

【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1月26日(2012.1.26)

【公表番号】特表2011-509289(P2011-509289A)

【公表日】平成23年3月24日(2011.3.24)

【年通号数】公開・登録公報2011-012

【出願番号】特願2010-541890(P2010-541890)

【国際特許分類】

C 07 D 493/04	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 3/10	(2006.01)
A 61 P 3/04	(2006.01)
A 61 P 3/06	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 1/00	(2006.01)
A 61 P 1/04	(2006.01)
A 61 P 1/18	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 27/02	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 13/12	(2006.01)
A 61 P 15/00	(2006.01)
A 61 P 17/00	(2006.01)
A 61 P 17/06	(2006.01)
A 61 P 1/10	(2006.01)
A 61 P 37/02	(2006.01)
A 61 P 25/24	(2006.01)
A 61 P 25/22	(2006.01)
A 61 P 25/20	(2006.01)
A 61 P 25/18	(2006.01)
A 61 P 25/08	(2006.01)
A 61 P 25/14	(2006.01)
A 61 P 25/04	(2006.01)
A 61 P 31/18	(2006.01)
A 61 P 37/08	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 19/02	(2006.01)
A 61 P 37/06	(2006.01)
A 61 P 9/12	(2006.01)
A 61 P 9/04	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 15/06	(2006.01)
A 61 K 31/454	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 K 31/4545	(2006.01)

【F I】

C 07 D 493/04	1 0 1 Z
A 61 P 43/00	1 1 1

A 6 1 P 3/10  
A 6 1 P 3/04  
A 6 1 P 3/06  
A 6 1 P 9/10  
A 6 1 P 9/00  
A 6 1 P 1/00  
A 6 1 P 1/04  
A 6 1 P 1/18  
A 6 1 P 25/28  
A 6 1 P 27/02  
A 6 1 P 25/00  
A 6 1 P 13/12  
A 6 1 P 15/00  
A 6 1 P 17/00  
A 6 1 P 17/06  
A 6 1 P 1/10  
A 6 1 P 37/02  
A 6 1 P 25/24  
A 6 1 P 25/22  
A 6 1 P 25/20  
A 6 1 P 25/18  
A 6 1 P 25/08  
A 6 1 P 25/14  
A 6 1 P 25/04  
A 6 1 P 31/18  
A 6 1 P 37/08  
A 6 1 P 29/00  
A 6 1 P 19/02  
A 6 1 P 37/06  
A 6 1 P 9/12  
A 6 1 P 9/04  
A 6 1 P 35/00  
A 6 1 P 15/06  
A 6 1 K 31/454  
C 0 7 D 493/04 1 0 6 B  
A 6 1 K 31/5377  
A 6 1 K 31/4545

【手続補正書】

【提出日】平成23年12月5日(2011.12.5)

【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

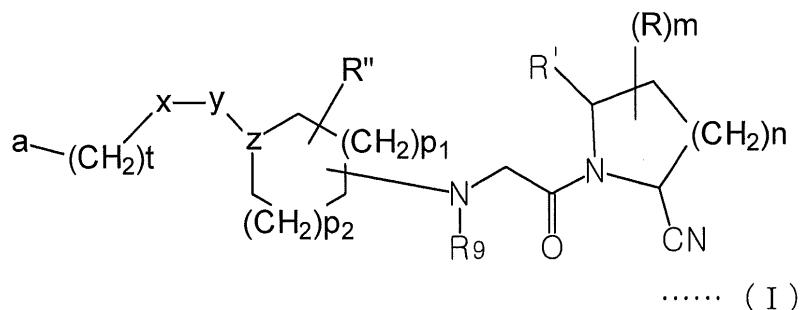
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iで表される化合物、

## 【化170】

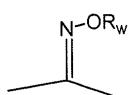


またはその互変異性体、位置異性体、立体異性体、溶媒和物、N-オキシド、もしくは薬学的に許容される塩。

(式中、「a」は、置換または非置換のヘテロシクロアルキル環および置換または非置換の炭水化物部分からなる群から選ばれ、

y は、-O-、-CO-、-SO<sub>2</sub>-、アミノアルキル、または

## 【化171】



から選ばれる1種であり、式中、R<sub>w</sub>は、水素、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールであり、

x は、-O-、-S-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、CONR<sub>10</sub>、NR<sub>10</sub>CO、および-NR<sub>d</sub>-から選ばれる1種であるか、あるいはxおよびyは一緒にになって化学結合を表し、ここでR<sub>10</sub>は、水素、アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、置換または非置換のアリールおよびヘテロアリールからなる群から選ばれ、R<sub>d</sub>は、水素、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールであり、

R および R' は独立して、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、アルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アルコキシアリル、アルキルカルボニル、アルコキカルボニル、アルケニル、アルキニル、アリールアルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、オキソ、ヒドロキシイミノカルボニル、アルコキシイミノカルボニル、または1~5個の炭素原子を有するアルキリデン基、あるいはR および R' は、x および y が一緒にになった化学結合を表さない場合は、R および R' が結合する炭素原子と一緒にになってC<sub>3~7</sub>環式もしくはヘテロシクロアルキル環を形成してもよく、

Z は -CH-、-N- から選ばれ、

R" は、水素、アルキル、アルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、ハロアルキルから選ばれ、

R<sub>9</sub>は、水素、メチル、COOR<sub>11</sub>から選ばれ、ここでR<sub>11</sub>は、アルキル、アルキルアリール、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、置換または非置換のアリールおよびヘテロアリールからなる群から選ばれ、

p<sub>1</sub>は0、1、または2であり、p<sub>2</sub>は、0、1、または2であるが、但し p<sub>1</sub>と p<sub>2</sub>との和は1ではなく、

m および n は、0、1、または2から選ばれる整数であり、

t は、0~4から選ばれる整数であるが、但し

「a」が置換または非置換のヘテロシクロアルキル環である場合、「t」は0ではなく、y が -CO- である場合、x は NR<sub>d</sub> ではない。)

## 【請求項2】

前記ヘテロシクロアルキル環が、O、S、およびNからなる群から選ばれるヘテロ原子を含む置換または非置換の4～7員单環式、二環式、または三環式環である、請求項1に記載の化合物。

**【請求項3】**

前記ヘテロシクロアルキル環が、置換または非置換のテトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、ジヒドロフラン、およびジヒドロピランからなる群から選ばれる、請求項2に記載の化合物。

**【請求項4】**

前記炭水化物部分が、ピラノース型またはフラノース型で存在する、請求項1に記載の化合物。

**【請求項5】**

前記炭水化物部分が置換または非置換の单糖、オリゴ糖、およびこれらの誘導体からなる群から選ばれる、請求項1に記載の化合物。

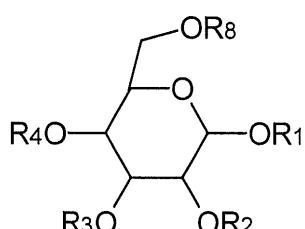
**【請求項6】**

前記单糖誘導体が、デオキシ糖、不飽和单糖、アザ糖、およびアミノ糖からなる群から選ばれる、請求項5に記載の化合物。

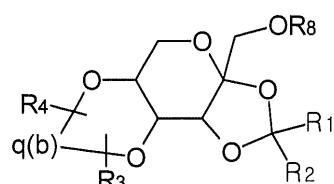
**【請求項7】**

前記「单糖」が、式I I、I I I、I V、V、V A

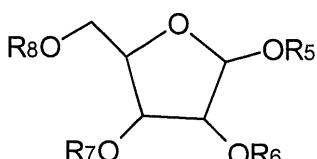
**【化172】**



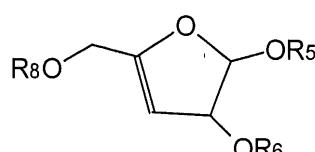
式I I



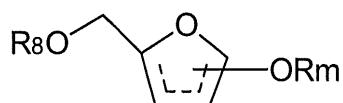
式I I I



式I V



式V



式VA

からなる群から選ばれる、請求項5に記載の化合物であって、式中

qは0または1であり、qが0である場合、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は2つの酸素原子に結合し、qが1である場合、R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>はbに結合し、

bは、-C(R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>)-、-C(R<sub>3</sub> R<sub>4</sub>)-CO-、-C(R<sub>3</sub> R<sub>4</sub>)-CH<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>-C(R<sub>3</sub> R<sub>4</sub>)-CH<sub>2</sub>-から選ばれ、

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、およびR<sub>8</sub>は置換されていても置換されていなく

てもよく、独立して、水素、アルキル、置換アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、ビアリール、アルキルアリール、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリールアリールアルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、アルコキシアリール、アリールアルキル、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルカノイル、置換アルカノイル、シクロアルカノイル、アロイル、ビアロイル、ヘテロアロイル、アルコキシカルボニルアルキル、アルコキシカルボニル、ヘテロシクロアルキルカルボニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、シクロアルキルスルフィニル、アリールスルフィニル、ヘテロシクロアルキルスルフィニル、ヘテロアリールスルフィニル、アリールアルキルスルホニル、シクロアルキルアルキルスルホニル、ヘテロシクロアルキルアルキルスルホニル、ヘテロアリールアルキルスルホニル、アルコキシスルホニル、オキシイミノアロイルメチル、結合アセタミド誘導体、シクロアルキルスルホニル、 $N(R_d)_2CO$  - からなる群から選ばれ、ここで $R_d$ は、水素、置換または非置換のアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールから選ばれ、ここでアルキル基上の置換基は、シクロアルキル、ビアリール、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アリールオキシ、アミンからなる群から選ばれてもよく、

あるいは $R_3$ 、 $R_4$ は一緒になって $C=O$ 、 $C=S$ 、 $C=N-OR_w$ を形成し、ここで $R_w$ は請求項1で定義のとおりであり、

あるいは $R_1$ と $R_2$ または $R_3$ と $R_4$ は、これらが結合する炭素原子と共に、 $C_{5-7}1,3$ -ジオキソラン環または $C_{4-7}$ スピロシクロアルキルもしくは $C_4-C_7$ スピロヘテロシクロアルキル環を有する $C_{5-7}1,3$ -ジオキソラン環を形成してもよく、

あるいは $R_5$ と $R_6$ は、これらが結合する酸素原子と共に、 $1,3$ -ジオキソラン環またはスピロシクロアルキル( $C_4-C_6$ )で置換された $1,3$ -ジオキソラン環を形成してもよく、

あるいは $R_6$ と $R_7$ は、これらが結合する酸素原子と共に、 $1,3$ -ジオキソラン環またはスピロシクロアルキル( $C_4-C_6$ )で置換された $1,3$ -ジオキソラン環を形成してもよく、

単不飽和を有する式VAの化合物中の $OR_m$ は、 $OR_5$ および $OR_7$ または $OR_6$ または $OR_7$ および $OR_5$ を表し、

$R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、および $R_7$ に関して選ばれるアルキル基、置換アルキル基、シクロアルキル基は、任意に、これらの部分中に1個以上の不飽和、ヘテロ原子、カルボニル、またはオキシムを含んでいてもよく、

単糖は、当該単糖の環中に存在する炭素原子または環外炭素原子を介して「x」に結合している、化合物。

#### 【請求項8】

ZがNであり、

tが0であり、

「a」が置換または非置換の单糖である、請求項1に記載の化合物。

#### 【請求項9】

2,3:4,5-ジ-O-イソプロピリデン-1-[ピペリジン-{4-アミノアセチルピロリジン-2-(S)-カルボニトリル}-1-イル]-1-デオキシ-D-フルクトピラノース、

2,3:4,5-ジ-O-イソプロピリデン-1-[ピペリジン-{4-アミノアセチルピロリジン-(2-(S)-カルボニトリル-4-(S)-フルオロ)}-1-イル]-1-デオキシ-D-フルクトピラノース、

2,3:4,5-ジ-O-イソプロピリデン-1-[ピペリジン-{4-アミノアセチルピロリジン-(2-(S)-カルボニトリル-4,4-ジフルオロ)}-1-イル]-1-デオキシ-D-フルクトピラノース、

2,3:4,5-ジ-O-イソプロピリデン-1-[ピペリジン-{4-アミノアセチ

ルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

2 , 3 : 4 , 5 - ジ - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - ( S ) - フルオロ ) } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

2 , 3 : 4 , 5 - ジ - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 , 4 - ジフルオロ ) } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 1 - デオキシフルクトピラノース、

2 , 3 : 4 , 5 - ジ - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノニアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - フルオロメチル ) - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

2 , 3 : 4 , 5 - ジ - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノニアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メトキシメチル ) - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

2 , 3 : 4 , 5 - ジ - O - 2 - エチルプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - [ 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - D - フルクトピラノース、

2 , 3 : 4 , 5 - ジ - O - シクロペンチリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 1 - デオキシフルクトピラノース、

2 , 3 : 4 , 5 - ジ - O - イソプロピリデン - 1 - [ アセチジン - { 3 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

2 , 3 : 4 , 5 - ジ - O - イソプロピリデン - 1 - [ ヒペリシン - { ( R ) - 3 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) カルボニトリル } - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - D - フルクトピラノース、

2 , 3 : 4 , 5 - ジ - 0 - イソプロピリデン - 1 - [ ピベリシン - { 3 - アミノアルセナルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 , 5 - ジヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - [ 4 - ミノアセチルビロリジン - 2 - ( S ) カルボニトリル } - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - D - フルクトピラノース、  
4 , 5 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - [ 4 - ア

ミノアセチルピロリジン - (2 - (S) - カルボニトリル - 4 - (S) - フルオロ) } - 1 - イル] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
4 - 5 - ジヒドロキシ - 2 - 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリミン - { 4 - }

ミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル ) } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

ミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - ( S ) - フルオロ ) } -  
 ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 4 - 5 - ジヒドロキシ - 2 - 3 - O - イソプロピリデン - 1 - 「 ピペリジン - f 4 - ア

ミノアセチルピロリジン - (2 - (S) - カルボニトリル) } - (4 - フルオロメチル) - 1 - イル] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
4 - 5 - ジヒドロキシ - 2 - 3 - O - イソプロピリデン - 1 - 「ピペリジン - { 4 - ア

ミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メトキシメチル ) - 1  
 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 4 - 5 - ジヒドロキシ - 2 - 3 - O - シクロペンチリデン - 1 - 「 ピペリジン - { 4 -

アミノアセチルピロリジン-2-(S)-カルボニトリル]-1-イル]-1-デオキシ-D-フルクトピラノース、

4 , 5 - ジヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { ( R ) - 3 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 , 5 - ジヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 3 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) カルボニトリル } - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - ( フラン - 2 - カルボン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - ( n - ペンタン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - ( イソブチル酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - アセチル - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - ( シクロブタノカルボン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース.

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - ( 3 - メチルオキセタン - 3 - カルボン酸エヌテル ) - 1 - テオキシ - - D - フルクトピラノース

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - ( シクロプロパンカルボン酸エステル ) - 1 - テオキシ - - D - フルクトピラノース

カルボン酸エチル) - 1 - デオキシ - D - フルクトピラノース、  
4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - ( 2 - ヒドロキシ安息香酸エチル ) - 1 - デオキシ - D - フルクトピラノース

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - ( シクロペンタカルボン酸エフテリ ) - 1 - 三オキシ - D - フルクトピラノース

カルボン酸エチル) - 1 - オキシ - 1 - ブロムドヒドロス、  
 4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - ( 6 - メトキシ - 2 - オクトエ酸エチル ) - 1 - ボオキシ - D - フルクトピラノース

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - ( 3 - フェニルプロピオニ酸エチル ) - 1 - ブオキシ - D - フリクトペニトース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - { 4 - ( 4 - クロロ - 2 - ニル ) - 3 - ケト - 2 - オキシカルボニル - 1 - ボキシル - 2 - フルクトヒドロース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアミド ] パリジン ( 4 - ( 2 , 3 - オキソブチル ) - 1 - ピペリジン - 4 - オキソ - 1 - ピペリジン )

セナルヒロリシソ - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - フルオロ ) } - 1 - イル ] - 5  
- ( シクロプロパンカルボン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ヒペリシン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( イソブチル酸エステル ) - 1 - デオキシ - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( 3 - メチルオキセタン - 3 - カルボン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( 3 - フェニルプロピオン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( 4 - トリフルオロメチル ) 安息香酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - ( S ) - フルオロ ) } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( シクロプロパンカルボン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - ( S ) - フルオロ ) } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( フラン - 3 - カルボン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - ( S ) - フルオロ ) } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( 2 - メトキシ安息香酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( フラン - 2 - カルボン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( 6 - メトキシ - 2 - ナフト工酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - { ( 3 - シクロペンチル ) - プロパン酸エステル } - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( 3 , 4 - ジフルオロ安息香酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( ウンデカン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( プロピオン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( ヘキサデカン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( 4 - カルボエトキシ - 3 - エトキシ安息香酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フル

クトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( ヘプタン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - { ( S ) - 2 - ( 2 - フルオロ - ビフェニル - 4 - イル ) - プロピオン酸エステル } - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - { ( R ) - 2 - ( 2 - フルオロ - ビフェニル - 4 - イル ) - プロピオン酸エステル } 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( モルホリン - 4 - 酢酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( 2 - プロピルペンタン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( アダマンタン - 2 - カルボン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( テトラヒドロフラン - 2 - カルボン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( n - ブタン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( 3 - ヒドロキシ - 2 - ヒドロキシメチル - 2 - メチルプロピオン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( n - ペンタン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( 1 - メチルシクロヘキサンカルボン酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 ( 3 , 4 , 5 - トリメトキシ安息香酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - ( S ) - フルオロ ) } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( イソブチル酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - ( S ) - フルオロ ) } - ( 4 -

メチル) - 1 - イル] - 5 - (プロピオン酸エステル) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ピペリジン - {4 - アミノアセチルピロリジン - (2 - (S) - カルボニトリル - 4 - (S) - フルオロ)} - (4 - メチル) - 1 - イル] - 5 - (n - 酪酸エステル) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ピペリジン - {4 - アミノアセチルピロリジン - (2 - (S) - カルボニトリル - 4 - (S) - フルオロ)} - (4 - メチル) - 1 - イル] - 5 - (n - ペンタン酸エステル) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ピペリジン - {4 - アミノアセチルピロリジン - (2 - (S) - カルボニトリル - 4 - (S) - フルオロ)} - (4 - メチル) - 1 - イル] - 5 - (3 - メチルオキセタン - 3 - カルボン酸エステル) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ピペリジン - {4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - (S) - カルボニトリル} - 1 - イル] - 5 - (3 - フェニルアクリル酸エステル) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ピペリジン - {4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - (S) - カルボニトリル} - 1 - イル] - 5 - (フラン - 2 - イル - メトキシイミノ酢酸エステル) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ピペリジン - {4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - (S) - カルボニトリル} - 1 - イル] - 5 - ({5 - [1 , 2 ] - ジチオラン - 3 - イル} ペンタン酸エステル) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ピペリジン - {4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - (S) - カルボニトリル} - 1 - イル] - 5 - (ピリジン - 3 - カルボン酸エステル) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ピペリジン - {4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - (S) - カルボニトリル} - (4 - メチル) - 1 - イル] - 5 - (フラン - 2 - イル - メトキシイミノ酢酸エステル) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ピペリジン - {4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - (S) - カルボニトリル} - (4 - メチル) - 1 - イル] - 5 - (5 - [1 , 2 ] - ジチオラン - 3 - イルペンタン酸エステル) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ピペリジン - {4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - (S) - カルボニトリル} - (4 - メチル) - 1 - イル] - 5 - {2 - [4 - (4 - クロロ - ベンゾイル) - フェノキシ] - 2 - メチル - プロピオン酸エステル} - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ピペリジン - {4 - アミノアセチルピロリジン - (2 - (S) - カルボニトリル - 4 - (S) - フルオロ)} - (4 - メチル) - 1 - イル] - 5 - ({5 - [1 , 2 ] - ジチオラン - 3 - イル} ペンタン酸エステル) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ピペリジン - {4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - (S) - カルボニトリル - 4 - (S) - フルオロ} - (4 - メチル) - 1 - イル] - 5 - (ピリジン - 3 - カルボン酸エステル) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、

4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ピペリジン - {4 - アミノアセチルピロリジン - (2 - (S) - カルボニトリル - 4 - (S) - フルオロ) - (4 - メチル) - 1 - イル} - 5 - {-2 - [4 - (4 - クロロ - ベンゾイル) - フェノキシ] -

2 - メチル - プロピオン酸エステル} - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - ( 2 - ヒドロキシ安息香酸エステル) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - { 2 - ( R ) - アミノ - 3 - メチル酪酸エステル } - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - { ( 2 - ( S ) - アミノ - 3 - メチル酪酸エステル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 4 , 5 - { ( 2 - ( S ) - アミノ - 3 - メチル酪酸 ) ジエステル } - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 4 - 酢酸 - 5 - イソ酪酸ジエステル - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 4 , 5 - イソ酪酸ジエステル - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 4 , 5 - O - カーボネート - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 4 , 5 - O - カーボネート - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - ( S ) - フルオロ ) } - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 4 , 5 - O - カーボネート - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 4 , 5 - O - カーボネート - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - ( S ) - フルオロ ) } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - N , N - ジメチルカルバモイル - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 5 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 4 - N , N - ジメチルカルバモイル - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 2 , 3 : 4 , 5 - ジ - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 1 - カルボニル ) - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 2 , 3 : 4 , 5 - ジ - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - フルオロ ) } - ( 1 - カルボニル ) - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 2 , 3 : 4 , 5 - ジ - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - ( 1 - カルボニル ) - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 2 , 3 : 4 , 5 - ジ - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチ

ルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - フルオロ ) } - ( 4 - メチル ) - ( 1 - カルボニル ) - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 2 , 3 : 4 , 5 - ジ - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - フルオロ ) } - ( 1 - スルホニル ) - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 2 , 3 : 4 , 5 - ジ - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 4 - メチル ) - ( 1 - スルホニル ) - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 2 , 3 : 4 , 5 - ジ - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - ( S ) - フルオロ } - ( 1 - スルホニル ) - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 4 , 5 - ジヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - フルオロ } - ( 4 - メチル ) - ( 1 - スルホニル ) - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 4 , 5 - ジヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - フルオロ ) } - ( 4 - メチル ) - ( 1 - スルホニル ) - 1 - イル ] - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 4 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル ) } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - O - ( N , N - ジメチルアミノカルボニルメチル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 5 - ヒドロキシ - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル ) } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 4 - O - ( N , N - ジメチルアミノカルボニルメチル ) - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 1 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル ) } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 4 , 5 - ジメトキシ - 1 - デオキシ - - D - フルクトピラノース、  
 2 - { 4 - [ 2 - ( 2 - ( S ) - シアノピロリジン - 1 - イル ) - 2 - オキソ - エチルアミノ ] - 4 - メチル - ピペリジン - 1 - イル } - 2 - オキソ - N - ( 2 , 2 , 7 , 7 - テトラメチル - テトラ - ヒドロ - ビス [ 1 , 3 ] ジオキソロ [ 4 , 5 - b ; 4 ' , 5 ' d ] - ピラン - 3 a - イルメチル ) - アセトアミド、  
 2 - { 4 - [ 2 - ( 2 - ( S ) - シアノピロリジン - 1 - イル ) - 2 - オキソ - エチルアミノ ] - 4 - メチル - ピペリジン - 1 - イル } - N - メチル - 2 - オキソ - N - ( 2 , 2 , 7 , 7 - テトラメチル - テトラヒドロ - ビス [ 1 , 3 ] ジオキソロ [ 4 , 5 - b ; 4 ' , 5 ' - d ] ピラン - 3 a - イルメチル ) - アセトアミド、  
 2 - { 4 - [ 2 - ( 2 - ( S ) - シアノピロリジン - 1 - イル ) - 2 - オキソ - エチルアミノ ] - 4 - メチル - ピペリジン - 1 - イル } N - シクロプロピル - 2 - オキソ N - ( 2 , 2 , 7 , 7 - テトラメチルテトラヒドロビス [ 1 , 3 ] ジオキソロ - [ 4 , 5 - b ; 4 ' , 5 ' - d ] ピラン - 3 a - イルメチル ) - アセトアミド、  
 2 - { 4 - [ 2 - ( 2 - ( S ) - シアノピロリジン - 1 - イル ) - 2 - オキソ - エチルアミノ ] - 4 - メチル - ピペリジン - 1 - イル } - N - ( 6 , 7 - ジヒドロキシ - 2 , 2 - ジメチル - テトラヒドロ - [ 1 , 3 ] - ジオキソロ [ 4 , 5 - b ] ピラン - 3 a - イルメチル ) - 2 - オキソ - アセトアミド、  
 2 - { 4 - [ 2 - ( 2 - ( S ) - シアノピロリジン - 1 - イル ) - 2 - オキソ - エチルアミノ ] - 4 - メチル - ピペリジン - 1 - イル } - N - ( 6 , 7 - ジヒドロキシ - 2 , 2 - ジメチル - テトラヒドロ - [ 1 , 3 ] ジオキソロ [ 4 , 5 - b ] ピラン - 3 a - イルメチル ) - N - メチル - 2 - オキソ - アセトアミド、  
 2 - { 4 - [ 2 - ( 2 - ( S ) - シアノピロリジン - 1 - イル ) - 2 - オキソ - エチルアミノ ] - 4 - メチル - ピペリジン - 1 - イル } - N - シクロプロピル - N - ( 6 , 7 - ジ

ヒドロキシ - 2 , 2 - ジメチルテトラヒドロ - [ 1 , 3 ] - ジオキソロ [ 4 , 5 - b ] ピラン - 3 a - イルメチル ) - 2 - オキソ - アセトアミド、

1 , 2 : 3 , 4 - ジ - O - イソプロピリデン - 6 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 6 - デオキシ - D - ガラクトピラノース、

1 , 2 : 3 , 4 - ジ - O - イソプロピリデン - 6 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - ( S ) - フルオロ ) } - 1 - イル ] - 6 - デオキシ - D - ガラクトピラノース、

1 , 2 : 3 , 4 - ジイソプロピリデン - 6 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 6 - デオキシ - D - ガラクトピラノース、

1 , 2 : 3 , 4 - ジ - O - イソプロピリデン - 6 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - ( S ) - フルオロ ) } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 6 - デオキシ - D - ガラクトピラノース、

1 , 2 : 3 , 4 - ジ - O - イソプロピリデン - 6 - [ ピペリジン - [ 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 1 - カルボニル ) - 1 - イル ] - 6 - デオキシ - D - ガラクトピラノース、

1 , 2 : 3 , 4 - ジ - O - イソプロピリデン - 6 - [ [ ピペリジン - 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル ] ( 4 - メチル ) - ( 1 - スルホニル ) - 1 - イル ] - 6 - デオキシ - D - ガラクトピラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - メチル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - エチル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - イソプロピル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - エトキシエチル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - メトキシエチル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - シクロペンチル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - ベンジル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - メチル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - エチル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - イソプロピル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - エトキシエチル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - トリフルオロエチル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - メチル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - ( S ) - フルオロ ) } - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - エチル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - ( S ) - フルオロ ) } - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - イソプロピル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - ( S ) - フルオロ ) } - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - メチル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - ( S ) - フルオロ ) } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - エチル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - ( S ) - フルオロ ) } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - イソプロピル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - ( 2 - ( S ) - カルボニトリル - 4 - ( S ) - フルオロ ) } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - メチル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - ( 1 - カルボニル ) - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 , 3 - O - イソプロピリデン - - 1 - O - メチル - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 4 - メチル - ( 1 - スルホニル ) - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - D - リボフラノース、

2 - { 4 - [ 2 - ( 2 - ( S ) - シアノピロリジン - 1 - イル ) - 2 - オキソ - エチルアミノ ] - 4 - メチルピペリジン - 1 - イル } - N - ( 6 - メトキシ - 2 , 2 - ジメチルテトラヒドロフロ [ 3 , 4 - d ] [ 1 , 3 ] ジオキソール - 4 - イルメチル ) - 2 - オキソアセトアミド、

1 , 2 - O - イソプロピリデン - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - - D - キシロフラノース、

1 , 2 - O - イソプロピリデン - 5 - [ 4 - メチルピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - - D - キシロフラノース、

1 , 2 - O - イソプロピリデン - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - 1 - イル ] - 3 - ( イソブチル酸エステル ) - 5 - デオキシ - - D - キシロフラノース、

1 , 2 - O - イソプロピリデン - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 3 - ( イソブチル酸エステル ) - 5 - デオキシ - - D - キシロフラノース、

1 , 2 - O - イソプロピリデン - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 3 - ( イソブチル酸エステル ) - 5 - デオキシ - - D - キシロフラノース、

1 , 2 - O - イソプロピリデン - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 3 - ( イソブチル酸エステル ) - 5 - デオキシ - - D - キシロフラノース、





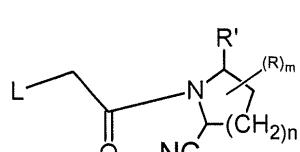
- 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 3 - O - ( ピロリジン - 1 - カルボニルメチル ) - - D - 5 - デオキシ - - D - キシロフラノース、  
 1 , 2 - O - イソプロピリデン - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 3 - ( シクロプロピルアミノカルボニルメチル ) - 5 - デオキシ - - D - キシロフラノース、  
 1 , 2 - O - イソプロピリデン - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 3 - ( アミノメチルカルボニルメチル ) - 5 - デオキシ - - D - キシロフラノース、  
 1 , 2 - O - イソプロピリデン - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 3 - O - メチル - 5 - デオキシ - - D - キシロフラノース、  
 1 , 2 - O - イソプロピリデン - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 3 - O - ベンジ - 5 - デオキシ - - D - キシロフラノース、  
 2 - { 4 - [ 2 - ( 2 - ( S ) - シアノピロリジン - 1 - イル ) - 2 - オキソ - エチルアミノ ] - 4 - メチルピペリジン - 1 - イル } - N - ( 6 - ヒドロキシ - 2 , 2 - ジメチルテトラヒドロフロ [ 2 , 3 - d ] [ 1 , 3 ] ジオキソール - 5 - イルメチル ) - 2 - オキソアセトアミド、  
 1 , 2 - O - イソプロピリデン - 5 - [ ピペリジン - { 4 - N - ( アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル ) - N - ( エトキシカルボニル ) } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - - D - キシロフラノース、  
 1 , 2 - O - イソプロピリデン - 5 - [ ピペリジン - { 4 - N - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - N ' - メトキシカルボニル ] } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - - D - キシロフラノース、  
 1 , 2 - O - イソプロピリデン - 5 - [ ピペリジン - { 4 - N - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル - N ' - ベンジルオキシカルボニル } - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - - D - キシロフラノース、  
 1 , 2 - O - イソプロピリデン - 5 - [ ピペリジン - { 4 - N - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - N - ペンチルオキシカルボニル ] - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - - D - キシロフラノース、  
 1 , 2 - O - イソプロピリデン - 5 - [ ピペリジン - { 4 - N - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } - N - フェニルオキシカルボニル ] - ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - - D - キシロフラノース、  
 1 , 2 - O - イソプロピリデン - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 5 - デオキシ - - D - リボフラノース、  
 1 , 2 - O - イソプロピリデン - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 3 - ( メトキシカルボニル ) - 5 - デオキシ - - D - リボフラノース、  
 1 , 2 - O - イソプロピリデン - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イル ] - 3 , 5 - ジデオキシ - - L - アラビノース、  
 2 ( R ) , 3 ( R ) - 2 , 3 - O - イソプロピリデン - 5 - [ ピペリジン - { 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル } ( 4 - メチル ) - 1 - イルメチル ] - 2 , 3 - ジヒドロフラン、  
 1 , 2 - O - イソプロピリデン - 3 - [ ピペリジン - { ( 4 - アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル ) - ( 1 - カルボニル - 4 - メチル ) } - 1 - イル ] - - D - キシロフラノース、  
 1 , 2 - O - イソプロピリデン - 3 - [ ピペリジン - { 4 - ( アミノアセチルピロリジン - 2 - ( S ) - カルボニトリル ) - ( 1 - カルボニル - 4 - メチル ) } - 1 - イル ] -

5 - メチル - 5 - デオキシ - - D - キシロフラノース、  
 4 - [ 2 - ( 2 - シアノ - ピロリジン - 1 - イル ) - 2 - オキソ - エチルアミノ ] - シクロヘキサンカルボン酸 ( 2 , 2 , 7 , 7 - テトラメチル - テトラヒドロ - ビス [ 1 , 3 ] ジオキソロ [ 4 , 5 - b ; 4 ' , 5 ' - d ] ピラン - 3 a - イルメチル ) - アミド、  
 4 - [ 2 - ( 2 - シアノ - ピロリジン - 1 - イル ) - 2 - オキソ - エチルアミノ ] - シクロヘキサンカルボン酸メチル - ( 2 , 2 , 7 , 7 - テトラメチル - テトラヒドロ - ビス [ 1 , 3 ] ジオキソロ [ 4 , 5 - b ; 4 ' , 5 ' - d ] ピラン - 3 a - イルメチル ) - アミド、  
 4 - [ 2 - ( 2 - シアノ - ピロリジン - 1 - イル ) - 2 - オキソ - エチルアミノ ] - シクロヘキサンカルボン酸 ( 6 - メトキシ - 2 , 2 - ジメチル - テトラヒドロ - フロ [ 3 , 4 - d ] [ 1 , 3 ] ジオキソール - 4 - イルメチル ) - メチル - アミドから選ばれる請求項 1 に記載の化合物ならびにその互変異性体、位置異性体、立体異性体、溶媒和物、N - オキシド、もしくは薬学的に許容される塩。

## 【請求項 10】

式 V I の化合物

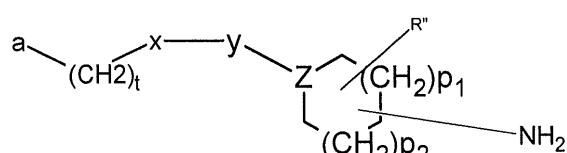
## 【化 173】



式 V I

を式 V I I の化合物

## 【化 174】



…式 V I I

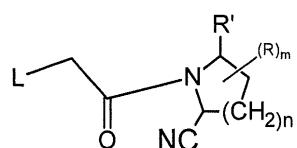
と反応させることを含む式 I の化合物の調製方法であって、

式中、置換基は化合物 1 で定義のような意味を有し、L は脱離基である、方法。

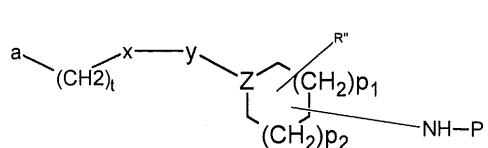
## 【請求項 11】

( a ) 式 V I の化合物を式 V I I I の化合物と反応させて、

## 【化 175】



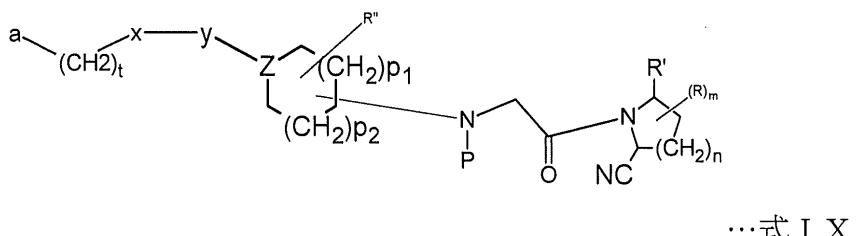
…式 V I



…式 V I I I

式 I X の化合物

## 【化176】



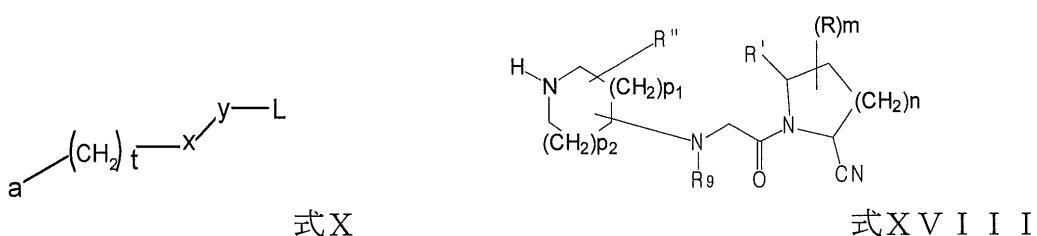
を得ること、および

(b) 式IXの化合物を脱保護することを含む、式Iの化合物の調製方法であって、  
式中、a、t、x、y、z、p<sub>1</sub>、p<sub>2</sub>、およびR''は、化合物1で定義のような意味を  
有し、Pは窒素保護基である、方法。

## 【請求項12】

(a) 式Xの化合物を式XVIIIの化合物と反応させることを含む式Iの化合物の調製  
方法であって、

## 【化177】



式中、置換基は、化合物1で定義のような意味を有し、Lは脱離基である、方法。

## 【請求項13】

請求項1に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩と薬学的に許容される担体または希釈剤とを含む医薬組成物。

## 【請求項14】

DPP-IVが関連する疾病的治療または予防方法であって、予防または治療の必要のある患者に、治療上有効な量の請求項1に記載の化合物を投与することを含む方法。

## 【請求項15】

前記DPP-IVが関連する疾患が、高血糖、糖尿病、低耐糖能、インスリン耐性、肥満、脂質疾患、異脂肪血症、高脂血症、高トリグリセリド血症、高コレステロール血症、低HDL値、高LDL値、アテローム性動脈硬化症およびその後遺症、血管再狭窄、過敏性腸症候群、クローン病および潰瘍性大腸炎を含む炎症性腸疾患、膵臓炎、腹部肥満、神経変性疾患、網膜症、ニューロパチー、ネフロパチー、X症候群、卵巣のアンドロゲン過剰症（多嚢胞性卵巣症候群）、皮膚または粘膜障害、乾癬、腸の痛み、便秘、自己免疫障害、脳脊髄炎、補体媒介性疾患、糸球体腎炎、リポジストロフィー、組織損傷、心身症、抑うつ障害、精神神経疾患、不安、抑うつ症、不眠症、統合失調症、てんかん、けいれん、慢性疼痛、HIV感染、アレルギー、炎症、関節炎、移植拒絶反応、高血圧、うっ血性心不全、腫瘍、ストレス誘導流産、サイトカイン媒介マウス流産からなる群から選ばれる、請求項14に記載の方法。

## 【請求項16】

(a) 別のジペプチジルペプチダーゼIV阻害剤、  
(b) PPAR作動薬、PPAR/二重作動薬、PPAR作動薬、ビグアニド  
、およびタンパク質チロシンホスファターゼ-IB阻害剤からなる群から選ばれるインスリン増感剤、  
(c) インスリンまたはインスリン模倣薬、  
(d) スルホニル尿素または他のインスリン分泌促進薬、

- (e) - グルコシダーゼ拮抗薬、
- (f) グルカゴン受容体拮抗薬、
- (g) GLP-1、GLP-1模倣薬、またはGLP-1受容体作動薬、
- (h) SGLT2阻害剤、
- (i) GIP、GIP模倣薬、またはGIP受容体作動薬、
- (j) PACAP、PACAP模倣薬、またはPACAP受容体作動薬、
- (k) (i) HMG-CoA還元酵素阻害剤、(ii) 封鎖剤、(iii) ニコチニルアルコール、ニコチン酸またはその塩、(iv) PPAR作動薬、(v) PPAR / 二重作動薬、(vi) コレステロール吸収阻害剤、(vii) アシリルCoA : コレステロールアシリルトランスフェラーゼ阻害剤、および(viii) 抗酸化剤などのコレステロール低下薬、
- (l) PPAR作動薬、
- (m) 抗肥満化合物、
- (n) 回腸胆汁酸運搬阻害剤、
- (o) 抗炎症剤、ならびに
- (p) 降圧薬からなる群から選ばれる1種以上のさらなる活性成分をさらに含む、請求項13に記載の医薬組成物。