

【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

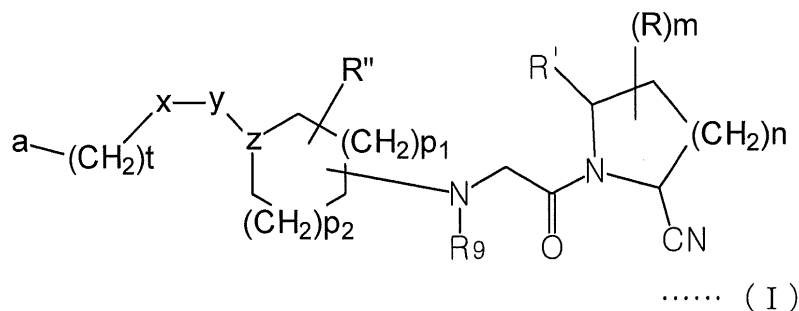
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iで表される化合物、

【化 1 7 0】

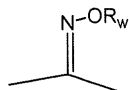


またはその互変異性体、位置異性体、立体異性体、溶媒和物、N - オキシド、もしくは薬学的に許容される塩。

(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 -、- C O -、- S O₂ -、アミノアルキル、または

【化 1 7 1】



から選ばれる 1 種であり、式中、R_w 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 -、- S O -、- S O₂ -、C O N R₁₀、N R₁₀ C O、および - N R_d - から選ばれる 1 種であるか、あるいは x および y は一緒になって化学結合を表し、ここで R₁₀ 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_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、アルコキシカルボニル、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あって C₃₋₇ 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 - C H -、- 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、

R₉ は、水素、メチル、C O O R₁₁ から選ばれ、ここで R₁₁ 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、

p₁ は 0、1、または 2 であり、p₂ は、0、1、または 2 であるが、但し p₁ と p₂ 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 - C O - である場合、x は N R_d 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員単環式、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単糖、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。

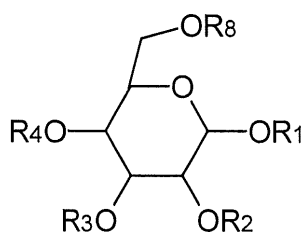
【請求項6】

前記単糖誘導体が、デオキシ糖、不飽和単糖、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。

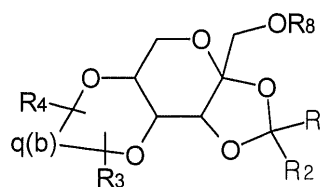
【請求項7】

前記「単糖」が、式I I、I I I、I V、V、V A

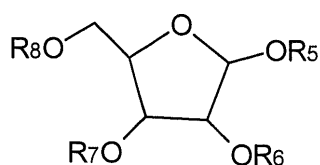
【化172】



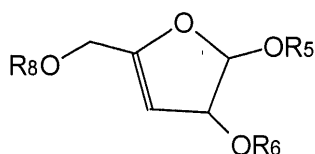
式 I I



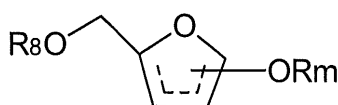
式 I I I



式 I V



式 V



式 V A

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、R₃およびR₄は2つの酸素原子に結合し、q が1である場合、R₃およびR₄はbに結合し、

b は、-C(R₃, R₄)-、-C(R₃R₄)-CO-、-C(R₃R₄)-CH₂-、-CH₂-C(R₃R₄)-CH₂- から選ばれ、

R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆、R₇、およびR₈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、ピアロイル、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フィニル、シクロアルキルアルキルスルフィニル、アルコキシスルフィニル、アリールスルホニル、ヘテロシクロアルキルスルホニル、ヘテロアリールスルホニル、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、 $C_{5-7}1,3$ -ジオキサラン環または C_{4-7} スピロシクロアルキルもしくは $C_4 \sim C_7$ スピロヘテロシクロアルキル環を有する $C_{5-7}1,3$ -ジオキサ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、 $1,3$ -ジオキサラン環またはスピロシクロアルキル($C_4 \sim C_6$)で置換された $1,3$ -ジオキサ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、 $1,3$ -ジオキサラン環またはスピロシクロアルキル($C_4 \sim C_6$)で置換された $1,3$ -ジオキサ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単糖である、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

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 } - 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 - (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 } - 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 } - 1 - イル] - 5 - (シクロペンタン
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 } - 1 - イル] - 5 - (6 - メトキシ -
2 - ナフトエ酸エステル) - 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 } - 1 - イル] - 5 - { 4 - (4 - クロ
ロフェニル) 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 - 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 - [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 -
(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 - ナフトエ酸エステル) - 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

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 - 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 - (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 - 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 - 4 - (S) - フルオロ } (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 } - 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

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 - (1, 2 - ジ
チオラン - 3 - イルペンタン酸エステル)] - 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 - 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、

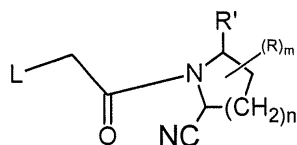
4 - [2 - (2 - シアノ - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エチルアミノ] - シクロヘキサンカルボン酸メチル - (2 , 2 , 7 , 7 - テトラメチル - テトラヒドロ - ビス [1 , 3] ジオキソロ [4 , 5 - b ; 4 ' , 5 ' - d] ピラン - 3 a - イルメチル) - アミド、

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

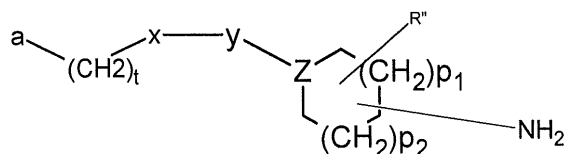
【化 173】



式 V I

を式 V I I の化合物

【化 174】



…式 V I I

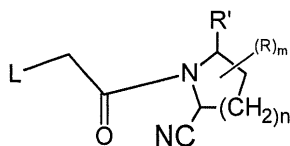
と反応させることを含む式 I の化合物の調製方法であって、

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。

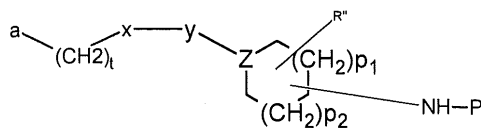
【請求項 11】

(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】



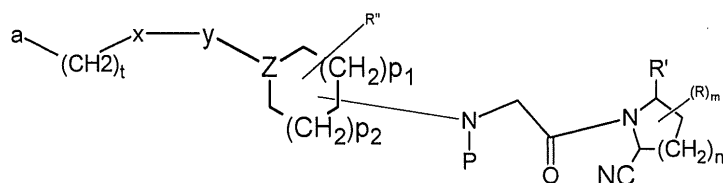
…式 V I



…式 V I I I

式 I X の化合物

【化 1 7 6】



…式 I X

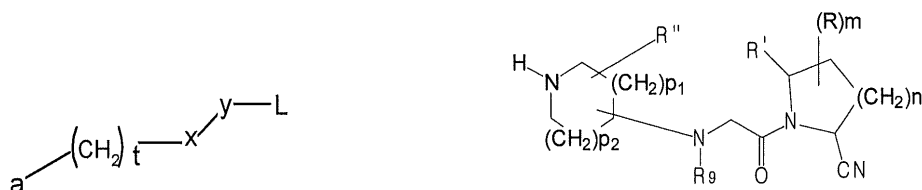
を得ること、および

(b) 式 I X 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、p₁、p₂、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 1 2】

(a) 式 X の化合物を式 X V I I I 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 1 7 7】



式 X

式 X V I I I

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 1 3】

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 1 4】

D P P - I V が関連する疾病の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 1 5】

前記 D P P - I V が関連する疾病が、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 H D L 値、高 L D L 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、リボジストロフィー、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、H I V 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 1 4 に記載の方法。

【請求項 1 6】

- (a) 別のジペプチジルペプチダーゼ I V 阻害剤、
- (b) P P A R 作動薬、P P A R / 二重作動薬、P P A R 作動薬、ピグアニド、およびタンパク質チロシンホスファターゼ - I B 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) G L P - 1、G L P - 1 模倣薬、または G L P - 1 受容体作動薬、
- (h) S G L T 2 阻害剤、
- (i) G I P、G I P 模倣薬、または G I P 受容体作動薬、
- (j) P A C A P、P A C A P 模倣薬、または P A C A P 受容体作動薬、
- (k) (i) H M G - C o A 還元酵素阻害剤、(i i) 封鎖剤、(i i i) ニコチンアルコール、ニコチン酸またはその塩、(i v) P P A R 作動薬、(v) P P A R / 二重作動薬、(v i) コレステロール吸収阻害剤、(v i i) アシル C o A : コレステロールアシルトランスフェラーゼ阻害剤、および(v i i i) 抗酸化剤などのコレステロール低下薬、
- (l) P P A R 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 1 3 に記載の医薬組成物。