

【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28年11月4日(2016.11.4)

【公表番号】特表2015-533128(P2015-533128A)

【公表日】平成27年11月19日(2015.11.19)

【年通号数】公開・登録公報2015-072

【出願番号】特願2015-535936(P2015-535936)

【国際特許分類】

C 07 D	311/30	(2006.01)
C 07 H	15/203	(2006.01)
A 61 K	31/353	(2006.01)
A 61 K	31/7048	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
A 61 P	39/06	(2006.01)
A 61 P	9/10	(2006.01)
A 61 P	9/00	(2006.01)
A 61 P	9/12	(2006.01)
A 61 P	11/00	(2006.01)
A 61 P	25/06	(2006.01)
A 61 P	27/02	(2006.01)
A 61 P	3/10	(2006.01)
A 61 K	45/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D	311/30	C S P
C 07 H	15/203	
A 61 K	31/353	
A 61 K	31/7048	
A 61 P	43/00	1 0 5
A 61 P	39/06	
A 61 P	9/10	
A 61 P	9/10	1 0 1
A 61 P	9/00	
A 61 P	9/12	
A 61 P	11/00	
A 61 P	25/06	
A 61 P	27/02	
A 61 P	3/10	
A 61 K	45/00	

【手続補正書】

【提出日】平成28年9月13日(2016.9.13)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0171

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0171】

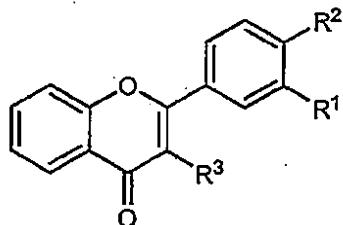
この明細書を通して、「含む (comprise)」という単語、または変形(「含む (comprises)」または「含むこと (comprising)」等)は、明示さ

れた要素、整数値もしくは工程、または要素、整数値もしくは工程の群を包含するが、他の要素、整数値もしくは工程、または要素、または整数値もしくは工程の群を除外しないことを示唆すると理解される。

本発明の実施形態として、例えば以下を挙げることができる。

(1) 一般式 (I) の化合物：

【化 3 6】



(I)

(式中、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup> は、H または O R<sup>6</sup> から独立して選択され；

R<sup>6</sup> は、R<sup>7</sup> または R<sup>8</sup> であり；

R<sup>7</sup> は、H、エステル、カルボン酸、スルホン酸、サルフェート、ホスホン酸、リン酸エステル、スルファメート、スルホン酸エステル、ホスファメート、ホスホン酸エステル、スルホネート、双性イオン種、アミノ酸、アミノホスホネート、非環状アミン、環状アミン、第4級アンモニウムカチオン、ポリエチレングリコール、糖類、およびデンドリマーを含む群から選択され；

R<sup>8</sup> は、H、糖類、スルホネート、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキルおよびアシリルを含む群から選択され、場合によって1つまたは複数のヘテロ原子によって中断される)

または、その薬学的に許容される塩、水和物、溶媒和物、プロドラッグもしくは異性体（ただし、化合物は少なくとも1つのR<sup>7</sup>および少なくとも1つのR<sup>8</sup>を含み、R<sup>7</sup>またはR<sup>8</sup>のうちの少なくとも1つはH以外であり；

さらにただし、

R<sup>2</sup> および R<sup>3</sup> が両方とも OH である場合、R<sup>1</sup> は -OCH<sub>3</sub> ではなく；

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> が両方とも OH である場合、R<sup>3</sup> は -OC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>CO<sub>2</sub>H ではなく；

R<sup>1</sup> が H であり、R<sup>2</sup> が OH である場合、R<sup>3</sup> は -OC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>CO<sub>2</sub>H ではない。)

(2) R<sup>7</sup> が、エステル、カルボン酸、スルホン酸、ホスホン酸、リン酸エステル、ポリエチレングリコール、糖類およびデンドリマーから選択される、(1)に記載の化合物。

(3) R<sup>7</sup> または R<sup>8</sup> が、独立して单糖、オリゴ糖、および多糖を含む群から選択される糖類である、(1)に記載の化合物。

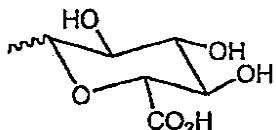
(4) 糖類が单糖である、(3)に記載の化合物。

(5) 单糖が、グルコース、グルクロン酸、ガラクトース、キシロース、アピオースおよびアロースを含む群から選択される、(4)に記載の化合物。

(6) 单糖がグルクロン酸である、(5)に記載の化合物。

(7) R<sup>7</sup> が、

【化 3 7】

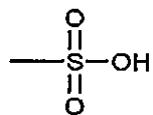


である、(1)に記載の化合物。

(8)  $R^7$  が、スルホネートである、(1)に記載の化合物。

(9)  $R^7$  が、

【化38】

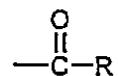


である、(1)に記載の化合物。

(10)  $R^8$  がアシル基である、(1)に記載の化合物。

(11) アシル基が、下記式：

【化39】



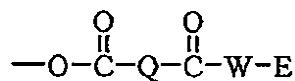
(式中、Rは、置換または非置換の低級アルキル、アルケニルまたはアルキニル、シクロアルキル基であり、場合によって1つまたは複数のヘテロ原子によって中断される)  
に従う、(9)に記載の化合物。

(12) Rが低級アルキルである、(10)に記載の化合物。

(13) Rが- $C(CH_3)_2$ である、(10)に記載の化合物。

(14)  $R^7$  が、下記式：

【化40】



(式中、

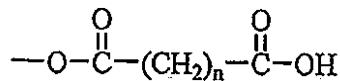
Qは置換または非置換の低級アルキレン、低級アルケニレン、低級アルキニレンであり、  
場合によって1つまたは複数のヘテロ原子によって中断される；

Wは、O、NH、S、O<sup>-</sup>、NH<sup>-</sup>またはS<sup>-</sup>であり；

Eは、H、一価もしくは二価のカチオン性塩、またはアンモニウムカチオン性塩である)  
に従うエステルである、(1)に記載の化合物。

(15)  $R^7$  が、下記式：

【化41】

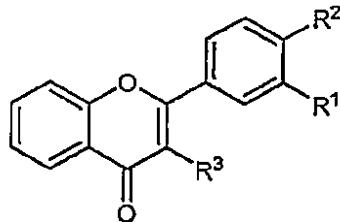


(式中、nは、10未満、7未満、5未満および4に等しい整数を含む群から選択される  
整数である)

に従うエステルである、(1)に記載の化合物。

(16) 一般式(I)の化合物：

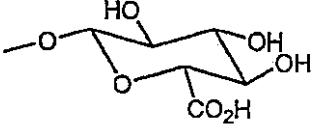
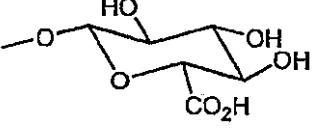
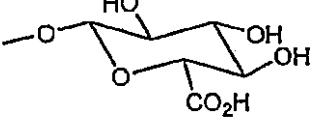
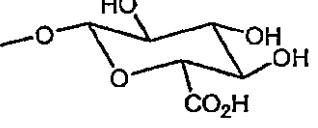
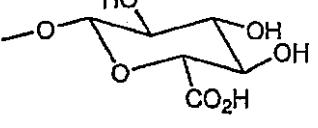
【化42】



(I)

(式中、  
【化43】)

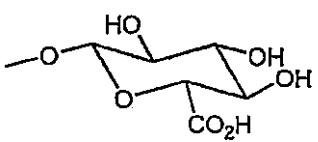
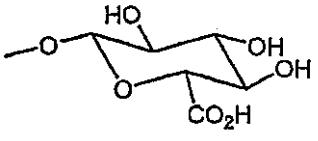
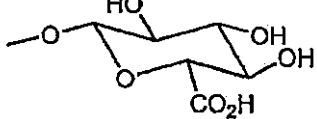
	$\text{R}^1$	$\text{R}^2$	$\text{R}^3$
(1)	$\text{---O---C=O---CH}_3$	$\text{---O---C=O---CH}_3$	$\text{---O---C(}(\text{CH}_2)_4\text{C=O---OH}$
(2)	$\text{---OCH}_3$	$\text{---O---C=O---CH}_3$	$\text{---O---C(}(\text{CH}_2)_4\text{C=O---OH}$
(3)	$\text{---O---C=O---CH}_3$	$\text{---OCH}_3$	$\text{---O---C(}(\text{CH}_2)_4\text{C=O---OH}$
(4)	$\text{---O---C=O---C(CH}_3)_3$	$\text{---O---C=O---C(CH}_3)_3$	$\text{---O---C(}(\text{CH}_2)_4\text{C=O---OH}$
(5)	$\text{---O---C=O---CH}_3$	$\text{---O---C=O---C(CH}_3)_3$	$\text{---O---C(}(\text{CH}_2)_4\text{C=O---OH}$
(6)	$\text{---O---C=O---C(CH}_3)_3$	$\text{---O---C=O---CH}_3$	$\text{---O---C(}(\text{CH}_2)_4\text{C=O---OH}$

	$\text{R}^1$	$\text{R}^2$	$\text{R}^3$
(7)	$\text{---O---C(=O)(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$	$\text{---O---C(=O)(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$	$\text{---O---C(=O)---CH}_3$
(8)	$\text{---O---C(=O)(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$	$\text{---O---C(=O)---CH}_3$	$\text{---O---C(=O)---CH}_3$
(9)	$\text{---O---C(=O)---CH}_3$	$\text{---O---C(=O)(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$	$\text{---O---C(=O)---CH}_3$
(10)	$\text{---O---C(=O)(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$	$\text{---O---C(=O)(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$	$\text{---O---C(=O)---C(CH}_3)_3$
(11)	$\text{---O---C(=O)(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$	$\text{---O---C(=O)---C(CH}_3)_3$	$\text{---O---C(=O)---C(CH}_3)_3$
(12)	$\text{---O---C(=O)---C(CH}_3)_3$	$\text{---O---C(=O)(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$	$\text{---O---C(=O)---C(CH}_3)_3$
(13)	$\text{---O---C(=O)(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$	$\text{---O---C(=O)(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$	$\text{---OCH}_3$
(14)	$\text{---OCH}_3$	$\text{---O---C(=O)(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$	$\text{---OCH}_3$
(15)	$\text{---O---C(=O)(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$	$\text{---OCH}_3$	$\text{---OCH}_3$
(16)	$\text{---O---C(=O)---CH}_3$	$\text{---O---C(=O)---CH}_3$	$\text{---O---C(=O)---CH}_3$
(17)		$\text{---OH}$	$\text{---O---C(=O)(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$
(18)	$\text{---OH}$		$\text{---O---C(=O)(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$
(19)			$\text{---O---C(=O)(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$
(20)		$\text{---O---C(=O)---CH}_3$	$\text{---O---C(=O)(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$

	$R^1$	$R^2$	$R^3$
(21)			
(22)			
(23)			
(24)			
(25)			
(26)			
(27)			
(28)			
(29)			
(30)			
(31)			

	$R^1$	$R^2$	$R^3$
(32)		$-OCH_3$	$-O-C(=O)C(CH_2)_4C(=O)OH$
(33)		$-OCH_3$	
(34)	$-OCH_3$		$-O-C(=O)C(CH_2)_4C(=O)OH$
(35)	$-OCH_3$		
(36)			$-OCH_3$
(37)		$-OCH_3$	$-OH$
(38)	$-OCH_3$		$-OH$
(39)			$-OH$
(40)	$-OH$	$-OH$	
(41)	$-OH$		$-OH$
(42)		$-OH$	$-OH$

	$R^1$	$R^2$	$R^3$
(43)		$\text{---OH}$	
(44)	$\text{---OH}$		
(45)			
(46)	$\text{---OH}$	$\text{---OH}$	$\text{---O---S(=O)(=O)---OH}$
(47)	$\text{---OH}$	$\text{---O---S(=O)(=O)---OH}$	$\text{---OH}$
(48)	$\text{---O---S(=O)(=O)---OH}$	$\text{---OH}$	$\text{---OH}$
(49)	$\text{---O---S(=O)(=O)---OH}$	$\text{---O---S(=O)(=O)---OH}$	$\text{---OH}$
(50)	$\text{---O---S(=O)(=O)---OH}$	$\text{---OH}$	$\text{---O---S(=O)(=O)---OH}$
(51)	$\text{---OH}$	$\text{---O---S(=O)(=O)---OH}$	$\text{---O---S(=O)(=O)---OH}$
(52)	$\text{---O---S(=O)(=O)---OH}$	$\text{---O---C(=O)---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---C(=O)---OH}$	$\text{---OH}$
(53)	$\text{---O---C(=O)---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---C(=O)---OH}$	$\text{---O---S(=O)(=O)---OH}$	$\text{---OH}$
(54)	$\text{---O---C(=O)---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH}_2\text{---C(=O)---OH}$	$\text{---OH}$	$\text{---O---S(=O)(=O)---OH}$

	$\text{R}^1$	$\text{R}^2$	$\text{R}^3$
(55)	$-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$
(56)	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	$-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$
(57)	$-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$
(58)	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$
(59)	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$
(60)	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$
(61)	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$
(62)	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$
(63)	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$
(64)	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	$-\text{OH}$	
(65)	$-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	
(66)	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$		$-\text{OH}$

	$R^1$	$R^2$	$R^3$
(67)			$-OH$
(68)	$-OH$		
(69)		$-OH$	
(70)			
(71)			
(72)			
(73)			
(74)			
(75)			
(76)			
(77)			

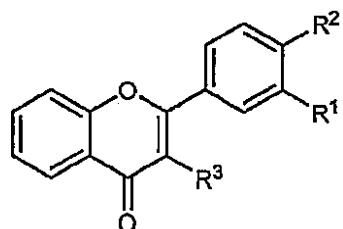
である)。

(17) (1) ~ (16)のいずれか一つに記載の化合物と共に薬学的および/または動物用に許容される担体または希釈剤を含む、医薬組成物および/または動物用組成物。

(18) 細胞アポトーシスおよび/または細胞壊死によって引き起こされた損傷を防止および/または緩和する方法であって、

治療上効果的な量の一般式(I)の化合物:

【化44】



(式中、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>は、HまたはOR<sup>6</sup>から独立して選択され；R<sup>6</sup>は、R<sup>7</sup>またはR<sup>8</sup>であり；R<sup>7</sup>は、H、エステル、カルボン酸、スルホン酸、サルフェート、ホスホン酸、リン酸エステル、スルファメート、スルホン酸エステル、ホスファメート、ホスホン酸エステル、スルホネート、双性イオン種、アミノ酸、アミノホスホネート、非環状アミン、環状アミン、第4級アンモニウムカチオン、ポリエチレングリコール、糖類、およびデンドリマーを含む群から選択され；R<sup>8</sup>は、H、糖類、スルホネート、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキルおよびアシルを含む群から選択され、場合によって1つまたは複数のヘテロ原子によって中断される)；またはその薬学的に許容される塩、水和物、溶媒和物、プロドラッグもしくは異性体(ただし、化合物は少なくとも1つのR<sup>7</sup>および少なくとも1つのR<sup>8</sup>を含み、R<sup>7</sup>またはR<sup>8</sup>のうちの少なくとも1つはH以外であり；さらにただし、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>が両方ともOHである場合、R<sup>1</sup>は-OCH<sub>3</sub>ではなく；R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>が両方ともOHである場合、R<sup>3</sup>は-OOC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>CO<sub>2</sub>Hではなく；R<sup>1</sup>がHであり、R<sup>2</sup>がOHである場合、R<sup>3</sup>は-OOC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>CO<sub>2</sub>Hではない)を投与することを含む、前記方法。(19) 被験体における細胞アポトーシスおよび/または細胞壊死によって引き起こされた疾患を防止および/または緩和する方法であって、治療上効果的な量の(1)～(16)のいずれか一つに記載の少なくとも1つの化合物を投与することを含む、前記方法。(20) 活性酸素種(ROS)の存在と関連した被験体における疾患を防止および/または治療する方法であって、治療上効果的な量の(1)～(16)のいずれか一つに記載の少なくとも1つの化合物を投与することを含む、前記方法。(21) かかる治療を必要とする被験体が虚血を発症するリスクがある、(19)に記載の方法。(22) 被験体が、急性状態または慢性状態の結果として虚血および/または再灌流傷害を患っている、(19)に記載の方法。(23) 疾患が、脳血管疾患、肺血管疾患、アテローム性動脈硬化症、動脈疾患、鬱血性心疾患、冠動脈疾患、末梢血管疾患、糖尿病、高血圧症、片頭痛、慢性閉塞性肺疾患および網膜血管疾患から選択される、(22)に記載の方法。(24) 疾患が、脳卒中、心筋梗塞、挫滅傷または外科手術から生じる機械的外傷から選択される、(23)に記載の方法。(25) 疾患が血管手術の結果である、(24)に記載の方法。(26) 疾患が心臓バイパスおよび/または移植手術の結果である、(24)に記載の方法。(27) 化合物が外科手術の前および/またはその間に被験体へ投与される、(24)に記載の方法。

- (28) 化合物が被験体へ経口投与される、(24)に記載の方法。
- (29) 活性酸素種 (ROS) の存在と関連した被験体における疾患の治療のための医薬品の製造における(1)～(16)のいずれか一つに記載の化合物の使用。
- (30) 被験体におけるアテローム性動脈硬化症および／または冠性心疾患の進行の減速のための医薬品の製造における(1)～(16)のいずれか一つに記載の化合物の使用。
- (31) 虚血および／または再灌流傷害によって引き起こされた被験体への損傷を少なくとも寛解する医薬品の製造における(1)～(16)のいずれか一つに記載の化合物の使用。
- (32) 治療的薬剤の投与によって引き起こされた被験体への損傷を少なくとも寛解する医薬品の製造における(1)～(16)のいずれか一つに記載の化合物の使用。
- (33) 活性を阻害し、一方で同時にERK活性を活性化する方法であって、治療上効果的な量の(1)～(16)のいずれか一つに記載の少なくとも1つの化合物を投与することを含む、前記方法。
- (34) アポトーシス促進シグナル伝達キナーゼを阻害する方法であって、治療上効果的な量の(1)～(16)のいずれか一つに記載の少なくとも1つの化合物を投与することを含む、前記方法。
- (35) 被験体におけるアポトーシス促進シグナル伝達キナーゼ活性の阻害のための医薬品の製造のための化合物の使用であって、化合物が(1)～(16)のいずれか一つに記載される化合物である、前記使用。
- (36) 虚血および／または再灌流傷害によって引き起こされた被験体への損傷を防止および／または少なくとも寛解する方法であって、治療上効果的な量の(1)～(16)のいずれか一つに記載の少なくとも1つの化合物を投与することを含む、前記方法。
- (37) 治療的薬剤の投与によって引き起こされた被験体への損傷を防止および／または少なくとも寛解する方法であって、
- i ) 治療的薬剤と；
- ii ) 治療上効果的な量の(1)～(16)のいずれか一つに記載の少なくとも1つの化合物とを被験体へ共投与することを含む、前記方法。

## 【手続補正2】

【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

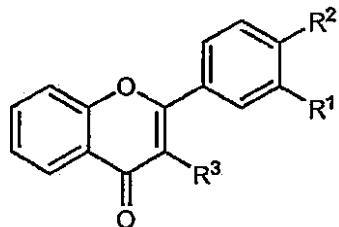
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(I)の化合物：

【化1】



(I)

(式中、

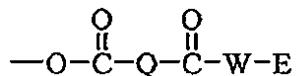
R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>は、HまたはOR<sup>6</sup>から独立して選択され；R<sup>6</sup>は、R<sup>7</sup>またはR<sup>8</sup>であり；R<sup>7</sup>は、H、エステル、カルボン酸、スルホン酸、サルフェート、ホスホン酸、リン酸エ

ステル、スルファメート、スルホン酸エステル、ホスファメート、ホスホン酸エステル、スルホネート、双性イオン種、アミノ酸、アミノホスホネート、非環状アミン、環状アミン、第4級アンモニウムカチオン、ポリエチレングリコール、糖類、およびデンドリマーを含む群から選択され；

R<sup>8</sup>は、H、糖類、スルホネート、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキルおよびアシルを含む群から選択され、場合によって1つまたは複数のヘテロ原子によって中断される）

または、その薬学的に許容される塩、水和物、溶媒和物、プロドラッグもしくは異性体（R<sup>7</sup>がエステルである場合、エステルは、下記式：

【化2】



（式中、

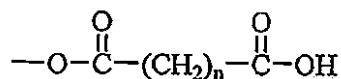
Qは置換または非置換の低級アルキレン、低級アルケニレン、低級アルキニレンであり、場合によって1つまたは複数のヘテロ原子によって中断される；

Wは、O、NH、S、O<sup>-</sup>、NH<sup>-</sup>またはS<sup>-</sup>であり；

Eは、Hである）

に従うか、またはエステルは、下記式：

【化3】



（式中、nは、10未満、7未満、5未満および4に等しい整数を含む群から選択される整数である）

に従い、

ただし、化合物は少なくとも1つのR<sup>7</sup>および少なくとも1つのR<sup>8</sup>を含み、R<sup>7</sup>またはR<sup>8</sup>のうちの少なくとも1つはH以外であり；

さらにただし、

R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>が両方ともOHである場合、R<sup>1</sup>は-OCH<sub>3</sub>ではなく；

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>が両方ともOHである場合、R<sup>3</sup>は-OOC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>CO<sub>2</sub>Hではなく；

R<sup>1</sup>がHであり、R<sup>2</sup>がOHである場合、R<sup>3</sup>は-OOC(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>CO<sub>2</sub>Hではない）。

【請求項2】

R<sup>7</sup>またはR<sup>8</sup>が、独立して单糖、オリゴ糖、または多糖から選択され、好ましくは糖類が单糖である、請求項1に記載の化合物。

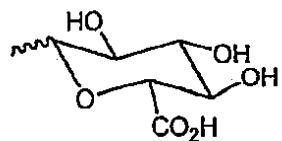
【請求項3】

单糖が、グルコース、グルクロン酸、ガラクトース、キシロース、アピオースまたはアロースであり、好ましくは单糖がグルクロン酸である、請求項1または2に記載の化合物。

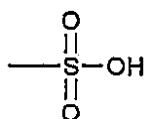
【請求項4】

R<sup>7</sup>が、

【化4】

、スルホネートおよび

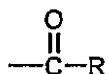
【化5】

を含む群から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

R<sup>8</sup>がアシル基であり、アシル基が、下記式：

【化6】

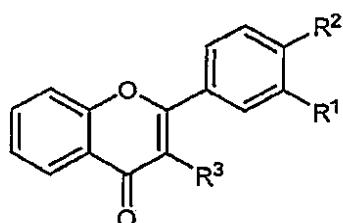


(式中、Rは、置換または非置換の低級アルキル、アルケニルまたはアルキニル、シクロアルキル基であり、場合によって1つまたは複数のヘテロ原子によって中断され、好ましくはRは低級アルキルであり、より好ましくはRは-C(CH<sub>3</sub>)である)  
に従う、請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

一般式(I)の化合物：

【化7】

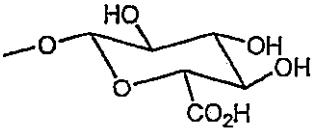
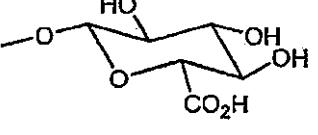
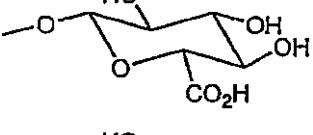
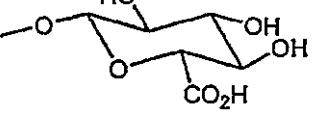
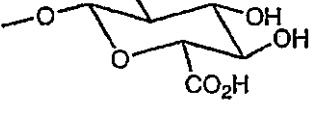


(I)

(式中、

【化 8】

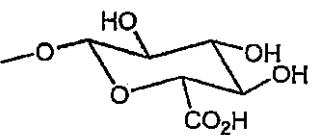
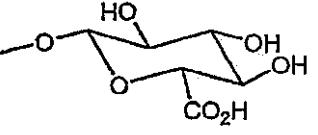
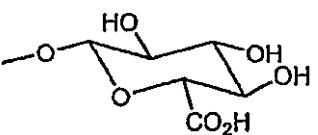
	$\text{R}^1$	$\text{R}^2$	$\text{R}^3$
(1)	$\text{---O---C(=O)---CH}_3$	$\text{---O---C(=O)---CH}_3$	$\text{---O---C(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$
(2)	$\text{---OCH}_3$	$\text{---O---C(=O)---CH}_3$	$\text{---O---C(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$
(3)	$\text{---O---C(=O)---CH}_3$	$\text{---OCH}_3$	$\text{---O---C(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$
(4)	$\text{---O---C(=O)---C(CH}_3)_3$	$\text{---O---C(=O)---C(CH}_3)_3$	$\text{---O---C(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$
(5)	$\text{---O---C(=O)---CH}_3$	$\text{---O---C(=O)---C(CH}_3)_3$	$\text{---O---C(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$
(6)	$\text{---O---C(=O)---C(CH}_3)_3$	$\text{---O---C(=O)---CH}_3$	$\text{---O---C(CH}_2)_4\text{C(=O)---OH}$

	$\text{R}^1$	$\text{R}^2$	$\text{R}^3$
(7)	$\text{---O---C(}=\text{O}\text{---CH}_2\text{)}_4\text{C---OH}$	$\text{---O---C(}=\text{O}\text{---CH}_2\text{)}_4\text{C---OH}$	$\text{---O---C(}=\text{O}\text{---CH}_3\text{)}$
(8)	$\text{---O---C(}=\text{O}\text{---CH}_2\text{)}_4\text{C---OH}$	$\text{---O---C(}=\text{O}\text{---CH}_3\text{)}$	$\text{---O---C(}=\text{O}\text{---CH}_3\text{)}$
(9)	$\text{---O---C(}=\text{O}\text{---CH}_3\text{)}$	$\text{---O---C(}=\text{O}\text{---CH}_2\text{)}_4\text{C---OH}$	$\text{---O---C(}=\text{O}\text{---CH}_3\text{)}$
(10)	$\text{---O---C(}=\text{O}\text{---CH}_2\text{)}_4\text{C---OH}$	$\text{---O---C(}=\text{O}\text{---CH}_2\text{)}_4\text{C---OH}$	$\text{---O---C(}=\text{O---C(CH}_3)_3\text{)}$
(11)	$\text{---O---C(}=\text{O}\text{---CH}_2\text{)}_4\text{C---OH}$	$\text{---O---C(}=\text{O---C(CH}_3)_3\text{)}$	$\text{---O---C(}=\text{O---C(CH}_3)_3\text{)}$
(12)	$\text{---O---C(}=\text{O---C(CH}_3)_3\text{)}$	$\text{---O---C(}=\text{O---CH}_2\text{)}_4\text{C---OH}$	$\text{---O---C(}=\text{O---C(CH}_3)_3\text{)}$
(13)	$\text{---O---C(}=\text{O}\text{---CH}_2\text{)}_4\text{C---OH}$	$\text{---O---C(}=\text{O}\text{---CH}_2\text{)}_4\text{C---OH}$	$\text{---OCH}_3$
(14)	$\text{---OCH}_3$	$\text{---O---C(}=\text{O---CH}_2\text{)}_4\text{C---OH}$	$\text{---OCH}_3$
(15)	$\text{---O---C(}=\text{O}\text{---CH}_2\text{)}_4\text{C---OH}$	$\text{---OCH}_3$	$\text{---OCH}_3$
(16)	$\text{---O---C(}=\text{O---CH}_3\text{)}$	$\text{---O---C(}=\text{O---CH}_3\text{)}$	$\text{---O---C(}=\text{O---CH}_3\text{)}$
(17)		$\text{---OH}$	$\text{---O---C(}=\text{O}\text{---CH}_2\text{)}_4\text{C---OH}$
(18)	$\text{---OH}$		$\text{---O---C(}=\text{O}\text{---CH}_2\text{)}_4\text{C---OH}$
(19)			$\text{---O---C(}=\text{O}\text{---CH}_2\text{)}_4\text{C---OH}$
(20)		$\text{---O---C(}=\text{O---CH}_3\text{)}$	$\text{---O---C(}=\text{O---CH}_2\text{)}_4\text{C---OH}$

	$\text{R}^1$	$\text{R}^2$	$\text{R}^3$
(21)			
(22)			
(23)			
(24)			
(25)			
(26)			
(27)			
(28)			
(29)			
(30)			
(31)			

	$\text{R}^1$	$\text{R}^2$	$\text{R}^3$
(32)		$-\text{OCH}_3$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$
(33)		$-\text{OCH}_3$	
(34)	$-\text{OCH}_3$		$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$
(35)	$-\text{OCH}_3$		
(36)			$-\text{OCH}_3$
(37)		$-\text{OCH}_3$	$-\text{OH}$
(38)	$-\text{OCH}_3$		$-\text{OH}$
(39)			$-\text{OH}$
(40)	$-\text{OH}$	$-\text{OH}$	
(41)	$-\text{OH}$		$-\text{OH}$
(42)		$-\text{OH}$	$-\text{OH}$

	$R^1$	$R^2$	$R^3$
(43)		—OH	
(44)	—OH		
(45)			
(46)	—OH	—OH	
(47)	—OH		—OH
(48)		—OH	—OH
(49)			—OH
(50)		—OH	
(51)	—OH		
(52)			—OH
(53)			—OH
(54)		—OH	

	$\text{R}^1$	$\text{R}^2$	$\text{R}^3$
(55)	$-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$
(56)	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	$-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$
(57)	$-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$
(58)	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$
(59)	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$
(60)	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$
(61)	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$
(62)	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$
(63)	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}(\text{CH}_2)_4\overset{\text{O}}{\parallel}\text{C}-\text{OH}$
(64)	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	$-\text{OH}$	
(65)	$-\text{OH}$	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$	
(66)	$-\text{O}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{S}-\text{OH}$		$-\text{OH}$

	$R^1$	$R^2$	$R^3$
(67)			$-OH$
(68)	$-OH$		
(69)		$-OH$	
(70)			
(71)			
(72)			
(73)			
(74)			
(75)			
(76)			
(77)			

である)。

#### 【請求項 7】

請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物と共に薬学的および / または動物用に許容される担体または希釈剤を含む、医薬組成物および / または動物用組成物。

#### 【請求項 8】

細胞アポトーシスおよび / または細胞壊死によって引き起こされた損傷を防止および / または緩和する医薬品の製造における請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

**【請求項 9】**

虚血、再灌流傷害、脳血管疾患、肺血管疾患、アテローム性動脈硬化症、脳卒中、心筋梗塞、心臓バイパスおよび／または移植手術、動脈疾患、鬱血性心疾患、冠動脈疾患、末梢血管疾患、糖尿病、高血圧症、片頭痛、慢性閉塞性肺疾患または網膜血管疾患を少なくとも防止および／または緩和する医薬品の製造における請求項 1～6 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

**【請求項 10】**

活性酸素種（ROS）の存在と関連した被験体における疾患の治療のための医薬品の製造における請求項 1～6 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

**【請求項 11】**

被験体におけるアテローム性動脈硬化症および／または冠性心疾患の進行の減速のための医薬品の製造における請求項 1～6 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

**【請求項 12】**

虚血および／または再灌流傷害によって引き起こされた被験体への損傷を少なくとも寛解する医薬品の製造における請求項 1～6 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

**【請求項 13】**

治療的薬剤の投与によって引き起こされた被験体への損傷を少なくとも寛解する医薬品の製造における請求項 1～6 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

**【請求項 14】**

活性を阻害し、一方で同時にERK活性を活性化する医薬品の製造における請求項 1～6 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

**【請求項 15】**

アポトーシス促進シグナル伝達キナーゼを阻害する医薬品の製造における請求項 1～6 のいずれか一項に記載の化合物の使用。