

【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】令和 2 年 4 月 23 日 (2020.4.23)

【公表番号】特表 2019-508504 (P2019-508504A)

【公表日】平成 31 年 3 月 28 日 (2019.3.28)

【年通号数】公開・登録公報 2019-012

【出願番号】特願 2018-567029 (P2018-567029)

【国際特許分類】

C 07D 309/10 (2006.01)

C 07D 405/10 (2006.01)

C 07D 405/14 (2006.01)

C 07D 471/04 (2006.01)

C 07D 405/12 (2006.01)

A 61K 31/4725 (2006.01)

A 61K 31/35 (2006.01)

A 61K 31/4035 (2006.01)

A 61K 31/4709 (2006.01)

A 61K 31/4184 (2006.01)

A 61K 31/416 (2006.01)

A 61K 31/423 (2006.01)

A 61K 31/4433 (2006.01)

A 61K 31/444 (2006.01)

A 61K 31/5377 (2006.01)

A 61K 31/455 (2006.01)

A 61K 31/437 (2006.01)

A 61K 31/4192 (2006.01)

A 61K 31/4439 (2006.01)

A 61K 31/454 (2006.01)

A 61K 45/00 (2006.01)

A 61P 13/02 (2006.01)

A 61P 43/00 (2006.01)

A 61P 31/04 (2006.01)

A 61P 1/04 (2006.01)

A 61P 29/00 (2006.01)

【 F I 】

C 07D 309/10

C 07D 405/10 C S P

C 07D 405/14

C 07D 471/04 1 0 8 Q

C 07D 405/12

A 61K 31/4725

A 61K 31/35

A 61K 31/4035

A 61K 31/4709

A 61K 31/4184

A 61K 31/416

A 61K 31/423

A 61K 31/4433

A 61K 31/444

A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	31/455	
A 6 1 K	31/437	
A 6 1 K	31/4192	
A 6 1 K	31/4439	
A 6 1 K	31/454	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	13/02	1 0 5
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	29/00	

【手続補正書】

【提出日】令和2年3月10日(2020.3.10)

【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

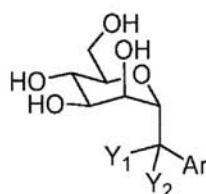
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(I)の化合物。

【化 1】



(I)

(式中、

Arは、アリール又はヘテロアリールであり、

ここで、Arに関して定義されるアリール及びヘテロアリールの各々は、W及び1つ又は2つのZ基で置換され、

ここで、Zは、低級アルキル、低級ハロアルキル、NO₂、CF₃、シクロプロピル、低級アルコキシ、ハロ、ヒドロキシル、及びアミノであり、

ここで、Zに関して定義されるアミノは、任意に1つ又は2つの低級アルキルで置換され、

Wは、アリール、ヘテロアリール、又はアジドであり、

ここで、Wに関して定義されるアリール又はヘテロアリールは、R₁₁、H、ボロン酸、ボロン酸ピナコールエステル、アルキル、OTf、ヒドロキシル、任意に1つ又は2つのアルキル又はアリール基で置換されたアミノ、アジド、アルキン、-SO₂アリール、C(O)OR₅、C(O)NR₈R₉、ハロ、OCF₃、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、CN、アルコキシ、NH₂SO₂R₆、NH₂SO₂NHR₆、NH₂COR₆、NH₂CONHR₆、及びシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、アリールオキシ、アラールキル、及びヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で置換され、それらのいずれも、任意に1つ以上のアルキル、ヒドロキシル、オキソ、CN、及びNR₈R₉で置換されてもよく、

ここで、 R_5 及び R_6 の各々は独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル及びヘテロアラルキルであり、

R_8 及び R_9 の各々は、独立して水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、及びヘテロアラルキルであり、又は R_8 及び R_9 は、一緒になってヘテロシクロアルキルを形成し、

R_{11} は、ハロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ハロアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、ヘテロアリール (heteraryl) アルキル、CN、アルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $NHSO_2R_{12}$ 、 $NHSO_2NHR_{12}$ 、 $NHCOR_{12}$ 、 $NHCONHR_{12}$ 、 $CONHR_{12}$ 、 $CONR_{12a}R_{12b}$ 、ヒドロキシ、及び OCF_3 であり、

ここで、 R_{12} 、 R_{12a} 及び R_{12b} の各々は独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル及びヘテロアラルキルから選択され、

Y_1 及び Y_2 の各々は独立して、H、ヒドロキシル、低級アルコキシ又はアミノから選択され、

ここで、 Y_1 及び Y_2 の各々に関して定義される各アミノは、任意に1つ又は2つの低級アルキル、シアノ、アジド、ニトロ、ハロアルキル、ハロ、ハロアルコキシ、及びアセチルで置換され、

但し、

前記式 (I) の化合物は、

3 - [4 - [(R) - ヒドロキシ - [(2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロピラン - 2 - イル] メチル] - 3 - メチル - フェニル] - N - メチル - ベンズアミド、

3 - [4 - [(S) - ヒドロキシ - [2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロピラン - 2 - イル] メチル] - 3 - メチル - フェニル] - N - メチル - ベンズアミド、

N - メチル - 3 - [3 - メチル - 4 - [[(2R, 3S, 4R, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシ - メチル) テトラヒドロ - ピラン - 2 - イル] メチル] フェニル] ベンズアミド、

4' - ((R) - ヒドロキシ ((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) メチル) - N - メチルピフェニル - 3 - カルボキサミド、

N - メチル - 4' - (((2R, 3S, 4R, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) メチル) ピフェニル - 3 - カルボキサミド、

4' - ((S) - ヒドロキシ ((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) メチル) - N - メチルピフェニル - 3 - カルボキサミド、

N, 3' - ジメチル - 4' - (((2R, 3S, 4R, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) メチル) ピフェニル - 3 - カルボキサミド、

N - メチル - 3' - (トリフルオロメチル) - 4' - (((2R, 3S, 4R, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) メチル) ピフェニル - 3 - カルボキサミド、

3' - クロロ - N - メチル - 4' - (((2R, 3S, 4R, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) メチル) ピフェニル - 3 - カルボキサミド、

3' - フルオロ - N - メチル - 4' - (((2R, 3S, 4R, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) メチル) ピフェニル - 3 - カルボキサミド、

3' - メトキシ - N - メチル - 4' - (((2 R , 3 S , 4 R , 5 S , 6 R) - 3 , 4 , 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) メチル) ビフェニル - 3 - カルボキサミド、

N³ , N⁵ - ジメチル - 4' - (((2 R , 3 S , 4 R , 5 S , 6 R) - 3 , 4 , 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) メチル) ビフェニル - 3 , 5 - ジカルボキサミド、

N³ , N⁵ , 3' - トリメチル - 4' - (((2 R , 3 S , 4 R , 5 S , 6 R) - 3 , 4 , 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) メチル) ビフェニル - 3 , 5 - ジカルボキサミド、

N³ , N⁵ - ジメチル - 3' - (トリフルオロメチル) - 4' - (((2 R , 3 S , 4 R , 5 S , 6 R) - 3 , 4 , 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) メチル) ビフェニル - 3 , 5 - ジカルボキサミド、

3' - クロロ - N³ , N⁵ - ジメチル - 4' - (((2 R , 3 S , 4 R , 5 S , 6 R) - 3 , 4 , 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) メチル) ビフェニル - 3 , 5 - ジカルボキサミド、

3' - フルオロ - N³ , N⁵ - ジメチル - 4' - (((2 R , 3 S , 4 R , 5 S , 6 R) - 3 , 4 , 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) メチル) ビフェニル - 3 , 5 - ジカルボキサミド、

3' - メトキシ - N³ , N⁵ - ジメチル - 4' - (((2 R , 3 S , 4 R , 5 S , 6 R) - 3 , 4 , 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) メチル) ビフェニル - 3 , 5 - ジカルボキサミドではないものとする。
)

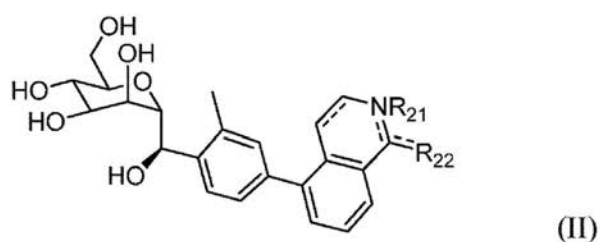
【請求項 2】

Y₁ が水素であり、C - 1 における立体化学が R 配置である請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 3】

式 (I I) の化合物。

【化 2】



(式中、

【化 3】

“ ---- ”

は、単結合又は二重結合を表し、

R₂₁ は、無、水素又は低級アルキルであり、

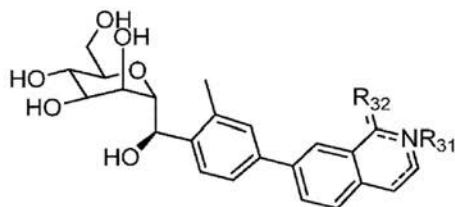
R₂₂ は、水素、アルキル、ヒドロキシル、O 又は N R₂₈ R₂₉ であり、

ここで、R₂₈ 及び R₂₉ の各々は独立して、水素、C₁ ~ C₆ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル又はヘテロアラルキルであり、又は R₂₈ 及び R₂₉ は、一緒になってヘテロシクロアルキルを形成する。)

【請求項 4】

式 (I I I) の化合物。

【化 4】



(III)

(式中、

【化 5】

“—”

は、単結合又は二重結合を表し、

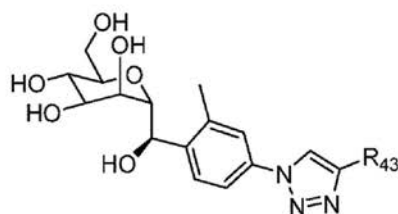
 R_{31} は、無、水素又は低級アルキルであり R_{32} は、水素、アルキル、ヒドロキシル、O又は $NR_{38}R_{39}$ であり、

ここで、 R_{38} 及び R_{39} の各々は独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、及びヘテロアラルキルであり、又は R_{38} 及び R_{39} は、一緒になってヘテロシクロアルキルを形成する。)

【請求項 5】

式 (IV) の化合物。

【化 6】



(IV)

(式中、

R_{43} は、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリールであり、

ここで、 R_{43} に関して定義されるアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリの各々は、任意に水素、ハロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ハロアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、ヘテロアリール (heteraryl) アルキル、CN、アルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $COOR_{44}$ 、 $NHSO_2R_{44}$ 、 $NHSO_2NHR_{44}$ 、 $NHCO R_{44}$ 、 $NHCONHR_{44}$ 、 $CONHR_{44}$ 、 $CONR_{44a}R_{44b}$ 、ヒドロキシ、又は OCF_3 から選択される1つ以上の置換基で置換され、

ここで、 R_{44} 、 R_{44a} 及び R_{44b} の各々は独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル又はヘテロアラルキルから選択される。)

【請求項 6】

式 (V) の化合物又はその薬学的に許容され得る塩。

【化 7】



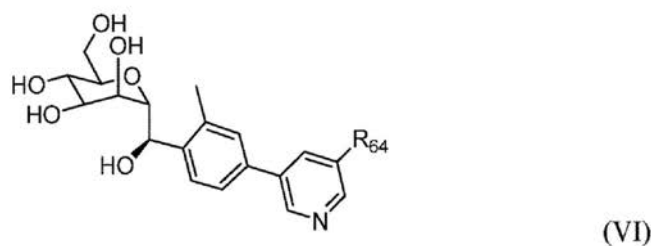
(式中、

R_{53} は、無、水素又は低級アルキルである。)

【請求項 7】

式 (VI) の化合物又はその薬学的に許容され得る塩。

【化 8】



(式中、

R_{64} は、 $-C(O)OR_{65}$ 、 $C(O)NR_{68}R_{69}$ 、ハロ、ヒドロキシ、 OCF_3 、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ハロアルキル、アラルキル、ヘテロシクロアルキル、 CN 、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $NHSO_2R_{66}$ 、 $NHSO_2NHR_{66}$ 、 $NHCO R_{66}$ 、 $NHCONHR_{66}$ 、又はアリール又はヘテロアリールであり、これらのいずれも、任意にハロ、ヒドロキシ、 OCF_3 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、 CN 、アルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $NHSO_2R_{66}$ 、 $NHSO_2NHR_{66}$ 、 $NHCO R_{66}$ 、又は $NHCONHR_{66}$ で置換されてもよく、

ここで、 R_{65} は、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリールであり、

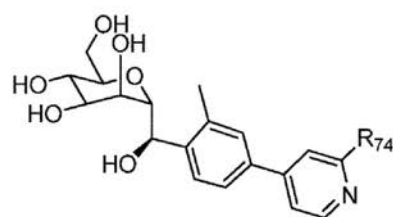
R_{68} 及び R_{69} の各々は、各々独立して水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、及びヘテロアラルキルから選択され、又は R_{68} 及び R_{69} は一緒になってヘテロシクロアルキルを形成し、

R_{66} は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル及びヘテロアラルキルである。)

【請求項 8】

式 (VII) の化合物。

【化 9】



(VII)

(式中、

R_{74} は、 $-C(O)OR_{75}$ 、 $C(O)NR_{78}R_{79}$ 、ハロ、ヒドロキシ、 OCF_3 、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ハロアルキル、アラルキル、ヘテロシクロアルキル、 CN 、アルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $NHSO_2R_{77}$ 、 $NHSO_2NHR_{77}$ 、 $NHCOR_{77}$ 、 $NHCONHR_{77}$ 、又はアリール又はヘテロアリールであり、これらのいずれも、任意にハロ、ヒドロキシ、 OCF_3 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、 CN 、アルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $NHSO_2R_{77}$ 、 $NHSO_2NHR_{77}$ 、 $NHCOR_{77}$ 又は $NHCONHR_{77}$ で置換され、

ここで、 R_{75} は、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリールであり、

R_{78} 及び R_{79} は、各々独立して水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル及びヘテロアラルキルから選択され、

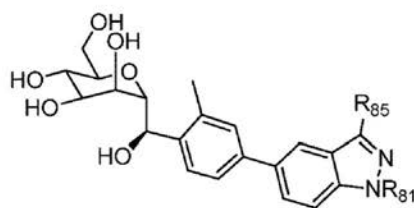
R_{78} 及び R_{79} は、一緒になってヘテロシクロアルキルを形成し、

R_{77} は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル又はヘテロアラルキルである。)

【請求項 9】

式 (VII) の化合物又はその薬学的に許容され得る塩。

【化 10】



(VIII)

(式中、

R_{81} は、無、水素、及び低級アルキルからのものであり、

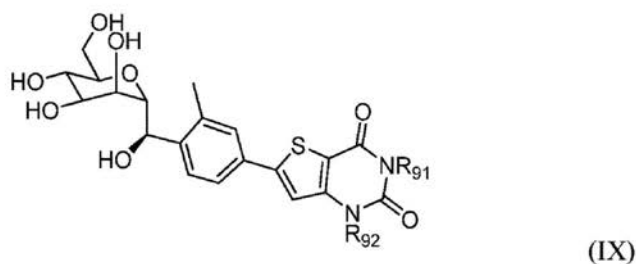
R_{85} は、水素、アルキル、 $NR_{88}R_{89}$ 、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、及びヘテロシクロアルキルからのものであり、それらのいずれも、任意に置換されてもよく、

R_{88} 及び R_{89} の各々は独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、又はヘテロアラルキルであり、又は R_{88} 及び R_{89} は、一緒になってヘテロシクロアルキルを形成する。)

【請求項 10】

式 (IX) の化合物。

【化 1 1】



(IX)

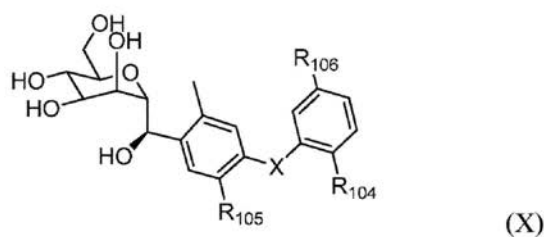
(式中、

 R_{91} 及び R_{92} の各々は独立して、水素又は低級アルキルである。)

【請求項 1 1】

式 (X) の化合物又はその薬学的に許容され得る塩。

【化 1 2】



(X)

(式中、

R_{106} は、シアノ、 $C(O)NR_{109}R_{110}$ 、 $NR_{109}R_{110}$ 、 $-SO_2$ 、 $NR_{111}R_{112}$ 、 $NHC(O)NR_{109}R_{110}$ 、ニトロ、ヒドロキシル、ハロ、及びヘテロアリールからのものであり、

R_{109} 及び R_{110} の各々は独立して、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、及びヘテロアラルキルであり、又は一緒になって、 R_{109} 及び R_{110} はヘテロシクロアルキルを形成してもよく、

R_{111} 及び R_{112} の各々は独立して、 H 、 $C_3 \sim C_7$ - シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ - アルキル、アリール、又はヘテロアリールであり、又は

R_{111} 及び R_{112} は、それらが結合された原子と一緒に、 $C_3 \sim C_7$ - ヘテロシクロアルキル又はヘテロアリールを形成し、

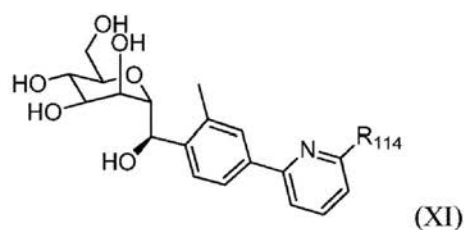
R_{104} 及び R_{105} の各々は独立して、水素又はニトロであり、

X は、 O 、 NH 、又は SO_2 である。)

【請求項 1 2】

式 (XI) の化合物又はその薬学的に許容され得る塩。

【化 1 3】



(XI)

(式中

 R_{114} は、 $-C(O)OR_{115}$ 、 $C(O)NR_{118}R_{119}$ 、ハロ、ヒドロキシ

、 OCF_3 、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ハロアルキル、アラ
ルキル、ヘテロシクロアルキル、 CN 、アルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ
、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}_{117}$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{NHR}_{117}$ 、 $\text{NH}\text{COR}_{117}$ 、 NHCONHR_{117} 、及びアリール及びヘテロアリールであり、これらは任意にハロ、ヒドロキシ、 OCF_3 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、 CN 、アルコキシ、アルキル
アミノ、ジアルキルアミノ、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}_{117}$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{NHR}_{117}$ 、 $\text{NH}\text{COR}_{117}$ 、又は NHCONHR_{117} で置換されてもよく、

R_{115} は、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘ
テロアリールから選択され、

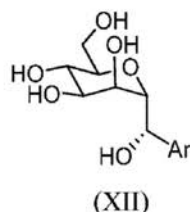
R_{118} 及び R_{119} は、各々独立して水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、アリール、ヘテロ
アリール、アラルキル、及びヘテロアラルキルから選択され、又は一緒になって、 R_{118}
及び R_{119} はヘテロシクロアルキルを形成してもよく、

R_{117} は、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル及び
ヘテロアラルキルである。))

【請求項 13】

式 (XII) の化合物又はそのエステル若しくは薬学的に許容され得る塩。

【化 14】



(式中、

Ar は、アリール又はヘテロアリールであり、

ここで、 Ar に関して定義されるアリール及びヘテロアリールの各々は、 W 及び1つ又は
2つの Z 基で置換され、

ここで、 Z は、低級アルキル、低級ハロアルキル、 NO_2 、 CF_3 、シクロプロピル
、低級アルコキシ、ハロ、ヒドロキシル及びアミノであり、

ここで、 Z に関して定義されるアミノは、任意に1つ又は2つの低級アルキルで置
換され、

W は、アリール、ヘテロアリール、又はアジドであり、

ここで、 W に関して定義されるアリール又はヘテロアリールは、 R_{11} 、 H 、ボロ
ン酸、ボロン酸ピナコールエステル、アルキル、 OTf 、ヒドロキシル、任意に1つ又は
2つのアルキル又はアリール基で置換されたアミノ、アジド、アルキン、 $-\text{SO}_2$ アリ
ール、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}_5$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}_8\text{R}_9$ 、ハロ、 OCF_3 、アルケニル、アルキニル
、ハロアルキル、 CN 、アルコキシ、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}_6$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{NHR}_6$ 、 NHCOR_6
、 NHCONHR_6 、及びシクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、アリ
ールオキシ、アラルキル、及びヘテロアリールから選択される1つ以上の置換基で置換され
、それらのいずれも、任意に1つ以上のアルキル、ヒドロキシル、オキソ、 CN 、及び NR_8R_9
で置換されてもよく、

ここで、 R_5 及び R_6 の各々は独立して、水素、アルキル、シクロアルキル、ヘ
テロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル及びヘテロアラルキルであ
り、

R_8 及び R_9 の各々は、独立して水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、アリール、ヘテ
ロアリール、アラルキル及びヘテロアラルキルであり、又は R_8 及び R_9 は、一緒になっ
てヘテロシクロアルキルを形成し、

R_{11} は、ハロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ハロ

アルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、ヘテロアリール (heteraryl) アルキル、CN、アルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}_{12}$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{NHR}_{12}$ 、 NHCOR_{12} 、 NHCONHR_{12} 、 CONHR_{12} 、 $\text{CONR}_{12a}\text{R}_{12b}$ 、ヒドロキシ、及び OCF_3 であり、

ここで、 R_{12} 、 R_{12a} 及び R_{12b} の各々は独立して、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル及びヘテロアラルキルから選択され、但し、前記式(XII)の化合物は

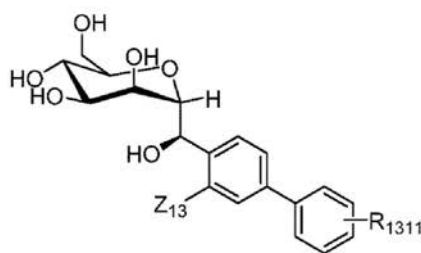
3 - [4 - [(S) - ヒドロキシ - [2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロピラン - 2 - イル] メチル] - 3 - メチル - フェニル] - N - メチル - ベンズアミド、又は

4' - ((S) - ヒドロキシ ((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) メチル) - N - メチルビフェニル - 3 - カルボキサミドではないものとする。)

【請求項14】

式(XIII)の化合物又はそのエステル若しくは薬学的に許容され得る塩。

【化15】



(XIII)

(式中、

R_{1311} は、ハロ、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ハロアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、ヘテロアリール (heteraryl) アルキル、CN、アルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}_{1312}$ 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{NHR}_{1312}$ 、 $\text{NH}\text{COR}_{1312}$ 、 NHCONHR_{1312} 、 CONHR_{1312} 、 $\text{CONR}_{1312a}\text{R}_{1312b}$ 、ヒドロキシ、及び OCF_3 から選択され、

R_{1312} 、 R_{1312a} 及び R_{1312b} は、独立して水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル及びヘテロアラルキルから選択され、

Z_{13} は、低級アルキル、低級ハロアルキル、 NO_2 、 CF_3 、シクロプロピル、低級アルコキシ、ハロ、ヒドロキシル、及び任意に1つ又は2つの低級アルキルで置換されたアミノから選択され、

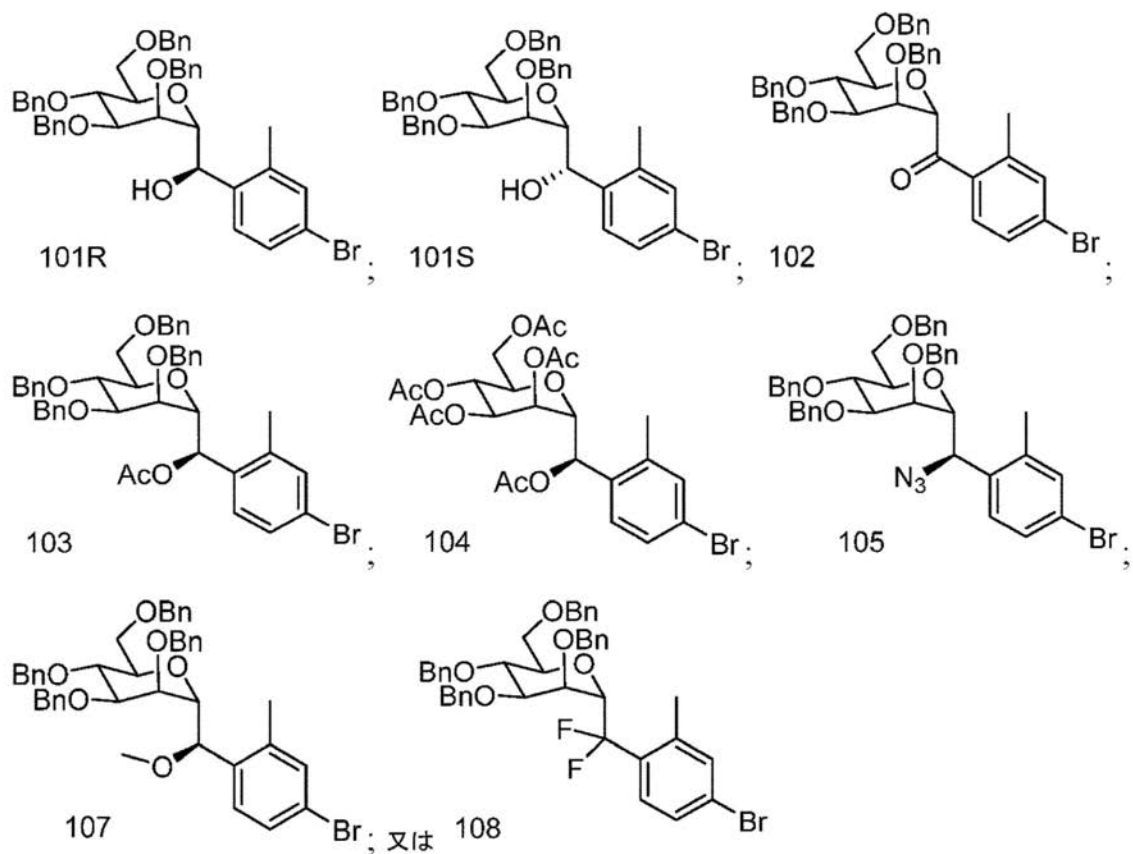
但し、前記化合物は

3 - [4 - [(R) - ヒドロキシ - [(2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロピラン - 2 - イル] メチル] - 3 - メチル - フェニル] - N - メチル - ベンズアミドではないものとする。)

【請求項15】

以下の化合物又はその薬学的に許容され得る塩。

【化 16】



【請求項 16】

(2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - ヒドロキシ(4 - (イソキノリン - 5 - イル) - 2 - メチルフェニル)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

7 - (4 - ((R) - ヒドロキシ(2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル)メチル) - 3 - メチルフェニル)イソキノリン - 1(2H) - オン、

(2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - (4 - (1 - アミノイソキノリン - 7 - イル) - 2 - メチルフェニル)(ヒドロキシ)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

7 - (4 - ((R) - ヒドロキシ(2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル)メチル) - 3 - メチルフェニル) - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1(2H) - オン、

(2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - ヒドロキシ(2 - メチル - 4 - (2 - メチル - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリン - 5 - イル)フェニル)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

4' - ((R) - アミノ((2R, 3S, 4R, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル)メチル) - N, 3' - ジメチルピフェニル - 3 - カルボキサミド、

4' - ((R) - メトキシ((2S, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル)メチル) - N, 3' - ジメチルピフェニル - 3 - カルボキサミド、

4' - (メトキシ((2S, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル)メチル) - N, 2' - ジメチルピフェニル - 3 - カルボキサミド、

4' - (ジフルオロ((2S, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル)メチル) - N, 3' - ジメチルビフェニル - 3 - カルボキサミド、

((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - ヒドロキシ(4 - (イソキノリン - 6 - イル) - 2 - メチルフェニル)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

7 - (4 - ((R) - ヒドロキシ((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル)メチル) - 3 - メチルフェニル) - 2 - メチルイソキノリン - 1(2H) - オン、

7 - (4 - ((R) - ヒドロキシ((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル)メチル) - 3 - メチルフェニル) - 2 - メチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1(2H) - オン、

4 - (4 - ((R) - ヒドロキシ((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル)メチル) - 3 - メチルフェニル)イソインドリン - 1 - オン、

((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - ヒドロキシ(2 - メチル - 4 - (キノリン - 6 - イル)フェニル)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - ヒドロキシ(2 - メチル - 4 - (キノリン - 7 - イル)フェニル)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - ヒドロキシ(2 - メチル - 4 - (3 - メチル - 3H - ベンゾ[d]イミダゾール - 5 - イル)フェニル)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - (4 - (3H - ベンゾ[d]イミダゾール - 5 - イル) - 2 - メチルフェニル)(ヒドロキシ)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - (4 - (3 - アミノ - 1H - インダゾール - 7 - イル) - 2 - メチルフェニル)(ヒドロキシ)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

6 - (4 - ((R) - ヒドロキシ((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル)メチル) - 3 - メチルフェニル)イソインドリン - 1 - オン、

((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - ヒドロキシ(2 - メチル - 4 - (3 - メチルベンゾ[d]イソオキサゾール - 5 - イル)フェニル)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - ヒドロキシ(4 - (イソキノリン - 7 - イル) - 2 - メチルフェニル)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - (4 - (2 - クロロピリジン - 4 - イル) - 2 - メチルフェニル(ヒドロキシ)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - (4 - (2' - クロロ - [2, 4' - ビピリジン] - 4 - イル) - 2 - メチルフェニル)(ヒドロキシ)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - ヒドロキシ(2 - メチル - 4 - (2 - (メチルアミノ)ピリジン - 4 - イル)フェニル)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - ヒドロキシ(2 - メチル - 4 - (

2 - モルホリノピリジン - 4 - イル) フェニル) メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

(2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 2 - ((R) - (4 - (2 - アミノピリジン - 4 - イル) - 2 - メチルフェニル(ヒドロキシ)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

(2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 2 - ((R) - (4 - (2 - (ジメチルアミノ)ピリジン - 4 - イル) - 2 - メチルフェニル)(ヒドロキシ)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

(2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 2 - ((R) - (4 - (3 - アミノベンゾ[d]イソオキサゾール - 5 - イル) - 2 - メチルフェニル)(ヒドロキシ)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

7 - (4 - ((R) - ヒドロキシ((2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル)メチル) - 3, 5 - ジメチルフェニル)イソキノリン - 1(2 H) - オン、

7 - (4 - ((S) - ヒドロキシ((2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル)メチル) - 3, 5 - ジメチルフェニル)イソキノリン - 1(2 H) - オン、

7 - (4 - ((R) - ヒドロキシ((2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル)メチル) - 3 - メチルフェニル) - 2 - イソプロピルイソキノリン - 1(2 H) - オン、

7 - (4 - ((R) - ヒドロキシ((2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル)メチル) - 3 - メチルフェニル) - 2 - イソプロピル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1(2 H) - オン、

7 - (4 - ((R) - ヒドロキシ((2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル)メチル) - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル) - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1(2 H) - オン、

7 - (4 - ((S) - ヒドロキシ((2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル)メチル) - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル) - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1(2 H) - オン、

5 - (4 - ((R) - ヒドロキシ((2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル)メチル) - 3 - メチルフェニル) - N - メチルニコチンアミド、

(2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 2 - ((R) - ヒドロキシ(4 - (イミダゾ[1, 2 - a]ピリジン - 2 - イル) - 2 - メチルフェニル)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

4' - ((R) - ヒドロキシ((2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル)メチル) - 5' - メチル - N - (ピリジン - 2 - イル)ピフェニル - 3 - カルボキサミド、

4' - ((R) - ヒドロキシ((2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル)メチル) - N³, N⁵, 3' - トリメチルピフェニル - 3, 5 - ジカルボキサミド、

4' - ((R) - ヒドロキシ((2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル)メチル) - N - メチル - 5' - (トリフルオロメチル)ピフェニル - 3 - カルボキサミド、

4' - ((S) - ヒドロキシ((2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル)メチル) - N - メチル - 3' - (トリフルオロメチル) - [1, 1' - ピフェニル] - 3 - カル

ボキサミド、

4' - ((R) - ヒドロキシ ((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) メチル) - N, N, 5' - トリメチルピフェニル - 3 - カルボキサミド、

5 - シアノ - 4' - ((R) - ヒドロキシ ((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) メチル) - N, 5' - ジメチルピフェニル - 3 - カルボキサミド、

4 - シアノ - 4' - ((R) - ヒドロキシ ((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) - テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) メチル) - N, 5' - ジメチルピフェニル - 3 - カルボキサミド、

4' - ((R) - アジド ((2R, 3S, 4R, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) メチル) - N, 3' - ジメチルピフェニル - 3 - カルボキサミド、

3' - クロロ - 4' - ((R) - ヒドロキシ ((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) メチル) - N - メチルピフェニル - 3 - カルボキサミド、

4' - ((R) - ヒドロキシ ((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) メチル) - 3' - メチルピフェニル - 4 - カルボニトリル、

(2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - (4 - アジド - 2 - メチルフェニル) (ヒドロキシ) メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

(2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - ヒドロキシ (2 - メチル - 4 - (4 - フェニル - 1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) フェニル) メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

(2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - ヒドロキシ (2 - メチル - 4 - (4 - (ピリジン - 3 - イル) - 1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) フェニル) メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

(2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((1R) - ヒドロキシ (2 - メチル - 4 - (4 - (ピペリジン - 3 - イル) - 1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル) フェニル) メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

4' - ((R) - ヒドロキシ ((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) メチル) - 3' - メチルピフェニル - 3 - カルボニトリル、

5 - (4 - ((R) - ヒドロキシ ((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) メチル) - 3 - メチルフェニル) ニコチン酸、

メチル 5 - (4 - ((R) - ヒドロキシ ((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) メチル) - 3 - メチルフェニル) ニコチネート、

3 - (1 - (4 - ((R) - ヒドロキシ ((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 2 - イル) メチル) - 3 - メチルフェニル) - 1H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - イル) 安息香酸、

(2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 2 - ((R) - ヒドロキシ (2 - メチル - 4 - (3 - メチル - 1H - インダゾール - 5 - イル) フェニル) メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

6 - (4 - ((R) - ヒドロキシ ((2R, 3S, 4S, 5S, 6R) - 3, 4, 5 -

トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル)メチル) - 3 - メチルフェニル)チエノ[3, 2 - d]ピリミジン - 2, 4 (1 H, 3 H) - ジオン、

(2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 2 - ((R) - ヒドロキシ(2 - メチル - 4 - (4 - (ピリジン - 2 - イル) - 1 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル)フェニル)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

3 - (4 - ((R) - ヒドロキシ((2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル)メチル) - 3 - メチル - 2 - ニトロフェノキシ)ベンゾニトリル、

5 - (4 - ((R) - ヒドロキシ((2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル)メチル) - 3 - メチルフェニル) - N - イソプロピルニコチンアミド、

(2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 2 - ((R) - ヒドロキシ(3 - メチル - 3' - (1 H - テトラゾール - 5 - イル)ピフェニル - 4 - イル)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

(2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 2 - ((R) - (4 - (1 - アミノイソキノリン - 5 - イル) - 2 - メチルフェニル)(ヒドロキシ)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオール、

5 - (4 - ((R) - ヒドロキシ((2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル)メチル) - 3 - メチルフェニル)イソキノリン - 1 (2 H) - オン、及び

(2 R, 3 S, 4 S, 5 S, 6 R) - 2 - ((R) - (4 - (3 - アミノ - 1 H - インダゾール - 5 - イル) - 2 - メチルフェニル)(ヒドロキシ)メチル) - 6 - (ヒドロキシメチル)テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3, 4, 5 - トリオールである化合物。

【請求項 17】

医薬として使用するための請求項 1 又は 2 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 18】

尿路感染症 (UTI) の治療における使用のための請求項 1 又は 2 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 19】

F i m H 機能又は活性の阻害により寛解される疾病又は病状の予防又は治療のための医薬の製造における使用のための請求項 1 又は 2 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 20】

請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の化合物及び薬学的に許容され得る担体を含む医薬組成物。

【請求項 21】

請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の化合物を含む F i m H 仲介疾病の治療用の医薬組成物。

【請求項 22】

前記疾病が、細菌感染症、クローン病 (CD) 及び炎症性腸疾患 (IBD) から選択される請求項 21 に記載の医薬組成物。

【請求項 23】

前記疾病が、反復性又は慢性の尿路感染症である請求項 22 に記載の医薬組成物。

【請求項 24】

請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の化合物及び他の治療薬を含む F i m H 仲介疾病の治療用医薬組成物。

【請求項 25】

経口 (PO) 投与用に処方された請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の式 (I) の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 26】

前記組成物が錠剤及びカプセル剤から選択される請求項 20 ～ 25 のいずれかに記載の医薬組成物。