

【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

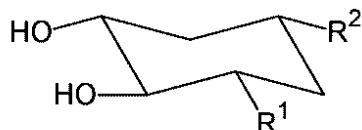
【補正の内容】

【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、

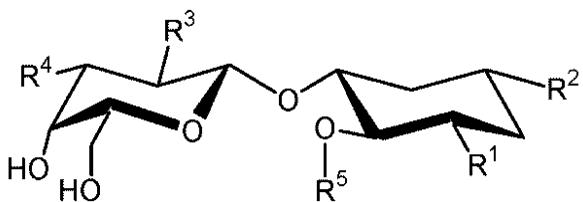
$R^1 = H, C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリール（これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、OH、またはNH_Xの1種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H, C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、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2】

前記化合物が、

【化108】



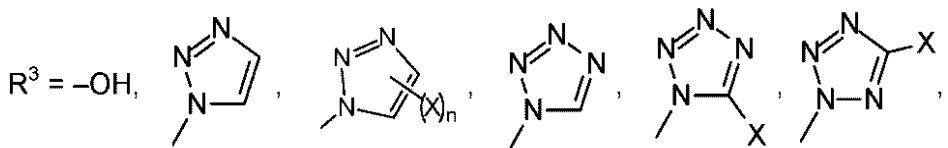
を含み、

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 、 NH_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）；

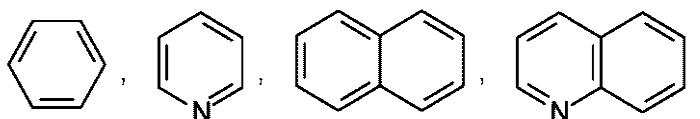
$R^2 = H, C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリール（これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、OH、またはNH_Xの1種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H, C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、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 、 NH_X 、 $NH(=O)X$ （ $X = H, C_1 \sim C_8$ 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109】

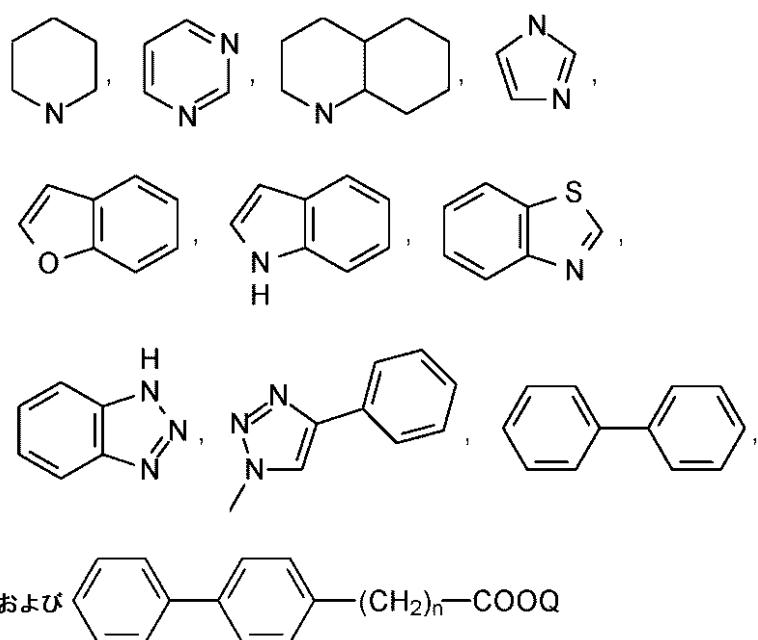


- $O-C(=O)-X$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH-C(=O)-NHX$ 、または $-NH-C(=O)-X$ であり、ここで、 $n = 0 \sim 2$ であり、 X は、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$

アルケニル、C₁ ~ C₈ アルキニル、
【化110】

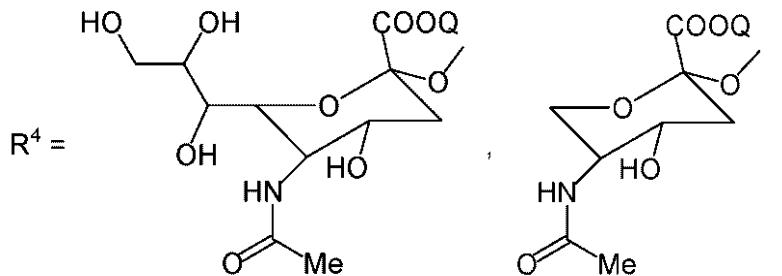


【化111】



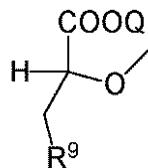
から独立に選択され、ここで、Qは、Hであるか、または生理学的に許容される塩、C₁ ~ C₈ アルカニル、C₁ ~ C₈ アルケニル、C₁ ~ C₈ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、(CH₂)_m-アリールまたは(CH₂)_m-ヘテロアリールであり、ここで、mは、1 ~ 10であり、ここで、n = 0 ~ 10であり、上記環化合物のいずれも、C₁、F、CF₃、C₁ ~ C₈ アルコキシ、NO₂、C₁ ~ C₈ アルカニル、C₁ ~ C₈ アルケニル、C₁ ~ C₈ アルキニル、C₁ ~ C₁₄ アリール、またはOY、C(=O)OY、NY₂またはC(=O)NHYから独立に選択される1から3個のもので置換されていてよ^く、ここで、Yは、H、C₁ ~ C₈ アルカニル、C₁ ~ C₈ アルケニル、C₁ ~ C₈ アルキニル、またはC₁ ~ C₁₄ アリールであり；

【化112】



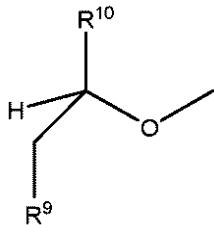
6' 硫酸化 GlcNAc、6' カルボキシル化 GlcNAc、6' 硫酸化 GalNAc、
6' 硫酸化ガラクトース、6' カルボキシル化ガラクトース、

【化113】



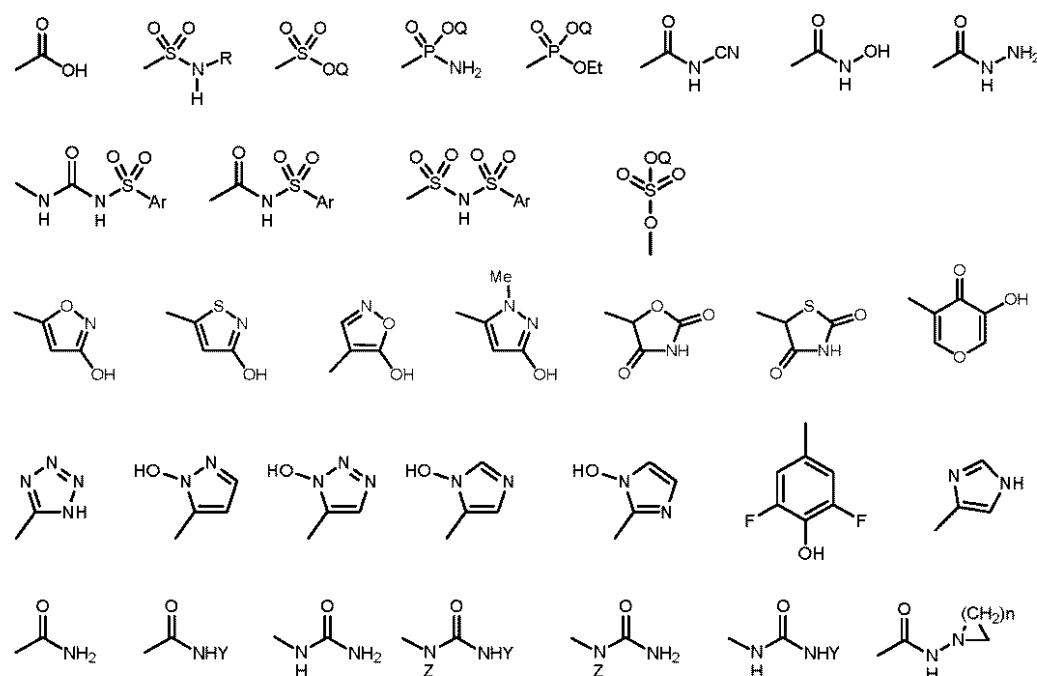
(ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩またはC₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、アリール、ヘテロアリール、(CH₂)_n-アリールまたは(CH₂)_n-ヘテロアリールであり、ここで、nは、1～10であり、ここで、R⁹は、アリール、ヘテロアリール、シクロヘキサン、t-ブタン、アダマンタン、またはトリアゾールであり、R⁹のいずれも、C1、F、CF₃、C₁～C₈アルコキシ、NO₂、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニルまたはOY、C(=O)OY、NY₂またはC(=O)NHYから独立に選択される1から3個のもので置換されていてよく、ここで、Yは、H、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニルまたはC₁～C₁₄アリールである)；または

【化114】



(ここで、R¹⁰は、

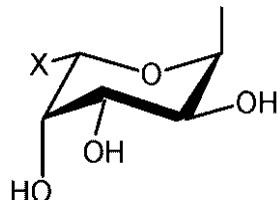
【化115】



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、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、アリール、ヘテロアリール、(CH₂)_m-アリールまたは(CH₂)_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=C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、ハロゲン化C₁～C₈アルカニル、アリール、およびMe、OMe

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】



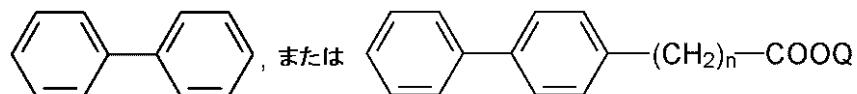
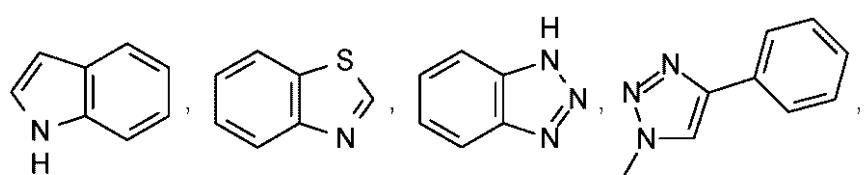
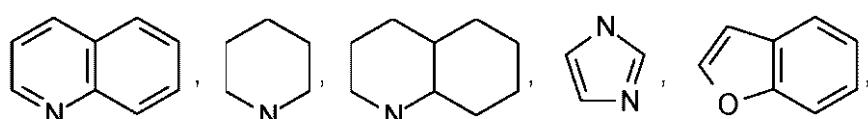
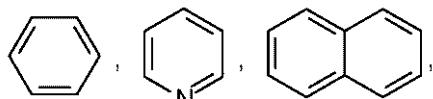
(ここで、 $X = CF_3$ 、シクロプロピルまたはフェニルである)、または

【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、C1、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。

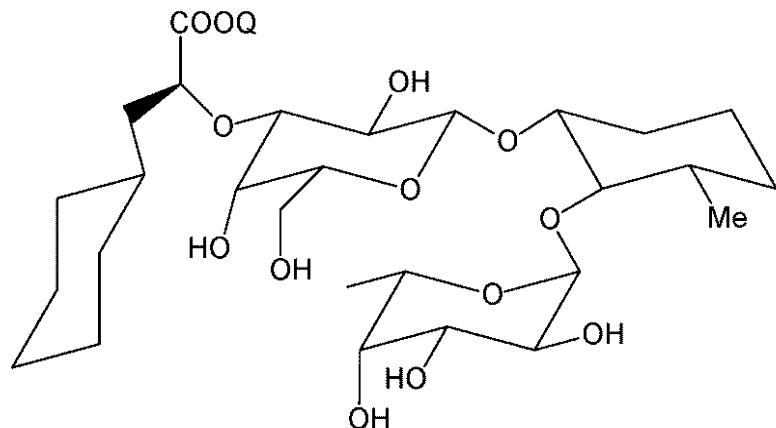
【請求項3】

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119】

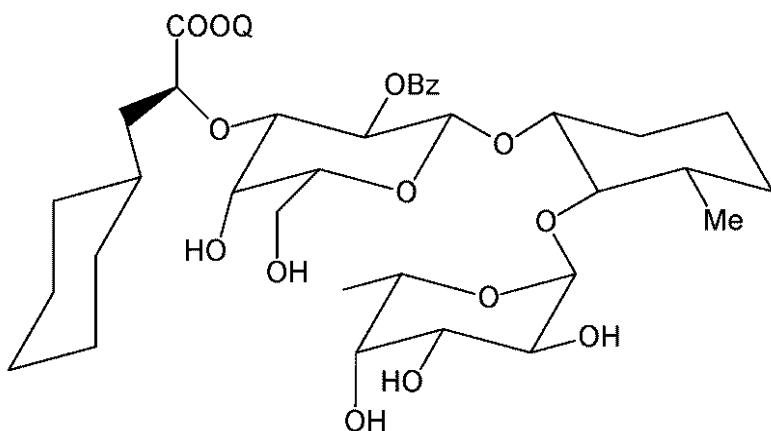


を有し、ここで、Qが、Hまたは生理学的に許容される塩であり、Meが、メチルである、請求項1に記載の組成物。

【請求項5】

前記化合物が、式：

【化120】

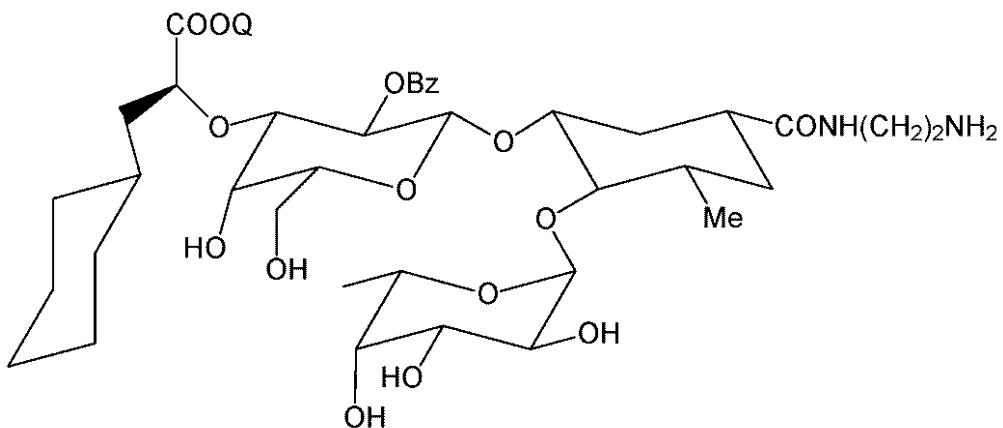


を有し、ここで、Qが、Hまたは生理学的に許容される塩であり、Meが、メチルであり、Bzが、ベンゾイルである、請求項1に記載の組成物。

【請求項6】

前記化合物が、式：

【化121】

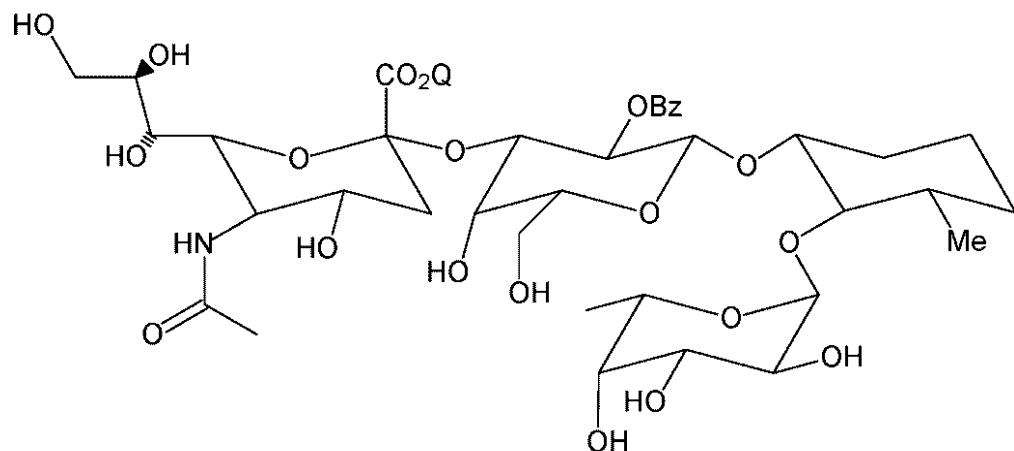


を有し、ここで、Qが、Hまたは生理学的に許容される塩であり、Meが、メチルであり、Bzが、ベンゾイルである、請求項1に記載の組成物。

【請求項 7】

前記化合物が、式：

【化 1 2 2】

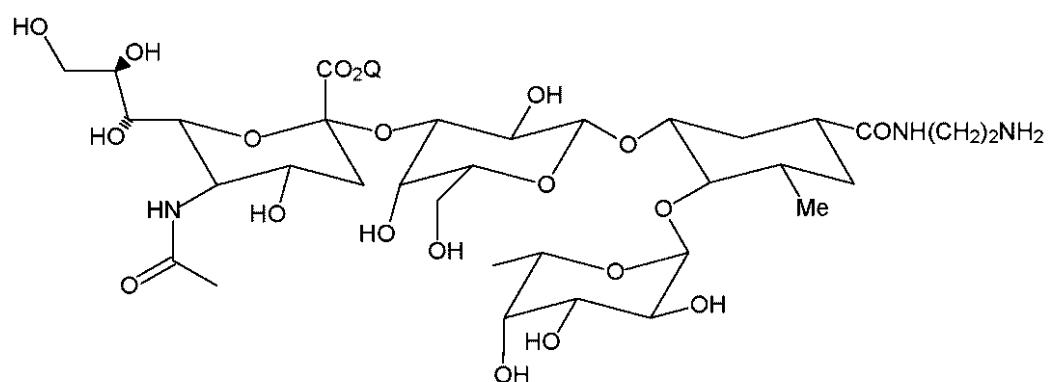


を有し、ここで、Qが、Hまたは生理学的に許容される塩であり、Meが、メチルであり、Bzが、ベンゾイルである、請求項1に記載の組成物。

【請求項 8】

前記化合物が、式：

【化 1 2 3】

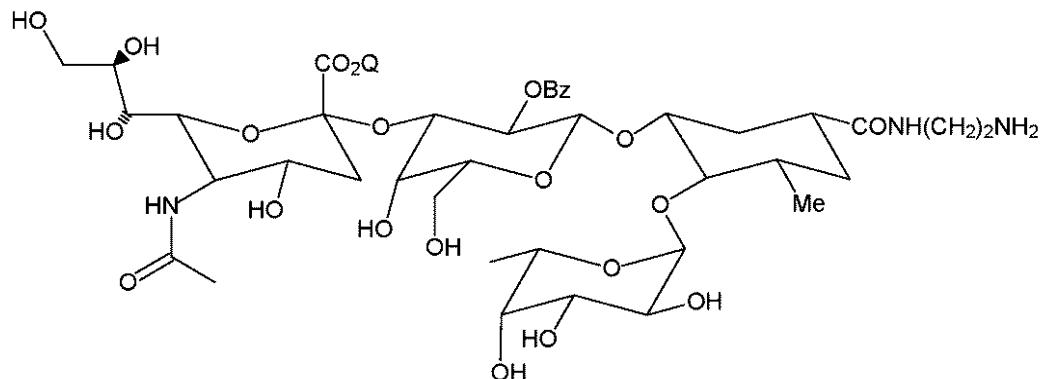


を有し、ここで、Qが、Hまたは生理学的に許容される塩であり、Meが、メチルである、請求項1に記載の組成物。

【請求項 9】

前記化合物が、式：

【化 1 2 4】



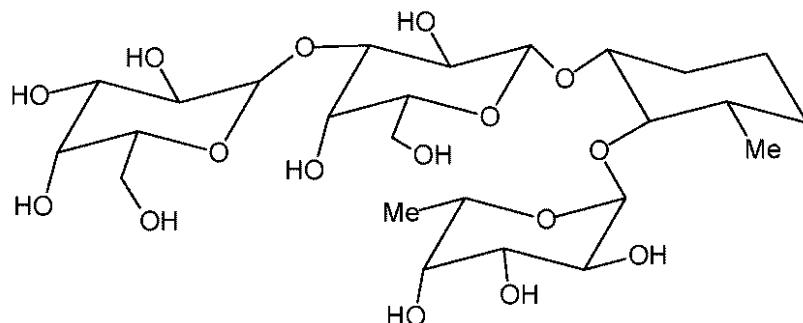
を有し、ここで、Qが、Hまたは生理学的に許容される塩であり、Meが、メチルであり

、Bzが、ベンゾイルである、請求項1に記載の組成物。

【請求項10】

前記化合物が、式：

【化125】

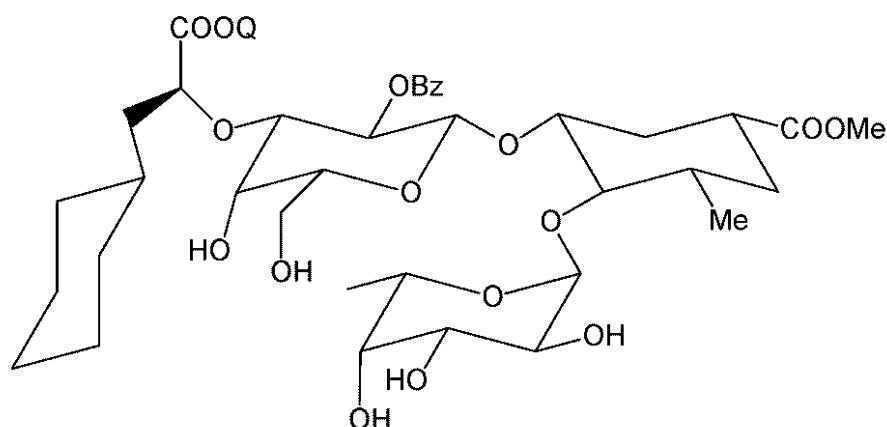


を有し、ここで、Meが、メチルである、請求項1に記載の組成物。

【請求項11】

前記化合物が、式：

【化126】

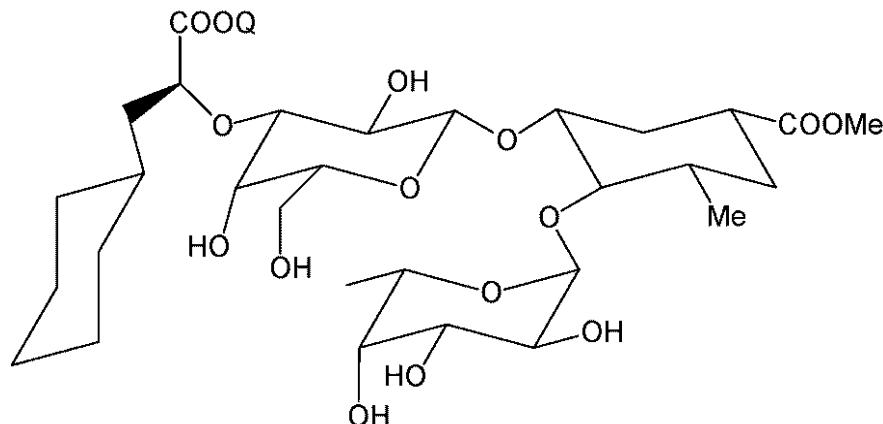


を有し、ここで、Qが、Hまたは生理学的に許容される塩であり、Meが、メチルであり、Bzが、ベンゾイルである、請求項1に記載の組成物。

【請求項12】

前記化合物が、式：

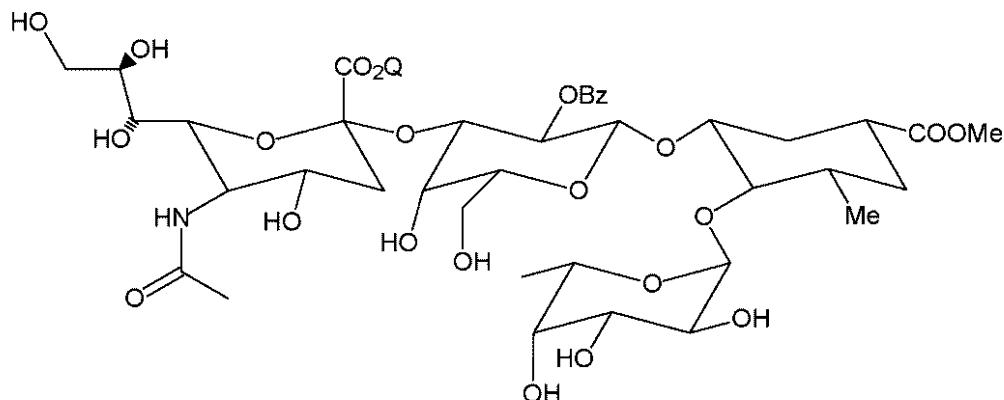
【化127】



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13】

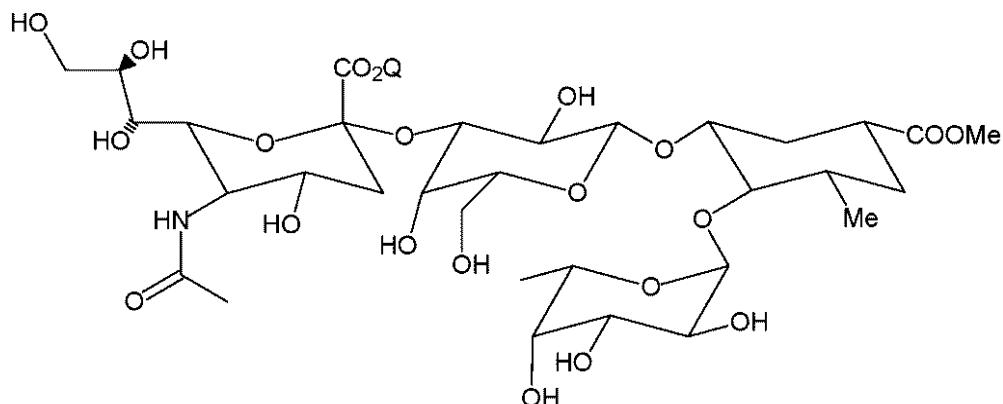
前記化合物が、式：
【化 128】



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 14】

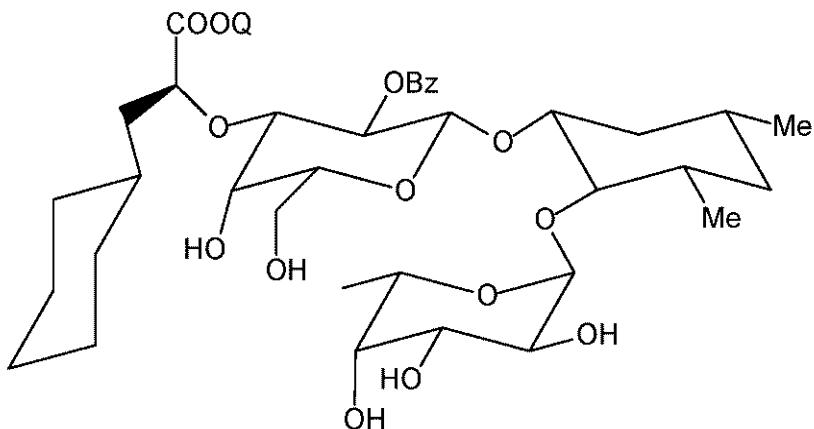
前記化合物が、式：
【化 1 2 9】



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 15】

前記化合物が、式：
【化 130】



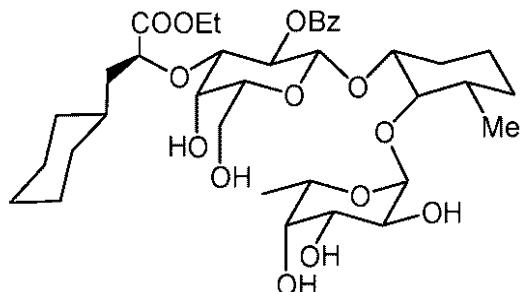
を有し、ここで、Qが、Hまたは生理学的に許容される塩であり、Meが、メチルであり

、 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 6】

前記化合物が、式：

【化 1 3 1】

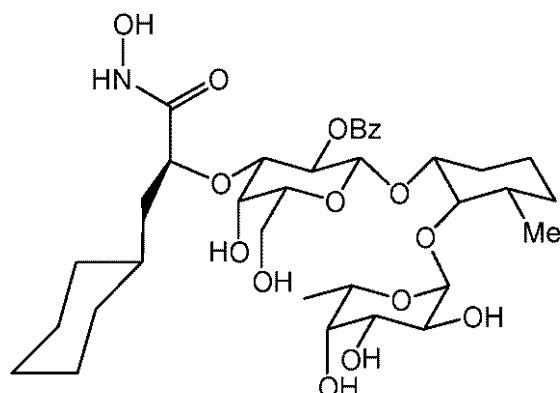


を有し、ここで、Me が、メチルであり、Et が、エチルであり、Bz が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 1 7】

前記化合物が、式：

【化 1 3 2】

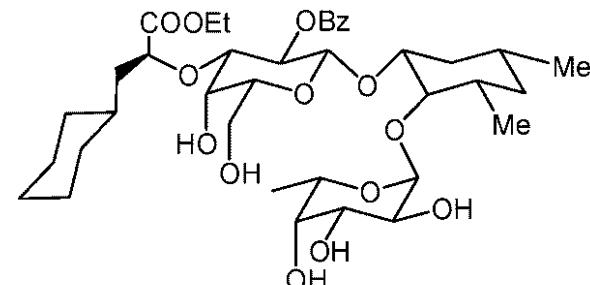


を有し、ここで、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 1 8】

前記化合物が、式：

【化 1 3 3】

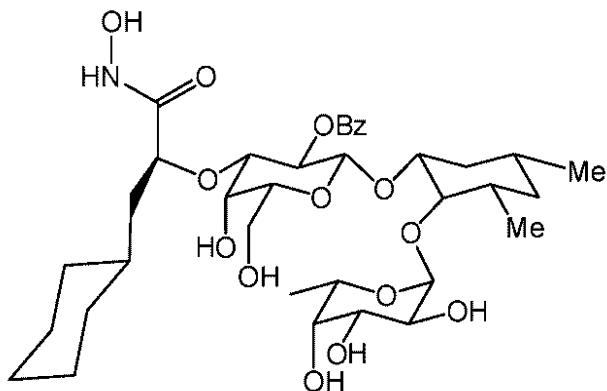


を有し、ここで、Me が、メチルであり、Et が、エチルであり、Bz が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 1 9】

前記化合物が、式：

【化134】



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20】

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19のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項21】

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とに結合している、請求項1から19のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項22】

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23】

前記血管異常が、糖尿病に伴う、請求項22に記載の組成物。

【請求項24】

前記血管異常が、鎌状赤血球症に伴う、請求項22に記載の組成物。

【請求項25】

前記血管異常が、動脈硬化症を伴う、請求項22に記載の組成物。

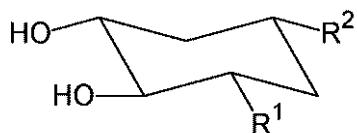
【請求項26】

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25に記載の組成物。

【請求項27】

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有するオリゴ糖またはグリコミ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135】



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

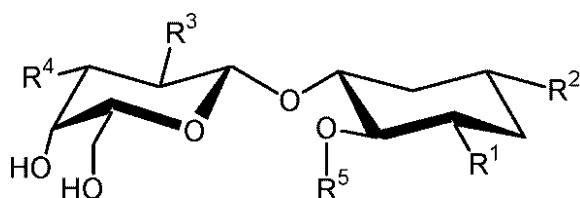
い) ; $C(=O)OX$ 、 $C(=O)OX$ で置換されたアルカニル、 $C(=O)NHX$ 、 $C(=O)NHX$ で置換されたアルカニル ($X = C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい) ; OX 、 NHX ($X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ 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、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) ; $-C(=O)NH(C_2H_2)_nNH_2$ ($n = 0 \sim 30$)、 $C(=O)NHX$ 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、

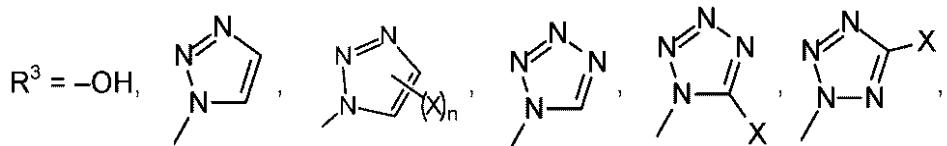
式中、

$R^1 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ 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) ; O_2X 、 NH_2X ($\text{X} = \text{H}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ 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) ;

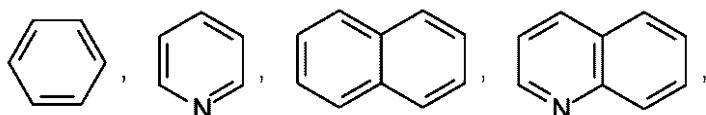
$\text{R}^2 = \text{H}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキニル、ハロゲン化 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリール (これらのいずれも、 Me 、 OMe 、ハロゲン化物、 OH 、または NH_2X の1種または複数で置換されていてよく、ここで、 $\text{X} = \text{H}$ 、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ 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) ; $-\text{C}(\text{=O})\text{NH}(\text{CH}_2)_n\text{NH}_2$ ($n = 0 \sim 30$)、 $\text{C}(\text{=O})\text{NH}_2$ 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) ; $-\text{O}_2\text{X}$ 、 $-\text{NH}_2\text{X}$ 、 $-\text{NH}-\text{C}(\text{=O})-\text{NH}_2\text{X}$ 、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137】

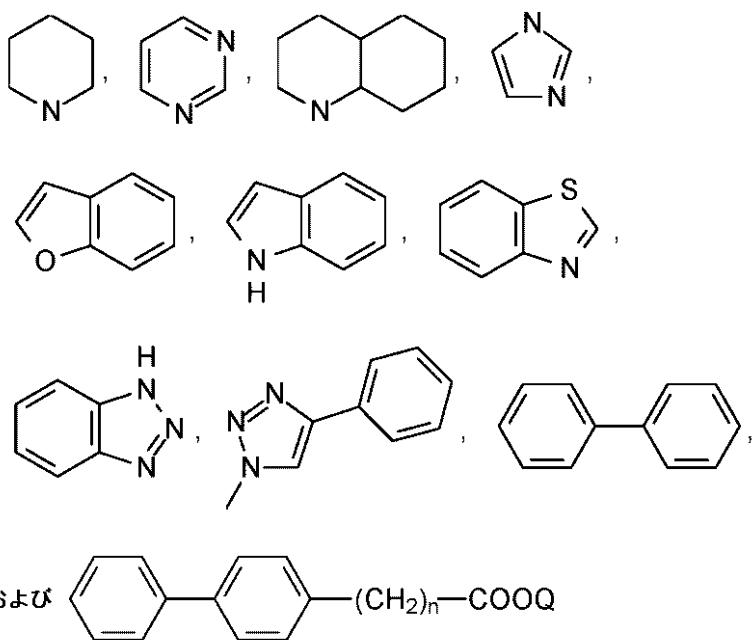


$-\text{O}-\text{C}(\text{=O})-\text{X}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}-\text{C}(\text{=O})-\text{NH}_2\text{X}$ 、または $-\text{NH}-\text{C}(\text{=O})-\text{X}$ であり、ここで、 $n = 0 \sim 2$ であり、 X は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルカニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ アルキニル、

【化138】

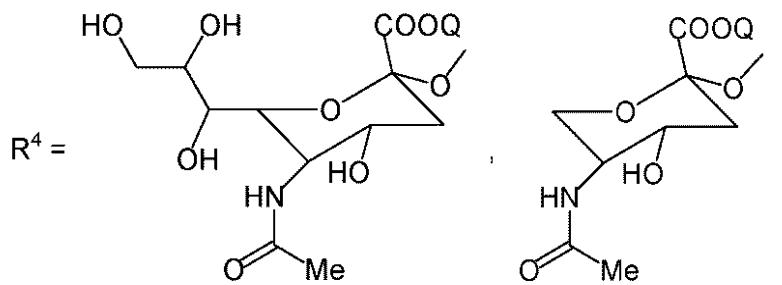


【化 1 3 9】



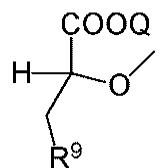
から独立に選択され、ここで、Qは、Hであるか、または生理学的に許容される塩、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、アリール、ヘテロアリール、(CH₂)_m-アリールまたは(CH₂)_m-ヘテロアリールであり、ここで、mは、1～10であり、ここで、n=0～10であり、上記環化合物のいずれも、C1、F、CF₃、C₁～C₈アルコキシ、NO₂、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、C₁～C₁₄アリール、またはOY、C(=O)OY、NY₂またはC(=O)NHYから独立に選択される1から3個のもので置換されていてよく、ここで、Yは、H、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、またはC₁～C₁₄アリールであり；

【化 1 4 0 】



6' 硫酸化 G 1 c N A c、6' カルボキシリ化 G 1 c N A c、6' 硫酸化 G a 1 N A c、
6' 硫酸化ガラクトース、6' カルボキシリ化ガラクトース、

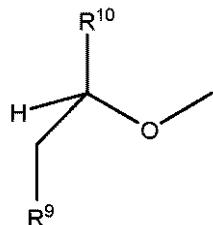
【化 1 4 1】



(ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩またはC₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、アリール、ヘテロアリール、(CH₂)_n-ア

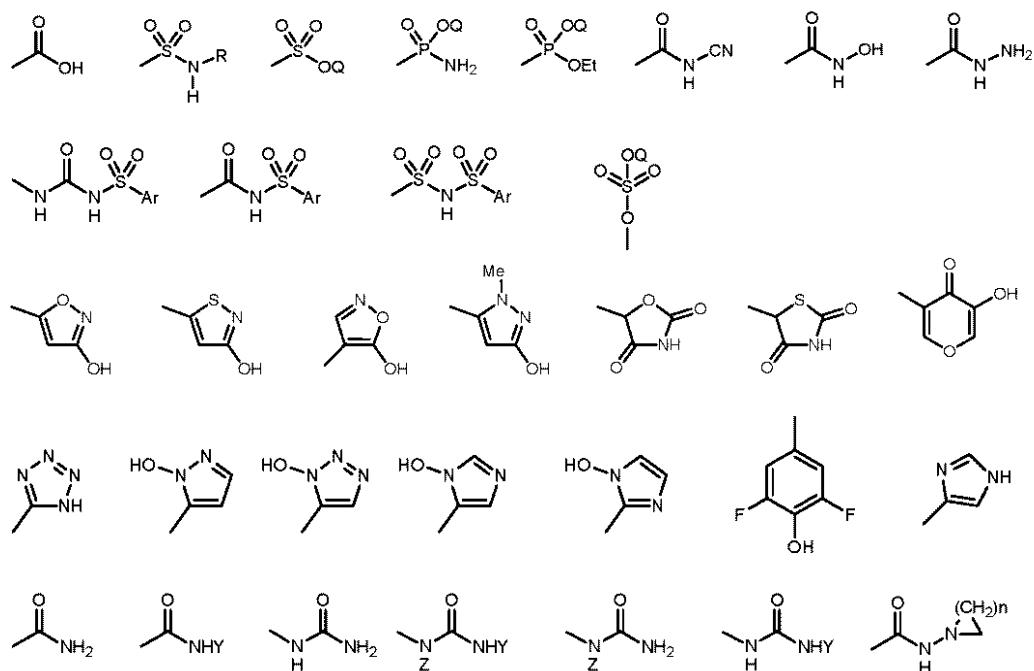
リールまたは(CH_2)_n-ヘテロアリールであり、ここで、nは、1~10であり、ここで、R⁹は、アリール、ヘテロアリール、シクロヘキサン、t-ブタン、アダマンタン、またはトリアゾールであり、R⁹のいずれも、C₁、F、CF₃、C₁~C₈アルコキシ、NO₂、C₁~C₈アルカニル、C₁~C₈アルケニル、C₁~C₈アルキニルまたはOY、C(=O)OY、NY₂またはC(=O)NHYから独立に選択される1から3個のもので置換されていてよく、ここで、Yは、H、C₁~C₈アルカニル、C₁~C₈アルケニル、C₁~C₈アルキニルまたはC₁~C₁₄アリールである)；または

【化 1 4 2】



(ここで、 $R^{1,0}$ は、

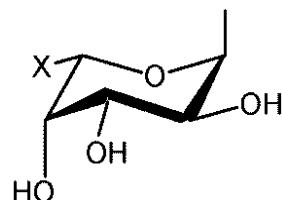
【化 1 4 3】



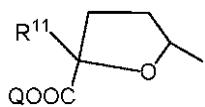
の 1 つであり、ここで、Q は、H または生理学的に許容される塩、C₁ ~ C₈ アルカニル、C₁ ~ C₈ アルケニル、C₁ ~ C₈ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、(C₂H₂)_m - アリールまたは(C₂H₂)_m - ヘテロアリールであり、ここで、m は、1 ~ 10 であり、n = 1 ~ 4 であり、Z および Y = C₁ ~ C₈ アルカニル、C₁ ~ C₈ アルケニル、C₁ ~ C₈ アルキニル、ハロゲン化 C₁ ~ C₈ アルカニル、アリール、および Me、OMe、ハロゲン化物、OH で置換されたヘテロアリールである) であり；

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 4 4】

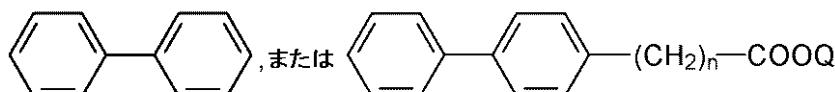
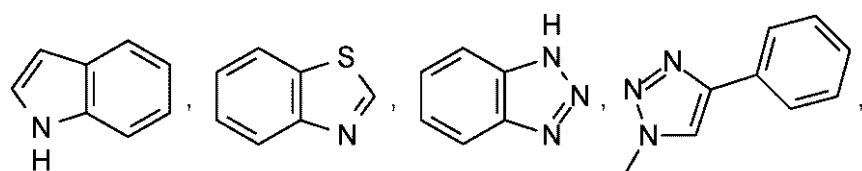
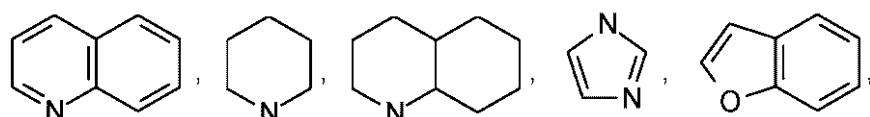
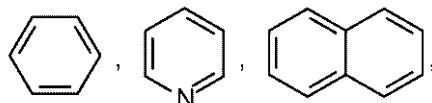


(ここで、 $X = CF_3$ 、シクロプロピルまたはフェニルである)、または
【化145】



(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146】



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、 C_1 、 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。

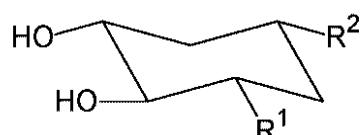
【請求項29】

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30】

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有するオリゴ糖またはグリコミ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147】



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

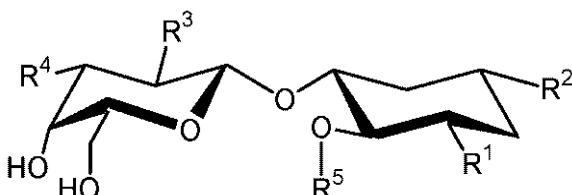
ゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリール（これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、OH、またはNH_Xの1種または複数で置換されていてよく、ここで、X = H、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい）； $C(=O)OX$ 、 $C(=O)OX$ で置換されたアルカニル、 $C(=O)NHX$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

$R^2 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ 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 ~ 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 、 NH_X 、 $NH(=O)X$ （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、

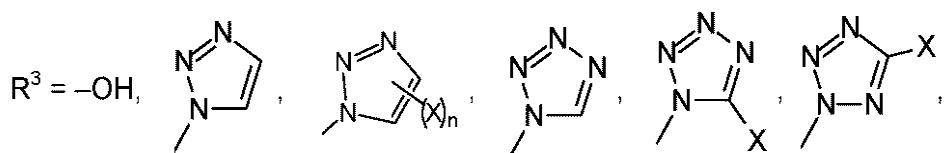
式中、

$R^1 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$ 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 、 NH_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) ;

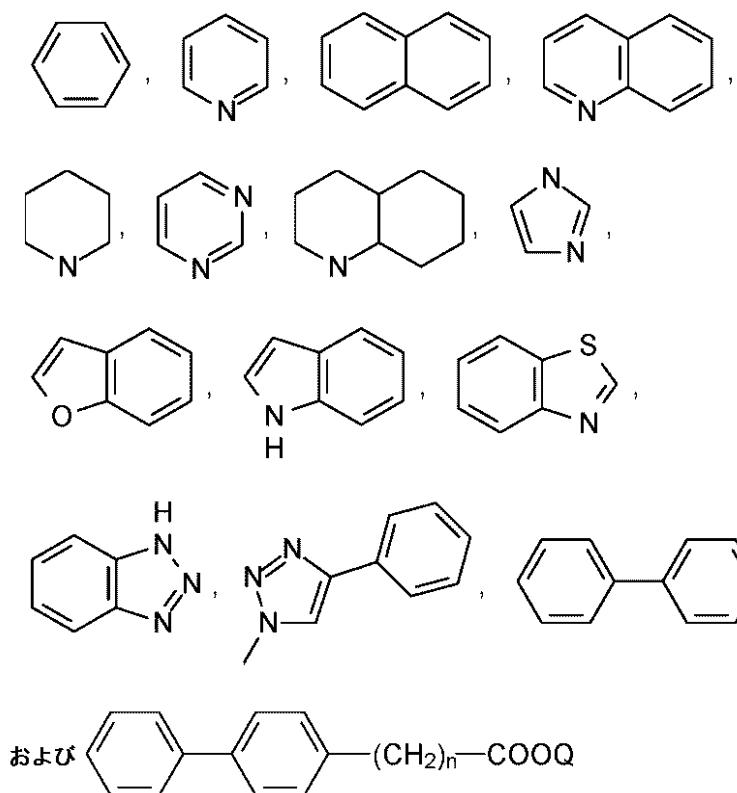
$R^2 = H, C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリール (これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、OH、またはNHXの1種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H, C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、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、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) ; $-C(=O)NH(C_2H_5)_nNH_2$ ($n = 0 \sim 30$)、 $C(=O)NHX$ 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 、 NH_X 、 $NH(=O)X$ ($X = H, C_1 \sim C_8$ 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149】



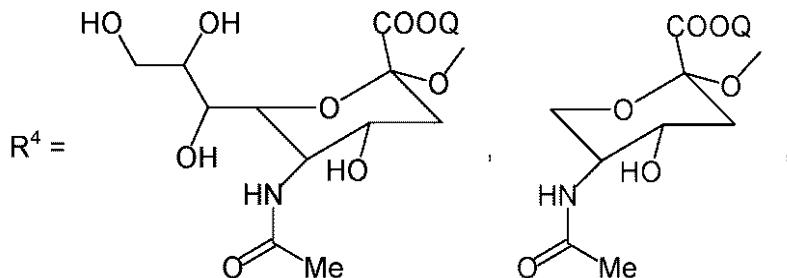
$-O-C(=O)-X$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH-C(=O)-NHX$ 、または $-NH-C(=O)-X$ であり、ここで、 $n = 0 \sim 2$ であり、 X は、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、

【化150】



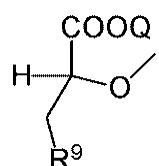
から独立に選択され、ここで、Qは、Hであるか、または生理学的に許容される塩、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、アリール、ヘテロアリール、(CH₂)_m-アリールまたは(CH₂)_m-ヘテロアリールであり、ここで、mは、1～10であり、ここで、n=0～10であり、上記環化合物のいずれも、C₁、F、CF₃、C₁～C₈アルコキシ、NO₂、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、C₁～C₁₄アリール、またはOY、C(=O)OY、NY₂またはC(=O)NHYから独立に選択される1から3個のもので置換されていてよく、ここで、Yは、H、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、またはC₁～C₁₄アリールであり；

【化151】



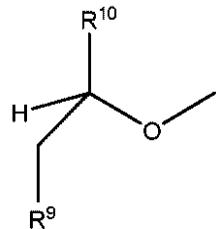
6'硫酸化GlcNAc、6'カルボキシリ化GlcNAc、6'硫酸化GalNAc、6'硫酸化ガラクトース、6'カルボキシリ化ガラクトース、

【化152】



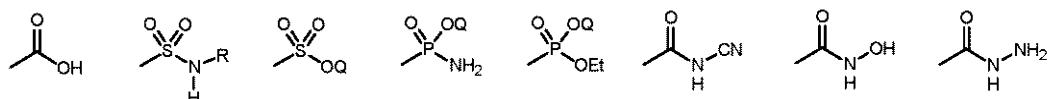
(ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩またはC₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、アリール、ヘテロアリール、(CH₂)_n-アリールまたは(CH₂)_n-ヘテロアリールであり、ここで、nは、1～10であり、ここで、R⁹は、アリール、ヘテロアリール、シクロヘキサン、t-ブタン、アダマンタン、またはトリアゾールであり、R⁹のいずれも、C1、F、CF₃、C₁～C₈アルコキシ、NO₂、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニルまたはOY、C(=O)OY、NY₂またはC(=O)NHYから独立に選択される1から3個のもので置換されていてよく、ここで、Yは、H、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニルまたはC₁～C₁₄アリールである)；または

【化153】

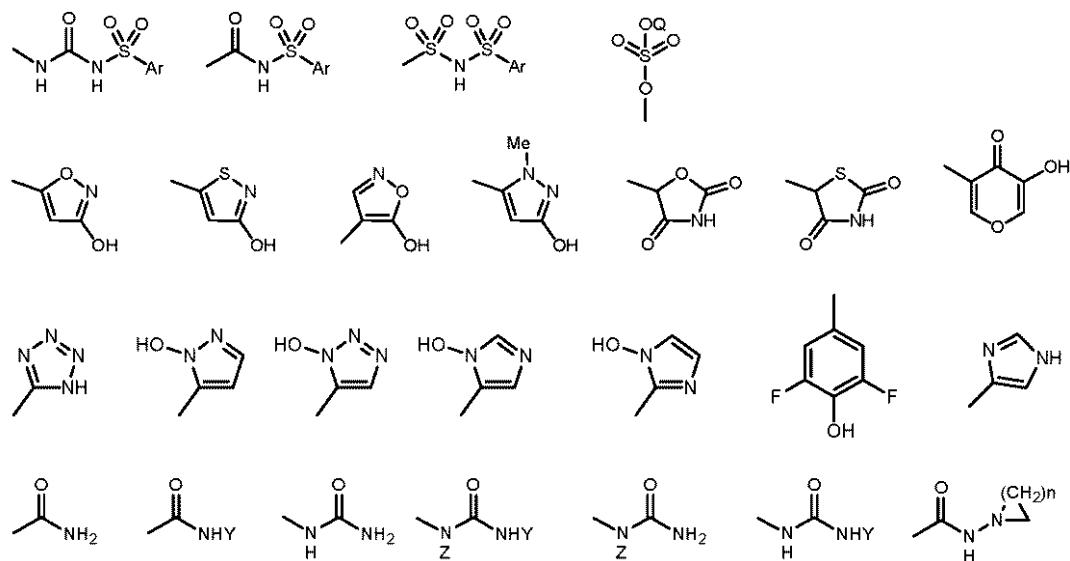


(ここで、R¹⁰は、

【化154】



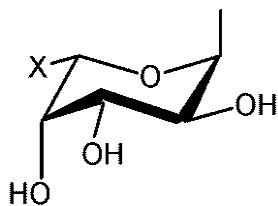
【化155】



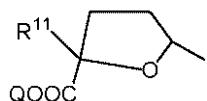
の1つであり、ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、アリール、ヘテロアリール、(CH₂)_m-アリールまたは(CH₂)_m-ヘテロアリールであり、ここで、mは、1～10であり、n=1～4であり、ZおよびY=C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、ハロゲン化C₁～C₈アルカニル、アリール、およびMe、OMe、ハロゲン化物、OHで置換されたヘテロアリールである)であり；

R⁵=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156】

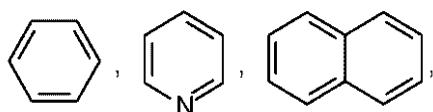


(ここで、X = C F₃、シクロプロピルまたはフェニルである)、または
【化157】

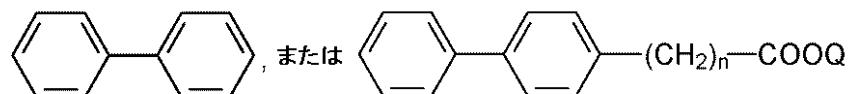
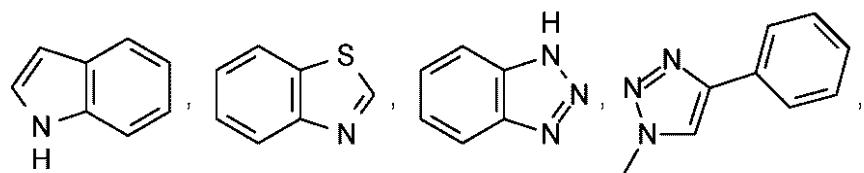
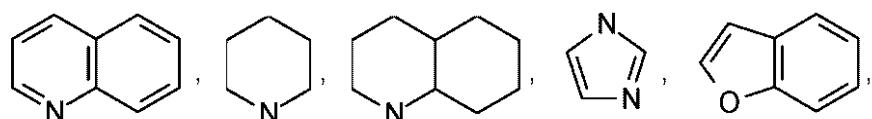


(ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、アリール、ヘテロアリール、(C H₂)_m-アリールまたは(C H₂)_m-ヘテロアリールであり、ここで、mは、1～10であり、ここで、R¹¹は、アリール、ヘテロアリール、

【化158】



【化159】



であり、ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、アリール、ヘテロアリール、(C H₂)_m-アリールまたは(C H₂)_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 = 0～10であり、上記環化合物のいずれの1つも、C₁、F、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニルまたはO Y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、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニルまたはC₁～C₈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32】

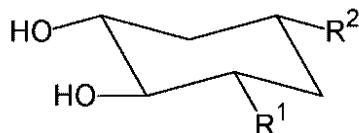
前記化合物が、請求項31に記載の化合物からなる、請求項30に記載の組成物。

【請求項33】

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有するオリゴ糖またはグリコミ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、

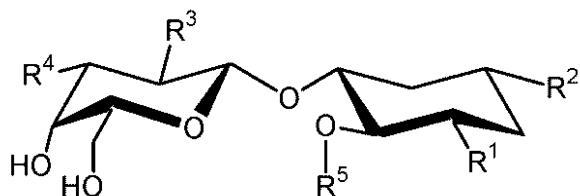
$R^1 = H, C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリール（これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、OH、またはNH_Xの1種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H, C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、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

$R^2 = H, C_1 \sim C_8$ 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）； $OX, NH\bar{X}$ 、 $NH(=O)X$ （ $X = H, C_1 \sim C_8$ 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161】



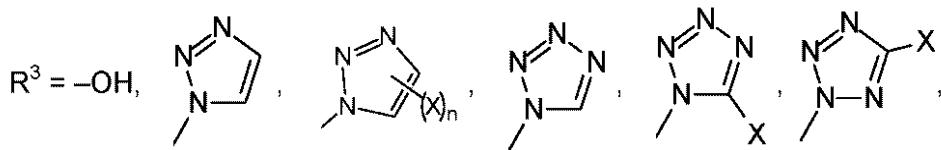
を含み、

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）；

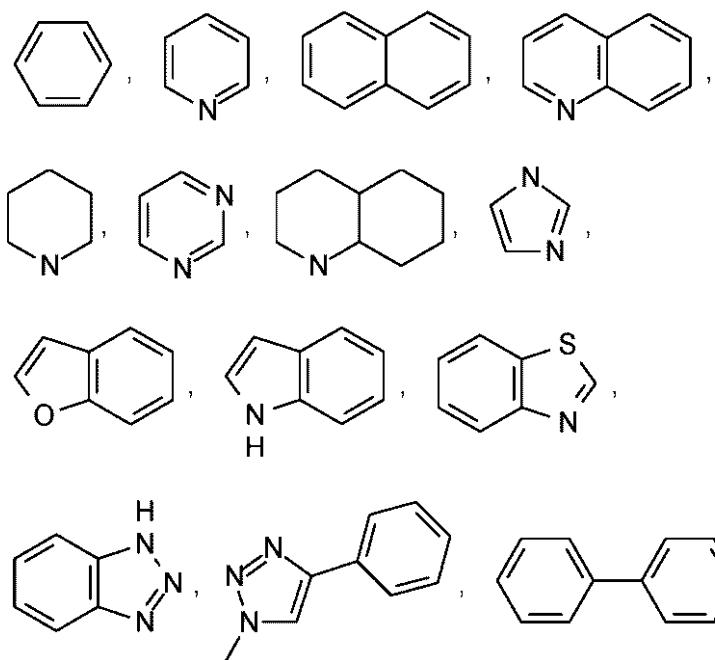
$R^2 = H, C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリール（これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、OH、またはNH_Xの1種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H, C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、ハロゲン化 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、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）； $-C(=O)NH(C_2H_2)_nNH_2$ （ $n = 0 \sim 30$ ）、 $C(=O)NHX$ 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162】

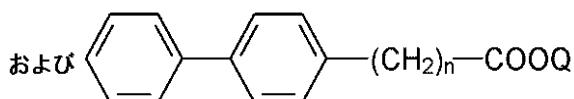


$-O-C(=O)-X, -NH_2, -NH-C(=O)-NHX$ 、または $-NH-C(=O)-X$ であり、ここで、 $n = 0 \sim 2$ であり、 X は、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、

【化163】

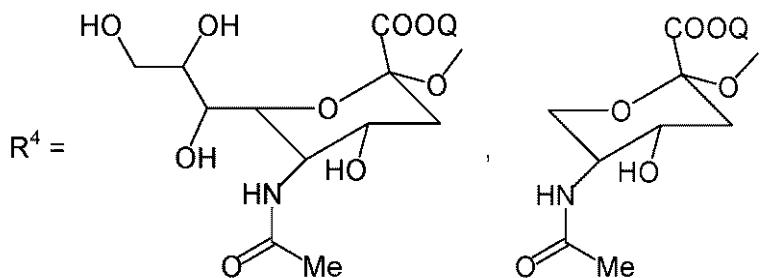


【化164】



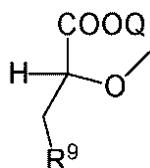
から独立に選択され、ここで、Qは、Hであるか、または生理学的に許容される塩、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、アリール、ヘテロアリール、(CH₂)_m-アリールまたは(CH₂)_m-ヘテロアリールであり、ここで、mは、1～10であり、ここで、n=0～10であり、上記環化合物のいずれも、C₁、F、CF₃、C₁～C₈アルコキシ、NO₂、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、C₁～C₁₄アリール、またはOY、C(=O)OY、NY₂またはC(=O)NHYから独立に選択される1から3個のもので置換されていてよく、ここで、Yは、H、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、またはC₁～C₁₄アリールであり；

【化165】



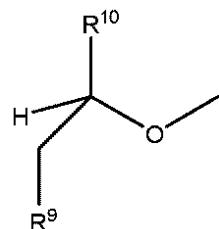
6'硫酸化GlcNAc、6'カルボキシリ化GlcNAc、6'硫酸化GalNAc、6'硫酸化ガラクトース、6'カルボキシリ化ガラクトース、

【化166】



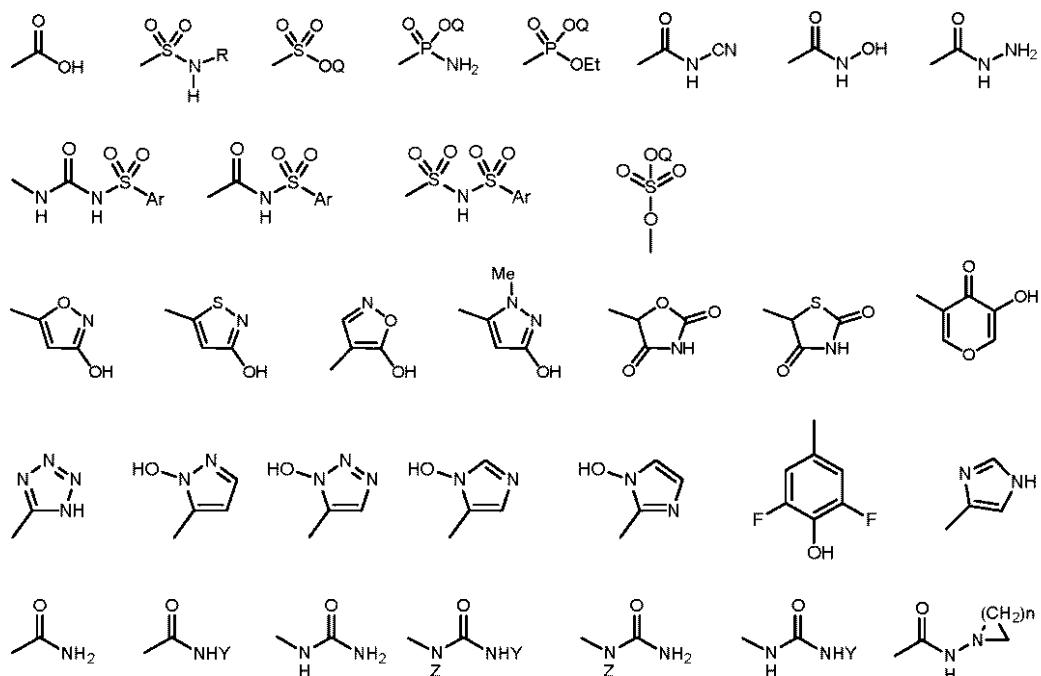
(ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩またはC₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、アリール、ヘテロアリール、(CH₂)_n-アリールまたは(CH₂)_n-ヘテロアリールであり、ここで、nは、1～10であり、ここで、R⁹は、アリール、ヘテロアリール、シクロヘキサン、t-ブタン、アダマンタン、またはトリアゾールであり、R⁹のいずれも、C1、F、CF₃、C₁～C₈アルコキシ、NO₂、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニルまたはOY、C(=O)OY、NY₂またはC(=O)NHYから独立に選択される1から3個のもので置換されていてよく、ここで、Yは、H、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニルまたはC₁～C₁₄アリールである)；または

【化167】



(ここで、R¹⁰は、

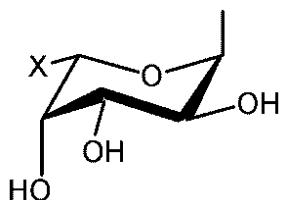
【化168】



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、C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、アリール、ヘテロアリール、(CH₂)_m-アリールまたは(CH₂)_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=C₁～C₈アルカニル、C₁～C₈アルケニル、C₁～C₈アルキニル、ハロゲン化C₁～C₈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；

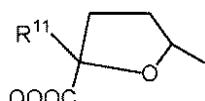
R^5 = H、D-マンノース、L-ガラクトース、D-アラビノース、L-フコース、ポリオール、

【化169】



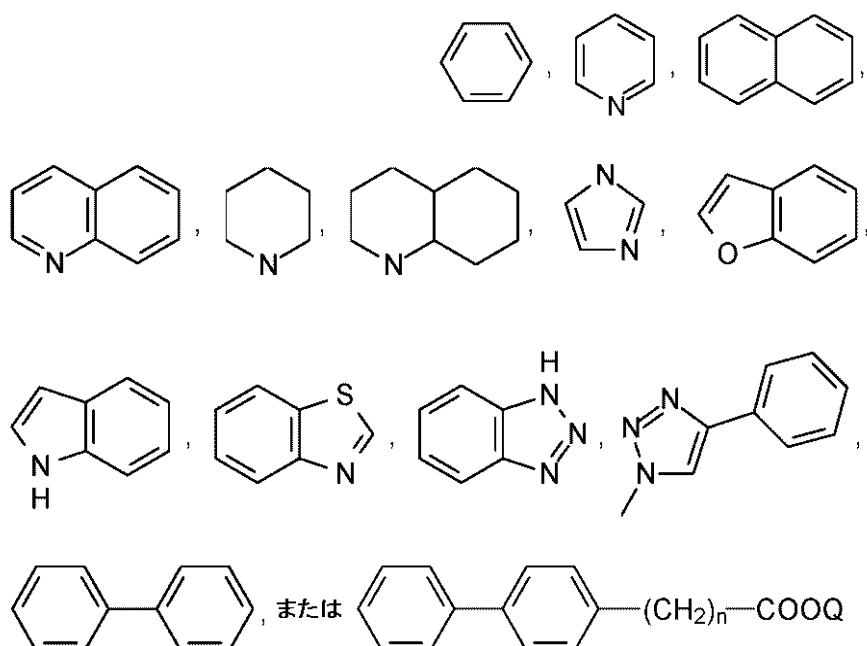
(ここで、 $X = CF_3$ 、シクロプロピルまたはフェニルである)、または

【化170】



(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171】



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、 C_1 、 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 3 7】

前記疾患が、慢性湿疹である、請求項 3 3 から 3 5 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 3 8】

前記疾患が、乾癬である、請求項 3 3 から 3 5 のいずれか一項に記載の組成物。