

【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26年9月25日(2014.9.25)

【公表番号】特表2013-541503(P2013-541503A)

【公表日】平成25年11月14日(2013.11.14)

【年通号数】公開・登録公報2013-062

【出願番号】特願2013-523380(P2013-523380)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/7004 (2006.01)

A 6 1 K 31/7024 (2006.01)

A 6 1 K 31/706 (2006.01)

A 6 1 K 31/7048 (2006.01)

A 6 1 K 39/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/7004

A 6 1 K 31/7024

A 6 1 K 31/706

A 6 1 K 31/7048

A 6 1 K 39/00 H

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】平成26年8月5日(2014.8.5)

【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

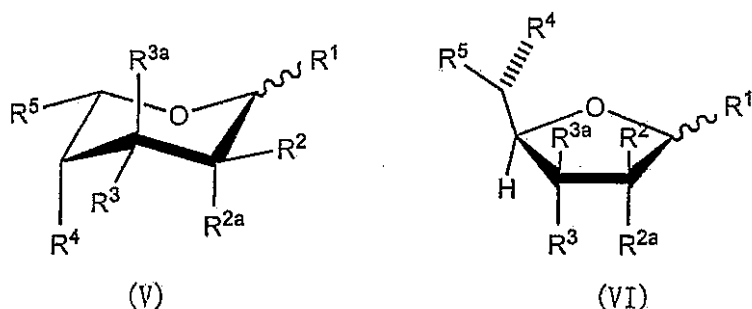
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

哺乳動物においてタンパク質フコシル化を阻害する方法において使用するための、下記式(V)または(VI)のうちの一つからなる群から選択されるフコースアナログまたはその生物学的に許容される塩もしくは溶媒和物を含む医薬組成物。

【化 1】



[式中、

式(V)または(VI)のそれぞれは または アノマーまたは相当するアルドース型であり；

R^1 、 R^2 、 R^{2a} 、 R^3 、 R^{3a} および R^4 のそれぞれは独立に、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_1\text{-C}_{10}$ アルキル、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_2\text{-C}_{10}$ アルケニル、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_2\text{-C}_{10}$ アルキニル、 $-\text{OC}(\text{O})$ アリール、 $-\text{OC}(\text{O})$ 複素環、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_1\text{-C}_{10}$ アルキレン(アリール)、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_2\text{-C}_{10}$ アルケニレン(アリール)、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_2\text{-C}_{10}$ アルキニレン(アリール)、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_1\text{-C}_{10}$ アルキレン(複素環)、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_2\text{-C}_{10}$ アルケニレン(複素環)、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_2\text{-C}_{10}$ アルキニレン(複素環)、 $-\text{OCH}_2\text{OC}(\text{O})$ アルキル、 $-\text{OCH}_2\text{OC}(\text{O})$ 0アルキル、 $-\text{OCH}_2\text{OC}(\text{O})$ アリール、 $-\text{OCH}_2\text{OC}(\text{O})$ 0アリール、 $-\text{OC}(\text{O})\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{O}-$ トリ- $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルキルシリル、 $-\text{OC}_1\text{-C}_{10}$ アルキルおよび小型電子吸引基からなる群から選択され、各 n は0から5から独立に選択される整数であり；

R^5 は、 $-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CHX}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{X}$ 、置換されていないかハロゲンで置換されている $-\text{CH}(\text{X}')\text{-C}_1\text{-C}_4$ アルキル、置換されていないかハロゲンで置換されている $-\text{CH}(\text{X}')\text{-C}_2\text{-C}_4$ アルケン、置換されていないかハロゲンで置換されている $-\text{CH}(\text{X}')\text{-C}_2\text{-C}_4$ アルキン、 $-\text{CH}=\text{C}(\text{R}^{10})(\text{R}^{11})$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{C}(\text{R}^{12})(\text{R}^{13})$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{14})=\text{C}=\text{C}(\text{R}^{15})(\text{R}^{16})$ 、置換されていないかメチルもしくはハロゲンで置換されている $-\text{C}_3$ 炭素環、置換されていないかメチルもしくはハロゲンで置換されている $-\text{CH}(\text{X}')\text{-C}_3$ 炭素環、置換されていないかメチルもしくはハロゲンで置換されている $-\text{CH}(\text{X}')\text{-C}_3$ 複素環、置換されていないかメチルもしくはハロゲンで置換されている $-\text{CH}(\text{X}')\text{-C}_3$ 複素環、 $-\text{CH}_2\text{N}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}_3$ およびベンジルオキシメチルからなる群から選択される構成員であるか、 R^5 は小型電子吸引基であり；

R^{10} は水素であり、または置換されていないかハロゲンで置換されている $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルキルであり；

R^{11} は置換されていないかハロゲンで置換されている $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルキルであり；

R^{12} は水素、ハロゲンまたは置換されていないかハロゲンで置換されている $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルキルであり；

R^{13} は水素または置換されていないかハロゲンで置換されている $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルキルであり；

R^{14} は水素またはメチルであり；

R^{15} および R^{16} は独立に水素、メチルおよびハロゲンから選択され；

X はハロゲンであり；

X はハロゲンまたは水素であり；

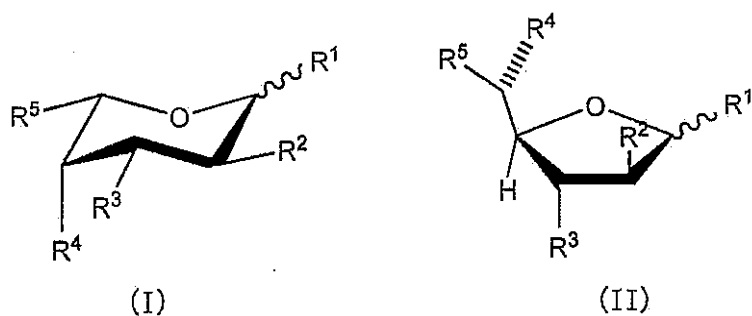
さらに、 R^1 、 R^2 、 R^{2a} 、 R^3 および R^{3a} のそれぞれは水素であっても良く；隣接する炭素原子上の2個の R^1 、 R^2 、 R^{2a} 、 R^3 および R^{3a} が一体となって、その隣接する炭素原子間に二重結合を形成していても良く；

ただし、(i) R^2 および R^{2a} がいずれも水素である場合、(ii) R^3 および R^{3a} がいずれも水素である場合、(iii) R^1 が水素である場合、(iv)前記隣接する炭素原子間に二重結合が存在する場合、または(v) R^5 がベンジルオキシメチルである場合を除き、 R^1 、 R^2 、 R^{2a} 、 R^3 、 R^{3a} 、 R^4 および R^5 のうちの少なくとも一つが小型電子吸引基であるか、 R^5 がハロゲン、不飽和部位、炭素環、複素環またはアジドを含む。]

【請求項2】

前記フコースアナログが下記式(I)または(II)のうちの一つからなる群またはそれらの生物学的に許容される塩もしくは溶媒和物から選択される請求項1に記載の医薬組成物。

【化2】



[式中、

式(I)または(II)のそれぞれは、アルファもしくはベータアノマーまたは対応するアルドース形であって良く;

R^1 から R^4 のそれぞれは、 $-OH$ 、 $-OC(O)H$ 、 $-OC(O)C_1-C_{10}$ アルキル、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルケニル、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルキニル、 $-OC(O)$ アリール、 $-OC(O)$ 複素環、 $-OC(O)C_1-C_{10}$ アルキレン(アリール)、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルケニレン(アリール)、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルキニレン(アリール)、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルキレン(複素環)、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルケニレン(複素環)、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルキニレン(複素環)、 $-OCH_2OC(O)$ アルキル、 $-OCH_2OC(O)O$ アルキル、 $-OCH_2OC(O)$ アリール、 $-OCH_2OC(O)O$ アリール、 $-OC(O)CH_2O(CH_2CH_2O)_nCH_3$ 、 $-OC(O)CH_2CH_2O(CH_2CH_2O)_nCH_3$ 、 $-O$ -トリ- C_1-C_3 アルキルシリルおよび $-OC_1-C_{10}$ アルキルからなる群から独立に選択され、各 n は、0から5から独立に選択される整数であり、

R^5 は、 $-C(CH_3)_3$ 、 $-C(CH_3)_2CH_3$ 、 $-CH_2C(CH_3)_3$ 、 $-C(O)OCH_3$ 、 $-CH(OAc)CH_3$ 、 $-CN$ 、 $-CH_2CN$ 、 $-CHX_2$ (各 X は F 、 Br または Cl である)、 $-CH_2X$ (X は F 、 Br 、 Cl または I である)およびメトキシランからなる群から選択される。]

【請求項 3】

前記哺乳動物が癌を有する請求項1または2に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

前記哺乳動物が自己免疫障害を有する請求項1または2に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

癌関連抗原またはその抗原性断片を免疫原として投与する段階をさらに有する請求項3に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 のそれぞれが独立に、 $-OH$ 、 $-OC(O)H$ 、 $-OC(O)C_1-C_{10}$ アルキル、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルケニル、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルキニル、 $-OC(O)$ アリール、 $-OC(O)$ 複素環、 $-OC(O)C_1-C_{10}$ アルキレン(アリール)、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルケニレン(アリール)、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルキニレン(アリール)、 $-OC(O)C_1-C_{10}$ アルキレン(複素環)、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルケニレン(複素環)、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルキニレン(複素環)、 $-OC(O)CH_2O(CH_2CH_2O)_nCH_3$ および $-OC(O)CH_2CH_2O(CH_2CH_2O)_nCH_3$ からなる群から選択され、 R^5 が $-C(CH_3)_3$ 、 $-C(CH_3)_2CH_3$ 、 $-CH_2C(CH_3)_3$ 、 $-C(O)OCH_3$ 、 $-CH(OAc)CH_3$ 、 $-CN$ 、 $-CH_2CN$ 、 $-CH_2X$ (X は F 、 Br 、 Cl または I である。)およびメトキシランからなる群から選択される請求項1または2に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

R^1 、 R^3 および R^4 のそれぞれが独立に、 $-OH$ 、 $-OC(O)H$ 、 $-OC(O)C_1-C_{10}$ アルキル、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルケニル、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルキニル、 $-OC(O)$ アリール、 $-OC(O)$ 複素環、 $-OC(O)C_1-C_{10}$ アルキレン(アリール)、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルケニレン(アリール)、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルキニレン(アリール)、 $-OC(O)C_1-C_{10}$ アルキレン(複素環)、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルケニレン(複素環)、 $-OC(O)C_2-C_{10}$ アルキニレン(複素環)、 $-OCH_2OC(O)$ アルキル、 $-OCH_2OC(O)O$ アルキル、 $-OCH_2OC(O)O$ アリール、 $-OCH_2OC(O)O$ アリール、 $-OC(O)CH_2O(CH_2CH_2O)_nCH_3$ 、 $-OC(O)CH_2CH_2O(CH_2CH_2O)_nCH_3$ 、 $-O$ -トリ- C_1-C_3 アルキルシリルおよび $-OC_1-C_{10}$ アルキルからなる群から選択され、各 n が0から5から独立に選択される整数であり;

R^2 が F であり、 R^{2a} および R^{3a} がそれぞれ H であり、 R^5 が $-CH_3$ である請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 のそれぞれが独立に $-OH$ 、 $-OC(O)H$ および $-OC(O)C_1-C_{10}$ アルキルからなる群から選択される請求項1または2に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 のそれぞれが独立に、 $-OH$ および $-OAc$ からなる群から選択される請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

R^5 が $-C(CH_3)_3$ および $-C(CH_3)_2CH_3$ からなる群から選択される請求項1または2に記載の医薬組成物。

【請求項 1 1】

R^5 が $-C \text{ CH}$ である請求項10に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2】

R^5 が $-\text{CH}_2\text{X}$ であり、 X が F 、 Br 、 Cl または I である請求項1または2に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3】

R^5 が $-\text{CHX}_2$ であり、 X が F である請求項1または2に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

R^5 が $-\text{CHF}_2$ であり、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 のそれぞれが $-\text{OAc}$ である請求項1または2に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

R^5 が $-\text{CH}_2\text{Br}$ であり、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 のそれぞれが $-\text{OAc}$ である請求項1または2に記載の医薬組成物。

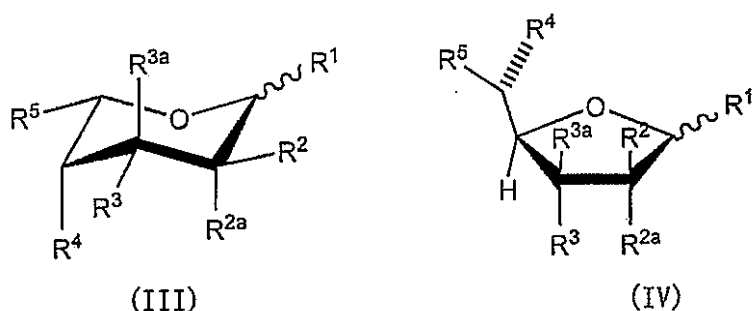
【請求項 1 6】

R^5 が $-C \text{ CH}$ であり、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 のそれぞれが $-\text{OAc}$ である請求項1または2に記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

前記フコースアナログが下記式(III)または(IV)のうちの一つまたはその生物学的に許容される塩もしくは溶媒和物からなる群から選択される請求項1に記載の医薬組成物。

【化 3】



[式中、

式(III)または(IV)のそれぞれは もしくは アノマーまたは相当するアルドース型であることができ；

R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 のそれぞれは独立に、フルオロ、クロロ、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_1-\text{C}_{10}$ アルキル、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_2-\text{C}_{10}$ アルケニル、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_2-\text{C}_{10}$ アルキニル、 $-\text{OC}(\text{O})$ アリール、 $-\text{OC}(\text{O})$ 複素環、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_1-\text{C}_{10}$ アルキレン(アリール)、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_2-\text{C}_{10}$ アルケニレン(アリール)、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_2-\text{C}_{10}$ アルキニレン(アリール)、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_1-\text{C}_{10}$ アルキレン(複素環)、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_2-\text{C}_{10}$ アルケニレン(複素環)、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_2-\text{C}_{10}$ アルキニレン(複素環)、 $-\text{OCH}_2\text{OC}(\text{O})$ アルキル、 $-\text{OCH}_2\text{OC}(\text{O})\text{O}$ アルキル、 $-\text{OCH}_2\text{OC}(\text{O})$ アリール、 $-\text{OCH}_2\text{OC}(\text{O})\text{O}$ アリール、 $-\text{OC}(\text{O})\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{O}-$ トリ- C_1-C_3 アルキルシリルおよび $-\text{OC}_1-\text{C}_{10}$ アルキルからなる群から選択され、各 n は0から5から独立に選択される整数であり；

R^{2a} および R^{3a} のそれぞれは独立に、 H 、 F および Cl からなる群から選択され；

R^5 は、 $-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CHF}_2$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $-C \text{ CH}$ 、 $-C \text{ CCH}_3$ 、 $-\text{CH}_2\text{C} \text{ CH}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$ 、 $-\text{CH}(\text{OAc})\text{CH}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CN}$ 、 $-\text{CH}_2\text{X}$ (X は F 、 Br 、 Cl または I である。)およびメトキシランからなる群から選択される。]

【請求項 1 8】

R^1 が F である請求項17に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

R^2 が F である請求項17に記載の医薬組成物。

【請求項 2 0】

R^3 が F である請求項17に記載の医薬組成物。

【請求項 2 1】

R^2 および R^{2a} がそれぞれFである請求項17に記載の医薬組成物。

【請求項22】

R^1 および R^2 がそれぞれFである請求項17に記載の医薬組成物。

【請求項23】

R^{2a} および R^{3a} がそれぞれ水素である請求項17に記載の医薬組成物。

【請求項24】

R^5 が-C₁H₅である請求項17に記載の医薬組成物。

【請求項25】

R^5 が-CH₂Xであり、XがF、Br、ClまたはIである請求項17に記載の医薬組成物。

【請求項26】

R^5 が-CHX₂であり、XがFである請求項17に記載の医薬組成物。

【請求項27】

R^5 が-CHF₂であり、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 のそれぞれが-OAcである請求項17に記載の医薬組成物。

【請求項28】

R^5 が-CH₂Brであり、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 のそれぞれが-OAcである請求項17に記載の医薬組成物。

【請求項29】

R^5 が-C₁H₅であり、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 のそれぞれが-OAcである請求項17に記載の医薬組成物。

【請求項30】

前記フコースアナログが表1、2および3の化合物から選択される請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項31】

R^1 、 R^3 および R^4 のそれぞれが独立に-OHおよび-OC(O)C₁-C₁₀アルキルから選択され、 R^2 がFであり、 R^5 が-CH₃である請求項17に記載の医薬組成物。

【請求項32】

R^1 、 R^3 および R^4 のそれぞれが独立に-OHおよび-OC(O)C₁-C₁₀アルキルから選択され、 R^2 がFであり、 R^{2a} および R^{3a} がそれぞれHであり、 R^5 が-CH₃である請求項17に記載の医薬組成物。

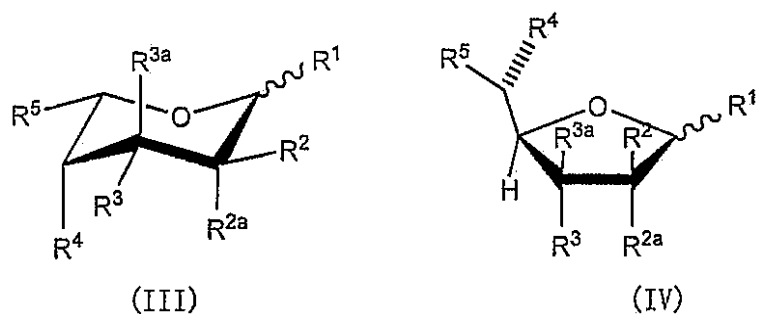
【請求項33】

R^1 、 R^3 および R^4 のそれぞれが独立に-OHおよび-OAcから選択され、 R^2 がFであり、 R^5 が-C₁H₅である請求項17に記載の医薬組成物。

【請求項34】

哺乳動物における癌の治療において使用するための、下記式(III)または(IV)のうちの一つからなる群から選択されるフコースアナログまたはその生物学的に許容される塩もしくは溶媒和物を含む医薬組成物、

【化4】



[式中、

式(III)または(IV)のそれぞれは もしくは アノマーまたは相当するアルドース型であることができ、

R^1 、 R^2 、 R^3 、および R^4 のそれぞれは独立に、フルオロ、クロロ、-OH、-OC(O)H、-OC(O) C_1 - C_{10} アルキル、-OC(O) C_2 - C_{10} アルケニル、-OC(O) C_2 - C_{10} アルキニル、-OC(O)アリール、-OC(O)複素環、-OC(O) C_1 - C_{10} アルキレン(アリール)、-OC(O) C_2 - C_{10} アルケニレン(アリール)、-OC(O) C_2 - C_{10} アルキニレン(アリール)、-OC(O) C_1 - C_{10} アルキレン(複素環)、-OC(O) C_2 - C_{10} アルケニレン(複素環)、-OC(O) C_2 - C_{10} アルキニレン(複素環)、-OCH₂OC(O)アルキル、-OCH₂OC(O)Oアルキル、-OCH₂OC(O)アリール、-OCH₂OC(O)Oアリール、-OC(O)CH₂O(CH₂CH₂O)_nCH₃、-OC(O)CH₂CH₂O(CH₂CH₂O)_nCH₃、-O-トリ- C_1 - C_3 アルキルシリルおよび-OC₁- C_{10} アルキルからなる群から選択され、各nは0から5から独立に選択される整数であり；

R^{2a} および R^{3a} のそれぞれは独立に、H、FおよびClからなる群から選択され；

R^5 は、-CH₃、-CHF₂、-CH=C=CH₂、-C(CH₃)₃、-C(CH₃)₂CH₃、-CH₂C(CH₃)₂CH₃、-C(O)OCH₃、-CH(OAc)CH₃、-CN、-CH₂CN、-CH₂X(XはF、Br、ClまたはIである。)およびメトキシランからなる群から選択される。]

【請求項 35】

R^1 、 R^3 および R^4 のそれぞれが独立に、-OH、-OC(O)H、-OC(O) C_1 - C_{10} アルキル、-OC(O) C_2 - C_{10} アルケニル、-OC(O) C_2 - C_{10} アルキニル、-OC(O)アリール、-OC(O)複素環、-OC(O) C_1 - C_{10} アルキレン(アリール)、-OC(O) C_2 - C_{10} アルケニレン(アリール)、-OC(O) C_2 - C_{10} アルキニレン(アリール)、-OC(O) C_1 - C_{10} アルキレン(複素環)、-OC(O) C_2 - C_{10} アルケニレン(複素環)、-OC(O) C_2 - C_{10} アルキニレン(複素環)、-OCH₂OC(O)アルキル、-OCH₂OC(O)Oアルキル、-OCH₂OC(O)アリール、-OCH₂OC(O)Oアリール、-OC(O)CH₂O(CH₂CH₂O)_nCH₃、-OC(O)CH₂CH₂O(CH₂CH₂O)_nCH₃、-O-トリ- C_1 - C_3 アルキルシリルおよび-OC₁- C_{10} アルキルからなる群から選択され、各nが0から5から独立に選択される整数であり；

R^2 がFであり、 R^{2a} および R^{3a} がそれぞれHであり、 R^5 が-CH₃である請求項34に記載の医薬組成物。

【請求項 36】

R^1 、 R^3 および R^4 のそれぞれが独立に-OHおよび-OC(O) C_1 - C_{10} アルキルから選択され、 R^2 がFであり、 R^5 が-CH₃である請求項34に記載の医薬組成物。

【請求項 37】

R^1 、 R^3 および R^4 のそれぞれが独立に-OHおよび-OC(O) C_1 - C_{10} アルキルから選択され、 R^2 がFであり、 R^{2a} および R^{3a} がそれぞれHであり、 R^5 が-CH₃である請求項34に記載の医薬組成物。

【請求項 38】

R^1 、 R^3 および R^4 のそれぞれが独立に-OHおよび-OAcから選択され、 R^2 がFであり、 R^5 が-C(CH₃)₃である請求項34に記載の医薬組成物。

【請求項 39】

粉剤の形態である、請求項1～38のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 40】

液体の形態である、請求項1～38のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 41】

前記組成物がヒトへの投与用に製剤される、請求項1～38のいずれか1項に記載の医薬組成物。

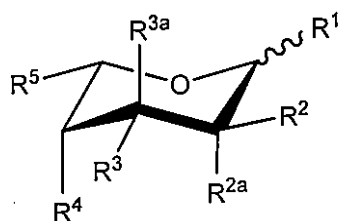
【請求項 42】

前記組成物がヒトへの経口投与用に製剤される、請求項1～38のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 43】

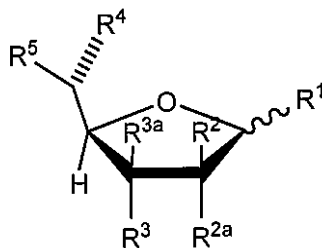
哺乳動物におけるタンパク質フコシル化を低下させるための医薬の製造におけるフコースアナログの使用であって、前記フコースアナログが、下記式(III)もしくは(IV)のうちの一つまたはその生物学的に許容される塩もしくは溶媒和物からなる群から選択され、

【化 5】



(III)

[式中、



(IV)

式(III)または(IV)のそれぞれは もしくは アノマーまたは相当するアルドース型であることができ；

R^1 、 R^3 および R^4 のそれぞれは独立に、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_1-\text{C}_{10}$ アルキル、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_2-\text{C}_{10}$ アルケニル、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_2-\text{C}_{10}$ アルキニル、 $-\text{OC}(\text{O})$ アリール、 $-\text{OC}(\text{O})$ 複素環、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_1-\text{C}_{10}$ アルキレン(アリール)、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_2-\text{C}_{10}$ アルケニレン(アリール)、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_2-\text{C}_{10}$ アルキニレン(アリール)、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_1-\text{C}_{10}$ アルキレン(複素環)、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_2-\text{C}_{10}$ アルケニレン(複素環)、 $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_2-\text{C}_{10}$ アルキニレン(複素環)、 $-\text{OCH}_2\text{OC}(\text{O})$ アルキル、 $-\text{OCH}_2\text{OC}(\text{O})\text{O}$ アルキル、 $-\text{OCH}_2\text{OC}(\text{O})$ アリール、 $-\text{OCH}_2\text{OC}(\text{O})\text{O}$ アリール、 $-\text{OC}(\text{O})\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O})_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{O}-$ トリ- C_1-C_3 アルキルシリルおよび $-\text{OC}_1-\text{C}_{10}$ アルキルからなる群から選択され、各 n が0から5から独立に選択される整数であり；

R^2 がFであり、 R^{2a} および R^{3a} がそれぞれHであり、 R^5 が $-\text{CH}_3$ である、前記使用。

【請求項 4 4】

R^1 、 R^3 および R^4 のそれぞれが独立に $-\text{OH}$ および $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_1-\text{C}_{10}$ アルキルから選択され、 R^2 がFであり、 R^5 が $-\text{CH}_3$ である請求項43に記載の使用。

【請求項 4 5】

R^1 、 R^3 および R^4 のそれぞれが独立に $-\text{OH}$ および $-\text{OC}(\text{O})\text{C}_1-\text{C}_{10}$ アルキルから選択され、 R^2 がFであり、 R^{2a} および R^{3a} がそれぞれHであり、 R^5 が $-\text{CH}_3$ である請求項43に記載の使用。

【請求項 4 6】

R^1 、 R^3 および R^4 のそれぞれが独立に $-\text{OH}$ および $-\text{OAc}$ から選択され、 R^2 がFであり、 R^5 が $-\text{CH}_3$ である請求項43に記載の使用。