OR}'_9$ 、 $=\text{N}-\text{NR}_9\text{R}'_9$ 、 $-\text{NR}_9-\text{NR}_9\text{R}'_9$ 、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{NR}_9-\text{COR}'_9$ 、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{CO}-\text{NR}_9\text{R}'_9$ 、 $-\text{OPO}_3\text{R}_9\text{R}'_9$ 、 $-\text{PO}_2\text{HR}'_9$ 及び $-\text{PO}_3\text{R}_9\text{R}'_9$ 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 $(\text{C}1 \sim \text{C}32)$ アルキルであり、且つ、 R'_9 が、 H 、 $(\text{C}1 \sim \text{C}32)$ アルキル、 $(\text{C}2 \sim \text{C}32)$ アルケニル及び $(\text{C}6 \sim \text{C}14)$ アリールからなる群から選択されるか、 R_9 及び R'_9 が、基 $-\text{NR}_9\text{R}'_9$ の一部として、それらが結合している N 原子と一緒にあって、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〕〕。

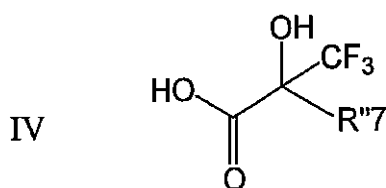
【請求項 40】

R'_7 が $-\text{C}_{16}\text{H}_{33}$ であり、 Y^- 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、 $(\text{C}3 \sim \text{C}7)$ シクロアルキル、好ましくはシクロプロピル、 $(\text{C}6 \sim \text{C}14)$ アリール、ニトロ、 $-\text{OR}'_9$ 、 $-\text{SR}'_9$ 、エポキシ、エピチオ、オキシ、 $-\text{COR}'_9$ 、 $-\text{COOR}'_9$ 、 $-\text{OSO}_3\text{R}'_9$ 、 $-\text{SO}_3\text{R}'_9$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}'_9$ 、 $-\text{NH}\text{SO}_2\text{R}'_9$ 、 $-\text{NR}_9\text{R}'_9$ 、アジリジン、 $=\text{N}-\text{OR}'_9$ 、 $=\text{N}-\text{NR}_9\text{R}'_9$ 、 $-\text{NR}_9-\text{NR}_9\text{R}'_9$ 、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{NR}_9-\text{COR}'_9$ 、 $-(\text{CH}_2)_n-\text{CO}-\text{NR}_9\text{R}'_9$ 、 $-\text{OPO}_3\text{R}_9\text{R}'_9$ 、 $-\text{PO}_2\text{HR}'_9$ 及び $-\text{PO}_3\text{R}_9\text{R}'_9$ 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 $(\text{C}2 \sim \text{C}32)$ アルケニルである〔式中、 R_9 は、 H 又は $(\text{C}1 \sim \text{C}32)$ アルキルであり、且つ、 R'_9 が、 H 、 $(\text{C}1 \sim \text{C}32)$ アルキル、 $(\text{C}2 \sim \text{C}32)$ アルケニル及び $(\text{C}6 \sim \text{C}14)$ アリールからなる群から選択されるか、 R_9 及び R'_9 が、基 $-\text{NR}_9\text{R}'_9$ の一部として、それらが結合している N 原子と一緒にあって、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 $-\text{C}_{16}\text{H}_{31}$ 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）、急性骨髄性白血病（AML）、慢性リンパ性白血病（CLL）、慢性骨髄性白血病（CML）、骨髄異形成症候群（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、パーキットリンパ腫及び多発性骨髄種）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、ファーター膨大部、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、腎盂、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、淚腺の癌腫、眼窩、脳、脊髄、脈管系の肉腫、血管肉腫及びカボ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 4 2 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 4 5】

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、肥厚性癬痕、挫瘡及び硬化症／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（A I H A）、肝炎、インスリン依存性糖尿病（I D D M）、全身性紅斑性狼瘡（S L E）、多発性硬化症（M S）、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 4 2 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 4 6】

明細書中で化合物 1 2、1 8、2 7、3 7、4 8、5 0、6 1～6 3、7 0、7 1、7 5、7 7、8 3～8 7、9 0～9 6 及び 9 8～1 0 7 と称される化合物の群から選択される化合物。