

【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24年3月15日 (2012.3.15)

【公表番号】特表2010-518094(P2010-518094A)

【公表日】平成22年5月27日 (2010.5.27)

【年通号数】公開・登録公報2010-021

【出願番号】特願2009-549133(P2009-549133)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/7034 (2006.01)

C 0 7 H 15/23 (2006.01)

A 6 1 K 47/48 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/14 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/7034

C 0 7 H 15/23

A 6 1 K 47/48

A 6 1 K 47/34

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/14

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 9/10 1 0 1

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 17/04

A 6 1 P 17/06

【手続補正書】

【提出日】平成23年2月4日 (2011.2.4)

【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

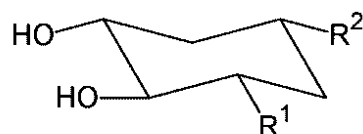
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

内皮機能不全を治療するために有効な量で、少なくとも１種のシクロヘキサン誘導体を含有するオリゴ糖またはグリコミメティック化合物を含む、個体における内皮機能不全を治療するための組成物であって、ここで、該シクロヘキサン誘導体は、式：

【化１０７】



を有し、

式中、

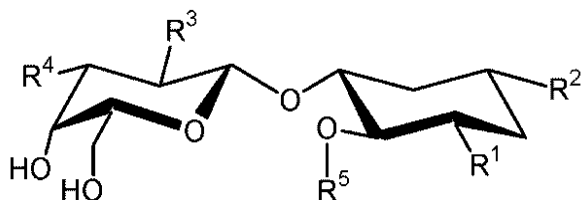
$R^1 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリーールまたはヘテロアリーール（これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、 OH 、または NHX の１種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリーールまたはヘテロアリーールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の１種または複数で置換されていてよい）； $C(=O)OX$ 、 $C(=O)OX$ で置換されたアルカニル、 $C(=O)NHX$ 、 $C(=O)NHX$ で置換されたアルカニル（ $X = C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリーールまたはヘテロアリーールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の１種または複数で置換されていてよい）； OX 、 NHX （ $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリーールまたはヘテロアリーールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の１種または複数で置換されていてよい）；

$R^2 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリーールまたはヘテロアリーール（これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、 OH 、または NHX の１種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリーールまたはヘテロアリーールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の１種または複数で置換されていてよい）； $-C(=O)OX$ （ X は、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリーールまたはヘテロアリーールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の１種または複数で置換されていてよい）； $-C(=O)NH(CH_2)_nNH_2$ （ $n = 0 \sim 30$ ）、 $C(=O)NHX$ または CX_2OH （ $X = C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリーールまたはヘテロアリーールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の１種または複数で置換されていてよい）； OX 、 NHX 、 $NH(=O)X$ （ $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリーールまたはヘテロアリーールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の１種または複数で置換されていてよい）；但し、 R^1 および R^2 は、同時に H であることはなく；該シクロヘキサン誘導体は、 OH 、 R^1 または R^2 において該オリゴ糖またはグリコミメティック化合物に少なくとも結合している、組成物。

【請求項２】

前記化合物が、

【化 1 0 8】



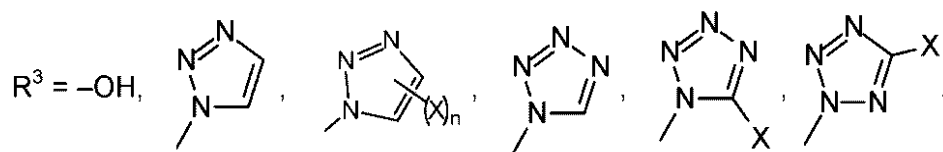
を含み、

式中、

$R^1 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリーールまたはヘテロアリーール（これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、OH、またはNHXの1種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリーールまたはヘテロアリーールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； $C(=O)OX$ 、 $C(=O)OX$ で置換されたアルカニル、 $C(=O)NHX$ 、 $C(=O)NHX$ で置換されたアルカニル（ $X = C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリーールまたはヘテロアリーールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； OX 、 NHX （ $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリーールまたはヘテロアリーールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）；

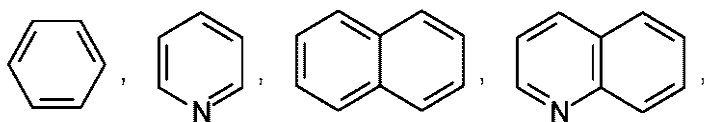
$R^2 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリーールまたはヘテロアリーール（これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、OH、またはNHXの1種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリーールまたはヘテロアリーールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； $-C(=O)OX$ （ X は、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリーールまたはヘテロアリーールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； $-C(=O)NH(CH_2)_nNH_2$ （ $n = 0 \sim 30$ ）、 $C(=O)NHX$ または CX_2OH （ $X = C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリーールまたはヘテロアリーールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； OX 、 NHX 、 $NH(=O)X$ （ $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリーールまたはヘテロアリーールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）；但し、 R^1 および R^2 は、同時にHであることはなく；

【化 1 0 9】

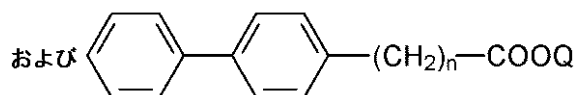
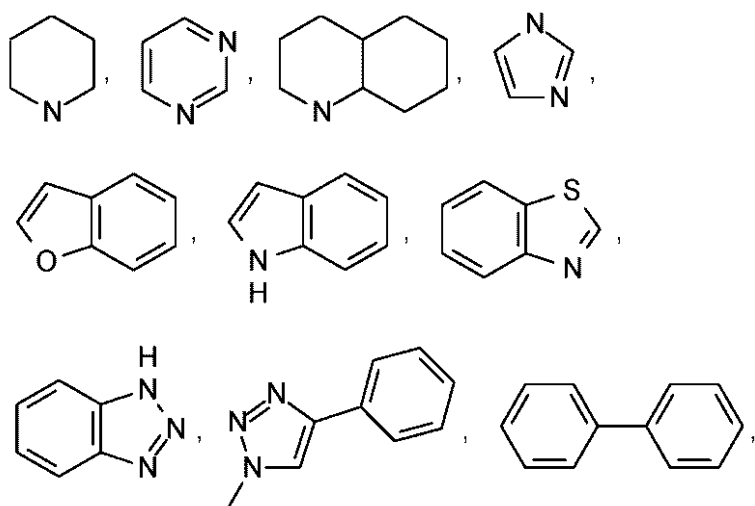


$-O-C(=O)-X$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH-C(=O)-NHX$ 、または $-NH-C(=O)-X$ であり、ここで、 $n = 0 \sim 2$ であり、 X は、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$

アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、
【化 1 1 0】

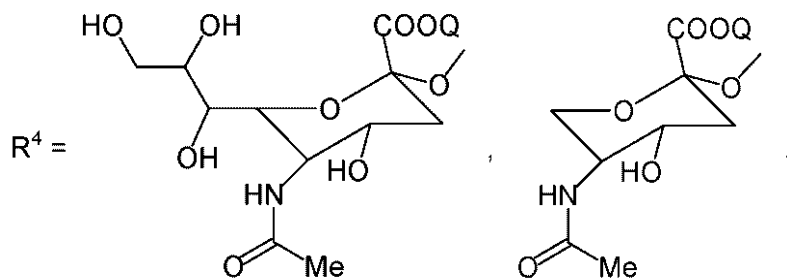


【化 1 1 1】



から独立に選択され、ここで、Qは、Hであるか、または生理学的に許容される塩、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_m$ -アリールまたは $(CH_2)_m$ -ヘテロアリールであり、ここで、mは、1～10であり、ここで、 $n = 0 \sim 10$ であり、上記環化合物のいずれも、Cl、F、 CF_3 、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 NO_2 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、 $C_1 \sim C_{14}$ アリール、またはOY、 $C(=O)OY$ 、 NY_2 または $C(=O)NHY$ から独立に選択される1から3個のもので置換されていてよく、ここで、Yは、H、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、または $C_1 \sim C_{14}$ アリールであり；

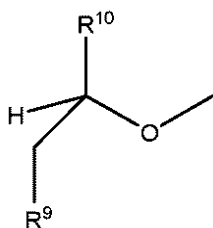
【化 1 1 2】



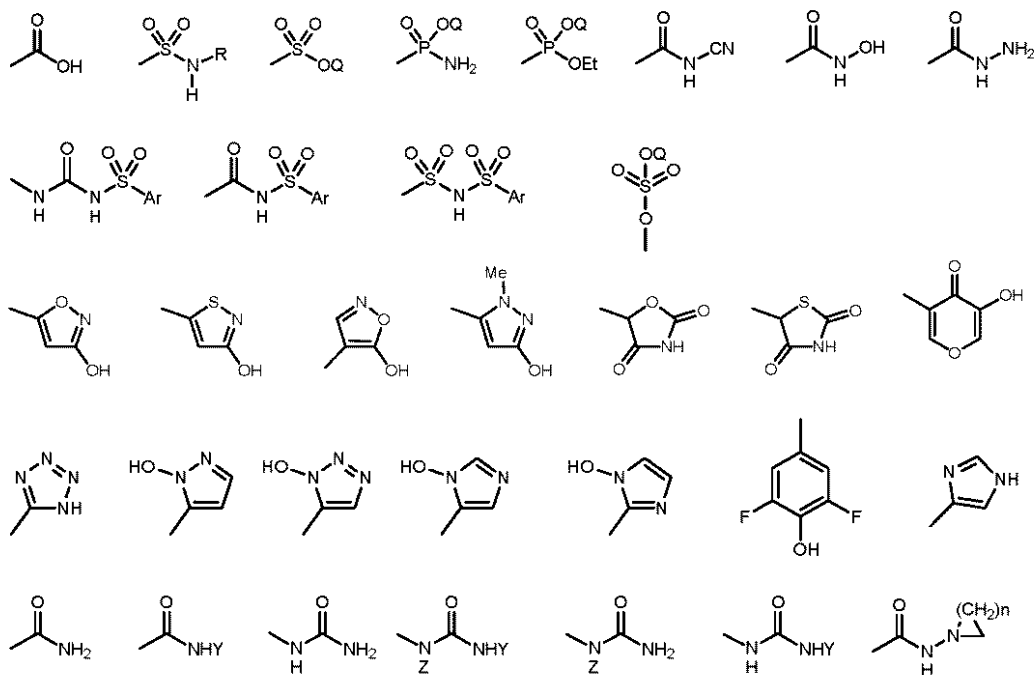
6' 硫酸化 GlcNAc、6' カルボキシル化 GlcNAc、6' 硫酸化 GalNAc、
6' 硫酸化ガラクトース、6' カルボキシル化ガラクトース、

$$\begin{array}{c} \text{COOQ} \\ | \\ \text{H}-\text{C}-\text{O}- \\ | \\ \text{R}^9 \end{array}$$

【化 1 1 4】



【化 1 1 5】

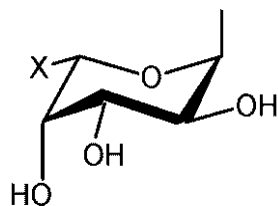


の1つであり、ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_m$ -アリールまたは $(CH_2)_m$ -ヘテロアリールであり、ここで、mは、1~10であり、n = 1~4であり、ZおよびY = $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリール、およびMe、OM

e、ハロゲン化物、OHで置換されたヘテロアリールである)であり;

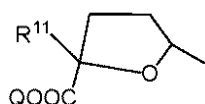
$R^5 = H$ 、D-マンノース、L-ガラクトース、D-アラビノース、L-フコース、ポリオール、

【化116】



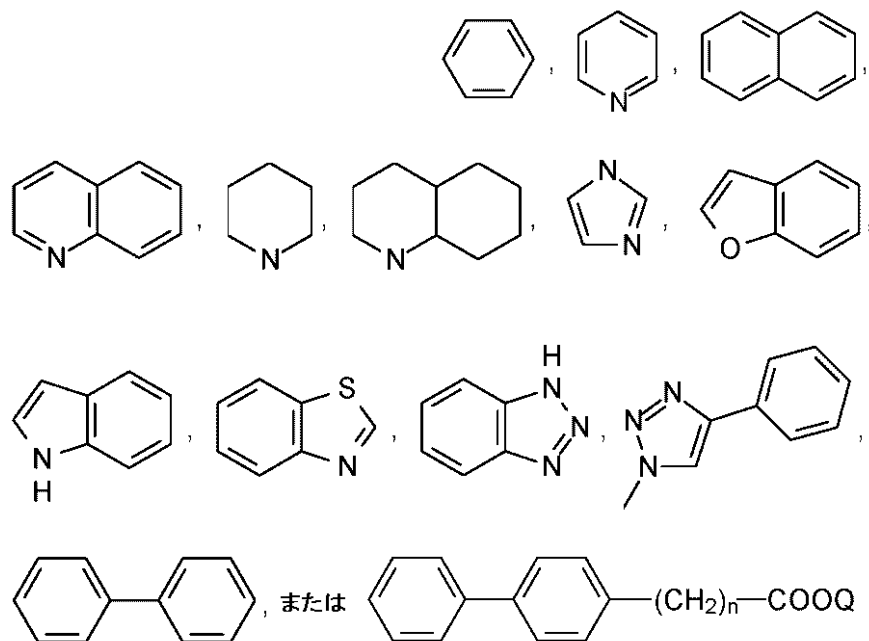
(ここで、 $X = CF_3$ 、シクロプロピルまたはフェニルである)、または

【化117】



(ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_m$ -アリールまたは $(CH_2)_m$ -ヘテロアリールであり、ここで、mは、1~10であり、ここで、 R^{11} は、アリール、ヘテロアリール、

【化118】



であり、ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_m$ -アリールまたは $(CH_2)_m$ -ヘテロアリールであり、ここで、mは、1~10であり、ここで、 $n = 0 \sim 10$ であり、上記環化合物のいずれの1つも、Cl、F、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニルまたはOYから独立に選択される1から3個のもので置換されていてよく、ここで、Yは、H、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_1 \sim C_8$ アルキニルである)である、請求項1に記載の組成物。

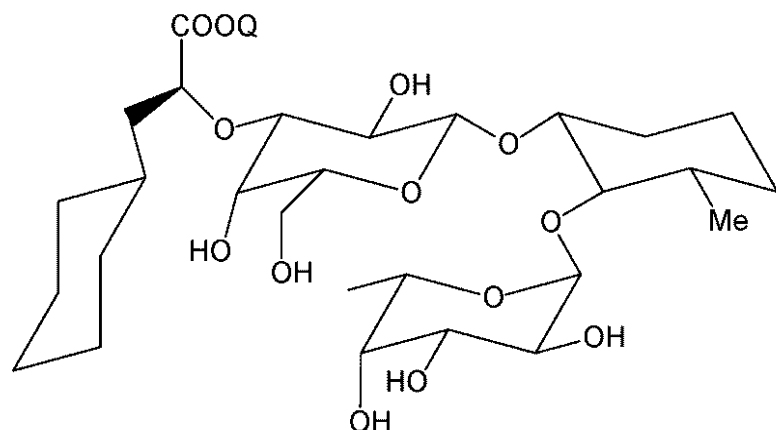
【請求項3】

前記化合物が、請求項2に記載の化合物からなる、請求項1に記載の組成物。

【請求項4】

前記化合物が、式：

【化 1 1 9】

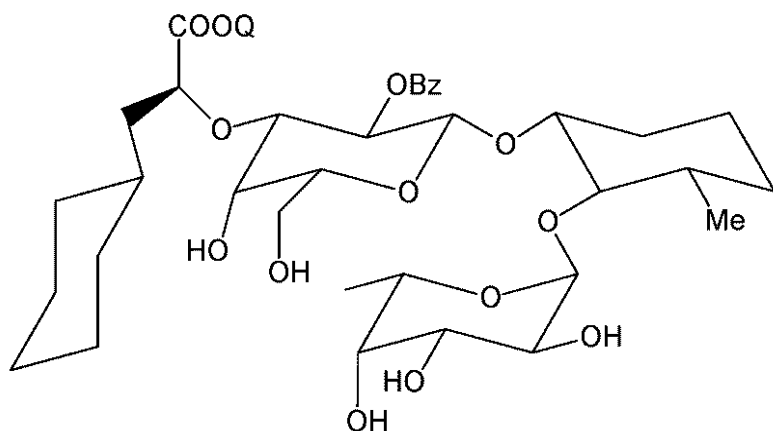


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 5】

前記化合物が、式：

【化 1 2 0】

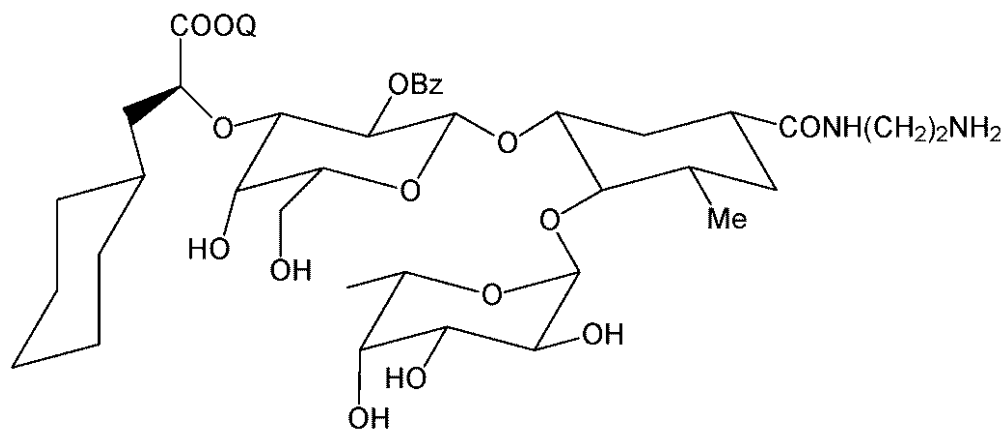


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 6】

前記化合物が、式：

【化 1 2 1】

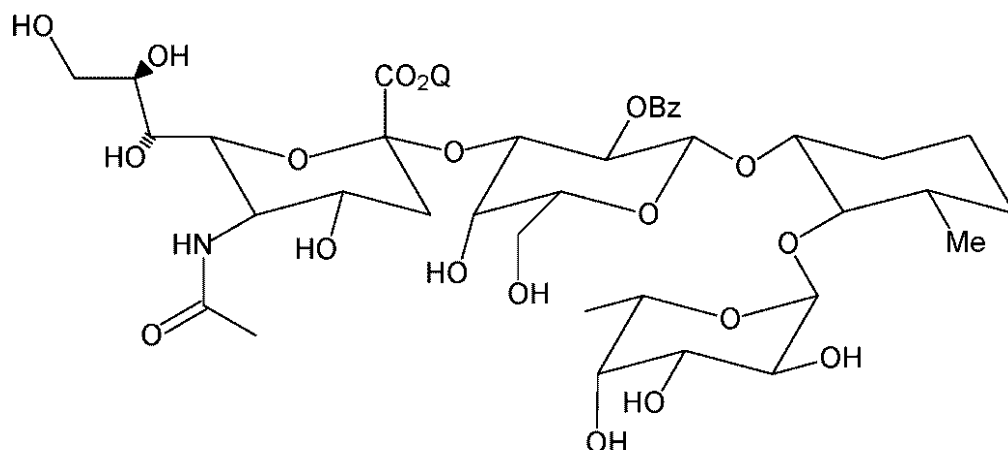


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

前記化合物が、式：

【化 1 2 2】

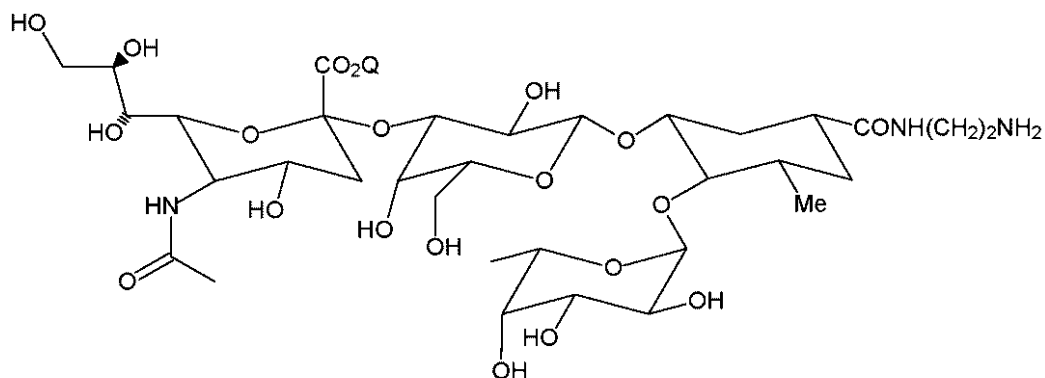


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 8】

前記化合物が、式：

【化 1 2 3】

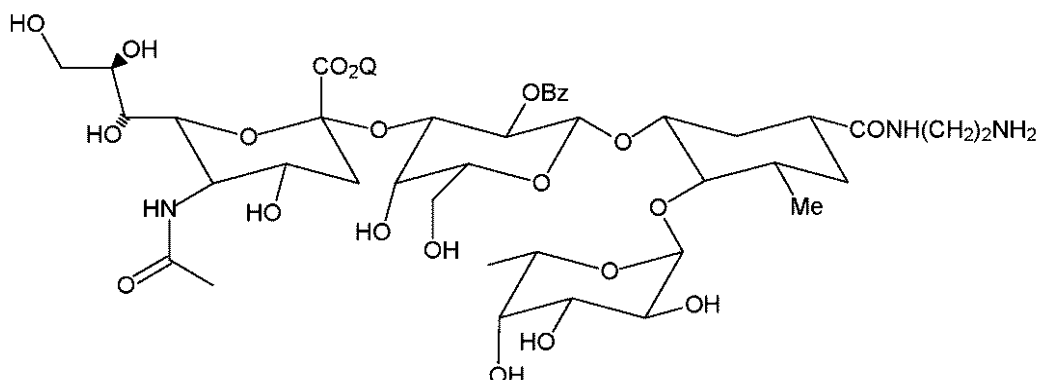


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 9】

前記化合物が、式：

【化 1 2 4】



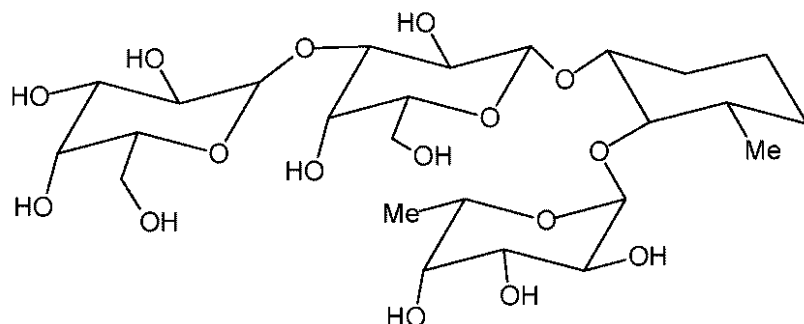
を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルであり

、B z が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 1 0】

前記化合物が、式：

【化 1 2 5】

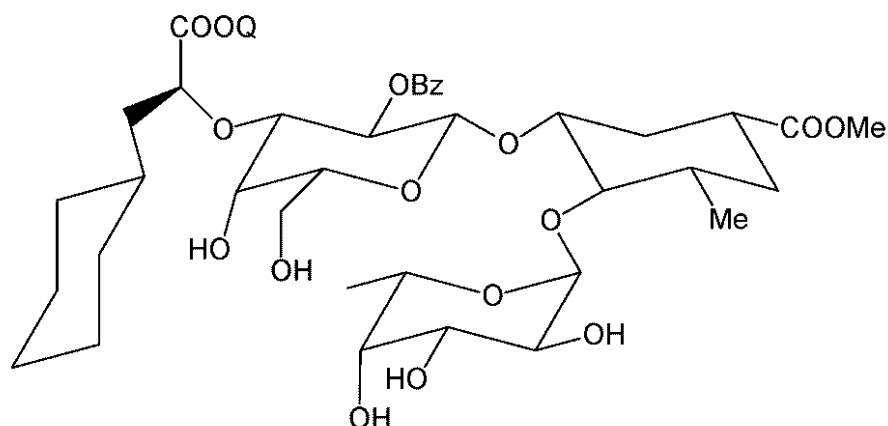


を有し、ここで、M e が、メチルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 1 1】

前記化合物が、式：

【化 1 2 6】

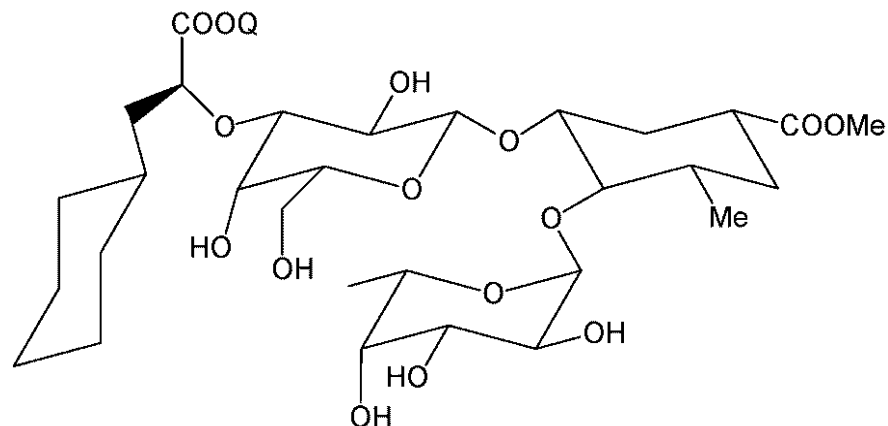


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、M e が、メチルであり、B z が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 1 2】

前記化合物が、式：

【化 1 2 7】

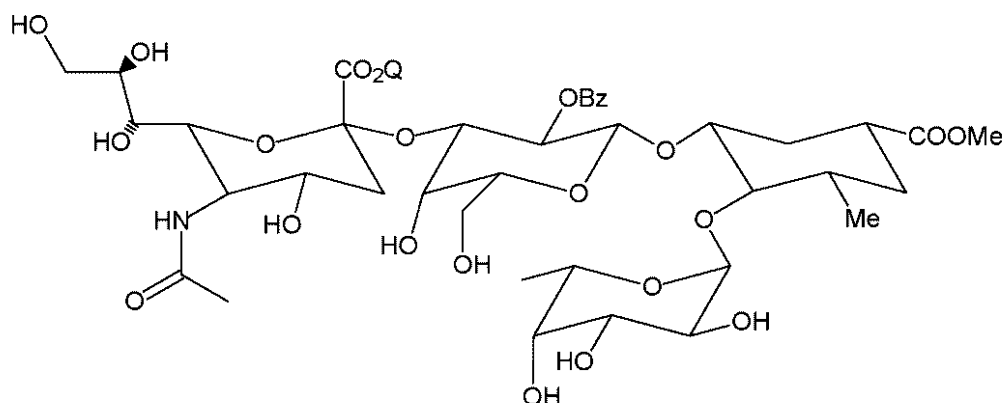


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、M e が、メチルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 1 3】

前記化合物が、式：

【化 1 2 8】

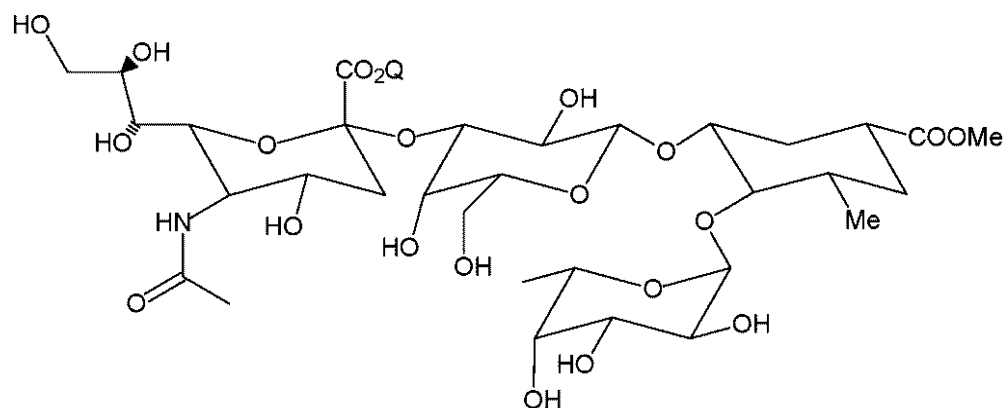


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 1 4】

前記化合物が、式：

【化 1 2 9】

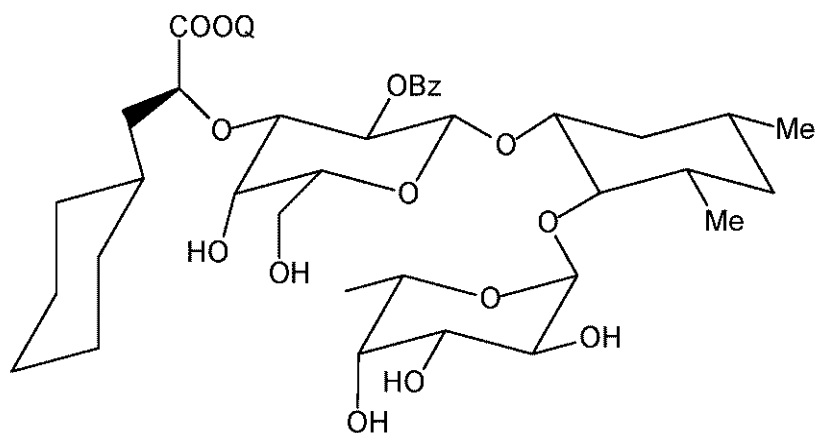


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 1 5】

前記化合物が、式：

【化 1 3 0】



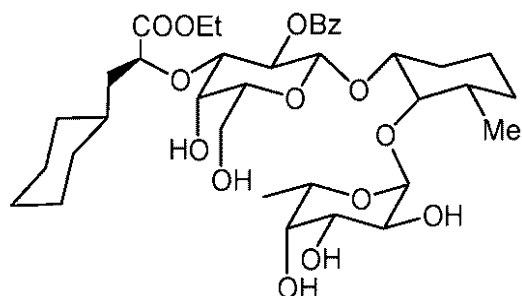
を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルであり

、B z が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 1 6】

前記化合物が、式：

【化 1 3 1】

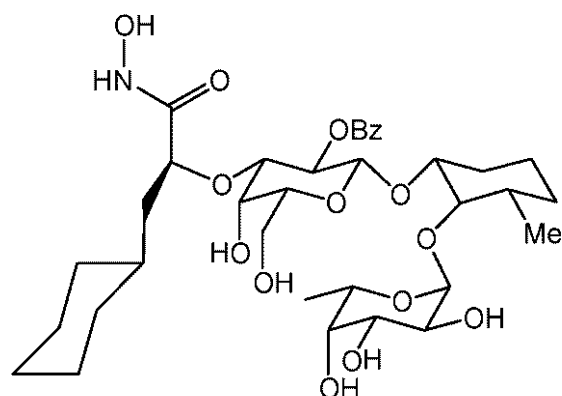


を有し、ここで、M e が、メチルであり、E t が、エチルであり、B z が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 1 7】

前記化合物が、式：

【化 1 3 2】

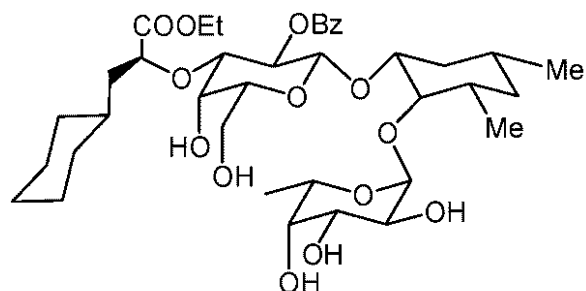


を有し、ここで、M e が、メチルであり、B z が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 1 8】

前記化合物が、式：

【化 1 3 3】

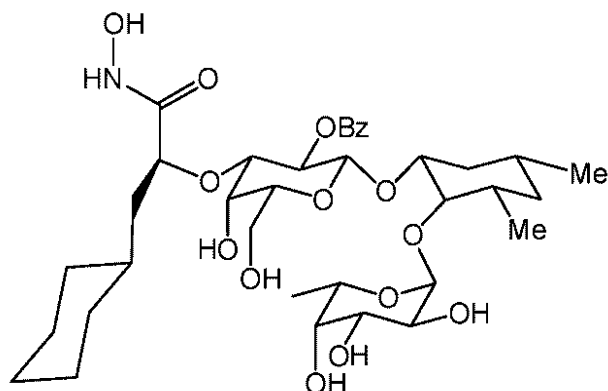


を有し、ここで、M e が、メチルであり、E t が、エチルであり、B z が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 1 9】

前記化合物が、式：

【化 1 3 4】



を有し、ここで、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 2 0】

前記化合物が、それに結合したポリエチレングリコールを有する、請求項 1 から 1 9 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 2 1】

前記化合物が、ポリエチレングリコールによって該化合物の別のものに結合している、請求項 1 から 1 9 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 2 2】

前記内皮機能不全が、血管異常である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 2 3】

前記血管異常が、糖尿病に伴う、請求項 2 2 に記載の組成物。

【請求項 2 4】

前記血管異常が、鎌状赤血球症に伴う、請求項 2 2 に記載の組成物。

【請求項 2 5】

前記血管異常が、動脈硬化症に伴う、請求項 2 2 に記載の組成物。

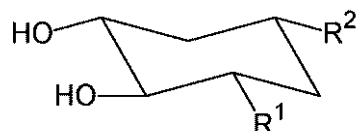
【請求項 2 6】

前記個体が、アスピリンまたは動脈硬化症に有用なアスピリン代用品によっても治療されている、請求項 2 5 に記載の組成物。

【請求項 2 7】

移植片対宿主病を治療するために有効な量で、少なくとも 1 種のシクロヘキサン誘導体を含むオリゴ糖またはグリコミメティック化合物を含む、個体における移植片対宿主病を治療するための組成物であって、ここで、該シクロヘキサン誘導体は、式：

【化 1 3 5】



を有し、
式中、

$R^1 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリーールまたはヘテロアリーール（これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、OH、または $NH X$ の 1 種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリーールまたはヘテロアリーールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよ

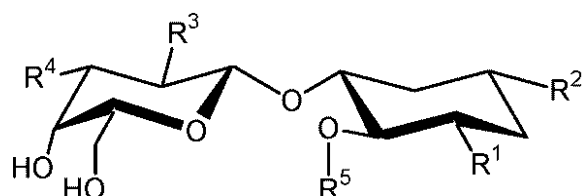
い) ; $C(=O)OX$ 、 $C(=O)OX$ で置換されたアルカニル、 $C(=O)NHX$ 、 $C(=O)NHX$ で置換されたアルカニル ($X = C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよい) ; OX 、 NHX ($X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよい) ;

$R^2 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリール (これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、 OH 、または NHX の 1 種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよい) ; $-C(=O)OX$ (X は、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよい) ; $-C(=O)NH(CH_2)_nNH_2$ ($n = 0 \sim 30$)、 $C(=O)NHX$ または CX_2OH ($X = C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよい) ; OX 、 NHX 、 $NH(=O)X$ ($X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよい) ; 但し、 R^1 および R^2 は、同時に H であることはなく ; 該シクロヘキサン誘導体は、 OH 、 R^1 または R^2 において該オリゴ糖またはグリコミメティック化合物に少なくとも結合している、組成物。

【請求項 28】

前記化合物が、

【化 136】



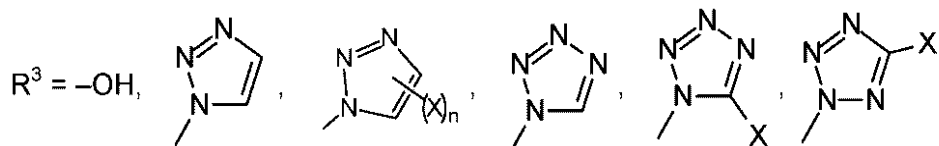
を含み、
式中、

$R^1 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリール (これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、 OH 、または NHX の 1 種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよい) ; $C(=O)OX$ 、 $C(=O)OX$ で置換されたアルカニル、 $C(=O)NHX$ 、 $C(=O)NHX$ で置換されたアルカニル ($X = C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種ま

たは複数で置換されていてよい) ; OX 、 NHX ($\text{X} = \text{H}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキニル、ハロゲン化 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよい) ;

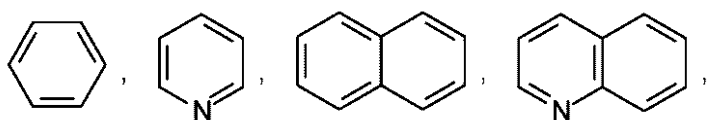
$\text{R}^2 = \text{H}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキニル、ハロゲン化 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリール (これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、 OH 、または NHX の 1 種または複数で置換されていてよく、ここで、 $\text{X} = \text{H}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキニル、ハロゲン化 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよい) ; $-\text{C}(=\text{O})\text{OX}$ (X は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよい) ; $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}(\text{CH}_2)_n\text{NH}_2$ ($n = 0 \sim 30$)、 $\text{C}(=\text{O})\text{NHX}$ または CX_2OH ($\text{X} = \text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキニル、ハロゲン化 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよい) ; OX 、 NHX 、 $\text{NH}(=\text{O})\text{X}$ ($\text{X} = \text{H}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキニル、ハロゲン化 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよい) ; 但し、 R^1 および R^2 は、同時に H であることはなく ;

【化 1 3 7】

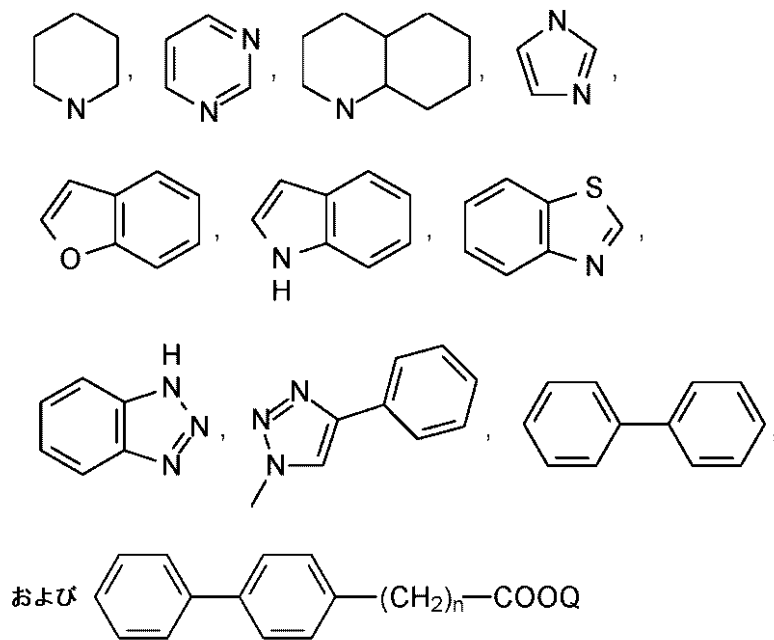


$-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{X}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-\text{NHX}$ 、または $-\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-\text{X}$ であり、ここで、 $n = 0 \sim 2$ であり、 X は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキニル、

【化 1 3 8】

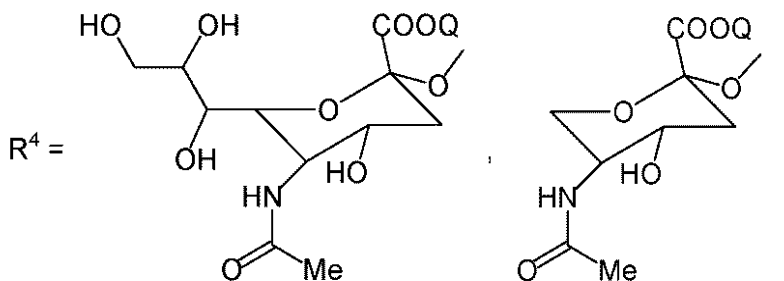


【化 1 3 9】



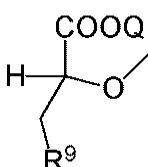
から独立に選択され、ここで、Qは、Hであるか、または生理学的に許容される塩、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(\text{CH}_2)_m$ -アリールまたは $(\text{CH}_2)_m$ -ヘテロアリールであり、ここで、mは、1～10であり、ここで、 $n = 0 \sim 10$ であり、上記環化合物のいずれも、Cl、F、 CF_3 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルコキシ、 NO_2 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{14}$ アリール、またはOY、 $\text{C}(=\text{O})\text{OY}$ 、 NY_2 または $\text{C}(=\text{O})\text{NHY}$ から独立に選択される1から3個のもので置換されていてよく、ここで、Yは、H、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキニル、または $\text{C}_1 \sim \text{C}_{14}$ アリールであり；

【化 1 4 0】



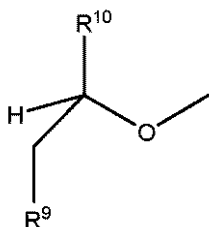
6' 硫酸化 GlcNAc、6' カルボキシル化 GlcNAc、6' 硫酸化 GalNAc、6' 硫酸化ガラクトース、6' カルボキシル化ガラクトース、

【化 1 4 1】

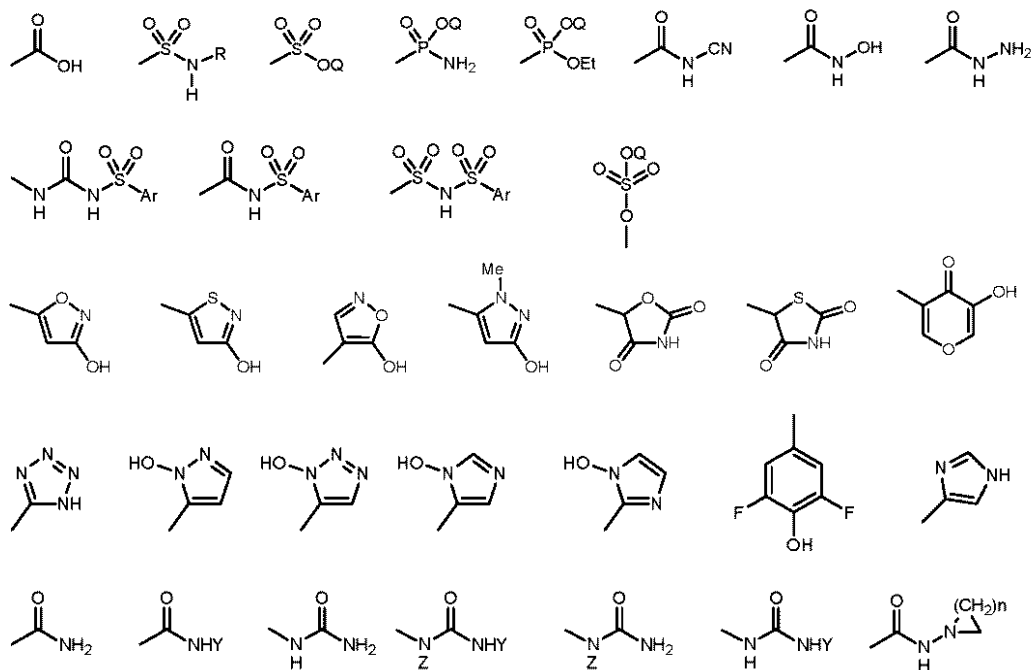


(ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩または $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(\text{CH}_2)_n$ -ア

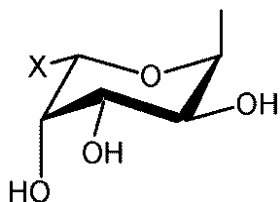
【化 1 4 2】



【化 1 4 3】

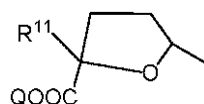


【化 1 4 4】



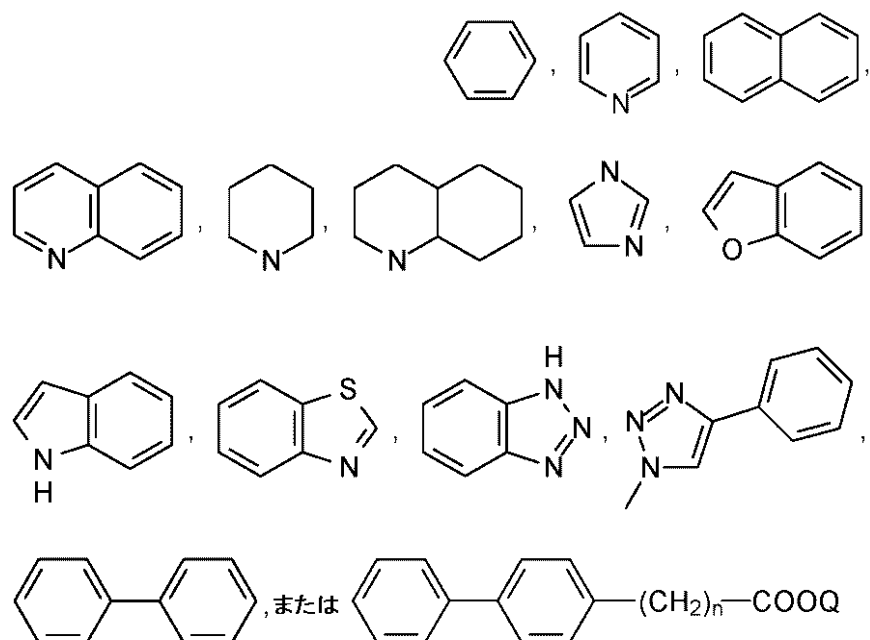
(ここで、 $X = CF_3$ 、シクロプロピルまたはフェニルである)、または

【化 1 4 5】



(ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_m$ -アリールまたは $(CH_2)_m$ -ヘテロアリールであり、ここで、mは、1～10であり、ここで、 R^{11} は、アリール、ヘテロアリール、

【化 1 4 6】



であり、ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_m$ -アリールまたは $(CH_2)_m$ -ヘテロアリールであり、ここで、mは、1～10であり、ここで、 $n = 0 \sim 10$ であり、上記環化合物のいずれの1つも、Cl、F、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニルまたはOYから独立に選択される1から3個のもので置換されていてよく、ここで、Yは、H、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_1 \sim C_8$ アルキニルである)である、請求項27に記載の組成物。

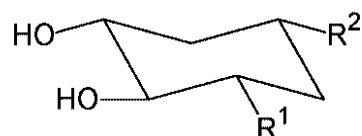
【請求項 2 9】

前記化合物が、請求項28に記載の化合物からなる、請求項27に記載の組成物。

【請求項 3 0】

皮膚T細胞リンパ腫を治療するために有効な量で、少なくとも1種のシクロヘキサン誘導体を含むオリゴ糖またはグリコミメティック化合物を含む、個体における皮膚T細胞リンパ腫を治療するための組成物であって、ここで、該シクロヘキサン誘導体は、式：

【化 1 4 7】



を有し、

式中、

$R^1 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロ

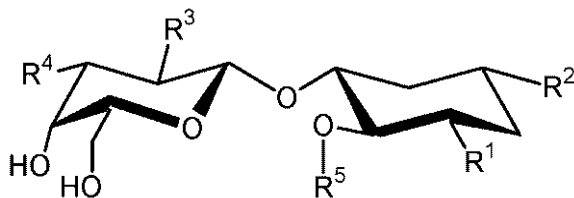
ゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリール（これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、OH、またはNHXの1種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； $C(=O)OX$ 、 $C(=O)OX$ で置換されたアルカニル、 $C(=O)NHX$ 、 $C(=O)NHX$ で置換されたアルカニル（ $X = C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； OX 、 NHX （ $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）；

$R^2 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリール（これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、OH、またはNHXの1種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； $-C(=O)OX$ （ X は、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； $-C(=O)NH(CH_2)_nNH_2$ （ $n = 0 \sim 30$ ）、 $C(=O)NHX$ または CX_2OH （ $X = C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； OX 、 NHX 、 $NH(=O)X$ （ $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）；但し、 R^1 および R^2 は、同時にHであることはなく；該シクロヘキサン誘導体は、OH、 R^1 または R^2 において該オリゴ糖またはグリコミメティック化合物に少なくとも結合している、組成物。

【請求項31】

前記化合物が、

【化148】



を含み、

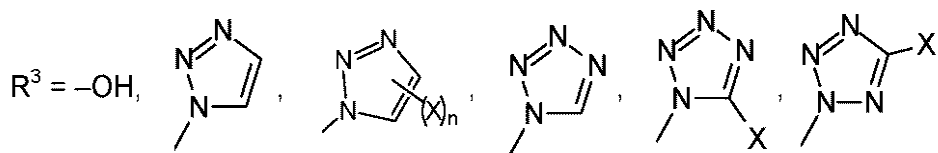
式中、

$R^1 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリール（これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、OH、またはNHXの1種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよ

い) ; $C(=O)OX$ 、 $C(=O)OX$ で置換されたアルカニル、 $C(=O)NHX$ 、 $C(=O)NHX$ で置換されたアルカニル ($X = C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよい) ; OX 、 NHX ($X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよい) ;

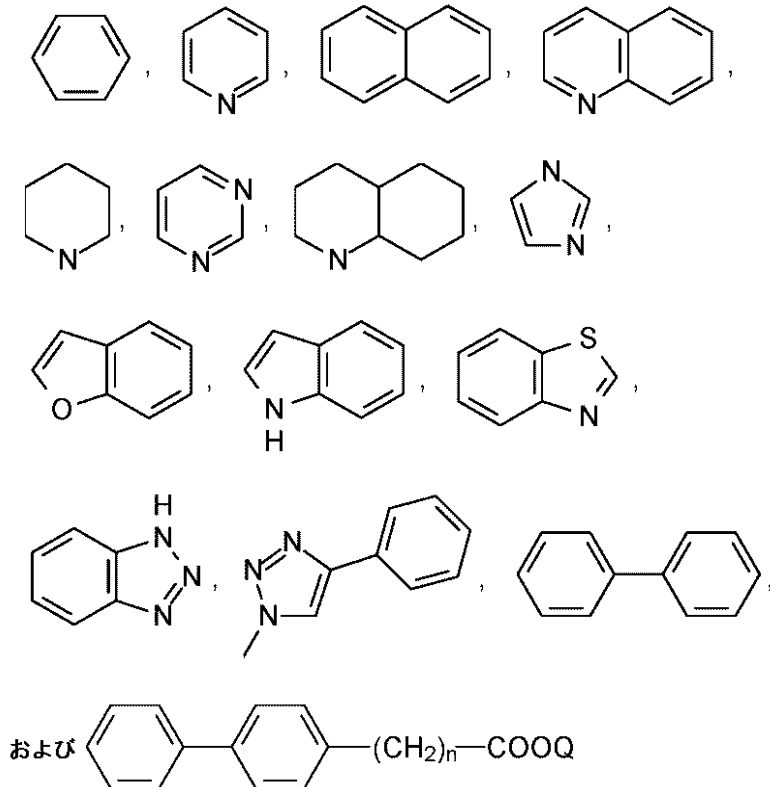
$R^2 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリール (これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、 OH 、または NHX の 1 種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよい) ; $-C(=O)OX$ (X は、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよい) ; $-C(=O)NH(CH_2)_nNH_2$ ($n = 0 \sim 30$)、 $C(=O)NHX$ または CX_2OH ($X = C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよい) ; OX 、 NHX 、 $NH(=O)X$ ($X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、または OH の 1 種または複数で置換されていてよい) ; 但し、 R^1 および R^2 は、同時に H であることはなく ;

【化 1 4 9】



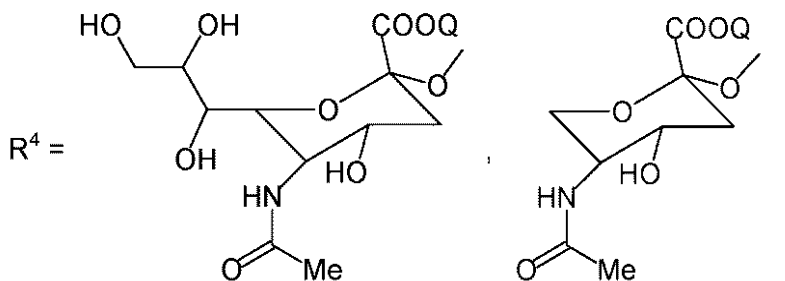
$-O-C(=O)-X$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH-C(=O)-NHX$ 、または $-NH-C(=O)-X$ であり、ここで、 $n = 0 \sim 2$ であり、 X は、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、

【化 1 5 0】



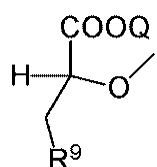
から独立に選択され、ここで、Qは、Hであるか、または生理学的に許容される塩、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(\text{CH}_2)_m$ -アリールまたは $(\text{CH}_2)_m$ -ヘテロアリールであり、ここで、mは、1～10であり、ここで、 $n = 0 \sim 10$ であり、上記環化合物のいずれも、Cl、F、 CF_3 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルコキシ、 NO_2 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{14}$ アリール、またはOY、 $\text{C}(=\text{O})\text{OY}$ 、 NY_2 または $\text{C}(=\text{O})\text{NHY}$ から独立に選択される1から3個のもので置換されていてよく、ここで、Yは、H、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキニル、または $\text{C}_1 \sim \text{C}_{14}$ アリールであり；

【化 1 5 1】



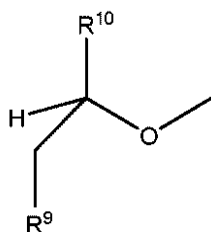
6' 硫酸化 GlcNAc、6' カルボキシル化 GlcNAc、6' 硫酸化 GalNAc、6' 硫酸化ガラクトース、6' カルボキシル化ガラクトース、

【化 1 5 2】



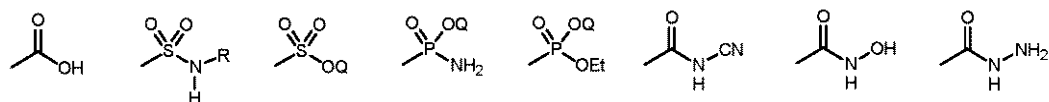
(ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩または $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_n$ -アリールまたは $(CH_2)_n$ -ヘテロアリールであり、ここで、nは、1～10であり、ここで、 R^9 は、アリール、ヘテロアリール、シクロヘキサン、t-ブタン、アダマンタン、またはトリアゾールであり、 R^9 のいずれも、Cl、F、 CF_3 、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 NO_2 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニルまたはOY、 $C(=O)OY$ 、 NY_2 または $C(=O)NHY$ から独立に選択される1から3個のもので置換されていてよく、ここで、Yは、H、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニルまたは $C_1 \sim C_{14}$ アリールである)；または

【化153】

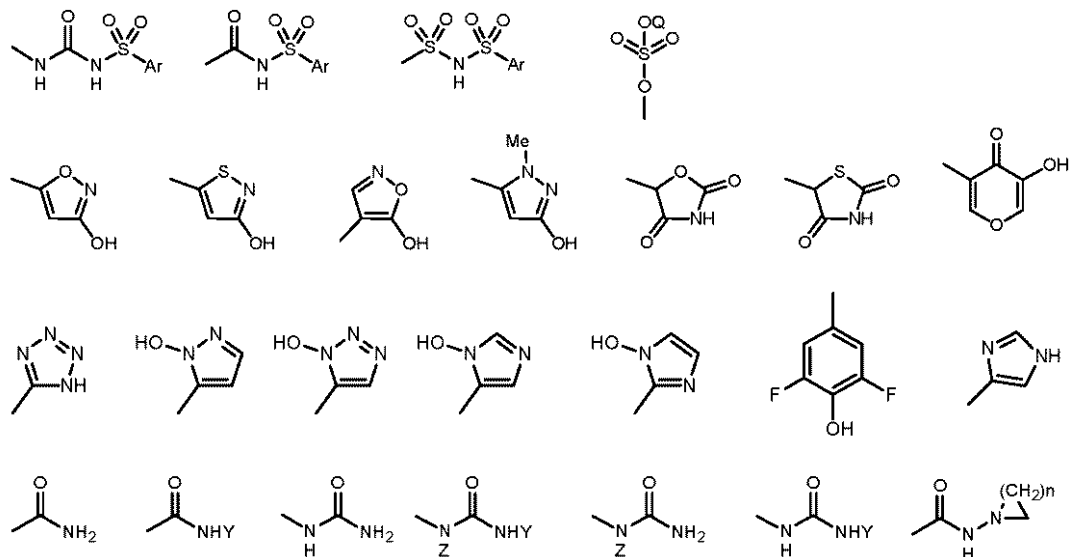


(ここで、 R^{10} は、

【化154】



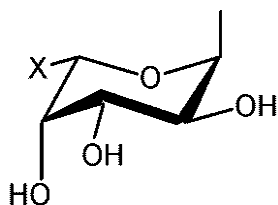
【化155】



の1つであり、ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_m$ -アリールまたは $(CH_2)_m$ -ヘテロアリールであり、ここで、mは、1～10であり、n = 1～4であり、ZおよびY = $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリール、およびMe、OMe、ハロゲン化物、OHで置換されたヘテロアリールである)であり；

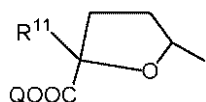
$R^5 = H$ 、D-マンノース、L-ガラクトース、D-アラビノース、L-フコース、ポリオール、

【化 1 5 6】



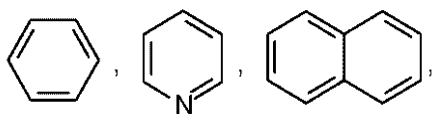
(ここで、 $X = CF_3$ 、シクロプロピルまたはフェニルである)、または

【化 1 5 7】

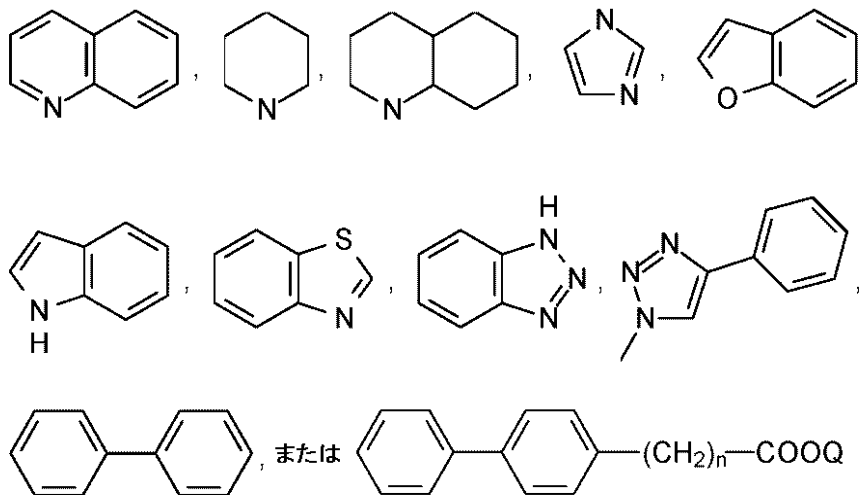


(ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_m$ -アリールまたは $(CH_2)_m$ -ヘテロアリールであり、ここで、mは、1～10であり、ここで、 R^{11} は、アリール、ヘテロアリール、

【化 1 5 8】



【化 1 5 9】



であり、ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_m$ -アリールまたは $(CH_2)_m$ -ヘテロアリールであり、ここで、mは、1～10であり、ここで、 $n = 0 \sim 10$ であり、上記環化合物のいずれの1つも、Cl、F、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニルまたはOYから独立に選択される1から3個のもので置換されていてよく、ここで、Yは、H、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_1 \sim C_8$ アルキニルである)である、請求項30に記載の組成物。

【請求項 3 2】

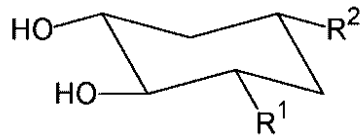
前記化合物が、請求項31に記載の化合物からなる、請求項30に記載の組成物。

【請求項 3 3】

皮膚中の炎症細胞が関与する疾患を治療するために有効な量で、少なくとも1種のシクロヘキサン誘導体を含むオリゴ糖またはグリコシメティック化合物を含む、個体にお

ける皮膚の炎症細胞が関与する疾患を治療するための組成物であって、ここで、該シクロヘキサン誘導体は、式：

【化 1 6 0】



を有し、

式中、

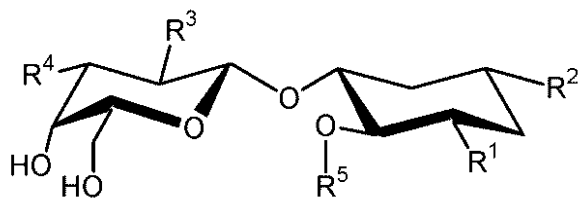
$R^1 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリール（これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、OH、またはNHXの1種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； $C(=O)OX$ 、 $C(=O)OX$ で置換されたアルカニル、 $C(=O)NHX$ 、 $C(=O)NHX$ で置換されたアルカニル（ $X = C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； OX 、 NHX （ $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）；

$R^2 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリール（これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、OH、またはNHXの1種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； $-C(=O)OX$ （ X は、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； $-C(=O)NH(CH_2)_nNH_2$ （ $n = 0 \sim 30$ ）、 $C(=O)NHX$ または CX_2OH （ $X = C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； OX 、 NHX 、 $NH(=O)X$ （ $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）；但し、 R^1 および R^2 は、同時にHであることはなく；該シクロヘキサン誘導体は、OH、 R^1 または R^2 において該オリゴ糖またはグリコミメティック化合物に少なくとも結合している、組成物。

【請求項 3 4】

前記化合物が、

【化 1 6 1】



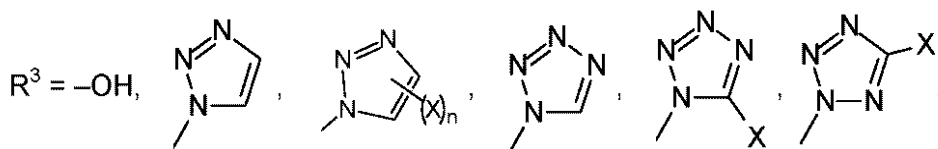
を含み、

式中、

$R^1 = \text{H}$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリール（これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、OH、またはNHXの1種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = \text{H}$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； $C(=O)OX$ 、 $C(=O)OX$ で置換されたアルカニル、 $C(=O)NHX$ 、 $C(=O)NHX$ で置換されたアルカニル（ $X = C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； OX 、 NHX （ $X = \text{H}$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）；

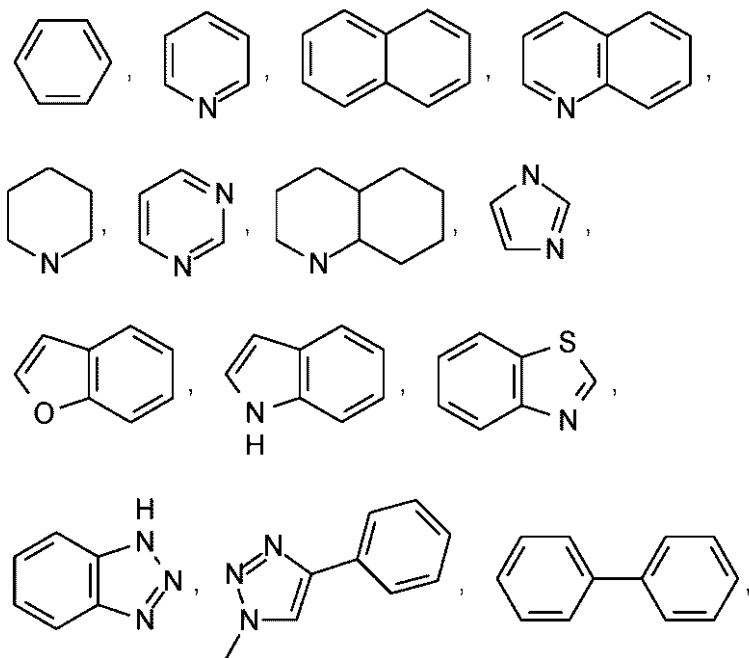
$R^2 = \text{H}$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリール（これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、OH、またはNHXの1種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = \text{H}$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； $-C(=O)OX$ （ X は、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； $-C(=O)NH(CH_2)_nNH_2$ （ $n = 0 \sim 30$ ）、 $C(=O)NHX$ または CX_2OH （ $X = C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； OX 、 NHX 、 $NH(=O)X$ （ $X = \text{H}$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）；但し、 R^1 および R^2 は、同時にHであることはなく；

【化 1 6 2】

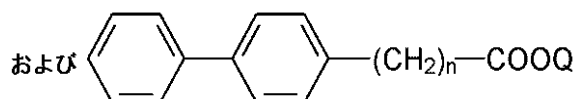


$-O-C(=O)-X$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH-C(=O)-NHX$ 、または $-NH-C(=O)-X$ であり、ここで、 $n = 0 \sim 2$ であり、 X は、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、

【化 1 6 3】

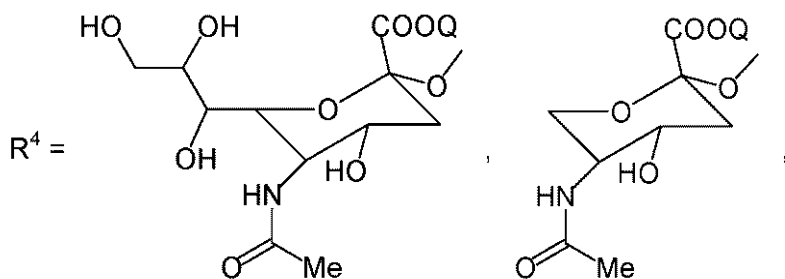


【化 1 6 4】



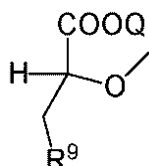
から独立に選択され、ここで、Qは、Hであるか、または生理学的に許容される塩、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_m$ -アリールまたは $(CH_2)_m$ -ヘテロアリールであり、ここで、mは、1～10であり、ここで、 $n = 0 \sim 10$ であり、上記環化合物のいずれも、Cl、F、 CF_3 、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 NO_2 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、 $C_1 \sim C_{14}$ アリール、またはOY、 $C(=O)OY$ 、 NY_2 または $C(=O)NHY$ から独立に選択される1から3個のもので置換されていてよく、ここで、Yは、H、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、または $C_1 \sim C_{14}$ アリールであり；

【化 1 6 5】



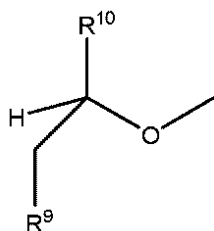
6' 硫酸化 GlcNAc、6' カルボキシル化 GlcNAc、6' 硫酸化 GalNAc、6' 硫酸化ガラクトース、6' カルボキシル化ガラクトース、

【化 1 6 6】



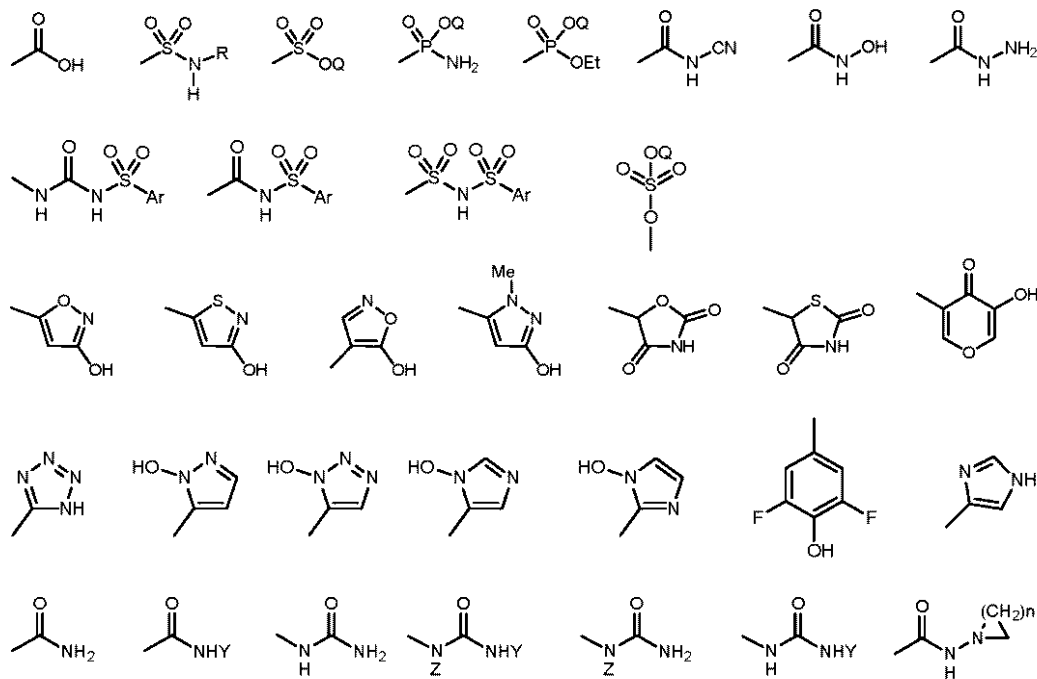
(ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩または $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_n$ -アリールまたは $(CH_2)_n$ -ヘテロアリールであり、ここで、nは、1~10であり、ここで、 R^9 は、アリール、ヘテロアリール、シクロヘキサン、t-ブタン、アダマンタン、またはトリアゾールであり、 R^9 のいずれも、 Cl 、F、 CF_3 、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 NO_2 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニルまたは OY 、 $C(=O)OY$ 、 NY_2 または $C(=O)NHY$ から独立に選択される1から3個のもので置換されていてよく、ここで、Yは、H、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニルまたは $C_1 \sim C_{14}$ アリールである)；または

【化 1 6 7】



(ここで、 R^{10} は、

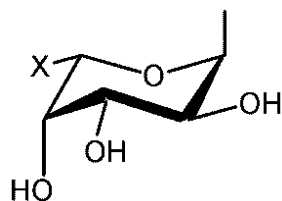
【化 1 6 8】



の1つであり、ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_m$ -アリールまたは $(CH_2)_m$ -ヘテロアリールであり、ここで、mは、1~10であり、n = 1~4であり、ZおよびY = $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリール、およびMe、OMe、ハロゲン化物、OHで置換されたヘテロアリールである)であり；

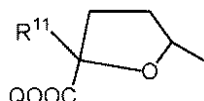
$R^5 = H$ 、D - マンノース、L - ガラクトース、D - アラビノース、L - フコース、ポリオール、

【化 1 6 9】



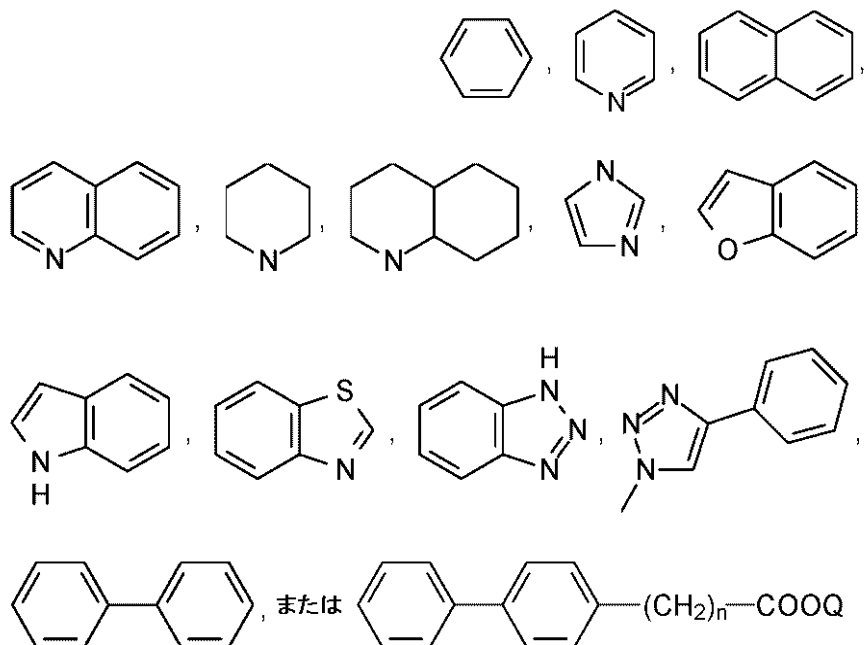
(ここで、 $X = CF_3$ 、シクロプロピルまたはフェニルである)、または

【化 1 7 0】



(ここで、Q は、H または生理学的に許容される塩、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_m$ - アリールまたは $(CH_2)_m$ - ヘテロアリールであり、ここで、m は、1 ~ 10 であり、ここで、 R^{11} は、アリール、ヘテロアリール、

【化 1 7 1】



であり、ここで、Q は、H または生理学的に許容される塩、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_m$ - アリールまたは $(CH_2)_m$ - ヘテロアリールであり、ここで、m は、1 ~ 10 であり、ここで、 $n = 0 \sim 10$ であり、上記環化合物のいずれの 1 つも、Cl、F、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニルまたは OY から独立に選択される 1 から 3 個のもので置換されていてよく、ここで、Y は、H、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニルまたは $C_1 \sim C_8$ アルキニルである) である、請求項 33 に記載の組成物。

【請求項 35】

前記化合物が、請求項 34 に記載の化合物からなる、請求項 33 に記載の組成物。

【請求項 36】

前記疾患が、皮膚炎である、請求項 33 から 35 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 37】

前記疾患が、慢性湿疹である、請求項 33 から 35 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 38】

前記疾患が、乾癬である、請求項 33 から 35 のいずれか一項に記載の組成物。