

【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 07 D	309/10	(2006.01)
C 07 D	405/10	(2006.01)
C 07 D	405/14	(2006.01)
C 07 D	471/04	(2006.01)
C 07 D	405/12	(2006.01)
A 61 K	31/4725	(2006.01)
A 61 K	31/35	(2006.01)
A 61 K	31/4035	(2006.01)
A 61 K	31/4709	(2006.01)
A 61 K	31/4184	(2006.01)
A 61 K	31/416	(2006.01)
A 61 K	31/423	(2006.01)
A 61 K	31/4433	(2006.01)
A 61 K	31/444	(2006.01)
A 61 K	31/5377	(2006.01)
A 61 K	31/455	(2006.01)
A 61 K	31/437	(2006.01)
A 61 K	31/4192	(2006.01)
A 61 K	31/4439	(2006.01)
A 61 K	31/454	(2006.01)
A 61 K	45/00	(2006.01)
A 61 P	13/02	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
A 61 P	31/04	(2006.01)
A 61 P	1/04	(2006.01)
A 61 P	29/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D	309/10	
C 07 D	405/10	C S P
C 07 D	405/14	
C 07 D	471/04	1 0 8 Q
C 07 D	405/12	
A 61 K	31/4725	
A 61 K	31/35	
A 61 K	31/4035	
A 61 K	31/4709	
A 61 K	31/4184	
A 61 K	31/416	
A 61 K	31/423	
A 61 K	31/4433	
A 61 K	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

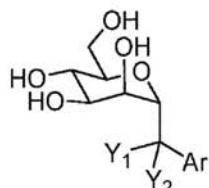
【補正の内容】

【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、ヒドロキシリ、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、R₁、H、ボロン酸、ボロン酸ピナコールエステル、アルキル、OTf、ヒドロキシリ、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、NHSO₂R₆、NHSO₂NHR₆、NHCOR₆、NHCONHR₆、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、ヒドロキシリ、オキソ、CN、及びNR₈R₉で置換されてもよく、

ここで、R₅ 及び R₆ 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、

R₈ 及び R₉ 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、及びヘテロアラルキルであり、又は R₈ 及び R₉ は、一緒になってヘテロシクロアルキルを形成し、

R₁₁ 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、NHSO₂R₁₂、NHSO₂NHR₁₂、NHCOR₁₂、NHCONHR₁₂、CONHR₁₂、CONR_{12a}R_{12b}、ヒドロキシ、及びOCF₃ であり、

ここで、R₁₂、R_{12a} 及び R_{12b} 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、アラルキル及びヘテロアラルキルから選択され、

Y₁ 及び Y₂ 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、Y₁ 及び Y₂ 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 - メチルビフェニル - 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) ビフェニル - 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 - メチルビフェニル - 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) ビフェニル - 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) ビフェニル - 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) ビフェニル - 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) ビフェニル - 3 - カルボキサミド、

3' - メトキシ - 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) ビフェニル - 3 - カルボキサミド、

N³ , N⁵ - 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) ビフェニル - 3 , 5 - ジカルボキサミド、

N³ , N⁵ , 3' - トリメチル - 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) 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' - (((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) 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' - (((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) 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' - (((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) 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' - (((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) ビフェニル - 3 , 5 - ジカルボキサミドではないものとする。
)

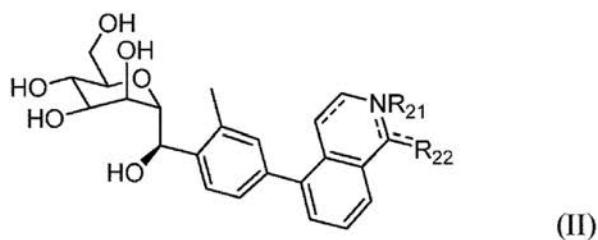
【請求項 2】

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 (II) 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、

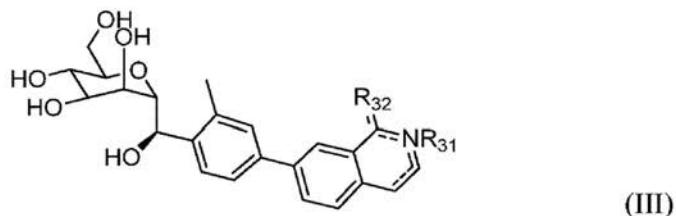
R₂₂ は、水素、アルキル、ヒドロキシル、O 又は NR₂₈R₂₉ であり、

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 (III) の化合物。

【化4】



(式中、

【化5】

“—”

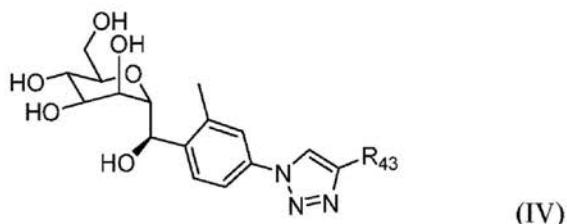
は、単結合又は二重結合を表し、

 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、C₁~C₆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】



(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ールの各々は、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、COOR₄₄、NH₂SR₄₄、NH₂SO₂R₄₄、NH₂SO₂NH₂R₄₄、NHCOR₄₄、NHCONHR₄₄、CONHR₄₄、CONR_{44a}R_{44b}、ヒドロキシ、又はOCF₃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、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】



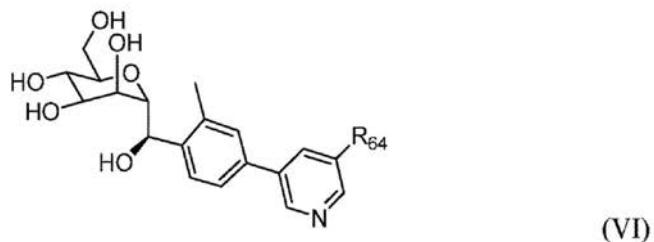
(式中、

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、 $NHSO_2R_{66}$ 、 $NHSO_2NHR_{66}$ 、 $NHCOR_{66}$ 、 $NHCONHR_{66}$ 、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、 $NHSO_2R_{66}$ 、 $NHSO_2NHR_{66}$ 、 $NHCOR_{66}$ 、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、

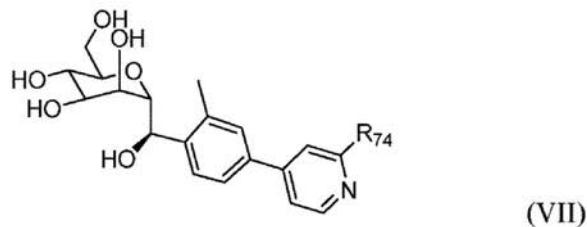
R_{68} 及び R_{69} の各々は、各々独立して水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、及びヘテロアラルキルから選択され、又は R_{68} 及び R_{69} は一緒になってヘテロシクロアルキルを形成し、

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】



(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、

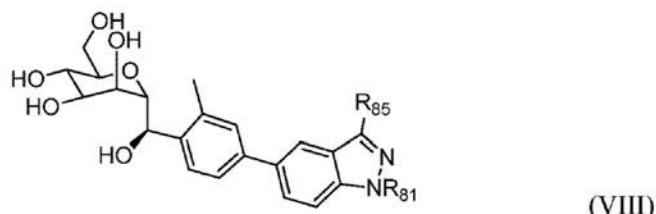
R_{78} 及び R_{79} は、一緒にになってヘテロシクロアルキルを形成し、

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(VIII)の化合物又はその薬学的に許容され得る塩。

【化10】



(式中、

R_{81} は、無、水素、及び低級アルキルからのものであり、

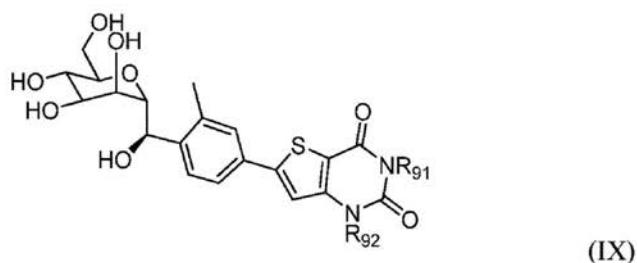
R_{85} は、水素、アルキル、 $NR_{88}R_{89}$ 、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、及びヘテロシクロアルキルからのものであり、これらのいずれも、任意に置換されてもよく、

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11】



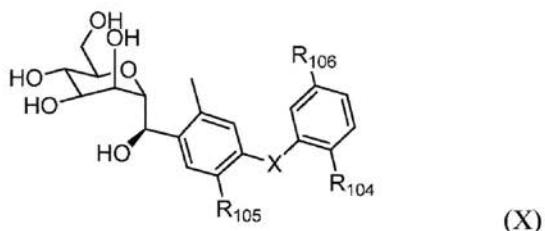
(式中、

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11】

式(X)の化合物又はその薬学的に許容され得る塩。

【化12】



(式中、

R_{106} は、シアノ、 $C(O)NR_{109}R_{110}$ 、 $NR_{109}R_{110}$ 、 $-SO_2NR_{111}R_{112}$ 、 $NHC(O)NR_{109}R_{110}$ 、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になって、 $C_3 \sim C_7$ - 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12】

式(XI)の化合物又はその薬学的に許容され得る塩。

【化13】



(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、 $\text{NHSO}_2\text{R}_{1\sim 7}$ 、 $\text{NHSO}_2\text{NHR}_{1\sim 7}$ 、 $\text{NHCOR}_{1\sim 7}$ 、 $\text{NHCONHR}_{1\sim 7}$ 、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、 $\text{NHSO}_2\text{R}_{1\sim 7}$ 、 $\text{NHSO}_2\text{NHR}_{1\sim 7}$ 、 $\text{NHCOR}_{1\sim 7}$ 、又は $\text{NHCONHR}_{1\sim 7}$ で置換されてもよく、

$\text{R}_{1\sim 5}$ 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、

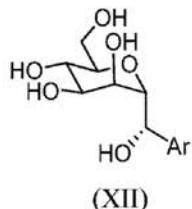
$\text{R}_{1\sim 8}$ 及び $\text{R}_{1\sim 9}$ は、各々独立して水素、C₁~C₆アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、及びヘテロアラルキルから選択され、又は一緒になって、 $\text{R}_{1\sim 8}$ 及び $\text{R}_{1\sim 9}$ はヘテロシクロアルキルを形成してもよく、

$\text{R}_{1\sim 7}$ は、水素、C₁~C₆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、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、R_{1~1}、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、 NHSO_2R_6 、 $\text{NHSO}_2\text{NHR}_6$ 、 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NR₈R₉で置換されてもよく、

ここで、R₅及びR₆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、

R₈及びR₉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、アラルキル及びヘテロアラルキルであり、又はR₈及びR₉は、一緒になってヘテロシクロアルキルを形成し、

R_{1~1}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、 $\text{NH}_2\text{SO}_2\text{R}_{1\sim 2}$ 、 $\text{NH}_2\text{SO}_2\text{NHR}_{1\sim 2}$ 、 $\text{NHCOR}_{1\sim 2}$ 、 $\text{NHCONHR}_{1\sim 2}$ 、 $\text{CONHR}_{1\sim 2}$ 、 $\text{CONR}_{1\sim 2}\text{aR}_{1\sim 2}\text{b}$ 、ヒドロキシ、及び OCF_3 であり、

ここで、 $\text{R}_{1\sim 2}$ 、 $\text{R}_{1\sim 2}\text{a}$ 及び $\text{R}_{1\sim 2}\text{b}$ 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

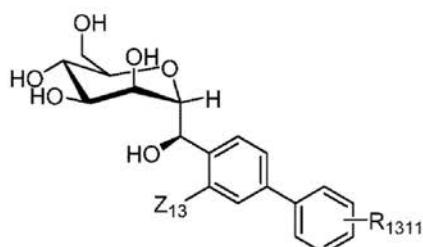
3-[4-[((S)-ヒドロキシ-[2R,3S,4S,5S,6R]-3,4,5-トリヒドロキシ-6-(ヒドロキシメチル)テトラヒドロピラン-2-イル]メチル]-3-メチル-フェニル]-N-メチル-ベンズアミド、又は

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、

$\text{R}_{1\sim 3\sim 1\sim 1}$ 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、 $\text{NH}_2\text{SO}_2\text{R}_{1\sim 3\sim 1\sim 2}$ 、 $\text{NH}_2\text{SO}_2\text{NHR}_{1\sim 3\sim 1\sim 2}$ 、 $\text{NHCOR}_{1\sim 3\sim 1\sim 2}$ 、 $\text{NHCONHR}_{1\sim 3\sim 1\sim 2}$ 、 $\text{CONHR}_{1\sim 3\sim 1\sim 2}$ 、 $\text{CONR}_{1\sim 3\sim 1\sim 2}\text{aR}_{1\sim 3\sim 1\sim 2}\text{b}$ 、ヒドロキシ、及び OCF_3 から選択され、

$\text{R}_{1\sim 3\sim 1\sim 2}$ 、 $\text{R}_{1\sim 3\sim 1\sim 2}\text{a}$ 及び $\text{R}_{1\sim 3\sim 1\sim 2}\text{b}$ は、独立して水素、C₁～C₆アルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル及びヘテロアラルキルから選択され、

$Z_{1\sim 3}$ 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、ヒドロキシリ、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、

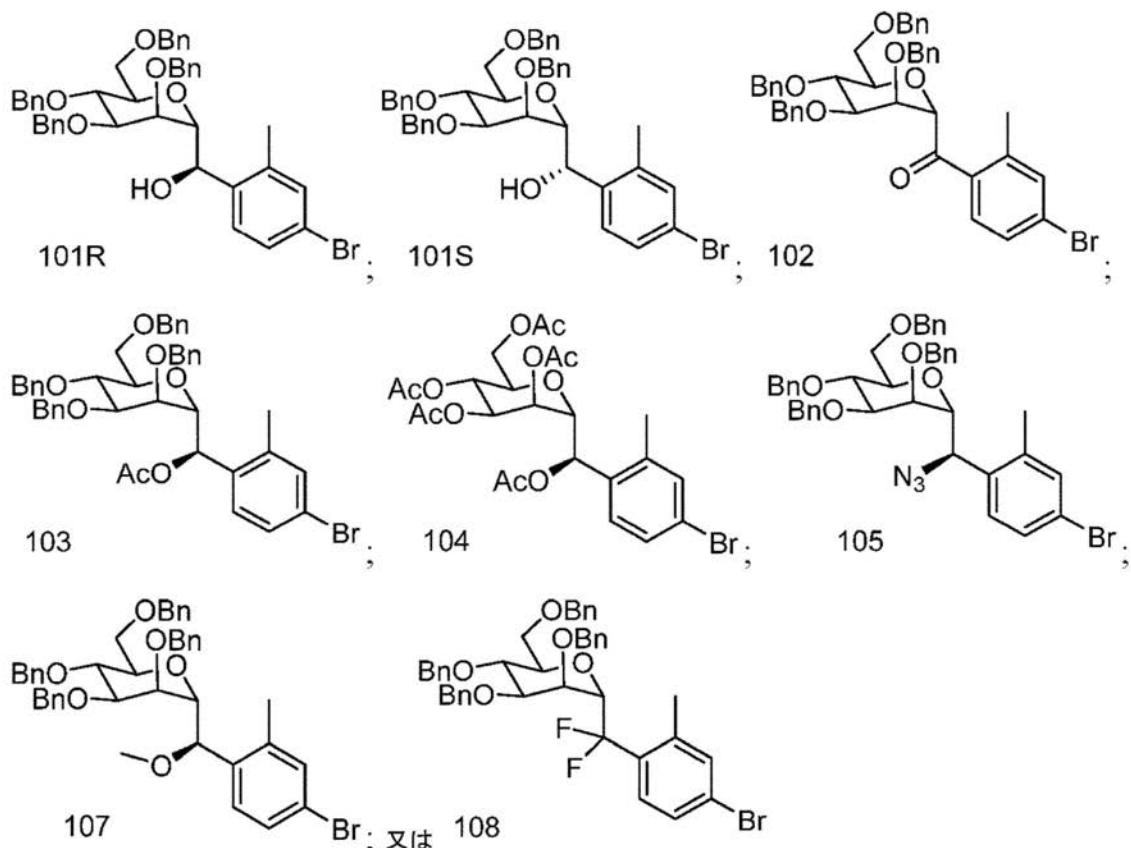
但し、前記化合物は

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' - ジメチルビフェニル - 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' - ジメチルビフェニル - 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' - ジメチルビフェニル - 3 - カルボキサミド、

4' - (ジフルオロ((2 S , 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 , 3' - ジメチルビフェニル - 3 - カルボキサミド、

(2 R , 3 S , 4 S , 5 S , 6 R) - 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 - 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 - メチルフェニル) - 2 - メチルイソキノリン - 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 - メチル - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 (2 H) - オン、

4 - (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) イソインドリン - 1 - オン、

(2 R , 3 S , 4 S , 5 S , 6 R) - 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 - 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) - 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 - 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) - ヒドロキシ(2 - メチル - 4 - (3 - メチル - 3 H - 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 - 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 H - 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 - 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 - 1 H - 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 - 2 H - ピラン - 3 , 4 , 5 - トリオール、

6 - (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) イソインドリン - 1 - オン、

(2 R , 3 S , 4 S , 5 S , 6 R) - 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 - 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) - 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 - 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 - 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 - 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 ' - 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 - 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) - 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 - 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) - 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 - メチルニコチニアミド、
 (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) ビフェニル - 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) - N ³ , N ⁵ , 3 ' - トリメチルビフェニル - 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) ビフェニル - 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 ' - ビフェニル] - 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' - トリメチルビフェニル - 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' - ジメチルビフェニル - 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' - ジメチルビフェニル - 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' - ジメチルビフェニル - 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 - メチルビフェニル - 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' - メチルビフェニル - 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 - (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' - メチルビフェニル - 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) ビフェニル - 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 (U T I) 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 (C D) 及び炎症性腸疾患 (I B D) 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 仲介疾病的治療用医薬組成物。

【請求項 25】

経口 (P O) 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。