

【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22年4月22日(2010.4.22)

【公表番号】特表2010-506832(P2010-506832A)

【公表日】平成22年3月4日(2010.3.4)

【年通号数】公開・登録公報2010-009

【出願番号】特願2009-532370(P2009-532370)

【国際特許分類】

C 0 7 H 15/207 (2006.01)

【F I】

C 0 7 H 15/207

【誤訳訂正書】

【提出日】平成22年2月19日(2010.2.19)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 0 5

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

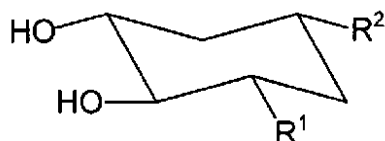
【0 0 0 5】

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目 1)

少なくとも 1 種のシクロヘキサン誘導体を、オリゴ糖または糖模倣化合物に組み込むことを含む、オリゴ糖模倣体を調製する方法であって、ここで、該シクロヘキサン誘導体は、式：

【化 7 9】



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）； $O(=O)X$ 、 $OX$ 、 $NHX$ 、 $NH(=O)X$ （ $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$  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）；

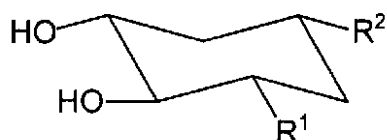
$R^2 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$  アルカニル、 $C_1 \sim C_8$  アルケニル、 $C_1 \sim C_8$  アルキニル、ハロ

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）； $O(=O)X$ 、 $OX$ 、 $NHX$ 、 $NH(=O)X$ （ $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$  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糖模倣化合物に少なくとも結合している方法。

（項目2）

オリゴ糖化合物もしくは糖模倣化合物における、またはオリゴ糖を含む、もしくは糖模倣体を含む化合物のオリゴ糖もしくは糖模倣体における少なくとも1種のヘキソースまたはヘキソサミンを、単糖模倣体で置換するための方法であって、オリゴ糖化合物もしくは糖模倣化合物における少なくとも1種のヘキソースまたはヘキソサミンを、シクロヘキサン誘導体で置き換えることを含み、ここで、該シクロヘキサン誘導体は、式：

【化80】



を有し、

式中、

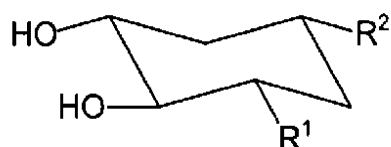
$R^1 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$  アルカニル、 $C_1 \sim C_8$  アルケニル、 $C_1 \sim C_8$  アルキニル、ハロゲン化  $C_1 \sim C_8$  アルカニル、アリールまたはヘテロアリール（これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、OH、またはNHXの1種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$  アルカニル、 $C_1 \sim C_8$  アルケニル、 $C_1 \sim C_8$  アルキニル、ハロゲン化  $C_1 \sim C_8$  アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、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）； $O(=O)X$ 、 $OX$ 、 $NHX$ 、 $NH(=O)X$ （ $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$  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）； $R^2 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$  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)； $O(=O)X$ 、 $OX$ 、 $NHX$ 、 $NH(=O)X$  ( $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$  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糖模倣化合物に少なくとも結合している方法。

(項目 3)

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糖模倣化合物であって、ここで、該シクロヘキサン誘導体は、式：

【化 8 1】



を有し、

式中、

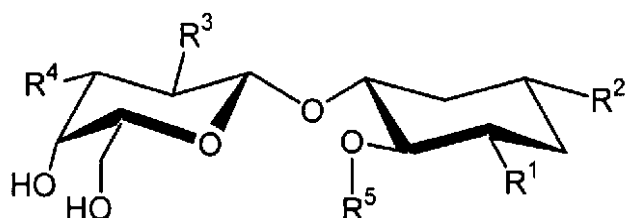
$R^1 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$  アルカニル、 $C_1 \sim C_8$  アルケニル、 $C_1 \sim C_8$  アルキニル、ハロゲン化  $C_1 \sim C_8$  アルカニル、アリールまたはヘテロアリール (これらのいずれも、 $Me$ 、 $OMe$ 、ハロゲン化物、 $OH$ 、または  $NHX$  の 1 種または複数で置換されていてよく、ここで、 $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$  アルカニル、 $C_1 \sim C_8$  アルケニル、 $C_1 \sim C_8$  アルキニル、ハロゲン化  $C_1 \sim C_8$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

$R^2 = H$ 、 $C_1 \sim C_8$  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、 $Me$ 、 $OMe$ 、

e、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)； $-C(=O)NH(CH_2)_nNH_2$  ( $n=0\sim30$ )、 $C(=O)NHX$ 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)； $O(=O)X$ 、 $OX$ 、 $NHX$ 、 $NH(=O)X$  ( $X=H$ 、 $C_1\sim C_8$  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糖模倣化合物に少なくとも結合している化合物。

(項目4)

【化82】



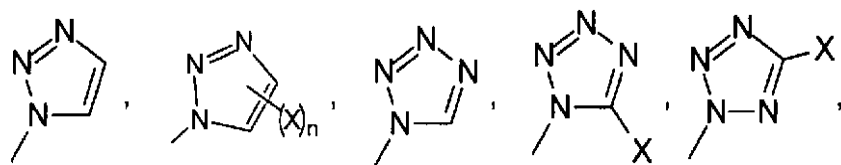
を含む化合物であって、

$R^1 = H$ 、 $C_1\sim C_8$  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)； $O(=O)X$ 、 $OX$ 、 $NHX$ 、 $NH(=O)X$  ( $X=H$ 、 $C_1\sim C_8$  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)；

$R^2 = H$ 、 $C_1\sim C_8$  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)； $-C(=O)NH(CH_2)_nNH_2$  ( $n=0\sim30$ )、 $C(=O)NHX$ 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)； $O(=O)X$ 、 $OX$ 、 $NHX$ 、 $NH(=O)X$  ( $X=H$ 、 $C_1\sim C_8$  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)；

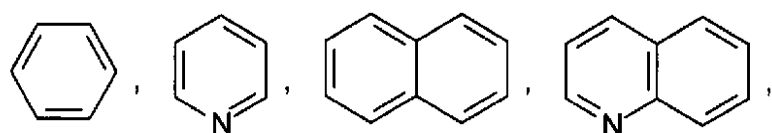
ル、 $C_1 \sim C_8$  アルキニル、ハロゲン化  $C_1 \sim C_8$  アルカニル、アリールまたはヘテロアリールであり、これらのいずれも、Me、OMe、ハロゲン化物、またはOHの1種または複数で置換されていてよい；但し、 $R^1$  および  $R^2$  は、同時にHであることはなく；  
 $R^3 = -OH$ 、

【化83】

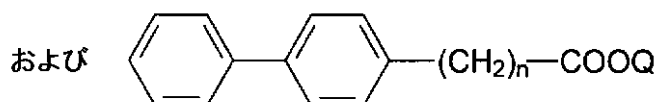
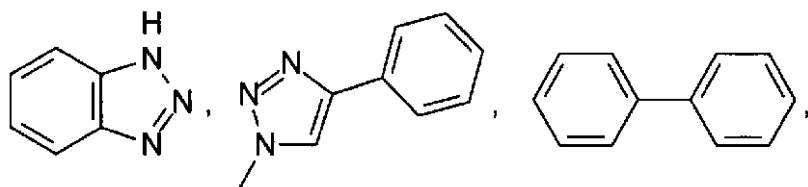
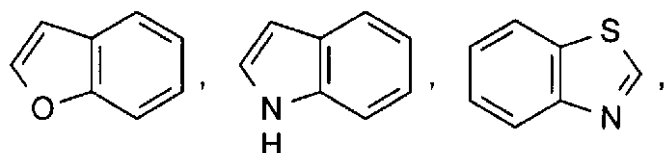
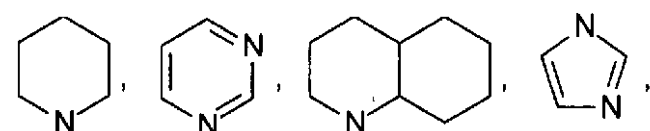


$-O-C(=O)-X$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH-C(=O)-NHX$ 、または  $-NH-C(=O)-X$  であり、ここで、 $n = 0 \sim 2$  であり、Xは、 $C_1 \sim C_8$  アルカニル、 $C_1 \sim C_8$  アルケニル、 $C_1 \sim C_8$  アルキニル、

【化84-1】



【化84-2】

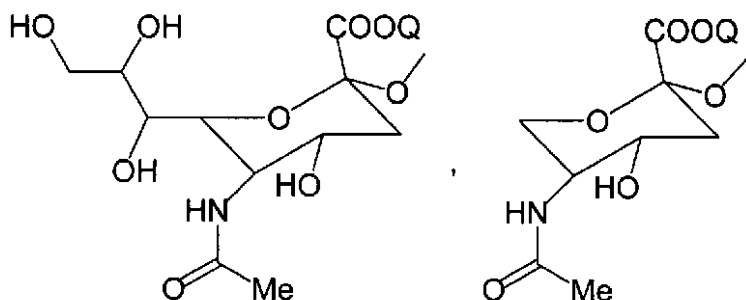


から独立に選択され、ここで、Qは、Hであるか、または生理学的に許容される塩、 $C_1 \sim C_8$  アルカニル、 $C_1 \sim C_8$  アルケニル、 $C_1 \sim C_8$  アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_m$ -アリールまたは  $(CH_2)_m$ -ヘテロアリールであり、ここで、 $m$ は、 $1 \sim 10$  であり、ここで、 $n = 0 \sim 10$  であり、上記環化合物のいずれも、Cl、F、 $CF_3$ 、 $C_1 \sim C_8$  アルコキシ、 $NO_2$ 、 $C_1 \sim C_8$  アルカニル、 $C_1 \sim C_8$  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、 $C(=O)OY$ 、N

$Y_2$  もしくは  $C(=O)NHY$  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；

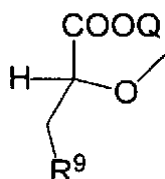
$R^4 =$

【化 8 5】



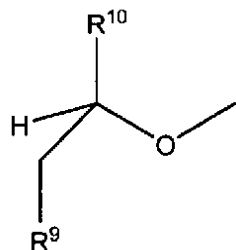
6' 硫酸化 GlcNAc、6' カルボキシル化 GlcNAc、6' 硫酸化 GalNAc、6' 硫酸化ガラクトース、6' カルボキシル化ガラクトース、

【化 8 6】



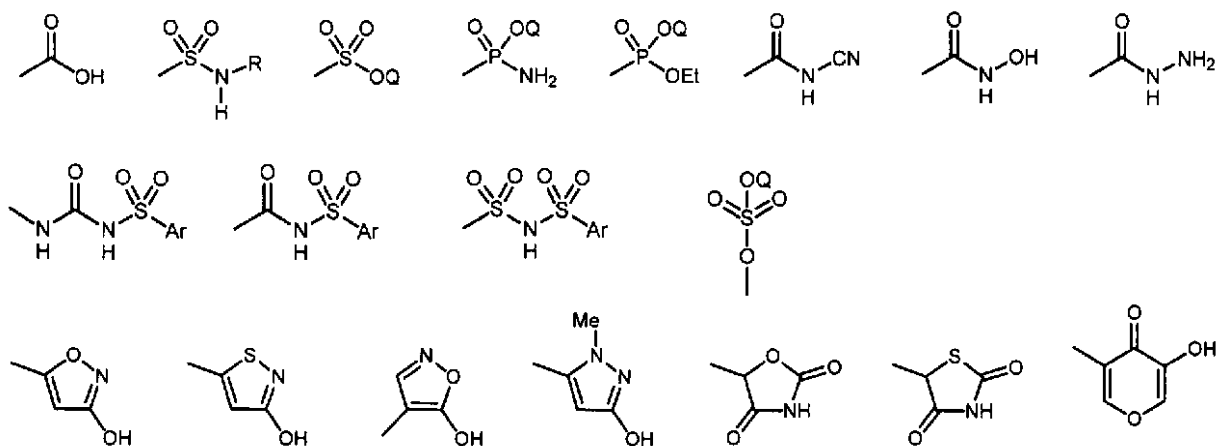
(ここで、 $Q$  は、 $H$  または生理学的に許容される塩または  $C_1 \sim C_8$  アルカニル、 $C_1 \sim C_8$  アルケニル、 $C_1 \sim C_8$  アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_n$ -アリールまたは  $(CH_2)_n$ -ヘテロアリールであり、ここで、 $n$  は、1 ~ 10 であり、ここで、 $R^9$  は、アリール、ヘテロアリール、シクロヘキサン、 $t$ -ブタン、アダマンタン、またはトリアゾールであり、 $R^9$  のいずれも、 $Cl$ 、 $F$ 、 $CF_3$ 、 $C_1 \sim C_8$  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 8 7】

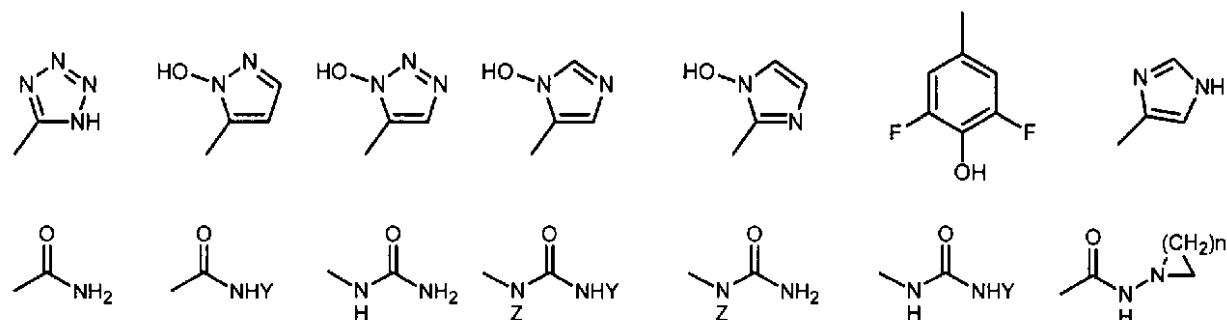


(ここで、 $R^{10}$  は、

## 【化 8 8 - 1】



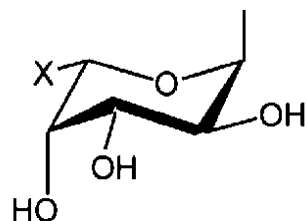
## 【化 8 8 - 2】



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；

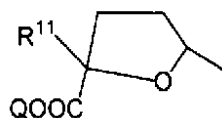
$R^5 = H$ 、D-マンノース、L-ガラクトース、D-アラビノース、L-フコース、ポリオール、

## 【化 8 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

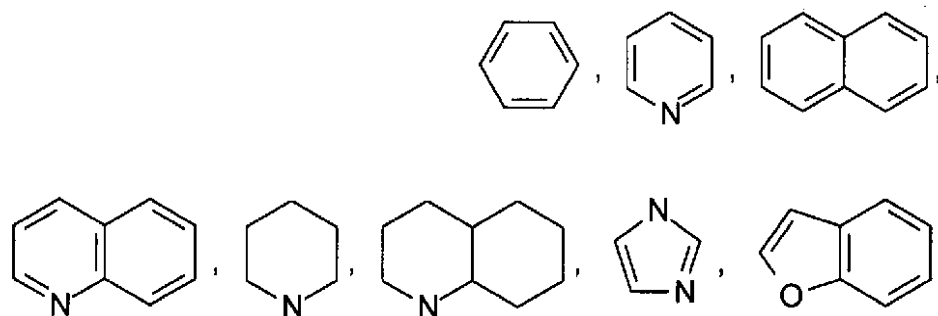
## 【化 9 0】



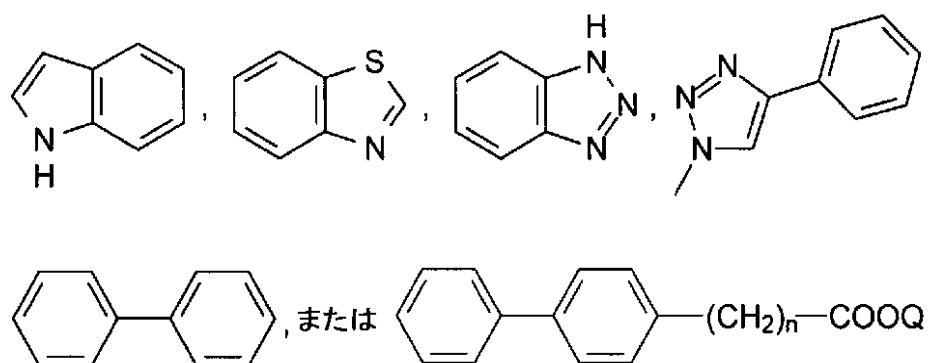
(ここで、Q は、H または生理学的に許容される塩、 $C_1 \sim C_8$  アルカニル、 $C_1 \sim C_8$

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91-1】



【化91-2】



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)である化合物。

(項目5)

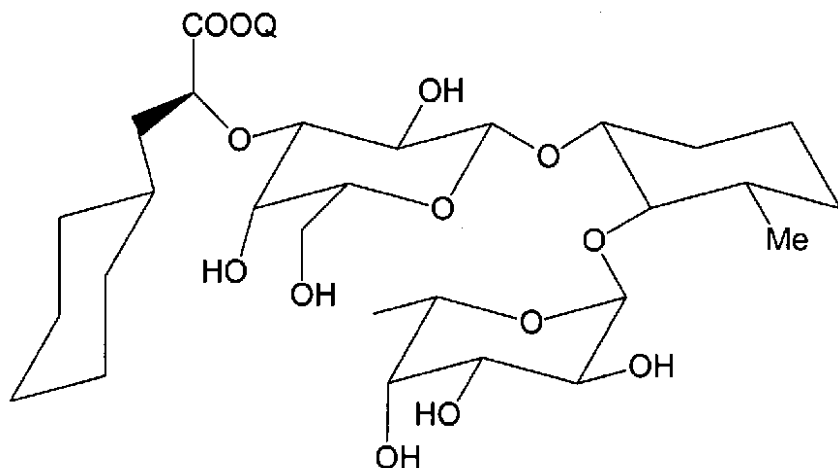
項目4に記載の化合物からなる化合物。

(項目6)

式：



【化 9 2】

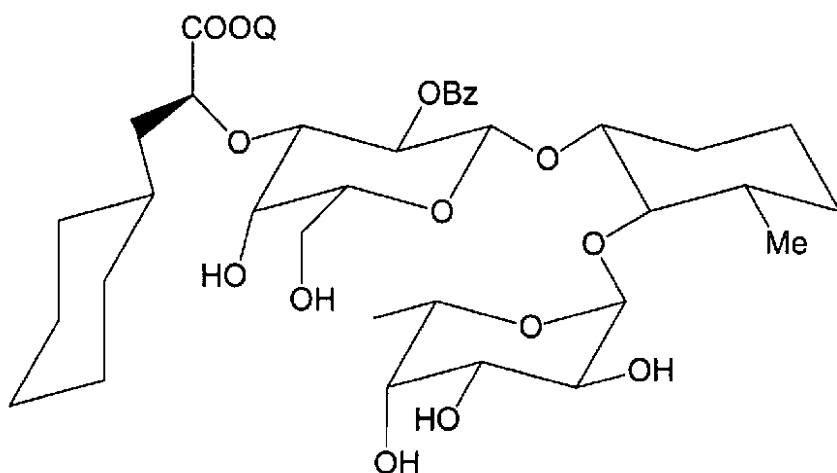


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルである、項目 5 に記載の化合物。

( 項目 7 )

式：

【化 9 3】

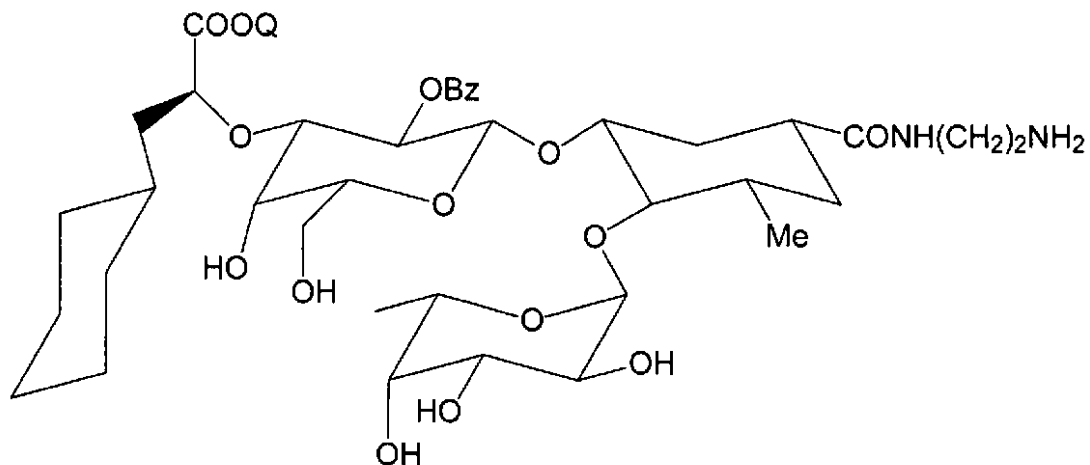


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、項目 5 に記載の化合物。

( 項目 8 )

式：

## 【化 9 4】

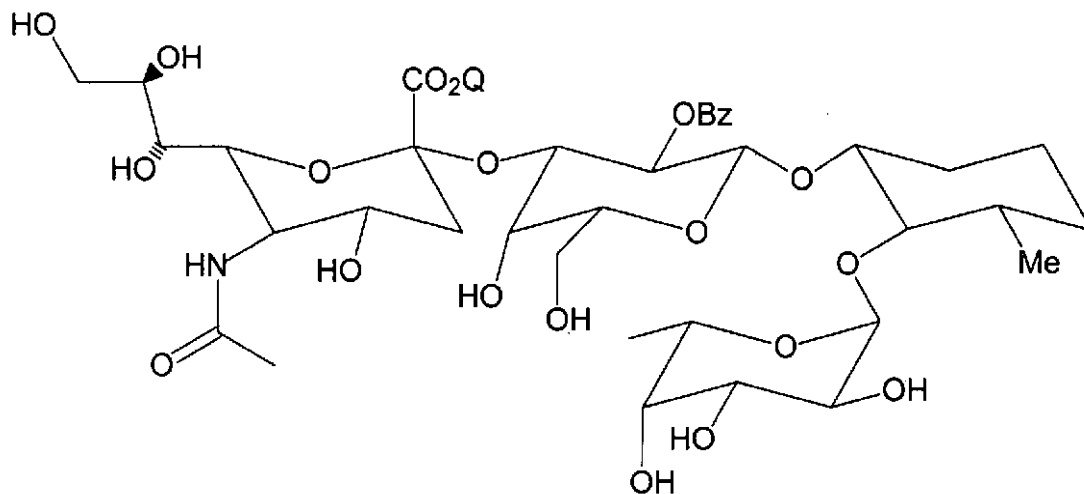


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、項目 5 に記載の化合物。

( 項目 9 )

式：

## 【化 9 5】

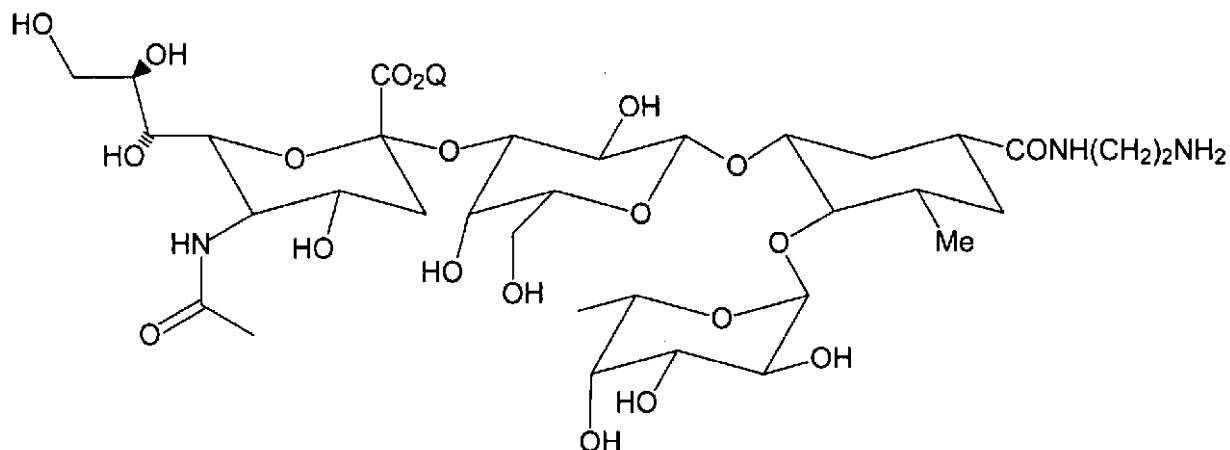


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、項目 5 に記載の化合物。

( 項目 1 0 )

式：

## 【化 9 6】

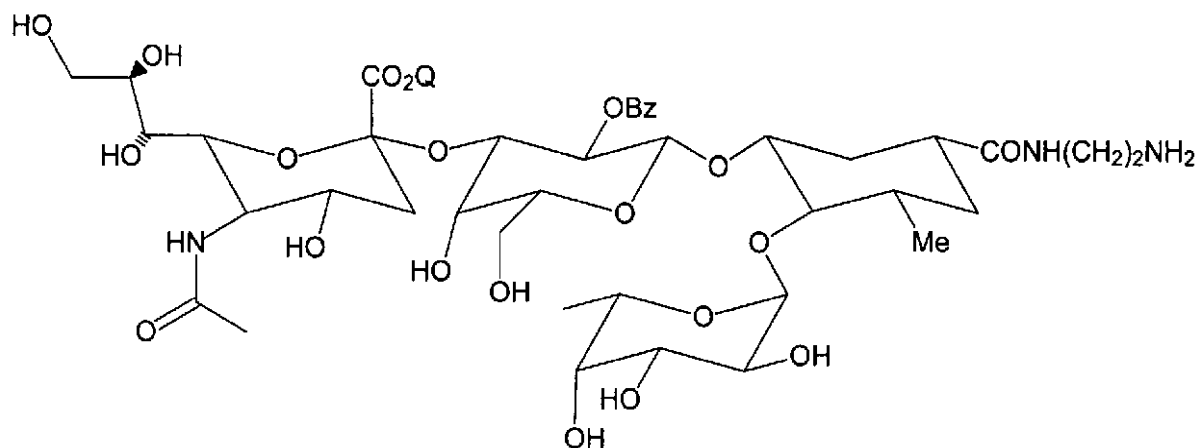


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルである、項目 5 に記載の化合物。

( 項目 1 1 )

式：

## 【化 9 7】

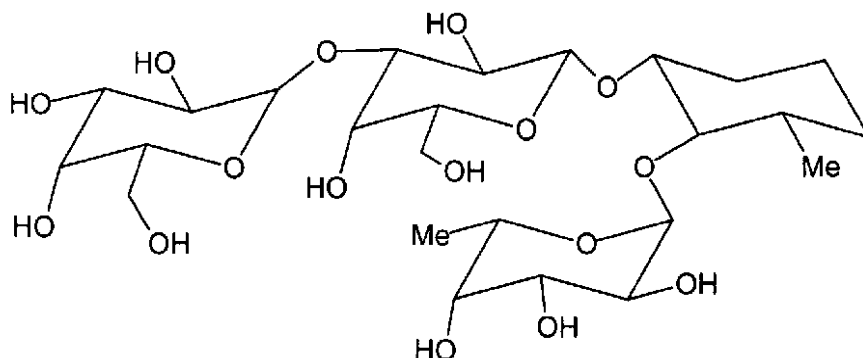


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、項目 5 に記載の化合物。

( 項目 1 2 )

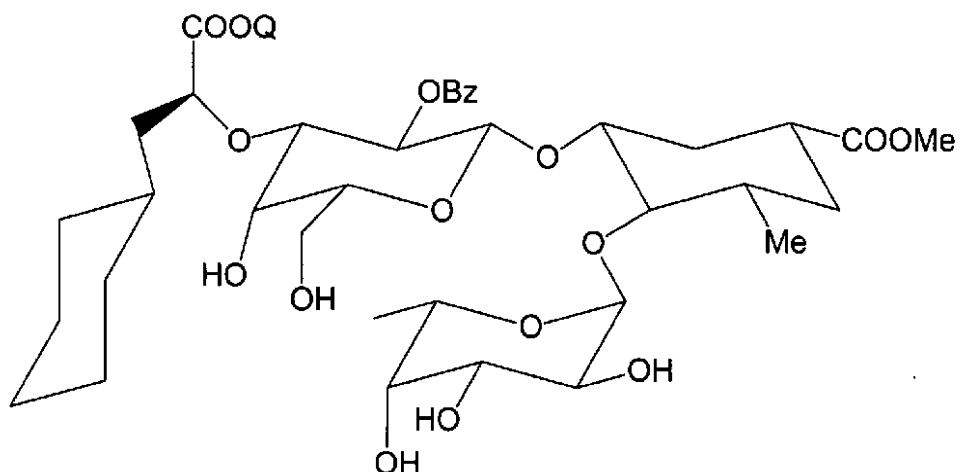
式：

## 【化 9 8】



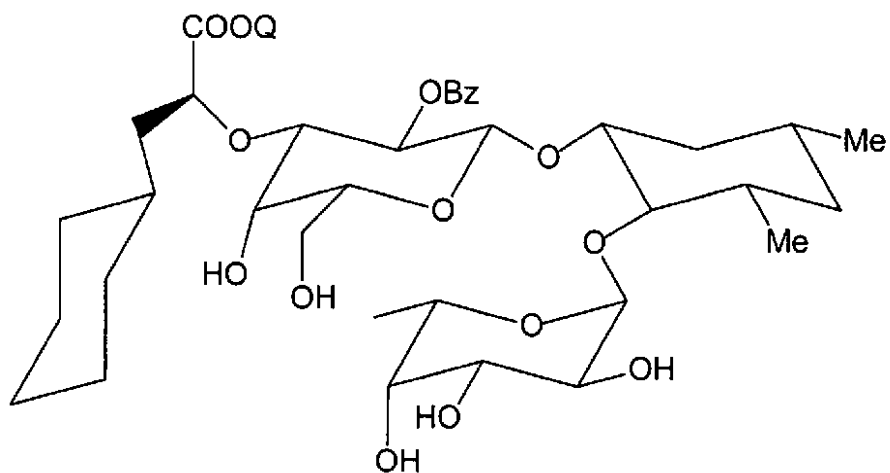
( 項目 1 3 )

【化 9 9】



( 項目 1 4 )

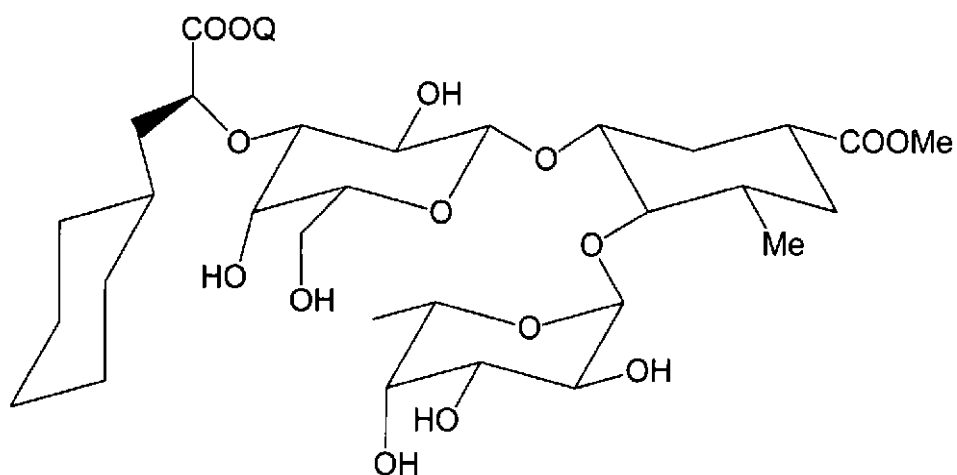
【化 1 0 0】



( 項目 1 5 )

式：

【化 1 0 1】

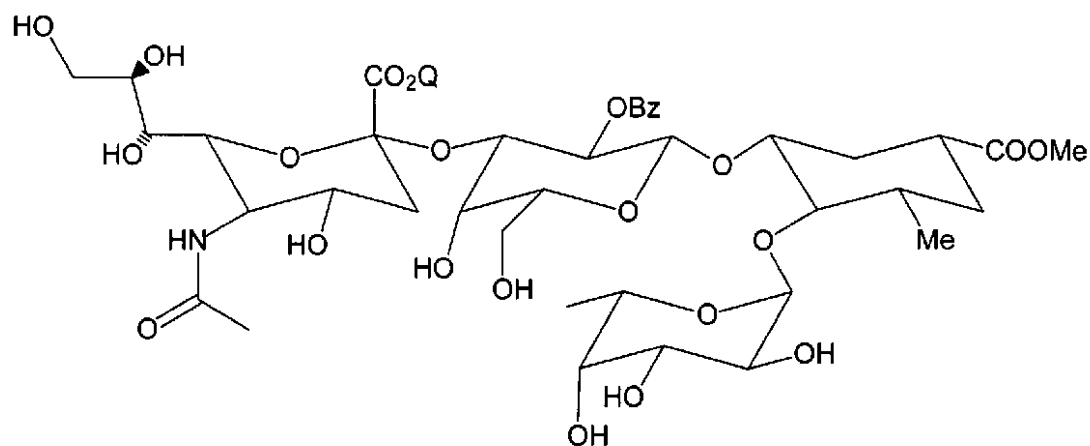


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルである、項目 5 に記載の化合物。

( 項目 1 6 )

式：

【化 1 0 2】

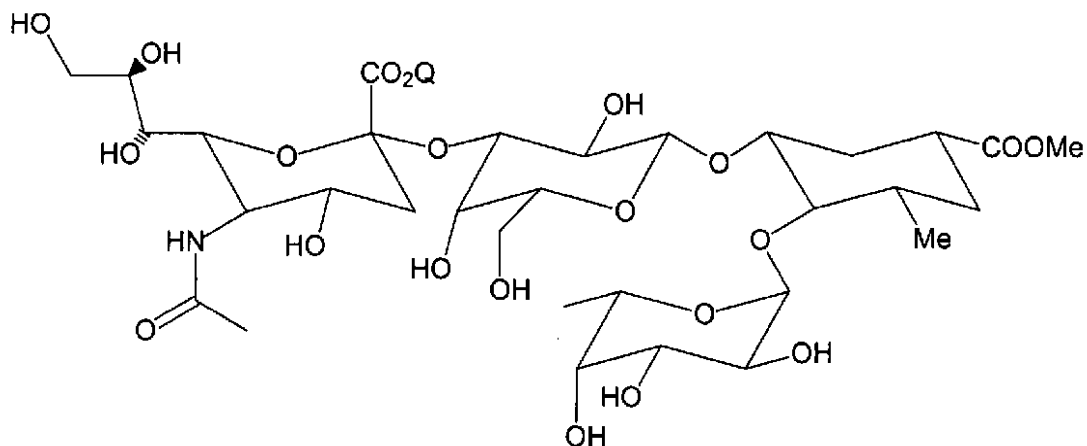


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、項目 5 に記載の化合物。

( 項目 1 7 )

式：

## 【化 1 0 3】

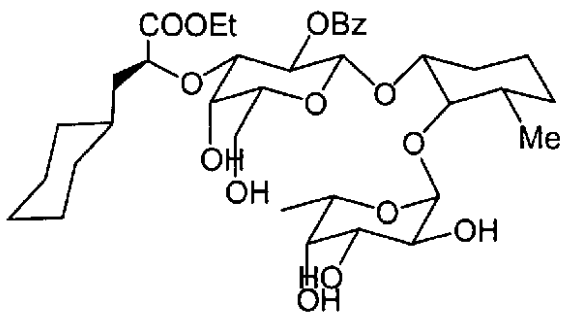


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルである、項目 5 に記載の化合物。

( 項目 1 8 )

式：

## 【化 1 0 4】

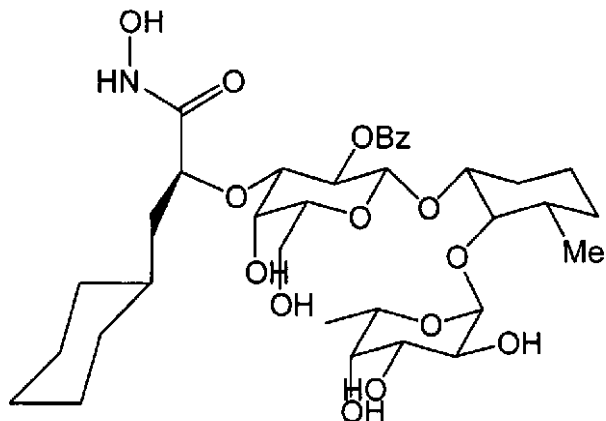


を有し、ここで、Me が、メチルであり、Et が、エチルであり、Bz が、ベンゾイルである、項目 5 に記載の化合物。

( 項目 1 9 )

式：

## 【化 1 0 5】

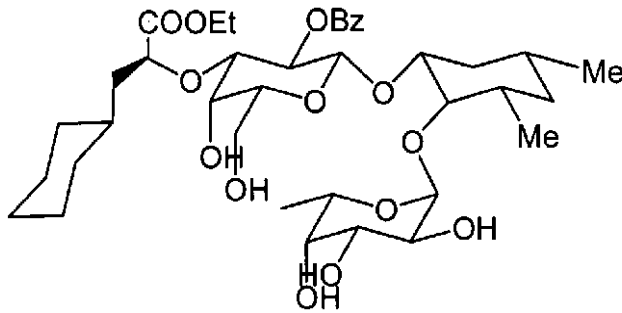


を有し、ここで、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、項目 5 に記載の化合物。

(項目 2 0 )

式：

【化 1 0 6】

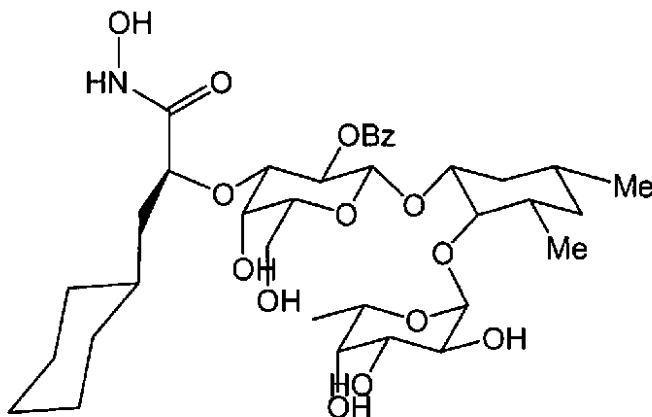


を有し、ここで、Me が、メチルであり、Et が、エチルであり、Bz が、ベンゾイルである、項目 5 に記載の化合物。

(項目 2 1 )

式：

【化 1 0 7】



を有し、ここで、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、項目 5 に記載の化合物。

(項目 2 2 )

前記化合物に結合しているポリエチレングリコールを含む、項目 4 に記載の化合物。

(項目 2 3 )

項目 4 に記載の化合物の別のものにポリエチレングリコールによって結合している、項目 4 に記載の化合物。

(項目 2 4 )

前記化合物に結合しているポリエチレングリコールを含む、項目 5 に記載の化合物。

(項目 2 5 )

項目 5 に記載の化合物の別のものにポリエチレングリコールによって結合している、項目 5 に記載の化合物。

摘要

要約すると、本発明は、オリゴ糖模倣体を得るための化合物および方法を提供する。本発明の一態様においては、少なくとも 1 種のシクロヘキサン誘導体を、オリゴ糖または糖模倣化合物に組み込むことを含む、オリゴ糖模倣体を調製するための方法が提供され、ここで、該シクロヘキサン誘導体は、式：

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0078

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0078】

本明細書で使用される「 $C_1 \sim C_8$  アルカニル」は、1 から 8 個の炭素原子を有するアルカン置換基を指し、直鎖、分枝または環式（シクロアルカニル）であってよい。例は、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチルおよび *t*-ブチルである。「ハロゲン化  $C_1 \sim C_8$  アルカニル」は、少なくとも 1 つのハロゲンを有する「 $C_1 \sim C_8$  アルカニル」を指す。複数のハロゲンが存在する場合、存在するハロゲンは、同じであるか、異なるか、両方（少なくとも 3 つが存在する場合）であってよい。「 $C_1 \sim C_8$  アルケニル」は、1 から 8 個の炭素原子、少なくとも 1 個の炭素 - 炭素二重結合を有するアルケン置換基を指し、直鎖、分枝または環式（シクロアルケニル）であってよい。例は、少なくとも 1 個の炭素 - 炭素二重結合を有することを除いて「 $C_1 \sim C_8$  アルカニル」の例に類似している。「 $C_1 \sim C_8$  アルキニル」は、1 から 8 個の炭素原子、少なくとも 1 個の炭素 - 炭素三重結合を有するアルキン置換基を指し、直鎖、分枝または環式（シクロアルキニル）であってよい。例は、少なくとも 1 個の炭素 - 炭素三重結合を有することを除いて「 $C_1 \sim C_8$  アルカニル」の例に類似している。「アルコキシ」は、「 $C_1 \sim C_8$  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」を有する酸素置換基を指す。これは、-O-アルキル；例えば、メトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、*i*-プロポキシ、*n*-ブトキシなど；およびそのアルケニルまたはアルキニル変型（メトキシを除けば）である。それは、さらに、O-アルキル-W-アルキルの基（ここで、W は、O または N である）、例えば、-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-W-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> を指し、ここで、*n* および *m* は、独立に 1 ~ 10 である。「アリール」は、結合によって分離されて、または縮合されていてよい単環または多環の 1 から 14 個の炭素原子を有する芳香族置換基を指す。「ヘテロアリール」は、芳香族置換基が、環炭素の代わりに少なくとも 1 個のヘテロ原子（N、O または S などの）を有することを除いて「アリール」に類似している。アリールおよびヘテロアリールの例には、フェニル、ナフチル、ピリジニル、ピリミジニル、トリアゾロ、フラニル、オキサゾリル、チオフェニル、キノリニルおよびジフェニルが含まれる。本明細書で使用される用語「独立に選択される」は、同一または異なる置換基の選択を指す。「Me」および「Et」は、それぞれメチルおよびエチルを表す。「Bz」は、ベンゾイルを表す。「Ar」は、アリールを表す。生理学的に許容される塩の例には、Na、K、Li、Mg および Ca が含まれる。本明細書で列挙される単糖置換基（例えば、D-マンノース、L-ガラクトース、D-アラビノースおよび L-フコース）は、フラノース、ピラノースまたは開環形態（open form）であってよい。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

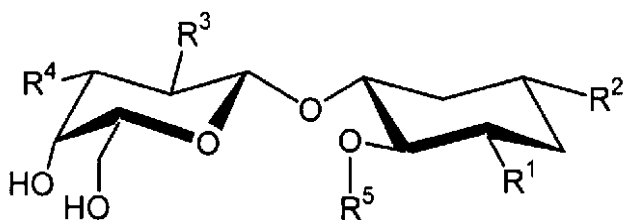
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

以下の式：



## 【化 7 9 A】



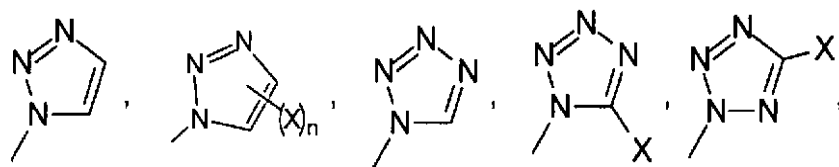
の化合物であって、

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）； $O(=O)X$ 、 $OX$ 、 $NHX$ （ $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$  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）； $O(=O)X$ 、 $OX$ 、 $NHX$ 、 $NH(=O)X$ （ $X = H$ 、 $C_1 \sim C_8$  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；  
 $R^3 = -OH$ 、

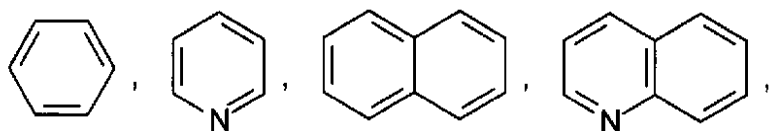
## 【化 8 3】



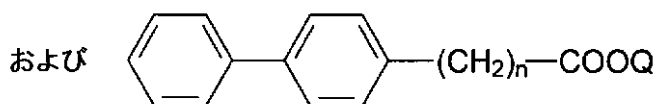
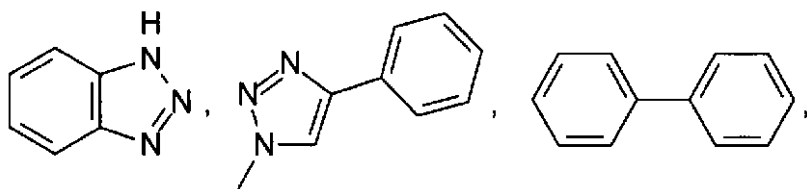
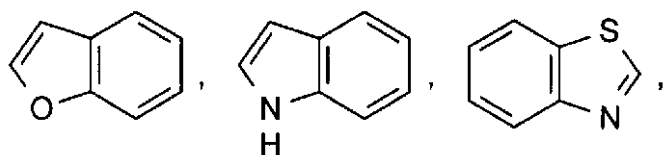
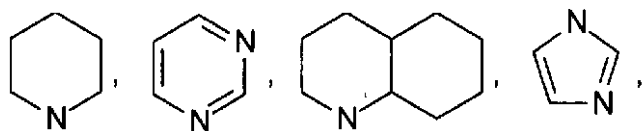
$-O-C(=O)-X$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH-C(=O)-NHX$ 、または  $-NH-C(=$

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 8 4 - 1】



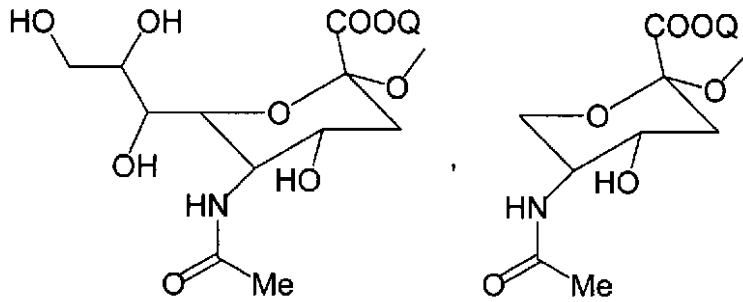
【化 8 4 - 2】



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、 $1 \sim 10$ 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、 $C(=O)OY$ 、 $NY_2$  もしくは $C(=O)NHY$ 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；

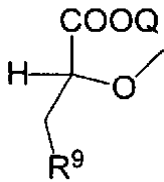
$R^4 =$

## 【化 8 5】



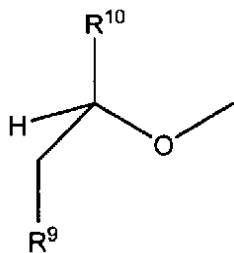
6' 硫酸化 GlcNAc、6' カルボキシル化 GlcNAc、6' 硫酸化 GalNAc、  
6' 硫酸化ガラクトース、6' カルボキシル化ガラクトース、

## 【化 8 6】



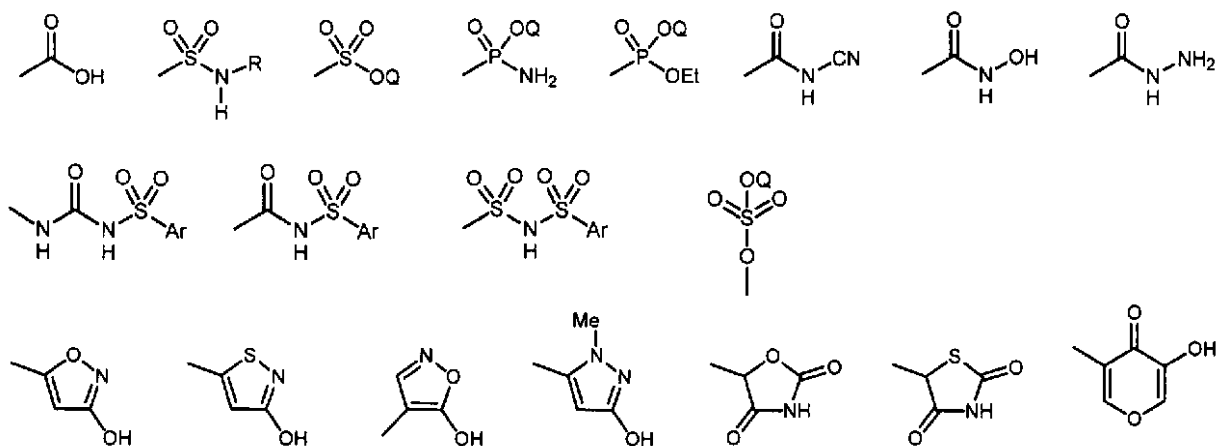
(ここで、Qは、Hまたは生理学的に許容される塩または $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ アルケニル、 $C_1 \sim C_8$ アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_n$ -アリールまたは $(CH_2)_n$ -ヘテロアリールであり、ここで、nは、1～10であり、ここで、 $R^9$ は、アリール、ヘテロアリール、シクロヘキサン、t-ブタン、アダマンタン、またはトリアゾールであり、 $R^9$ のいずれも、Cl、F、 $CF_3$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルコキシ、 $NO_2$ 、 $C_1 \sim C_8$ アルカニル、 $C_1 \sim C_8$ 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 8 7】

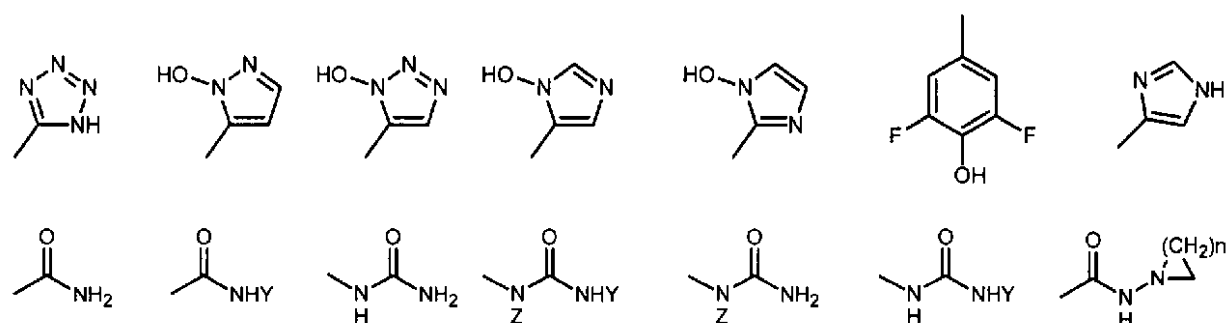


(ここで、 $R^{10}$ は、

## 【化 8 8 - 1】



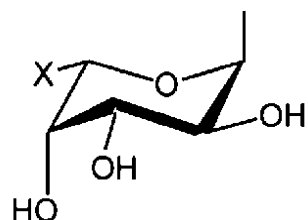
## 【化 8 8 - 2】



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；

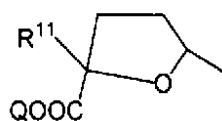
$R^5 = H$ 、D-マンノース、L-ガラクトース、D-アラビノース、L-フコース、ポリオール、

## 【化 8 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

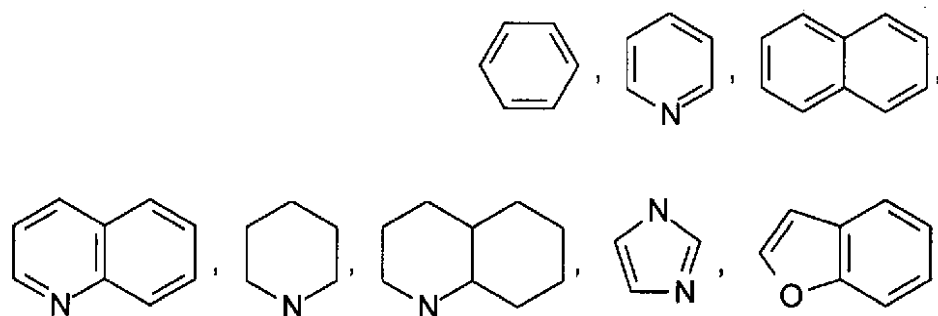
## 【化 9 0】



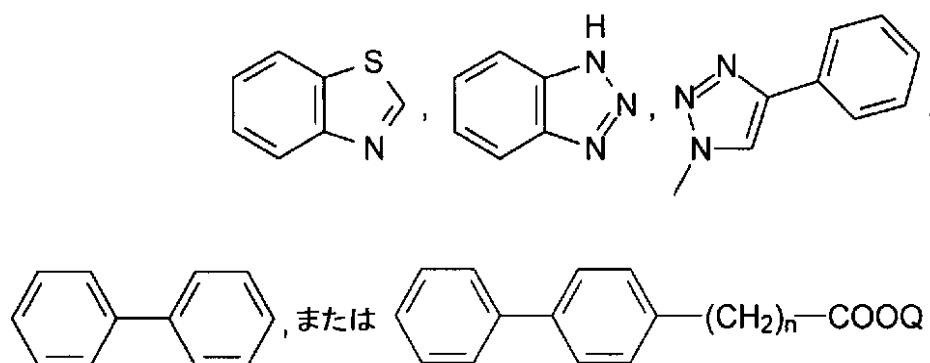
(ここで、Q は、H または生理学的に許容される塩、 $C_1 \sim C_8$  アルカニル、 $C_1 \sim C_8$  アルケニル、 $C_1 \sim C_8$  アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 $(CH_2)_m$ -アリールまたは  $(CH_2)_m$ -ヘテロアリールであり、ここで、m は、1 ~ 10 であり、ここで

、 $R^{11}$  は、アリール、ヘテロアリール、

【化 9 1 - 1】



【化 9 1 - 2 A】



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) であり、ここで

「 $C_1 \sim C_8$  アルカニル」は、1 から 8 個の炭素原子を有するアルカン置換基を指し、直鎖、分枝または環式であってよく；

「 $C_1 \sim C_8$  アルケニル」は、1 から 8 個の炭素原子、少なくとも 1 個の炭素 - 炭素二重結合を有するアルケン置換基を指し、直鎖、分枝または環式であってよく；

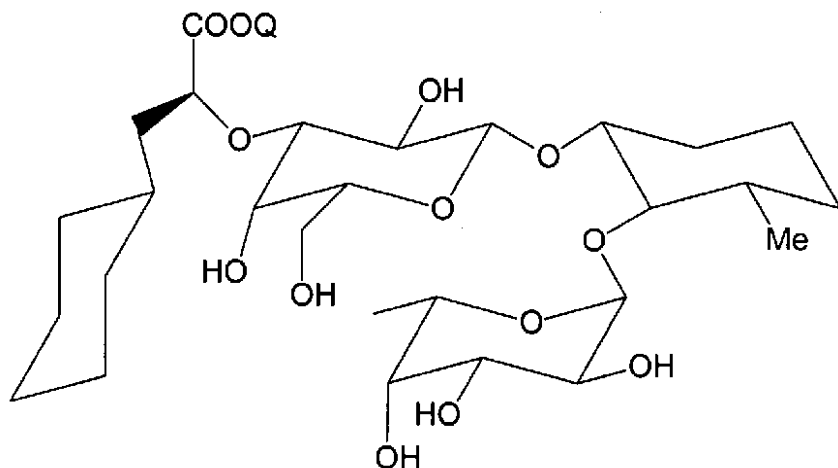
「 $C_1 \sim C_8$  アルキニル」は、1 から 8 個の炭素原子、少なくとも 1 個の炭素 - 炭素三重結合を有するアルキン置換基を指し、直鎖、分枝または環式であってよく；そして

「アリール」は、結合によって分離されて、または縮合されていてよい単環または多環の 1 から 14 個の炭素原子を有する芳香族置換基を指す、化合物。

【請求項 2】

式：

## 【化 9 2】

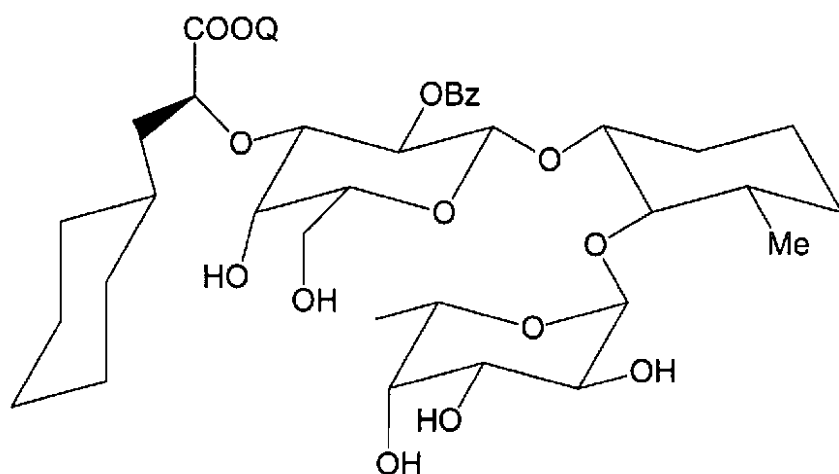


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 3】

式：

## 【化 9 3】

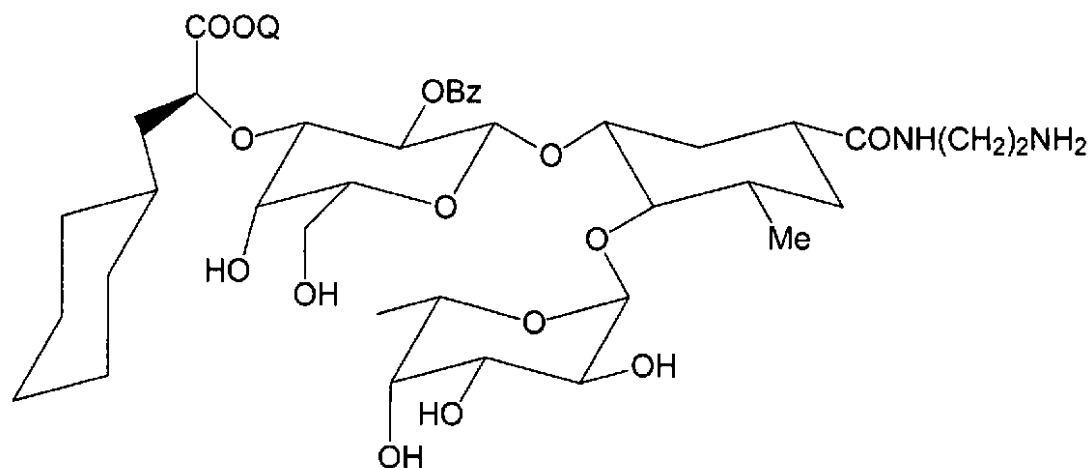


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

式：

## 【化 9 4】

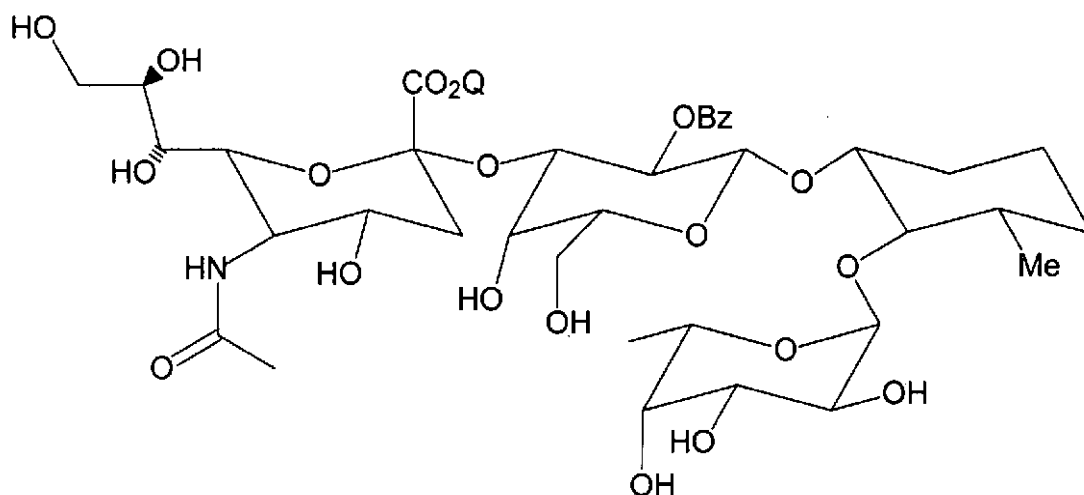


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

式：

【化 9 5】

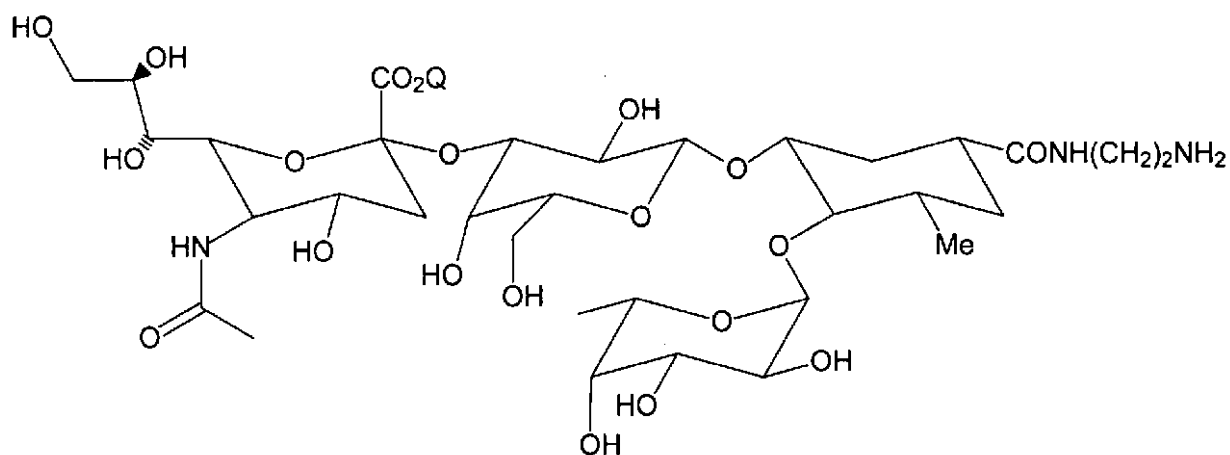


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

式：

【化 9 6】

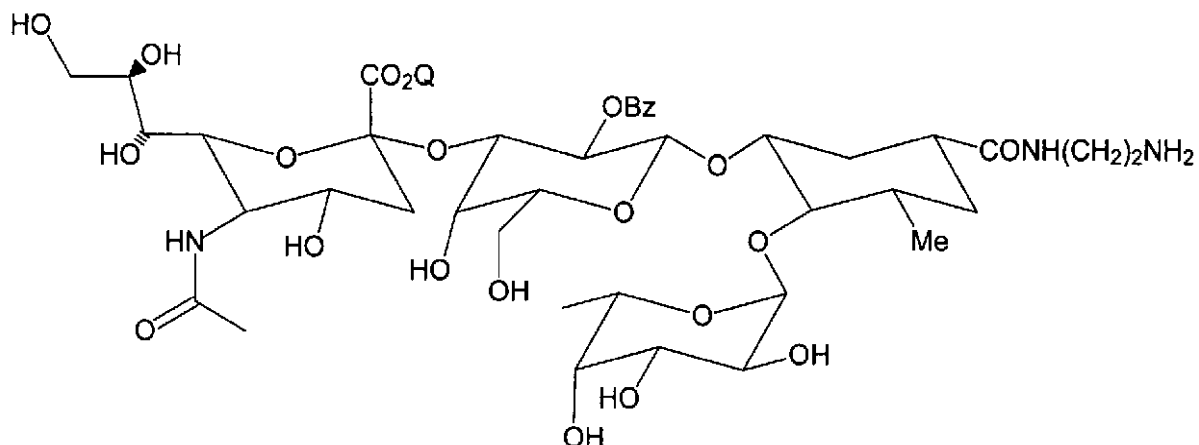


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

式：

## 【化 9 7】

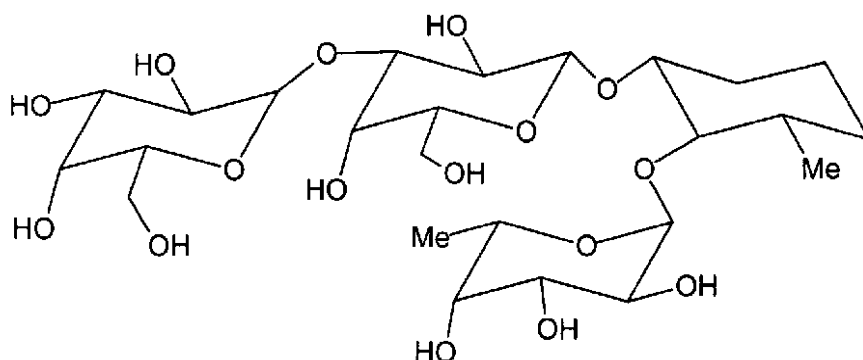


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 8】

式：

## 【化 9 8】

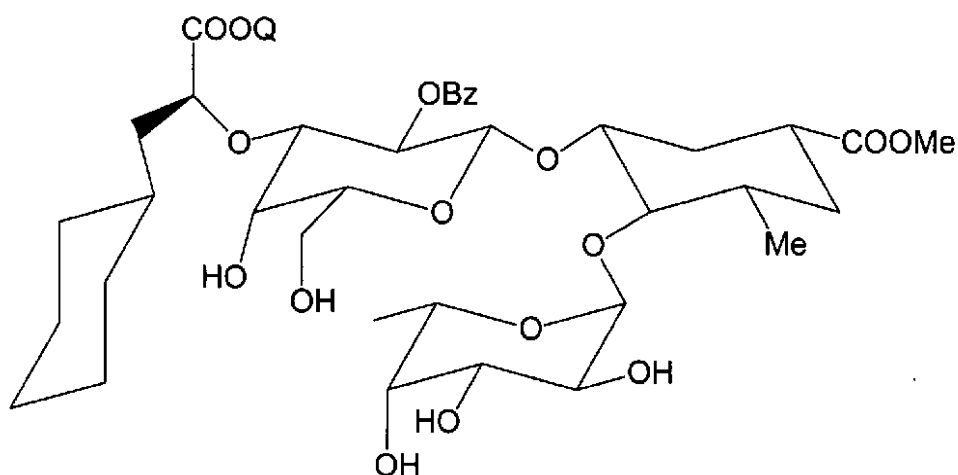


を有し、ここで、Me が、メチルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 9】

式：

## 【化 9 9】



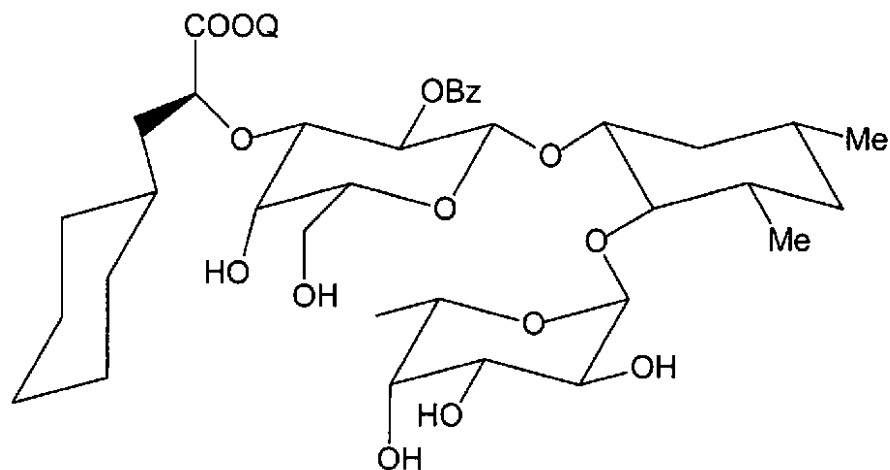
を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 10】

式：



## 【化 1 0 0】

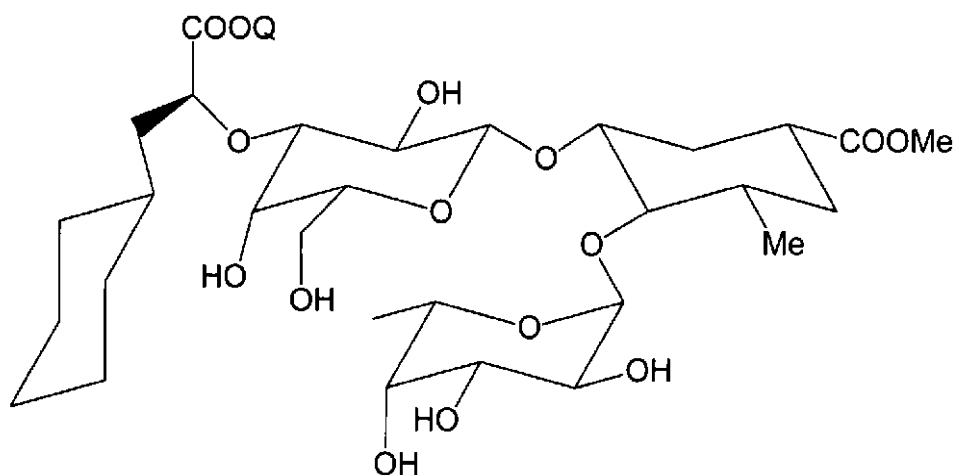


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 1 1】

式：

## 【化 1 0 1】

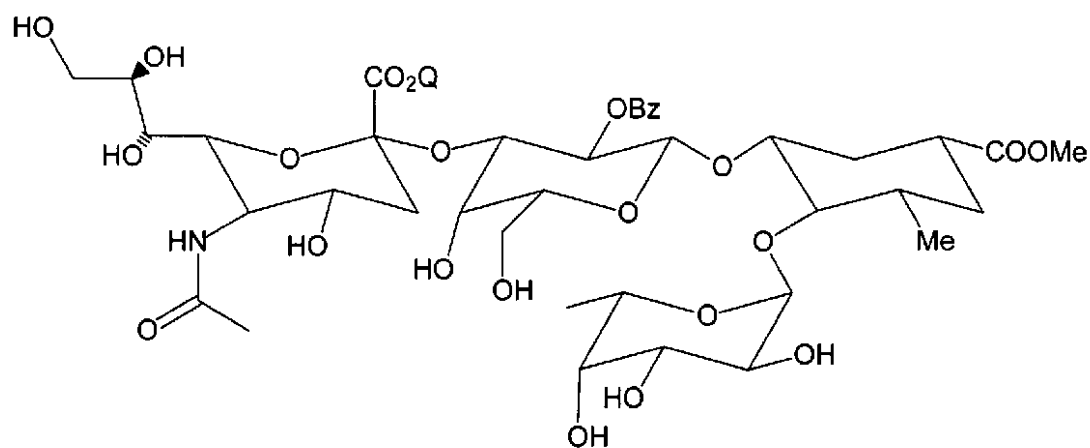


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 1 2】

式：

## 【化 1 0 2】

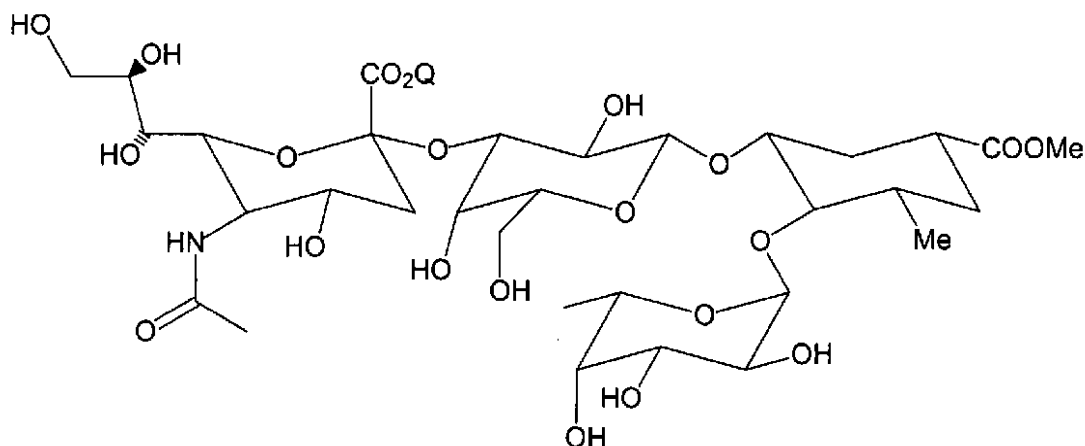


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 13】

式：

【化 103】

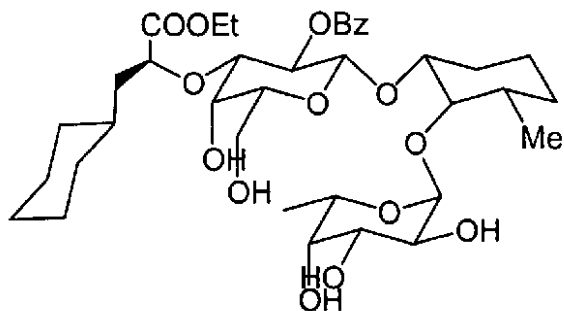


を有し、ここで、Q が、H または生理学的に許容される塩であり、Me が、メチルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 14】

式：

【化 104】

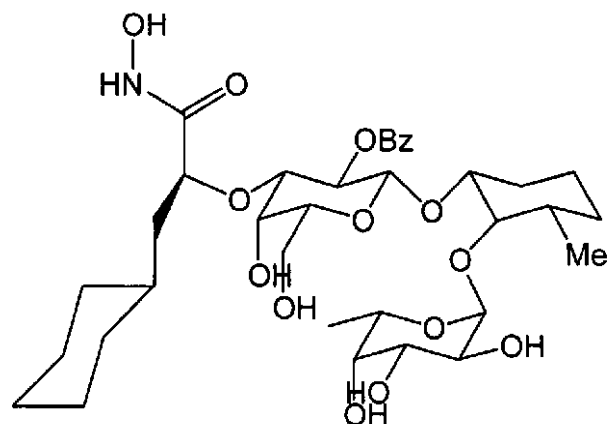


を有し、ここで、Me が、メチルであり、Et が、エチルであり、Bz が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 15】

式：

【化 105】



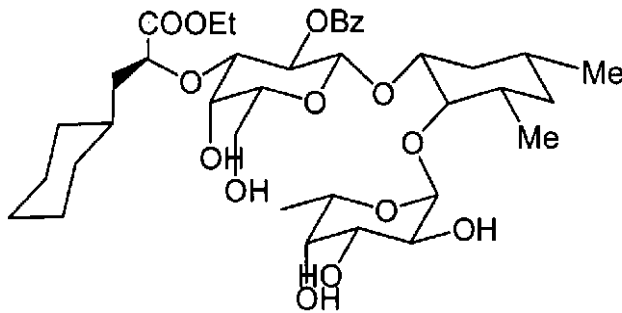
を有し、ここで、Me が、メチルであり、Bz が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の

化合物。

【請求項 16】

式：

【化 106】

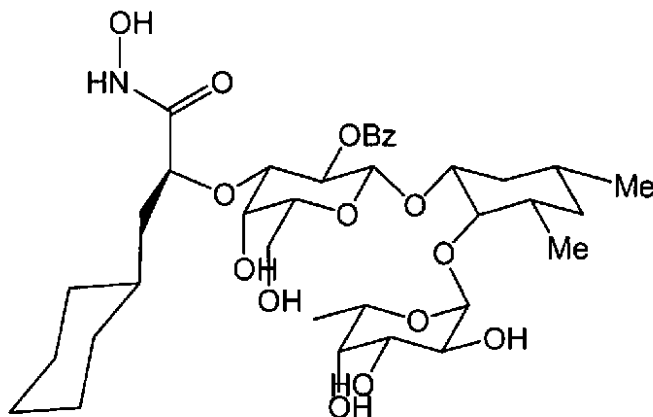


を有し、ここで、Me が、メチルであり、Et が、エチルであり、Bz が、ベンゾイルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 17】

式：

【化 107】



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 に記載の化合物。

【請求項 18】

前記化合物に結合しているポリエチレングリコールを含む、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 19】

請求項 1 に記載の化合物の別のものにポリエチレングリコールによって結合している、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 20】

請求項 1 ~ 19 のいずれか一項に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 21】

E - セレクチンのアンタゴニストとしての使用のための請求項 1 ~ 19 のいずれか一項に記載の化合物を含む医薬組成物。